



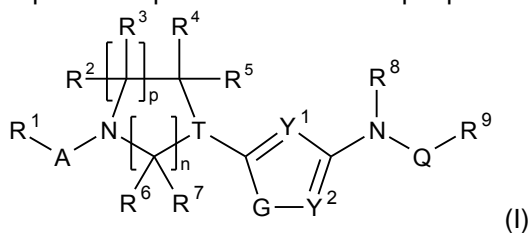
УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **104203** (13) **C2**
(51) МПК (2013.01)**C07D 413/04** (2006.01)**C07D 413/14** (2006.01)**C07D 417/04** (2006.01)**C07D 417/14** (2006.01)**A01P 3/00****A01N 43/78** (2006.01)**A01N 43/76** (2006.01)**A01N 43/836** (2006.01)ДЕРЖАВНА СЛУЖБА
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
УКРАЇНИ**(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВІНАХІД**

(21) Номер заявки: а 2012 02484	(72) Винахідник(и): Зульцер-Моссе Сара (FR/CH), Ламберт Клеменс (DE/CH), Респондек Матіас Штефан (DE/CH), Куаранта Лаура (IT/CH)
(22) Дата подання заявки: 05.08.2010	(73) Власник(и): СІНГЕНТА ПАРТІСІПЕЙШНС АГ, Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel, Switzerland (CH)
(24) Дата, з якої є чинними права на винахід: 10.01.2014	(74) Представник: Петров Андрій Володимирович, реєстр. №139
(31) Номер попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції: 09167736.9	(56) Перелік документів, взятих до уваги експертизою: WO 2007014290, A, 01.02.2007 WO 2009094445, A, 30.07.2009 PATANI G. A. ET AL. BIOSOSTERISM: A RATIONAL APPROACH IN DRUG DESIGN// CHEMICAL REVIEWS, vol. 96, no. 8, 01.01.1996, pp. 3147-3176
(32) Дата подання попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції: 12.08.2009	
(33) Код держави-учасниці Паризької конвенції, до якої подано попередню заявку: EP	
(41) Публікація відомостей про заявку: 10.04.2012, Бюл.№ 7	
(46) Публікація відомостей про видачу патенту: 10.01.2014, Бюл.№ 1	
(86) Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору РСТ: PCT/EP2010/061381, 05.08.2010	

(54) ГЕТЕРОЦИКЛИ З МІКРОБІОЦИДНИМИ ВЛАСТИВОСТЯМИ**(57) Реферат:**

Гетероциклічні сполуки формули I, а також фунгіцидна композиція на їх основі та спосіб боротьби з фітопатогенними мікроорганізмами.

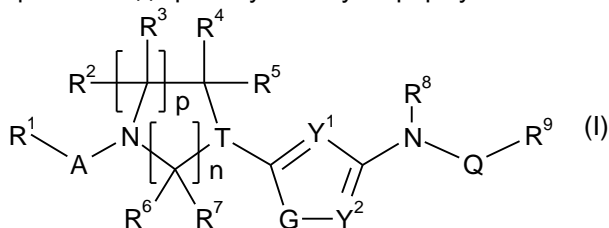


UA 104203 C2

Предметом цього винаходу є гетероцикли, наприклад в якості діючих речовин, які характеризуються мікробіоцидною активністю, зокрема фунгіцидною дією. Предметом винаходу також є отримання цих гетероциклів; гетероциклічні похідні, що використовуються в якості проміжних продуктів під час приготування таких гетероциклів; отримання цих проміжних продуктів; агрохімічні композиції, які містять принаймні один із таких гетероциклів; приготування цих композицій та використання гетероциклів або композицій у сільськогосподарському виробництві, садівництві чи городництві у цілях профілактики та для боротьби із зараженням рослин, заготовлених продовольчих культур, насіння чи неживих матеріалів фітопатогенними мікроорганізмами, переважно грибами.

Певні гетероцикли, які можна використовувати в якості фунгіцидів, описані в публікаціях WO 2007/014290, WO 2008/013622, WO 2008/013925, WO 2008/091580, WO 2008/091594 та WO 2009/055514.

Цей винахід пропонує сполуки формули I:



де
А означає $x-C(=O)-$, $x-C(=S)-$, $x-C(R^{10}R^{11})-C(=O)-$, $x-C(R^{12}R^{13})-C(=S)-$, $x-O-C(=O)-$, $x-O-C(=S)-$, $x-N(R^{14})-C(=O)-$, $x-N(R^{15})-C(=S)-$, $x-C(R^{16}R^{17})-SO_2-$ або $x-N=C(R^{26})-$, причому x у кожному випадку означає зв'язок, приєднаний до R^1 ;

Т означає CR^{18} або N;

G означає O або S;

Y^1 та Y^2 незалежно означають CR^{19} або N;

Q означає $-C(=O)-z$, $-C(=S)-z$, $-C(=O)-O-z$, $-C(=S)-O-z$, $-C(=O)-N(R^{20})-z$, $-C(=S)-N(R^{21})-z$ або $-SO_2-z$, причому z у кожному випадку означає зв'язок, приєднаний до R^9 ;

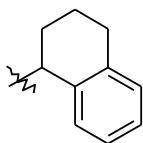
n дорівнює 1 або 2;

p дорівнює 1 або 2, за умови, що якщо n дорівнює 2, p дорівнює 1;

R^1 означає фенол, піридил, імідазоліл або піразоліл, де кожен фенол, піридил, імідазоліл і піразоліл - як варіант - заміщений 1-3 заміщувачами, незалежно вибраними з (C_1-C_4) алкілу, (C_1-C_4) галоалкілу, галогену, ціано, гідроксі й аміно;

кожен із R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{16} , R^{17} , R^{18} , R^{19} та R^{26} незалежно означає водень, галоген, ціано, (C_1-C_4) алкіл або (C_1-C_4) галоалкіл;

кожен із R^8 , R^{14} , R^{15} , R^{20} та R^{21} незалежно означає водень, (C_1-C_4) алкіл або (C_1-C_4) алкоксі; а R^9 означає фенол, бензил або групу (a):



(a),

де кожен фенол, бензил і кожна група (a) - як варіант - заміщений(-а) 1-3 заміщувачами, незалежно вибраними з (C_1-C_4) алкілу, (C_1-C_4) галоалкілу, (C_1-C_4) алкоксі, (C_1-C_4) галоалкоксі, галогену, ціано, гідроксилу, $N(R^{27})_2$, SH, (C_1-C_4) алкілтіо, нітро, фенолсульфонілу та фенолсульфінілу, де фенолсульфоніл і фенолсульфініл - як варіант - заміщені 1-3 заміщувачами, незалежно вибраними з (C_1-C_4) алкілу, (C_1-C_4) галоалкілу, (C_1-C_4) алкоксі, (C_1-C_4) галоалкоксі, галогену та ціано;

кожен R^{27} незалежно означає водень, (C_1-C_4) алкіл, фенолсульфоніл або фенолсульфініл, де фенолсульфоніл і фенолсульфініл - як варіант - заміщені 1-3 заміщувачами, незалежно вибраними з (C_1-C_4) алкілу, (C_1-C_4) галоалкілу, (C_1-C_4) алкоксі, (C_1-C_4) галоалкоксі, галогену та ціано; чи сіл або N-оксид цих сполук.

Якщо заміщувачі визначені як такі, що заміщуються «як варіант», це означає, що вони можуть нести чи не нести один або більше однакових або різних заміщувачів. Зазвичай одночасно присутніми є не більше трьох таких факультативних заміщувачів.

Термін «галоген» означає фтор, хлор, бром чи йод, оптимально фтор, хлор чи бром.

Термін «аміно» означає $-NH_2$.

Алкільні заміщувачі можуть мати форму прямого чи розгалуженого ланцюга. Залежно від кількості вказаних атомів вуглецю алкіл - самостійно або як частина іншого заміщувача - представляє собою, наприклад, метил, етил, n-пропіл, n-бутил, n-пентил, n-гексил, а також ізомери цих сполук, наприклад ізо-пропіл, ізо-бутил, сек-бутил, трет-бутил, ізо-аміл або півалоїл.

Галоалкільна група може містити один або кілька однакових чи різних атомів галогену; її прикладами є CH_2Cl , CHCl_2 , CCl_3 , CH_2F , CHF_2 , CF_3 , CF_3CH_2 , CH_3CF_2 , CF_3CF_2 або CCl_3CCl_2 .

Наявність одного чи кількох можливих асиметричних атомів вуглецю в сполуці формули I означає, що сполуки можуть зустрічатися у формах оптичних ізомерів, тобто в енантімерних або діастереомерних формах. Внаслідок наявності можливого аліфатичного подвійного зв'язку $\text{C}=\text{C}$ може виникати геометрична ізомерія, тобто цис-транс або (E)-(Z) ізомерія. Крім того, внаслідок обмеження обертання навколо одинарного зв'язку можуть виникати атропоізомери. Формула I призначена для охоплення всіх можливих згаданих ізомерних форм та їх сумішей. Цей винахід охоплює всі можливі згадані ізомерні форми та їх суміші для сполуки формули I. Аналогічним чином, формула I призначена для охоплення всіх можливих таутомерів. Цей винахід охоплює всі можливі таутомерні форми для сполуки формули I.

У кожному випадку сполуки формули I згідно з цим винаходом знаходяться у вільній формі, в окисненій формі як N-оксид або сіль, наприклад у формі солі, придатної для використання в агрономії.

N-оксиди являють собою окиснені форми третинних амінів або окиснені форми азоту, що містять гетероароматичні сполуки. Вони описані, наприклад, у книзі A. Albini and S. Pietra «Heterocyclic N-oxides», CRC Press, Boca Raton 1991.

До придатних солей сполук формули I належать солі, які отримують додаванням кислоти, наприклад неорганічної (мінеральної) кислоти, такої як хлористоводнева, бромистоводнева, сірчана, азотна чи фосфорна кислота, або органічної карбонової кислоти, такої як щавелева, винна, молочна, масляна, толуїлова, капронова чи фталева кислота, або сульфокислоти, такої як метан-, бензол- чи толуолсульфокислота.

Оптимально сполука формули I є сполукою, в якій:

A означає x-C(=O)- , x-C(=S)- , $\text{x-C(R}^{10}\text{R}^{11}\text{)-C(=O)-}$, $\text{x-C(R}^{12}\text{R}^{13}\text{)-C(=S)-}$, x-O-C(=O)- , x-O-C(=S)- , $\text{x-N(R}^{14}\text{)-C(=O)-}$, $\text{x-N(R}^{15}\text{)-C(=S)-}$ або $\text{x-C(R}^{16}\text{R}^{17}\text{)-SO}_2\text{-}$, причому x у кожному випадку означає зв'язок, приєднаний до R^1 ;

T означає CR^{18} або N;

G означає O або S;

Y^1 та Y^2 незалежно означають CR^{19} або N;

Q означає -C(=O)-z , -C(=S)-z , -C(=O)-O-z , -C(=S)-O-z , $\text{-C(=O)-N(R}^{20}\text{)-z}$, $\text{-C(=S)-N(R}^{21}\text{)-z}$ або $\text{-SO}_2\text{-z}$, причому z у кожному випадку означає зв'язок, приєднаний до R^9 ;

n дорівнює 1 або 2;

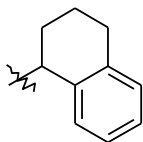
p дорівнює 1 або 2, за умови, що якщо n дорівнює 2, p дорівнює 1;

R^1 означає феніл, піридил, імідазоліл або піразоліл, де кожен феніл, піридил, імідазоліл і піразоліл - як варіант - заміщений 1-3 заміщувачами, незалежно вибраними з $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ алкілу, $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ галоалкілу, галогену, ціано, гідроксі й аміно;

кожен із R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{16} , R^{17} , R^{18} та R^{19} незалежно означає водень, галоген, ціано, $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ алкіл або $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ галоалкіл;

кожен із R^8 , R^{14} , R^{15} , R^{20} та R^{21} незалежно означає водень або $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ алкіл; а

R^9 означає феніл, бензил або групу (a):



(a),

де кожен феніл, бензил і кожна група (a) - як варіант - заміщений(-а) 1-3 заміщувачами, незалежно вибраними з $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ алкілу, $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ галоалкілу, галогену, ціано, гідроксі й аміно.

Оптимально сполука формули I є сполукою, в якій:

A означає x-C(=O)- , x-C(=S)- , $\text{x-C(R}^{10}\text{R}^{11}\text{)-C(=O)-}$, $\text{x-C(R}^{12}\text{R}^{13}\text{)-C(=S)-}$, x-O-C(=O)- , x-O-C(=S)- або $\text{x-C(R}^{16}\text{R}^{17}\text{)-SO}_2\text{-}$, причому x у кожному випадку означає зв'язок, приєднаний до R^1 ;

T означає CR^{18} або N;

G означає O або S;

Y^1 означає N;

Y^2 означає CR^{19} або N;

Q означає $-C(=O)-z$, $-C(=S)-z$, $-C(=O)-O-z$, $-C(=S)-O-z$, $-C(=O)-N(R^{20})-z$, $-C(=S)-N(R^{21})-z$ або $-SO_2-z$, причому z у кожному випадку означає зв'язок, приєднаний до R^9 ;

n дорівнює 1 або 2;

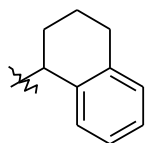
r дорівнює 1;

5 R^1 означає феніл або піразоліл; де кожен феніл і піразоліл - як варіант - заміщений 1-3 заміщувачами, незалежно вибраними з (C_1-C_4) алкілу, (C_1-C_4) галоалкілу, галогену, ціано, гідроксидної аміно;

кожен із R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{16} , R^{17} , R^{18} та R^{19} незалежно означає водень, галоген, (C_1-C_4) алкіл, (C_1-C_4) галоалкіл;

10 кожен із R^8 , R^{20} та R^{21} незалежно означає водень або (C_1-C_4) алкіл; а

R^9 означає феніл, бензил або групу (a):



(a),

15 де кожен феніл, бензил і кожна група (a) - як варіант - заміщений(-а) 1-3 заміщувачами, незалежно вибраними з (C_1-C_4) алкілу, (C_1-C_4) галоалкілу, галогену, ціано, гідроксидної аміно. (claim 9)

Оптимально сполука формули I є сполукою, в якій:

A означає $x-C(=O)-$, $-x-CR^{10}R^{11}-C(=O)-$, $x-O-C(=O)-$ або $x-C(R^{16}R^{17})-SO_2-$, причому x у кожному випадку означає зв'язок, приєднаний до R^1 ;

20 T означає CR^{18} або N;

G означає S;

Y^1 означає N;

Y^2 означає CR^{19} або N;

25 Q означає $-C(=O)-z$, $-C(=O)-O-z$, $-C(=O)-N(R^{20})-z$ або $-SO_2-z$, причому z у кожному випадку являє собою зв'язок із R^9 ;

n дорівнює 1 або 2;

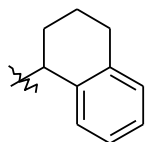
r дорівнює 1;

30 R^1 означає феніл або піразоліл, де феніл і піразоліл - як варіант - заміщені 1-3 заміщувачами, незалежно вибраними з (C_1-C_4) алкілу, (C_1-C_4) галоалкілу та галогену;

кожен із R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^{10} , R^{11} , R^{16} , R^{17} , R^{18} та R^{19} незалежно означає водень, фтор або метил;

кожен R^8 та R^{20} незалежно означає водень або метил; а

R^9 означає феніл, бензил або групу (a):



35 (a),

де кожен феніл, бензил і кожна група (a) - як варіант - заміщений(-а) 1-3 заміщувачами, незалежно вибраними з (C_1-C_4) алкілу, (C_1-C_4) галоалкілу, гідроксидної та галогену.

Оптимально сполука формули I є сполукою, в якій:

40 A означає $x-C(=O)-$, $x-CH_2-C(=O)-$, $x-O-C(=O)-$ або $x-CH_2-SO_2-$, причому x у кожному випадку означає зв'язок, приєднаний до R^1 ;

T означає CH або N;

G означає S;

Y^1 означає N;

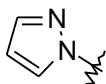
Y^2 означає CH або N;

45 Q означає $-C(=O)-z$, $-C(=O)-O-z$, $-C(=O)-NH-z$ або $-SO_2-z$, причому z у кожному випадку означає зв'язок, приєднаний до R^9 ;

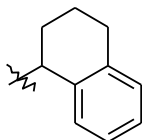
n дорівнює 1 або 2;

r дорівнює 1;

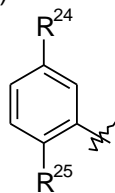
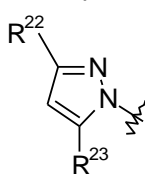
R^1 означає феніл або групу (b):



- (b),
де феніл і група (b) - як варіант - заміщені 1-3 заміщувачами, незалежно вибраними з галогену, (C₁-C₄)алкілу та (C₁-C₄)галоалкілу;
5 кожен із R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ та R⁷ означає водень;
R⁸ означає водень, а
R⁹ означає феніл, бензил або групу (a):

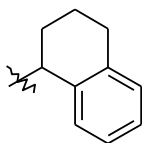


- (a),
10 де кожен феніл, бензил і кожна група (a) - як варіант - заміщений(-а) 1-3 заміщувачами, незалежно вибраними з (C₁-C₄)алкілу, (C₁-C₄)галоалкілу, гідроксі та галогену.
Оптимально сполука формули I є сполукою, в якій:
А означає х-CH₂-C(=O)-, де х означає зв'язок, приєднаний до R¹;
Т означає CH;
15 G означає S;
Y¹ означає N;
Y² означає CH;
Q означає -C(=O)-z, -C(=O)-O-z або C(=O)-N(R²⁰)-z, причому z у кожному випадку означає зв'язок, приєднаний до R⁹;
20 n дорівнює 2;
p дорівнює 1;
R¹ вибраний із груп (c) або (d):

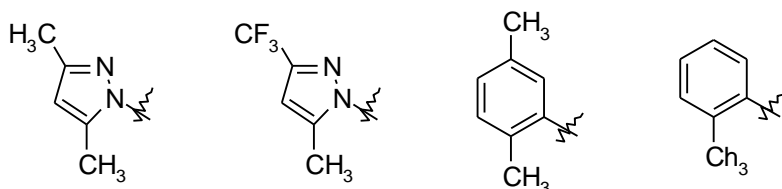


(c), (d),

- 25 де R²², R²³, R²⁴ та R²⁵ незалежно вибрані з водню, галогену, метилу та галометилу;
кожен із R₂, R₃, R₄, R₅, R₆ та R₇ означає водень;
R₈ означає водень;
R⁹ означає феніл, бензил або групу (a):

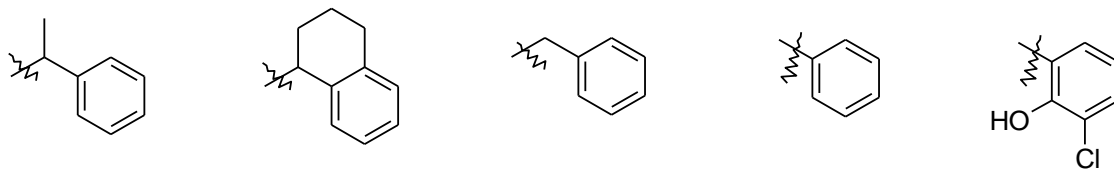


- (a),
30 де феніл, бензил і група (a) - як варіант - заміщені 1-3 заміщувачами, незалежно вибраними з галогену, гідроксі, метилу та галометилу.
Цей винахід також пропонує сполуку формули I, в якій:
А означає х-CH₂C(=O)-, х-CH₂C(=S)-, х-OC(=O)-, х-C(=O)- або х-CH₂-SO₂-, причому х у кожному випадку означає зв'язок, приєднаний до R¹;
35 Т означає CH або N;
G означає O або S;
Y¹ означає N;
Y² означає CH або N;
Q означає -C(=O)-z, -C(=S)-z, -C(=O)O-z, -C(=O)NH-z або -SO₂-z, причому z у кожному
40 випадку означає зв'язок, приєднаний до R⁹;
n дорівнює 1 або 2;
p дорівнює 1 або 2, за умови, що якщо n дорівнює 2, p дорівнює 1;
R¹ означає групу (e), (f), (g) або (h):



(e), (f), (g), (h);

R^2, R^3, R^4, R^5, R^6 та R^7 означають H;
 R^8 означає H або метил;
 R^9 означає групу (i), (j), (k), (l) або (m):



(i)

5

), (j), (k), (l), (m).

У наступному переліку наведено визначення, включаючи оптимальні визначення, для замішувачів A, T, G, Y^1 , Y^2 , Q, n, p, $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{14}, R^{15}, R^{16}, R^{17}, R^{18}, R^{19}, R^{20}, R^{21}, R^{22}, R^{23}, R^{24}, R^{25}, R^{26}$ та R^{27} стосовно сполук формули I. Для будь-якого з цих замішувачів будь-яке з наведених нижче визначень можна застосовувати в поєднанні з будь-яким визначенням будь-якого іншого замішувача, наведеним нижче чи в будь-якому іншому місці цього документа. Цей винахід охоплює сполуки формули з усіма можливими поєднаннями наведених нижче визначень замішувачів. Загалом будь-яке визначення замішувача в цьому документі може вживатися в поєднанні з будь-яким іншим визначенням замішувача.

10

15

A означає $x-C(=O)-$, $x-C(=S)-$, $x-C(R^{10}R^{11})-C(=O)-$, $x-C(R^{12}R^{13})-C(=S)-$, $x-O-C(=O)-$, $x-O-C(=S)-$, $x-N(R^{14})-C(=O)-$, $x-N(R^{15})-C(=S)-$, $x-C(R^{16}R^{17})-SO_2-$ або $x-N=C(R^{26})-$, причому x у кожному випадку означає зв'язок, приєднаний до R^1 . Оптимально A означає $x-C(=O)-$, $x-C(=S)-$, $x-C(R^{10}R^{11})-C(=O)-$, $x-C(R^{12}R^{13})-C(=S)-$, $x-O-C(=O)-$, $x-O-C(=S)-$, $x-N(R^{14})-C(=O)-$, $x-N(R^{15})-C(=S)-$ або $x-C(R^{16}R^{17})-SO_2-$, у кожному випадку x означає зв'язок, приєднаний до R^1 . Оптимальніше A означає $x-C(=O)-$, $x-C(=S)-$, $x-C(R^{10}R^{11})-C(=O)-$, $x-C(R^{12}R^{13})-C(=S)-$, $x-O-C(=O)-$, $x-O-C(=S)-$ або $x-C(R^{16}R^{17})-SO_2-$, причому x у кожному випадку означає зв'язок, приєднаний до R^1 . Ще оптимальніше A означає $x-C(=O)-$, $-x-CR^{10}R^{11}-C(=O)-$, $x-O-C(=O)-$ або $x-C(R^{16}R^{17})-SO_2-$, причому x у кожному випадку означає зв'язок, приєднаний до R^1 . Навіть ще оптимальніше A означає $x-CH_2C(=O)-$, $x-CH_2C(=S)-$, $x-OC(=O)-$, $x-C(=O)-$ або $x-CH_2-SO_2-$, причому x у кожному випадку означає зв'язок, приєднаний до R^1 . Найоптимальніше A означає $x-CH_2-C(=O)-$, де x означає зв'язок, приєднаний до R^1 .

20

25

T означає CR^{18} або N. Оптимально T означає CH або N. Оптимальніше T означає CH.

G означає O або S. Оптимально G означає S.

30

Y^1 означає CR^{19} або N. Оптимально Y^1 означає N.

Y^2 означає CR^{19} або N. Оптимально Y^2 означає CH або N. Оптимальніше Y^2 означає CH.

Q означає $-C(=O)-z$, $-C(=S)-z$, $-C(=O)-O-z$, $-C(=S)-O-z$, $-C(=O)-N(R^{20})-z$, $-C(=S)-N(R^{21})-z$ або $-SO_2-z$, причому z у кожному випадку означає зв'язок, приєднаний до R^9 . Оптимально Q означає $-C(=O)-z$, $-C(=S)-z$, $-C(=O)O-z$, $-C(=O)NH-z$ або $-SO_2-z$, причому z у кожному випадку означає зв'язок, приєднаний до R^9 . Оптимально Q означає $-C(=O)-z$, $-C(=O)-O-z$, $-C(=O)-N(R^{20})-z$ або $-SO_2-z$, причому z у кожному випадку означає зв'язок, приєднаний до R^9 . Оптимальніше Q означає $-C(=O)-z$, $-C(=O)-O-z$, $-C(=O)-NH-z$ або $-SO_2-z$, причому z у кожному випадку означає зв'язок, приєднаний до R^9 . Ще оптимальніше Q означає $-C(=O)-z$, $-C(=O)-O-z$ або $C(=O)-N(R^{20})-z$, причому z у кожному випадку означає зв'язок, приєднаний до R^9 . Найоптимальніше Q означає $-C(=O)-z$, де z означає зв'язок, приєднаний до R^9 .

35

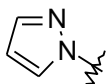
40

n дорівнює 1 або 2. Оптимально n дорівнює 2.

p дорівнює 1 або 2, за умови, що, якщо n рівне 2, p дорівнює 1. Оптимально p дорівнює 1.

R^1 означає феніл, піридил, імідазоліл або піразоліл, де кожен феніл, піридил, імідазоліл та піразоліл - як варіант - заміщений 1-3 замішувачами, незалежно вибраними з (C_1-C_4) алкілу, (C_1-C_4) галоалкілу, галогену, ціано, гідроксі й аміно. Оптимально R^1 означає феніл або піразоліл, де кожен феніл і піразоліл - як варіант - заміщений 1-3 замішувачами, незалежно вибраними з (C_1-C_4) алкілу, (C_1-C_4) галоалкілу, галогену, ціано, гідроксі й аміно. Оптимально R^1 означає феніл або піразоліл, де феніл і піразоліл - як варіант - заміщені 1-3 замішувачами, незалежно вибраними з (C_1-C_4) алкілу, (C_1-C_4) галоалкілу та галогену. Оптимальніше R^1 означає феніл або групу (b):

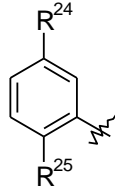
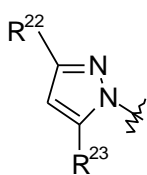
45



(b),

де феніл і група (b) - як варіант - заміщені 1-3 заміщувачами, незалежно вибраними з галогену, (C₁-C₄)алкілу та (C₁-C₄)галоалкілу.

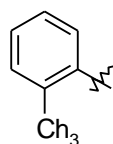
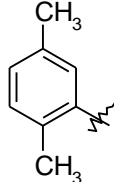
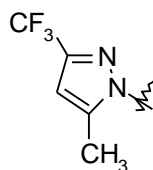
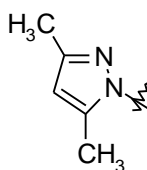
5 В одній із груп сполук R¹ вибрано з груп (c) або (d):



(c), (d),

де R²², R²³, R²⁴ та R²⁵ незалежно вибрані з водню, галогену, метилу та галометилу.

В одній з груп сполук R¹ означає групу (e), (f), (g) або (h):



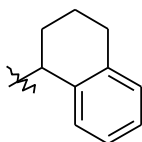
(e), (f), (g), (h).

10 Кожен із R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸ та R¹⁹ незалежно означає водень, галоген, ціано, (C₁-C₄)алкіл або (C₁-C₄)галоалкіл. Оптимально кожен із R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸ та R¹⁹ незалежно означає водень, галоген, (C₁-C₄)алкіл або (C₁-C₄)галоалкіл. Оптимальніше кожен із R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸ та R¹⁹ незалежно означає водень, фтор або метил. Ще оптимальніше кожен із R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁶, R¹⁷, R¹⁸ та R¹⁹ незалежно означає водень.

15 Кожен із R⁸, R¹⁴, R¹⁵, R²⁰ та R²¹ незалежно означає водень або (C₁-C₄)алкіл. Оптимально кожен із R⁸, R¹⁴, R¹⁵, R²⁰ та R²¹ незалежно означає водень або метил.

Оптимальніше кожен із R⁸, R¹⁴, R¹⁵, R²⁰ та R²¹ незалежно означає водень.

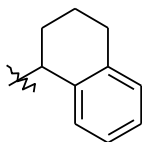
R⁹ означає феніл, бензил або групу (a):



20

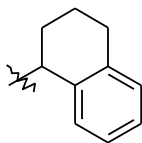
(a),

де кожен феніл, бензил і кожна група (a) - як варіант - заміщений(-а) 1-3 заміщувачами, незалежно вибраними з (C₁-C₄)алкілу, (C₁-C₄)галоалкілу, (C₁-C₄)алкокси, (C₁-C₄)галоалкокси, галогену, ціано, гідроксилу, N(R²⁷)₂, SH, (C₁-C₄)алкілтіо, нітро, фенілсульфонілу та фенілсульфінілу, де фенілсульфоніл і фенілсульфініл - як варіант - заміщені 1-3 заміщувачами, незалежно вибраними з (C₁-C₄)алкілу, (C₁-C₄)галоалкілу, (C₁-C₄)алкокси, (C₁-C₄)галоалкокси, галогену та ціано. Оптимально R⁹ означає феніл, бензил або групу (a):



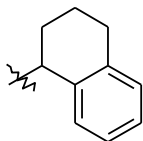
(a),

30 де кожен феніл, бензил і кожна група (a) - як варіант - заміщений(-а) 1-3 заміщувачами, незалежно вибраними з (C₁-C₄)алкілу, (C₁-C₄)галоалкілу, галогену, ціано, гідроксі й аміно. Оптимально R⁹ означає феніл, бензил або групу (a):



(a),

де кожен феніл, бензил і кожна група (а) - як варіант - заміщені(-а) 1-3 заміщувачами, незалежно вибраними з (C₁-C₄)алкілу, (C₁-C₄)галоалкілу, гідроксі та галогену. Оптимальніше R⁹ означає феніл, бензил або групу (а):



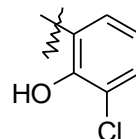
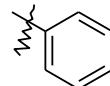
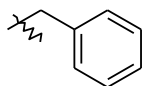
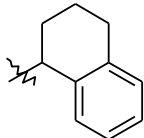
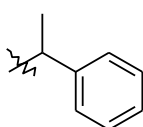
5 (а),

де феніл, бензил і група (а) - як варіант - заміщені 1-3 заміщувачами, незалежно вибраними з галогену, гідроксі, метилу та галометилу.

R²⁶ означає водень, галоген, ціано, (C₁-C₄)алкіл або (C₁-C₄)галоалкіл. Оптимально R²⁶ означає водень, галоген, (C₁-C₄)алкіл або (C₁-C₄)галоалкіл. Оптимально R²⁶ означає водень, фтор або метил. Оптимальніше R²⁶ означає водень.

10 Кожен R²⁷ незалежно означає водень, (C₁-C₄)алкіл, фенілсульфоніл або фенілсульфініл, де фенілсульфоніл і фенілсульфініл - як варіант - заміщені 1-3 заміщувачами, незалежно вибраними з (C₁-C₄)алкілу, (C₁-C₄)галоалкілу, (C₁-C₄)алкокси, (C₁-C₄)галоалкокси, галогену та ціано. Оптимально R²⁷ незалежно означає водень, (C₁-C₄)алкіл, фенілсульфоніл або фенілсульфініл, де фенілсульфоніл і фенілсульфініл - як варіант - заміщені 1-3 заміщувачами, незалежно вибраними з галогену, метилу та галометилу.

В одній із груп сполук R⁹ означає групу (і), (j), (k), (l) або (m):



(і), (j), (k), (l), (m).

20 Оптимально R²² означає водень або CF₃.

Оптимально R²³, R²⁴ та R²⁵ незалежно означають водень або метил.

В одній із груп сполук G означає S, Y¹ означає N, а Y² означає CH.

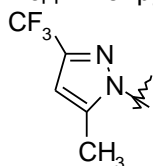
В одній із груп сполук р дорівнює 1, а n дорівнює 2.

В одній із груп сполук R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ та R⁷ означають H.

25 В одній із груп сполук Q означає -C(=O)-z, де z означає зв'язок, приєднаний до R⁹.

В одній із груп сполук A означає x-CH₂-C(=O)-, де x означає зв'язок, приєднаний до R¹.

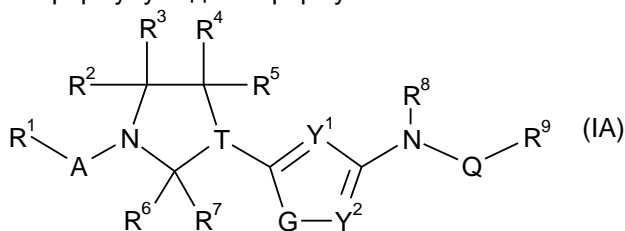
В одній із груп сполук R¹ означає групу (f)



(f).

30 В одній із груп сполук R⁹ означає феніл, заміщений гідроксилом, а як варіант - заміщений одним або двома додатковими заміщувачами згідно з наведеними вище визначеннями. Оптимально гідроксі знаходиться в орто-положенні. Оптимально одним із додаткових заміщувачів є галоген, і оптимально він знаходиться в мета-положенні, суміжно з гідроксі.

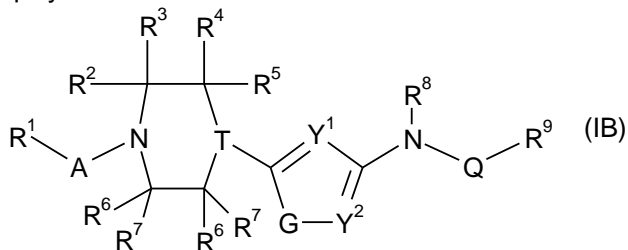
35 З метою уникнення непорозумінь, якщо n дорівнює 1 та р дорівнює 1, сполуки формули I мають формулу згідно з формулою IA:



в якій A, T, G, Y¹, Y², Q, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ та R⁹ відповідають визначенням для формули I.

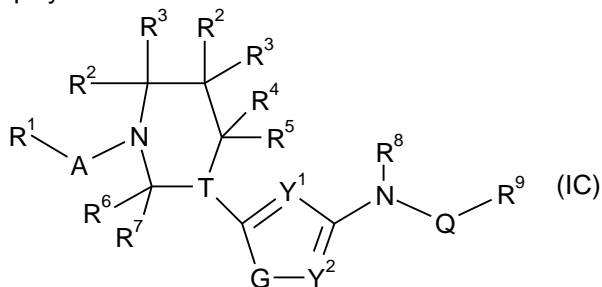
Якщо n дорівнює 2, а р дорівнює 1, сполуки формули I мають формулу згідно

з формулою IB:



в якій A, T, G, Y¹, Y², Q, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ та R⁹ відповідають визначенням для формули I.

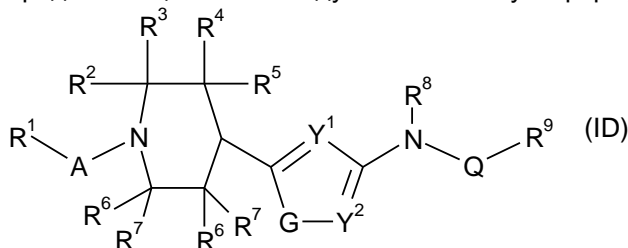
5 Якщо n дорівнює 1, а р дорівнює 2, сполуки формули I мають формулу згідно з формулою IC:



в якій A, T, G, Y¹, Y², Q, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ та R⁹ відповідають визначенням для формули I.

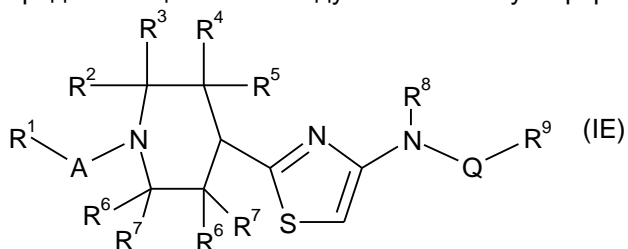
10 Предметом цього винаходу також є вказані вище сполуки формули IA, формули IB та формули IC.

Предметом цього винаходу є також сполуки формули ID:



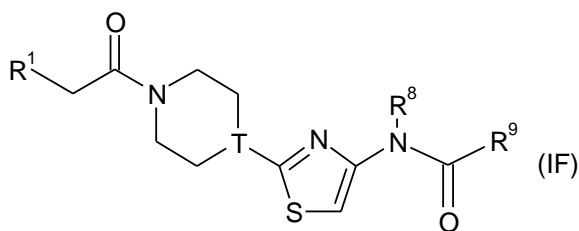
15 в якій A, G, Y¹, Y², Q, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ та R⁹ відповідають визначенням для формули I. Оптимальними для A, G, Y¹, Y², Q, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ та R⁹ є визначення, наведені для формули I.

Предметом цього винаходу є також сполуки формули IE:



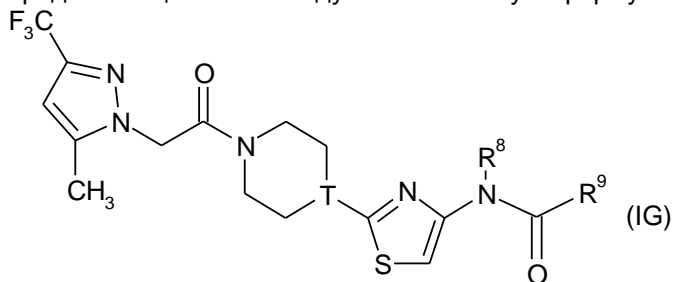
20 в якій A, Q, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ та R⁹ відповідають визначенням для формули I. Оптимальними для A, Q, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ та R⁹ є визначення, наведені для формули I.

Предметом цього винаходу є також сполуки формули IF:



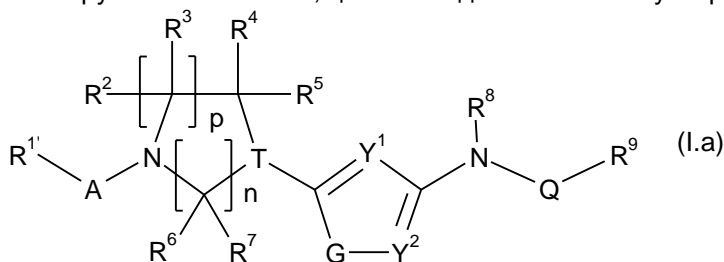
- де Т означає СН або N,
 R^8 означає CH_3 або H, а
 R^1 та R^9 відповідають визначенням для формули I. Оптимальними для R^1 та R^9 є визначення, наведені для формули I.

Предметом цього винаходу є також сполуки формули IG:



- де Т означає СН або N,
 R^8 означає CH_3 або H, а
 R^9 відповідає визначенню для формули I. Оптимальними для R^9 є визначення, наведені для формули I.

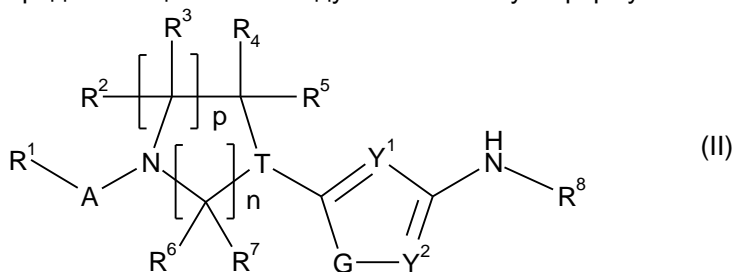
Цей винахід охоплює також сполуки формули I, у якій R^1 означає захисну групу, таку як алкільна група. Таким чином, цей винахід охоплює сполуки формули I.a:



- в якій $R^{1'}$ означає (C_1-C_8) алкіл, наприклад (C_1-C_4) алкіл, наприклад трет-бутил, а A, T, G, Y^1 , Y^2 , Q, n, p, R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 та R^9 відповідають визначенням для формули I. Оптимально A означає $x-O-C(=O)-$, де x означає зв'язок з R^1 . Оптимальними для A, T, G, Y^1 , Y^2 , Q, n, p, R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 та R^9 є визначення, наведені для формули I.

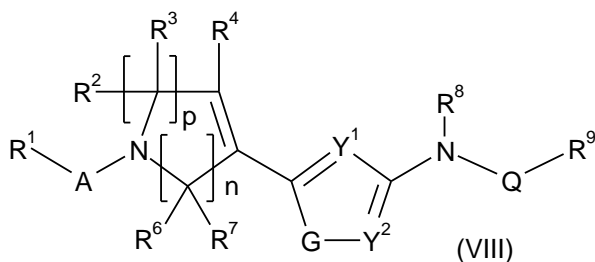
Ці сполуки придатні для синтезу сполук формули I.

- Предметом цього винаходу є також сполуки формули II:



де R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , A, T, G, Y^1 , Y^2 , p та n відповідають визначенням для формули I. Оптимальними для R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , A, T, G, Y^1 , Y^2 , p та n є визначення, наведені для формули I. Сполуки формули II представляють інтерес як проміжні продукти при синтезі сполук формули I.

Предметом цього винаходу є також сполуки формули VIII:



де $R^1, R^2, R^3, R^4, R^6, R^7, R^8, A, T, G, Y^1, Y^2, p$ та n відповідають визначенням для формули I. Оптимальними для $R^1, R^2, R^3, R^4, R^6, R^7, R^8, A, T, G, Y^1, Y^2, p$ та n є визначення, наведені для формули I. Сполуки формули VIII представляють інтерес як проміжні продукти при синтезі

5 сполук формули I.

Оптимальними окремими сполуками є:

(2-{1-[2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-іл)-амід (R)-1,2,3,4-тетрагідронафталін-1-карбонової кислоти (сполука № I.g.001);

3-хлор-2-гідроксі-N-(2-{1-[2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-іл)-бензамід (сполука № I.g.006);

(2-{1-[2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-іл)-амід 1,2,3,4-тетрагідронафталін-1-карбонової кислоти (сполука № I.g.011);

1,2,3,4-тетрагідронафталін-1-іловий ефір (2-{1-[2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-іл)-карбамінової кислоти (сполука № I.g.013);

N-2-{1-[2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-іл)-2-фенілпропіонамід (сполука № I.g.016);

1-фенілетиловий ефір N-(2-{1-[2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-іл)-карбамінової кислоти (сполука № I.g.018);

N-2-{1-[2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-іл)-бензамід (сполука № I.g.021);

Феніловий ефір (2-{1-[2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-іл)-карбамінової кислоти (сполука № I.g.023);

1-(2-{1-[2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-іл)-3-фенілсечовина (сполука № I.g.024);

(2-{1-[2-(2,5-диметилфеніл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-іл)-амід 1,2,3,4-тетрагідронафталін-1-карбонової кислоти (сполука № I.g.136);

N-(2-{1-[2-(2,5-диметилфеніл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-іл)-2-фенілпропіонамід (сполука № I.g.141);

N-{2-[1-(2,5-диметил-фенілметансульфоніл)-піперидин-4-іл]-тіазол-4-іл}-бензамід (сполука № I.g.246);

{2-[1-(2-о-толілацетил)-піперидин-4-іл]-тіазол-4-іл}-амід 1,2,3,4-тетрагідронафталін-1-карбонової кислоти (сполука № I.g.386);

3-фтор-2-гідроксі-N-(2-{1-[2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-іл)-бензамід (сполука № I.g.501);

3-бром-2-гідроксі-N-(2-{1-[2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-іл)-бензамід (сполука № I.g.502);

2-гідроксі-N-(2-{1-[2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-іл)-бензамід (сполука № I.g.503);

2-метоксі-N-(2-{1-[2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-іл)-бензамід (сполука № I.g.506);

N-2-{1-[2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-іл)-2-(толуол-4-сульфоніламіно)-бензамід (сполука № I.g.508);

2-метоксі-6-гідроксі-N-(2-{1-[2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-іл)-бензамід (сполука № I.g.509);

2-фтор-6-гідроксі-N-(2-{1-[2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-іл)-бензамід (сполука № I.g.510);

3-метоксі-2-гідроксі-N-(2-{1-[2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-іл)-бензамід (сполука № I.g.510); метил-(2-{1-[2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-іл)-амід 1,2,3,4-тетрагідронафталін-1-карбонової кислоти

(сполука № I.h.011); та

N-метил-N-2-{1-[2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-іл)-2-фенілпропіонамід (сполука № I.h.016);

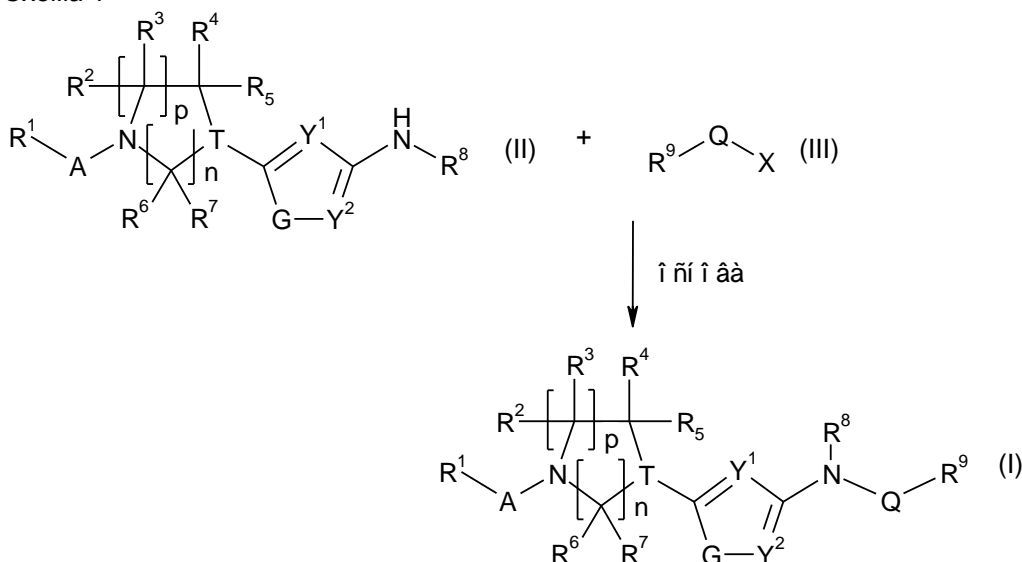
(2-{4-[2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-ацетил]-піперазин-1-іл}-тіазол-4-іл)-амід

1,2,3,4-тетрагідронафталін-1-карбонової кислоти (сполука № I.n.011); а також N-(2-{4-[2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-ацетил]-піперазин-1-іл}-тіазол-4-іл)-бензамід (сполука № I.n.011).

Сполуки формули (I) можуть бути отримані згідно з наведеними нижче схемами.

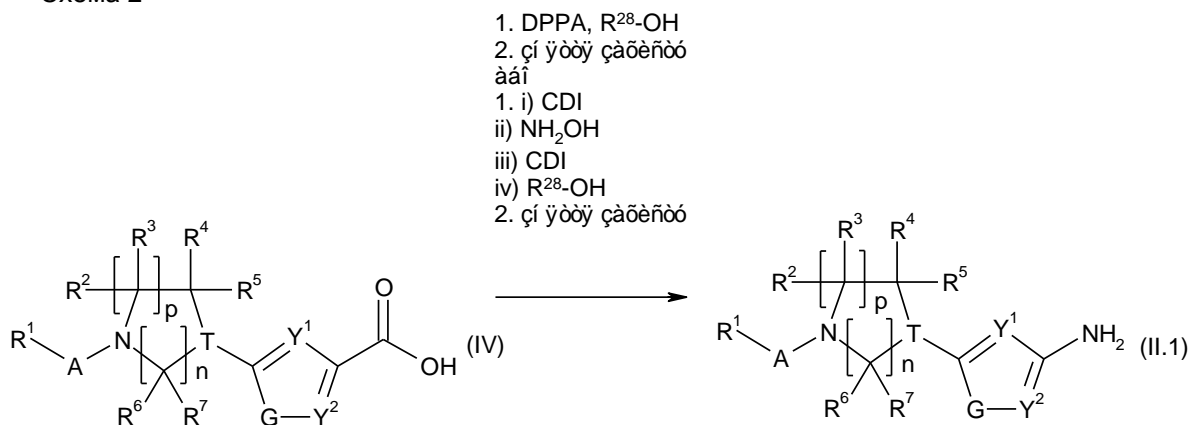
- 5 Сполуки формули I, в якій $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, A, T, G, Y^1, Y^2, n, p$ та Q відповідають визначенням для формули I, можуть бути отримані шляхом трансформації сполуки формули II, у якій $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, A, T, G, Y^1, Y^2, n, p$ та Y відповідають визначенням для формули I, при її взаємодії зі сполукою формули III, у якій R^9 та Q відповідають визначенням для формули I, а X означає гідроксі, галоген, оптимально фтор, хлор
- 10 чи бром, або алкоксі, такий як метоксі чи етоксі. Це показано на схемі 1.

Схема 1



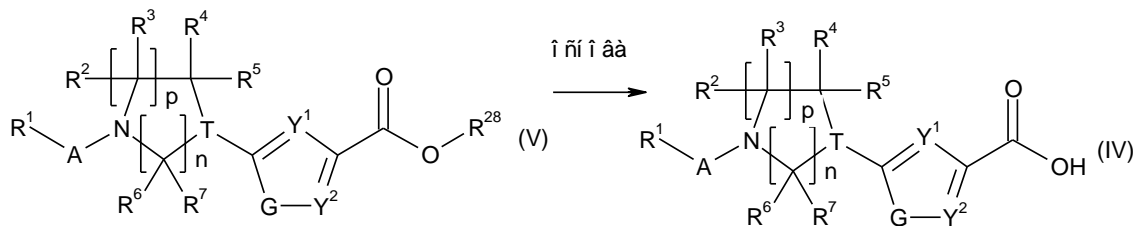
- 15 Сполуки формули II.1, в якій $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, A, T, G, n, p, Y^1$ та Y^2 відповідають визначенням для формули I, можуть бути отримані шляхом трансформації сполуки формули IV, в якій $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, A, T, G, n, p, Y^1$ та Y^2 відповідають визначенням для формули I, при її взаємодії з азидом, таким як дифенілфосфорилазид, з наступним перегрупуванням Курціуса отриманого ацилазиду з використанням спирту $R^{28}-OH$, де R^{28} означає (C_1-C_6) алкіл або
- 20 - як варіант - заміщений арил, та подальшим гідролізом карбамату з використанням неорганічної кислоти, такої як соляна кислота чи сірчана кислота, або органічної кислоти, такої як трифтороцтова кислота. Це показано на схемі 2.

Схема 2



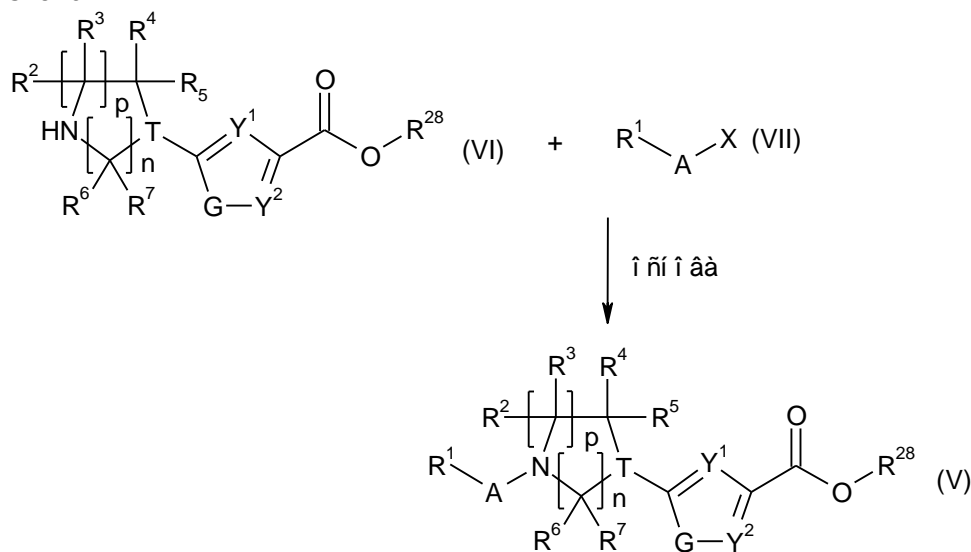
- 25 Сполуки формули IV, в якій $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, A, T, G, n, p, Y^1$ та Y^2 відповідають визначенням для формули I, можуть бути отримані шляхом омилення сполуки формули V, в якій $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, A, T, G, n, p, Y^1$ та Y^2 відповідають визначенням для формули I, а R^{28} означає (C_1-C_6) алкіл або - як варіант - заміщений арил, при її взаємодії з основою, такою як гідроксид натрію, гідроксид калію або гідроксид літію. Це показано на схемі 3.

Схема 3



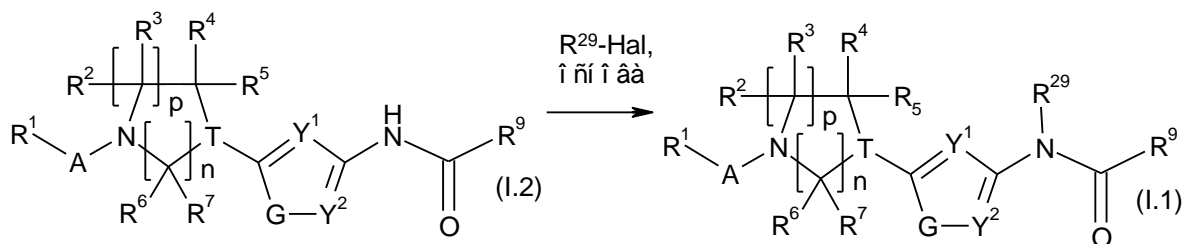
полуки формули V, у якій R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , A, T, G, n, p, Y^1 та Y^2 відповідають визначенням для формули I, а R^{28} означає (C_1-C_6) алкіл або - як варіант - заміщений арил, можуть бути отримані шляхом трансформації сполуки формули VI, у якій R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , T, G, n, p, Y^1 та Y^2 відповідають визначенням для формули I, а R^{28} означає (C_1-C_6) алкіл або - як варіант - заміщений арил, при її взаємодії зі сполукою формули VII, в якій R^1 та A відповідають визначенням для формули I, а X означає гідроксі, галоген, оптимально фтор, хлор чи бром, або алкокси, наприклад метоксі чи етоксі. Це показано на схемі 4.

Схема 4



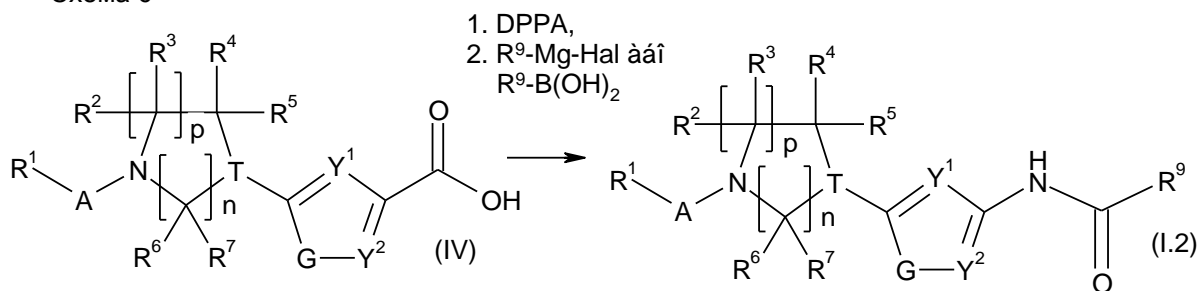
Як варіант, сполуки формули I.1, в якій R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^9 , A, T, G, n, Y^1 та Y^2 відповідають визначенням для формули I, а R^{29} означає (C_1-C_6) алкіл, можуть бути отримані шляхом трансформації сполуки формули I.2, в якій R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^9 , A, T, G, n, Y^1 та Y^2 відповідають визначенням для формули I, при її взаємодії з алкілгалогенідом R^{29} -Hal, де R^{29} означає (C_1-C_6) алкіл, а Hal означає галоген, оптимально хлор або бром. Це показано на схемі 5.

Схема 5



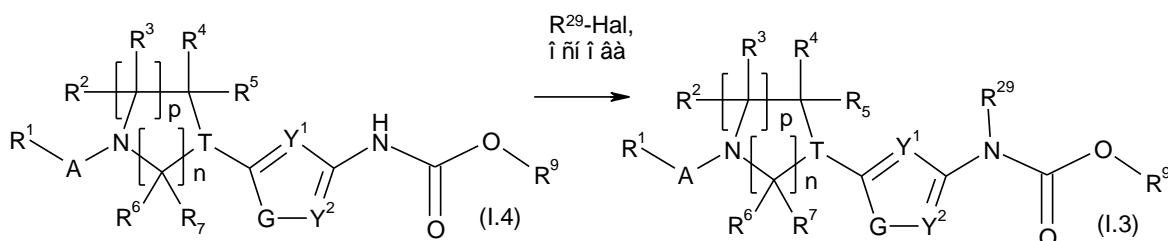
Сполуки формули I.2, в якій R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^9 , A, T, G, n, p, Y^1 та Y^2 відповідають визначенням для формули I, можуть бути отримані шляхом трансформації сполуки формули IV, в якій R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , A, T, G, n, p, Y^1 та Y^2 відповідають визначенням для формули I, при її взаємодії з азидом, таким як дифенілфосфорилазид, з наступним перегрупуванням Курціуса отриманого ацилазиду з використанням реактиву Гриньяра R^9 -Mg-Hal, де R^9 відповідає визначенню для формули I, а Hal означає галоген, оптимально хлор, бром чи йод, або боронової кислоти R^9 -B(OH)₂, де R^9 відповідає визначенню для формули I, та каталізатора, такого як гідроксид біс(1,5-циклооктадієн)родію(I). Це показано на схемі 6.

Схема 6



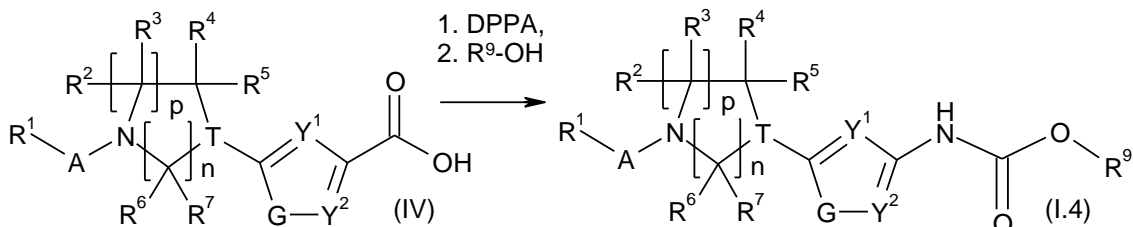
Як варіант, сполуки формули I.3, в якій $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^9, A, T, G, n, p, Y^1$ та Y^2 відповідають визначенням для формули I, а R^{29} означає (C_1-C_6) алкіл, можуть бути отримані шляхом трансформації сполуки формули I.4, в якій $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^9, A, T, G, n, p, Y^1$ та Y^2 відповідають визначенням для формули I, при її взаємодії з алкілгалогенідом $R^{29}\text{-Hal}$, де R^{29} означає (C_1-C_6) алкіл, а Hal означає галоген, оптимально хлор або бром. Це показано на схемі 7.

Схема 7



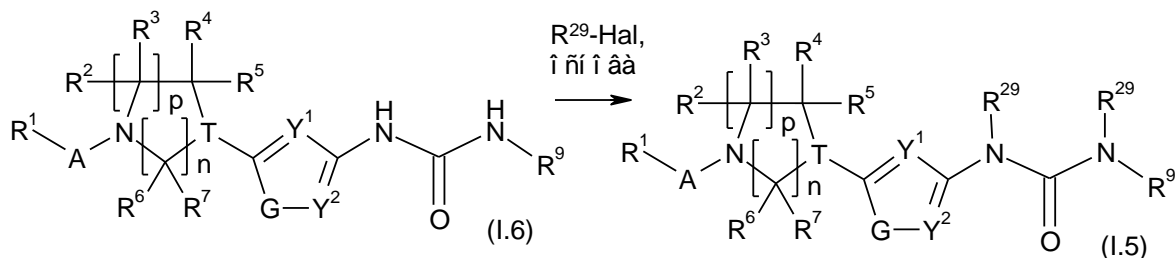
Сполуки формули I.4, в якій $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^9, A, T, G, n, p, Y^1$ та Y^2 відповідають визначенням для формули I, можуть бути отримані шляхом трансформації сполуки формули IV, в якій $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, A, T, G, n, p, Y^1$ та Y^2 відповідають визначенням для формули I, при її взаємодії з азидом, таким як дифенілфосфорилазид, з наступним перегрупуванням Курціуса отриманого ацилазиду з використанням спирту $R^9\text{-OH}$, де R^9 відповідає визначенню для формули I. Це показано на схемі 8.

Схема 8



Як варіант, сполуки формули I.5, в якій $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^9, A, T, G, n, p, Y^1$ та Y^2 відповідають визначенням для формули I, а R^{29} означає (C_1-C_6) алкіл, можуть бути отримані шляхом трансформації сполуки формули I.6, в якій $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^9, A, T, G, n, p, Y^1$ та Y^2 відповідають визначенням для формули I, при її взаємодії з алкілгалогенідом $R^{29}\text{-Hal}$, де R^{29} означає (C_1-C_6) алкіл, а Hal означає галоген, оптимально хлор або бром. Це показано на схемі 9.

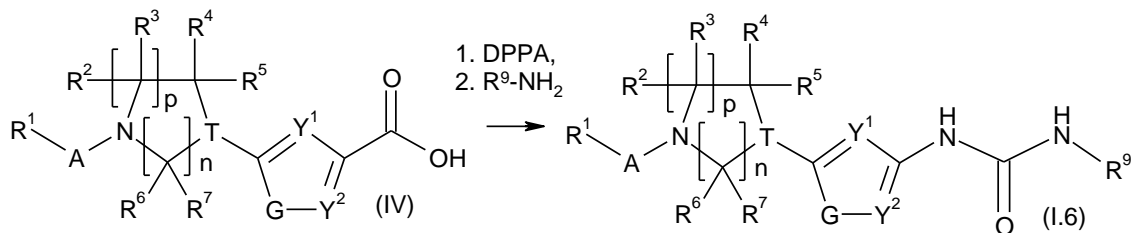
Схема 9



Сполуки формули I.6, в якій $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^9, A, T, G, n, p, Y^1$ та Y^2 відповідають визначенням для формули I, можуть бути отримані шляхом трансформації сполуки формули IV, в якій $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, A, T, G, n, p, Y^1$ та Y^2 відповідають визначенням для формули I, при її взаємодії з азидом, таким як дифенілфосфорилазид, з наступним перегрупуванням

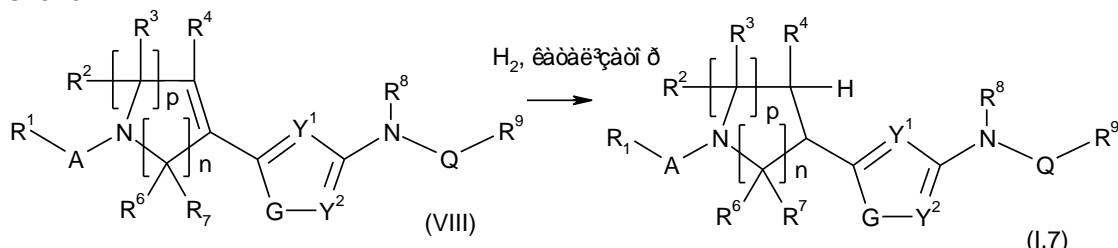
Курціуса отриманого ацилазиду з використанням аміну R^9-NH_2 , де R^9 відповідає визначенню для формули I. Це показано на схемі 10.

Схема 10



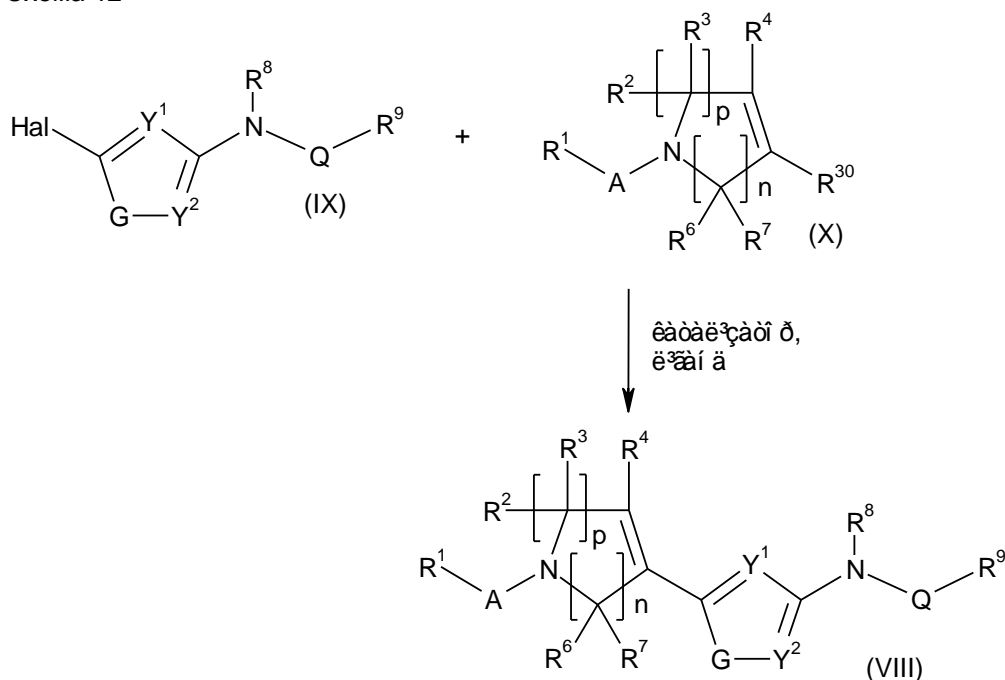
Як варіант, сполуки формули I.7, в якій $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, A, G, n, p, Y^1, Y^2$ та Q відповідають визначенням для формули I, можуть бути отримані шляхом відновлення сполуки формули VIII, в якій $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, A, G, n, p, Y^1, Y^2$ та Q відповідають визначенням для формули I, при її взаємодії з воднем та каталізатором, таким як паладій на активованому вугіллі, платина або скелетний нікелевий каталізатор. Це показано на схемі 11.

Схема 11



Сполуки формули VIII, в якій $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^9, A, G, n, p, Y^1, Y^2$ та Q відповідають визначенням для формули I, можуть бути отримані за допомогою реакції перехресного сполучення сполуки формули IX, в якій R^8, R^9, G, Y^1, Y^2 та Q відповідають визначенням для формули I, а Hal означає галоген, оптимально хлор, бром чи йод, зі сполукою формули X, в якій $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7$ та A відповідають визначенням для формули I, а R³⁰ означає B(OH)₂, при їх взаємодії з перехідним металом, таким як тетракіс(трифенілфосфін)паладій, та лігандом. Це показано на схемі 12.

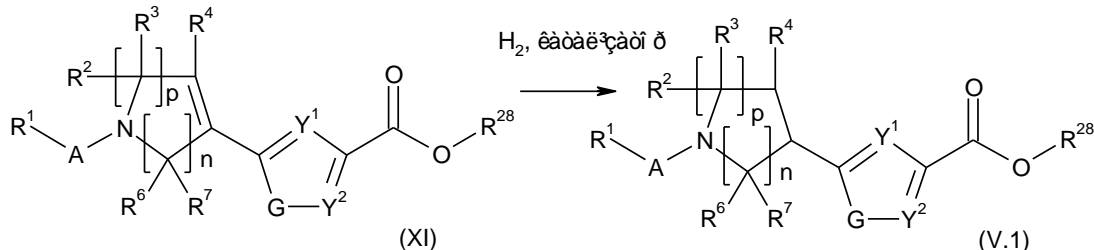
Схема 12



Як варіант, сполуки формули V.1, в якій $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, A, G, n, p, Y^1$ та Y² відповідають визначенням для формули I, а R²⁸ означає (C₁-C₆)алкіл або - як варіант - заміщений арил, можуть бути отримані шляхом відновлення сполуки формули XI, в якій $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, A, G, n, p, Y^1$ та Y² відповідають визначенням для формули I, а R²⁸ означає (C₁-C₆)алкіл або - як варіант - заміщений арил, при її взаємодії з воднем і каталізатором, таким

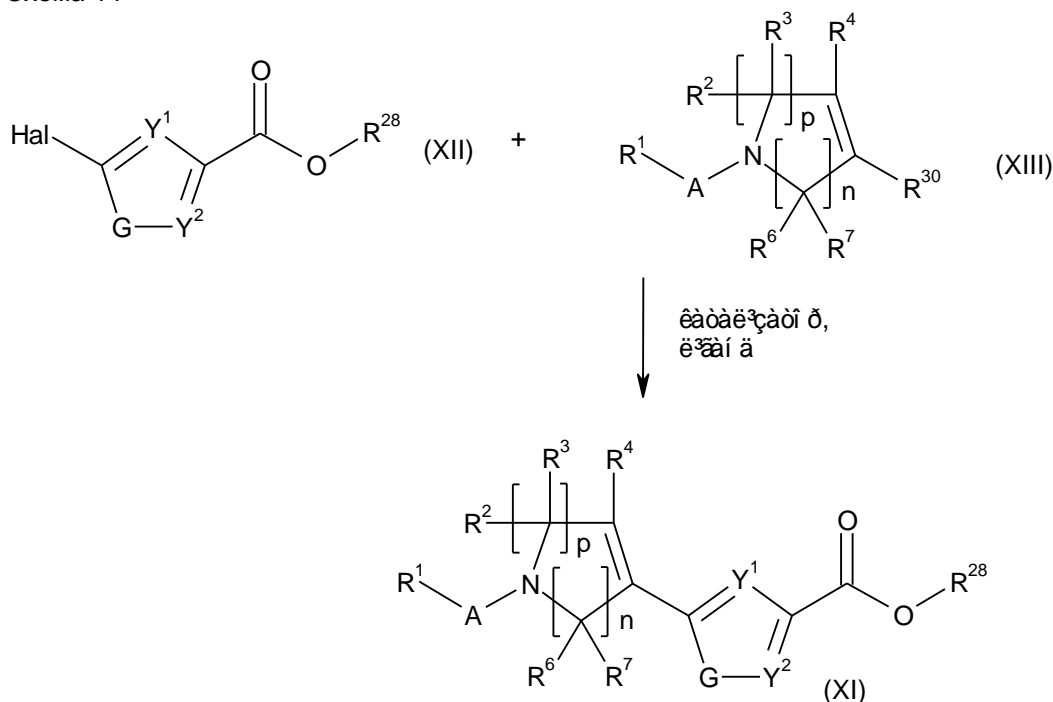
як паладій на активованому вугіллі, платина або скелетний нікелевий каталізатор. Це показано на схемі 13.

Схема 13



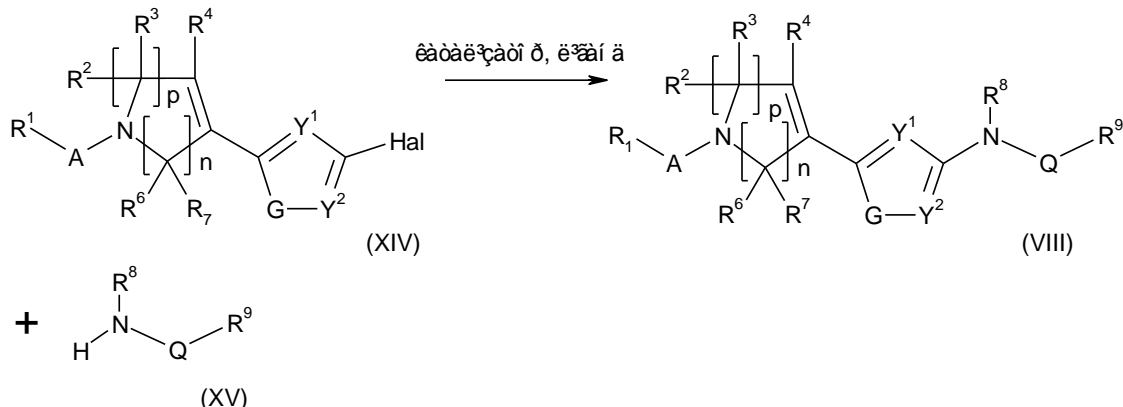
- 5 Сполуки формули XI, в якій R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , A, G, n, p, Y^1 та Y^2 відповідають визначенням для формули I, а R^{28} означає (C₁-C₆)алкіл або - як варіант - заміщений арил, можуть бути отримані за допомогою реакції перехресного сполучення сполуки формули XII, в якій G, Y^1 та Y^2 відповідають визначенням для формули I, R^{28} означає (C₁-C₆)алкіл або - як варіант - заміщений арил, а Hal означає галоген, оптимально хлор, бром або йод, зі сполукою
- 10 формули XIII, у якій R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 та A відповідають визначенням для формули I, а R^{30} означає B(OH)₂, при їх взаємодії з перехідним металом, таким як хлорид біс-(трифенілфосфін)паладію(II). Це показано на схемі 14.

Схема 14



- 15 Як варіант, сполуки формули VIII, в якій R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , A, G, n, p, Y^1 , Y^2 та Q відповідають визначенням для формули I, можуть бути отримані за допомогою реакції перехресного сполучення сполуки формули XIV, в якій R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 , A, G, n, p, Y^1 та Y^2 відповідають визначенням для формули I, зі сполукою формули XV, в якій R^8 , R^9 та Q відповідають визначенням для формули I, при їх взаємодії з лігандом, таким як ксантфос або
- 20 диметилетилендіамін, та каталізатором, таким як Pd(OAc)₂ або йодид міді. Це показано на схемі 15.

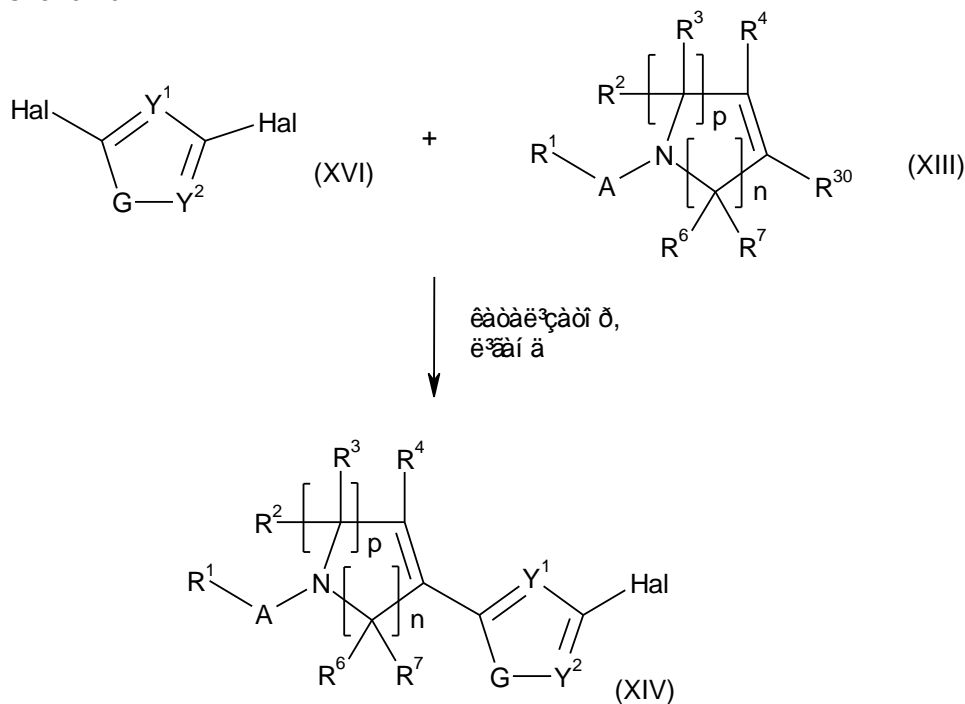
Схема 15



5

Сполуки формули XIV, в якій R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , A, G, n, p, Y^1 та Y^2 відповідають визначенням для формули I, можуть бути отримані за допомогою реакції перехресного сполучення сполуки формули XVI, в якій G, Y^1 та Y^2 відповідають визначенням для формули I, зі сполукою формули XIII, в якій R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 та A відповідають визначенням для формули I, а R^{30} означає $\text{B}(\text{OH})_2$, при їх взаємодії з перехідним металом, таким як хлорид біс-(трифенілфосфін)паладію(II). Це показано на схемі 16.

Схема 16



10

Авторами цієї розробки було виявлено, що з точки зору практичного застосування нові сполуки формули I характеризуються надто високим рівнем біологічної активності для захисту рослин від захворювань, викликаних грибками.

15

Сполуки формули I можуть використовуватися в агропромисловому виробництві та споріднених сферах застосування, наприклад в якості діючих речовин для боротьби зі шкідниками рослин або на неживих матеріалах для боротьби з мікроорганізмами, що викликають псування, чи організмами, які є потенційно небезпечними для людини. Нові сполуки вирізняються чудовою активністю за низьких норм витрачання, хорошою переносимістю рослинами та нешкідливістю для навколишнього середовища. Вони мають досить корисні лікувальні, профілактичні й системні властивості та можуть використовуватися для захисту цілої низки культурних рослин. Сполуки формули I можуть використовуватися для пригнічення життєдіяльності чи знищення шкідників, що вражають культурні рослини цілком або їх окремі частини (фрукти, квітки, листя, стебла, бульби, коріння), в той же час забезпечуючи й захист частин рослин, які виростають пізніше, наприклад від ураження фітопатогенними мікроорганізмами.

25

Сполуки формули I можна також застосовувати в якості протравлюючих препаратів для

обробки посадкового матеріалу рослин, наприклад насіння, такого як плоди, бульби чи зерно, або паростків рослин (наприклад, рису), з метою забезпечення захисту від грибкових інфекцій, а також від фітопатогенних грибків, що зустрічаються в ґрунті. Перед висаджуванням посадковий матеріал можна обробити композицією, що містить сполуку формули I: насіння, наприклад, може бути протравлене перед висіванням. Діючі речовини згідно з цим винаходом можна використовувати для обробки насінної зернини шляхом просочування насіння рідкою препаративною формою або їх покриття твердою препаративною формою. Композицією можна також обробляти місце посадки під час висадки посадкового матеріалу, наприклад у борозну для закладення насіння під час висівання. Предметом цього винаходу також є згадані методи обробки посадкового матеріалу рослин та сам посадковий матеріал рослин, оброблений таким чином.

Крім того, сполуки згідно з цим винаходом можуть застосовуватися для боротьби з грибами в споріднених галузях, наприклад для захисту технічних матеріалів, включаючи деревину технічну продукцію, що з неї виготовляється, при зберіганні харчових продуктів або для підтримання гігієни.

Крім того, цей винахід може бути використаний для захисту неживих матеріалів, наприклад пиломатеріалів, стінових плит і фарби, від ураження грибами.

Сполуки формули I є ефективними, наприклад, у боротьбі з фітопатогенними грибами наступних класів: *Fungi imperfecti* (недосконалі гриби) (наприклад, *Alternaria* spp.), базидіоміцети (наприклад, *Corticium* spp., *Ceratobasidium* spp., *Waitea* spp., *Thanatephorus* spp., *Rhizoctonia* spp., *Hemileia* spp., *Puccinia* spp., *Phakopsora* spp., *Ustilago* spp., *Tilletia* spp.), аскоміцети (наприклад, *Venturia* spp., *Blumeria* spp., *Erysiphe* spp., *Podosphaera* spp., *Uncinula* spp., *Monilinia* spp., *Sclerotinia* spp., *Colletotrichum* spp., *Glomerella* spp., *Fusarium* spp., *Gibberella* spp., *Monographella* spp., *Phaeosphaeria* spp., *Mycosphaerella* spp., *Cercospora* spp., *Pyrenophora* spp., *Rhynchosporium* spp., *Magnaporthe* spp., *Gaeumannomyces* spp., *Oculimacula* spp., *Ramularia* spp., *Botryotinia* spp.) та ооміцети (наприклад, *Phytophthora* spp., *Pythium* spp., *Plasmopara* spp., *Peronospora* spp., *Pseudoperonospora* spp., *Bremia* spp). Спостерігається чудова дія в боротьбі зі збудниками несправжньої борошнистої роси (наприклад, *Plasmopara viticola*) та картопляної гнилі (наприклад, *Phytophthora infestans*). Крім того, нові сполуки формули I є ефективними в боротьбі з фітопатогенними грамнегативними та грампозитивними бактеріями (наприклад, *Xanthomonas* spp, *Pseudomonas* spp, *Erwinia amylovora*, *Ralstonia* spp.) і вірусами (наприклад, вірус мозаїчної хвороби тютюну).

У рамках цього винаходу до цільових сільськогосподарських культур та/або корисних рослин, що підлягають захисту, в першу чергу належать наступні види рослин: зернові (пшениця, ячмінь, жито, овес, рис, кукурудза, сорго та споріднені види); буряк (цукровий і кормовий); насіннячкові, кісточкові та ягідні культури (яблуня, груша, слива, персик, мигдаль, вишня, полуниця, малина та ожина); бобові рослини (боби, сочевиця, горох, соя); олійні рослини (ріпак, гірчиця, мак, маслини, соняшник, кокос, рицина, боби какао й арахіс); гарбузові культури (гарбуз, огірки, дині); волокнисті рослини (бавовна, льон, коноплі, джут); цитрусові (апельсин, лимон, грейпфрут, мандарин); овочі (шпинат, салат-латук, спаржа, капуста, морква, цибуля, томати, картопля, перець стручковий або червоний); лаврові (авокадо, кориця, камфора), а також такі рослини, як тютюн, горіхи, кава, баклажани, цукрова тростина, чай, перець, виноград, хміль, банани та каучуконосні рослини, а також газонні трави та декоративні рослини.

До корисних рослин та/або цільових сільськогосподарських культур згідно з цим винаходом окрім традиційних відносяться також генетично покращені чи отримані за допомогою генної інженерії сорти, наприклад, ті, що вирізняються стійкістю до комах (Bt- та VIP-сорти), стійкістю до хвороб і до негативного впливу гербіцидів (стійкі до гліфосату та глюфосинату сорти кукурудзи, доступні на ринку під торговими назвами RoundupReady® та LibertyLink®), або нематодостійкі сорти. В якості прикладу генетично покращених або отриманих за допомогою генної інженерії сортів сільськогосподарських культур можна назвати сорти бавовни Stoneville 5599BR та Stoneville 4892BR.

Під терміном «корисні рослини» та/або «цільові сільськогосподарські культури» слід також розуміти корисні рослини з виробленою стійкістю до токсичної дії гербіцидів, наприклад бромексину, або класів гербіцидів (таких як, наприклад, інгібітори HPPD, інгібітори ALS, наприклад примісульфурон, просульфурон і трифлорисульфурон, інгібітори EPSPS (5-енолпірувілшкімат-3-фосфат-синтази), інгібітори GS (глутамінсинтетази) чи інгібітори PPO (протопорфіриноген-оксидази)), отримані за допомогою традиційних методів селекції або за допомогою генної інженерії. Прикладом сільськогосподарської культури зі стійкістю до імідазолінонів, наприклад імазамоксу, виробленої традиційними методами селекції

(мутагенез), є ріпак (канола) Clearfield®. В якості прикладу сільськогосподарських культур зі стійкістю до гербіцидів або класів гербіцидів, яка є результатом застосування генної інженерії, можна навести стійкі до гліфосату та глюфосинату сорти кукурудзи, доступні на ринку під торговими назвами RoundupReady®, Herculex I® та LibertyLink®.

5 Під терміном «корисні рослини» та/або «цільові сільськогосподарські культури» слід також розуміти корисні рослини, які в результаті трансформації з використанням технологій рекомбінантних ДНК отримали здатність синтезувати один або більше токсинів з вибіркоvim характером дії, таких як, наприклад, токсини, що виробляються токсиноутворюючими бактеріями, особливо тими, що належать до роду бацил.

10 Під терміном «корисні рослини» та/або «цільові сільськогосподарські культури» слід також розуміти корисні рослини, які в результаті трансформації з використанням технологій рекомбінантних ДНК отримали здатність синтезувати антипатогенні речовини з вибіркоvim характером дії, наприклад так звані «білки, пов'язані з патогенезом» (pathogenesis-related proteins) (PR-білки, див., наприклад, EP-A-0 392 225). Приклади таких антипатогенних речовин і
15 трансгенних рослин, здатних синтезувати такі антипатогенні речовини, відомі, наприклад, з публікацій EP-A-0 392 225, WO 95/33818 та EP-A-0 353 191. Методи отримання таких трансгенних рослин добре відомі фахівцям у цій галузі й описані, наприклад, у вищезгаданих публікаціях.

20 Під терміном «місце масового знаходження» рослини, який зустрічається в цьому документі, слід розуміти ділянку, де ростуть рослини чи висаджено посадковий матеріал рослин, або ділянку, де посадковий матеріал рослин буде висаджений у ґрунт. Прикладом такого місця масового знаходження є поле, на якому ростуть культурні рослини.

Під терміном «посадковий матеріал рослини» слід розуміти генеративні частини рослини, наприклад насіння, які можуть використовуватися для розмноження рослини, та вегетативний
25 рослинний матеріал, такий як паростки чи бульби (наприклад, картопля). Можна згадати, наприклад, насіння (у строгому сенсі слова), коріння, плоди, бульби, цибулини, кореневища та частини рослин. Можна також згадати пророслі рослини та розсаду, які призначені для пересаджування після пророщення чи після появи сходів. Ці молоді рослини можна захистити до пересадки шляхом повної або часткової обробки зануренням. Оптимально під «посадковим
30 матеріалом рослин» слід розуміти насіння.

Сполуки формули I можуть застосовуватися в немодифікованій формі чи, оптимально, разом з присадками, що традиційно використовуються в технології приготування хімічних сполук. З цією метою їх можна зручно вводити відомим способом до складу концентратів, що емульгуються, паст для покриття насіння, розчинів або суспензій, що безпосередньо
35 розприскуються чи розводяться, розведених емульсій, змочуваних порошків, розчинних порошків, дустів, гранул, а також помістити в оболонку, наприклад, з полімерних речовин. Так само як типи композицій, методики застосування, такі як обприскування, розпилення, обпилення, розкидання, покриття оболонкою чи полив, вибирають згідно з поставленими цілями та умовами обробки, що переважають. Композиції також можуть містити додаткові присадки,
40 такі як стабілізатори, протипінні речовини, регулятори в'язкості, зв'язуючі речовини або підсилювачі клейкості, а також добрива, джерела поживних мікроелементів або інші речовини спеціальної дії.

Придатні, наприклад для сільськогосподарського використання, носії та присадки можуть бути твердими чи рідкими, та представляють собою речовини, застосовні в технології
45 приготування хімічних сполук, наприклад натуральні чи регеновані мінеральні речовини, розчинники, диспергатори, змочуючі агенти, підсилювачі клейкості, згущувачі, зв'язуючі речовини чи добрива. Такі носії описані, наприклад, в публікації WO 97/33890.

Сполуки формули I зазвичай використовуються у формі композицій і для обробки посівної площі чи рослину, що потребує захисту, одночасно чи послідовно з додатковими сполуками.
50 Такими додатковими сполуками можуть бути, наприклад, добрива чи джерела поживних мікроелементів або інші препарати, що впливають на ріст рослин. Ними також можуть бути селективні чи неселективні гербіциди, а також інсектициди, фунгіциди, бактерициди, нематодциди, молюскоциди або суміші кількох таких препаратів, за необхідності разом із додатковими носіями, поверхнево-активними речовинами чи присадками для покращення
55 нанесення, які традиційно застосовуються в технології приготування хімічних сполук.

Сполуки формули I можуть використовуватися у формі фунгіцидних композицій для знищення патогенних мікроорганізмів чи захисту від них; такі фунгіцидні композиції містять у якості діючої речовини принаймні одну сполуку формули I або принаймні одну оптимальну окрему сполуку, їх визначених вище, у вільній формі солі, придатної для використання
60 в агрохімії, та принаймні одну з вищезгаданих присадок.

Цей винахід пропонує фунгіцидну композицію, що містить принаймні одну сполуку формули I, застосовуваний в агрохімії носій і - як варіант - присадку. Застосовуваним в агрохімії носієм може бути, наприклад, носій, придатний для сільськогосподарського застосування. Сільськогосподарські носії добре відомі в цій галузі. Оптимально крім сполуки формули I згадані фунгіцидні композиції можуть містити додаткову фунгіцидну діючу речовину.

Сполука формули (I) може бути єдиною діючою речовиною композиції або, де це необхідно, може примішуватися до однієї чи більше додаткових діючих речовин, таких як інсектицид, фунгіцид, синергіст, гербіцид або регулятор росту рослин. Додаткова діюча речовина може в деяких випадках спричинити неочікуваний синергічний ефект. Прикладами придатних для використання додаткових діючих речовин є наступні: азоксистробін (131860-33-8), димоксистробін (149961-52-4), енестробін (238410-11-2), флуоксастробін (193740-76-0), крезоксимметил (143390-89-0), метоміностробін (133408-50-1), оризастробін (248593-16-0), пікоксистробін (117428-22-5), піраклостробін (175013-18-0), азаконазол (60207-31-0), бромуконазол (116255-48-2), ципроконазол (94361-06-5), дифеноконазол (119446-68-3), диніконазол (83657-24-3), диніконазол-M (83657-18-5), епоксиконазол (13385-98-8), фенбуконазол (114369-43-6), флухіноконазол (136426-54-5), флусилазол (85509-19-9), флутріафол (76674-21-0), гексаконазол (79983-71-4), імазаліл (58594-72-2), імібенконазол (86598-92-7), іпконазол (125225-28-7), метконазол (125116-23-6), міклобутаніл (88671-89-0), окспоконазол (174212-12-5), пефуразоат (58011-68-0), пенконазол (66246-88-6), прохлораз (67747-09-5), пропіконазол (60207-90-1), протіконазол (178928-70-6), симеконазол (149508-90-7), тебуконазол (107534-96-3), тетраконазол (112281-77-3), тріадимефон (43121-43-3), тріадименол (55219-65-3), трифлумізол (99387-89-0), тритиконазол (131983-72-7), диклобутразол (76738-62-0), етаконазол (60207-93-4), флуконазол (86386-73-4), флуконазол-цис (112839-32-4), тіабендазол (148-79-8), хінконазол (103970-75-8), фенпіклоніл (74738-17-3), флудіоксоніл (131341-86-1), ципродиніл (121552-61-2), мепаніпірим (110235-47-7), піриметаніл (53112-28-0), альдиморф (91315-15-0), додеморф (1593-77-7), фенпропіморф, (67564-91-4), тридеморф (81412-43-3), фенпропідин (67306-00-7), спіроксамін (118134-30-8), ізопіразам (881685-58-1), седаксан (874967-67-6), біксафен (581809-46-3), пентіопірад (183675-82-3), флуксапіроксад (907204-31-3), боскалід (188425-85-6), пенфлуфен (494793-67-8), флуопірам (658066-35-4), мандипропамід (374726-62-2), бентіавалікарб (413615-35-7), диметоморф (110488-70-5), хлороталоніл (1897-45-6), флуазинам (79622-59-6), дитіанон (3347-22-6), метрафенон (220899-03-6), трициклазол (41814-78-2), мефеноксам (70630-17-0), металаксил (57837-19-1), ацибензолар (126448-41-7) (ацибензолар-S-метил (126448-41-7)), манкозєб (8018-01-7), аметоктрадин (865318-97-4) іпконазол (125225-28-7), амисулбром (348635-87-0), цифлуфенамід (180409-60-3), етабоксам (16650-77-3), флуопіколід (239110-15-7), флутіаніл (304900-25-2), ізотіаніл (224049-04-1), прохіназид (189278-12-4), валіфенал (283159-90-0), 1-метилциклопропен (3100-04-7), трифлуксистробін (141517-21-7), сірка (7704-34-9), мідний карбонат амонію (CAS 33113-08-5); олеат міді (CAS 1120-44-1); фолпет (133-07-3), квіноксифен (124495-18-7), каптан (133-06-2), фенгексамід (126833-17-8), глюфосинат і його солі (51276-47-2, 35597-44-5 (S-ізомер)), гліфосат (1071-83-6) і його солі (69254-40-6 (діамоній), 34494-04-7 (диметиламоній), 38641-94-0 (ізопропіламоній), 40465-66-5 (моноамоній), 70901-20-1 (калій), 70393-85-0 (гліфосат натрію), 81591-81-3 (тримезіум)), (2-дихлорметилєн-3-етил-1-метил-індан-4-іл)-амід 1,3-диметил-1Н-піразол-4-карбонової кислоти, (4'-метилсульфаніл-біфеніл-2-іл)-амід 1,3-диметил-1Н-піразол-4-карбонової кислоти, [2-(2,4-дихлорфеніл)-2-метоксі-1-метилетил]-амід 1,3-диметил-4Н-піразол-4-карбонової кислоти, (5-хлор-2,4-диметил-піридин-3-іл)-(2,3,4-триметоксі-6-метилфеніл)-метанон, (5-бром-4-хлор-2-метоксіпіридин-3-іл)-(2,3,4-триметоксі-6-метилфеніл)-метанон, 2-{2-[(E)-3-(2,6-дихлорфеніл)-1-метилпроп-2-ен-(E)-іліденамінооксиметил]-феніл}-2-[(Z)-метоксііміно]-N-метил-ацетамід, 3-[5-(4-хлорфеніл)-2,3-диметил-ізоксазолідин-3-іл]-піридин.

Інший варіант цього винаходу стосується використання сполуки формули I або оптимальної окремої сполуки з визначених вище, композиції, що містить принаймні одну сполуку формули I або принаймні одну оптимальну окрему сполуку, чиє визначення наведено вище, чи фунгіцидної суміші, що містить принаймні одну сполуку формули I або принаймні одну оптимальну окрему сполуку із визначених вище, у суміші з іншими описаними вище фунгіцидами для пригамування чи профілактики зараження рослин, наприклад корисних рослин, таких як культурні рослини, їхнього посадкового матеріалу, наприклад насіння, зібраного врожаю, наприклад, зібраних продовольчих культур, або неживих матеріалів фітопатогенними мікроорганізмами, переважно грибовими організмами.

Ще один варіант винаходу стосується методу пригамування чи профілактики зараження рослин, наприклад корисних рослин, таких як культурні рослини, їхнього посадкового матеріалу,

наприклад насіння, зібраного врожаю, наприклад зібраних продовольчих культур, або неживих матеріалів фітопатогенними мікроорганізмами чи мікроорганізмами, що викликають псування, чи організмами, які є потенційно небезпечними для людини, особливо грибовими організмами, який полягає в нанесенні сполуки формули I чи однієї з визначених вище оптимальних окремих сполук в якості діючої речовини на рослини, частини рослин або місця їх масового знаходження, на їхній посадковий матеріал або на будь-яку частину неживого матеріалу.

Під «пригамуванням» або «профілактикою» слід розуміти зниження зараженості фітопатогенними мікроорганізмами чи мікроорганізмами, що викликають псування, або організмами, які є потенційно небезпечними для людини, особливо грибовими організмами, до рівня прояву покращення.

Оптимальним методом пригамування чи профілактики зараження культурних рослин фітопатогенними мікроорганізмами, особливо грибовими організмами, який включає застосування сполуки формули I або агрохімічної композиції, що містить принаймні одну зі згаданих сполук, є обробка зеленої частини рослин. Частота обробки та норма витрачання будуть залежати від безпеки зараження відповідним патогеном. Однак сполуки формули I можуть також проникати в рослину з ґрунту через коріння (системна дія) при просочуванні місця масового знаходження рослин рідкою препаративною формою або внесенні сполук у твердій формі, наприклад у формі гранул, у ґрунт (обробка ґрунту). При вирощуванні канадського рису такі гранули можна застосовувати на затоплених рисових полях. Сполуки формули I можна також застосовувати для обробки насінного матеріалу шляхом просочування насіння чи бульб рідкою препаративною формою фунгіциду або їх покриття твердою препаративною формою.

Препаративна форма, наприклад композиція, що містить сполуку формули I, та, за необхідності, тверду чи рідку присадку або мономеру для поміщення сполуки формули I в оболонку, може бути отримана відомим способом, зазвичай шляхом ретельного змішування та/або подрібнення сполуки з наповнювачами, наприклад розчинниками, твердими носіями та - як варіант - поверхнево-активними речовинами.

Як правило, агрохімічні препаративні форми та/або композиції містять від 0,1 до 99 мас.%, оптимально від 0,1 до 95 мас.% сполуки формули I, від 99,9 до 1 мас.%, оптимально від 99,8 до 5 мас.% твердої чи рідкої присадки, та від 0 до 25 мас.%, оптимально від 0,1 до 25 мас.% поверхнево-активної речовини.

Зазвичай ефективна норма витрачання складає від 5 г до 2 кг діючої речовини (д.р.) на гектар (га), оптимально від 10 г до 1 кг д.р./га, найоптимальніше від 20 г до 600 д.р./га. У випадку використання в якості протравлювача для насіння, застосовні дози складають від 10 мг до 1 г діючої речовини на 1 кг насіння.

Оптимальним є створення комерційних продуктів у вигляді концентратів, але кінцевий користувач, як правило, використовує розведені препаративні форми.

Детальніше описаний вище винахід буде проілюстровано за допомогою наступних прикладів, які не претендують на вичерпну повноту.

Приклад 1: У цьому прикладі описано отримання 2-{1-[2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-іл)-аміду 1,2,3,4-тетрагідронафталін-1-карбонової кислоти (сполука № I.g.011)

а) Отримання етилового ефіру 2-{1-[2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-карбонової кислоти

До розчину (5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-оцтової кислоти (9,1 г, 36,1 ммоль) у DMF (100 мл) додають діізопропілетиламін (45 мл, 216 ммоль), а потім тетрафторборат О-(бензотріазол-1-іл)-N,N,N',N'-тетраметилуронію (15,5 г, 39,7 ммоль). Після перемішування протягом 15 хвилин за кімнатної температури до реакційної суміші додають гідрохлорид етилового ефіру 2-піперидин-4-іл-тіазол-4-карбонової кислоти (10 г, 36,1 ммоль). Після перемішування всю ніч за кімнатної температури розчинник випарюють, отриману олію жовтого кольору розчиняють в етилацетаті (300 мл), промивають насиченим водним розчином бікарбонату натрію (300 мл), розчином 1М HCl (300 мл) і розсолем (100 мл). Органічний шар висушують над сульфатом натрію, фільтрують і за зниженого тиску випарюють. Неочищену суміш очищують за допомогою колонкової хроматографії на силікагелі (дихлорметан/метанол 10:1) для отримання етилового ефіру 2-{1-[2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-карбонової кислоти (13,6 г, 88 %). $^1\text{H-NMR}$ (400 МГц, CDCl_3): δ = 1,40 (t, 3H), 1,70-1,85 (m, 2H), 2,16-2,30 (m, 2H), 2,32 (s, 3H), 2,79-2,89 (m, 1H), 3,22-3,43 (m, 1H), 4,03-4,12 (m, 1H), 4,42 (q, 3H), 4,54-4,69 (m, 1H), 4,93-5,08 (2d, 2H (діастереотопні)), 6,35 (s, 1H), 8,10 (br, 1H). MS: m/z = 209 (M+1).

б) Отримання 2-{1-[2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-карбонової кислоти

До розчину етилового ефіру 2-{1-[2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-карбонової кислоти (2,67 г, 6,2 ммоль) у THF (20 мл) за кімнатної температури додають водний розчин гідроксиду натрію (2 М, 4,65 мл, 9,3 ммоль). Після перемішування протягом 3 годин за кімнатної температури реакційну суміш окислюють 2М водного розчину HCl до досягнення рівня pH 2-3, і розчин екстрагують етилацетатом (20 мл). Органічний шар повторно екстрагують етилацетатом (20 мл), об'єднані органічні шари промивають розсолем (10 мл), висушують над сульфатом натрію, фільтрують та за зниженого тиску випарюють для отримання 2-{1-[2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-карбонової кислоти (2,33 г, 94 %), яка може бути використана в процесі виконання наступного етапу без подальшого очищення. $^1\text{H-NMR}$ (400 МГц, ацетон- d_6): δ = 1,69-1,82 (m, 1H), 1,87-2,02 (m, 1H), 2,16-2,37 (m, 2H), 2,38 (s, 3H), 2,89-2,99 (m, 1H), 3,38-3,48 (m, 2H), 4,14-4,22 (m, 1H), 4,50-4,69 (m, 1H), 5,20-5,36 (2d, 2H (діастереотопні)), 6,41, (s, 1H), 8,34 (s, 1H). MS: m/z = 403 (M+1).

с) Отримання трет-бутилового ефіру 2-{1-[2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-карбамінової кислоти

До розчину 2-{1-[2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-карбонової кислоти (9,95 г, 24,74 ммоль) у трет-бутанолі (90 мл) додають триетиламін (8,2 мл, 56,9 ммоль). Після перемішування протягом 30 хвилин за кімнатної температури додають дифенілфосфорилазид (10,9 мл, 49,5 ммоль), реакційну суміш розділяють на 6 частин, і кожен частину піддають дії випромінювання в мікрохвильовій печі (100 °C, 15 хв.). Після охолодження до кімнатної температури всі частини об'єднують, до реакційної суміші додають воду (3 мл) і перемішують протягом 30 хвилин. Далі додають ацетонітрил (40 мл), а потім - основний амберліст A21. Після перемішування всю ніч за кімнатної температури смола відфільтровують, а розчинники за зниженого тиску випарюють. Залишок очищують за допомогою колонкової хроматографії на силікагелі (етилацетат/циклогексан 7:3) для отримання трет-бутилового ефіру 2-{1-[2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-карбамінової кислоти (9,6 г, 82 %). $^1\text{H-NMR}$ (400 МГц, CDCl_3): δ = 1,53 (s, 9H), 1,68-1,78 (m, 2H), 2,08-2,19 (m, 2H), 2,32 (s, 3H), 2,85-2,95 (m, 1H), 3,10-3,20 (m, 1H), 3,23-3,34 (m, 1H), 3,97-4,04 (m, 1H), 4,50-4,58 (m, 1H), 4,93-5,05 (2d, 2H, діастереотопні протони), 6,33 (s, 1H), 7,10 (br, 1H), 7,30 (s, 1H). MS: m/z = 474 (M+1).

д) Отримання 1-[4-(4-аміно-тіазол-2-іл)-піперидин-1-іл]-2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-етанону

До розчину трет-бутилового ефіру 2-{1-[2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-карбамінової кислоти (9,6 г, 20,3 ммоль) за кімнатної температури додають розчин 4М HCl у діоксані (50 мл, 203 ммоль). Після перемішування протягом 2 днів за кімнатної температури розчинник випарюють за зниженого тиску. Отриману жовтуватку піну розтирають з діетиловим ефіром і фільтрують для отримання хлористоводневої солі 1-[4-(4-аміно-тіазол-2-іл)-піперидин-1-іл]-2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-етанону, яку суспендують у насиченому водному розчині бікарбонату натрію (500 мл). Після перемішування протягом 30 хвилин за кімнатної температури реакційну суміш екстрагують етилацетатом (500 мл). Об'єднані органічні шари промивають водою (100 мл) і розсолем (100 мл), фільтрують, висушують над сульфатом натрію та випарюють за зниженого тиску для отримання 1-[4-(4-аміно-тіазол-2-іл)-піперидин-1-іл]-2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-етанону (5,63 г, 74 %). $^1\text{H-NMR}$ (400 МГц, CDCl_3): δ = 1,65-1,80 (m, 2H), 2,08-2,20 (m, 2H), 2,31 (s, 3H), 2,81-2,91 (m, 1H), 3,08-3,18 (m, 1H), 3,21-3,32 (m, 1H), 3,95-4,08 (m, 3H), 4,50-4,59 (m, 1H), 4,93-5,04 (2d, 2H, діастереотопні протони), 5,84 (s, 1H), 6,32 (s, 1H). MS: m/z = 374 (M+1).

е) Отримання (2-{1-[2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-іл)-аміду 1,2,3,4-тетрагідронафталін-1-карбонової кислоти (сполука № I.g.011)

До розчину 1-[4-(4-аміно-тіазол-2-іл)-піперидин-1-іл]-2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-етанону (120 мг, 0,32 ммоль) та діізопропілетиламіну (0,2 мл, 0,96 ммоль) у дихлорметані (5 мл) по краплі додають розчин 1,2,3,4-тетрагідро-нафталін-1-карбоніл хлориду (74 мг, 0,38 ммоль) у дихлорметані (3 мл) за температури 0 °C. Після перемішування всю ніч за кімнатної температури розчинник випарюють, а залишок очищують за допомогою флеш-хроматографії на силікагелі (етилацетат/циклогексан 1:1) для отримання (2-{1-[2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-іл)-аміду 1,2,3,4-тетрагідронафталін-1-карбонової кислоти (сполука № I.g.011, 82 мг, 48 %). М.р. = 179,2-181,3 °C. $^1\text{H-NMR}$ (400 МГц, CDCl_3): δ = 1,60-1,75 (m, 3H), 1,81-1,89 (m, 2H), 2,05-2,15 (m, 2H), 2,31 (s, 3H), 2,32-2,40 (m, 1H), 2,77-2,94 (m, 3H), 3,05-3,18 (m, 1H), 3,19-3,29 (m, 1H), 3,87 (t, 1H), 3,95-4,04 (m, 1H), 4,50-4,59 (m, 1H), 4,90-5,06 (2d, 2H, діастереотопні протони), 6,32 (s, 1H), 7,25-7,30 (m, 4H), 7,49 (s, 1H), 7,79 (br, 1H). MS: m/z = 532 (M+1).

Приклад 2. У цьому прикладі описано отримання фенілового ефіру (2-{1-[2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-іл)-карбамінової кислоти (сполука № I.g.023)

а) Отримання фенілового ефіру (2-{1-[2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-іл)-карбамінової кислоти (сполука № I.g.023)

До розчину 1-[4-(4-аміно-тіазол-2-іл)-піперидин-1-іл]-2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-етанону (80 мг, 0,21 ммоль) у дихлорметані (5 мл) додають діізопропілетиламін (0,053 мл, 0,25 ммоль), а потім - фенілхлорформіат (0,033 мл, 0,21 ммоль) за температури 0 °С. Після перемішування всю ніч за кімнатної температури розчинники випарюють за зниженого тиску, а залишок очищують за допомогою колонкової хроматографії на силікагелі (етилацетат/гептан 7:3) для отримання фенілового ефіру (2-{1-[2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-іл)-карбамінової кислоти (сполука № I.g.023, 71 мг, 67 %). ¹H-ЯМР (400 МГц, CDCl₃): δ = 1,57-1,78 (m, 2H), 2,08-2,19 (m, 2H), 2,22 (s, 3H), 2,75-2,81 (m, 1H), 3,05-3,20 (m, 2H), 3,95-3,99 (m, 1H), 4,44-4,52 (m, 1H), 4,83-4,98 (2d, 2H, діастереотопні протони), 6,25 (s, 1H), 7,05-7,20 (m, 3H), 7,29-7,38 (m, 2H), 7,95 (br, 1H). МС: m/z = 494 (M+1).

Приклад 3. У цьому прикладі описано отримання 1-(2-{1-[2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-іл)-3-фенілсечовини (сполука № I.g.024)

а) Отримання 1-(2-{1-[2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-іл)-3-фенілсечовини (сполука № I.g.024)

До розчину 1-[4-(4-аміно-тіазол-2-іл)-піперидин-1-іл]-2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-етанону (100 мг, 0,27 ммоль) у THF (5 мл) по краплі додають розчин фенілізоціанату (30 мкл, 0,28 ммоль) у THF (1 мл) за температури 0 °С. Після перемішування всю ніч за кімнатної температури до реакційної суміші додають метанол (1 мл). Після перемішування протягом 15 хвилин за кімнатної температури розчинники випарюють, а залишок розтирають з діетиловим ефіром (5 мл), щоб викликати випадіння осаду. Отриману тверду речовину фільтрують і сушать під вакуумом для отримання 1-(2-{1-[2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-іл)-3-фенілсечовини у вигляді твердої речовини бежевого кольору (сполука № I.g.024, 105 мг, 79 %). М.р. = 192,6 °С. ¹H-ЯМР (400 МГц, CDCl₃): δ = ¹H-ЯМР (MeOD): d = 1,65 (m, 1H), 1,80 (m, 1H), 2,40 (m, 2H), 2,30 (s, 3H), 2,98 (m, 1H), 3,30 (m, 1H), 3,39 (m, 1H), 4,10 (m, 1H), 4,52 (m, 1H), 5,22 (2d, 2H, діастереотопні), 6,42 (s, 1H), 7,05 (t, 1H), 7,09 (s, 1H), 7,26-7,45 (m, 6H). МС: m/z = 494 (M+1).

Приклад 4. У цьому прикладі описано отримання N-(2-{1-[2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-іл)-С-феніл-метан сульфонаміду (сполука № I.g.025)

а) Отримання N-(2-{1-[2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-іл)-бензолсульфонаміду (сполука № I.g.025)

До розчину 1-[4-(4-аміно-тіазол-2-іл)-піперидин-1-іл]-2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-етанону (100 мг, 0,04 ммоль) у диметилацетаміді (0,8 мл) за кімнатної температури додають діізопропілетиламін (8,6 мкл, 0,28 ммоль), а потім - бензолсульфонілхлорид (8,8 мг, 0,05 ммоль). Після перемішування протягом 15 хвилин за температури 60 °С реакційну суміш очищують безпосередньо за допомогою препаративної ВЕРХ для отримання N-(2-{1-[2-(5-метил-3-трифторметил-піразол-1-іл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-іл)-бензолсульфонаміду (сполука № I.g.025). МС: m/z = 514 (M+1).

Приклад 5. У цьому прикладі описано отримання N-(2-{1-[2-(2,5-диметилфеніл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-іл)-2-фенілпропіонаміду (сполука № I.g.141)

а) Отримання етилового ефіру 2-{1-[2-(2,5-диметилфеніл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-карбонової кислоти

До розчину 2,5-диметилфенілоцтової кислоти (5,45 г, 27,4 ммоль) у DMF (80 мл) додають діізопропілетиламін (85,4 мл, 411,32 ммоль), а потім - тетрафторборат О-(бензотріазол-1-іл)-N,N,N',N'-тетраметилуранію (12,8 г, 32,9 ммоль) за температури 0 °С. Після перемішування протягом 15 хвилин за кімнатної температури до реакційної суміші додають етиловий ефір 2-піперидин-4-іл-тіазол-4-карбонової кислоти (6,59 г, 27,4 ммоль). Після перемішування всю ніч за кімнатної температури розчинник випарюють, отриману олію жовтого кольору розчиняють в етилацетаті (500 мл), промивають насиченим водним розчином бікарбонату натрію (500 мл), а водну фазу повторно екстрагують етилацетатом (100 мл). Об'єднані органічні шари промивають розчином 0,5 М HCl (400 мл) і розсол (400 мл), висушують над сульфатом натрію, фільтрують і випарюють за зниженого тиску для отримання етилового ефіру 2-{1-[2-(2,5-диметилфеніл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-карбонової кислоти (10,46 г, 98 %), який може бути використаний у процесі виконання наступного етапу без подальшого очищення. ¹H-ЯМР (400 МГц, CDCl₃): δ = 1,41 (t, 3H), 1,52-1,82 (m, 2H), 2,10-2,22 (m, 2H), 2,25 (s, 3H), 2,30 (s, 3H), 2,73-

2,86 (m, 1H), 3,08-3,22 (m, 1H), 3,29-3,40 (m, 1H), 3,68 (s, 2H), 3,8-3,95 (m, 1H), 4,38-4,42 (q, 2H), 4,73-4,88 (m, 1H), 6,96 (s, 1H), 6,98-7,01 (d, 1H), 7,08 (d, 1H), 8,10 (s, 1H). MS: $m/z = 387 (M+1)$.

б) Отримання 2-{1-[2-(2,5-диметилфеніл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-карбонової кислоти

5 До розчину етилового ефіру 2-{1-[2-(2,5-диметилфеніл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-карбонової кислоти (10,46 г, 27,06 ммоль) у THF (30 мл) за кімнатної температури додають водний розчин гідроксиду натрію (2 М, 20,3 мл). Після перемішування протягом 3 годин за кімнатної температури реакційну суміш окислюють водним розчином HCl (2 М) до досягнення рівня pH 2-3, до реакційної суміші додають етилацетат (30 мл), і шари розділяють. Водний шар екстрагують етилацетатом (20 мл), об'єднані органічні шари промивають розсолем (10 мл), висушують над сульфатом натрію, фільтрують і випарюють за зниженого тиску для отримання 2-{1-[2-(2,5-диметилфеніл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-карбонової кислоти (5,9 г, 60,8 %), яка може бути використана в процесі виконання наступного етапу без подальшого очищення.

10 $^1\text{H-NMR}$ (400 МГц, d_6 -DMSO): $\delta = 1,55$ -1,65 (m, 2H), 2,01-2,12 (m, 2H), 2,15 (s, 3H), 2,22 (s, 3H), 2,77-2,86 (m, 1H), 3,18-3,29 (m, 1H), 3,65 (d, 2H), 3,98-4,07 (m, 1H), 4,45-4,53 (m, 1H), 6,90 (s, 1H), 6,92 (s, 1H), 6,93 (s, 1H), 7,04 (d, 1H), 8,49 (br, 1H), 12,95 (s, 1H). MS: $m/z = 359 (M+1)$.

с) Отримання трет-бутилового ефіру (2-{1-[2-(2,5-диметилфеніл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-іл)-карбаїнової кислоти

20 До розчину 2-{1-[2-(2,5-диметилфеніл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-карбонової кислоти (5,65 г, 15,76 ммоль) у трет-бутанолі (60 мл) додають тріетиламін (5,2 мл, 36,2 ммоль). Після перемішування протягом 30 хвилин за кімнатної температури додають дифенілфосфорилазид (6,9 мл, 31,5 ммоль), реакційну суміш розділяють на 4 частини, і кожен частину піддають дії випромінювання у мікрохвильовій печі (100 °C, 15 хв.). Після охолодження до кімнатної температури всі частини об'єднують, до реакційної суміші додають воду (1 мл) і перемішують протягом 30 хвилин. Далі додають ацетонітрил (50 мл), а потім - основний амберліст A21. Після перемішування всю ніч за кімнатної температури смола відфільтровують, а розчинники за зниженого тиску випарюють. Залишок очищують за допомогою колонкової хроматографії на силікагелі (етилацетат/циклогексан 7:3) для отримання трет-бутилового ефіру (2-{1-[2-(2,5-диметилфеніл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-іл)-карбаїнової кислоти (4,93 г, 73 %). $^1\text{H-NMR}$ (400 МГц, CDCl_3): $\delta = 1,53$ (s, 9H), 1,53-1,61 (m, 1H), 1,67-1,79 (m, 1H), 1,95-2,04 (m, 1H), 2,08-2,14 (m, 1H), 2,25 (s, 3H), 2,30 (s, 3H), 2,80-2,90 (m, 1H), 3,06-3,20 (m, 2H), 3,68 (s, 2H), 3,80-3,89 (m, 1H), 4,68-4,74 (m, 1H), 6,95 (s, 1H), 6,98 (d, 1H), 7,07 (d, 1H), 7,23 (s, 1H). MS: $m/z = 430 (M+1)$.

д) Отримання 1-[4-(4-аміно-тіазол-2-іл)-піперидин-1-іл]-2-(2,5-диметилфеніл)-етанону

35 До розчину трет-бутилового ефіру (2-{1-[2-(2,5-диметилфеніл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-іл)-карбаїнової кислоти (5,65 г, 13,15 ммоль) за кімнатної температури додають розчин 4М HCl у діоксані (35 мл). Після перемішування протягом 3 днів за кімнатної температури розчинник випарюють за зниженого тиску. Отриману тверду речовину розтирають з діетиловим ефіром і фільтрують для отримання хлористоводневої солі 1-[4-(4-аміно-тіазол-2-іл)-піперидин-1-іл]-2-(2,5-диметилфеніл)-етанону, яку суспендують у насиченому водному розчині бікарбонату натрію (500 мл). Після перемішування протягом 30 хвилин за кімнатної температури реакційну суміш екстрагують етилацетатом (500 мл). Об'єднані органічні шари промивають водою (100 мл) і розсолем (100 мл), фільтрують, висушують над сульфатом натрію та випарюють за зниженого тиску для отримання 1-[4-(4-аміно-тіазол-2-іл)-піперидин-1-іл]-2-(2,5-диметилфеніл)-етанону (3,27 г, 75 %). $^1\text{H-NMR}$ (400 МГц, CDCl_3): $\delta = 1,53$ -1,61 (m, 1H), 1,67-1,79 (m, 1H), 1,95-2,04 (m, 1H), 2,08-2,13 (m, 1H), 2,25 (s, 3H), 2,30 (s, 3H), 2,78-2,88 (m, 1H), 3,06-3,20 (m, 2H), 3,68 (s, 2H), 3,80-3,89 (m, 1H), 4,05 (s, 1H), 4,68-4,74 (m, 1H), 6,95 (s, 1H), 6,98 (d, 1H), 7,07 (d, 1H), 7,23 (s, 1H). MS: $m/z = 330 (M+1)$. MS: $m/z = 330 (M+1)$.

е) Отримання N-(2-{1-[2-(2,5-диметилфеніл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-іл)-2-фенілпропіонаміду (сполука № I.g.141)

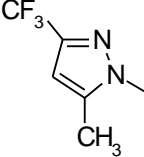
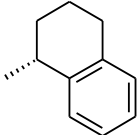
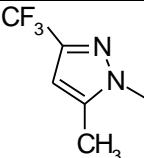
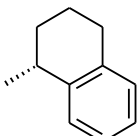
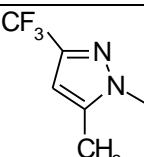
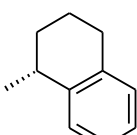
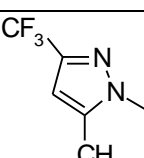
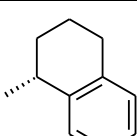
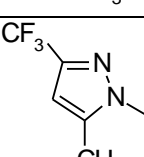
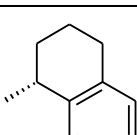
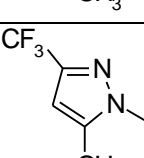
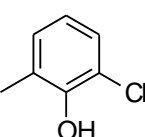
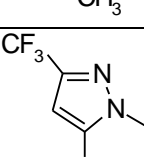
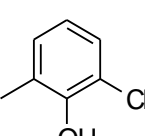
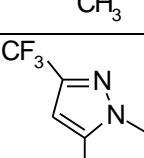
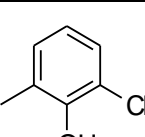
50 До розчину (рац)-2-фенілпропіонової кислоти (46 мг, 0,30 ммоль) і діізопропілетиламіну (0,15 мл, 0,9 ммоль) в ацетонітрилі (2 мл) за кімнатної температури додають гексафторфосфат бензотріазол-1-іл-оксі-трис-(диметиламіно)-фосфонію (322 мг, 0,73 ммоль). Після перемішування протягом 30 хвилин за кімнатної температури до реакційної суміші додають 1-[4-(4-аміно-тіазол-2-іл)-піперидин-1-іл]-2-(2,5-диметилфеніл)-етанон (100 мг, 0,30 ммоль). Після перемішування всю ніч за кімнатної температури розчинник випарюють, а залишок очищують за допомогою флеш-хроматографії на силікагелі (етилацетат/циклогексан 1:1) для отримання N-(2-{1-[2-(2,5-диметилфеніл)-ацетил]-піперидин-4-іл}-тіазол-4-іл)-2-фенілпропіонаміду (сполука № I.g.141, 19 мг, 13,4 %). $^1\text{H-NMR}$ (400 МГц, CDCl_3): $\delta = 1,46$ -1,39 (m, 1H), 1,52 (d, 3H), 1,68-1,56 (m, 1H), 1,89-1,83 (m, 1H), 2,01-1,97 (m, 1H), 2,15 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 2,73-2,67 (m, 1H), 3,18-2,92

(m, 2H), 3,59 (s, 2H), 3,68-3,63 (q, 1H), 3,78-3,71 (m, 1H), 4,65-4,62 (m, 1H), 6,91-6,82 (m, 2H), 7,02-6,98 (m, 1H), 7,31-7,15 (m, 5H), 7,42 (s, 1H), 8,05 (br, 1H). МС: m/z = 462 (M+1).

У таблиці 1 наведено приклади окремих сполук формули I згідно з цим винаходом.

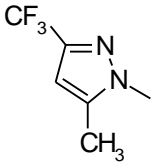
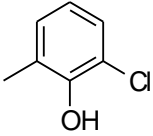
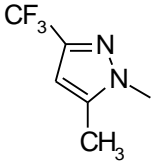
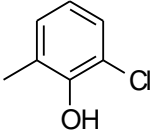
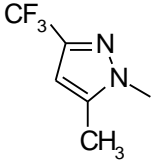
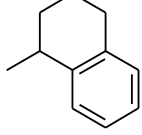
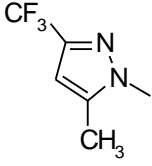
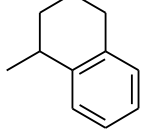
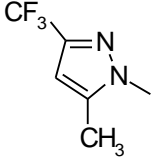
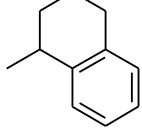
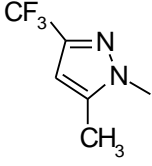
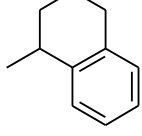
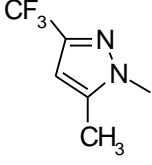
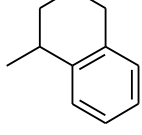
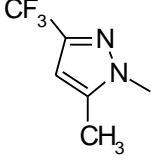
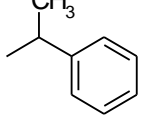
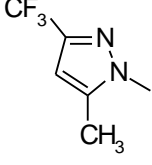
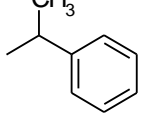
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
001		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)-	
002		-CH ₂ C(=O)-	-C(=S)-	
003		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)O-	
004		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)NH-	
005		-CH ₂ C(=O)-	-SO ₂ -	
006		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)-	
007		-CH ₂ C(=O)-	-C(=S)-	
008		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)O-	

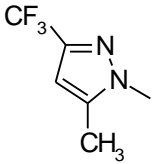
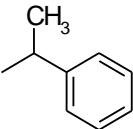
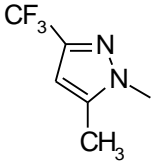
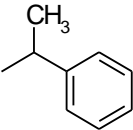
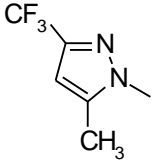
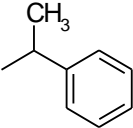
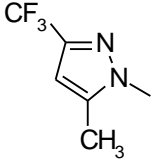
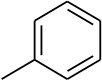
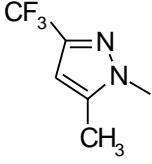
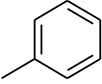
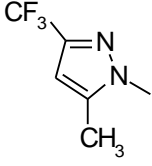
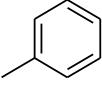
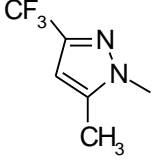
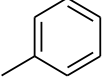
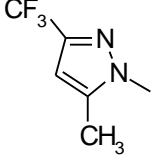
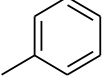
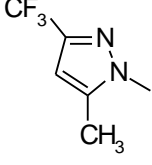
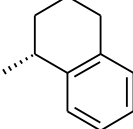
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

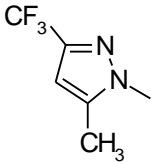
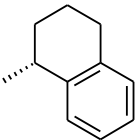
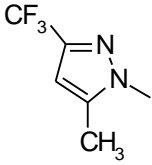
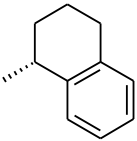
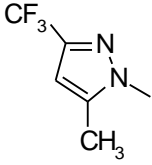
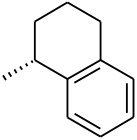
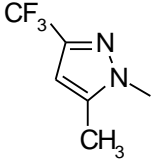
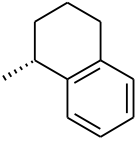
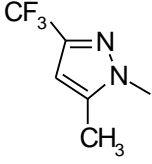
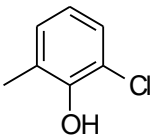
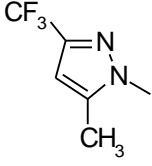
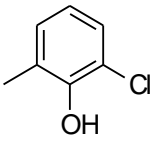
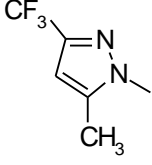
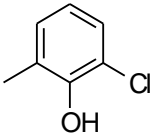
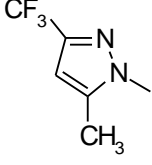
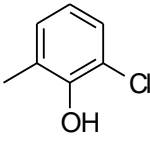
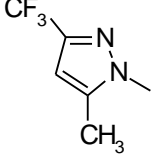
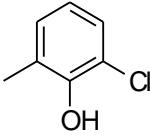
№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
009		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)NH-	
010		-CH ₂ C(=O)-	-SO ₂ -	
011		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)-	
012		-CH ₂ C(=O)-	-C(=S)-	
013		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)O-	
014		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)NH-	
015		-CH ₂ C(=O)-	-SO ₂ -	
016		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)-	
017		-CH ₂ C(=O)-	-C(=S)-	

Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

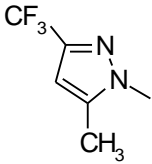
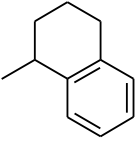
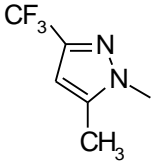
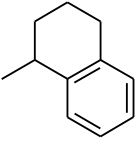
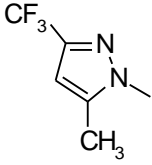
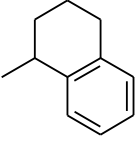
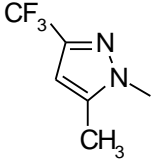
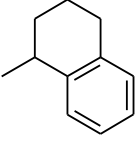
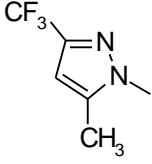
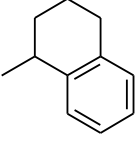
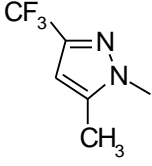
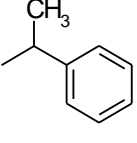
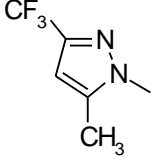
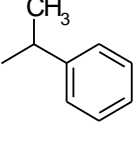
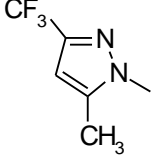
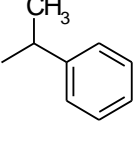
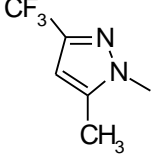
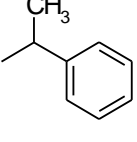
№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
018		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)O-	
019		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)NH-	
020		-CH ₂ C(=O)-	-SO ₂ -	
021		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)-	
022		-CH ₂ C(=O)-	-C(=S)-	
023		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)O-	
024		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)NH-	
025		-CH ₂ C(=O)-	-SO ₂ -	
026		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)-	

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

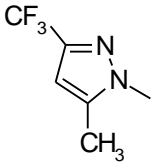
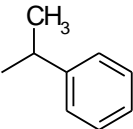
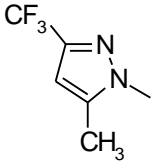
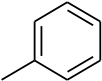
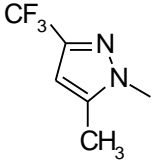
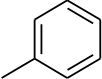
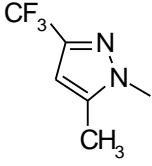
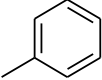
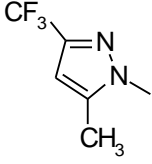
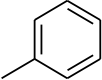
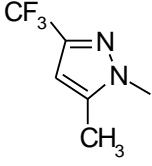
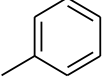
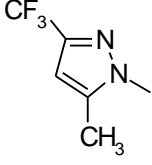
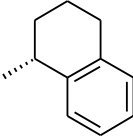
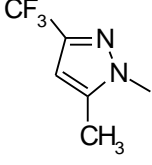
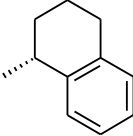
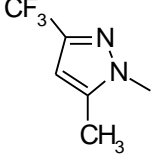
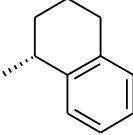
№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
027		-CH ₂ C(=S)-	-C(=S)-	
028		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)O-	
029		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)NH-	
030		-CH ₂ C(=S)-	-SO ₂ -	
031		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)-	
032		-CH ₂ C(=S)-	-C(=S)-	
033		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)O-	
034		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)NH-	
035		-CH ₂ C(=S)-	-SO ₂ -	

Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

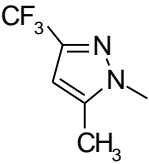
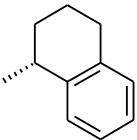
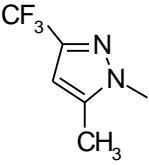
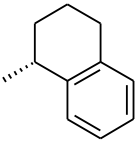
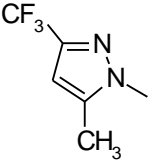
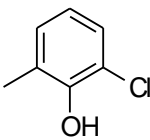
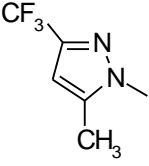
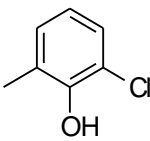
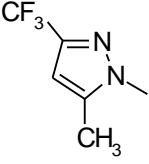
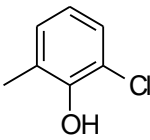
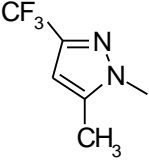
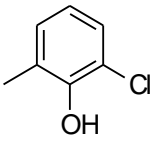
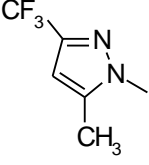
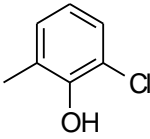
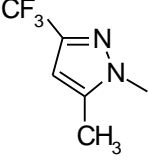
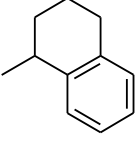
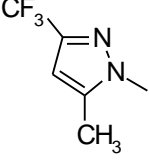
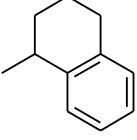
№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
036		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)-	
037		-CH ₂ C(=S)-	-C(=S)-	
038		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)O-	
039		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)NH-	
040		-CH ₂ C(=S)-	-SO ₂ -	
041		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)-	
042		-CH ₂ C(=S)-	-C(=S)-	
043		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)O-	
044		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)NH-	

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
045		-CH ₂ C(=S)-	-SO ₂ -	
046		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)-	
047		-CH ₂ C(=S)-	-C(=S)-	
048		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)O-	
049		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)NH-	
050		-CH ₂ C(=S)-	-SO ₂ -	
051		-OC(=O)-	-C(=O)-	
052		-OC(=O)-	-C(=S)-	
053		-OC(=O)-	-C(=O)O-	

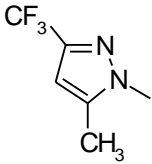
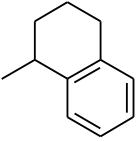
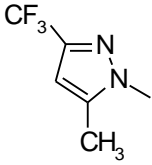
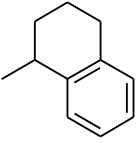
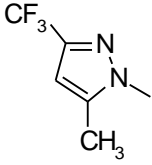
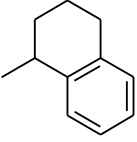
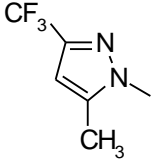
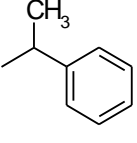
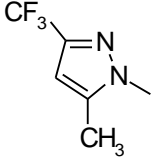
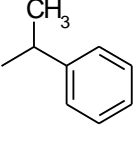
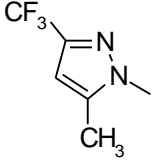
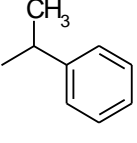
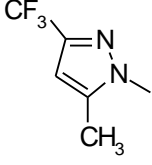
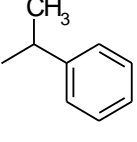
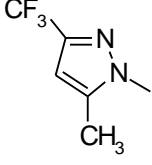
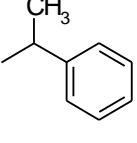
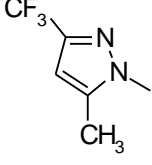
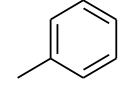
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
054		-OC(=O)-	-C(=O)NH-	
055		-OC(=O)-	-SO ₂ -	
056		-OC(=O)-	-C(=O)-	
057		-OC(=O)-	-C(=S)-	
058		-OC(=O)-	-C(=O)O-	
059		-OC(=O)-	-C(=O)NH-	
060		-OC(=O)-	-SO ₂ -	
061		-OC(=O)-	-C(=O)-	
062		-OC(=O)-	-C(=S)-	

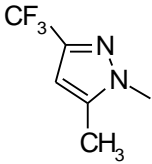
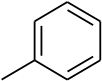
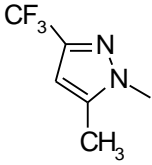
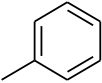
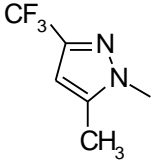
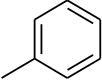
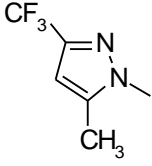
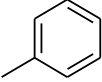
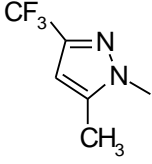
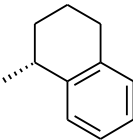
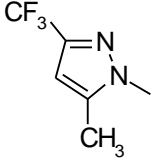
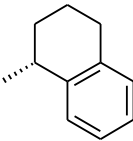
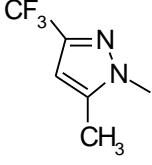
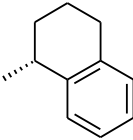
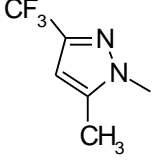
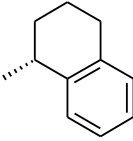
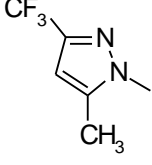
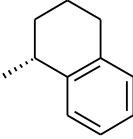
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
063		-OC(=O)-	-C(=O)O-	
064		-OC(=O)-	-C(=O)NH-	
065		-OC(=O)-	-SO ₂ -	
066		-OC(=O)-	-C(=O)-	
067		-OC(=O)-	-C(=S)-	
068		-OC(=O)-	-C(=O)O-	
069		-OC(=O)-	-C(=O)NH-	
070		-OC(=O)-	-SO ₂ -	
071		-OC(=O)-	-C(=O)-	

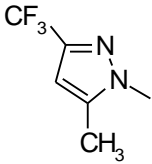
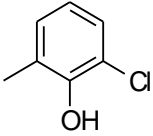
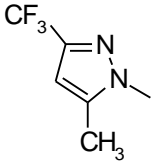
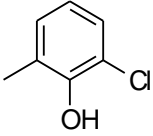
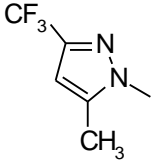
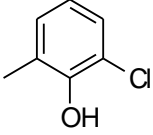
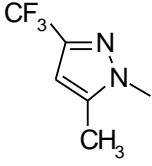
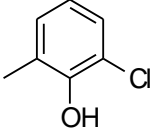
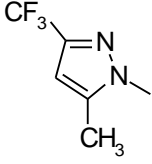
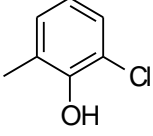
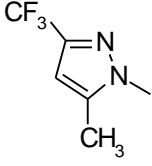
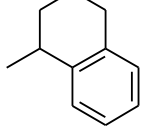
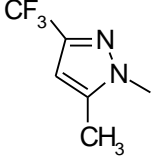
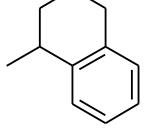
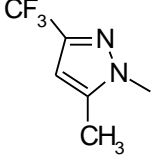
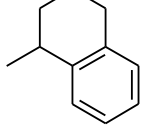
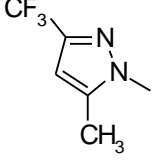
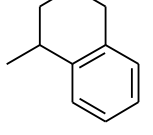
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
072		-OC(=O)-	-C(=S)-	
073		-OC(=O)-	-C(=O)O-	
074		-OC(=O)-	-C(=O)NH-	
075		-OC(=O)-	-SO ₂ -	
076		-C(=O)-	-C(=O)-	
077		-C(=O)-	-C(=S)-	
078		-C(=O)-	-C(=O)O-	
079		-C(=O)-	-C(=O)NH-	
080		-C(=O)-	-SO ₂ -	

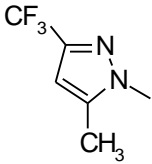
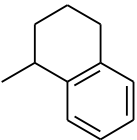
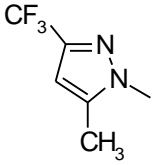
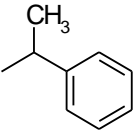
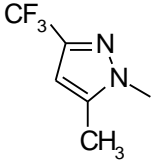
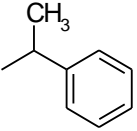
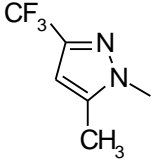
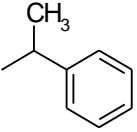
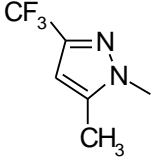
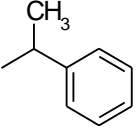
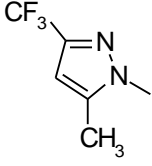
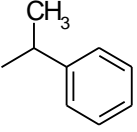
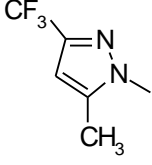
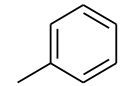
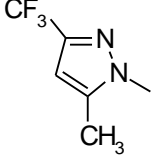
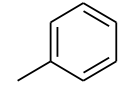
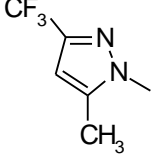
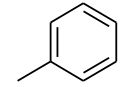
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
081		-C(=O)-	-C(=O)-	
082		-C(=O)-	-C(=S)-	
083		-C(=O)-	-C(=O)O-	
084		-C(=O)-	-C(=O)NH-	
085		-C(=O)-	-SO ₂ -	
086		-C(=O)-	-C(=O)-	
087		-C(=O)-	-C(=S)-	
088		-C(=O)-	-C(=O)O-	
089		-C(=O)-	-C(=O)NH-	

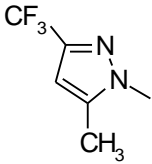
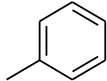
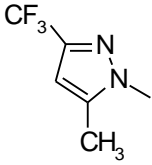
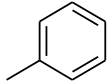
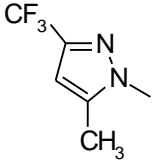
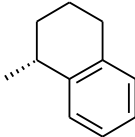
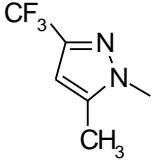
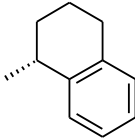
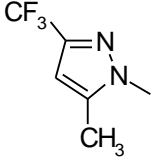
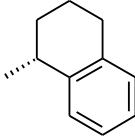
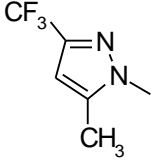
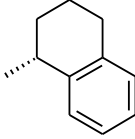
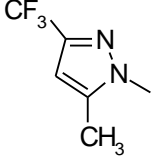
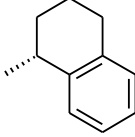
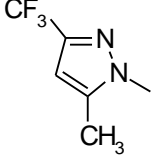
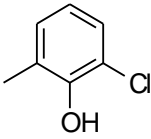
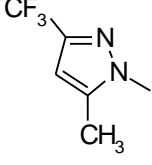
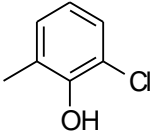
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
090		-C(=O)-	-SO ₂ -	
091		-C(=O)-	-C(=O)-	
092		-C(=O)-	-C(=S)-	
093		-C(=O)-	-C(=O)O-	
094		-C(=O)-	-C(=O)NH-	
095		-C(=O)-	-SO ₂ -	
096		-C(=O)-	-C(=O)-	
097		-C(=O)-	-C(=S)-	
098		-C(=O)-	-C(=O)O-	

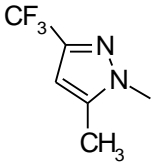
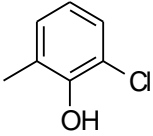
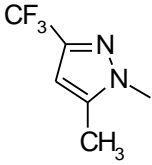
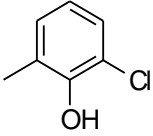
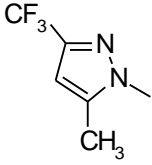
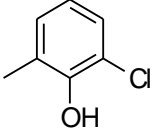
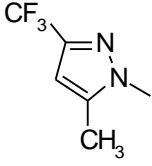
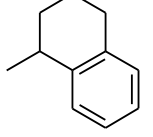
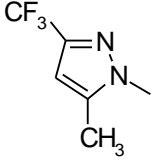
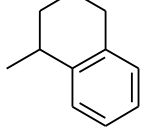
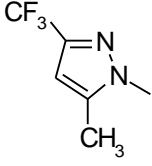
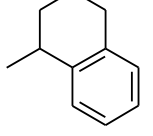
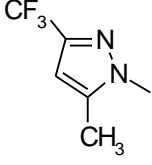
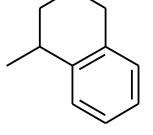
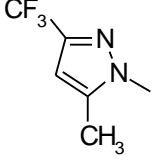
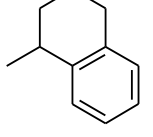
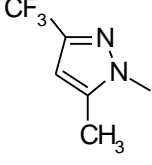
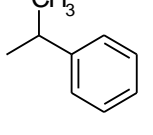
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
099		-C(=O)-	-C(=O)NH-	
100		-C(=O)-	-SO ₂ -	
101		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)-	
102		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=S)-	
103		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)O-	
104		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)NH-	
105		-CH ₂ SO ₂ -	-SO ₂ -	
106		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)-	
107		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=S)-	

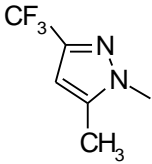
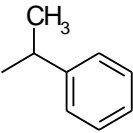
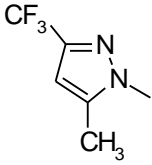
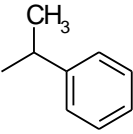
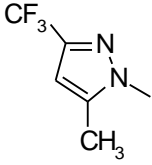
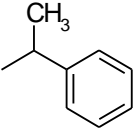
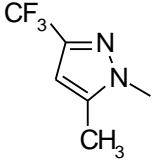
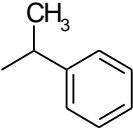
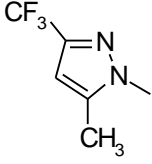
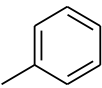
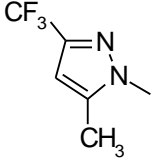
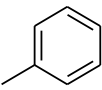
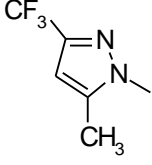
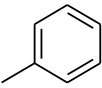
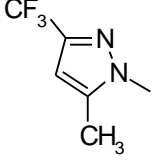
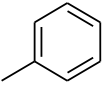
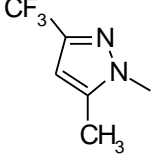
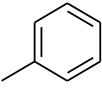
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
108		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)O-	
109		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)NH-	
110		-CH ₂ SO ₂ -	-SO ₂ -	
111		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)-	
112		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=S)-	
113		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)O-	
114		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)NH-	
115		-CH ₂ SO ₂ -	-SO ₂ -	
116		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)-	

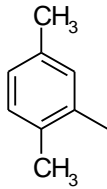
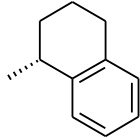
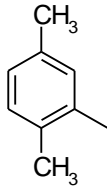
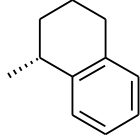
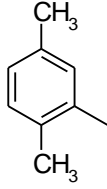
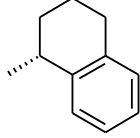
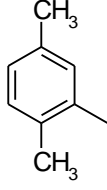
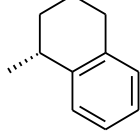
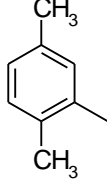
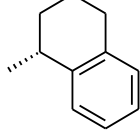
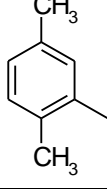
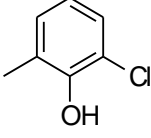
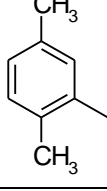
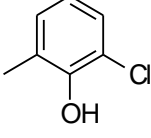
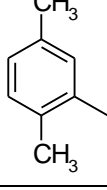
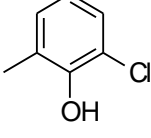
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
117		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=S)-	
118		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)O-	
119		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)NH-	
120		-CH ₂ SO ₂ -	-SO ₂ -	
121		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)-	
122		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=S)-	
123		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)O-	
124		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)NH-	
125		-CH ₂ SO ₂ -	-SO ₂ -	

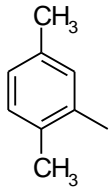
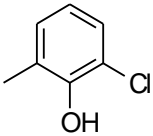
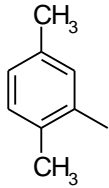
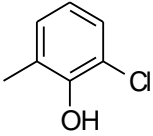
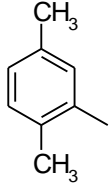
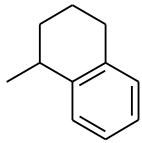
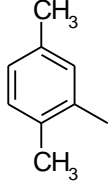
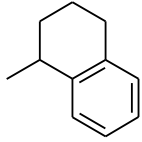
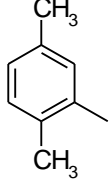
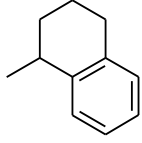
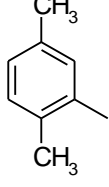
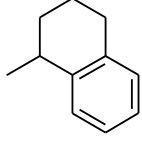
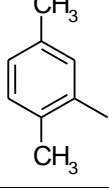
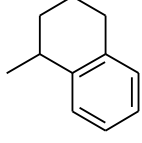
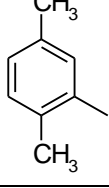
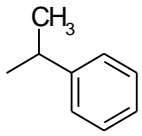
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
126		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)-	
127		-CH ₂ C(=O)-	-C(=S)-	
128		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)O-	
129		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)NH-	
130		-CH ₂ C(=O)-	-SO ₂ -	
131		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)-	
132		-CH ₂ C(=O)-	-C(=S)-	
133		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)O-	

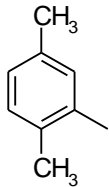
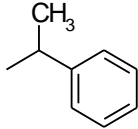
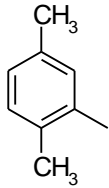
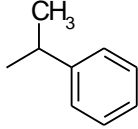
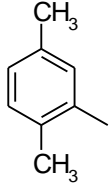
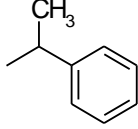
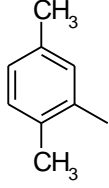
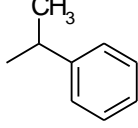
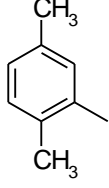
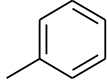
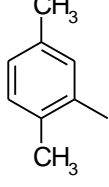
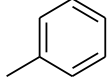
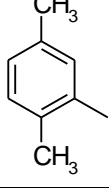
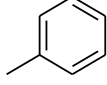
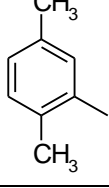
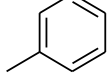
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
134		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)NH-	
135		-CH ₂ C(=O)-	-SO ₂ -	
136		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)-	
137		-CH ₂ C(=O)-	-C(=S)-	
138		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)O-	
139		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)NH-	
140		-CH ₂ C(=O)-	-SO ₂ -	
141		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)-	

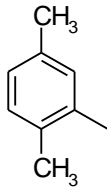
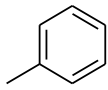
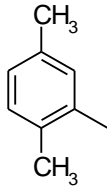
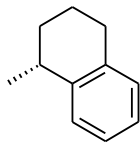
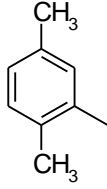
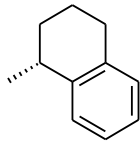
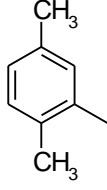
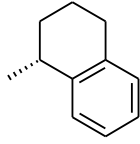
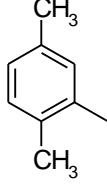
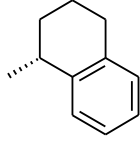
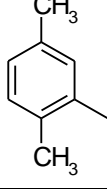
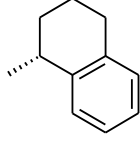
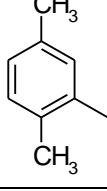
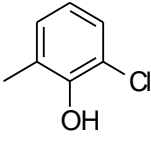
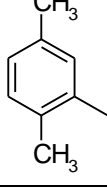
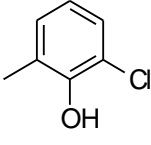
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
142		-CH ₂ C(=O)-	-C(=S)-	
143		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)O-	
144		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)NH-	
145		-CH ₂ C(=O)-	-SO ₂ -	
146		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)-	
147		-CH ₂ C(=O)-	-C(=S)-	
148		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)O-	
149		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)NH-	

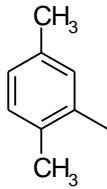
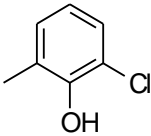
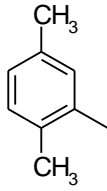
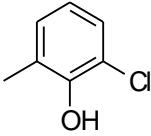
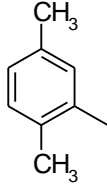
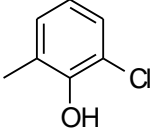
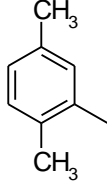
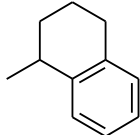
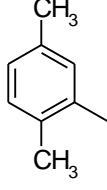
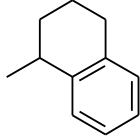
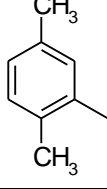
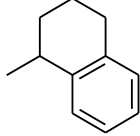
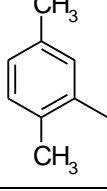
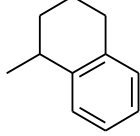
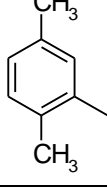
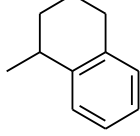
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
150		-CH ₂ C(=O)-	-SO ₂ -	
151		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)-	
152		-CH ₂ C(=S)-	-C(=S)-	
153		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)O-	
154		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)NH-	
155		-CH ₂ C(=S)-	-SO ₂ -	
156		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)-	
157		-CH ₂ C(=S)-	-C(=S)-	

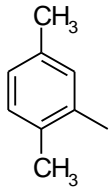
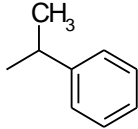
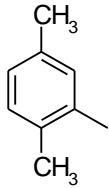
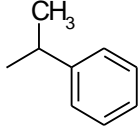
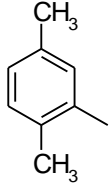
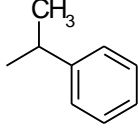
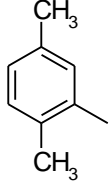
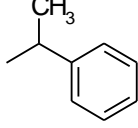
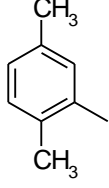
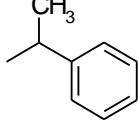
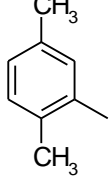
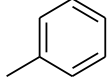
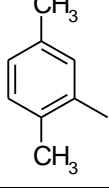
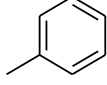
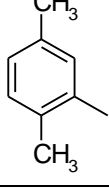
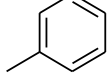
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
158		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)O-	
159		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)NH-	
160		-CH ₂ C(=S)-	-SO ₂ -	
161		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)-	
162		-CH ₂ C(=S)-	-C(=S)-	
163		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)O-	
164		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)NH-	
165		-CH ₂ C(=S)-	-SO ₂ -	

Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
166		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)-	
167		-CH ₂ C(=S)-	-C(=S)-	
168		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)O-	
169		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)NH-	
170		-CH ₂ C(=S)-	-SO ₂ -	
171		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)-	
172		-CH ₂ C(=S)-	-C(=S)-	
173		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)O-	

Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
174		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)NH-	
175		-CH ₂ C(=S)-	-SO ₂ -	
176		-OC(=O)-	-C(=O)-	
177		-OC(=O)-	-C(=S)-	
178		-OC(=O)-	-C(=O)O-	
179		-OC(=O)-	-C(=O)NH-	
180		-OC(=O)-	-SO ₂ -	
181		-OC(=O)-	-C(=O)-	

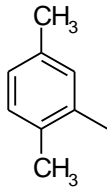
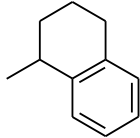
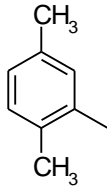
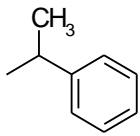
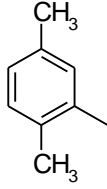
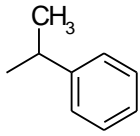
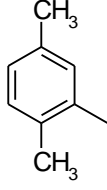
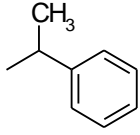
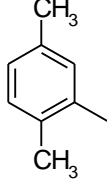
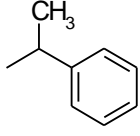
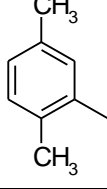
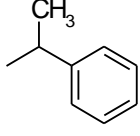
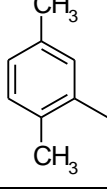
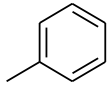
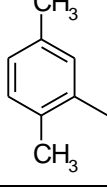
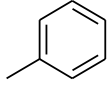
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
182		-OC(=O)-	-C(=S)-	
183		-OC(=O)-	-C(=O)O-	
184		-OC(=O)-	-C(=O)NH-	
185		-OC(=O)-	-SO ₂ -	
186		-OC(=O)-	-C(=O)-	
187		-OC(=O)-	-C(=S)-	
188		-OC(=O)-	-C(=O)O-	
189		-OC(=O)-	-C(=O)NH-	

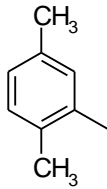
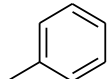
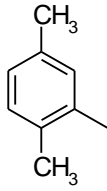
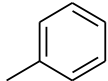
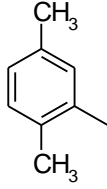
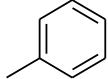
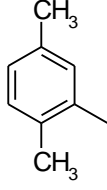
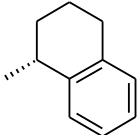
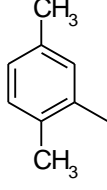
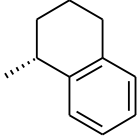
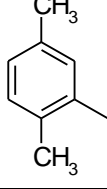
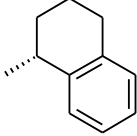
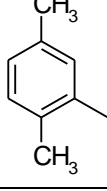
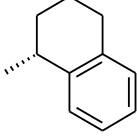
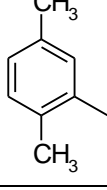
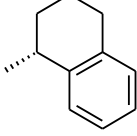
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
190		-OC(=O)-	-SO ₂ -	
191		-OC(=O)-	-C(=O)-	
192		-OC(=O)-	-C(=S)-	
193		-OC(=O)-	-C(=O)O-	
194		-OC(=O)-	-C(=O)NH-	
195		-OC(=O)-	-SO ₂ -	
196		-OC(=O)-	-C(=O)-	
197		-OC(=O)-	-C(=S)-	

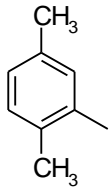
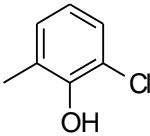
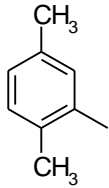
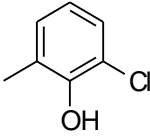
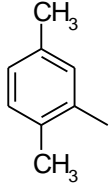
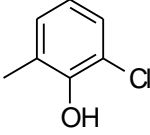
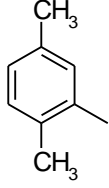
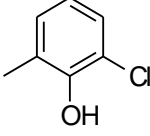
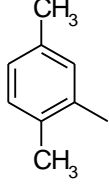
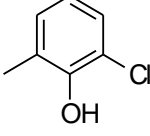
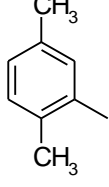
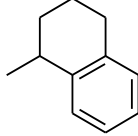
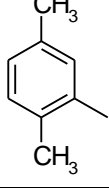
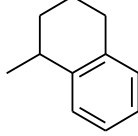
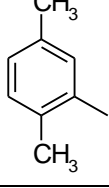
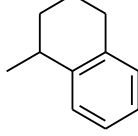
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
198		-OC(=O)-	-C(=O)O-	
199		-OC(=O)-	-C(=O)NH-	
200		-OC(=O)-	-SO ₂ -	
201		-C(=O)-	-C(=O)-	
202		-C(=O)-	-C(=S)-	
203		-C(=O)-	-C(=O)O-	
204		-C(=O)-	-C(=O)NH-	
205		-C(=O)-	-SO ₂ -	

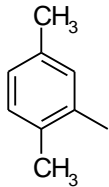
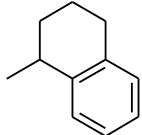
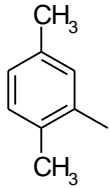
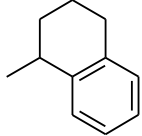
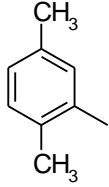
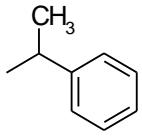
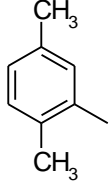
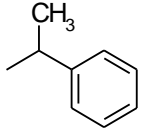
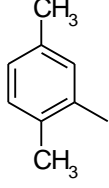
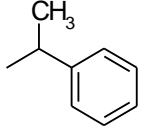
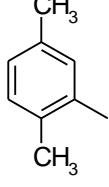
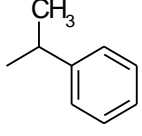
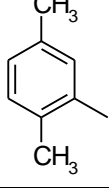
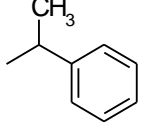
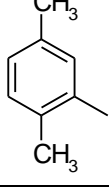
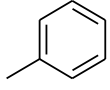
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
206		-C(=O)-	-C(=O)-	
207		-C(=O)-	-C(=S)-	
208		-C(=O)-	-C(=O)O-	
209		-C(=O)-	-C(=O)NH-	
210		-C(=O)-	-SO ₂ -	
211		-C(=O)-	-C(=O)-	
212		-C(=O)-	-C(=S)-	
213		-C(=O)-	-C(=O)O-	

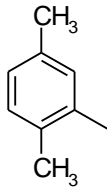
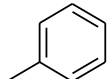
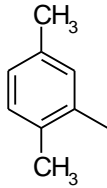
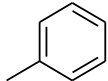
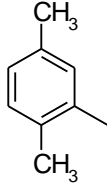
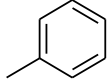
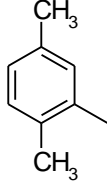
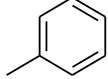
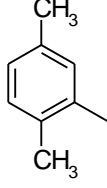
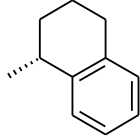
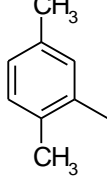
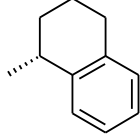
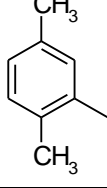
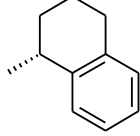
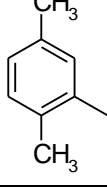
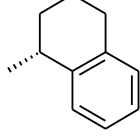
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
214		-C(=O)-	-C(=O)NH-	
215		-C(=O)-	-SO ₂ -	
216		-C(=O)-	-C(=O)-	
217		-C(=O)-	-C(=S)-	
218		-C(=O)-	-C(=O)O-	
219		-C(=O)-	-C(=O)NH-	
220		-C(=O)-	-SO ₂ -	
221		-C(=O)-	-C(=O)-	

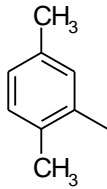
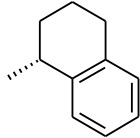
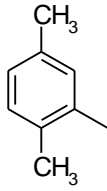
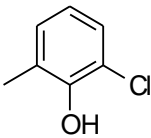
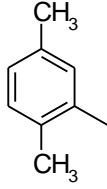
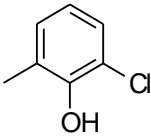
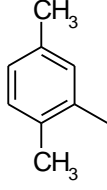
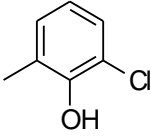
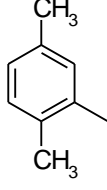
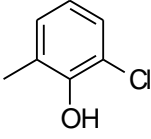
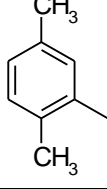
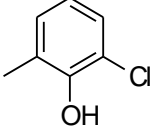
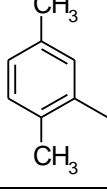
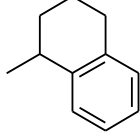
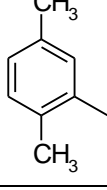
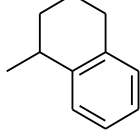
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
222		-C(=O)-	-C(=S)-	
223		-C(=O)-	-C(=O)O-	
224		-C(=O)-	-C(=O)NH-	
225		-C(=O)-	-SO ₂ -	
226		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)-	
227		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=S)-	
228		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)O-	
229		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)NH-	

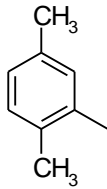
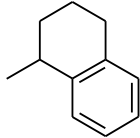
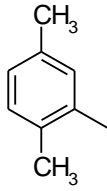
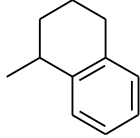
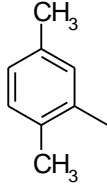
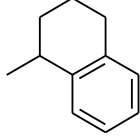
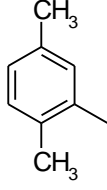
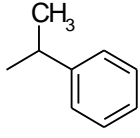
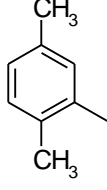
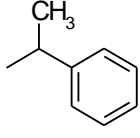
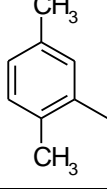
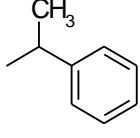
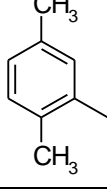
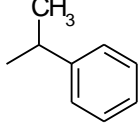
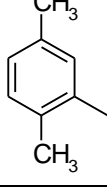
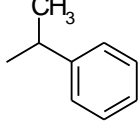
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
230		-CH ₂ SO ₂ -	-SO ₂ -	
231		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)-	
232		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=S)-	
233		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)O-	
234		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)NH-	
235		-CH ₂ SO ₂ -	-SO ₂ -	
236		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)-	
237		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=S)-	

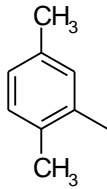
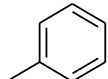
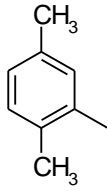
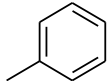
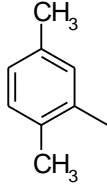
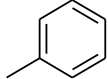
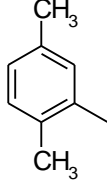
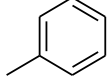
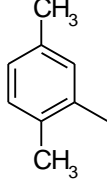
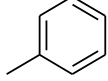
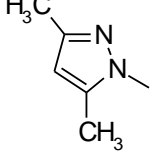
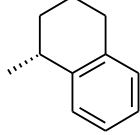
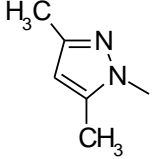
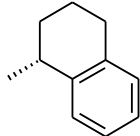
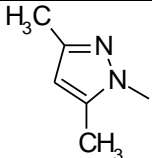
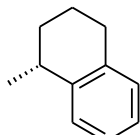
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
238		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)O-	
239		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)NH-	
240		-CH ₂ SO ₂ -	-SO ₂ -	
241		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)-	
242		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=S)-	
243		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)O-	
244		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)NH-	
245		-CH ₂ SO ₂ -	-SO ₂ -	

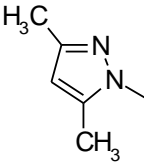
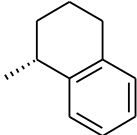
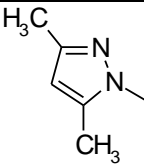
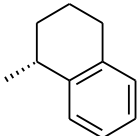
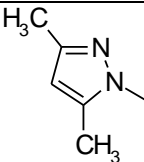
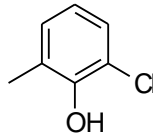
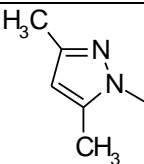
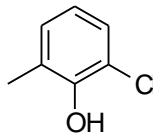
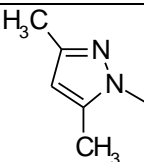
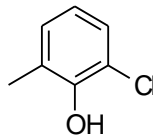
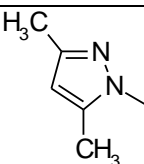
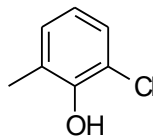
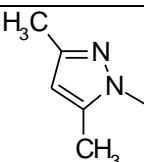
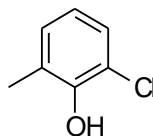
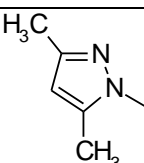
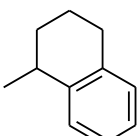
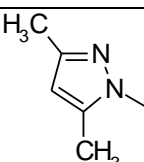
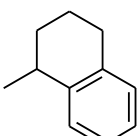
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
246		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)-	
247		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=S)-	
248		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)O-	
249		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)NH-	
250		-CH ₂ SO ₂ -	-SO ₂ -	
251		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)-	
252		-CH ₂ C(=O)-	-C(=S)-	
253		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)O-	

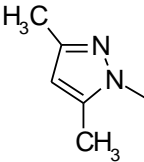
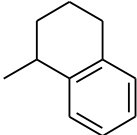
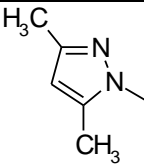
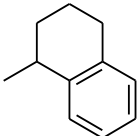
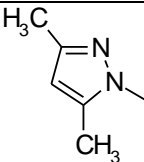
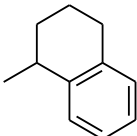
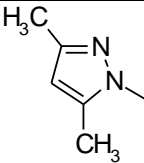
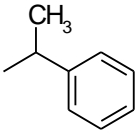
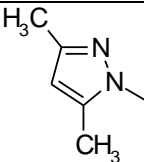
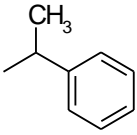
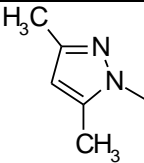
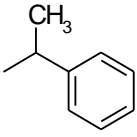
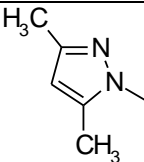
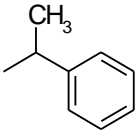
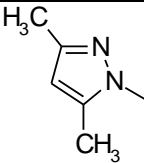
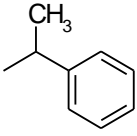
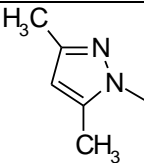
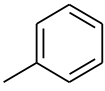
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
254		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)NH-	
255		-CH ₂ C(=O)-	-SO ₂ -	
256		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)-	
257		-CH ₂ C(=O)-	-C(=S)-	
258		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)O-	
259		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)NH-	
260		-CH ₂ C(=O)-	-SO ₂ -	
261		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)-	
262		-CH ₂ C(=O)-	-C(=S)-	

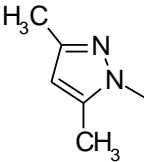
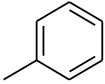
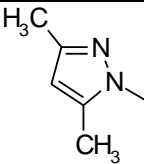
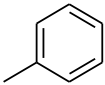
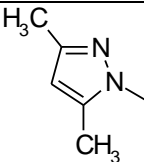
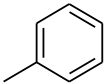
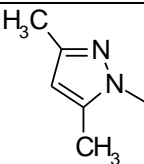
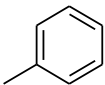
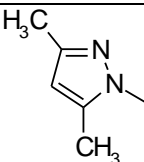
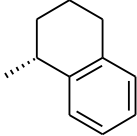
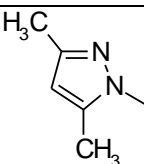
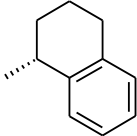
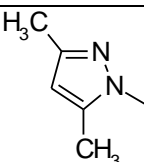
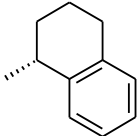
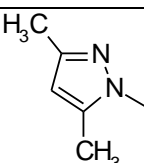
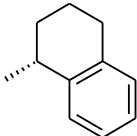
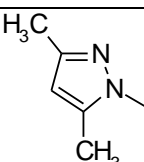
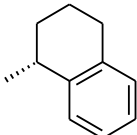
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
263		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)O-	
264		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)NH-	
265		-CH ₂ C(=O)-	-SO ₂ -	
266		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)-	
267		-CH ₂ C(=O)-	-C(=S)-	
268		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)O-	
269		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)NH-	
270		-CH ₂ C(=O)-	-SO ₂ -	
271		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)-	

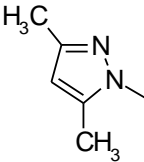
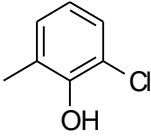
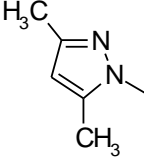
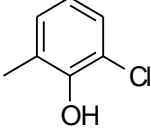
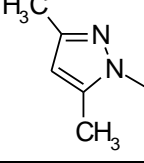
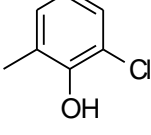
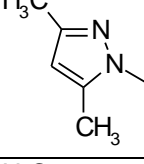
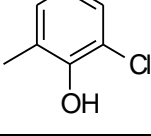
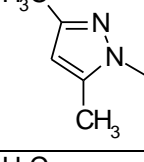
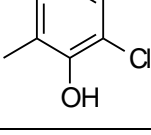
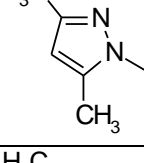
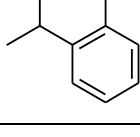
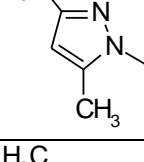
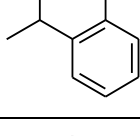
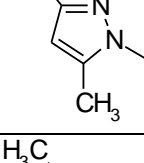
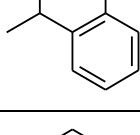
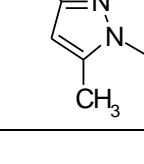
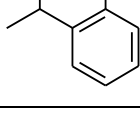
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
272		-CH ₂ C(=O)-	-C(=S)-	
273		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)O-	
274		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)NH-	
275		-CH ₂ C(=O)-	-SO ₂ -	
276		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)-	
277		-CH ₂ C(=S)-	-C(=S)-	
278		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)O-	
279		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)NH-	
280		-CH ₂ C(=S)-	-SO ₂ -	

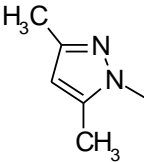
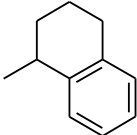
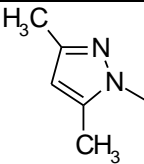
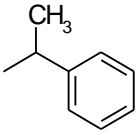
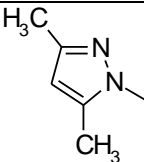
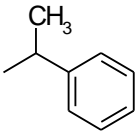
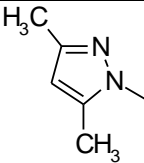
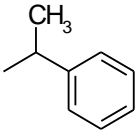
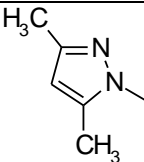
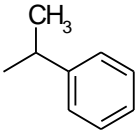
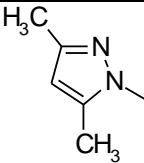
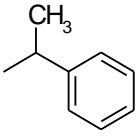
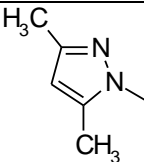
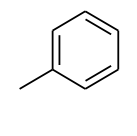
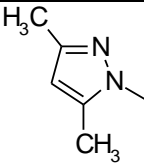
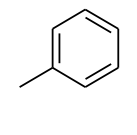
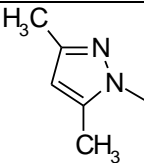
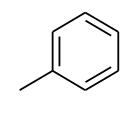
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
281		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)-	
282		-CH ₂ C(=S)-	-C(=S)-	
283		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)O-	
284		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)NH-	
285		-CH ₂ C(=S)-	-SO ₂ -	
286		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)-	
287		-CH ₂ C(=S)-	-C(=S)-	
288		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)O-	
289		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)NH-	

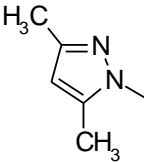
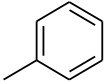
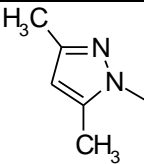
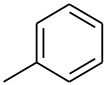
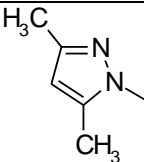
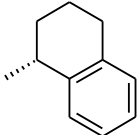
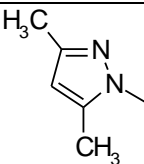
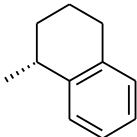
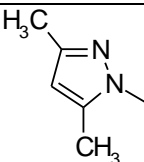
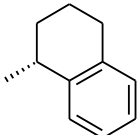
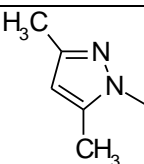
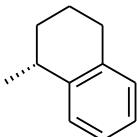
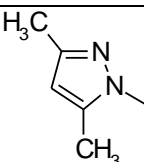
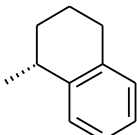
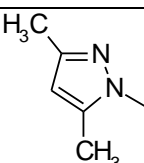
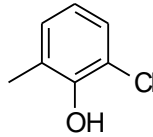
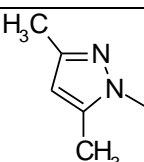
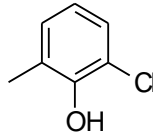
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
290		-CH ₂ C(=S)-	-SO ₂ -	
291		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)-	
292		-CH ₂ C(=S)-	-C(=S)-	
293		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)O-	
294		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)NH-	
295		-CH ₂ C(=S)-	-SO ₂ -	
296		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)-	
297		-CH ₂ C(=S)-	-C(=S)-	
298		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)O-	

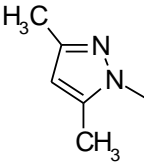
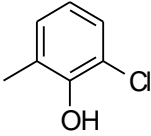
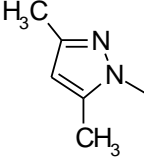
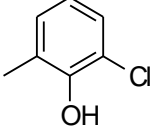
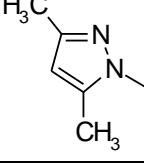
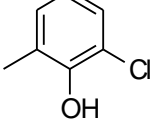
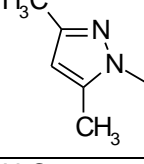
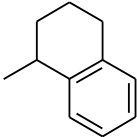
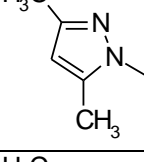
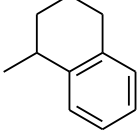
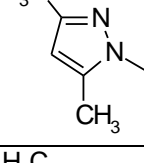
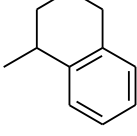
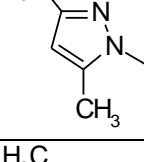
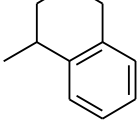
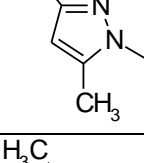
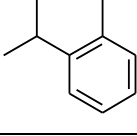
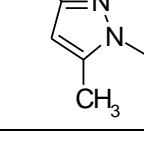
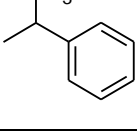
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
299		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)NH-	
300		-CH ₂ C(=S)-	-SO ₂ -	
301		-OC(=O)-	-C(=O)-	
302		-OC(=O)-	-C(=S)-	
303		-OC(=O)-	-C(=O)O-	
304		-OC(=O)-	-C(=O)NH-	
305		-OC(=O)-	-SO ₂ -	
306		-OC(=O)-	-C(=O)-	
307		-OC(=O)-	-C(=S)-	

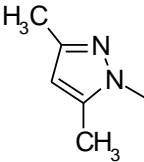
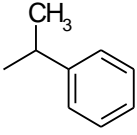
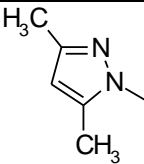
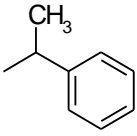
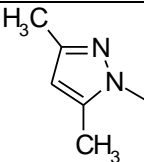
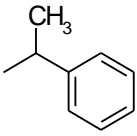
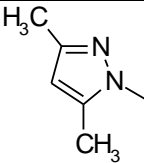
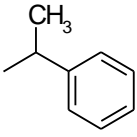
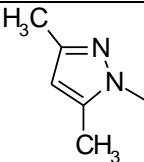
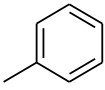
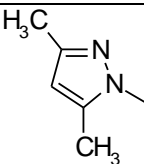
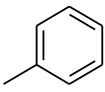
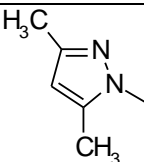
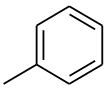
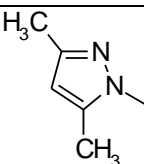
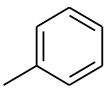
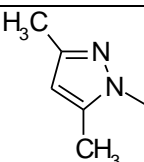
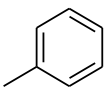
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
308		-OC(=O)-	-C(=O)O-	
309		-OC(=O)-	-C(=O)NH-	
310		-OC(=O)-	-SO ₂ -	
311		-OC(=O)-	-C(=O)-	
312		-OC(=O)-	-C(=S)-	
313		-OC(=O)-	-C(=O)O-	
314		-OC(=O)-	-C(=O)NH-	
315		-OC(=O)-	-SO ₂ -	
316		-OC(=O)-	-C(=O)-	

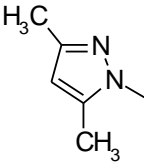
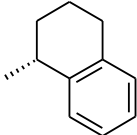
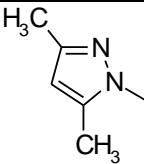
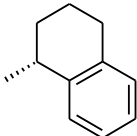
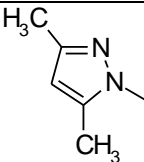
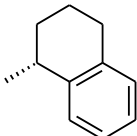
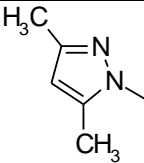
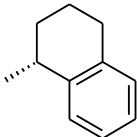
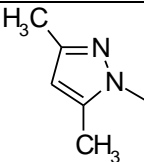
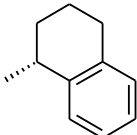
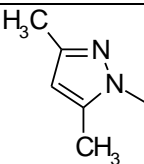
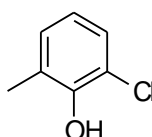
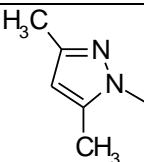
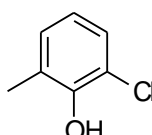
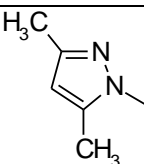
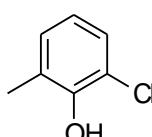
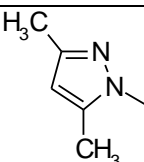
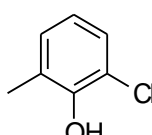
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
317		-OC(=O)-	-C(=S)-	
318		-OC(=O)-	-C(=O)O-	
319		-OC(=O)-	-C(=O)NH-	
320		-OC(=O)-	-SO ₂ -	
321		-OC(=O)-	-C(=O)-	
322		-OC(=O)-	-C(=S)-	
323		-OC(=O)-	-C(=O)O-	
324		-OC(=O)-	-C(=O)NH-	
325		-OC(=O)-	-SO ₂ -	

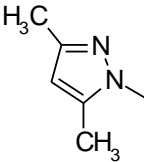
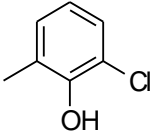
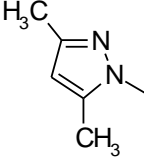
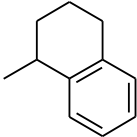
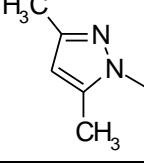
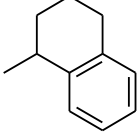
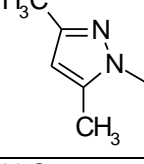
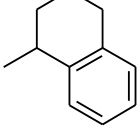
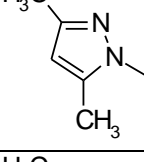
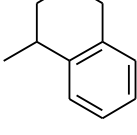
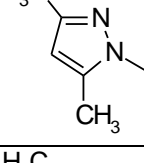
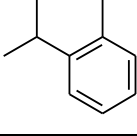
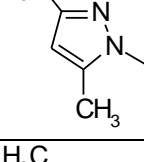
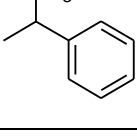
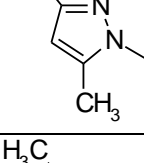
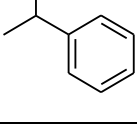
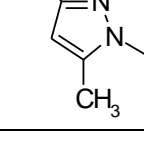
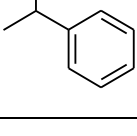
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
326		-C(=O)-	-C(=O)-	
327		-C(=O)-	-C(=S)-	
328		-C(=O)-	-C(=O)O-	
329		-C(=O)-	-C(=O)NH-	
330		-C(=O)-	-SO ₂ -	
331		-C(=O)-	-C(=O)-	
332		-C(=O)-	-C(=S)-	
333		-C(=O)-	-C(=O)O-	
334		-C(=O)-	-C(=O)NH-	

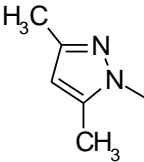
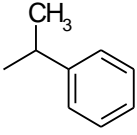
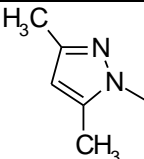
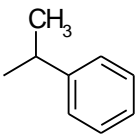
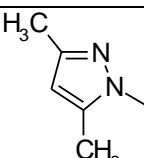
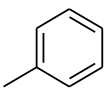
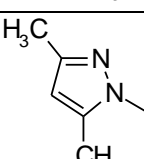
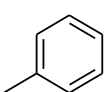
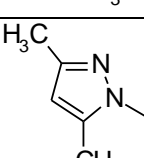
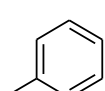
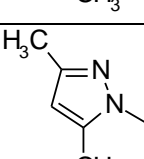
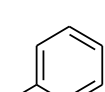
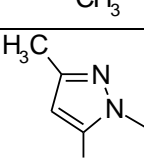
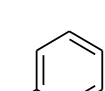
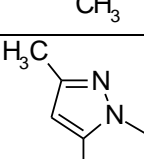
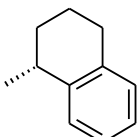
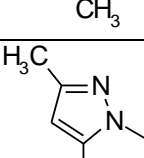
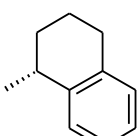
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
335		-C(=O)-	-SO ₂ -	
336		-C(=O)-	-C(=O)-	
337		-C(=O)-	-C(=S)-	
338		-C(=O)-	-C(=O)O-	
339		-C(=O)-	-C(=O)NH-	
340		-C(=O)-	-SO ₂ -	
341		-C(=O)-	-C(=O)-	
342		-C(=O)-	-C(=S)-	
343		-C(=O)-	-C(=O)O-	

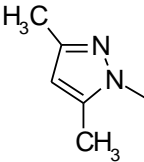
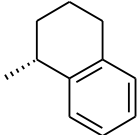
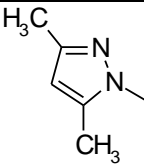
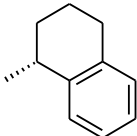
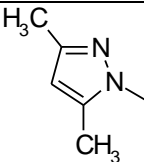
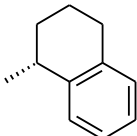
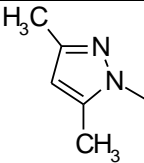
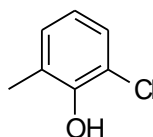
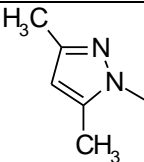
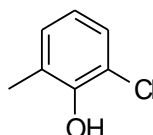
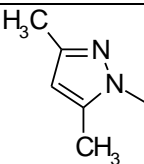
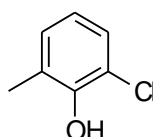
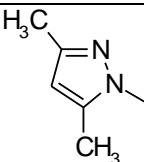
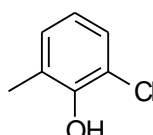
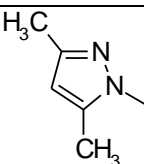
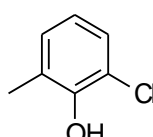
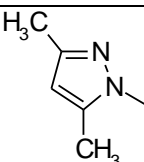
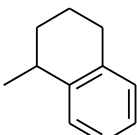
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
344		-C(=O)-	-C(=O)NH-	
345		-C(=O)-	-SO ₂ -	
346		-C(=O)-	-C(=O)-	
347		-C(=O)-	-C(=S)-	
348		-C(=O)-	-C(=O)O-	
349		-C(=O)-	-C(=O)NH-	
350		-C(=O)-	-SO ₂ -	
351		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)-	
352		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=S)-	

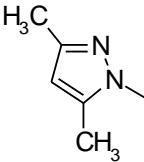
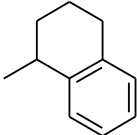
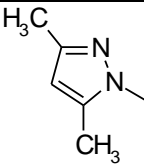
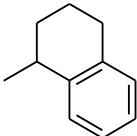
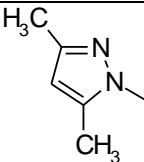
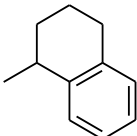
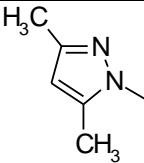
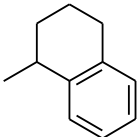
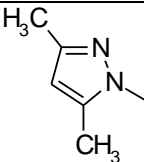
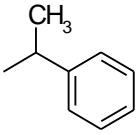
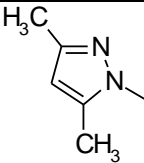
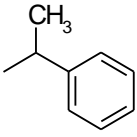
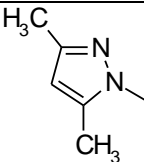
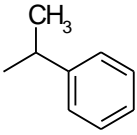
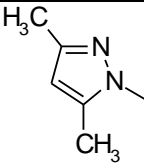
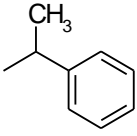
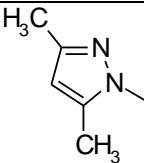
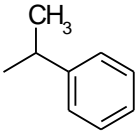
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
353		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)O-	
354		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)NH-	
355		-CH ₂ SO ₂ -	-SO ₂ -	
356		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)-	
357		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=S)-	
358		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)O-	
359		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)NH-	
360		-CH ₂ SO ₂ -	-SO ₂ -	
361		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)-	

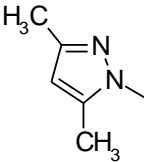
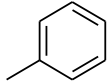
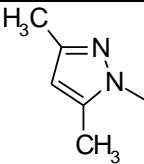
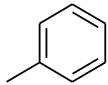
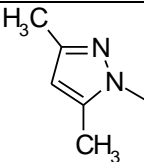
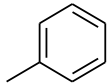
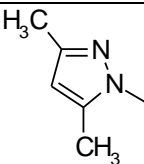
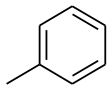
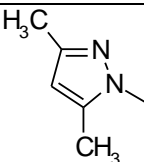
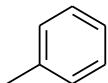
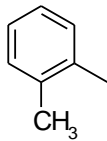
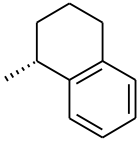
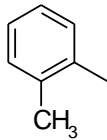
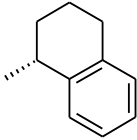
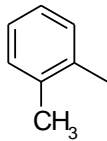
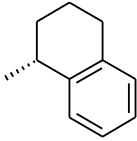
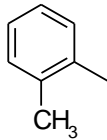
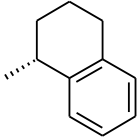
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
362		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=S)-	
363		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)O-	
364		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)NH-	
365		-CH ₂ SO ₂ -	-SO ₂ -	
366		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)-	
367		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=S)-	
368		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)O-	
369		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)NH-	
370		-CH ₂ SO ₂ -	-SO ₂ -	

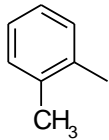
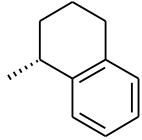
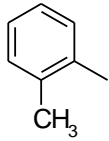
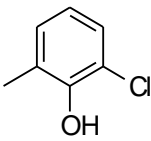
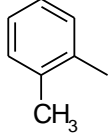
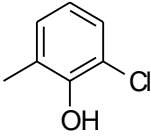
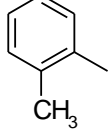
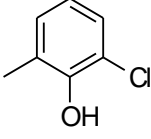
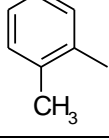
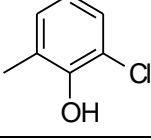
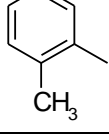
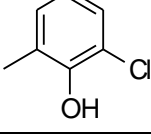
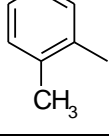
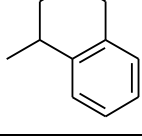
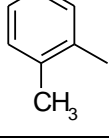
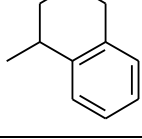
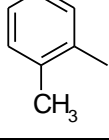
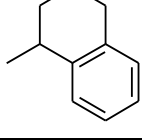
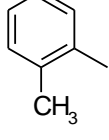
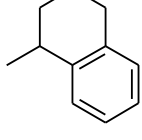
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
371		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)-	
372		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=S)-	
373		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)O-	
374		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)NH-	
375		-CH ₂ SO ₂ -	-SO ₂ -	
376		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)-	
377		-CH ₂ C(=O)-	-C(=S)-	
378		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)O-	
379		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)NH-	

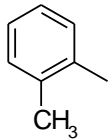
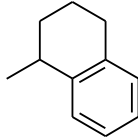
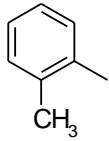
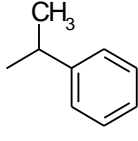
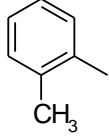
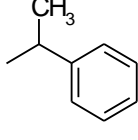
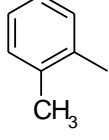
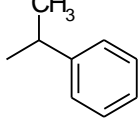
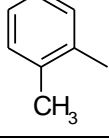
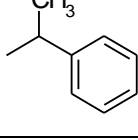
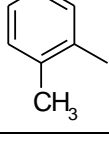
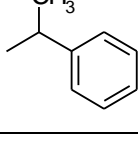
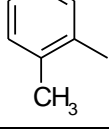
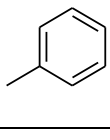
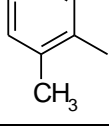
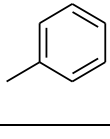
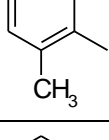
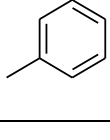
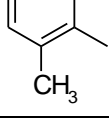
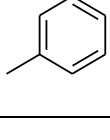
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
380		-CH ₂ C(=O)-	-SO ₂ -	
381		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)-	
382		-CH ₂ C(=O)-	-C(=S)-	
383		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)O-	
384		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)NH-	
385		-CH ₂ C(=O)-	-SO ₂ -	
386		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)-	
387		-CH ₂ C(=O)-	-C(=S)-	
388		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)O-	
389		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)NH-	

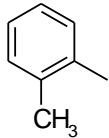
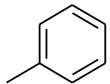
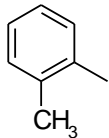
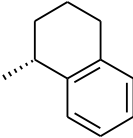
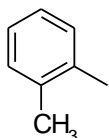
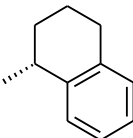
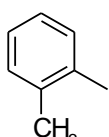
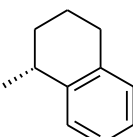
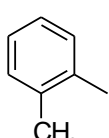
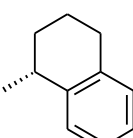
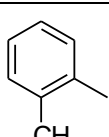
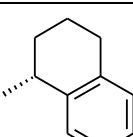
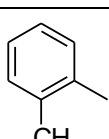
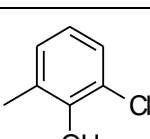
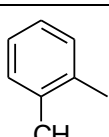
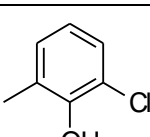
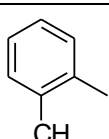
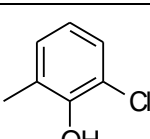
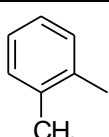
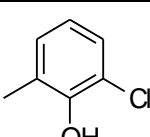
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
390		-CH ₂ C(=O)-	-SO ₂ -	
391		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)-	
392		-CH ₂ C(=O)-	-C(=S)-	
393		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)O-	
394		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)NH-	
395		-CH ₂ C(=O)-	-SO ₂ -	
396		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)-	
397		-CH ₂ C(=O)-	-C(=S)-	
398		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)O-	
399		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)NH-	

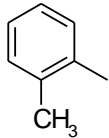
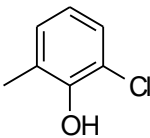
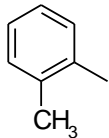
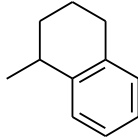
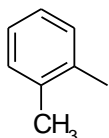
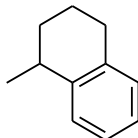
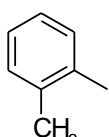
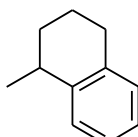
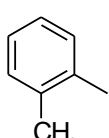
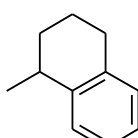
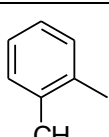
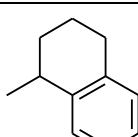
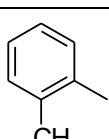
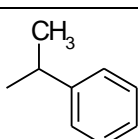
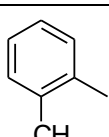
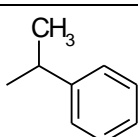
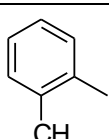
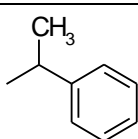
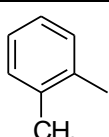
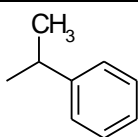
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
400		-CH ₂ C(=O)-	-SO ₂ -	
401		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)-	
402		-CH ₂ C(=S)-	-C(=S)-	
403		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)O-	
404		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)NH-	
405		-CH ₂ C(=S)-	-SO ₂ -	
406		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)-	
407		-CH ₂ C(=S)-	-C(=S)-	
408		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)O-	
409		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)NH-	

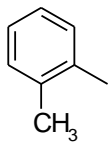
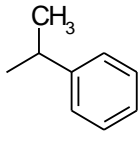
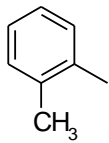
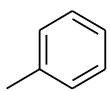
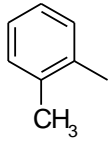
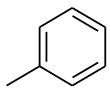
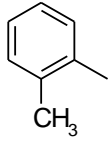
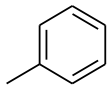
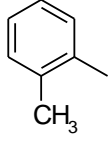
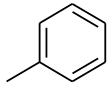
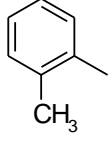
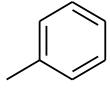
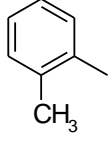
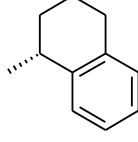
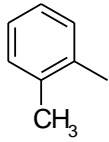
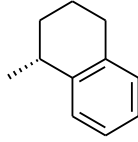
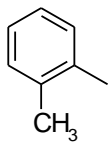
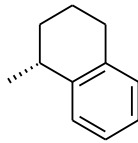
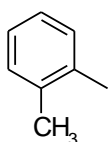
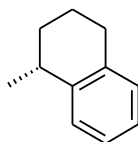
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
410		-CH ₂ C(=S)-	-SO ₂ -	
411		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)-	
412		-CH ₂ C(=S)-	-C(=S)-	
413		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)O-	
414		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)NH-	
415		-CH ₂ C(=S)-	-SO ₂ -	
416		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)-	
417		-CH ₂ C(=S)-	-C(=S)-	
418		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)O-	
419		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)NH-	

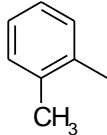
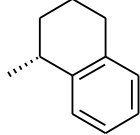
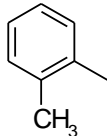
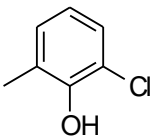
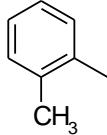
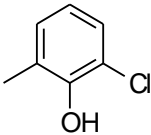
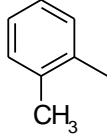
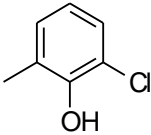
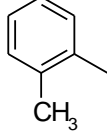
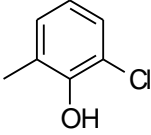
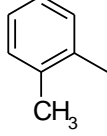
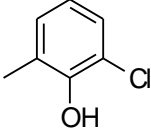
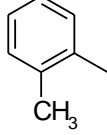
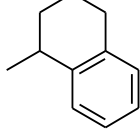
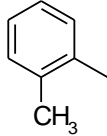
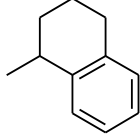
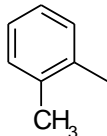
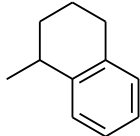
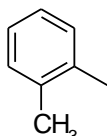
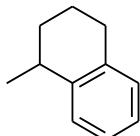
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
420		-CH ₂ C(=S)-	-SO ₂ -	
421		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)-	
422		-CH ₂ C(=S)-	-C(=S)-	
423		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)O-	
424		-CH ₂ C(=S)-	-C(=O)NH-	
425		-CH ₂ C(=S)-	-SO ₂ -	
426		-OC(=O)-	-C(=O)-	
427		-OC(=O)-	-C(=S)-	
428		-OC(=O)-	-C(=O)O-	
429		-OC(=O)-	-C(=O)NH-	

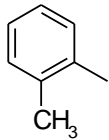
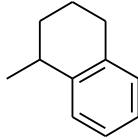
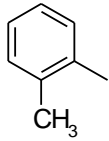
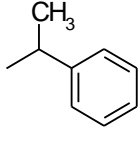
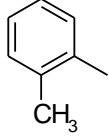
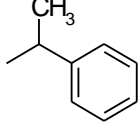
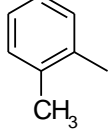
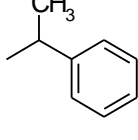
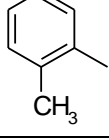
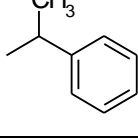
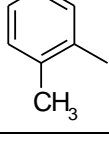
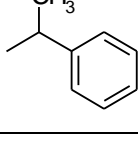
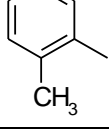
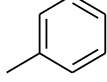
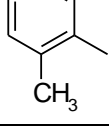
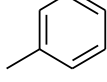
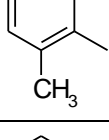
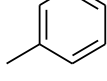
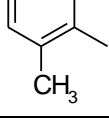
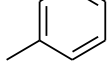
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
430		-OC(=O)-	-SO ₂ -	
431		-OC(=O)-	-C(=O)-	
432		-OC(=O)-	-C(=S)-	
433		-OC(=O)-	-C(=O)O-	
434		-OC(=O)-	-C(=O)NH-	
435		-OC(=O)-	-SO ₂ -	
436		-OC(=O)-	-C(=O)-	
437		-OC(=O)-	-C(=S)-	
438		-OC(=O)-	-C(=O)O-	
439		-OC(=O)-	-C(=O)NH-	

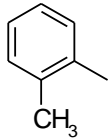
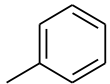
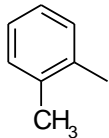
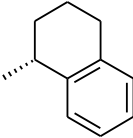
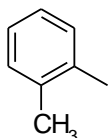
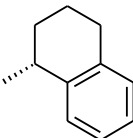
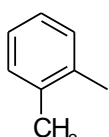
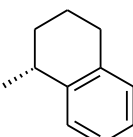
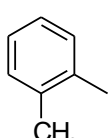
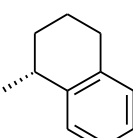
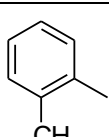
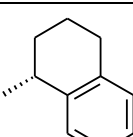
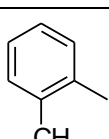
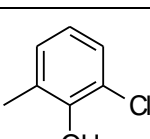
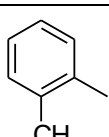
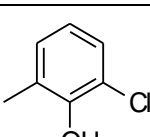
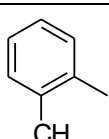
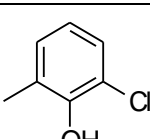
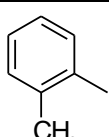
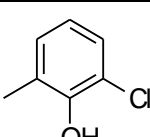
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
440		-OC(=O)-	-SO ₂ -	
441		-OC(=O)-	-C(=O)-	
442		-OC(=O)-	-C(=S)-	
443		-OC(=O)-	-C(=O)O-	
444		-OC(=O)-	-C(=O)NH-	
445		-OC(=O)-	-SO ₂ -	
446		-OC(=O)-	-C(=O)-	
447		-OC(=O)-	-C(=S)-	
448		-OC(=O)-	-C(=O)O-	
449		-OC(=O)-	-C(=O)NH-	

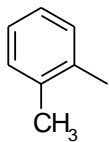
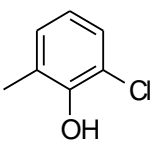
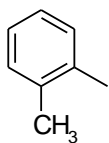
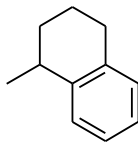
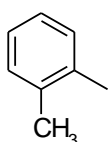
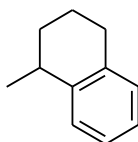
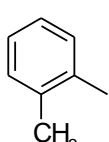
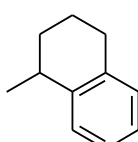
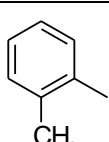
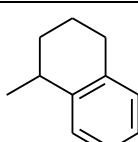
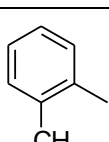
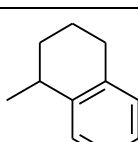
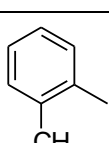
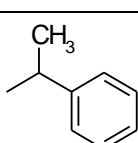
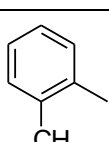
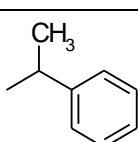
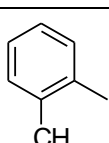
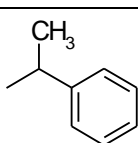
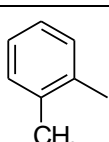
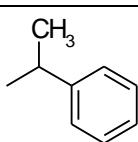
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
450		-OC(=O)-	-SO ₂ -	
451		-C(=O)-	-C(=O)-	
452		-C(=O)-	-C(=S)-	
453		-C(=O)-	-C(=O)O-	
454		-C(=O)-	-C(=O)NH-	
455		-C(=O)-	-SO ₂ -	
456		-C(=O)-	-C(=O)-	
457		-C(=O)-	-C(=S)-	
458		-C(=O)-	-C(=O)O-	
459		-C(=O)-	-C(=O)NH-	

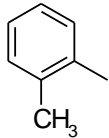
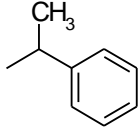
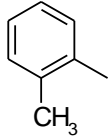
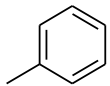
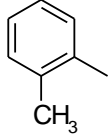
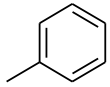
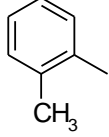
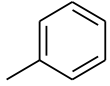
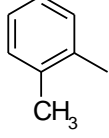
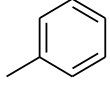
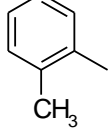
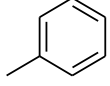
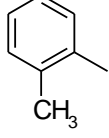
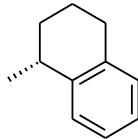
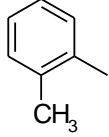
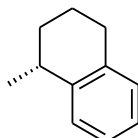
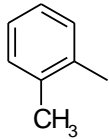
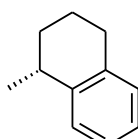
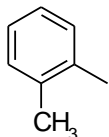
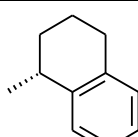
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
460		-C(=O)-	-SO ₂ -	
461		-C(=O)-	-C(=O)-	
462		-C(=O)-	-C(=S)-	
463		-C(=O)-	-C(=O)O-	
464		-C(=O)-	-C(=O)NH-	
465		-C(=O)-	-SO ₂ -	
466		-C(=O)-	-C(=O)-	
467		-C(=O)-	-C(=S)-	
468		-C(=O)-	-C(=O)O-	
469		-C(=O)-	-C(=O)NH-	

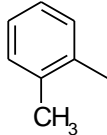
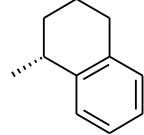
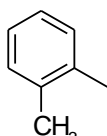
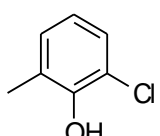
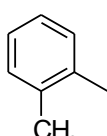
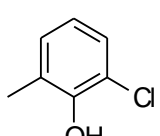
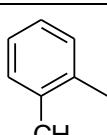
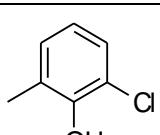
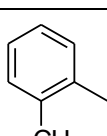
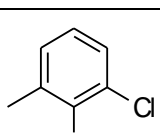
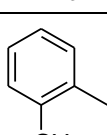
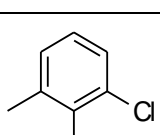
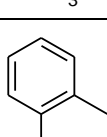
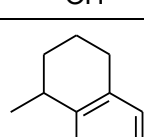
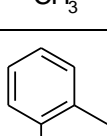
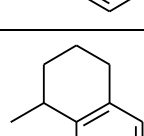
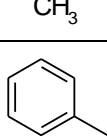
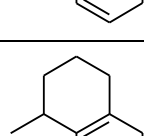
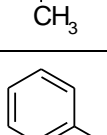
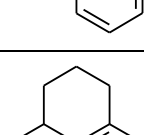
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
470		-C(=O)-	-SO ₂ -	
471		-C(=O)-	-C(=O)-	
472		-C(=O)-	-C(=S)-	
473		-C(=O)-	-C(=O)O-	
474		-C(=O)-	-C(=O)NH-	
475		-C(=O)-	-SO ₂ -	
476		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)-	
477		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=S)-	
478		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)O-	
479		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)NH-	

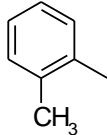
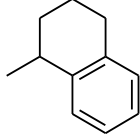
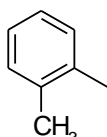
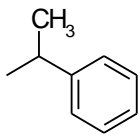
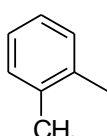
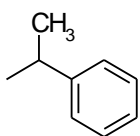
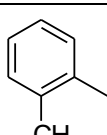
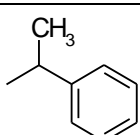
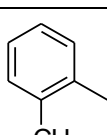
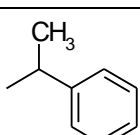
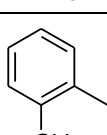
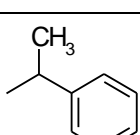
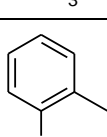
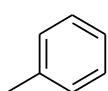
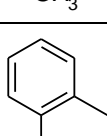
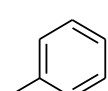
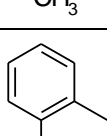
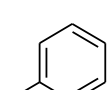
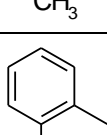
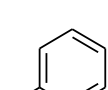
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
480		-CH ₂ SO ₂ -	-SO ₂ -	
481		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)-	
482		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=S)-	
483		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)O-	
484		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)NH-	
485		-CH ₂ SO ₂ -	-SO ₂ -	
486		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)-	
487		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=S)-	
488		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)O-	
489		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)NH-	

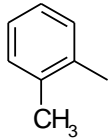
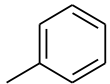
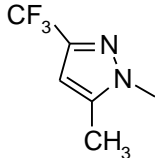
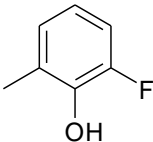
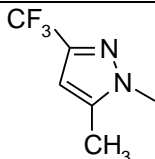
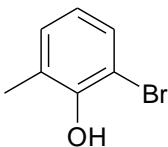
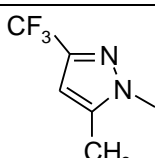
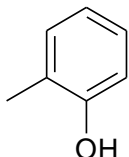
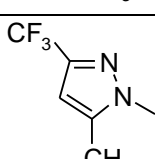
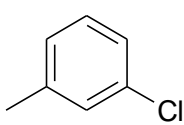
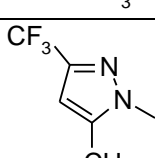
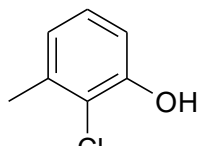
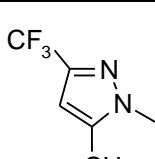
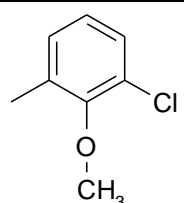
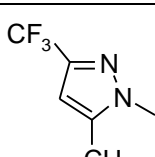
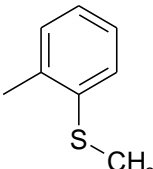
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
490		-CH ₂ SO ₂ -	-SO ₂ -	
491		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)-	
492		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=S)-	
493		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)O-	
494		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)NH-	
495		-CH ₂ SO ₂ -	-SO ₂ -	
496		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)-	
497		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=S)-	
498		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)O-	
499		-CH ₂ SO ₂ -	-C(=O)NH-	

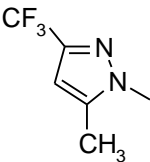
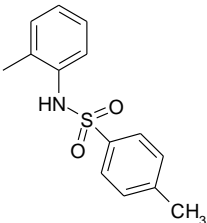
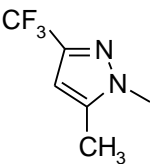
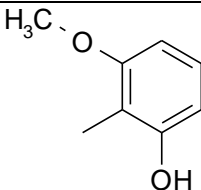
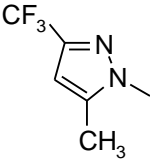
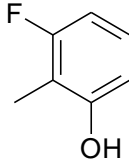
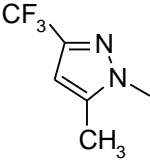
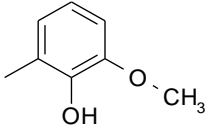
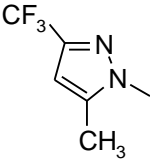
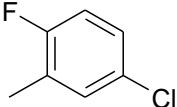
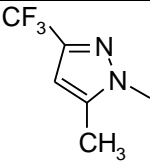
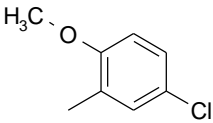
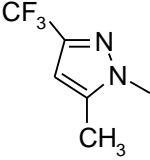
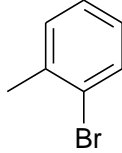
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
500		-CH ₂ SO ₂ -	-SO ₂ -	
501		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)-	
502		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)-	
503		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)-	
504		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)-	
505		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)-	
506		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)-	
507		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)-	

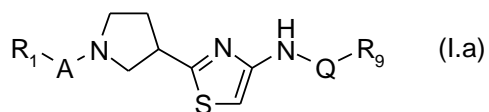
Таблиця 1

Окремі сполуки формули I згідно з винаходом

№ сполуки	R ¹	A	Q	R ⁹
508		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)-	
509		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)-	
510		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)-	
511		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)-	
512		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)-	
513		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)-	
514		-CH ₂ C(=O)-	-C(=O)-	

де

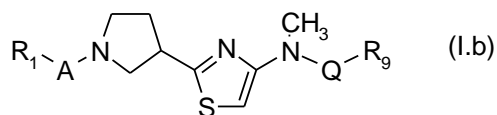
а) 514 сполук формули (I.a):



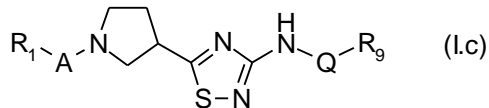
5

в якій A , Q , R^1 та R^9 відповідають визначенням із таблиці 1.

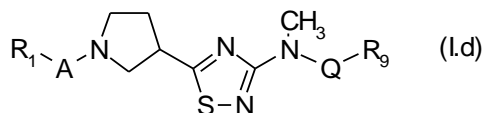
b) 514 сполук формули (I.b):



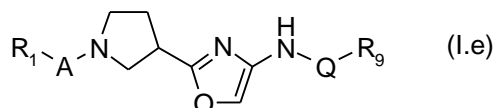
в якій A, Q, R¹ та R⁹ відповідають визначенням із таблиці 1.
с) 514 сполук формули (l.c):



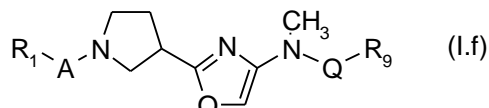
5 в якій A, Q, R¹ та R⁹ відповідають визначенням із таблиці 1.
d) 514 сполук формули (l.d):



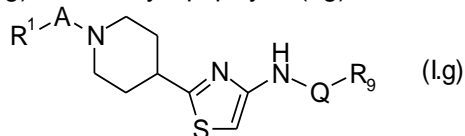
в якій A, Q, R¹ та R⁹ відповідають визначенням із таблиці 1.
е) 514 сполук формули (l.e):



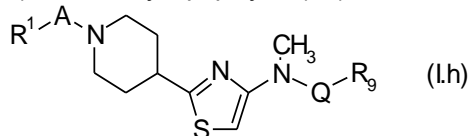
10 в якій A, Q, R¹ та R⁹ відповідають визначенням із таблиці 1.
f) 514 сполук формули (l.f):



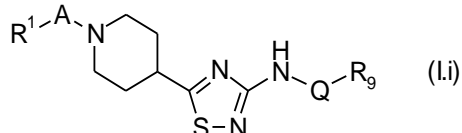
15 в якій A, Q, R¹ та R⁹ відповідають визначенням із таблиці 1.
g) 514 сполук формули (l.g):



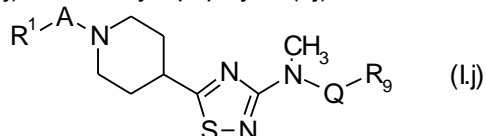
в якій A, Q, R¹ та R⁹ відповідають визначенням із таблиці 1.
h) 514 сполук формули (l.h):



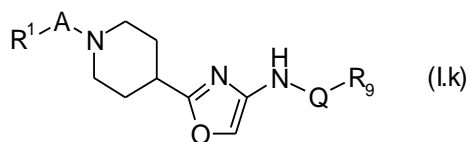
20 в якій A, Q, R¹ та R⁹ відповідають визначенням із таблиці 1.
i) 514 сполук формули (l.i):



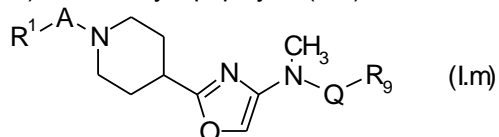
в якій A, Q, R¹ та R⁹ відповідають визначенням із таблиці 1.
j) 514 сполук формули (l.j):



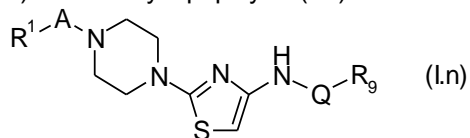
25 в якій A, Q, R¹ та R⁹ відповідають визначенням із таблиці 1.
к) 514 сполук формули (l.k):



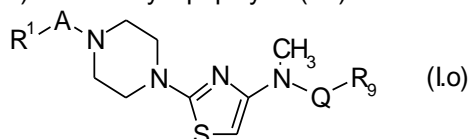
в якій A, Q, R¹ та R⁹ відповідають визначенням із таблиці 1.
m) 514 сполук формули (l.m):



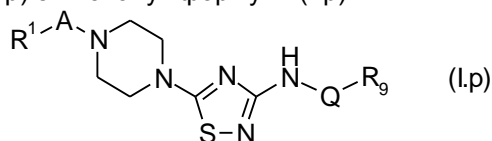
5 в якій A, Q, R¹ та R⁹ відповідають визначенням із таблиці 1.
n) 514 сполук формули (l.n):



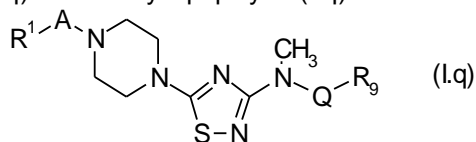
в якій A, Q, R¹ та R⁹ відповідають визначенням із таблиці 1.
o) 514 сполук формули (l.o):



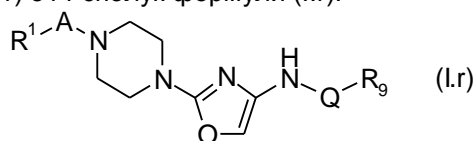
10 в якій A, Q, R¹ та R⁹ відповідають визначенням із таблиці 1.
p) 514 сполук формули (l.p):



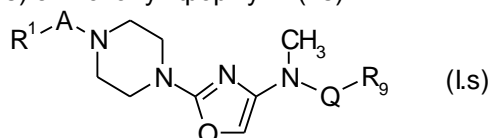
в якій A, Q, R¹ та R⁹ відповідають визначенням із таблиці 1.
q) 514 сполук формули (l.q):



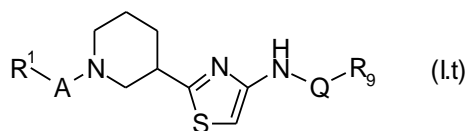
в якій A, Q, R¹ та R⁹ відповідають визначенням із таблиці 1.
r) 514 сполук формули (l.r):



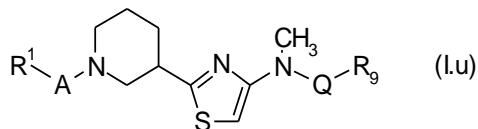
20 в якій A, Q, R¹ та R⁹ відповідають визначенням із таблиці 1.
s) 514 сполук формули (l.s):



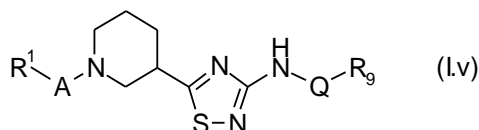
в якій A, Q, R¹ та R⁹ відповідають визначенням із таблиці 1.
t) 514 сполук формули (l.t):



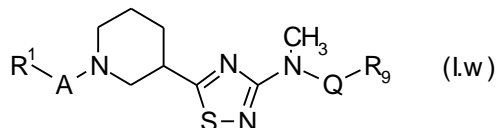
в якій A, Q, R¹ та R⁹ відповідають визначенням із таблиці 1.
u) 514 сполук формули (I.u):



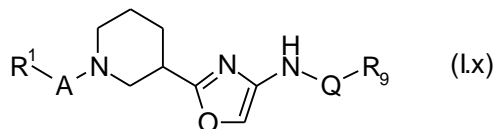
5 в якій A, Q, R¹ та R⁹ відповідають визначенням із таблиці 1.
v) 514 сполук формули (I.v):



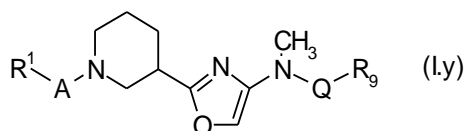
в якій A, Q, R¹ та R⁹ відповідають визначенням із таблиці 1.
w) 514 сполук формули (I.w):



10 в якій A, Q, R¹ та R⁹ відповідають визначенням із таблиці 1.
x) 514 сполук формули (I.x):



15 в якій A, Q, R¹ та R⁹ відповідають визначенням із таблиці 1.
y) 514 сполук формули (I.y):



в якій A, Q, R¹ та R⁹ відповідають визначенням із таблиці 1.

У цьому описі значення температури вказано у градусах Цельсія, а «m.p.» означає «melting point» (температура плавлення). «PX/MC» означає рідинну хромато-мас-спектроскопію. Опис установки та методу: (ВЕРХ HP 1100 виробництва Agilent, Phenomenex Gemini C18, розмір часток 3 мкм, 110 ангстрем; колона 30 x 3 мм, 1,7 мл/хв., 60 °С, Н₂О + 0,05 % НСООН (95 %) / СН₃CN/MeOH 4:1 + 0,04 % НСООН (5 %) - 2 хв. - СН₃CN/MeOH 4:1 + 0,04 % НСООН (5 %) - 0,8 хв.; мас-спектрометр ZQ виробництва компанії Waters.; метод іонізації: електророзпилення (іонізація електророзпиленням (ESI)); полярність - позитивні іони; капілярна напруга (кВ): 3,00; різниця потенціалів на конусі (В): 30,00, екстрактор (В) 2,00; температура джерела (°С) 100, температура десольвації (°С): 250; швидкість потоку газу на конусі (л/год.): 50; швидкість потоку газу для десольвації (л/год.) 400.

У таблиці 2 представлено вибрані значення m.p. і вибрані дані РХ/МС для сполук з таблиці 1.

Таблиця 2

Температура плавлення та дані РХ/МС для сполук із таблиці 1

Номер сполуки	Температура плавлення (°C)	РХ/МС
I.g.001	175	
I.g.006		Rt = 3,27 хв.; МС: m/z = 527 (M+1)
I.g.011	179-181	
I.g.013		Rt = 2,02 хв.; МС: m/z = 570 (M+23)
I.g.016		Rt = 1,9 хв.; МС: m/z = 506 (M+1)
I.g.018		Rt = 1,91 хв.; МС: m/z = 522 (M+23)
I.g.021 ¹		Rt = 2,77 хв.; МС: m/z = 478 (M+1)
I.g.023	154-156	Rt = 1,94 хв.; МС: m/z = 508 (M+1)
I.g.024		Rt = 1,85 хв.; МС: m/z = 494 (M+1)
I.g.025 ¹		Rt = 2,75 хв.; МС: m/z = 514 (M+1)
I.g.136		Rt = 2,01 хв.; МС: m/z = 488 (M+1)
I.g.141		Rt = 1,98 хв.; МС: m/z = 462 (M+1)
I.g.196		Rt = 2,17 хв.; МС: m/z = 490 (M+1)
I.g.211	233-234	
I.g.246	173-175	
I.g.386	174-175	
I.g.501		Rt = 1,88 хв.; МС: m/z = 512 (M+1)
I.g.502	193-195	
I.g.503		Rt = 1,85 хв.; МС: m/z = 494 (M+1)
I.g.504		Rt = 1,95 хв.; МС: m/z = 512 (M+1)
I.g.505		Rt = 1,70 хв.; МС: m/z = 528 (M+1)
I.g.506		Rt = 1,97 хв.; МС: m/z = 542 (M+1)
I.g.507		Rt = 1,85 хв.; МС: m/z = 524 (M+1)
I.g.508		Rt = 1,98 хв.; МС: m/z = 647 (M+1)
I.g.509		Rt = 2,03 хв.; МС: m/z = 524 (M+1)
I.g.510		Rt = 1,94 хв.; МС: m/z = 512 (M+1)
I.g.511		Rt = 1,85 хв.; МС: m/z = 524 (M+1)
I.g.512		Rt = 1,96 хв.; МС: m/z = 530 (M+1)
I.g.513		Rt = 2,03 хв.; МС: m/z = 542 (M+1)
I.g.514		Rt = 1,86 хв.; МС: m/z = 558 (M+2)
I.h.011		Rt = 1,90 хв.; МС: m/z = 546 (M+1)
I.n.011	207-209	
I.n.021		Rt = 1,78 хв.; МС: m/z = 479 (M+1)
I.n.023		Rt = 1,83 хв.; МС: m/z = 495 (M+1)
I.n.024	175-178	

Сполуки згідно з цим винаходом можуть бути отримані відповідно до наведених вище схем реакцій, в яких, якщо не вказано інше, визначення кожної змінної відповідає представленому вище визначенню для сполуки формули (I).

5

Біологічні приклади

Phytophthora infestans/томати/профілактична обробка листя (фітофтороз томатів)

Листя помідорів поміщають на водний агар у багатолункові плашки (24 лунки) та обприскують розробленою досліджуваною сполукою, розведеною у воді. Листя заражають шляхом їх обприскування суспензією спор грибка через 1 день після обробки. Заражене листя витримують у камері для кліматичних випробувань за температури 16 °C та відносної вологості 75 % за світлового режиму 24 год. темряви, 12 год. освітлення/12 год. темряви; дію сполуки оцінюють як відсоток ефективності боротьби з хворобою в порівнянні з необробленим листям у період, коли на необробленому контрольному листі проявляється відповідний рівень ураження хворобою (через 5-7 днів після обробки).

15

У цьому випробуванні ефективність сполук I.g.001, I.g.006, I.g.011, I.g.013, I.g.016, I.g.018, I.g.021, I.g.023, I.g.024, I.g.136, I.g.386, I.g.501, I.g.503, I.g.506, I.g.508, I.g.509, I.g.510, I.g.511, I.h.011, I.n.011 та I.n.021 у боротьбі з інфекцією при концентрації 200 ppm складає не менше

80 % у порівнянні з необробленим контрольним листям, що знаходиться в аналогічних умовах, на якому спостерігається значне розповсюдження хвороби.

Phytophthora infestans /картопля/профілактична обробка (фітофтороз картоплі (картопляна гниль))

5 2-тижневі рослини картоплі сорту Bintje обприскують у зрошувальній камері розведеною у воді досліджуваною сполукою. Досліджувані рослини заражають шляхом їх обприскування суспензією спорангію через 2 дні після обробки сполукою. Заражені досліджувані рослини витримують у вегетаційній камері за температури 18 °C за 14-годинного освітлення на добу та відносної вологості 100 %; відсоток охопленої хворобою площі листя оцінюють у період, коли

10 на необроблених контрольних рослинах проявляється відповідний рівень ураження хворобою (через 5-7 днів після обробки).

У цьому випробуванні ефективність сполук I.g.001, I.g.006, I.g.011, I.g.016, I.g.023, I.g.024, I.g.136, I.g.501, I.g.502 та I.g.511 у боротьбі з інфекцією при концентрації 200 ppm складає не менше 80 % у порівнянні з необробленим контрольним листям, що знаходиться

15 в аналогічних умовах, на якому спостерігається значне розповсюдження хвороби.

Phytophthora infestans /картопля/тривала обробка (фітофтороз картоплі (картопляна гниль))

2-тижневі рослини картоплі сорту Bintje обприскують у зрошувальній камері розведеною у воді досліджуваною сполукою. Досліджувані рослини заражають шляхом їх обприскування суспензією спорангію через 6 днів після обробки сполукою. Заражені досліджувані рослини витримують у вегетаційній камері за температури 18 °C за 14-годинного освітлення на добу та відносної вологості 100 %, відсоток охопленої хворобою площі листя оцінюють у період, коли

20 на необроблених контрольних рослинах проявляється відповідний рівень ураження хворобою (через 9-11 днів після обробки).

У цьому випробуванні ефективність сполук I.g.001, I.g.006, I.g.011, I.g.016, I.g.023, I.g.024, I.g.501 та I.g.502 у боротьбі з інфекцією при 200 ppm складає не менше 80 % у порівнянні з необробленим контрольним листям, що знаходиться в аналогічних умовах, на якому

25 спостерігається значне розповсюдження хвороби.

Phytophthora infestans /картопля/лікувальна обробка (фітофтороз картоплі (картопляна гниль))

30 2-тижневі рослини картоплі сорту Bintje заражають шляхом їх обприскування суспензією спорангію за один день до обробки сполукою. Заражені рослини обприскують у зрошувальній камері розведеною у воді досліджуваною сполукою. Заражені досліджувані рослини витримують у вегетаційній камері за температури 18 °C за 14-годинного освітлення на добу та відносної вологості 100 %, відсоток охопленої хворобою площі листя оцінюють у період, коли

35 на необроблених контрольних рослинах проявляється відповідний рівень ураження хворобою (через 3-4 дні після обробки).

У цьому випробуванні ефективність сполук I.g.001, I.g.011 та I.g.023 у боротьбі з інфекцією при концентрації 200 ppm складає не менше 80 % у порівнянні з необробленим контрольним листям, що знаходиться в аналогічних умовах, на якому спостерігається значне

40 розповсюдження хвороби.

Plasmopara viticola (мілдью) /виноград/профілактична обробка листя (несправжня борошниста роса винограду)

Листя винограду поміщають на водний агар у багатолункові плашки (24 лунки) та обприскують розведеною у воді досліджуваною сполукою. Листя заражають шляхом їх обприскування суспензією спор грибка через 1 день після обробки. Заражене листя витримують у камері для кліматичних випробувань за температури 19 °C та відносної вологості 80 % за світлового режиму 12 год. освітлення/12 год. темряви; дію сполуки оцінюють як відсоток ефективності боротьби з хворобою у порівнянні з необробленим листям у період, коли

50 на необробленому контрольному листі проявляється відповідний рівень ураження хворобою (через 6-8 днів після обробки).

У цьому випробуванні ефективність сполук I.g.001, I.g.011, I.g.013, I.g.016, I.g.018, I.g.021, I.g.023, I.g.024, I.g.246, I.g.386, I.g.501, I.g.503, I.g.506, I.g.508, I.g.509, I.g.510, I.n.011 та I.n.021 у боротьбі з інфекцією при концентрації 200 ppm складає не менше 80 % у порівнянні з необробленим контрольним листям, що знаходиться в аналогічних умовах, на якому

55 спостерігається значне розповсюдження хвороби.

Plasmopara viticola (мілдью)/виноград/профілактична обробка (несправжня борошниста роса винограду)

5-тижневі саджанці винограду сорту Gutedel обприскують у зрошувальній камері розведеною у воді досліджуваною сполукою. Досліджувані рослини заражають шляхом обприскування нижньої поверхні листя суспензією спорангію через один день після обробки сполукою.

60

Заражені досліджувані рослини витримують у теплиці за температури 22 °С і відносної вологості 100 %; відсоток охопленої хворобою площі листя оцінюють у період, коли на необроблених контрольних рослинах проявляється відповідний рівень ураження хворобою (через 6-8 днів після обробки).

5 У цьому випробуванні ефективність сполук I.g.001, I.g.006, I.g.011, I.g.016, I.g.023, I.g.024, I.g.501, I.g.502 та I.g.503 у боротьбі з інфекцією при концентрації 200 ppm складає не менше 80 % у порівнянні з необробленим контрольним листям, що знаходиться в аналогічних умовах, на якому спостерігається значне розповсюдження хвороби.

10 *Plasmopara viticola* (мілдью)/виноград/тривала обробка (несправжня борошниста роса винограду)

5-тижневі саджанці винограду сорту Gutedel обприскують у зрошувальній камері розведеною у воді досліджуваною сполукою. Досліджувані рослини заражають шляхом обприскування нижньої поверхні листя суспензією спорангію через 6 днів після обробки сполукою. Заражені досліджувані рослини витримують у теплиці за температури 22 °С і відносної вологості 100 %; відсоток охопленої хворобою площі листя оцінюють у період, коли на необроблених контрольних рослинах проявляється відповідний рівень ураження хворобою (через 11-13 днів після обробки).

20 У цьому випробуванні ефективність сполук I.g.001, I.g.006, I.g.011, I.g.023, I.g.024, I.g.501 та I.g.502 у боротьбі з інфекцією при концентрації 200 ppm складає не менше 80 % у порівнянні з необробленим контрольним листям, що знаходиться в аналогічних умовах, на якому спостерігається значне розповсюдження хвороби.

Plasmopara viticola (мілдью)/виноград/лікувальна обробка (несправжня борошниста роса винограду)

25 5-тижневі саджанці винограду сорту Gutedel заражають шляхом обприскування нижньої поверхні листя суспензією спорангію за один день до обробки сполукою. Заражені рослини винограду обприскують у зрошувальній камері розведеною у воді досліджуваною сполукою. Заражені досліджувані рослини витримують у теплиці за температури 22 °С і відносної вологості 100 %; відсоток охопленої хворобою площі листя оцінюють у період, коли на необроблених контрольних рослинах проявляється відповідний рівень ураження хворобою (через 4-6 днів після обробки).

У цьому випробуванні ефективність сполук I.g.001, I.g.006, I.g.011 та I.g.023 у боротьбі з інфекцією при концентрації 200 ppm складає не менше 80 % у порівнянні з необробленим контрольним листям, що знаходиться в аналогічних умовах, на якому спостерігається значне розповсюдження хвороби.

35 *Pythium ultimum* / культура в рідкому поживному середовищі (чорна ніжка паростків)

Фрагменти міцелію та ооспор щойно вирощеної в рідкому поживному середовищі культури грибка вмішують безпосередньо в поживний бульйон (PDB (КДБ) - картопляно-декстрозний бульйон). Після розміщення розчину (DMSO) досліджуваної сполуки в титраційний мікропланшет (на 96 лунок) додають поживний бульйон, що містить суміш міцелію і спор грибка. 40 Плашки для випробувань витримують за температури 24 °С, і через 2-3 дні після обробки сполукою фотометрично визначають пригнічення росту.

45 У цьому випробуванні ефективність сполук I.g.006, I.g.501, I.g.502, I.g.503 та I.g.511 у боротьбі з інфекцією при концентрації 200 ppm складає не менше 80 % у порівнянні з необробленим контрольним листям, що знаходиться в аналогічних умовах, на якому спостерігається значне розповсюдження хвороби.

Pythium ultimum/бавовник/просочування ґрунту (чорна ніжка паростків)

Випробування проводять у пластмасових контейнерах (місткістю 650 мл) із застосуванням суміші з 50 % вермікулиту + 50 % стерильного ґрунту Cigu в 10 об.% води. 10 насінин (бавовник сорту Sure Grow 747) висівають у 2 ряди по 5 насінин у контейнер (3 аналогічні моделі 50 для оцінки активності, 3 аналогічні моделі для оцінки фітотоксичності). Обробка здійснюється безпосередньо після висівання: насіння в кожному ряді поливають розведеною у воді сполукою в кількості 10 мл на один рядок. Одразу після цього насінини покривають тонким шаром того ж ґрунту, і стається зараження. *Pythium ultimum* культивують протягом 14 днів на шматочках моркви в колбах Ру. Для зараження вміст колб Ру змішують і однорідно розподіляють 55 над пластмасовими контейнерами без подальшої фільтрації (70 мл суспензії на контейнер). Умови зараження: 20 °С, режим освітлення 12 год. світла/12 год. темряви в теплиці. Дію сполуки оцінюють як відсоток ефективності боротьби з хворобою в порівнянні з необробленими контрольними рослинами у період, коли на необроблених контрольних рослинах проявляється відповідний рівень ураження хворобою (через 13-16 днів після обробки).

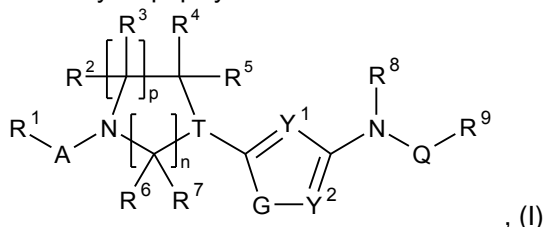
60 У цьому випробуванні ефективність сполук I.g.006, I.g.501, I.g.502 та I.g.511

у боротьбі з інфекцією при концентрації 200 ppm складає не менше 80 % у порівнянні з необробленим контрольним листям, що знаходиться в аналогічних умовах, на якому спостерігається значне розповсюдження хвороби.

5

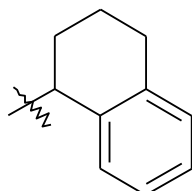
ФОРМУЛА ВИНАХОДУ

1. Сполука формули I:



де

- 10 А означає $x-C(=O)-$, $x-C(=S)-$, $x-C(R^{10}R^{11})-C(=O)-$, $x-C(R^{12}R^{13})-C(=S)-$, $x-O-C(=O)-$, $x-O-C(=S)-$, $x-N(R^{14})-C(=O)-$, $x-N(R^{15})-C(=S)-$, $x-C(R^{16}R^{17})-SO_2-$ або $x-N=C(R^{26})-$, причому x у кожному випадку означає зв'язок, приєднаний до R^1 ;
 Т означає CR^{18} або N ;
 G означає O або S ;
 15 Y^1 та Y^2 незалежно означають CR^{19} або N ;
 Q означає $-C(=O)-z$, $-C(=S)-z$, $-C(=O)-O-z$, $-C(=S)-O-z$, $-C(=O)-N(R^{20})-z$, $-C(=S)-N(R^{21})-z$ або $-SO_2-z$, причому z у кожному випадку означає зв'язок, приєднаний до R^9 ;
 n дорівнює 1 або 2;
 p дорівнює 1 або 2, за умови, що, якщо n дорівнює 2, p дорівнює 1;
 20 R^1 означає феніл, піридил, імідазоліл або піразоліл, де кожен феніл, піридил, імідазоліл і піразоліл, як варіант, заміщений 1-3 замісниками, незалежно вибраними з (C_1-C_4) алкілу, (C_1-C_4) галоалкілу, галогену, ціано, гідроксі й аміно;
 кожен із R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{16} , R^{17} , R^{18} , R^{19} та R^{26} незалежно означає водень, галоген, ціано, (C_1-C_4) алкіл або (C_1-C_4) галоалкіл;
 25 кожен із R^8 , R^{14} , R^{15} , R^{20} та R^{21} незалежно означає водень, (C_1-C_4) алкіл або (C_1-C_4) алкоксі; а R^9 означає феніл, бензил або групу (a):



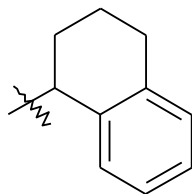
, (a)

- де кожен феніл, бензил і кожна група (a), як варіант, заміщені(-а) 1-3 замісниками, незалежно вибраними з (C_1-C_4) алкілу, (C_1-C_4) галоалкілу, (C_1-C_4) алкоксі, (C_1-C_4) галоалкоксі, галогену, ціано, гідроксилу, $N(R^{27})_2$, SH , (C_1-C_4) алкілтіо, нітро, фенілсульфонілу та фенілсульфінілу, де фенілсульфоніл і фенілсульфініл, як варіант, заміщені 1-3 замісниками, незалежно вибраними з (C_1-C_4) алкілу, (C_1-C_4) галоалкілу, (C_1-C_4) алкоксі, (C_1-C_4) галоалкоксі, галогену та ціано; кожен R^{27} незалежно означає водень, (C_1-C_4) алкіл, фенілсульфоніл або фенілсульфініл, де фенілсульфоніл і фенілсульфініл, як варіант, заміщені 1-3 замісниками, незалежно вибраними з (C_1-C_4) алкілу, (C_1-C_4) галоалкілу, (C_1-C_4) алкоксі, (C_1-C_4) галоалкоксі, галогену та ціано; або сіль або N-оксид цих сполук.

2. Сполука згідно з п. 1, де

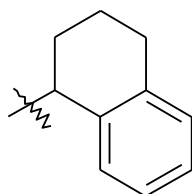
- А означає $x-C(=O)-$, $x-C(=S)-$, $x-C(R^{10}R^{11})-C(=O)-$, $x-C(R^{12}R^{13})-C(=S)-$, $x-O-C(=O)-$, $x-O-C(=S)-$, $x-N(R^{14})-C(=O)-$, $x-N(R^{15})-C(=S)-$ або $x-C(R^{16}R^{17})-SO_2-$, причому x у кожному випадку означає зв'язок, приєднаний до R^1 ;
 Т означає CR^{18} або N ;
 G означає O або S ;
 40 Y^1 та Y^2 незалежно означають CR^{19} або N ;
 Q означає $-C(=O)-z$, $-C(=S)-z$, $-C(=O)-O-z$, $-C(=S)-O-z$, $-C(=O)-N(R^{20})-z$, $-C(=S)-N(R^{21})-z$ або $-SO_2-z$, причому z у кожному випадку означає зв'язок, приєднаний до R^9 ;
 n дорівнює 1 або 2;
 p дорівнює 1 або 2, за умови, що, якщо n дорівнює 2, p дорівнює 1;

- R^1 означає феніл, піридил, імідазоліл або піразоліл, де кожен феніл, піридил, імідазоліл та піразоліл, як варіант, заміщені 1-3 замісниками, незалежно вибраними з (C_1-C_4) алкілу, (C_1-C_4) галоалкілу, галогену, ціано, гідроксі й аміно;
кожен із $R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{16}, R^{17}, R^{18}$ та R^{19} незалежно означає водень, галоген, ціано, (C_1-C_4) алкіл або (C_1-C_4) галоалкіл;
кожен із $R^8, R^{14}, R^{15}, R^{20}$ та R^{21} незалежно означає водень або (C_1-C_4) алкіл; а
 R^9 означає феніл, бензил або групу (а):



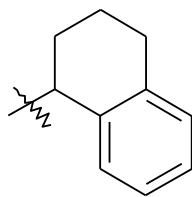
, (a)

- де кожен феніл, бензил і кожна група (а), як варіант, заміщені(-а) 1-3 замісниками, незалежно вибраними з (C_1-C_4) алкілу, (C_1-C_4) галоалкілу, галогену, ціано, гідроксі й аміно.
3. Сполука згідно з п. 1, де
А означає $x-C(=O)-$, $x-C(=S)-$, $x-C(R^{10}R^{11})-C(=O)-$, $x-C(R^{12}R^{13})-C(=S)-$, $x-O-C(=O)-$, $x-O-C(=S)-$ або $x-C(R^{16}R^{17})-SO_2-$, причому x у кожному випадку означає зв'язок, приєднаний до R^1 ;
Т означає CR^{18} або N;
G означає O або S;
 Y^1 означає N;
 Y^2 означає CR^{19} або N;
Q означає $-C(=O)-z$, $-C(=S)-z$, $-C(=O)-O-z$, $-C(=S)-O-z$, $-C(=O)-N(R^{20})-z$, $-C(=S)-N(R^{21})-z$ або $-SO_2-z$, причому z у кожному випадку означає зв'язок, приєднаний до R^9 ;
п дорівнює 1 або 2;
р дорівнює 1;
 R^1 означає феніл або піразоліл, де кожен феніл та піразоліл, як варіант, заміщені 1-3 замісниками, незалежно вибраними з (C_1-C_4) алкілу, (C_1-C_4) галоалкілу, галогену, ціано, гідроксі й аміно;
кожен із $R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^{10}, R^{11}, R^{12}, R^{13}, R^{16}, R^{17}, R^{18}$ та R^{19} незалежно означає водень, галоген, (C_1-C_4) алкіл або (C_1-C_4) галоалкіл;
кожен із R^8, R^{20} та R^{21} незалежно означає водень або (C_1-C_4) алкіл; а
 R^9 означає феніл, бензил або групу (а):



, (a)

- де кожен феніл, бензил і кожна група (а), як варіант, заміщені(-а) 1-3 замісниками, незалежно вибраними з (C_1-C_4) алкілу, (C_1-C_4) галоалкілу, галогену, ціано, гідроксі й аміно.
4. Сполука згідно з п. 1, де
А означає $x-C(=O)-$, $-x-CR^{10}R^{11}-C(=O)-$, $x-O-C(=O)-$ або $x-C(R^{16}R^{17})-SO_2-$, причому x у кожному випадку означає зв'язок, приєднаний до R^1 ;
Т означає CR^{18} або N;
G означає S;
 Y^1 означає N;
 Y^2 означає CR^{19} або N;
Q означає $-C(=O)-z$, $-C(=O)-O-z$, $-C(=O)-N(R^{20})-z$ або $-SO_2-z$, причому z у кожному випадку являє собою зв'язок із R^9 ;
п дорівнює 1 або 2;
р дорівнює 1;
 R^1 означає феніл або піразоліл, де кожен феніл та піразоліл, як варіант, заміщені 1-3 замісниками, незалежно вибраними з (C_1-C_4) алкілу, (C_1-C_4) галоалкілу та галогену;
кожен із $R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^{10}, R^{11}, R^{16}, R^{17}, R^{18}$ та R^{19} незалежно означає водень, фтор або метил;
кожен із R^8 та R^{20} незалежно означає водень або метил; а
 R^9 означає феніл, бензил або групу (а):



, (a)

де кожен феніл, бензил і кожна група (a), як варіант, заміщені(-а) 1-3 замісниками, незалежно вибраними з (C₁-C₄)алкілу, (C₁-C₄)галоалкілу, гідроксі та галогену.

5. Сполука згідно з п. 1, де

5 А означає x-C(=O)-, x-CH₂-C(=O)-, x-O-C(=O)- або x-CH₂-SO₂-, причому x у кожному випадку означає зв'язок, приєднаний до R¹;

Т означає CH або N;

G означає S;

Y¹ означає N;

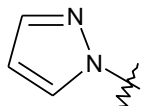
10 Y² означає CH або N;

Q означає -C(=O)-z, -C(=O)-O-z, -C(=O)-NH-z або -SO₂-z-, причому z у кожному випадку означає зв'язок, приєднаний до R⁹;

n дорівнює 1 або 2;

p дорівнює 1;

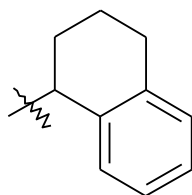
15 R¹ означає феніл або групу (b):



, (b)

де феніл і група (b), як варіант, заміщені 1-3 замісниками, незалежно вибраними з галогену, (C₁-C₄)алкілу та (C₁-C₄)галоалкілу; кожен із R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ та R⁷ означає водень; R⁸ означає водень; а

20 R⁹ означає феніл, бензил або групу (a):



, (a)

де кожен феніл, бензил і кожна група (a), як варіант, заміщені(-а) 1-3 замісниками, незалежно вибраними з (C₁-C₄)алкілу, (C₁-C₄)галоалкілу, гідроксі та галогену.

6. Сполука згідно з п. 1, де

25 А означає x-CH₂-C(=O)-, де x означає зв'язок, приєднаний до R¹;

Т означає CH;

G означає S;

Y¹ означає N;

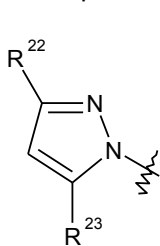
Y² означає CH;

30 Q означає -C(=O)-z, -C(=O)-O-z або C(=O)-N(R²⁰)-z, причому z у кожному випадку означає зв'язок, приєднаний до R⁹;

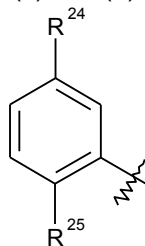
n дорівнює 2;

p дорівнює 1;

R¹ вибраний із груп (c) або (d):



, (c)



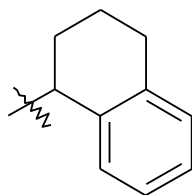
, (d)

35

де R²², R²³, R²⁴ та R²⁵ незалежно вибрані з водню, галогену, метилу та галометилу; кожен із R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ та R⁷ означає водень;

R^8 означає водень;

R^9 означає феніл, бензил або групу (а):



, (a)

де феніл, бензил і група (а), як варіант, заміщені 1-3 замісниками, незалежно вибраними з галогену, гідроксі, метилу та галометилу.

7. Сполука згідно з будь-яким з пп. 1-6, де G означає S, Y^1 означає N, а Y^2 означає CH.

8. Сполука згідно з будь-яким з пп. 1-7, де p дорівнює 1, а n дорівнює 2.

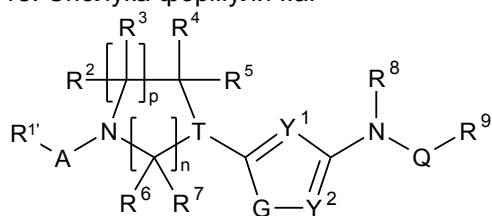
9. Сполука згідно з будь-яким з пп. 1-8, де R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 та R^7 означають H.

10. Сполука згідно з будь-яким з пп. 1-9, де Q означає $-C(=O)-z$, де z означає зв'язок, приєднаний до R^9 .

11. Сполука згідно з будь-яким з пп. 1-10, де R^9 означає феніл, заміщений гідроксі і, як варіант, одним чи двома додатковими замісниками.

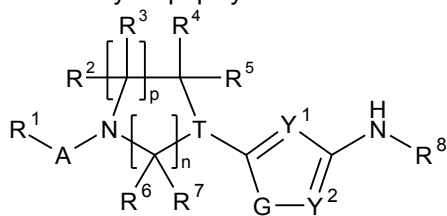
12. Сполука згідно з п. 11, де гідроксі знаходиться в орто-положенні.

13. Сполука формули I.a:



, (I.a)

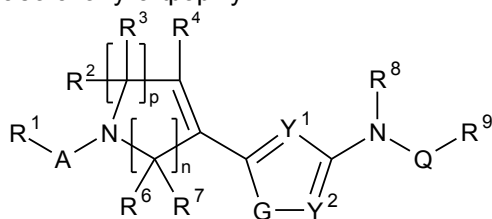
в якій $R^{1'}$ означає (C_1-C_8) алкіл, а визначення A, T, G, Y^1 , Y^2 , Q, n, p, R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 та R^9 відповідають визначенням для формули I у будь-якому пункті 1-12; або сполука формули II:



, (II)

де R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , A, T, G, Y^1 , Y^2 , n та p відповідають визначенням для формули I у будь-якому пункті 1-12;

або сполука формули VIII:



, (VIII),

де R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^6 , R^7 , R^8 , A, T, G, Y^1 , Y^2 , p та n відповідають визначенням для формули I у будь-якому пункті 1-12.

14. Фунгіцидна композиція, яка містить принаймні одну сполуку з визначених у будь-якому пункті 1-12 та застосовуваний в агрохімії носій, а також, як варіант, присадку та, як варіант, принаймні одну додаткову фунгіцидно активну сполуку.

15. Метод пригнічення або профілактики зараження рослин, їх посадкового матеріалу, зібраного врожаю чи неживих матеріалів фітопатогенними мікроорганізмами чи мікроорганізмами, що викликають псування, чи організмами, які є потенційно небезпечними для людини, який полягає в нанесенні сполуки, визначеної в будь-якому пункті 1-12, на рослини, частини рослин або місця їх масового знаходження, на їх посадковий матеріал або на будь-яку частину неживого матеріалу; де фітопатогенними мікроорганізмами переважно є грибові організми.

Комп'ютерна верстка А. Крулевський

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

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