(19) **RU** (11) **2 126 392** (13) **C1**

(51) МПК[6] **C 07 D 249/12, 261/12, A 01 N 43/80, 43/653, 43/54**

РОССИЙСКОЕ АГЕНТСТВО
ПО ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

(21), (22) Заявка: 96113104/04, 30.08.1994

(30) Приоритет: 19.11.1993 US 08/155963
19.11.1993 US 08/155970

(46) Дата публикации: 20.02.1999

(56) Ссылки: SU 568367 A, 1977. SU 1276244 A3, 1986. SU 791199 A, 1980. SU 621301 A, 1978. US 4098896 A, 1978. EP 0508126 A1, 1992. WO 9216510 A1, 1992. WO 9307116 A1, 15.04.93.

(85) Дата перевода заявки PCT на национальную фазу: 19.06.96

(86) Заявка PCT:
US 94/09525 (30.08.94)

(87) Публикация PCT:
WO 95/14009 (26.05.95)

(98) Адрес для переписки:
103735 Москва, ул.Ильинка 5/2 Союзпатент

(71) Заявитель:
Е.И.Дю Пон Де Немурс энд Компани (US)

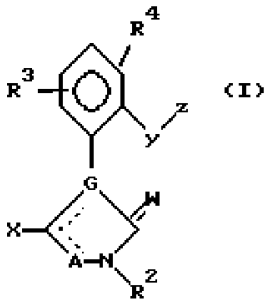
(72) Изобретатель: Браун Ричард Джеймс (US), Сан Кинг-Мо (US), Фрейзьер Дебора Анн (US)

(73) Патентообладатель:
Е.И.Дю Пон Де Немурс энд Компани (US)

(54) ЦИКЛИЧЕСКИЕ АМИДЫ ИЛИ ИХ СЕЛЬСКОХОЗЯЙСТВЕННО ПРИГОДНЫЕ СОЛИ, ФУНГИЦИДНАЯ КОМПОЗИЦИЯ, СПОСОБ БОРЬБЫ С БОЛЕЗНЯМИ РАСТЕНИЙ, ВЫЗВАННЫМИ ФИТОПАТОГЕННЫМИ ГРИБАМИ

(57) Реферат:

Изобретение относится к циклическим амидам, замещенным в α-положении различными арильными группами, их сельскохозяйственно пригодным солям и составам на их основе, и их использованию в качестве фунгицидов системного или избирательного действия. Указанные соединения представлены общей формулой I (значение радикалов см. в формуле изобретения). 3 с. и 8 з.п.ф-лы, 33 табл.



RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

(19) **RU** (11) **2 126 392** (13) **C1**

(51) Int. Cl.[6] **C 07 D 249/12, 261/12, A 01 N 43/80, 43/653, 43/54**

RUSSIAN AGENCY
FOR PATENTS AND TRADEMARKS

(12) ABSTRACT OF INVENTION

(21), (22) Application: 96113104/04, 30.08.1994

(30) Priority: 19.11.1993 US 08/155963
19.11.1993 US 08/155970

(46) Date of publication: 20.02.1999

(85) Commencement of national phase: 19.06.96

(86) PCT application:
US 94/09525 (30.08.94)

(87) PCT publication:
WO 95/14009 (26.05.95)

(98) Mail address:
103735 Moskva, ul.Il'inka 5/2 Sojuzpatent

(71) Applicant:
E.I.Dju Pon De Nemurs ehnd Kompani (US)

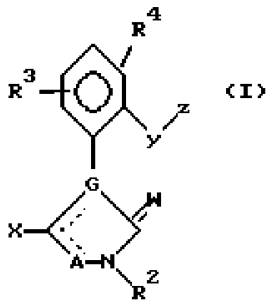
(72) Inventor: Braun Richard Dzhejms (US),
San King-Mo (US), Frejz'er Debora Ann (US)

(73) Proprietor:
E.I.Dju Pon De Nemurs ehnd Kompani (US)

(54) CYCLIC AMIDES OR AGRICULTURALLY ACCEPTABLE SALTS THEREOF, FUNGICIDAL COMPOSITION, METHOD OF CONTROLLING PLANT DISEASES INDUCED BY PHYTOPATHOGENIC FUNGI

(57) Abstract:

FIELD: agriculture, more particularly fungicides. SUBSTANCE: present invention describes cyclic amides, agriculturally acceptable salts and compositions based thereon. Said compounds are represented by general formula I:



(I)

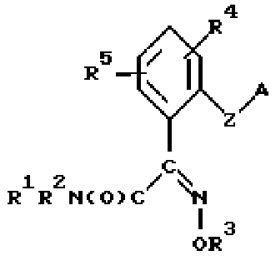
(radicals are as defined in the claims). EFFECT: improved properties of the fungicidal composition. 12 cl, 4 ex, 31 tbl

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

Настоящее изобретение относится к циклическим амидам, замещенным в α-положении различными арильными группами, их сельскохозяйственно пригодным солям и составам на их основе, и их использованию в качестве фунгицидов системного или избирательного действия.

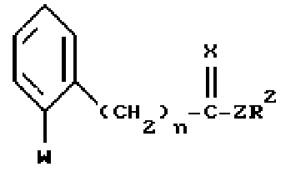
В заявке EP-A-398692 раскрываются амиды формулы I, пригодные для использования в качестве фунгицидов для защиты культурных растений от болезней. Указанные соединения представлены следующей общей формулой



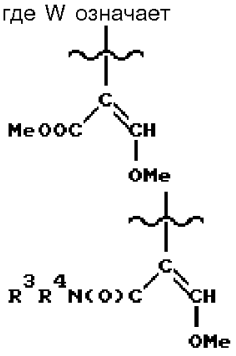
где R^1 и R^2 каждый независимо означает водород, низший алкил или низший циклоалкил.

Все соединения, раскрываемые в EP-A-398692, содержат арильный остаток, связанный с ациклической алкоксииминоацетамидной группой. Нигде в указанной заявке не упоминается о получении циклических амидов предлагаемого изобретения.

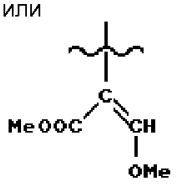
В заявке PCT WO 93/07116 описываются соединения формулы II, которые можно использовать в качестве защитных фунгицидов культурных растений. Указанные соединения представлены следующей общей формулой II



где W означает

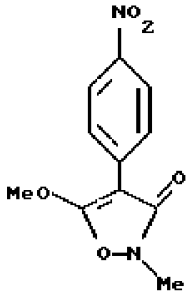


или

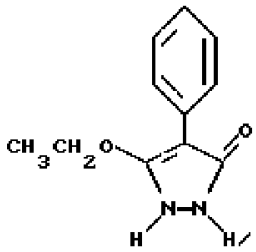


Указанная заявка также не предлагает циклических амидов настоящего изобретения.

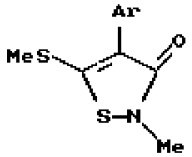
Известно получение производных 4-нитрофенилизоксазолона



J.Heterocyclic Chem., (1987), 24, с.465, фенилпиразолонов



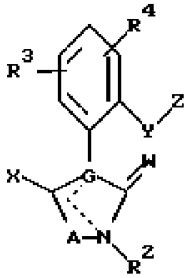
J.Heterocyclic Chem., (1988), 25, стр.1307, и арил-изотиазолинонов



Astraliah J.Chem., (1977), 30(8), с.1815.

Однако не известно использование указанных соединений в качестве фунгицидов и получение орто-замещенных производных предлагаемого изобретения.

Данное изобретение предлагает соединения формулы I, включая все геометрические и пространственные изомеры, сельскохозяйственно пригодные их соли, агрономические составы на их основе и их использование в качестве фунгицидов:



где A означает O; S; N; NR^5, или CR^{14};

G означает C или N; при условии, что если G означает C, то A имеет значения O, S, NR^5, и свободная двойная связь имеется у радикала G; а если G означает N, то A принимает значения N или CR^{14}, и свободная двойная связь имеется у радикала A;

W означает O или S;

X означает OR^1; $S(O)_mR^1$; или галоген;

R^1, R^2 и R^5 каждый независимо означает H; C_1 - C_6-алкил; C_1 - C_6-галогеналкил; C_2 - C_6-алкенил; C_2 - C_6-галогеналкенил; C_2 - C_6-алкинил; C_2 - C_6-галогеналкинил; C_3 - C_6-циклоалкил; C_2 - C_4-алкилкарбонил, C_2 - C_4-алкоксикарбонил; или бензоил, возможно замещенный радикалом R^{13};

R^3 и R^4 каждый независимо означает H;

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

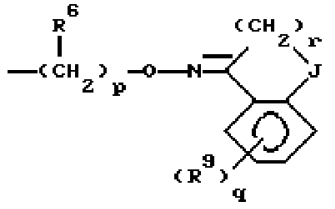
галоген-; циано-; нитро-; C_1 - C_6-алкил; C_1 - C_6-галогеналкил; C_2 - C_6-алкенил; C_2 - C_6-галогеналкенил; C_2 - C_6-алкинил; C_2 - C_6-галогеналкинил; C_1 - C_6-алкоксил; C_1 - C_6-галогеналкоксил; C_2 - C_6-алкенилокси-; или C_2 - C_6-алкинилокси-;

Y означает -O-; $-S(O)_n-$; $-CHR^6CHR^6-$; $-CR^6=CR^6-$; $-C\equiv C-$; $-CHR^6O-$; $-OCHR^6-$; $-CHR^6S(O)_n-$; $-S(O)_nCHR^6-$; $-CHR^6O-N=C(R^7)-$; $-(R^7)C=N-OCH(R^6)-$; $-C(R^7)=N-O-$; $-O-N-C(R^7)$; $-CHR^6OC(=O)N(R^{15})-$; или непосредственную связь; причем направленность указанной связи Y такова, что остаток ее, изображенный слева, связан с фенильным ядром, а остаток ее, изображенный справа, связан с радикалом Z;

R^6 независимо означает H или C_1 - C_3-алкил;

R^7 означает H; C_1 - C_6-алкил; C_1 - C_6-галогеналкил; C_1 - C_6-алкокси-; C_1 - C_6-галогеналкокси-; C_2 - C_6-алкенил; C_2 - C_6-галогеналкенил; C_2 - C_6-алкинил; C_2 - C_6-галогеналкинил; C_3 - C_6-циклоалкил; C_2 - C_4-алкилкарбонил; C_2 - C_4-алкоксикарбонил; циано- или морфолинил;

Z означает C_1-C_{10}-алкил, C_2 - C_{10}-алкенил, или C_2 - C_{10}-алкинил, каждый из которых может быть замещен R^8, или Z означает C_3 - C_8-циклоалкил или фенил, каждый из которых может быть замещен одним из радикалов, R^9, R^{10} или как радикалом R^9, так R^{10}, или Z означает 3 - 14-членную неароматическую гетероциклическую ядерную систему, выбранную из группы, состоящей из моноциклического ядра, конденсированного бициклического ядра и конденсированного трициклического ядра, или Z означает 5 - 14-членную ароматическую гетероциклическую ядерную систему, выбранную из группы, состоящей из моноциклического ядра, конденсированного бициклического ядра и конденсированного трициклического ядра, при этом каждую неароматическую или ароматическую циклическую систему, содержащую от 1 до 6-гетероатомов, независимо выбирают из группы, состоящей из 1 - 4 атомов азота, 1 - 2 атомов кислорода и 1 - 2 атомов серы, причем каждая неароматическая или ароматическая циклическая система может быть замещена одним из радикалов R^9, R^{10}, или как радикалом R^9, так и R^{10}; или R^7 и Z, взятые вместе, образуют группу $-CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2CH_2CH_2-$, $-CH_2CH_2OCH_2CH_2-$, причем каждая группа CH_2 может быть замещена 1 - 2 атомами галогена; или Y и Z, взятые вместе, образуют



или R^3, Y и Z, выбирают вместе с фенильным кольцом с образованием нафталинового кольца, замещенного у любого атома ядра свободным радикалом R^4, при условии, что если R^3, Y и Z выбирают вместе с фенильным кольцом с образованием нафталинового кольца, замещенного радикалом R^4, а A - S, W - O, X - SCH_3 и R^2 - CH_3, то R^4 имеет любое значение, кроме H;

J означает $-CH_2-$; $-CH_2CH_2-$; $-OCH_2-$; $-CH_2O-$; $-SCH_2-$; $-CH_2S-$; $-N(R^{16})CH_2-$; или $-CH_2N(R^{16})-$, причем каждая CH_2-группа может быть замещена 1 - 2 CH_3-группами;

R^8 означает группу, выбранную из группы, состоящей из 1 - 6 атомов галогена; C_1 - C_6-алкокси-; C_1 - C_6-галогеналкоксила; C_1 - C_6-алкилтио-; C_1 - C_6-галогеналкилтио-; C_1 - C_6-алкилсульфинила; C_1 - C_6-алкилсульфонила; C_3 - C_6-циклоалкила; C_3 - C_6-алкенилокси-; $CO_2(C_1$ - C_6-алкила); $NH(C_1$ - C_6-алкила); $N(C_1$ - C_6-алкила); циано-; или нитро-, или R^8 означает фенил, фенокси, пиридинил, пиридинилокси, тиенил, фуранил, пиримидинил, или пиримидинилокси, каждый из которых может быть замещен одним из радикалов R^{11}, R^{12} или как радикалом R^{11}, так и R^{12};

R^9 означает группу, выбранную из 1 - 2 атомов галогена; C_1 - C_6-алкила; C_1 - C_6-галогеналкила; C_1 - C_6-алкокси-; C_1 - C_6-галогеналкокси-; C_2 - C_6-алкенила; C_2 - C_6-галогеналкенила; C_2 - C_6-алкинила; C_1 - C_6-алкилтио-; C_1 - C_6-галогеналкилтио-; C_1 - C_6-алкилсульфинила; C_1 - C_6-алкилсульфонила; C_3 - C_6-циклоалкила; C_3 - C_6-алкенилокси-; $CO_2(C_1$ - C_6-алкила); $NH(C_1$ - C_6-алкила); $N(C_1$ - C_6-алкила)$_2$; $-C(R^{18})=NOR^{17}$; циано- или нитро-; или R^9 означает фенил, бензил, бензоил, фенокси, пиридинил, пиридинилокси, тиенил, тиенилокси, фуранил, пиримидинил, или пиримидинилокси, каждый из которых может быть замещен одним из радикалов R^{11}, R^{12} или как радикалом R^{11}, так и R^{12};

R^{10} означает галоген-; C_1 - C_4- алкил; C_1 - C_4-галогеналкил; C_1 - C_4-алкокси-; нитро-; или циано-; или R^9 и R^{10}, связанные с соседними углерода атомами, образуют вместе $-OCH_2O-$ или $-OCH_2CH_2O-$; причем каждая CH_2-группа может быть замещена 1 - 2 атомами галогена;

R^{11} и R^{12} каждый независимо означает галоген; C_1 - C_4-алкил; C_1 - C_4-галогеналкил; C_1-C_4-алкоксил; C_1 - C_4-галогеналкокси-; нитро-; или циано-;

R^{13} означает галоген; C_1 - C_3-алкил; C_1 - C_3-галогеналкил; C_1 - C_3-алкокси-; C_1 - C_3-галогеналкокси-; нитро- или циано-;

R^{14} означает H; галоген; C_1 - C_6-алкил; C_1 - C_6-галогеналкил; C_2 - C_6-алкенил; C_2 - C_6-галогеналкенил; C_2 - C_6-алкинил; C_2 - C_6-галогеналкинил; или C_3 - C_6-циклоалкил;

R^{15}, R^{16}, R^{17} и R^{18} каждый независимо означает H, C_1 - C_3-алкил; или фенил, возможно замещенный атомами галогена, C_1 - C_4-алкил, C_1 - C_4-галогеналкил, C_1 - C_4-алкокси-, C_1 - C_4-галогеналкокси-, нитро-

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

или циано-;

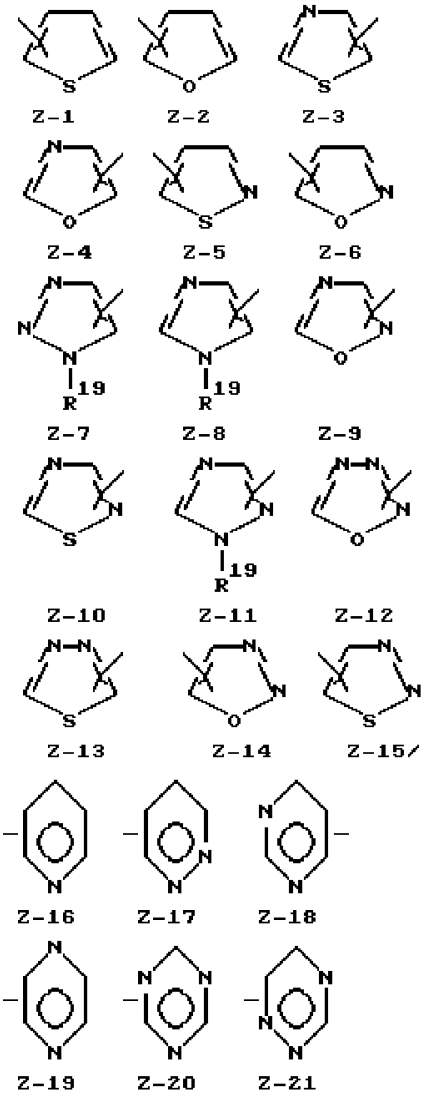
m, n и q каждый независимо означает 0, 1 или 2;

p и r каждый независимо означает 0 или 1.

В вышеуказанный толкованиях, термин "алкил", используемый в данном описании как индивидуально, так и в комбинации с другими терминами, например как "галогеналкил" означает алкил с неразветвленной или разветвленной углеродной цепью, например метил, этил, н-пропил, изопропил или различные изомеры бутила, пентила или гексила. "Алкенил" означает алкены с неразветвленной или разветвленной углеродной цепью, например 1-пропенил, 2-пропенил, или различные изомеры бутенила, пентенила и гексенила. "Алкенил" означает также полиены, например как 1,3-гексадиен. "Алкинил" означает алкины с неразветвленной или разветвленной углеродной цепью; например этинил, 1-пропинил, 3-пропинил и различные изомеры бутинила, пентинила и гексинила. "Алкинил" может также обозначать остатки, содержащие кратные тройные связи, например как 2,4-гексадиин. "Алкокси" означает, например, метокси, этокси, н-пропилокси, изопропилокси и различные изомерные формы бутокси, пентокси и гексилокси. "Алкенилокси" обозначает алкенилоксигруппы. В качестве примера алкенилоксигруппы можно указать $H_2C=CHCH_2O$, $(CH_3)_2C=CHCH_2O$, $(CH_3)CH=CHCH_2O$, $(CH_3)CH=C(CH_3)CH_2O$ и $CH_2=CHCH_2CH_2O$. "Алкинилокси" означает углеводородные остатки с неразветвленной или разветвленной цепью. В качестве примера алкинилоксигруппы можно указать $HC\equiv CCH_2O$, $CH_3C\equiv CCH_2O$ и $CH_3C\equiv CCH_2CH_2O$. Термин "галоген", как индивидуально, так и в комбинации с другими терминами, например как галогеналкил, означает фтор, хлор, бром или йод. Кроме того, если указанный термин используют в виде сложного слова, например как "галогеналкил", то указанный алкил может быть частично или полностью замещен атомами галогена, которые могут иметь одинаковые или разные значения. В качестве примера "галогеналкила" можно привести F_3C, $ClCH_2$, CF_3CH_2 и CF_3CCl_2. Термин "циклоалкил" означает остатки циклопропила, циклобутила, циклопентила и циклогексила. Термин "неароматическая гетероциклическая кольцевая система" означает полностью насыщенные гетероциклы или частично ароматические гетероциклы. Общее число атомов углерода в замещающей группе указывается по C_i - C_j, где i и j имеют значения от 1 до 10. Например, C_1 - C_3-алкил имеет значение от метила до пропила; C_2-алкокси обозначает CH_3CH_2O; и C_3-алкокси означает, например, $CH_3CH_2CH_2O$ или $(CH_3)_2CHO$. В вышеуказанных толкованиях, в случае, когда соединение формулы I включает в свой состав одно или несколько ароматических азот-содержащих ядер (например, пиридинил и пиримидинил), все связи с указанными гетероциклами выполнены через углеродный атом(ы) углеводородных остатков.

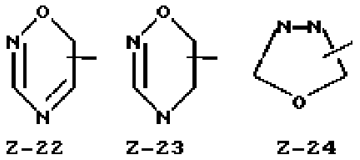
Ниже приведены предпочтительные варианты предлагаемых соединений, композиций на их основе, а также способы использования для повышения реакционной способности и/или упрощения синтеза указанных соединений.

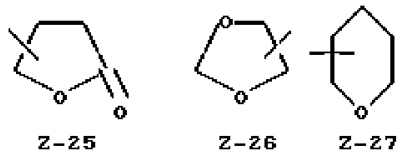
Предпочтительный вариант осуществления изобретения 1. Соединения вышеуказанной формулы I, где W означает O; R^1 означает C_1 - C_3-алкил или C_1 - C_3-галогеналкил; R^2 означает H; C_1 - C_6-алкил; C_1 - C_6-галогеналкил; или C_3 - C_6-циклоалкил; R^3 и R^4 - каждый независимо означает H; галоген; циано-; нитро-; C_1 - C_6-алкил; C_1 - C_6-галогеналкил; C_1 - C_6-алкокси или C_1 - C_6-галогеналкокси; Y означает -O-; CH=CH-; $-CH_2O-$; $-OCH_2-$; $-CH_2S(O)_n$; $-CH_2O-N=C(R^7)-$; $-C(R^7)=N-O-$; $-CH_2OC(O)NH-$ или простую связь; R^7 означает H; C_1 - C_6-алкил; C_1 - C_6-галогеналкил; C_2 - C_6-алкенил; C_2 - C_6-алкинил; или циано-; Z означает C_1 - C_{10}-алкил, возможно замещенный радикалом R^8; или C_3 - C_8-циклоалкил или фенил, каждый из которых может быть замещен одним из радикалов R^9, R^{10}, или как радикалом R^9, так R^{10}; или Z означает

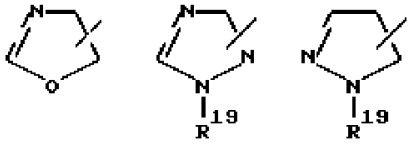


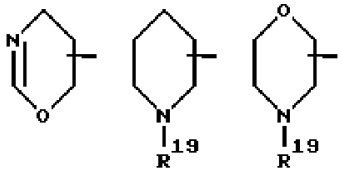
RU 2126392 C1

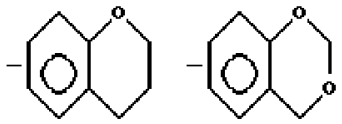
RU 2126392 C1

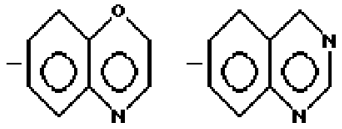

Z-22 Z-23 Z-24

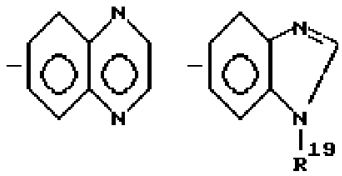

Z-25 Z-26 Z-27

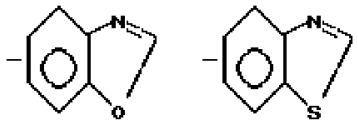

Z-28 Z-29 Z-30

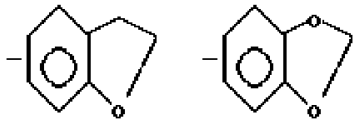

Z-31 Z-32 Z-33

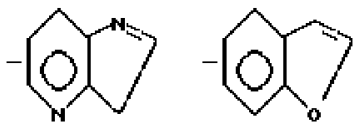

Z-35 Z-34


Z-36 Z-37

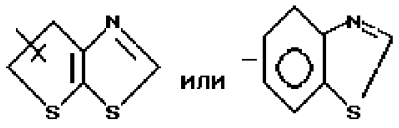

Z-38 Z-39


Z-40 Z-41

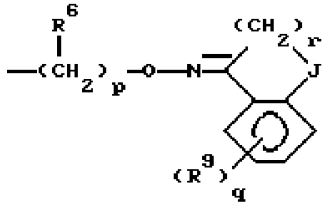

Z-42 Z-43


Z-44 Z-45


Z-46 Z-47


Z-48 или Z-49

причем каждая группа может быть замещена одним из радикалов R^9, R^{10}, или как радикалом R^9, так и R^{10}, или R^3, Y и Z, взятые вместе с фенильным кольцом, образуют нафталиновое кольцо, замещенное у любого атома ядра свободной группой R^4, или Y и Z, взятые вместе, образуют

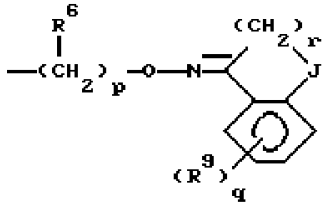


или R^8 означает группу, выбранную из 1 - 6 атомов галогена; C_1 - C_6-алкокси-; C_1 - C_6-галогеналкокси-; или R^8 означает фенил, фенокси, пиридинил, пиридинилокси, пиримидинил, или пиримидинилокси-, каждый из которых может быть замещен одним из радикалов R^{11}, R^{12} или, как радикалом R^{11}, так и R^{12};

R^9 означает группу, выбранную из 1 - 2 атомов галогена; C_1 - C_6-алкила; C_1 - C_6-галогеналкила; C_1 - C_6-алкокси-; C_1 - C_6-галогеналкокси-; C_1 - C_6-алкилтио-; циано-; $CO_2(C_1$ - C_6-алкила); $NH(C_1$ - C_6-алкила) или $N(C_1$ - C_6-алкила)$_2$; или R^9 означает C_3 - C_6-циклоалкил; фенил, фенокси-, пиридинил, пиридирилокси-, пиримидинил, или пиримидинилокси-, каждый из которых может быть замещен одним из радикалов R^{11}, R^{12} или как радикалом R^{11}, так и R^{12};

R^{19} означает H; C_1 - C_6-алкил; C_1 - C_6-галогеналкил; или фенил, возможно замещенный атомами галогена, C_1 - C_4-алкила, C_1 - C_4-галогеналкила, C_1 - C_4-алкокси-, C_1 - C_4-галогеналкоксила, нитро- или циано-.

Предпочтительный вариант 2. Соединения, полученные из предпочтительного варианта 1, где Z означает фенил или от Z-1 до Z-21, каждый из которых может быть замещен одним из радикалов R^9, R^{10}, или как радикалом R^9, так R^{10}; или Y и Z, взятые вместе, образуют



или J означает $-CH_2-$; $-CH_2CH_2-$; p = 0 и r = 1.

Предпочтительный вариант 3. Соединения, полученные из предпочтительного варианта 2, где A означает O; N; NR^5, или CR^{14}; X означает OR^1; R^1 означает C_1 - C_3-алкил; R^2 означает H или C_1 - C_2-алкил; R^3 и R^4 каждый

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

независимо означает H; Y означает -O-; CH=CH-; $-CH_2O-$; $-OCH_2-$; $-CH_2O-N=C(R^7)-$; или $-CH_2OC(=O)NH-$; R^7 означает H; C_1 - C_3-алкил; C_1 - C_3-галогеналкил; и Z означает фенил, пиридинил, пиримидинил или тиенил, каждый из которых может быть замещен одним из радикалов R^9, R^{10}, или как радикалом R^9, так R^{10}.

Предпочтительный вариант 4. Соединения, полученные из предпочтительного варианта 3, где A означает O; или NR^5; G означает C; Y означает -O-; $-CH_2O-$; $-OCH_2-$ или $-CH_2O-N=C(R^7)-$; и R^7 означает H; C_1 - C_2-алкил или C_1 - C_2-галогеналкил.

Предпочтительный вариант 5. Соединения, полученные из предпочтительного варианта 3, где A означает N; или CR^{14}; G означает N; Y означает -O-; $-CH_2O-$; $-OCH_2-$ или $-CH_2O-N=C(R^7)-$; и R^7 означает H; C_1 - C_2-алкил или C_1 - C_2-галогеналкил.

Предпочтительный вариант 6. Соединения, полученные из предпочтительного варианта 4, где R^1 означает метил; R^2 означает метил и Z означает фенил, возможно замещенный одним из радикалов R^9, R^{10}, или как радикалом R^9, так R^{10}.

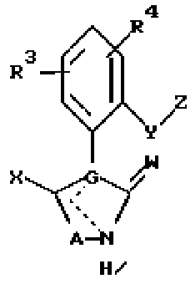
Предпочтительный вариант 7. Соединения, полученные из предпочтительного варианта 5, где R^1 означает метил; R^2 означает метил и Z означает фенил, возможно замещенный одним из радикалов R^9, R^{10}, или как радикалом R^9, так R^{10}.

Общепризнано, что некоторые реагенты и реакционные условия, описанные далее в описании, для получения соединений общей формулы I, могут оказаться несовместимы с некоторыми функциональными группами, заявленными для радикалов R^1, R^2, R^3, R^4, A, G, W, X, Y, и Z. В этих случаях, для получения требуемых продуктов необходимо включить в процесс синтеза реакции введения/снятия защитной группы. Любой специалист в области органического синтеза хорошо знает когда целесообразно введение защитных групп, и какие именно защитные группы необходимо вводить.

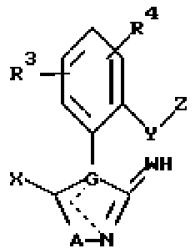
В нижеследующем описании получения соединений формулы I, соединения, представленные формулами Ia-Ik, входят в различные подгруппы соединений формулы I. Все заместители, используемые для соединений формулы Ia-Ik и соединения 1-39 входят в вышеупомянутый объем соединений формулы I, если не оговорено иначе.

Соединения предлагаемого изобретения могут существовать в виде одного или нескольких стереоизомеров. В объем различных стереоизомеров настоящего изобретения входят энантиомеры, диастереоизомеры и геометрический изомеры. Любой специалист в данной области знает, что один стереизомер может проявлять большую оптическую активность по сравнению с другими, а также как разделить указанные стереоизомеры. В соответствии с этим, в объем настоящего изобретения входят стереоизомерные смеси, стереоизомеры в чистом виде, и оптически активные смеси соединений формулы I, а также сельскохозяйственно пригодные их соли.

Любому специалисту в данной области техники ясно, что некоторые соединения формулы I могут существовать в одной или нескольких таутомерных формах. Так например, соединение формулы I, где R^2 означает H, может существовать в форме таутомера Ia



или Ib



или смеси обоих таутомеров Ia и Ib. Настоящее изобретение включает в свой объем все таутомерные формы соединений формулы I.

Соединения формулы I можно получить по нижеописанным методам органического синтеза 1) - 5). Методы 1) - 4) описывают синтез, включающий создание амидного ядра после образования арильного остатка. Метод 5) описывает процесс получения арильного остатка с уже образованным амидным кольцом.

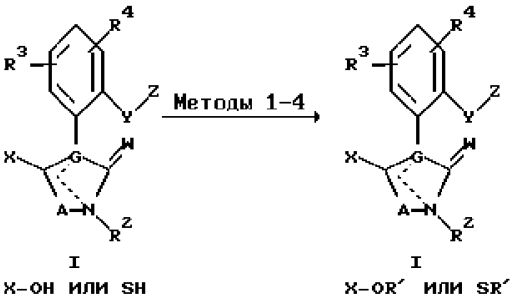
1) Методы алкилирования

Соединения формулы I получают путем обработки соединений формулы I подходящим реагентом переноса алкильной группы в инертном растворителе в присутствии или без дополнительных кислотных или основных реагентов или других реагентов (Схема 1). Подходящие растворители выбирают из группы, состоящей из полярного апротонного растворителя, например как ацетонитрил, диметилформамид или диметилсульфоксид; простых эфиров, например как тетрагидрофуран, диметоксиэтан или диэтиловый эфир; кетонов таких как ацетон или 2-бутанон; углеводородов, например как толуол или бензол; и галоидоуглеводородов, например как дихлорметан или хлороформ.

Схема 1

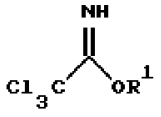
RU 2126392 C1

RU 2126392 C1



Метод 1: Q-CH=N_2 (Q=H или $(CH_3)_3Si$)

Метод 2:



кислота Льюиса

Метод 3: $(R^1)_3O^+BF_4^-$

Метод 4: $(R^1)_2SO_4$; R^1OSO_2Q; или R^1-галогензамещенный, возможно в присутствии основания (галоген - F, Cl, Br или J) (Q - C_1 - C_6-алкил, C_1 - C_6-галогеналкил).

Так, например, соединения формулы I можно получить действием диазоалкановых соединений формулы 2, например диазометана (Q=H) или триметилсилилдиазометана (Q=$CH_3)_3Si$) на дикарбонильные производные соединений формулы I. При использовании триметилсилилдиазометана необходим протонный сорастворитель, например как метанол. Примеры, иллюстрирующие указанные методы можно найти в Chem. Pharm. Bull., (1984), 32, с.3759.

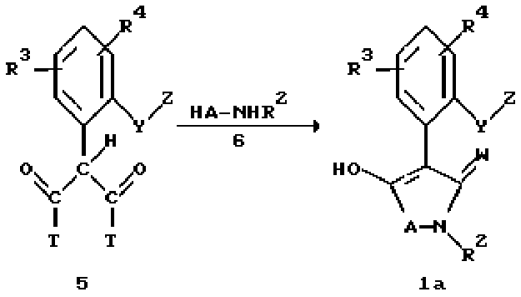
В соответствии с методом 2, соединения формулы I можно также получить взаимодействием карбонильных производных формулы I с алкилтрихлорацетимидатами формулы 3 в присутствии катализатора на основе кислоты Льюиса. В качестве подходящих кислот Льюиса можно указать триметилсилилтрифлат и тетрафторборную кислоту. Алкилтрихлорацетимидаты можно получить из соответствующего спирта и трихлорацетонитрила известными в литературе методами (J.Danklmaier и H.Honig, Synth. Commun., (1990), 20, с.203).

Соединения формулы I можно также получить из соединений формулы I путем обработки их триалкилоксония тетрафторборатом (то есть, солью Meerwein) формулы 4 (Метод 3). Известно в данной области использование триалкилоксониевых солей в качестве высокоэффективных алкилирующих реагентов (см., U. Schollkopf, U. Groth, C. Deng, Angew. Chem., Int. Ed. Engl, (1981), 20, с. 798).

К другим алкилирующим реагентам с помощью которых можно превратить карбонильные соединения формулы 1 в соединения формулы I относятся диалкилсульфаты, например диметилсульфат, галоидалкилсульфонаты, например, метил- трифторметансульфонат, и галоидные алкилы, например, йодистый метил, и бромистый пропаргил (Метод 4). Указанные реакции алкилирования можно проводить с введением или без введения основания. В качестве подходящих оснований можно указать алкоголяты щелочных металлов, например трет-бутилат калия, неорганические основания, например гидрид натрия и карбонат калия, или третичные амины, например, триэтиламин, пиридин, 1,8-диазабицикло[5.4.0]ундец-7-ен(DBU), и триэтиендиамин (см. R. E. Benson, T.L.Caims, J.Am.Chem.Soc., (1948), 70 с.2115 в качестве примеров, иллюстрирующих реакции алкилирования с использованием реагентов указанного типа.

Соединения формулы 1a (соединения формулы 1, где G-C, W-O и X-OH) можно получить реакцией конденсации малонатов или производных малонатов формулы 5 с нуклеофильным реагентом формулы 6 (схема 2). Нуклеофильные реагенты формулы 6 представляют собой N-замещенные гидроксиламины (HO-NHR^2) и замещенные гидразины (HN(R^5)NHR^2). В качестве примера таких нуклеофильных реагентов можно привести н-метилгидроксиламин и метилгидразин. Сложные эфиры малоновой кислоты формулы 5 можно получить методами, раскрываемыми далее в описании изобретения. Сложные эфиры формулы 5 можно также активировать первоначально гидролизом такого сложного эфира с образованием соответствующей карбоновой кислоты, которую затем превращают в ее хлорангидрид (T=Cl), используя, например, хлористый тионил или хлористый оксалил, или в ацилимидазол (T=1-имидазолил) путем ее обработки 1,1'-карбонилдиимидазолом.

Схема 2.



T-O(C_1 - C_4-алкил), Cl, 1-имидазолили.

Сложные эфиры формулы 5a можно получить через Cu(I)-катализируемую реакцию сложных эфиров малоновой кислоты формулы 7 с замещенными йодбензолами формулы 8 в соответствии с модифицированными методами A.Osuka, N.Kobayashi и H.Suzuki, Synthesis, (1983), 67 и проиллюстрированными в схеме 3.

Схема 3.



R^{20}-C_1-C_4-алкил.

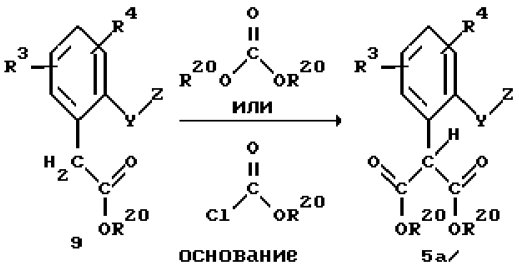
Кроме того, сложные эфиры малоновой кислоты формулы 5a можно получить обработкой сложных эфиров фенилуксусной кислоты формулы 9 диалкилкарбонатом или алкилхлорформиатом в присутствии подходящего основания, например как, но не ограничивая объема, металлического натрия или гидрида натрия (схема 4), (см.,

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

например, J.Am.Chem. Soc., (1928), 50, с.2758.

Схема 4.

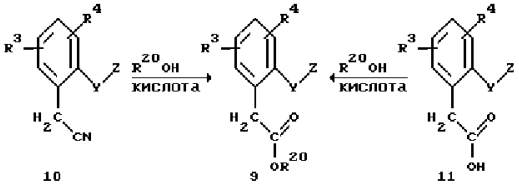


9 5a

R^{20} - C_1 - C_4-алкил.

Сложные эфиры формулы 9 можно получить катализируемым кислотой алкоголизмом фенилацетонитрилов формулы 10 или реакцией этерификации фенилацетатов формулы 11, как показано в Схеме 5 (см. Org. Synth., Coll., вып.1 (1941), стр.270).

Схема 5.

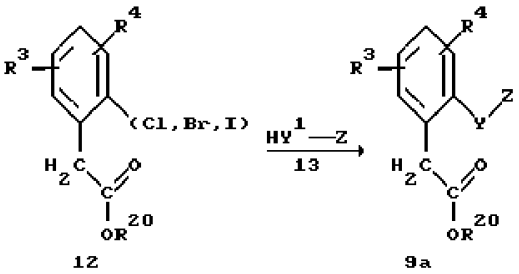


10 9 11

R^{20} - C_1 - C_4-алкил.

Сложные эфиры фенилуксусной кислоты формулы 9a можно получить через Cu(I)-катализируемую реакцию конденсации галоидбензолов формулы 12 с соединениями формулы 13, по методике, описанной в заявке EP-A-307103, и проиллюстрированной ниже в схеме 6.

Схема 6



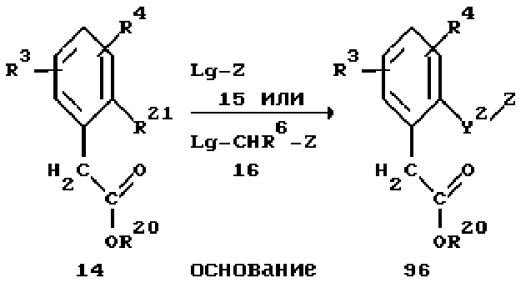
12 9a

R^{20} - C_1 - C_4-алкил;

Y^1 = O, S, $OCHR^6$, $SCHR^6$, O-N=(R^7).

Некоторые сложные эфиры формулы 9 (формула 9b) можно также получить путем образования мостиковой связи Y^2 с использованием традиционных химических реакций нуклеофильного замещений (Схема 7). При замещении соответствующей уходящей группы (Lg) в электрофилах формулы 15 или 16 нуклеофильным сложным эфиром формулы 14 получают соединения формулы 9b. Для образования соответствующего алкоголята или тиоалкоголята соединения формулы 14 используют основание, например, гидрид натрия.

Схема 7.



14 96

R^{20} - C_1 - C_4-алкил;

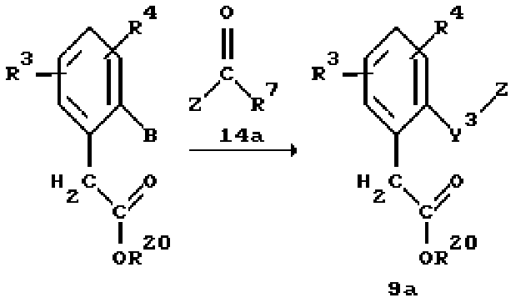
R^{21} - OH, SH, CHR^6OH, CHR^6SH;

Y^1 - O, S, $OCHR^6$, $SCHR^6$, O-N=(R^7);

Lg - Br, Cl, OSO_2CH_3, OSO_2(4-метилфенил).

Некоторые сложные эфиры формулы 9 (формула 9e) можно также получить путем образования мостиковой связи с Y^3 из замещенного гидроксиламина 9d и карбонильных соединений 14a. Замещенный гидроксиламин формулы 9d получают, в свою очередь, из сложных эфиров формулы 9c. Этот метод получения описан в заявке EP-600835 и проиллюстрирован в Схеме 8.

Схема 8.



9a

9cB - CHR^6Br;

9dB - CHR^6ONH_2HCl;

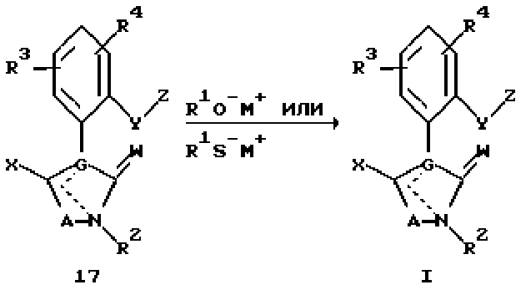
R^{20} - C_1 - C_4-алкил;

Y^3 - $CHR^6ON=O(R^7)$

2) Методы замещения и присоединения/удаления конъюгатов.

Соединения формулы I можно получить путем взаимодействия соединений формулы 17 с алкоголятами щелочных металлов ($R^1O^-M^+$) или тиоалкоголятов щелочных металлов ($R^1S^-M^+$) в соответствующем растворителе (Схема 9). В качестве уходящей группы Lg^1 в амидах формулы 17 может быть любая группа, известная в данной области, которая способна к реакции замещения указанного типа. В качестве примеров уходящих групп можно указать хлор, бром и сульфонильные и сульфонатные группы. В качестве подходящих инертных растворителей можно указать диметилформамид или диметилсульфоксид.

Схема 9.



17 I

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

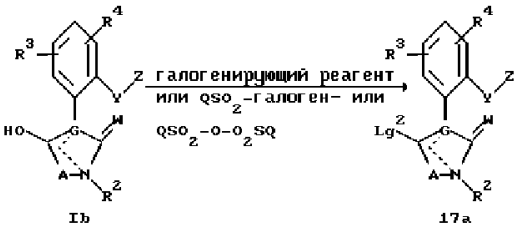
Lg^1 - Br, Cl, $-OSO_2Q$, OSO_2Q;

Q - C_1 - C_6-алкил или C_1 - C_6-галогеналкил;

M - K или Na.

Соединения формулы 17a можно получить из соединений формулы 1b (соединения формулы 1, где X означает OH) путем их взаимодействия с галогенирующими реагентами, например, хлористым тионилом или бромангидридом фосфорной кислоты с образованием соответствующих β-галогензамещенных производных (Схема 10). В альтернативном варианте, соединения формулы 1b можно обработать галоидалкилсульфонилом или ангидридом галоидалкилсульфокислоты, например, хлорангидридом метансульфокислоты, или ангидридом трифторметансульфокислоты, с образованием соответствующего β-=алкилсульфоната формулы 17a. Реакцию с сульфонилгалогенидами можно проводить в присутствии подходящего основания (например, триэтиламина).

Схема 10.



Ib 17a

Lg^2 - Cl, Br, $-OSO_2Q$;

Q - C_1 - C_6-алкил или C_1 - C_6-галогеналкил;

Галоген- - Br, Cl или F.

Как проиллюстрировано в схеме 11, сульфонилпроизводные формулы 17b можно получить окислением соответствующих тио-соединений формулы 18 с использованием общеизвестных методов окисления серы (см. Schrenk, K. В кн. The Chemistry of Sulfones ahd Sulfoxides; Patai, S. и др., Eds.: Wiley: New York, 1988). В качестве окислителей можно использовать метахлорзамещенную пероксибензойную кислоту, перекись водорода и Oxone ^{R} ($KHSO_5$).

Схема 11.



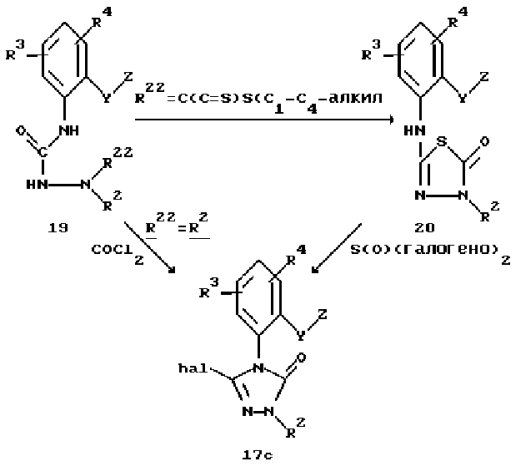
18 17b

Q - C_1 - C_6-алкил или C_1 - C_6-галогеналкил.

В альтернативном варианте, галогенпроизводные формулы 17c (соединения формулы 17a, где A - N; G - N и W - O) можно получить из гидразидов формулы 19, как показано в качестве иллюстрации на Схеме 12. В случае, когда R^{22} - C(= S)S(C_1 - C_4-алкил), диацильное производное формулы 19 обрабатывают избытком тионилгалогенида, например, хлористым тионилом. Образованный вначале продукт представляет собой соединение формулы 20 с замкнутым кольцом, которое можно затем выделить или превратить непосредственно в соединение формулы 17c; см. P. Molina, A.Tarraga, A.Espinosa, Synthesis, (1989), 923 в качестве примера, иллюстрирующего указанный способ.

В альтернативном варианте, в случае, когда R^{22}=R^2, имеющего вышеуказанные значения, гидразид формулы 19 циклизуется с фосгеном с образованием циклической мочевины формулы 17, где галоген-Cl. Указанная методика подробно описана в журнале J.Org.Chem., (1989), 54, стр.1048.

Схема 12.



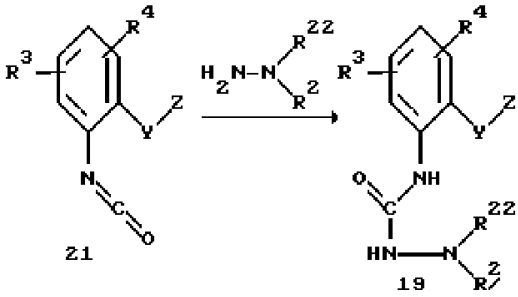
19 20 17c

R^{22} - C(C(=S)S(C_1 - C_4-алкил) или R^2;

Галоген-Cl, Br, I.

Гидразиды формулы 19 можно получить как показано в качестве иллюстрации на Схеме 13. При конденсации формулы 21 с гидразином формулы $H_2NNR^2R^{22}$ в инертном растворителе, например, тетрагидрофуране получают гидразин.

Схема 13.



21 19

R^{22} - C(C(=S)S(C_1 - C_4-алкил) или R^2.

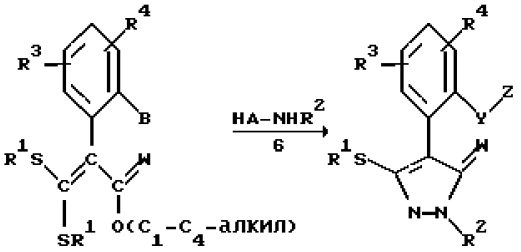
3) Методы присоединения/циклизации конъюгата

Кроме методов, раскрываемых выше, соединения формулы I, где X=SR^1 и G=C (формула Ic) можно получить обработкой любого кетендиоацеталя формулы 22 с нуклеофилами формулы 6 (Схема 14). Нуклеофилы формулы 6 описаны ранее.

Схема 14.

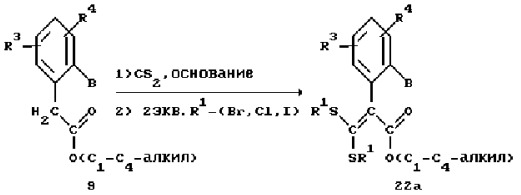
RU 2126392 C1

RU 2126392 C1



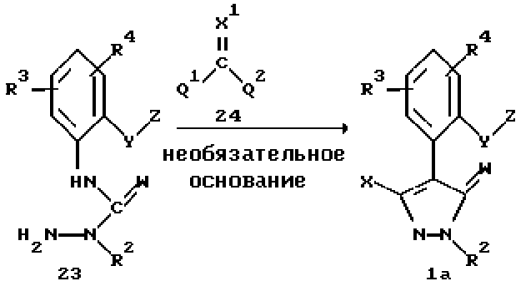
Контендитиоацетали формулы 22a можно получить реакцией конденсации фенилацетатов формулы 9 с сероуглеродом в присутствии подходящего основания с последующим взаимодействием полученного продукта с двумя эквивалентами R^1-галогенида, например, как йодметан или бромистый пропаргил (Схема 15).

Схема 15.



В альтернативном варианте, соединения формулы 1a (соединения формулы 1, где A-N; G-N) можно получит реакцией конденсации N-аминомочевин формулы 23 с карбонилирующим реагентом формулы 24 (Схема 16). К карбонилирующим реагентам формулы 24 относятся реагенты переноса карбонильной или тиокарбонильной группы, например как фосген, тиофосген, дифосген ($ClC(=O)OCCl_3$), трифосген ($Cl_3COC(=O)OCCl_3$), N, N'-карбонилдиимидазол, N,N'-тиокарбонилдиимидазол и 1,1'-карбонилди(1,2,4-триазол). В альтернативном варианте, в качестве соединений формулы 24 можно использовать алкилхлорформиаты или диалкилкарбонаты. Некоторые реакции с введением таких карбонилирующих реагентов целесообразно проводить в присутствии основания для обеспечения эффективного взаимодействия реагентов. К подходящим основаниям относятся алкоголяты щелочных металлов, например как трет-бутилат калия, неорганические основания, например, гидрид натрия или карбонат калия, или третичные амины, например, триэтиламин, пиридин, 1,8-диазабицикло[5.4.0]ундец-7-ен(DBU), или триэтилендиамин. В качестве растворителей можно использовать полярные апротонные растворители, например, ацетонитрил, диметилформамид или диметилсульфоксид; простые эфиры, например тетрагидрофуран, диметоксиэтан или диэтиловый эфир; кетоны, например ацетон или 2-бутанон; углеводороды, например, толуол или бензол; или галоидоуглероды такие как дихлорметан или хлороформ. Реакционная температура может варьировать в диапазоне от 0 до 150 °C, а время проведения реакции может меняться от 1 от 72 часов в зависимости от выбора основания, растворителя, температурного режима и подложек-носителей.

Схема 16.



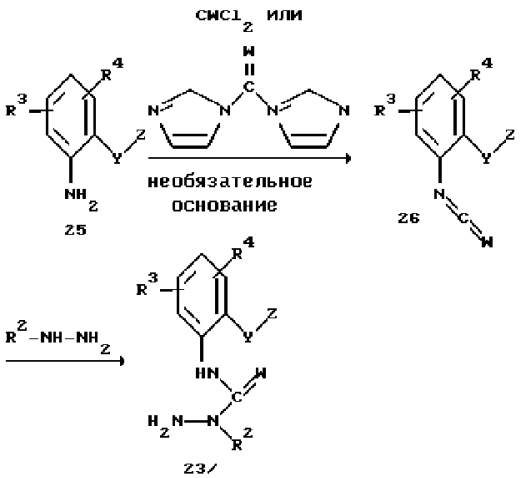
Q^1 и Q^2 каждый независимо - Cl; $OCCCl_3$; $O(C_1 - C_4)$-алкил; 1-имидазолил; 1,2,4-тиазолил;

X-OH или SH;

X^1-O или S.

N-Аминопроизводные мочевин формулы 23 можно получить, как проиллюстрировано на Схеме 17. При обработке анилина формулы 25 фосгеном, тиофосгеном, N, N'-карбонилдиимидазолом или N,N'-тиокарбонилдиимидазолом получают изоцианат или изотиоцианат формулы 26. Основание можно ввести в реакции с использованием фосгена или тиофосгена. При последующей обработке изо(тио)цианата R^2-замещенным гидразином получают N-аминомочевину формулы 23.

Схема 17.



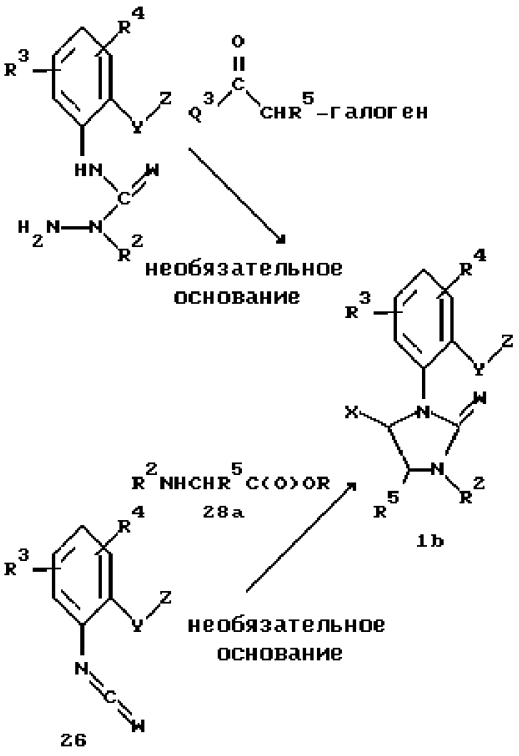
Соединения формулы 1b (Соединения формулы 1, где A-CR^5; G-N; X-O) можно получить любым из методов, проиллюстрированным на Схеме 18. Производные мочевины формулы 27 подвергают взаимодействию с активированными производными 2-галоидозамещенной карбоновой кислоты, например, хлорангидридами 2-галоидозамещенной карбоновой кислоты, сложными эфирами 2-галоидозамещенной карбоновой кислоты или 2-галоидоацилимидазолами. Первоначальное ацилирование у азота анилина сопровождается внутримолекулярным смещением 2-галогеногруппы для инициирования реакции циклизации. Для ускорения реакции ацилирования и/или последующей циклизации можно прибавить в реакционную смесь основание. В качестве основания можно использовать триэтиламин и гидрид натрия. В альтернативном варианте, соединения формулы 1b можно получить путем взаимодействия изоцианатов формулы 26 со сложными эфирами формулы 28. Как указывалось выше, к реакционной смеси

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

можно прибавить основание для ускорения реакционного процесса и последующей циклизации до соединений формулы 1b.

Схема 18.



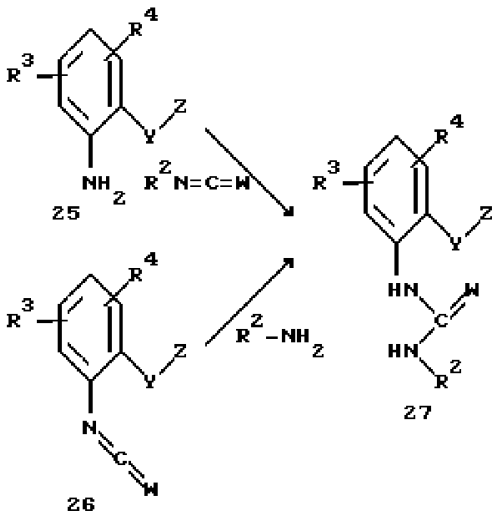
Q^3 - Cl, $O(C_1 - C_4)$-алкил, 1-имидазолил;

Галоген - Cl, Br или I;

R - $(C_1 - C_4)$-алкил.

Производные мочевины формулы 27 можно получить любым из методов, проиллюстрированных на Схеме 19. Анилины формулы 25 могут быть обработаны изоцианатами или изотиоцианатами формулы $R^2N=C=W$ по описанной выше методике. В альтернативном варианте, любой изоцианат или изотиоцианат формулы 26 может быть конденсирован с амином формулы R^2-NH_2 с образованием мочевины. Анилины и изо(тио)цианаты формулы 25 и 26, соответственно, имеются в продаже или их можно получить общеизвестными методами. Например, изотиоцианаты можно получить в соответствии с методами, описанными в журнале J.Heterocycl. Chem., (1990), 27, стр.407. Изоцианаты можно получить по методу March, J.Advanced Organic Chemistry, 3, John Wiley: New-York, (1985), стр.944, 1166.

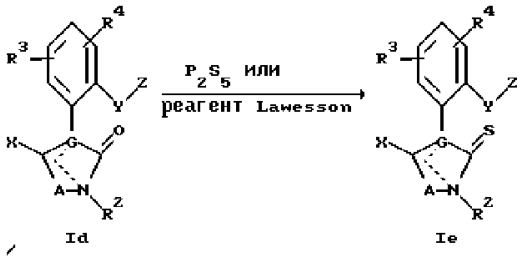
Схема 19.



4) Методы введения сульфогруппы (тионирования)

Соединения формулы Ie, то есть соединения формулы I, где W-S, можно получить путем обработки соединений формулы Id (соединения формулы I, где W-O) сульфирующими реагентами, например, P_2S_3 или реагентом Lawesson [2,4-бис(4-метоксифенил)-1,3-дитиа-2,4-дифосфетан-2,4-дисульфид] по методике, проиллюстрированной ниже в схеме 20 (см. (Bull.Soc.Chim.Belg. (1978), 87, стр.229; Tetrahedron Lett., (1983), 24, 3815).

Схема 20.

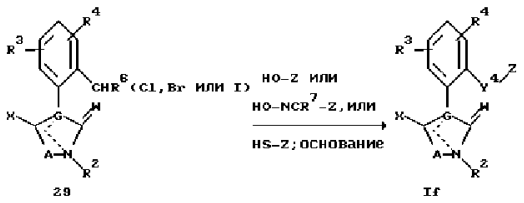


X - OR^1 или SR^1.

5) Методы синтеза арильного остатка

Соединения формулы If (соединения формулы I, где Y означает CHR^6O, CHR^6S, или CHR^6O-N= CR^7) можно получить путем обработки бензилгалогенидов формулы 29 различными нуклеофильными (Схема 21). Соответствующий спирт или тиол обрабатывают основание, например, гидридом натрия с образованием алкоголята или тиоалкоголята, который действует в качестве нуклеофила.

Схема 21.



Y^4 - CHR^6O, CHR^6O-N=CR^7, CHR^6S.

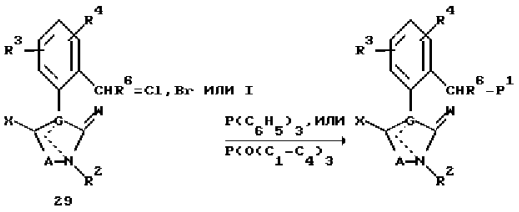
Бензилгалогениды формулы 29 можно получить реакцией свободнорадикального галогенирования алкильного производного (то есть H вместо галогена в формулу 29) или кислотным гидролизом соответствующего простого метилового эфира (то есть OMe вместо галогена в формуле 29).

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

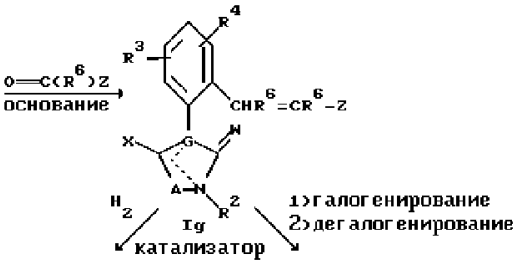
Соединения формулы I, где Y означает $CR^6=CR^6$ и CHR^6-CHR^6 (соединения формулы Ig и Ih, соответственно) можно получить по методике, проиллюстрированной в Схеме 22. При обработке бензилгалогенидов формулы 29 трифенилфосфином или триалкилфосфитом получают фосфониевую соль (формулы 30) или фосфонат (формулы 31), соответственно. В результате реакции конденсации фосфорсодержащего соединения основанием или карбонильным соединением формулы $Z(R^6)C=O$ получают олефин формулы Ig.

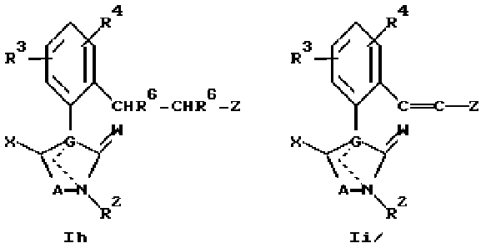
Схема 22.



29

30 : $P^1=P^+(C_6H_5)_3$галоид; 31 : $P^1=P(O(C_1 - C_4))_2$





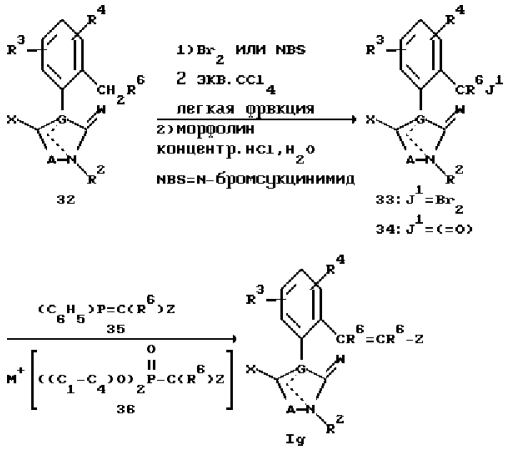
Ih Ii

Олефины формулы Ig можно превратить в насыщенные производные формулы Ih гидрогенизацией через металлический катализатор, например как палладий на угле, которая хорошо известна в данной области техники (Rylander, Catalytic Hydrogenation in Organic Synthesis; Academic: New- York, 1979).

Алкины формулы Ii можно получить путем галогенирования/дегалогенирования олефинов формулы Ig по общеизвестным в данной области методам (March, J. Advanced Organic Chemistry, 3-издание, John Wiley: New-York, (1985), стр. 924). Кроме того, алкины формулы Ii можно получить известной реакцией галоидзамещенных ароматических соединений с алкиновыми производными в присутствии катализаторов, например, никелевого или палладиевого катализатора (см. J.Organomet.Chem., (1975), 93, стр.253-257).

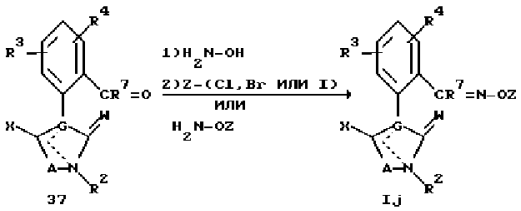
Олефин формулы Ig можно также получить восстановлением реакционной способности реагентов реакцией конденсации методом Wittig и Horner-Emmons. Так например, 2-алкилфенильные производные формулы 31 можно превратить в соответствующее двубромистое соединение формулы 33, как проиллюстрировано на Схеме 23 (см. , Synthesis, (1988), стр.330). Указанное двубромистое соединение можно гидролизовать до карбонильного соединения формулы 34, которое, в свою очередь, можно конденсировать с форсфорсодержащим нуклеофильным реагентом формулы 35 или 36 с получением олефина формулы Ig.

Схема 23.



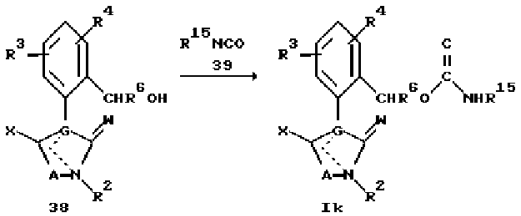
Оксимы формулы Ij (формула I, где Y означает $C(R^7)=N-O$) можно получить из карбонильных соединений формулы 37 путем конденсации их с гидроксиламином и последующим O-алкилированием при использовании электрофильных реагентов формулы Z-(Cl, Br или I) (Схема 24). В альтернативном варианте, O-замещенный гидроксиламин может быть конденсирован с карбонильным соединением формулы 37 с непосредственным образованием оксимов формулы Ij.

Схема 24.



Карбаматы формулы Ik можно получить путем взаимодействия бензиловых спиртов формулы 38 с изоцианатами формулы 39 (Схема 25). Для ускорения реакции в реакционную смесь можно добавить основание, например триэтиламин.

Схема 25.



Приводимые ниже примеры иллюстрируют получение новых циклических амидов формулы I. Спектры ^{1}H-ЯМР даны в частях на млн., тетраметилсилан; s-синглет, d-дублет, t-триплет, dt-двойной триплет, td-тройной дублет, m-мультиплет.

Пример 1.

Стадия A: Получение метил 2-(3-метоксифенокси)фенилацетата

2-Хлорфенилуксусную кислоту (60 г),

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

3-метоксифенол (87 г), карбонат калия (97,2 г) и хлорид меди (I) (0,6 г) смешивают и полученную смесь перемешивают механическим путем с получением густой коричневой суспензии. Суспензию нагревают в течение 4,5 часов, охлаждают до температуры 70°C и затем прибавляют 10 мм N,N-диметилформамида. Полученную смесь выливают в воду со льдом и подкисляют концентрированным водным раствором HCl. Реакционную смесь экстрагируют диэтиловым эфиром, объединенные экстракты промывают водой (4 раза), сушат ($MgSO_4$), фильтруют и упаривают при пониженном давлении с получением 122 г масла. Неочищенный продукт растворяют в 73 мл метанола, и затем прибавляют 2,1 мл концентрированной серной кислоты. Полученную смесь нагревают с обратным холодильником в течение 4 часов. Затем смесь выливают в ледяную воду и экстрагируют диэтиловым эфиром. Объединенные органические слои промывают 10% водным раствором NaOH (2 раза), затем водой (4 раза) и солевым раствором. Органическую фазу сушат ($MgSO_4$), фильтруют и упаривают при пониженном давлении с получением 46,4 г (48%) названного соединения стадии A в виде красноватого масла. ^{1}H-ЯМР($CDCl_3$): δ 6,45 - 7,4 (м, 8H), 3,76 (с, 3H), 3,69 (с, 2H), 3,62 (с, 3H).

Стадия B: Получение диметил [2-(3-метоксифенокси)фенил]пропандиоата

Метил 2-(3-метоксифенокси)фенилацетат (6,81 г) растворяют в 11 мл диметилкарбоната и к полученному раствору прибавляют 600 мг натрия. Смесь кипятят с обратным холодильником в течение 10 часов, а затем охлаждают. Реакционную смесь гасят водой, подкисляют концентрированным водным раствором HCl и экстрагируют дихлорметаном. Объединенные органические экстракты сушат ($MgSO_4$), отфильтровывают и упаривают при пониженном давлении с получением масла. Требуемый продукт отделяют от непрореагировавшего исходного материала флеш-хроматографией (4 : 1, гексан : этилацетат в качестве элюента) с получением после упаривания 3,54 г (43%) названного соединения стадии B. ^{1}H-ЯМР($CDCl_3$): δ 7,46 (дд, J=1,5, 7,5 Гц, 1H), 7,29 (т, J=8 Гц, 1H), 7,2 (м, 2H), 6,92 (д, J=8 Гц, 1H), 6,65 (тд, J=1,5, 7,5 Гц, 1H), 6,5 (м, 2H), 5,14 (с, 1H), 3,77 (с, 3H), 3,73 (с, 6H).

Стадия C: Получение 5-Гидрокси-4-[2-(3-метоксифенокси)фенил-2-метил-3(2H)изоксазолона

Хлористоводородный N-метилгидроксиламин (2,79 г) растворяют в 20 мл метанола при кипячении с обратным холодильником. Затем раствор охлаждают и обрабатывают раствором, содержащим 3,76 г гидроокиси калия в 15 мл метанола. Выпавший в осадок хлористый калий удаляют фильтрованием и прибавляют по каплям раствор, содержащий 3,54 г диметил [2-(3-метоксифенокси)-фенил]пропандиоата в 25 мл метанола. Смесь перемешивают при комнатной температуре в течение ночи. Реакционную смесь упаривают в вакууме до объема приблизительно 30 мл и подкисляют концентрированным водным раствором HCl и затем охлаждают. Растворители удаляют при пониженном давлении, и остаток разделяют водный и дихлорметановый слои. Объединенные органические слои сушат ($MgSO_4$), отфильтровывают и упаривают при пониженном давлении с получением 2,95 г (88%) названного соединения Стадии C. ^{1}H-ЯМР($CDCl_3$): δ 7,2-7,4 (м, 3H), 7,12 (дт= 1, 7,5 Гц, 1H), 6,81 (д, J=8,5 Гц, 1H), 6,72 (d, J=8 Гц, 1H), 6,6 (м, 2H), 4,43 (с, 1H), 3,77 (с, 3H), 3,28 (с, 3H).

Стадия D: Получение 5-метокси-4-[2-(3-метоксифеноксифенил] -2-метил-3(2H)-изоксазолона

5-Гидрокси-4[2-(3-метоксифеноксифенил]-2-метил-3(2H)-изоксазолон (2,5 г) растворяют в 3 мл метанола и 15 мл толуола, и полученный раствор охлаждают на бане со льдом. Триметилсилилдиазометан (5 мл 2,0 М раствора в гексане) добавляют по каплям. Отмечено выделение газа. Полученный желтый раствор перемешивают при комнатной температуре в течение ночи. Растворители отгоняют при пониженном давлении, и остаток очищают флеш-хроматографией (гексан : этилацетат, 1 : 1 в качестве элюента). Второй компонент элюирования собирают с получением 950 мг (36%) названного соединения Стадии D. ^{1}H-ЯМР($CDCl_3$): δ 7,51 (дд, J= 1,7, 7,5 Гц, 1H), 7,27 (дт, J=1,7, 7,5 Гц, 1H), 7,17 (м, 2H), 6,97 (дд, J=1,8 Гц, 1H), 6,5 (м, 3H), 3,92 (с, 3H), 3,74 (с, 3H), 3,33 (с, 3H).

Пример 2.

Стадия A: Получение 1-(Бромметил)-2-йодбензола

К раствору 2-йодбензилового спирта (50 г) в диэтиловом эфире (500 мл), охлажденному на ледяной бане, прибавляют по каплям трибромид фосфора (28 мл). Реакционную смесь быстро охлаждают в холодильнике в течение 3,5 часов, затем гасят медленным добавлением метанола (50 мл). Полученную смесь промывают последовательно водой, насыщенным раствором бикарбоната натрия, и затем водой (порция по 100 мл каждая). Органическую фазу сушат ($MgSO_4$), фильтруют и упаривают при пониженном давлении до белого твердого продукта, который превращают в порошок в гексане и собирают фильтрованием с получением 58 г (91%) названного вещества Стадии A в виде твердого продукта, т.пл. 55 - 57°C.

Стадия B: Получение 1-йод-2-[(2-метилфенокси)метил]бензола

Гидрид натрия (60% масляная дисперсия) (7,8 г) добавляют порциями к охлажденному на водяной бане со льдом раствору о-крезола (21,1 г) в тетрагидрофуране (500 мл). Смесь перемешивают в течение 20 минут, и затем прибавляют 1-(бромметил)2-йодбензола (58 г). Полученную смесь нагревают до 60°C в течение 16 часов. Затем прибавляют еще порцию гидрида натрия (2 г), и реакционную смесь нагревают еще в течение 3 часов. Реакционную смесь охлаждают и осторожно гасят водой, и экстрагируют этилацетатом (2 X 250 мл). Объединенные органические экстракты сушат ($MgSO_4$), фильтруют и упаривают при пониженном давлении до масла, которое превращают в порошок холодным гексаном с образованием преципитата, который собирают фильтрованием. Получают 59,1 г (94%) названного соединения Стадии B в виде

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

белого твердого продукта, т.пл. 106 - 108°C.

Стадия C: Получение диметил[2-[(2-метилфенокси)метил]фенил]пропандиоата

К суспензии гидрида натрия (60% масляная дисперсия) (15,4 г) в 90 мл 1,3-диметил-3,4,5,6-тетрагидро-2[1H]-пиримидинона (DMPU), охлажденному на водяной бане со льдом, добавляют по каплям раствор диметилмалоната (44 мл) в DMPU (150 мл). Сразу же после введения реагента, смесь перемешивают в течение 20 минут, и затем добавляют 1-йод[2-[(2-метилфенокси)метил]бензол (62,5 г) и йодид меди (I) (73,3 г). Полученную смесь перемешивают при 100°C в течение 5 часов, затем перемешивают при 25°C в течение ночи. Смесь разбавляют 1 н. HCl (примерно 150 мл) и экстрагируют диэтиловым эфиром (3 X 400 мл). Объединенные органические экстракты сушат ($MgSO_4$), фильтруют и упаривают при пониженном давлении до получения полутвердого продукта, который очищают флеш-хроматографией на силикагеле (используя гексан : этилацетат, 5 : 2, в качестве элюента). Выпавший осадок собирают и упаривают до белого твердого продукта, который порошкуют в гексане, извлекают фильтрованием и получают 56,9 г (79%) названного соединения Стадии C в виде белого твердого вещества, т.пл. 99 - 103 °C.

Стадия D: Получение 5-гидрокси-4-[2-[(2-метилфенокси)метил]фенил]-3(2H)-изоксазолона

К раствору хлористоводородного N-метилгидроксиламина (34,7 г) в метаноле (120 мл), охлажденному на водяной бане со льдом, добавляют по каплям раствор гидроксида калия (46,6 г) в метаноле (80 мл). После завершения введения, смесь перемешивают в течение 10 минут. Выпавший в осадок хлористый калий извлекают фильтрованием, и раствор, содержащий диметил[2-[(2-метилфенокси)метил]фенил]пропандиоата (44 г) в 100 мл метанола прибавляют к раствору, содержащему N-метилгидроксиламин. Полученную смесь перемешивают в течение 3 дней и охлаждают на водяной бане со льдом. Добавляют концентрированную HCl (15 мл), и выпавший твердый осадок собирают фильтрованием. Растворитель отгоняют в вакууме, и остаток разводят примерно 100 мл воды, и затем экстрагируют дихлорметаном (3 X 150 мл) и этилацетатом (3 X 100 мл). Объединенные органические экстракты сушат ($MgSO_4$), фильтруют и упаривают при пониженном давлении с получением 31,3 г (75%) названного соединения Стадии D в виде полутвердого продукта. ^{1}H-ЯМР(DMSO-d_6): δ 7,4 (м, 2H), 7,15 (м, 2H), 7,10 (м, 2H), 6,8 (м, 2H), 5,16 (с, 2H), 2,9 (с, 3H), 2,23 (с, 3H).

Стадия E: Получение 5-метокси-2-метил-4-[2-[(2-метилфенокси)метил]фенил] 3(2H)-изоксазолона

5-Гидрокси-4-[2-[(2-метилфенокси)метил]фенил]3(2H)-изоксазолона (31,3 г) растворяют в 330 мл смеси толуола и метанола, 10 : 1, и полученный раствор охлаждают на водяной бане со льдом. Затем к реакционному раствору прибавляют по каплям раствор триметилсилилдиазометана (примерно 2M в гексане) (55 мл). При введении наблюдается выделение газа. Полученный желтый раствор перемешивают при 25°C в течение 2 часов. Затем раствор разбавляют 100 мл воды и экстрагируют этилацетатом (4 x 100 мл). Объединенные органические экстракты сушат ($MgSO_4$), фильтруют и упаривают при пониженном давлении с получением масла, которое очищают флеш-хроматографией (силикагель; гексан : этилацетат, 1 : 1, в качестве элюента). Второй компонент элюирования собирают с получением 4,35 г (13%) названного соединения Стадии E в виде белого твердого вещества, т. пл. 90 - 92 °C. ^{1}H-ЯМР($CDCl_3$): δ 7,61 (д, 1H), 7,35 (м, 3H), 7,12 (м, 2H), 6,84 (м, 2H), 5,12 (с, 2H), 3,96 (с, 3H), 3,41 (с, 3H), 2,24 (с, 3H).

Пример 3.

Стадия A: Получение 1-метил-N-(2-феноксифенил)-гидразин-карбоксамида

2-Феноксианилин (5,57 г) и триэтиламин (4,2 мл) растворяют в 100 мл 1,2-дихлорэтана. Затем прибавляют трифосген ($Cl_3COC(=O)OCCl_3$, 2,97 г) с образованием преципитата. Смесь кипятят с обратным холодильником, и выпавшую фазу растворяют. Через 5,5 часов раствор охлаждают и добавляют 1,6 мл метилгидразина с выпадением нового осадка. Смесь перемешивают при комнатной температуре в течение ночи. Растворитель отгоняют, и остаток разделяют между этилацетатом и 1н. водным раствором HCl. Органические фазы сушат ($MgSO_4$), фильтруют, и упаривают при пониженном давлении. Остаток очищают флеш-хроматографией (1 : 1, гексан : этилацетат в качестве элюента). Второй компонент с наименьшей полярностью собирают, элюент удаляют при пониженном давлении, и осадок порошкуют гексаном с выходом 3,86 г (50%) названного соединения Стадии A, т.пл. 117 - 119°C.

Стадия B: Получение 2-метил-4-(2-феноксифенил)-5-тиоксо-1,2,4-триазолидин-3-она.

Раствор, содержащий 1,54 г 1-метил-N-(2-феноксифенил)гидразинкарбоксамида в 50 мл тетрагидрофурана, охлажденного в ледяной бане, обрабатывают 0,46 мл тиофосгена, а затем 1,68 мл триэтиламина с выпадением осадка. Смесь перемешивают при температуре окружающей среды в течение ночи. Выпавший осадок извлекают фильтрованием и промывают тетрагидрофураном. Объединенный фильтрат и промывки упаривают при пониженном давлении с получением 1,8 г масла янтарного цвета. Неочищенный материал используют в следующей Стадии без дополнительной очистки. ^{1}H-ЯМР($CDCl_3$): δ 6,8-7,4 (м, 9H), 3,57 (с, 3H).

Стадия C: Получение 2,4-дигидро-2-метил-5-(метилтио)4-(2-феноксифенил)-3H-1,2,4-триазол-3-она.

Раствор, содержащий 900 мг неочищенного 2-метил-4(2-феноксифенил)-5-тиоксо-1,2,4-триазолидин-3-она в 50 мл тетрагидрофурана обрабатывают 150 мг гидрида натрия (60% масляная дисперсия). Через 5 минут к

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

реакционной смеси прибавляют 0,5 мл йодметана, и полученную смесь перемешивают при температуре окружающей среды в течение ночи. Выпавший осадок удаляют фильтрованием и фильтрат упаривают до масла. Полученное масло разделяют между диэтиловым эфиром и раствором 1 н. соляной кислоты. Органические фазы сушат ($MgSO_4$), фильтруют и упаривают при пониженном давлении. Остаток порошкуют в смеси гексана и н-бутилхлорида с выходом 530 мг (56%) названного соединения Стадии С, т. пл. 129 - 130°С.

Пример 4.

Стадия А: Получение 2,2-диметил-N-(2-метилфенил)гидразинкарбоксамида.

о-Толилизоцианат (10,0 г) растворяют в 75 мл толуола в атмосфере N_2. Полученный раствор охлаждают до 5°С и затем медленно прибавляют раствор, содержащий 1,1-диметилгидразин в метаноле (5,7 мл). После введения, полученную смесь снимают с ледяной бани, и полученную суспензию перемешивают еще 10 минут. Твердый осадок отфильтровывают промывкой последовательно гексаном, небольшим количеством 20% раствором диэтилового эфира с гексаном, а затем опять гексаном. В результате получают 11,1 г (77%) названного соединения Стадии А. ^{1}Н-ЯМР($CDCl_3$): δ 8,1 (шир.с, 1Н), 7,94 (д, 1Н), 7,21-7,15 (м, 3Н), 6,99 (т, 1Н), 5,23 (шир.с, 1Н), 2,63 (с, 6Н), 2,27 (с, 3Н).

Стадия В: Получение 5-хлор-2,4-дигидро-2-метил-4-(2-метилфенил)-3Н-1,2,4-триазол-3-она.

К раствору, содержащему 11,1 г 2,2-диметил-N-(2-метилфенил)гидразинкарбоксамида, растворенному в 600 мл метиленхлорида в атмосфере N_2, добавляют 17,1 г трифосгена. Полученный раствор кипятят с обратным холодильником в течение ночи, охлаждают, и затем упаривают при пониженном давлении. Полученный остаток растворяют в этилацетате и промывают сначала водой, а затем насыщенным водным раствором NaCl. Органическую фазу сушат ($MgSO_4$), фильтруют, и упаривают при пониженном давлении. Остаток очищают флеш-хроматографией (30 - 50% этилацетате/гексан в качестве элюента) с выходом 8,25 г (64%) названного соединения Стадии В. ^{1}Н-ЯМР($CDCl_3$): δ 7,42-7,30 (м, 3Н), 7,17 (д, 1Н), 3,54 (с, 3Н), 2,22 (с, 3Н).

Стадия С: Получение 2,4-дигидро-5-метокси-2-метил-4-(2-метилфенил)-3Н-1,2,4-триазол-3-она.

8,25 г 5-Хлор-2,4-дигидро-2-метил-4-(2-метилфенил)3Н-1,2,4-триазол-3-она растворяют в 80 мл смеси диметоксиэтана и метанола, 1 : 1, в атмосфере N_2. Затем к раствору добавляют 14,0 мл метилата натрия (30% раствор в метаноле), и полученную смесь кипятят с обратным холодильником в течение 3 часов. Смесь охлаждают, разбавляют этилацетатом, промывают сначала водой, а затем насыщенным водным раствором NaCl. Объединенные органические экстракты сушат ($MgSO_4$), фильтруют, и упаривают при пониженном давлении. Остаток очищают флеш-хроматографией (используя 50 - 70% этилацетат/гексан в качестве элюента) и порошкуют смесью из 50% диэтилового эфира и гексана. Получено 6,7 г названного соединения Стадии С (95% степени чистоты). ^{1}Н-ЯМР($CDCl_3$): δ 7,35-7,27 (м, 3Н), 7,18 (д, 1Н), 3,94 (с, 3Н), 3,46 (с, 3Н), 2,22 (с, 3Н).

Стадия D: Получение 4-[2-(бромэтил)фенил]-2,4-дигидро-5-метокси-2-метил-3Н-1,2,4-триазол-3-она.

К раствору/суспензии, содержащему 6,7 г 2,4-дигидро-5-метокси-2-метил-4(2-метилфенил)-3Н-1,2,4-триазол-3-она в 95 мл тетрахлорметана в атмосфере N_2, добавляют N-бромсукцинимид (6,53 г) и каталитически эффективное количество перекиси бензоила. Реакционный раствор кипятят с обратным холодильником в течение 2 часов. Затем прибавляют еще 1,63 г N-бромсукцинимида и каталитически эффективное количество перекиси бензоила, и полученный раствор нагревают при кипячении с обратным холодильником в течение часа. После охлаждения добавляют метиленхлорид, органический слой промывают последовательно водой, затем 0,1 н. раствором тиосульфата натрия, и насыщенным водным раствором NaCl. Объединенные органические экстракты сушат ($MgSO_4$), фильтруют, и упаривают при пониженном давлении. Остаток очищают флеш-хроматографией (используя 3 - 10% диэтиловый эфир/хлористый метилен в качестве элюента). Получают 3,12 г названного соединения Стадии D. ^{1}Н-ЯМР($CDCl_3$): δ 7,5 (м, 1Н), 7,44 (м, 2Н), 7,22 (м, 1Н), 4,60 (д, 1Н), 4,36 (д, 1Н), 3,96 (с, 3Н), 3,47 (с, 3Н).

Стадия Е: Получение 2,4-дигидро-5-метокси-2-метил-4-[2-[[[(фенилметилен)-амин]окси]метил]фенил]-3Н-1,2,4-триазол-3-она.

0,40 г 4-[2-(бромметил)фенил]-2,4-дигидро-5-метокси-2-метил-3Н-1,2,4-триазол-3-она растворяют примерно в 5 мл N,N-диметилформамида в атмосфере N_2. К полученному раствору прибавляют 0,20 г ацетофеноноксим, затем 0,07 г 60% гидрида натрия. Раствор перемешивают в течение 4 часов при комнатной температуре после чего разбавляют этилацетатом, промывают сначала водой, а затем насыщенным водным раствором NaCl. Органическую фазу сушат ($MgSO_4$), фильтруют, и упаривают при пониженном давлении. Остаток очищают флеш-хроматографией (используя 60% этилацетат/гексан в качестве элюента). Получают 0,38 г названного соединения Стадии Е. ^{1}Н-ЯМР($CDCl_3$): δ/ 7,6 (м, 3Н), 7,44 (м, 2Н), 7,35 (м, 3Н), 7,25 (м, 1Н), 5,26 (д, 1Н), 5,22 (д, 1Н), 3,88 (с, 3Н), 3,40 (с, 3Н), 2,20 (с, 3Н).

В соответствии с общими методиками, описанными в данном описании изобретения, или возможными их модификациями, можно получить соединения, приведенные в Таблицах 1 - 26.

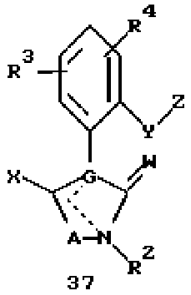
В приводимых таблицах используют следующие сокращения. Все алкильные группы относятся к нормальным изомерам, если не оговорено особо.

n - нормальный; MeO - метокси; MeS - метилтио; i - изо; Pr - пропил; Bu - бутил; Me - метил; CN - циано; Ph - фенил; Et -

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

этил; c - цикло; NO_2 - нитро.



37

Методы приготовления и использования композиций.

Соединения предлагаемого изобретения обычно используют в составе с любой другой сельскохозяйственно пригодной композицией. Фунгицидные композиции настоящего изобретения содержат эффективное количество по меньшей мере одного из вышеуказанных соединений формулы I и по меньшей мере один ингредиент, выбранный из (a) поверхностно-активного вещества, (b) органического растворителя и (c) по меньшей мере одного твердого или жидкого наполнителя. Пригодные для использования формы композиций можно получить традиционными способами. Композиции можно получить, например, в виде порошковидных препаратов, гранул, таблеток, растворов, суспензий, эмульсий, смачиваемых порошков, эмульгируемых концентратов, сыпучих препаратов и тому подобное. Пригодные для распыления композиции можно приготовить при разведении их в соответствующей среде и использовать в объемах от одного до нескольких сотен литров на гектар. Высококонцентрированные композиции используют, главным образом, в качестве полупродукта, из которого затем приготавливают требуемый для использования состав. Заявляемые фунгицидные композиции обычно содержат эффективное количество активного ингредиента, наполнитель и поверхностно-активное вещество при следующем их соотношении, мас.% (см. табл. G).

Типичные твердые наполнители описывает Watkins и др., Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers, 2-е издание, Dorland Books, Cadwell, New Jersey. Типичные жидкие наполнители описывает Marsden, Solvents, Guide, Interscience, New York, (1950). В трудах McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual, Allured Publ.Corp., Ridgewood, New-Jersey а также в энциклопедии Sisley Wood, Encyclopedia of Surface Active Agents, Chemical Publ.Co., Inc. , New York, (1964) дается перечень поверхностно-активных веществ, а также рекомендации по их использованию. Все предлагаемые составы содержат небольшое количество добавок для снижения пенообразования, слеживаемости, коррозии, роста микроорганизмов и тому подобное.

Специалисты хорошо знакомы с технологией приготовления таких композиций. Растворы приготавливают простым смешиванием ингредиентов.

Тонкодисперсные твердые композиции получают смешиванием ингредиентов и, обычно, помолом их в молотковой мельнице или жидкостной дробилке. Диспергируемые в воде гранулы можно получить методом агломерации тонко-измельченных порошковых композиций; см. например, Cross и др., Pesticide Formulations, Washington, D.C., (1988), стр. 251-259. Суспензии приготавливают мокрым помолом; см., например, патент US 3060084. Гранулы и таблетки можно изготовить путем распыления активного ингредиента на предварительно полученные гранулированные носители или методами агломерации. См. Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, Декабрь 4, 1967, стр.147-148, Perry, Chemical Enginer's Handbook, 4-ое издание, McGraw-Hill, New-York, (1963), стр.8-57 и далее, и заявку WO 91/13546.

Таблетки можно получить по методике, описанной в патенте US N 4172714. Вододиспергируемые и водорастворимые гранулы можно получить по методике, описанной в патенте DE N 3246493.

Для дальнейшей информации относительно приготовления фунгицидной композиции, см. патент US 3235361, со строки 16 колонки 6, по строку 19 колонки 7, и Примеры 10 - 41; патент US 3309192, со строки 43 колонки 5, по строку 62 колонки 7, и Примеры 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138-140, 162-164, 166, 167 и 169-182; патент US 2891855, со строки 66 колонки 3, по строку 17 колонки 5, и Примеры 1-4; Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley и Sons, Inc, New-York, (1961), стр.81-96; и Hance и др., Weed Control Handbook, 8-издание, Blackwell Scientific Publications, Oxford, (1989).

В приводимых ниже Примерах, все ингредиенты даны в мас.% и все композиции приготовлены традиционными методами. Соединение I относится к соединению, приведенному в Индексной таблице A.

Пример A.

Смачиваемый порошок, %:

Соединение 1 - 65

Полиэтиленгликолевый эфир додецилфенола - 2

Лигнинсульфонат натрия - 4

Алюмосиликат натрия - 6

Монтмориллонит (прокаленный) - 23

Пример B

Гранула, %:

Соединение 1 - 10

Гранулированный аттапульгит (низко сыпучий, 0,71/0,30 мм; стандарт США, N сит 25-50) - 90

Пример C

Экструдированная гранула, %:

Соединение 1 - 25

Безводный сульфат натрия - 10

Неочищенный лигнинсульфонат кальция - 5

Алкилнафталинсульфонат натрия - 1

Кальциево-магниевый бентонит - 59

Пример D

Соединение 1, % - 20

Смесь растворимых в масле сульфонатов и политиленоксидов, % - 10

Изофорон, % - 70

Соединения настоящего изобретения пригодны для использования в качестве средств борьбы с болезнями растений. Настоящее изобретение, таким образом, предлагает способ борьбы с болезнями растений, вызванных фитопатогенными

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

грибами, заключающийся в том, что на растение или часть его, либо семена или посевы растений наносят эффективное количество соединения формулы I или фунгицидной композиции на его основе. Соединения и композиции предлагаемого изобретения обеспечивают защиту растений от болезней, вызванных широким спектром фитопатогенных грибов в классах Basidiomycete, Ascomycete, Oomycete и Deuteromycete. Они эффективны в борьбе с широким спектром болезней растений, особенно возбудителями заболевания листвы декоративных растений, овощных и полевых культур, хлебных злаков и плодовых культур. К этим возбудителям болезни относятся Plasmopara viticola, Phytophthora infestans, Peronospora tabacina, Pseudoperonospora cubensis, Pythium aphanidermatum, Altemaria brassicae, Septoria nodorum, Cercosporidium personatum, Cercospora arachidicola, Pseudocercosporella herpotrichoides, Cercospora beticola, Botrytis cinerea, Monilinia fructicola, Pyricularia oryzae, Podosphaera leucotricha, Venturia inaequalis, Erysiphe graminis, Uncinula necatur, Puccinia recondita, Puccinia graminis, Hemileia vastatrix, Puccinia striiformis, Puccinia arachidis, Rhizoctonia solani, Sphaerotheca fuliginea, Fusarium oxysporum, Verticillium dahliae, Pythium aphanidermatum, Phytophthora megasperma и другими классами и видами, тесно связанными с указанными болезнетворными микроорганизмами.

Соединения предлагаемого изобретения можно также использовать в смеси с одним или несколькими инсектицидами, фунгицидами, нематоцидами, бактериоцидами, акарицидами, полуядохимикатами, репеллентами, аттрактантами, феромонами, стимуляторами роста растений или другими биологически активными соединениями для получения многокомпонентного пестицида, который обеспечивает даже более широкий спектр защиты сельскохозяйственных культур. В качестве примеров других защитных средств сельскохозяйственных культур, которые пригодны для использования в смеси с заявляемыми соединениями можно указать инсектициды, например, ацефат, авермектин B, азинфосметил, бифентрин, бифенат, бупрофениз, карбофуран, хлордимеформ, хлорпирифос, цифлутрин, делтаметрин, диазинон, дифлуибензурон, диметоат, эфсенвалерат, фенпропатрин, фенвалерат, фипронил, флуцитринат, флуфенпрокс, флумалинат, фонофос, изофенфос, малатион, метальдегид, мета-мидофос, метидатион, метомил, метопрен, метоксихлор, монокротофос, оксамил, паратион-метил, перметрин, форат, фозалон, фосмет, фосфамидон, пиримикарб, профенофос, ротенон, сулпрофос, тербуфос, тетрахлорвинфос, тиодикарб, тралометрин, трихлорфон и трифлумурон; фунгициды, например, беномил, ластицин S, бромконазол, каптафол, каптан, карбендазим, хлорнеб, хлороталонил, оксихлорид меди, купраты, цимоксанил, ципроконазол, дихлоран, диклобутразол, дикломезин, дифеноконазол, диниконазол, додин, эдифенфос, эпоксиконазол, фенаримол, фенбуконазол, фенпропидин, фенпропиморф, флуквинконазол, флусилазол, флутоланил, флутриафол, фолпет, фуралаксил, гексаконазол, ипконазол, ипробенфос, ипродион, изопротиолан, казугамицин, манкозеб, манеб, мепронил, металаксил, метконазол, миклобутанил, нео-азарин, оксадиксин, пенконазол, пенцикурон, фозетил-A1, пробеназол, прохлораз, пропиконазол, пирифенох, пироквилон, сера, тебуконазол, тетраконазол, тиабендазол, тиофанат-метил, тиурам, триадимефон, триадименол, трициклазол, униконзол, валидамицин и винклозолин; нематоциды, например, альдоксикарб, фенамимифос и фостиетан; бактерициды, например, окситетрациклин, стрептомици и трисульфат меди; акарициды, например, амитраз, бинапакрил, хлорбензилат, цигексатин, дикофол, диенохлор, фенбутатиноксид, гекситиазокс, окситиохинокс, пропаргит и тебуфенпирад; и биологические агенты, например Bacillus thuringiensis и бакуловирус.

В некоторых случаях, для снижения вероятности противофунгицидной устойчивости, особенно предпочтительно использование предлагаемых соединений в смеси с другими фунгицидами, имеющих аналогичный спектр защиты, но разный режим воздействия.

Способ борьбы с болезнями растений обычно заключается в том, эффективное количество соединения предлагаемого изобретения наносят, как до, так и после заражения, на защищаемый участок растения, например, корни, стебли, листву, плоды, семена, клубни или луковицы, или в место (почву или песок) произрастания защищаемых растений. Предлагаемые соединения можно также наносить на посевной материал для защиты семян и рассады от возбудителей болезни.

Нормы внесения заявляемых соединений можно меняться в зависимости от множества факторов окружающей среды и их следует рассчитывать в реальных условиях использования. Защиту листвы обычно можно обеспечить путем ее обработки при норме внесения активного ингредиента от менее чем 1 г/га до 5000 г/га. Защиту семян и рассады обычно можно обеспечить путем их обработки при норме расхода активного ингредиента от 0,1 до 10 г на кг семенного материала.

Следующие испытания демонстрируют эффективность ингибирующего эффекта соединений предлагаемого изобретения на специфичные возбудители болезни растений. Метод защиты растений от возбудителей болезни, используемых в качестве контроля, обеспечиваемый предлагаемыми соединениями, не ограничивается, однако, до этих видов. См. Таблицы A-D характеристических показателей соединений предлагаемого изобретения.

Испытуемые соединения вначале растворяли в ацетоне в количестве до 3% от конечного объема и затем суспендировали при концентрации 200 млн$^{-1}$ в очищенной воде, содержащей 250 млн$^{-1}$ поверхностно-активного вещества Trem ® 014 (сложные эфиры многоатомных спиртов). Полученные суспензии затем использовали в следующих испытаниях.

Испытание A

Испытуемую суспензию распыляли на всходы пшеницы до стекания ее с

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

поверхности растений. На следующий день растения инокулировали спорами Erysiphe graminis f. Sp. Tritici, (возбудитель настоящей мучнистой росы пшеницы) и инкубировали в ростовой камере при температуре 20°С в течение 7 дней, после чего производили оценку степени повреждения болезнью.

Испытание B

Испытуемую суспензию распыляли на всходы пшеницы до стекания ее с поверхности растений. На следующий день растения инокулировали порошком со спорами Puccinia recondita (возбудитель листовой ржавчины пшеницы) и инкубировали в насыщенной влагой атмосфере при температуре 20°С в течение 24 часов. Затем растения инкубировали в ростовой камере, при температуре 20°С в течени 6 дней после чего производили оценку степени повреждения болезнью.

Испытание C

Испытуемую суспензию распыляли на рисовые всходы до стекания ее с поверхности растений. На следующий день растения инокулировали суспензией, содержащей споры Pyricularia oryzae (возбудитель пирикуляриоза риса) и инкубировали в насыщенной влагой атмосфере при температуре 27°С в течение 24 часов. Затем растения инкубировали в ростовой камере, при температуре 30°С в течение 5 дней после чего производили оценку степени повреждения болезнью.

Испытание D

Испытуемую суспензию распыляли на рассаду томатов до стекания ее с поверхности растений. На следующий день растения инокулировали суспензией, содержащей споры Phytophthora infestans (возбудитель бурой фитофторозной гнили картофеля и томатов) и инкубировали в насыщенной влагой атмосфере при температуре 20°С в течение 24 часов. Затем растения инкубировали в ростовой камере при температуре 20°С в течение 5 дней после чего производили оценку степени повреждения болезнью.

Испытание E

Испытуемую суспензию распыляли на саженцы винограда до стекания ее с поверхности растений. На следующий день растения инокулировали суспензией, содержащей споры Plasmopara viticola (возбудитель ложной мучнистой росы виноградной лозы) и инкубировали в насыщенной влагой атмосфере при температуре 20°С в течение 24 часов. Затем растения инкубировали в ростовой камере при температуре 20°С в течение 6 дней. Затем растения инкубировали в насыщенной влагой атмосфере при температуре 20°С в течение 24 часов после чего производили оценку степени повреждения болезнью.

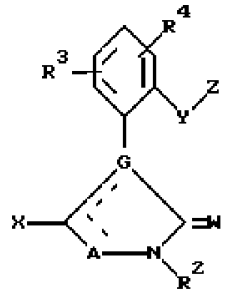
Испытание F

Испытуемую суспензию распыляли на огуречные всходы до стекания ее с поверхности растений. На следующий день растения инокулировали суспензией, содержащей споры Botrytis cinerea (возбудитель серой гнили урожая многих сельскохозяйственных растений) и инкубировали в насыщенной влагой атмосфере при температуре 20°С в течение 48 часов. Затем растения инкубировали в ростовой камере при температуре 20°С в течение 5 дней, после чего производили оценку степени повреждения болезнью.

Результаты испытаний соединений, указанных в таблицах A-E, приведены в табл. 1. В указанной таблице оценка 100 свидетельствует о 100% эффекте в борьбе с болезнями культурных растений, а оценка 0 свидетельствует об отсутствии эффекта (относительно контроля).

Формула изобретения:

1. Циклические амиды формулы I



где A - O или N;

G - C или N, при условии, что когда G означает C, то A означает O, и свободная двойная связь имеется у радикала G, а если G означает N, то A имеет значение N и свободная двойная связь имеется у радикала A;

W - O и S;

X - O R^1; $S(O)_mR^1$ или галоген;

R^1 - C_1-C_6-алкил, C_1-C_6-галогеналкил, C_2-C_6-алкенил, C_2-C_6-алкинил;

R^2 - H или C_1-C_6-алкил;

R^3 - H, галоген, нитро, C_1-C_6-алкил, C_1-C_6-галогеналкил, C_2-C_6-алкенил, C_2-C_6-алкинил или C_1-C_6-алкокси;

R^4 - H или C_1-C_6-алкил или C_1-C_6-алкокси;

Y означает -O-; $S(O)_n$-; $-CR^6=CR^6-$; $-C\equiv C-$, $-CHR^6O-$; $-OCHR^6-$; $-CHR^6S(O)_n$; $-CHR^6O-N=C(R^7)-$; $-(R^7)C=N-OCH(R^6)-$; $-CHR^6OC(=O)N(R^{15})-$; или прямую связь, причем направленность указанной связи Y такова, что ее фрагмент, изображенный слева, связан с фенильным ядром, а фрагмент, изображенный справа, связан с радикалом Z;

R^6 независимо означает H или C_1-C_3-алкил;

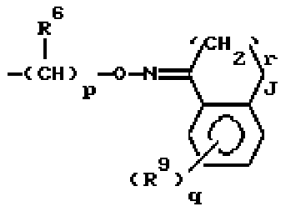
R^7 - H, C_1-C_6-алкил, C_1-C_6-галогеналкил, C_1-C_6-алкокси, C_3-C_6-циклоалкил или циано;

Z - C_1-C_{10}-алкил или C_2-C_6-алкенил, каждый из которых может быть замещен R^8, или Z - C_3-C_8-циклоалкил или фенил, каждый из которых может быть замещен одним из радикалов R^9, R^{10}, или одновременно как радикалом R^9, так и R^{10}, либо Z - пирролил, пиразолил, тиенил, тиазолил, изотиазолил, тиадизолил, фуранил, оксазолил, изоксазолил, оксадиазолил, пиридинил, пиримидинил, пиразинил, триазинил, 4,5-дигидро-1,2,4-триазинил, индолил, бензофуранил, 2,3-дигидробензофуранил, бензооксазолил, бензотиазолил, бензо[b]тиофенил, хинолинил, хиноксалинил, циннолинил, 1,3-бензодиоксолил,

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

3,4-дигидро2H-1-бензотиопиранил, тиазоло[2,3-c][1,2,4]-триазолил, тиазоло [3,2-b][1,2,4]триазолил или [1,2,4]триазоло[1,5-a]пиримидинил, каждый необязательно замещен одним из R^9 и R^{10} или как R^9, так и R^{10}; либо Y и Z, взятые вместе, образуют



или R^3, Y и Z, взятые вместе с фенильным кольцом, образуют нафталиновое кольцо, которое может быть замещено в любом кольце свободно перемещающимся радикалом R^4;

J означает $-CH_2-$;

R^8 означает группу, выбранную из 1 - 6 атомов галогена, C_1-C_6-алкокси, циано или фенила;

R^9 означает группу, выбранную из 1 - 2 атомов галогена, C_1-C_6-алкила, C_1-C_6-галогеналкила, C_1-C_6-алкокси, C_1-C_6-галогеналкокси, C_2-C_6-алкенила, C_2-C_6-алкинила, C_1-C_6-алкилтио-, C_1-C_6-алкилсульфинила, C_1-C_6-алкилсульфонина, C_3-C_6-циклоалкила, $CO_2(C_1$-C_6-алкила), N-(C_1-C_6-алкила)$_2$, $-C(R^{18})=NOR^{17}$, циано или нитро, либо R^9 - фенил, бензил, бензоил, фенокси, пиридинил, пиридинилокси, тиенил, тиенилокси, фуранил или пиримидинилокси, каждый из которых может быть замещен одним из радикалов R^{11}, R^{12} либо как R^{11}, так и R^{12};

R^{10} - галоген, C_1-C_4-алкил, C_1-C_4-галогеналкил, C_1-C_4-алкокси, нитро или циано;

R^{11} и R^{12} каждый независимо - галоген, C_1-C_4-алкил, C_1-C_4-галогеналкил, C_1-C_4-алкокси, C_1-C_4-галогеналкокси, нитро или циано;

R^{15} - C_1-C_3-алкил;

R^{17} и R^{18} каждый независимо - C_1-C_3-алкил или фенил, возможно замещенный галогеном или C_1-C_4-алкилом;

m = 0,1 или 2;

n = 0;

q каждый независимо 0 или 1;

p и r = 1;

при условии, что (a) если A-N, G-N, $X\text{-}S(O)_mR^1$, m = 0, то Y и Z, взятые вместе, имеют иное значение, чем алкил, галогеналкил или алкокси,

или их сельскохозяйственно пригодные соли.

2. Соединение по п.1, где W означает O; R^1 - C_1-C_3-алкил или C_1-C_3-галогеналкил, Y означает -O-; -CH= CH-; $-CH_2O-$; $-OCH_2-$; $-CH_2S(O)_n$; $CH_2O\text{-}N=C(R^7)$-; $-CH_2OC(O)N(CH_3)$- или прямую связь.

3. Соединение по п.2, где X - OR^1, R^1 - C_1-C_3-алкил, R^3 и R^4 каждый - водород, R^7 - водород, C_1-C_3-алкил или C_1-C_3-галогеналкил и Z - фенил, пиридинил, пиримидинил, тиазолил, тиадиазолил или тиенил, каждый из которых может быть замещен одним из радикалов R^9, R^{10} либо как радикалом R^9, так и R^{10}.

4. Соединение по п.2, гле X - OR^1, R^1 - C_1-C_3-алкил, R^3 - метил, R^4 - H, R^7 - H, C_1-C_3-алкил, C_1-C_3-галогеналкил и Z - фенил, пиридинил, пиримидинил, тиазолил, тиадиазолил или тиенил, каждый из которых может быть замещен одним из радикалов R^9, R^{10} либо как радикалом R^9, так и R^{10}.

5. Соединение по п.3, где A означает O, G - C, Y означает -O-; CH_2O-; $-OCH_2-$ или $-CH_2O\text{-}N=C(R^7)$- и R^7 - H, C_1-C_2-алкил или C_1-C_2-галогеналкил.

6. Соединение по п.3, где A - N, G - N, Y означает -O-; $-CH_2O$-; $-OCH_2$ или $-CH_2O\text{-}N=C(R^7)$- и R^7 - H, C_1-C_2-алкил или C_1-C_2-галогеналкил.

7. Соединение по п. 5, где R^1 - метил, R^2 - метил и Z фенил, возможно замещенный одним из радикалов R^9, R^{10} либо как радикалом R^9, так и R^{10}.

8. Соединение по п. 6, где R^1 - метил, R^2 метил и Z - фенил, возможно замещенный одним из радикалов R^9, R^{10} либо как радикалом R^9, так и R^{10}.

9. Соединение по п.8, где Z - фенил или замещенный фенил, выбранный из группы, включающей 2-Br-Ph; 2,4-диCl-Ph; 2-CF_3-Ph; 2-I-Ph; 2-F-Ph; 3,5-ди- CF_3-Ph; 2-Cl-Ph; 2,4,6-три-Cl-Ph; 4-Cl-Ph; 3-F-Ph; 4-CF_3-Ph; 3,4-ди-Cl-Ph; 3,5 -ди-Cl-Ph; 3-CF_3-Ph; 3,4-ди-CF_3-Ph; 4-Br-Ph; 4-F-Ph; и 3-Cl-Ph.

10. Фунгицидная композиция, включающая активный ингредиент и по меньшей мере один компонент, выбранный из (a) поверхностно-активного вещества, (b) органического растворителя и (c) по меньшей мере одного твердого или жидкого наполнителя, отличающаяся тем, что в качестве активного ингредиента она содержит эффективное количество соединения по п.1.

11. Способ борьбы с болезнями растений, вызванных фитопатогенными грибами, включающий нанесение на растение, или участок его поверхности, или всходы активного соединения, отличающийся тем, что в качестве активного соединения используют соединение по п.1 в эффективном количестве.

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

Таблица 1

Соединения формулы I, где G–C; W–O; R_3=R_4–H; Y=CH_2ON=$C(CH_3)$; Z–3-CF_3-Ph, свободная двойная связь у радикала G и R^2–Me

X	A	X	A	X	A	X	A
MeO	O	MeS	O	MeO	S	MeS	S
EtO	O	EtS	O	EtO	S	EtS	S
н-PrO	O	н-PrS	O	н-PrO	S	н-PrS	S

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

$H_2C=CHCH_2O$	O	$H_2C=CHCH_2S$	O	$H_2C=CHCH_2O$	S	$H_2C=CHCH_2S$	S
$HC\equiv CCH_2O$	O	$HC\equiv CCH_2S$	O	$HC\equiv CCH_2O$	S	$HC\equiv CCH_2S$	S
CF_3O	O	CF_3S	O	CF_3O	S	CF_3S	S
(циклопропил)O	O	(циклопропил)S	O	(циклопропил)O	S	(циклопропил)S	S
R^2–Et							
X	A	X	A	X	A	X	A
MeO	O	MeS	O	MeO	S	MeS	S
EtO	O	EtS	O	EtO	S	EtS	S
н-PrO	O	н-PrS	O	н-PrO	S	н-PrS	S
$H_2C=CHCH_2O$	O	$H_2C=CHCH_2S$	O	$H_2C=CHCH_2O$	S	$H_2C=CHCH_2S$	S
$HC\equiv CCH_2O$	O	$HC\equiv CCH_2S$	O	$HC\equiv CCH_2O$	S	$HC\equiv CCH_2S$	S
CF_3O	O	CF_3S	O	CF_3O	S	CF_3S	S
(циклопропил)O	O	(циклопропил)S	O	(циклопропил)O	S	(циклопропил)S	S
R^2–н-Pr							
X	A	X	A	X	A	X	A
MeO	O	MeS	O	MeO	S	MeS	S
EtO	O	EtS	O	EtO	S	EtS	S
н-PrO	O	н-PrS	O	н-PrO	S	н-PrS	S
$H_2C=CHCH_2O$	O	$H_2C=CHCH_2S$	O	$H_2C=CHCH_2O$	S	$H_2C=CHCH_2S$	S
$HC\equiv CCH_2O$	O	$HC\equiv CCH_2S$	O	$HC\equiv CCH_2O$	S	$HC\equiv CCH_2S$	S
CF_3O	O	CF_3S	O	CF_3O	S	CF_3S	S
(циклопропил)O	O	(циклопропил)S	O	(циклопропил)O	S	(циклопропил)S	S
R^2–H							
X	A	X	A	X	A	X	A
MeO	O	MeS	O	MeO	S	MeS	S
EtO	O	EtS	O	EtO	S	EtS	S
н-PrO	O	н-PrS	O	н-PrO	S	н-PrS	S
$H_2C=CHCH_2O$	O	$H_2C=CHCH_2S$	O	$H_2C=CHCH_2O$	S	$H_2C=CHCH_2S$	S
$HC\equiv CCH_2O$	O	$HC\equiv CCH_2S$	O	$HC\equiv CCH_2O$	S	$HC\equiv CCH_2S$	S

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

CF_3O	O	CF_3S	O	CF_3O	S	CF_3S	S
(циклопропил)O	O	(циклопропил)S	O	(циклопропил)O	S	(циклопропил)S	S

R^2=Me

X	A	X	A	X	A	X	A
MeO	NH	MeS	NH	MeO	NMe	MeS	NMe
EtO	NH	EtS	NH	EtO	NMe	EtS	NMe
н-PrO	NH	н-PrS	NH	н-PrO	NMe	н-PrS	NMe
$H_2C=CHCH_2O$	NH	$H_2C=CHCH_2S$	NH	$H_2C=CHCH_2O$	NMe	$H_2C=CHCH_2S$	NMe
$HC\equiv CCH_2O$	NH	$HC\equiv CCH_2S$	NH	$HC\equiv CCH_2O$	NMe	$HC\equiv CCH_2S$	NMe
CF_3O	NH	CF_3S	NH	CF_3O	NMe	CF_3S	NMe
(циклопропил)O	NH	(циклопропил)S	NH	(циклопропил)O	NMe	(циклопропил)S	NMe

R^2=H

X	A	X	A	X	A	X	A
MeO	NH	MeS	NH	MeO	NMe	MeS	NMe
EtO	NH	EtS	NH	EtO	NMe	EtS	NMe
н-PrO	NH	н-PrS	NH	н-PrO	NMe	н-PrS	NMe
$H_2C=CHCH_2O$	NH	$H_2C=CHCH_2S$	NH	$H_2C=CHCH_2O$	NMe	$H_2C=CHCH_2S$	NMe
$HC\equiv CCH_2O$	NH	$HC\equiv CCH_2S$	NH	$HC\equiv CCH_2O$	NMe	$HC\equiv CCH_2S$	NMe
CF_3O	NH	CF_3S	NH	CF_3O	NMe	CF_3S	NMe
(циклопропил)O	NH	(циклопропил)S	NH	(циклопропил)O	NMe	(циклопропил)S	NMe

Таблица 2

Соединения формулы I, где: G=N; W=O; R^3=R^4=H; Y=$CH_2ON=C(CH_3)$; Z=3-CF_3-Ph, свободная двойная связь у радикала A и

R^2=Me

X	A	X	A	X	A	X	A
MeO	N	MeS	N	MeO	CH	MeO	CH
EtO	N	EtS	N	EtO	CH	EtO	CH
н-PrO	N	н-PrS	N	н-PrO	CH	н-PrO	CH
$H_2C=CHCH_2O$	N	$H_2C=CHCH_2S$	N	$H_2C=CHCH_2O$	CH	$H_2C=CHCH_2O$	CH
$HC\equiv CCH_2O$	N	$HC\equiv CCH_2S$	N	$HC\equiv CCH_2O$	CH	$HC\equiv CCH_2O$	CH

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

CF_3O	N	CF_3S	N	CF_3O	CH	CF_3O	CH
(циклопропил)O	N	(циклопропил)S	N	(циклопропил)O	CH	(циклопропил)O	CH

R^2–Et

X	A	X	A	X	A	X	A
MeO	N	MeS	N	MeO	CH	MeO	CH
EtO	N	EtS	N	EtO	CH	EtO	CH
н-PrO	N	н-PrS	N	н-PrO	CH	н-PrO	CH
$H_2C=CHCH_2O$	N	$H_2C=CHCH_2S$	N	$H_2C=CHCH_2O$	CH	$H_2C=CHCH_2O$	CH
$HC\equiv CCH_2O$	N	$HC\equiv CCH_2S$	N	$HC\equiv CCH_2O$	CH	$HC\equiv CCH_2O$	CH
CF_3O	N	CF_3S	N	CF_3O	CH	CF_3O	CH
(циклопропил)O	N	(циклопропил)S	N	(циклопропил)O	CH	(циклопропил)O	CH

R^2–н-Pr

X	A	X	A	X	A	X	A
MeO	N	MeS	N	MeO	CH	MeO	CH
EtO	N	EtS	N	EtO	CH	EtO	CH
н-PrO	N	н-PrS	N	н-PrO	CH	н-PrO	CH
$H_2C=CHCH_2O$	N	$H_2C=CHCH_2S$	N	$H_2C=CHCH_2O$	CH	$H_2C=CHCH_2O$	CH
$HC\equiv CCH_2O$	N	$HC\equiv CCH_2S$	N	$HC\equiv CCH_2O$	CH	$HC\equiv CCH_2O$	CH
CF_3O	N	CF_3S	N	CF_3O	CH	CF_3O	CH
(циклопропил)O	N	(циклопропил)S	N	(циклопропил)O	CH	(циклопропил)O	CH

R^2–H

X	A	X	A	X	A	X	A
MeO	N	MeS	N	MeO	CH	MeO	CN
EtO	N	EtS	N	EtO	CH	EtO	CN
н-PrO	N	н-PrS	N	н-PrO	CH	н-PrO	CN
$H_2C=CHCH_2O$	N	$H_2C=CHCH_2S$	N	$H_2C=CHCH_2O$	CH	$H_2C=CHCH_2O$	CN
$HC\equiv CCH_2O$	N	$HC\equiv CCH_2S$	N	$HC\equiv CCH_2O$	CH	$HC\equiv CCH_2O$	CN
CF_3O	N	CF_3S	N	CF_3O	CH	CF_3O	CN
(циклопропил)O	N	(циклопропил)S	N	(циклопропил)O	CH	(циклопропил)O	CN

R^2–Me

X	A	X	A	X	A	X	A

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

MeO	CMe	MeS	CMe	MeO	CEt	MeO	NMe
EtO	CMe	EtS	CMe	EtO	CEt	EtO	NMe
н-PrO	CMe	н-PrS	CMe	н-PrO	CEt	н-PrO	NMe
$H_2C=CHCH_2O$	CMe	$H_2C=CHCH_2S$	CMe	$H_2C=CHCH_2O$	CEt	$H_2C=CHCH_2O$	NMe
$HC\equiv CCH_2O$	CMe	$HC\equiv CCH_2S$	CMe	$HC\equiv CCH_2O$	CEt	$HC\equiv CCH_2O$	NMe
CF_3O	CMe	CF_3S	CMe	CF_3O	CEt	CF_3O	NMe
(циклопропил)O	CMe	(циклопропил)S	CMe	(циклопропил)O	CEt	(циклопропил)O	NMe

R^2–H

X	A	X	A	X	A	X	A
MeO	CEt	MeS	CEt	MeO	CMe	Me0	CMe
EtO	CEt	EtS	CEt	EtO	CMe	Et0	CMe
н-PrO	CEt	н-PrS	CEt	н-PrO	CMe	н-Pr0	CMe
$H_2C=CHCH_2O$	CEt	$H_2C=CHCH_2S$	CEt	$H_2C=CHCH_2O$	CMe	$H_2C=CHCH_20$	CMe
$HC\equiv CCH_2O$	CEt	$HC\equiv CCH_2S$	CEt	$HC\equiv CCH_2O$	CMe	$HC\equiv CCH_20$	CMe
CF_3O	CEt	CF_3S	CEt	CF_3O	CMe	CF_30	CMe
(циклопропил)O	CEt	(циклопропил)S	CEt	(циклопропил)O	CMe	(циклопропил)O	CMe

Таблица 3

Соединения формулы I, где G – C; W – O; R^3= R^4 – H; Y – CH_20,

Z –2-Me-Ph, свободная двойная связь у радикала G и

R^2–Me

X	A	X	A	X	A	X	A
MeO	O	MeS	O	MeO	S	MeS	S
EtO	O	EtS	O	EtO	S	EtS	S
н-PrO	O	н-PrS	O	н-PrO	S	н-PrS	S
$H_2C=CHCH_2O$	O	$H_2C=CHCH_2S$	O	$H_2C=CHCH_2O$	S	$H_2C=CHCH_2S$	S
$HC\equiv CCH_2O$	O	$HC\equiv CCH_2S$	O	$HC\equiv CCH_2O$	S	$HC\equiv CCH_2S$	S
CF_3O	O	CF_3S	O	CF_3O	S	CF_3S	S
(циклопропил)O	O	(циклопропил)S	O	(циклопропил)O	S	(циклопропил)S	S

R^2–Et

X	A	X	A	X	A	X	A
MeO	O	MeS	O	MeO	S	MeS	S

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

EtO	O	EtS	O	EtO	S	EtS	S
н-PrO	O	н-PrS	O	н-PrO	S	н-PrS	S
$H_2C=CHCH_2O$	O	$H_2C=CHCH_2S$	O	$H_2C=CHCH_2O$	S	$H_2C=CHCH_2S$	S
$HC\equiv CCH_2O$	O	$HC\equiv CCH_2S$	O	$HC\equiv CCH_2O$	S	$HC\equiv CCH_2S$	S
CF_3O	O	CF_3S	O	CF_3O	S	CF_3S	S
(циклопропил)O	O	(циклопропил)S	O	(циклопропил)O	S	(циклопропил)S	S

R^2=н-Pr

X	A	X	A	X	A	X	A
MeO	O	MeS	O	MeO	S	MeS	S
EtO	O	EtS	O	EtO	S	EtS	S
н-PrO	O	н-PrS	O	н-PrO	S	н-PrS	S
$H_2C=CHCH_2O$	O	$H_2C=CHCH_2S$	O	$H_2C=CHCH_2O$	S	$H_2C=CHCH_2S$	S
$HC\equiv CCH_2O$	O	$HC\equiv CCH_2S$	O	$HC\equiv CCH_2O$	S	$HC\equiv CCH_2S$	S
CF_3O	O	CF_3S	O	CF_3O	S	CF_3S	S
(циклопропил)O	O	(циклопропил)S	O	(циклопропил)O	S	(циклопропил)S	S

R^2=H

X	A	X	A	X	A	X	A
MeO	O	MeS	O	MeO	S	MeS	S
EtO	O	EtS	O	EtO	S	EtS	S
н-PrO	O	н-PrS	O	н-PrO	S	н-PrS	S
$H_2C=CHCH_2O$	O	$H_2C=CHCH_2S$	O	$H_2C=CHCH_2O$	S	$H_2C=CHCH_2S$	S
$HC\equiv CCH_2O$	O	$HC\equiv CCH_2S$	O	$HC\equiv CCH_2O$	S	$HC\equiv CCH_2S$	S
CF_3O	O	CF_3S	O	CF_3O	S	CF_3S	S
(циклопропил)O	O	(циклопропил)S	O	(циклопропил)O	S	(циклопропил)S	S

R^2=Me

X	A	X	A	X	A	X	A
MeO	NH	MeS	NH	MeO	NMe	MeS	NMe
EtO	NH	EtS	NH	EtO	NMe	EtS	NMe
н-PrO	NH	н-PrS	NH	н-PrO	NMe	н-PrS	NMe
$H_2C=CHCH_2O$	NH	$H_2C=CHCH_2S$	NH	$H_2C=CHCH_2O$	NMe	$H_2C=CHCH_2S$	NMe
$HC\equiv CCH_2O$	NH	$HC\equiv CCH_2S$	NH	$HC\equiv CCH_2O$	NMe	$HC\equiv CCH_2S$	NMe
CF_3O	NH	CF_3S	NH	CF_3O	NMe	CF_3S	NMe
(циклопропил)O	NH	(циклопропил)S	NH	(циклопропил)O	NMe	(циклопропил)S	NMe

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

R^2–H

X	A	X	A	X	A	X	A
MeO	NH	MeS	NH	MeO	NMe	MeS	NMe
EtO	NH	EtS	NH	EtO	NMe	EtS	NMe
н-PrO	NH	н-PrS	NH	н-PrO	NMe	н-PrS	NMe
$H_2C=CHCH_2O$	NH	$H_2C=CHCH_2S$	NH	$H_2C=CHCH_2O$	NMe	$H_2C=CHCH_2S$	NMe
$HC\equiv CCH_2O$	NH	$HC\equiv CCH_2S$	NH	$HC\equiv CCH_2O$	NMe	$HC\equiv CCH_2S$	NMe
CF_3O	NH	CF_3S	NH	CF_3O	NMe	CF_3S	NMe
(циклопропил)O	NH	(циклопропил)S	NH	(циклопропил)O	NMe	(циклопропил)S	NMe

Таблица 4

Соединения формулы I, где G–N; W–O;R^3=R^4–H; Y–CH_20; Z–2-Me-Ph, свободная двойная связь у радикала A и

R^2–Me

X	A	X	A	X	A	X	A
MeO	N	MeS	N	MeO	CH	MeO	CN
EtO	N	EtS	N	EtO	CH	EtO	CN
н-PrO	N	н-PrS	N	н-PrO	CH	н-PrO	CN
$H_2C=CHCH_2O$	N	$H_2C=CHCH_2S$	N	$H_2C=CHCH_2O$	CH	$H_2C=CHCH_2O$	CN
$HC\equiv CCH_2O$	N	$HC\equiv CCH_2S$	N	$HC\equiv CCH_2O$	CH	$HC\equiv CCH_2O$	CN
CF_3O	N	CF_3S	N	CF_3O	CH	CF_3O	CN
(циклопропил)O	N	(циклопропил)S	N	(циклопропил)O	CH	(циклопропил)O	CN

R^2–Et

X	A	X	A	X	A	X	A
MeO	N	MeS	N	MeO	CH	MeO	CN
EtO	N	EtS	N	EtO	CH	EtO	CN
н-PrO	N	н-PrS	N	н-PrO	CH	н-PrO	CN
$H_2C=CHCH_2O$	N	$H_2C=CHCH_2S$	N	$H_2C=CHCH_2O$	CH	$H_2C=CHCH_2O$	CN
$HC\equiv CCH_2O$	N	$HC\equiv CCH_2S$	N	$HC\equiv CCH_2O$	CH	$HC\equiv CCH_2O$	CN
CF_3O	N	CF_3S	N	CF_3O	CH	CF_3O	CN
(циклопропил)O	N	(циклопропил)S	N	(циклопропил)O	CH	(циклопропил)O	CN

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

R^2=н-Pr

X	A	X	A	X	A	X	A
MeO	N	MeS	N	MeO	CH	MeO	CH
EtO	N	EtS	N	EtO	CH	EtO	CH
н-PrO	N	н-PrS	N	н-PrO	CH	н-PrO	CH
$H_2C=CHCH_2O$	N	$H_2C=CHCH_2S$	N	$H_2C=CHCH_2O$	CH	$H_2C=CHCH_2O$	CH
$HC\equiv CCH_2O$	N	$HC\equiv CCH_2S$	N	$HC\equiv CCH_2O$	CH	$HC\equiv CCH_2O$	CH
CF_3O	N	CF_3S	N	CF_3O	CH	CF_3O	CH
(циклопропил)	N	(циклопропил)	N	(циклопропил)	CH	(циклопропил)	CH

R^2=H

X	A	X	A	X	A	X	A
MeO	N	MeS	N	MeO	CH	MeO	CH
EtO	N	EtS	N	EtO	CH	EtO	CH
н-PrO	N	н-PrS	N	н-PrO	CH	н-PrO	CH
$H_2C=CHCH_2O$	N	$H_2C=CHCH_2S$	N	$H_2C=CHCH_2O$	CH	$H_2C=CHCH_2O$	CH
$HC\equiv CCH_2O$	N	$HC\equiv CCH_2S$	N	$HC\equiv CCH_2O$	CH	$HC\equiv CCH_2O$	CH
CF_3O	N	CF_3S	N	CF_3O	CH	CF_3O	CH
(циклопропил)O	N	(циклопропил)S	N	(циклопропил)O	CH	(циклопропил)O	CH

R^2=Me

X	A	X	A	X	A	X	A
MeO	C^{Me}	MeS	C^{Me}	MeO	CEt	MeO	CEt
EtO	C^{Me}	EtS	C^{Me}	EtO	CEt	EtO	CEt
н-PrO	C^{Me}	н-PrS	C^{Me}	н-PrO	CEt	н-PrO	CEt
$H_2C=CHCH_2O$	C^{Me}	$H_2C=CHCH_2S$	C^{Me}	$H_2C=CHCH_2O$	CEt	$H_2C=CHCH_2O$	CEt
$HC\equiv CCH_2O$	C^{Me}	$HC\equiv CCH_2S$	C^{Me}	$HC\equiv CCH_2O$	CEt	$HC\equiv CCH_2O$	CEt
CF_3O	C^{Me}	CF_3S	C^{Me}	CF_3O	CEt	CF_3O	CEt

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

(циклопропил)O	CMe	(циклопропил)S	CMe	(циклопропил)O	CEt	(циклопропил)O	CEt

R^2–H

X	A	X	A	X	A	X	A
MeO	CEt	MeS	CEt	MeO	CMe	Me0	CMe
EtO	CEt	EtS	CEt	EtO	CMe	Et0	CMe
н-PrO	CEt	н-PrS	CEt	н-PrO	CMe	н-Pr0	CMe
$H_2C=CHCH_2O$	CEt	$H_2C=CHCH_2S$	CEt	$H_2C=CHCH_2O$	CMe	$H_2C=CHCH_20$	CMe
$HC\equiv CCH_2O$	CEt	$HC\equiv CCH_2S$	CEt	$HC\equiv CCH_2O$	CMe	$HC\equiv CCH_20$	CMe
CF_3O	CEt	CF_3S	CEt	CF_3O	CMe	CF_30	CMe
(циклопропил)O	CEt	(циклопропил)S	CEt	(циклопропил)O	CMe	(циклопропил)O	CMe

Таблица 5

Соединения формулы I, где G–C; W–S; R^3=R^4–H; Y–$CH_20N=C(CH_3)$; Z–3-CF_3-Ph, свободная двойная связь у радикала G и

R^2–Me

X	A	X	A	X	A	X	A
MeO	O	MeS	O	MeO	S	MeS	S
EtO	O	EtS	O	EtO	S	EtS	S
н-PrO	O	н-PrS	O	н-PrO	S	н-PrS	S
$H_2C=CHCH_2O$	O	$H_2C=CHCH_2$	O	$H_2C=CHCH_2$	S	$H_2C=CHCH_2S$	S
$HC\equiv CCH_2O$	O	$HC\equiv CCH_2S$	O	$HC\equiv CCH_2O$	S	$HC\equiv CCH_2S$	S
CF_3O	O	CF_3S	O	CF_3O	S	CF_3S	S
MeO	NH	MeO	NMe	MeO	NEt	MeS	NPr

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

Таблица 6

Соединения формулы I, где A–N; G–N; W–S; R^3=R^4–H; Y–CH_20N=C(Me), Z–3-CF_3-Ph, свободная двойная связь у радикала A и R^2–Me

X	X	X	X
MeO	EtO	н-Pro	H_2C=$CHCH_2O$
$HC{\equiv}CCH_2O$	CF_3O	OCF_2H	OCH_2CF_3
(циклопропил)O	MeS	EtS	н-PrO
H_2C=$CHCH_2S$	$HC{\equiv}CCH_2S$	CF_3S	(циклопропил)S

Таблица 7

Соединения формулы I, где G–C; W–S; R^3=R^4–H; Y–CH_20; Z–2-Me-Ph, свободная двойная связь у радикала радикалом G и R^2–Me

X	A	X	A	X	A	X	A
MeO	O	MeS	O	MeO	S	MeS	S
EtO	O	EtS	O	EtO	S	EtS	S
н-PrO	O	н-PrS	O	н-PrO	S	н-PrS	S
H_2C=$CHCH_2$	O	H_2C=$CHCH_2$	O	H_2C=$CHCH_2$	S	H_2C=$CHCH_2$	S
$HC{\equiv}CCH_2O$	O	$HC{\equiv}CCH_2S$	O	$HC{\equiv}CCH_2O$	S	$HC{\equiv}CCH_2S$	S
CF_3O	O	CF_3S	O	CF_3O	S	CF_3S	S
MeO	NH	MeO	NMe	MeO	NEt	MeS	NPr

Таблица 8

Соединения формулы I, где A–N; G–N; W–S; R^3=R^4–H; Y–CH_20;

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

Z−2-Me-Ph, свободная двойная связь у радикала A и

R^2−Me.

X	X	X	X
MeO	EtO	н-Pro	$H_2C=CHCH_2O$
$HC\equiv CCH_2O$	CF_3O	OCF_2H	OCH_2CF_3
(циклопропил)O	MeS	EtS	н-PrO
$H_2C=CHCH_2S$	$HC\equiv CCH_2S$	CF_3S	(циклопропил)S

Таблица 9.

Соединения формулы I, где G−C; A−W=O; X−MeO; R^2−Me; Y−$CH_20N=C(Me)$, Z−3-CF_3-Ph, свободная двойная связь у радикала G и

R^3	R^4	R^3	R^4	R^3	R^4
3-F	H	5-NO_2	H	3-F	5-F
5-F	H	6-Me	H	3-Cl	5-Cl
3-Cl	H	3-Me	H	4-Me	5-Cl
4-Cl	H	4-MeO	H	3-F	5-CF_3
5-Br	H	5-CF_3O	H	3-Cl	5-NO_2
4-CF_3	H	5-аллил	H	6-CF_3O	H
5-CN	H	5-пропаргил	H	5-Pr	H

Таблица 10.

Соединения формулы I, где A−N; G−N; W−O; X−MeO; R^2−Me; Y−$CH_20N=C(Me)$; Z=3-CF_3-Ph, свободная двойная связь у радикала A и

R^3	R^4	R^3	R^4	R^3	R^4
3-F	H	5-NO_2	H	3-F	5-F
5-F	H	6-Me	H	3-Cl	5-Cl
3-Cl	H	3-Me	H	4-Me	5-Cl
4-Cl	H	4-MeO	H	3-F	5-CF_3
5-Br	H	5-CF_3O	H	3-Cl	5-NO_2
4-CF_3	H	5-аллил	H	6-CF_3O	H
5-CN	H	5-пропаргил	H	5-Pr	H

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

Таблица 11

Соединения формулы I, где A=N; G=N; W=O; X=MeO; R^2=Me, свободная двойная связь у радикала G и

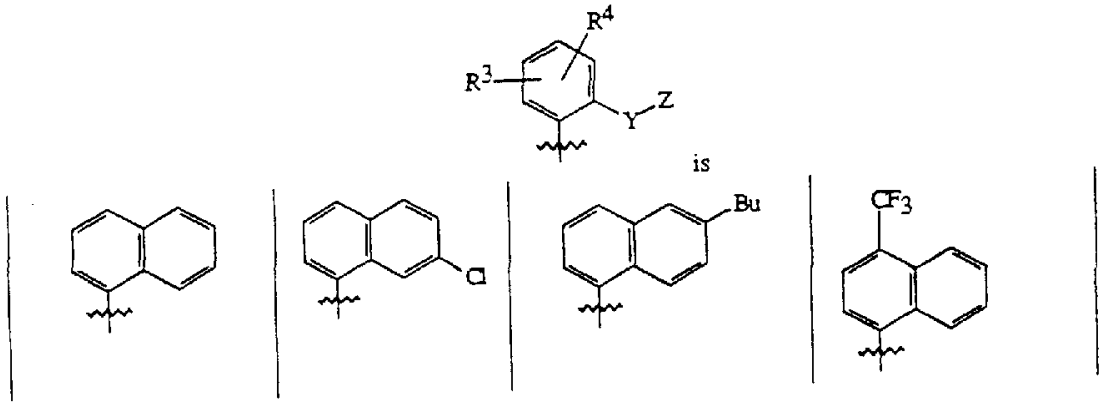
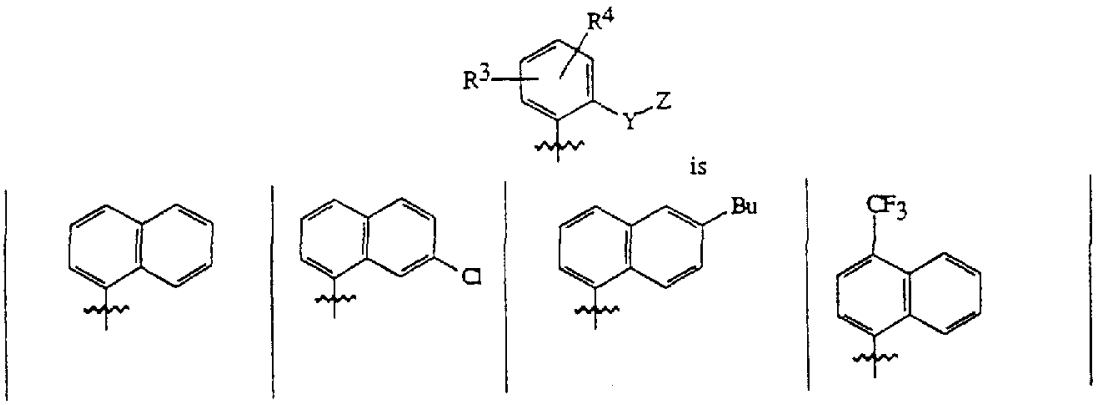


Таблица 12

Соединения формулы I, где A=N; G=N; W=O; X=MeO; R^2=Me, свободная двойная связь у радикала A и



RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

Таблица 13

Соединения формулы I, где G–C; W–O; X–MeO; R^2–Me; R^3=R^4–H; Z–Ph, свободная двойная связь у радикала G и

A–O

Y	Y	Y	Y	Y
S	CH_2CH_2	CH(Me)O	SCH_2	CH(Me)=N-O
CH=CH	CH(Me)CH_2	OCH_2	SCH(Me)	O-N=CH
C(Me)=CH	CH_2CH(Me)	OCH(Me)	CH_2O-N=CH	O-N=C(Me)
C=C(Me)	CH(Me)CH(Me)	CH_2S	CH_2O-N=C(Me)	CH_2OC(=O)
C(Me)=C(Me)	CH_2O	CH(Me)S	CH=N-O	CH(Me)OC(=O)
прямая связь	C≡C			

A–S

Y	Y	Y	Y	Y
S	CH_2CH_2	CH(Me)O	SCH_2	CH(Me)=N-O
CH=CH	CH(Me)CH_2	OCH_2	SCH(Me)	O-N=CH
C(Me)=CH	CH_2CH(Me)	OCH(Me)	CH_2O-N=CH	O-N=C(Me)
C=C(Me)	CH(Me)CH(Me)	CH_2S	CH_2O-N=C(Me)	CH_2OC(=O)
C(Me)=C(Me)	CH_2O	CH(Me)S	CH=N-O	CH(Me)OC(=O)
прямая связь	C≡C			

A–NMe

Y	Y	Y	Y	Y
S	CH_2CH_2	CH(Me)O	SCH_2	CH(Me)=N-O
CH=CH	CH(Me)CH_2	OCH_2	SCH(Me)	O-N=CH
C(Me)=CH	CH_2CH(Me)	OCH(Me)	CH_2O-N=CH	O-N=C(Me)
C=C(Me)	CH(Me)CH(Me)	CH_2S	CH_2O-N=C(Me)	CH_2OC(=O)
C(Me)=C(Me)	CH_2O	CH(Me)S	CH=N-O	CH(Me)OC(=O)

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

прямая связь	C≡C				

Таблица 14

Соединения формулы I, где G–N; W–O; X–MeO; R^2–Me; R^3=R^4–H; Z–Ph, свободная двойная связь у радикала A и

A–N

Y	Y	Y	Y	Y
S	CH_2CH_2	CH(Me)O	SCH_2	CH(Me)=N-O
CH=CH	CH(Me)CH_2	OCH_2	SCH(Me)	O-N=CH
C(Me)=CH	CH_2CH(Me)	OCH(Me)	CH_2O-N=CH	O-N=C(Me)
C=C(Me)	CH(Me)CH(Me)	CH_2S	CH_2O-N=C(Me)	CH_2OC(=O)
C(Me)=C(Me)	CH_2O	CH(Me)S	CH=N-O	CH(Me)OC(=O)
прямая связь	C≡C			

A–S

Y	Y	Y	Y	Y
S	CH_2CH_2	CH(Me)O	SCH_2	CH(Me)=N-O
CH=CH	CH(Me)CH_2	OCH_2	SCH(Me)	O-N=CH
C(Me)=CH	CH_2CH(Me)	OCH(Me)	CH_2O-N=CH	O-N=C(Me)
C=C(Me)	CH(Me)CH(Me)	CH_2S	CH_2O-N=C(Me)	CH_2OC(=O)
C(Me)=C(Me)	CH_2O	CH(Me)S	CH=N-O	CH(Me)OC(=O)
прямая связь	C≡C			

A–NMe

Y	Y	Y	Y	Y
S	CH_2CH_2	CH(Me)O	SCH_2	CH(Me)=N-O
CH=CH	CH(Me)CH_2	OCH_2	SCH(Me)	O-N=CH
C(Me)=CH	CH_2CH(Me)	OCH(Me)	CH_2O-N=CH	O-N=C(Me)

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

C=C(Me)	CH(Me)CH(Me)	CH_2S	CH_2O-N=C(Me)	$CH_2OC(=O)$
C(Me)=C(Me)	CH_2O	CH(Me)S	CH=N-O	CH(Me)OC(=O)
прямая связь	C≡C			

Таблица 15

Соединения формулы I, где G–C; W–O; X–MeO; R^2–Me; R^3=R^4=H; свободная двойная связь у радикала G и

Y–O, A–O

Z	Z	Z	Z
гексил	4-октенил	3-пентенил	4-PhO-2-пиридинил
$PhO(CH_2)_3$	$PhCH=CHCH_2$	$PhC\equiv CCH_2$	(циклопропил)CH_2
2-Br-Ph	2-Me-Ph	2-Et-Ph	6-(2-CN-PhO)-4-пиримидинил
2-CN-Ph	2-F-Ph	2-Cl-Ph	6-PhO-4-пиримидинил
2,4-диCl-Ph	2-Me-4-Cl-Ph	2,4,6-триCl-Ph	4-EtO-2- пиримидинил
2-CF_3-Ph	4-Ph-Ph	3-PhO-Ph	3-(пиримидинилокси)-Ph
2-I-Ph	3-(2-Cl-PhO)Ph	3-(2-Et-PhO)-Ph	4-(2-тиенил)Ph
циклогексил	3,5-диCl-Ph	6-Ph-2-пиридинил	3-(2-пиримидинилокси)Ph
4-NO_2-Ph	3,5-диCF$_3$-Ph	6-PhO-4-пиридинил	3-пиридинил
$PhCH_2CH_2$	2-MeO-Ph	3-тиенилокси-Ph	4-(3-Cl-2-пиридинилокси)-Ph
(2-CN-Ph)CH_2	2,6-диMeO-Ph	3(4-CF_3-PhO)Ph	4-(PhO)-циклогексил
CF_3CH_2	3-(2-CN-PhO)-Ph	3-(2-Me-PhO)-Ph	5-PhO-2-пиримидинил
2-MeS-Ph	5-PhO-3-пиридинил	5-PhO-2-пиридинил	6-(2-NO_2-PhO-4-пиримидинил
изо-Bu	6-Me-2-пиридинил	6-PhO-2-пиридинил	6-(2-Cl-PhO)-4-пиримидинил
2-CF_3O-Ph	3-CF_3O-Ph	6-CF_3-2-пиридинил	6-(2-CF_3-PhO)-4-пиримидинил
4-Me-Ph	4-Br-Ph	6-PhO-3-пиридинил	4,6-диMeO-2-пиримидинил
4-Cl-Ph	3-Et-Ph	2-пиримидинил	4,6-диMe-2-пиримидинил

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

3-Me-Ph	4-Et-Ph	4-пиримидинил	6-CF_3-4-пиримидинил
3-CF_3-Ph	4-MeO-Ph	4-MeO-2-пиримидинил	4-CF_3-2-пиридинил
3-Cl-2-Me-Ph	4-трет-Bu-Ph	4-Me-2-пиримидинил	4-CF_3-2-пиримидинил
3-трет-Bu-Ph	4-CN-Ph	6-MeO-4-пиримидинил	2-пиридинил
3-NO_2-Ph	4-NO2-Ph	2-Ph-4-тиазолил	6-CF_3-2-пиразинил
3-F-Ph	4-F-Ph	3-MeO-6-пиридазинил	5-CF_3-3-пиридинил
4-CF_3-Ph	3Ph-Ph	5-Me-2-фуранил	3-MeO-2-пиридинил
3,4-диCl-Ph	3,4-диMe-Ph	2,5-диMe-3-тиенил	5-CN-2-пиридинил
3,4-диCF$_3$-Ph	3,5-диMe-Ph	3-OCF_2H-Ph	6-Me-2-пиридинил
3-EtO-Ph	3-MeS-Ph	4-OCF_2H-Ph	

Y=CH_2O, A=O

Z	Z	Z	Z
гексил	4-октенил	3-пентенил	4-PhO-2-пиридинил
PhO$(CH_2)_3$	PhCH=$CHCH_2$	PhC≡CCH_2	(циклопропил)CH_2
2-Br-Ph	2-Me-Ph	2-Et-Ph	6-(2-CN-PhO)-4-пиримидинил
2-CN-Ph	2-F-Ph	2-Cl-Ph	6-PhO-4-пиримидинил
2,4-диCl-Ph	2-Me-4-Cl-Ph	2,4,6-триCl-Ph	4-EtO-2- пиримидинил
2-CF_3-Ph	4-Ph-Ph	3-PhO-Ph	3-(пиримидинилокси)-Ph
2-I-Ph	3-(2-Cl-PhO)Ph	3-(2-Et-PhO)-Ph	4-(2-тиенил)Ph
циклогексил	3,5-диCl-Ph	6-Ph-2-пиридинил	3-(2-пиримидинилокси)Ph
4-NO_2-Ph	3,5-диCF$_3$-Ph	6-PhO-4-пиридинил	3-пиридинил
$PhCH_2CH_2$	2-MeO-Ph	3-тиенилокси-Ph	4-(3-Cl-2-пиридинилокси)-Ph
(2-CN-Ph)CH_2	2,6-диMeO-Ph	3(4-CF_3-PhO)Ph	4-(PhO)-циклогексил
CF_3CH_2	3-(2-CN-PhO)-Ph	3-(2-Me-PhO)-Ph	5-PhO-2-пиримидинил
2-MeS-Ph	5-PhO-3-пиридинил	5-PhO-2-пиридинил	6-(2-NO_2-PhO-4-пиримидинил
изо-Bu	6-Me-2-пиридинил	6-PhO-2-пиридинил	6-(2-Cl-PhO)-4-пиримидинил
2-CF_3O-Ph	3-CF_3O-Ph	6-CF_3-2-пиридинил	6-(2-CF_3-PhO)-4-пиримидинил

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

4-Me-Ph	4-Br-Ph	6-PhO-3-пиридинил	4,6-диMeO-2-пиримидинил
4-Cl-Ph	3-Et-Ph	2-пиримидинил	4,6-диMe-2-пиримидинил
3-Me-Ph	4-Et-Ph	4-пиримидинил	6-CF_3-4-пиримидинил
3-CF_3-Ph	4-MeO-Ph	4-MeO-2-пиримидинил	4-CF_3-2-пиридинил
3-Cl-2-Me-Ph	4-трет-Bu-Ph	4-Me-2-пиримидинил	4-CF_3-2-пиримидинил
3-трет-Bu-Ph	4-CN-Ph	6-MeO-4-пиримидинил	2-пиридинил
3-NO_2-Ph	4-NO2-Ph	2-Ph-4-тиазолил	6-CF_3-2-пиразинил
3-F-Ph	4-F-Ph	3-MeO-6-пиридазинил	5-CF_3-3-пиридинил
4-CF_3-Ph	3Ph-Ph	5-Me-2-фуранил	3-MeO-2-пиридинил
3,4-диCl-Ph	3,4-диMe-Ph	2,5-диMe-3-тиенил	5-CN-2-пиридинил
3,4-диCF$_3$-Ph	3,5-диMe-Ph	3-OCF_2H-Ph	6-Me-2-пиридинил
3-EtO-Ph	3-MeS-Ph	4-OCF_2H-Ph	

Y$^-$O, A$^-$NMe

Z	Z	Z	Z
гексил	4-октенил	3-пентенил	4-PhO-2-пиридинил
PhO$(CH_2)_3$	PhCH=$CHCH_2$	PhC≡CCH_2	(циклопропил)CH_2
2-Br-Ph	2-Me-Ph	2-Et-Ph	6-(2-CN-PhO)-4-пиримидинил
2-CN-Ph	2-F-Ph	2-Cl-Ph	6-PhO-4-пиримидинил
2,4-диCl-Ph	2-Me-4-Cl-Ph	2,4,6-триCl-Ph	4-EtO-2- пиримидинил
2-CF_3-Ph	4-Ph-Ph	3-PhO-Ph	3-(пиримидинилокси)-Ph
2-I-Ph	3-(2-Cl-PhO)Ph	3-(2-Et-PhO)-Ph	4-(2-тиенил)Ph
циклогексил	3,5-диCl-Ph	6-Ph-2-пиридинил	3-(2-пиримидинилокси)Ph
4-NO_2-Ph	3,5-диCF$_3$-Ph	6-PhO-4-пиридинил	3-пиридинил
$PhCH_2CH_2$	2-MeO-Ph	3-тиенилокси-Ph	4-(3-Cl-2-пиридинилокси)-Ph
(2-CN-Ph)CH_2	2,6-диMeO-Ph	3(4-CF_3-PhO)Ph	4-(PhO)-циклогексил
CF_3CH_2	3-(2-CN-PhO)-Ph	3-(2-Me-PhO)-Ph	5-PhO-2-пиримидинил
2-MeS-Ph	5-PhO-3-пиридинил	5-PhO-2-пиридинил	6-(2-NO_2-PhO-4-пиримидинил

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

изо-Bu	6-Me-2-пиридинил	6-PhO-2-пиридинил	6-(2-Cl-PhO)-4-пиримидинил
2-CF_3O-Ph	3-CF_3O-Ph	6-CF_3-2-пиридинил	6-(2-CF_3-PhO)-4-пиримидинил
4-Me-Ph	4-Br-Ph	6-PhO-3-пиридинил	4,6-диMeO-2-пиримидинил
4-Cl-Ph	3-Et-Ph	2-пиримидинил	4,6-диMe-2-пиримидинил
3-Me-Ph	4-Et-Ph	4-пиримидинил	6-CF_3-4-пиримидинил
3-CF_3-Ph	4-MeO-Ph	4-MeO-2-пиримидинил	4-CF_3-2-пиридинил
3-Cl-2-Me-Ph	4-трет-Bu-Ph	4-Me-2-пиримидинил	4-CF_3-2-пиримидинил
3-трет-Bu-Ph	4-CN-Ph	6-MeO-4-пиримидинил	2-пиридинил
3-NO_2-Ph	4-NO2-Ph	2-Ph-4-тиазолил	6-CF_3-2-пиразинил
3-F-Ph	4-F-Ph	3-MeO-6-пиридазинил	5-CF_3-3-пиридинил
4-CF_3-Ph	3Ph-Ph	5-Me-2-фуранил	3-MeO-2-пиридинил
3,4-диCl-Ph	3,4-диMe-Ph	2,5-диMe-3-тиенил	5-CN-2-пиридинил
3,4-диCF$_3$-Ph	3,5-диMe-Ph	3-OCF_2H-Ph	6-Me-2-пиридинил
3-EtO-Ph	3-MeS-Ph	4-OCF_2H-Ph	

Y=CH_2O, A=NMe

Z	Z	Z	Z
гексил	4-октенил	3-пентенил	4-PhO-2-пиридинил
$PhO(CH_2)_3$	$PhCH=CHCH_2$	$PhC\equiv CCH_2$	(циклопропил)CH_2
2-Br-Ph	2-Me-Ph	2-Et-Ph	6-(2-CN-PhO)-4-пиримидинил
2-CN-Ph	2-F-Ph	2-Cl-Ph	6-PhO-4-пиримидинил
2,4-диCl-Ph	2-Me-4-Cl-Ph	2,4,6-триCl-Ph	4-EtO-2- пиримидинил
2-CF_3-Ph	4-Ph-Ph	3-PhO-Ph	3-(пиримидинилокси)-Ph
2-I-Ph	3-(2-Cl-PhO)Ph	3-(2-Et-PhO)-Ph	4-(2-тиенил)Ph
циклогексил	3,5-диCl-Ph	6-Ph-2-пиридинил	3-(2-пиримидинилокси)Ph
4-NO_2-Ph	3,5-диCF$_3$-Ph	6-PhO-4-пиридинил	3-пиридинил
$PhCH_2CH_2$	2-MeO-Ph	3-тиенилокси-Ph	4-(3-Cl-2-пиридинилокси)-Ph
(2-CN-Ph)CH_2	2,6-диMeO-Ph	3(4-CF_3-PhO)Ph	4-(PhO)-циклогексил

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

CF_3CH_2	3-(2-CN-PhO)-Ph	3-(2-Me-PhO)-Ph	5-PhO-2-пиримидинил
2-MeS-Ph	5-PhO-3-пиридинил	5-PhO-2-пиридинил	6-(2-NO_2-PhO-4-пиримидинил
изо-Bu	6-Me-2-пиридинил	6-PhO-2-пиридинил	6-(2-Cl-PhO)-4-пиримидинил
2-CF_3O-Ph	3-CF_3O-Ph	6-CF_3-2-пиридинил	6-(2-CF_3-PhO)-4-пиримидинил
4-Me-Ph	4-Br-Ph	6-PhO-3-пиридинил	4,6-диMeO-2-пиримидинил
4-Cl-Ph	3-Et-Ph	2-пиримидинил	4,6-диMe-2-пиримидинил
3-Me-Ph	4-Et-Ph	4-пиримидинил	6-CF_3-4-пиримидинил
3-CF_3-Ph	4-MeO-Ph	4-MeO-2-пиримидинил	4-CF_3-2-пиридинил
3-Cl-2-Me-Ph	4-трет-Bu-Ph	4-Me-2-пиримидинил	4-CF_3-2-пиримидинил
3-трет-Bu-Ph	4-CN-Ph	6-MeO-4-пиримидинил	2-пиридинил
3-NO_2-Ph	4-NO2-Ph	2-Ph-4-тиазолил	6-CF_3-2-пиразинил
3-F-Ph	4-F-Ph	3-MeO-6-пиридазинил	5-CF_3-3-пиридинил
4-CF_3-Ph	3Ph-Ph	5-Me-2-фуранил	3-MeO-2-пиридинил
3,4-диCl-Ph	3,4-диMe-Ph	2,5-диMe-3-тиенил	5-CN-2-пиридинил
3,4-диCF$_3$-Ph	3,5-диMe-Ph	3-OCF_2H-Ph	6-Me-2-пиридинил
3-EtO-Ph	3-MeS-Ph	4-OCF_2H-Ph	

Таблица 16

Соединения формулы I, где A–O; G–C; W–O; X–MeO; R^2–Me; R^3=R^4–H, свободная двойная связь у радикала G и Y–CH_2ON=C(CH_3)

Z	Z	Z	Z
гексил	4-октенил	3-пентенил	4-PhO-2-пиридинил
$PhO(CH_2)_3$	$PhCH=CHCH_2$	$PhC\equiv CCH_2$	(циклопропил)CH_2
2-Br-Ph	2-Me-Ph	2-Et-Ph	6-(2-CN-PhO)-4-пиримидинил
2-CN-Ph	2-F-Ph	2-Cl-Ph	6-PhO-4-пиримидинил
2,4-диCl-Ph	2-Me-4-Cl-Ph	2,4,6-триCl-Ph	4-EtO-2- пиримидинил
2-CF_3-Ph	4-Ph-Ph	3-PhO-Ph	3-(пиримидинилокси)-Ph

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

2-I-Ph	3-(2-Cl-PhO)Ph	3-(2-Et-PhO)-Ph	4-(2-тиенил)Ph
циклогексил	3,5-диCl-Ph	6-Ph-2-пиридинил	3-(2-пиримидинилокси)Ph
4-NO_2-Ph	3,5-диCF$_3$-Ph	6-PhO-4-пиридинил	3-пиридинил
PhCH$_2$CH$_2$	2-MeO-Ph	3-тиенилокси-Ph	4-(3-Cl-2-пиридинилокси)-Ph
(2-CN-Ph)CH$_2$	2,6-диMeO-Ph	3(4-CF$_3$-PhO)Ph	4-(PhO)-циклогексил
CF$_3$CH$_2$	3-(2-CN-PhO)-Ph	3-(2-Me-PhO)-Ph	5-PhO-2-пиримидинил
2-MeS-Ph	5-PhO-3-пиридинил	5-PhO-2-пиридинил	6-(2-NO_2-PhO-4-пиримидинил
изо-Bu	6-Me-2-пиридинил	6-PhO-2-пиридинил	6-(2-Cl-PhO)-4-пиримидинил
2-CF$_3$O-Ph	3-CF$_3$O-Ph	6-CF$_3$-2-пиридинил	6-(2-CF$_3$-PhO)-4-пиримидинил
4-Me-Ph	4-Br-Ph	6-PhO-3-пиридинил	4,6-диMeO-2-пиримидинил
4-Cl-Ph	3-Et-Ph	2-пиримидинил	4,6-диMe-2-пиримидинил
3-Me-Ph	4-Et-Ph	4-пиримидинил	6-CF$_3$-4-пиримидинил
3-CF$_3$-Ph	4-MeO-Ph	4-MeO-2-пиримидинил	4-CF$_3$-2-пиридинил
3-Cl-2-Me-Ph	4-трет-Bu-Ph	4-Me-2-пиримидинил	4-CF$_3$-2-пиримидинил
3-трет-Bu-Ph	4-CN-Ph	6-MeO-4-пиримидинил	2-пиридинил
3-NO_2-Ph	4-NO2-Ph	2-Ph-4-тиазолил	6-CF$_3$-2-пиразинил
3-F-Ph	4-F-Ph	3-MeO-6-пиридазинил	5-CF$_3$-3-пиридинил
4-CF$_3$-Ph	3Ph-Ph	5-Me-2-фуранил	3-MeO-2-пиридинил
3,4-диCl-Ph	3,4-диMe-Ph	2,5-диMe-3-тиенил	5-CN-2-пиридинил
3,4-диCF$_3$-Ph	3,5-диMe-Ph	3-OCF$_2$H-Ph	6-Me-2-пиридинил
3-EtO-Ph	3-MeS-Ph	4-OCF$_2$H-Ph	

Таблица 17

Соединения формулы I, где A$-$NMe;G$-$C; W$-$O; X$-$MeO; R$^2-$Me; R^3=R$^4-$H, свободная двойная связь у радикала G и Y$-$CH$_2$ON=C(CH$_3$)

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

Z	Z	Z	Z
гексил	4-октенил	3-пентенил	4-PhO-2-пиридинил
$PhO(CH_2)_3$	$PhCH=CHCH_2$	$PhC\equiv CCH_2$	(циклопропил)CH_2
2-Br-Ph	2-Me-Ph	2-Et-Ph	6-(2-CN-PhO)-4-пиримидинил
2-CN-Ph	2-F-Ph	2-Cl-Ph	6-PhO-4-пиримидинил
2,4-диCl-Ph	2-Me-4-Cl-Ph	2,4,6-триCl-Ph	4-EtO-2- пиримидинил
2-CF_3-Ph	4-Ph-Ph	3-PhO-Ph	3-(пиримидинилокси)-Ph
2-I-Ph	3-(2-Cl-PhO)Ph	3-(2-Et-PhO)-Ph	4-(2-тиенил)Ph
циклогексил	3,5-диCl-Ph	6-Ph-2-пиридинил	3-(2-пиримидинилокси)Ph
4-NO_2-Ph	3,5-диCF$_3$-Ph	6-PhO-4-пиридинил	3-пиридинил
$PhCH_2CH_2$	2-MeO-Ph	3-тиенилокси-Ph	4-(3-Cl-2-пиридинилокси)-Ph
(2-CN-Ph)CH_2	2,6-диMeO-Ph	3(4-CF_3-PhO)Ph	4-(PhO)-циклогексил
CF_3CH_2	3-(2-CN-PhO)-Ph	3-(2-Me-PhO)-Ph	5-PhO-2-пиримидинил
2-MeS-Ph	5-PhO-3-пиридинил	5-PhO-2-пиридинил	6-(2-NO_2-PhO-4-пиримидинил
изо-Bu	6-Me-2-пиридинил	6-PhO-2-пиридинил	6-(2-Cl-PhO)-4-пиримидинил
2-CF_3O-Ph	3-CF_3O-Ph	6-CF_3-2-пиридинил	6-(2-CF_3-PhO)-4-пиримидинил
4-Me-Ph	4-Br-Ph	6-PhO-3-пиридинил	4,6-диMeO-2-пиримидинил
4-Cl-Ph	3-Et-Ph	2-пиримидинил	4,6-диMe-2-пиримидинил
3-Me-Ph	4-Et-Ph	4-пиримидинил	6-CF_3-4-пиримидинил
3-CF_3-Ph	4-MeO-Ph	4-MeO-2-пиримидинил	4-CF_3-2-пиридинил
3-Cl-2-Me-Ph	4-трет-Bu-Ph	4-Me-2-пиримидинил	4-CF_3-2-пиримидинил
3-трет-Bu-Ph	4-CN-Ph	6-MeO-4-пиримидинил	2-пиридинил
3-NO_2-Ph	4-NO2-Ph	2-Ph-4-тиазолил	6-CF_3-2-пиразинил
3-F-Ph	4-F-Ph	3-MeO-6-пиридазинил	5-CF_3-3-пиридинил
4-CF_3-Ph	3Ph-Ph	5-Me-2-фуранил	3-MeO-2-пиридинил
3,4-диCl-Ph	3,4-диMe-Ph	2,5-диMe-3-тиенил	5-CN-2-пиридинил
3,4-диCF$_3$-Ph	3,5-диMe-Ph	3-OCF_2H-Ph	6-Me-2-пиридинил
3-EtO-Ph	3-MeS-Ph	4-OCF_2H-Ph	

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

Таблица 18

Соединения формулы I, где A–N; G–N; W–O; X–MeO; R^2–Me; R^3=R^4–H, свободная двойная связь у радикала A и Y–$CH_2ON=C(CH_3)$

Z	Z	Z	Z
гексил	4-октенил	3-пентенил	4-PhO-2-пиридинил
$PhO(CH_2)_3$	$PhCH=CHCH_2$	$PhC\equiv CCH_2$	(циклопропил)CH_2
2-Br-Ph	2-Me-Ph	2-Et-Ph	6-(2-CN-PhO)-4-пиримидинил
2-CN-Ph	2-F-Ph	2-Cl-Ph	6-PhO-4-пиримидинил
2,4-диCl-Ph	2-Me-4-Cl-Ph	2,4,6-триCl-Ph	4-EtO-2- пиримидинил
2-CF_3-Ph	4-Ph-Ph	3-PhO-Ph	3-(пиримидинилокси)-Ph
2-I-Ph	3-(2-Cl-PhO)Ph	3-(2-Et-PhO)-Ph	4-(2-тиенил)Ph
циклогексил	3,5-диCl-Ph	6-Ph-2-пиридинил	3-(2-пиримидинилокси)Ph
4-NO_2-Ph	3,5-диCF$_3$-Ph	6-PhO-4-пиридинил	3-пиридинил
$PhCH_2CH_2$	2-MeO-Ph	3-тиенилокси-Ph	4-(3-Cl-2-пиридинилокси)-Ph
(2-CN-Ph)CH_2	2,6-диMeO-Ph	3(4-CF_3-PhO)Ph	4-(PhO)-циклогексил
CF_3CH_2	3-(2-CN-PhO)-Ph	3-(2-Me-PhO)-Ph	5-PhO-2-пиримидинил
2-MeS-Ph	5-PhO-3-пиридинил	5-PhO-2-пиридинил	6-(2-NO_2-PhO-4-пиримидинил
изо-Bu	6-Me-2-пиридинил	6-PhO-2-пиридинил	6-(2-Cl-PhO)-4-пиримидинил
2-CF_3O-Ph	3-CF_3O-Ph	6-CF_3-2-пиридинил	6-(2-CF_3-PhO)-4-пиримидинил
4-Me-Ph	4-Br-Ph	6-PhO-3-пиридинил	4,6-диMeO-2-пиримидинил
4-Cl-Ph	3-Et-Ph	2-пиримидинил	4,6-диMe-2-пиримидинил
3-Me-Ph	4-Et-Ph	4-пиримидинил	6-CF_3-4-пиримидинил
3-CF_3-Ph	4-MeO-Ph	4-MeO-2-пиримидинил	4-CF_3-2-пиридинил
3-Cl-2-Me-Ph	4-трет-Bu-Ph	4-Me-2-пиримидинил	4-CF_3-2-пиримидинил

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

3-трет-Bu-Ph	4-CN-Ph	6-MeO-4-пиримидинил	2-пиридинил
3-NO_2-Ph	4-NO2-Ph	2-Ph-4-тиазолил	6-CF_3-2-пиразинил
3-F-Ph	4-F-Ph	3-MeO-6-пиридазинил	5-CF_3-3-пиридинил
4-CF_3-Ph	3Ph-Ph	5-Me-2-фуранил	3-MeO-2-пиридинил
3,4-диCl-Ph	3,4-диMe-Ph	2,5-диMe-3-тиенил	5-CN-2-пиридинил
3,4-диCF_3-Ph	3,5-диMe-Ph	3-OCF_2H-Ph	6-Me-2-пиридинил
3-EtO-Ph	3-MeS-Ph	4-OCF_2H-Ph	

$Y^{-}CH_2S$

Z	Z	Z	Z
гексил	4-октенил	3-пентенил	4-PhO-2-пиридинил
$PhO(CH_2)_3$	$PhCH=CHCH_2$	$PhC\equiv CCH_2$	(циклопропил)CH_2
2-Br-Ph	2-Me-Ph	2-Et-Ph	6-(2-CN-PhO)-4-пиримидинил
2-CN-Ph	2-F-Ph	2-Cl-Ph	6-PhO-4-пиримидинил
2,4-диCl-Ph	2-Me-4-Cl-Ph	2,4,6-триCl-Ph	4-EtO-2- пиримидинил
2-CF_3-Ph	4-Ph-Ph	3-PhO-Ph	3-(пиримидинилокси)-Ph
2-I-Ph	3-(2-Cl-PhO)Ph	3-(2-Et-PhO)-Ph	4-(2-тиенил)Ph
циклогексил	3,5-диCl-Ph	6-Ph-2-пиридинил	3-(2-пиримидинилокси)Ph
4-NO_2-Ph	3,5-диCF_3-Ph	6-PhO-4-пиридинил	3-пиридинил
$PhCH_2CH_2$	2-MeO-Ph	3-тиенилокси-Ph	4-(3-Cl-2-пиридинилокси)-Ph
(2-CN-Ph)CH_2	2,6-диMeO-Ph	3(4-CF_3-PhO)Ph	4-(PhO)-циклогексил
CF_3CH_2	3-(2-CN-PhO)-Ph	3-(2-Me-PhO)-Ph	5-PhO-2-пиримидинил
2-MeS-Ph	5-PhO-3-пиридинил	5-PhO-2-пиридинил	6-(2-NO_2-PhO-4-пиримидинил
изо-Bu	6-Me-2-пиридинил	6-PhO-2-пиридинил	6-(2-Cl-PhO)-4-пиримидинил
2-CF_3O-Ph	3-CF_3O-Ph	6-CF_3-2-пиридинил	6-(2-CF_3-PhO)-4-пиримидинил
4-Me-Ph	4-Br-Ph	6-PhO-3-пиридинил	4,6-диMeO-2-пиримидинил
4-Cl-Ph	3-Et-Ph	2-пиримидинил	4,6-диMe-2-пиримидинил
3-Me-Ph	4-Et-Ph	4-пиримидинил	6-CF_3-4-пиримидинил

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

3-CF_3-Ph	4-MeO-Ph	4-MeO-2-пиримидинил	4-CF_3-2-пиридинил
3-Cl-2-Me-Ph	4-трет-Bu-Ph	4-Me-2-пиримидинил	4-CF_3-2-пиримидинил
3-трет-Bu-Ph	4-CN-Ph	6-MeO-4-пиримидинил	2-пиридинил
3-NO_2-Ph	4-NO2-Ph	2-Ph-4-тиазолил	6-CF_3-2-пиразинил
3-F-Ph	4-F-Ph	3-MeO-6-пиридазинил	5-CF_3-3-пиридинил
4-CF_3-Ph	3Ph-Ph	5-Me-2-фуранил	3-MeO-2-пиридинил
3,4-диCl-Ph	3,4-диMe-Ph	2,5-диMe-3-тиенил	5-CN-2-пиридинил
3,4-диCF_3-Ph	3,5-диMe-Ph	3-OCF_2H-Ph	6-Me-2-пиридинил
3-EtO-Ph	3-MeS-Ph	4-OCF_2H-Ph	

Таблица 19

Соединения формулы I, где A–N; G–N; W–O; X–MeO; R^2–Me; R^3=R^4–H, свободная двойная связь у радикала A и

Y–CH_2ON=C(CH)-

Z	Z	Z	Z
2-Me-Ph	3-Me-Ph	3-CF_3-Ph	3-Cl-Ph
4-Cl-Ph	4-CF_3-Ph	2,5-диMe-Ph	3,5-диCl-Ph

Таблица 20

Соединения формулы I, где A–N; G–N; W–O; X–MeO; Z–3-CF_3-Ph; R^2–Me; R^3=R^4–H, свободная двойная связь у радикала A и

Y–CH_2ON=C(R^7)

R^7	R^7	R^7	R^7
CF_3	OCH_2CF_3	Et	н-Pr
Cl	MeO	EtO	MeS

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

Таблица 21

Соединения формулы I, где A–O; G–N; W–O; X–MeO; R^3=R^4–H; Y–CH_2ON=C(R^7), свободная двойная связь у радикала G и R_2–Me,

R^7	Z	R^7	Z
циклопропил	3,4-(OCH_2CH_2O)-Ph	циклопропил	3,4-($OCHFCF_2O$)-Ph
циклопропил	3,4-(OCF_2O)-Ph	циклопропил	Ph
циклопропил	4-CF_3-Ph	циклопропил	3-CF_3-Ph
циклопропил	4-Cl-Ph	циклопропил	3-Cl-Ph
циклопропил	2-Me-Ph	циклопропил	3-OCF_3-Ph
CF_3	3,4-(OCH_2CH_2O)-Ph	CF_3	3,4-($OCHFCF_2O$)-Ph
CF_3	3,4-(OCF_2O)-Ph	CF_3	Ph
CF_3	4-CF_3-Ph	CF_3	3-CF_3-Ph
CF_3	4-Cl-Ph	CF_3	3-Cl-Ph
CF_3	2-Me-Ph	CF_3	3-OCF_3-Ph
Et	3,4-(OCH_2CH_2O)-Ph	Et	3,4-($OCHFCF_2O$)-Ph
Et	3,4-(OCF_2O)-Ph	Et	Ph
Et	4-CF_3-Ph	Et	3-CF_3-Ph
Et	4-Cl-Ph	Et	3-Cl-Ph
Et	2-Me-Ph	Et	3-OCF_3-Ph

Таблица 22

Соединения формулы I, где A=NMe; G–C; W–O; X–MeO; R^3=R^4–H; Y–CH_2ON=C(R^7), свободная двойная связь у радикала G и

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

R_2–Me

R^7	Z	R^7	Z
циклопропил	3,4-(OCH_2CH_2O)-Ph	циклопропил	3,4-($OCHFCF_2O$)-Ph
циклопропил	3,4-(OCF_2O)-Ph	циклопропил	Ph
циклопропил	4-CF_3-Ph	циклопропил	3-CF_3-Ph
циклопропил	4-Cl-Ph	циклопропил	3-Cl-Ph
циклопропил	2-Me-Ph	циклопропил	3-OCF_3-Ph
CF_3	3,4-(OCH_2CH_2O)-Ph	CF_3	3,4-($OCHFCF_2O$)-Ph
CF_3	3,4-(OCF_2O)-Ph	CF_3	Ph
CF_3	4-CF_3-Ph	CF_3	3-CF_3-Ph
CF_3	4-Cl-Ph	CF_3	3-Cl-Ph
CF_3	2-Me-Ph	CF_3	3-OCF_3-Ph
Et	3,4-(OCH_2CH_2O)-Ph	Et	3,4-($OCHFCF_2O$)-Ph
Et	3,4-(OCF_2O)-Ph	Et	Ph
Et	4-CF_3-Ph	Et	3-CF_3-Ph
Et	4-Cl-Ph	Et	3-Cl-Ph
Et	2-Me-Ph	Et	3-OCF_3-Ph

Таблица 23

Соединения формулы I, где A–N; G–N; W–O; X–MeO; R^3=R^4–H; Y–CH_2ON=C(R^7), свободная двойная связь у радикала A и R_2–Me,

R^7	Z	R^7	Z
циклопропил	3,4-(OCH_2CH_2O)-Ph	циклопропил	3,4-($OCHFCF_2O$)-Ph
циклопропил	3,4-(OCF_2O)-Ph	циклопропил	Ph
циклопропил	4-CF_3-Ph	циклопропил	3-CF_3-Ph
циклопропил	4-Cl-Ph	циклопропил	3-Cl-Ph

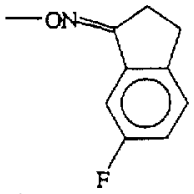
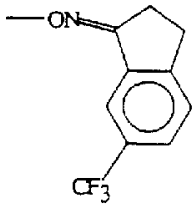
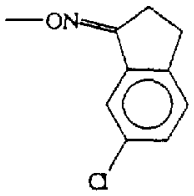
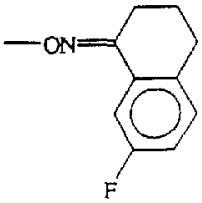
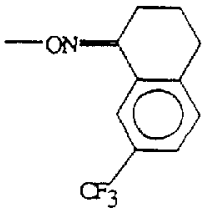
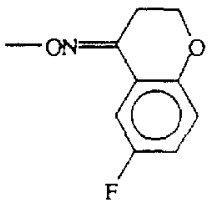
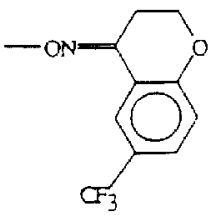
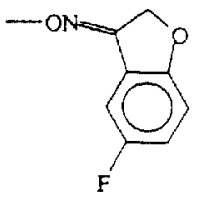
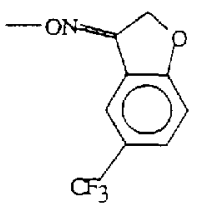
RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

циклопропил	2-Me-Ph	циклопропил	3-OCF_3-Ph
CF_3	3,4-(OCH_2CH_2O)-Ph	CF_3	3,4-($OCHFCF_2O$)-Ph
CF_3	3,4-(OCF_2O)-Ph	CF_3	Ph
CF_3	4-CF_3-Ph	CF_3	3-CF_3-Ph
CF_3	4-Cl-Ph	CF_3	3-Cl-Ph
CF_3	2-Me-Ph	CF_3	3-OCF_3-Ph
Et	3,4-(OCH_2CH_2O)-Ph	Et	3,4-($OCHFCF_2O$)-Ph
Et	3,4-(OCF_2O)-Ph	Et	Ph
Et	4-CF_3-Ph	Et	3-CF_3-Ph
Et	4-Cl-Ph	Et	3-Cl-Ph
Et	2-Me-Ph	Et	3-OCF_3-Ph

Таблица 24

Соединения формулы I, где A–O; G–N; W–O; X–MeO; R^3=R^4–H; свободная двойная связь у радикала G и R_2–Me.

Y-Z	Y-Z	Y-Z
		
		
		

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

Таблица 25

Соединения формулы I, где A–NMe; G–C; W–O; X–MeO; R^3=R^4–H; свободная двойная связь у радикала G и

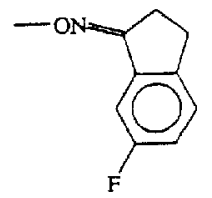
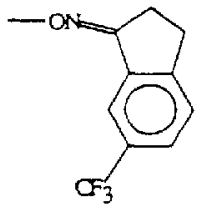
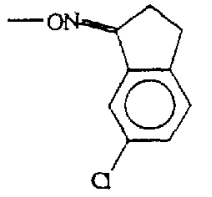
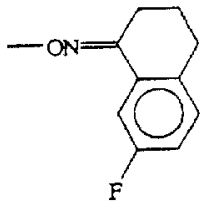
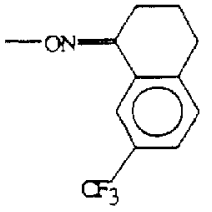
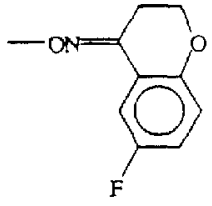
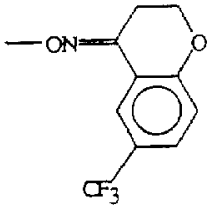
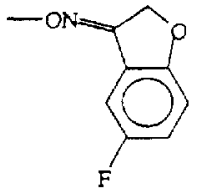
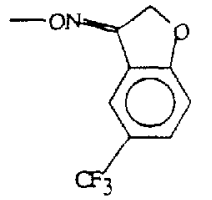
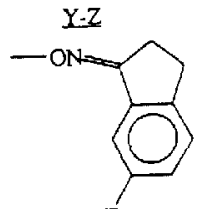
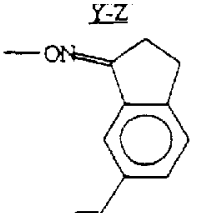
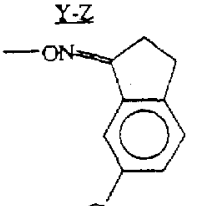
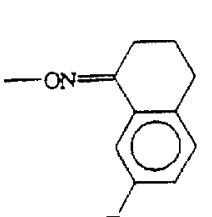
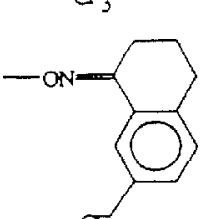
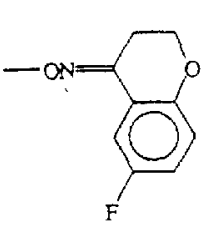
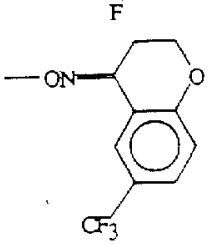
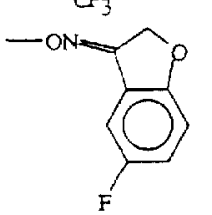
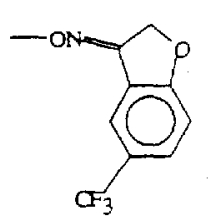
R_2–Me	Y-Z	Y-Z	Y-Z
			
			
			

Таблица 26

Соединения формулы I, где A=N; G–C; W–O; X–MeO; R^3=R^4–H; свободная двойная связь у радикала G и

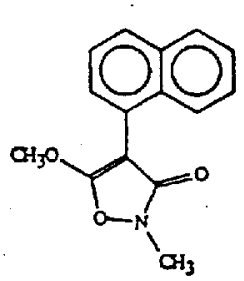
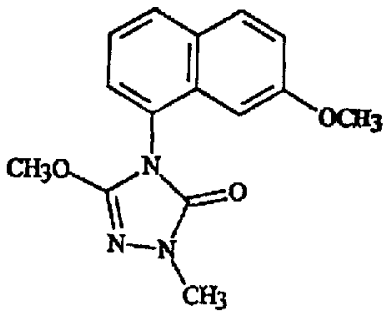
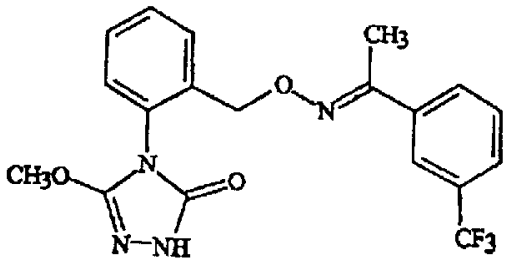
R_2–Me	Y-Z	Y-Z	Y-Z
			
			
			

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

	Активный ингредиент	Разбавитель	ПАВ
Смачиваемые порошки	5-90	0-74	1-10
Масляные суспензии, эмульсии, растворы (в том числе эмульгируемые концентраты)	5-50	40-95	0-15
Порошки	1-25	70-99	0-5
Гранулы, приманки, таблетки	0,01-99	5-99,99	0-15
Высококонцентрированны составы	90-99	0-10	0-2

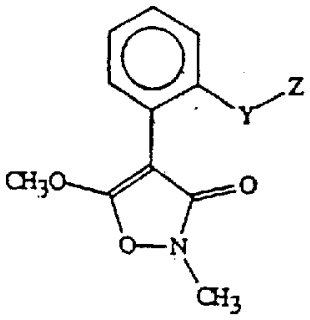
ТАБЛИЦА ПОКАЗАТЕЛЕЙ А

Соединение		т.пл.(°С)
1		117-120
54		180-181
55		160-163

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

ТАБЛИЦА ПОКАЗАТЕЛЕЙ B



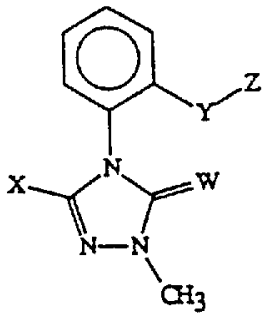
Соединение	Y	Z	Т.пл. (^{o}C)
2	O	(2-MeO-Ph)	масло *
3	O	CH_2-Ph	масло *
4	-	Me	масло *
5	CH_2O	2-Me-Ph	масло *
56	$CH_2ON=C(Me)$	*циклогексил*	масло *
57	$CH_2ON=C(Me)$	5-Me-2-ФУ-ранил	масло *

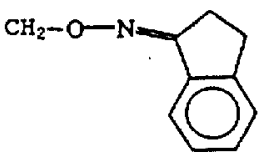
* См. Таблицу индексов D по данным ^{1}H ЯМР-анализа

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

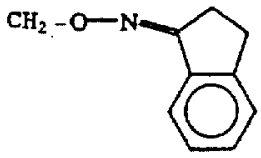
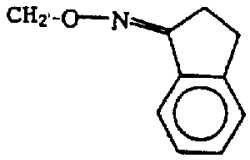
ТАБЛИЦА ПОКАЗАТЕЛЕЙ С



Соединение	W	X	Y	Z	Т.пл., °С
6	0	MeS	0	Ph	129-130
7	0	MeO	0	Me	129-126
8	0	MeO	-	Me	95-97
9	0	MeS	-	Me	95-97
10	0	Cl	-	Me	99-100
11	0	MeO	0	Ph	88-91
12	0	Cl	CH_2O	2-Me-Ph	88-96
13	0	MeO	CH_2O	2-Me-Ph	110-113
14	0	Eto	CH_2O	2-Me-Ph	масло *
15	0	MeS	CH_2O	2-Me-Ph	80-88
16	0	$OCH_2C{\equiv}CH$	CH_2O	2-Me-Ph	122-130
17	0	Cl	$CH_2ON{=}C(Me)$	4-Me-Ph	масло *
18	0	MeO	$CH_2ON{=}C(Me)$	4-Me-Ph	116-118
19	0	MeS	$CH_2ON{=}C(Me)$	4-Me-Ph	масло *
20	O	Cl			масло *

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

21	S	Mes	O	Ph	масло *
22	0	MeO			126-130
23	0	Cl	$CH_2ON=C(H)$	Ph	масло *
24	0	MeS			масло *
25	0	Cl	CH_2O	3-(OPh)-Ph	масло *
26	0	MeO	CH_2O	3-(OPh)-Ph	масло *
27	0	MeO	$CH_2ON=C(Me)$	Ph	101-104
28	O	MeS	CH_2O	3-(OPh)-Ph	95-100
29	0	Cl	CH_2S	2-Me-Ph	106-109
30	0	MeO	CH_2S	2-Me-Ph	115-118
31	0	MeS	CH_2S	2-Me-Ph	82-86
32	0	Cl	CH_2S	2-бензо тиазолил	95-97
33	0	MeO	CH=C	Ph	164-166
34	0	Meo	$CH_2ON=C(Me)$	4-Br- Ph	115-120
35	0	Cl	$CH_2ON=C(Me)$	4-Br-Ph	смола *
36	0	Cl	$CH_2ON=C(Me)$	3-(бензоил)-Ph	масло *
37	0	MeS	$CH_2ON=C(Me)$	4-Br-Ph	117-122
38	0	MeO	CH_2O	3-(бензоил)-Ph	масло *
39	0	Cl	$CH_2=NOCH_2$	4-Cl-Ph	масло *
40	0	Cl	$CH_2ON=C(Me)$	1,3-бензодиоксол-5-ил	масло *
41	0	MeO	$CH=NOCH_2$	4-Cl-Ph	*
42	0	MeO	$CH_2ON=C(Me)$	1,3-бензодиоксол-5-ил	масло *

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

43	0	Cl	O	4-(6-OPh)-1,3-пиримидинил	масло *
44	0	MeO	CH_2S	2-бензтиазолил	95-97
45	0	MeO	$CH_2ON=C(Me)$	2-Me-Ph	масло*
46	0	MeO	$CH_2ON=C(Me)$	4-CF_3-Ph	138-144
47	0	Meo	$CH_2ON=C(CF_3)$	Ph	масло*
48	0	Meo	$CH_2ON=C(Me)$	Ph	масло*
49	0	Meo	$CH_2ON=C(Me)$	3-Me-Ph	масло*
50	0	Meo	$CH_2ON=C(Me)$	4-Meo-Ph	масло*
51	0	Meo	$CH_2ON=C(Me)$	3-Cl-Ph	масло*
52	0	Meo	$CH_2ON=C(Me)$	Ph	масло*
53	0	MeO	$CH=NOCH_2$	2-Me-Ph	масло*
58	0	$OCH_2C\equiv CH$	CH_2O	2-Me-Ph	122-130
59	0	MeO	-	CH_2Br	тв.в-во
60	0	MeO	$CH_2ON=C(Me)$	3-CF_3-Ph	103.5-105.5
61	0	MeO	$CH_2ON=C(CF_3)$	3-CF_3-Ph	масло*
62	0	MeO	$CH_2ON=C(Me)$	2- пиридинил	122-124
63	0	MeO	$CH_2ON=C(Me)$	3- пиридинил	90-109 dec.
64	0	Meo	$CH_2ON=C(Me)$	4- пиридинил	140-142
65	0	Meo	$CH_2ON=C(Me)$	1-Me-3-пирролил	135-137.5
66	0	Meo	$CH_2ON=C(Me)$	2-пиразинил	119-121
67	0	Meo	$CH_2ON=C(Me)$	3,5- диCF_3-Ph	147-149
68	0	MeO	$CH_2ON=C(c-Pr)$	4-Cl-Ph	масло*
69	0	$MeSO_2$	$CH_2ON=C(Me)$	4-CF_3-Ph	50-55
70	0	MeS(O)	$CH_2ON=C(Me)$	4-CF_3-Ph	масло*/ смола
71	0	MeO	$CH_2ON=C(Me)$	6-Me-3-пиридинил	134-136
72	0	MeO	$CH_2ON=C(Me)$	4,6-diMe2-пиримидинил	119-121
73	0	Meo	$CH_2ON=C(Me)$	4-CF_3-2 -пиридинил	144-145

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

74	0	MeO	$CH_2ON=C(Me)$	4-CN-2-пиридинил	120-125
75	0	MeO	$CH_2ON=C(Me)$	4-Ph-2-пиридинил	115-117.5
76	0	MeO	$CH_2ON=C(Me)$	2-тиенил	100-105
77	0	MeO	$CH_2ON=C(Me)$	2-бензофуранил	149-154
78	0	MeO	$CH_2ON=C(Me)$	5-Cl-3-Me-бензо[b]тиофен-2-ил	167-169
79	0	MeO	$CH_2ON=C(Me)$	3,5-ди Cl-Ph	149-153
80	0	MeO	$CH_2ON=C(Me)$	2,4-диMe-5-тиазолил	123-124
81	0	MeO	$CH_2ON=C(Me)$	2- хиноксалинил	225-227
82	0	MeO	$CH_2ON=C(Me)$	3,5-диMe-Ph	масло *
83	0	MeO	$CH_2ON=C(Me)$	3-CN-Ph	смола *
84	0	MeO	$CH_2ON=C(CN)$	3-CF_3-Ph	138-141
85	0	MeO	$CH_2ON=C(Me)$	6-Me-2-CF_3-тиазоло[2,3-c]-1,2,4-триазол-5-ил	157-160
86	0	MeO	$CH_2ON=C(Me)$	2-хинолинил	168-171
87	0	MeO	O	3-[3,5-бис(трифторметил)-фенил]-1,2,4-тиадиазол-5-ил	139.5-141.5
88	0	MeO	$CH_2ON=C(OMe)$	Ph	масло *
89	0	MeO	$CH_2ON=C(Me)$	4-CO_2Me-2-пиридинил	150-151.5
90	0	MeO	$CH_2ON=C(Me)$	5-Me-1-Ph-1H-пиразол-4-ил	45-49
91[a)]	0	F_2CHO	$CH_2ON=C(Me)$	3-CF_3-Ph	масло *
92	0	MeO	CH_2O	2-CN-2-(3-CF_3-Ph)этенил	115-118
93	0	MeO	O	5-Ph-1,3,4-оксадиазол-2-ил	130-132
94	0	MeO	O	5-(4-Me-Ph)-1,3,4-оксадиазол-2-ил	150-151
95	0	MeO	O	5-(4-Cl-Ph)-1,3,4-оксадиазол-2-ил	130-132
96	0	MeO	O	5-(3-MeO-Ph)-1,3,4-оксадиазол-2-ил	108-111
97	0	MeO	O	5-(4-CF_3-Ph)-1,3,4-оксадиазол-2-ил	тв.в-во

а) Соединение содержит 15% по весу 4- [2-(бромметил)фенил]-5--(дифторметокси)-2,4-дигидро -2- метил-3H-1,2,4-триазол-3-она

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

98	O	MeO	O	3-(2-CN-PhO)-Ph	масло	*
99	O	MeO	O	3-(2-NO_2-PhO)-Ph	масло	*
100	O	MeO	O	3-(3-NO_2-2-пиридинил -O)-Ph	масло	*
101	O	MeO	O	3-(3,4-диCl-Ph)-1,2,4-тиадиазол -5- ил	156-158	
102	O	MeO	O	6-(3,5- диCF_3-Ph)-пиримидин -4- ил	168-170	
103	O	MeO	O	3-(2-пиримидинил -O)-Ph	масло	*
104	O	MeO	CH_2S	5,7-диMe-6-Ph-[1,2,4]триазоло-[1,5-a]пиридин-2-ил	155-160	
105	O	MeO	O	3-(3-Br-4-MeO-Ph)-1,2,4-тиадиазол - 5-ил	161-162	
106	O	MeO	O	3-(3-CF_3O-Ph)-1,2,4-тиадиазол- 5- ил	112-113	
107	O	MeO	O	3-(4-HCF_2O-Ph)-1,2,4-тиадиазол	тв.в-во	
108	O	MeO	CH_2O-N=C(CH_3)	4-(CF_3CH_2O)-3-CF_3-Ph	масло	*
109	O	MeO	O	3-(2-Me-PhO)-2-NO_2-Ph	131-133	
110	O	MeO	O	3-c-Pr-1,2,4-тиадиазол-5-ил		*
111	O	MeO	OCH_2	2-Cl-5- тиазолил		*
112	O	MeO	O	3-(3-CN-2-пиридинил-O)-Ph	132-134	
113	O	MeO	O	6-Cl-3- NO_2-2-пиридинил	146-151	
114	O	MeO	O	3-(6-Cl-5-NO_2-4-пиримидинил - O)-Ph	70-74	
115	O	MeO	O	3-(2,6-диCN-Ph-O)-Ph	65-68	
116	O	MeO	O	5-$MeSO_2$-1,3,4-оксадиазол-2-ил		*
117	O	MeO	CH_2S	5-Ph-2- бензоксазолил	55	
118	O	MeO	CH_2S	5- Cl-2- бензотриазолил	тв.в-во	
119	O	MeO	O	3-(4-NO_2-2-CF_3-PhO)-Ph	масло	*
120	O	MeO	O	3-(3-NO_2 -2-тиенил-O)-Ph	масло	*
121	O	MeO	OCH_2	5-Ph-2- оксазолил	150-152	

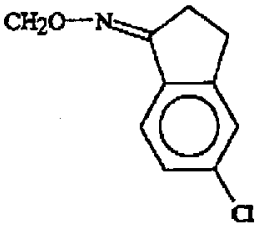
RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

122	O	MeO	CH_2S	3-(3,5-диCl-Ph)-4,5-дигидро-1,2,4-триазин-6-ил	174-179
123	O	MeO	O	3-(3-тиенил)-1,2,4-тиадиазол-5-ил	* тв.-во
124	O	MeO	CH_2O-N=C(CH_3)	4-(C≡CH)-2- пиридинил	99-102
125	O	MeO	O	3-(2-CN-3-F-PhO)-Ph	масло *
126	O	MeO	O	3-(2,6- диNO_2-PhO)-Ph	масло *
127	O	MeO	O	3-(6-Cl-3-пиридинил)-1,2,4-тиадиазол-5-ил	169-170
128	O	MeO	CH_2O-N=C(CH_3)	3,4-дигидро-4,4-диМе-2H-1-бензотиопиран-6- ил	масло *
129	O	MeO	O	3-(2-фуранил)-1,2,4-тиадиазол-5-ил	107-108
130	O	MeO	O	3-(3-Cl-benzyl)-1,2,4-тиадиазол-5-ил	* тв.в-во
131	O	MeO	CH_2S	5-Me-3-(3-CF_3-Ph)-1,2,4- триазин -6-ил	64-66
132	O	MeO	O	5-CN-4-Et_2N-2- тиазолил	* тв.в-во
133	O	MeO	CH_2O-N=C(CH_3)	4-MeS-Ph	* масло
134	O	MeO	O	3-[3,5-бис[CF_3CH_2O] -Ph]-1,2,4- тиадиазол-5-ил	* масло
135	O	CH_2=C=CH-O	CH_2ON=C(Me)	3,5-диCF$_3$-Ph	масло*
136	O	MeO	CH_2OC(=O)NMe	4-Cl-Ph	115-117
137	O	MeO	CH(Me)ON=C(Me)	3-CF_3-Ph	149-152
138	O	Cl	S	4,6-диCl-2-бензотиазолил	* пена
139	O	MeO	CH_2ON=C(Me)	3-MeS(=O)-Ph	*
140	O	MeO	CH_2ON=C(Me)	3-$MeSO_2$-Ph	*
141	O	MeO	CH_2ON=C(Me)	3-Ph-5- изоксазолил	47-51
142	O	MeO	O	6-Me-4-(CF_3CH_2O)-2-пиримидинил	*
143	O	MeO	O	3-(3-Cl-Ph)-4-CN-5-изотиазолил	181-182
144	O	MeO	O	3-(2,4-ди Cl-PhCH_2)-1,2,4 -тиадиазол-5-ил	*

RU 2126392 C1

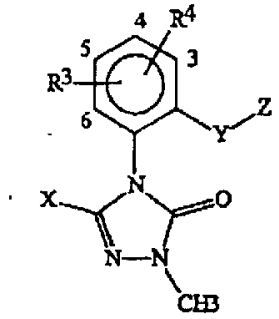
RU 2126392 C1

145	O	MeO	O	3-(CH_2=CHC(Me)$_2$)-1,2,4-тиадиазол-5-ил	96-100
146	O	MeO	CH_2ON=CH	2-Cl-1-PhCH_2-1H-индол-3-ил	масло*
147	O	MeO	O	3-(3-Cl-Ph)-1,2,4-оксадиазол-5-ил	121-124
148	O	MeO	O	4-(3-CF_3-PhO)-6-MeO-2-триазинил	масло*
149	O	MeO	O	3-CN-4-циннолинил	192-194
150	O	MeO			175-179
151	O	MeO	O	4-(3-OMe-PhO)-6-MeO-2-триазинил	135-139
152	O	MeO	CH_2ON=C(Me)	2,3-дигдиро-2-Me-5-бензофуранил	масло*
153	O	MeO	O	t-BuOCH(Me)	89
154	O	MeO	CH=CH	Ph	масло*
155	O	MeO	O	4-Me-5-$CH_3C(=NOC_6H_5)$-2-тиазолил	135-137
156	O	MeO	O	3-$C_6H_5C(=NOCH_3)$-1,2,4-тиадиазол-5-ил	масло*
157	O	MeO	O	3-(4-Cl-$C_6H_4C(=NOCH_3)$)-1,2,4-тиадиазол-5-ил	тв.в-во*

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

ТАБЛИЦА ПОКАЗАТЕЛЕЙ Д



Соединения №	X	R^3	R^4	Y	Z	Т.пл.(°С)
158	Cl	4-CH_3O	H	O	CH_3	140-142
159	MeO	5-Cl	H	O	3-(3-CF_3O-Ph)-1,2,4-тиадиазол-5-ил	*
160	MeO	6-CH_3	H	O	3-(3,5-диCl-Ph)-1,2,4-тиадиазол-5-ил	152-158
161	MeO	4-CH_3O	H	O	3-(4-CF_3-Ph)-1,2,4-тиадиазол-5-ил	110-112
162	MeO	4-Br	H	прямая связь	2-CF_3-тиазоло[3,2-b][1,2,4]-триазол-5-ил	177-181
163	Cl	5-NO_2	H	$CH_2ON=C(Me)$	3-CF_3-Ph	*
164	MeO	6-CH_2=CH	H	O	3-(3,5-диCl-Ph)-1,2,4-тиадиазол-5-ил	171-172
165	MeO	6-Me	3-Me	$CH_2ON=C(Me)$	3,5-диCl-Ph	*
166	MeO	6-Br-CH_2	H	$CH_2ON=C(Me)$	4-CF_3-2-пиридинил	* масло
167	MeO	4-HC≡C	H	$CH_2ON=C(Me)$	3-CF_3-Ph	± смола
168	MeO	6-Me	H	O	4-(4-CH_3-$C_6H_4C(=NOCH_3)$)-2-тиазолил	116-117

* См. Таблицу Е данных ^{1}H ЯМР-анализа

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

Таблица показателей E

№ Соединения	Данные ^{1}H ЯМР(200 Мгц, раствор $CDCl_3$, если не указано иначе)
2	δ 7.51(дд,1H), 7.27(дт,1H), 7.17(м,2H), 6.97(дд,1H), 6.6(м, 3H), 3.92(с,3H), 3.74(с,3H), 3.33(с,3H)
3	δ 7.32(м,7H), 6.99(м,2H), 5.08(с,2H), 3.84(с,3H), 3.42(с,3H)
4	δ 7.25(м,4H), 3.98(с,3H), 3.45(с,3H), 2.30(с,3H)
5	δ 7.61(д,1H), 7.35(м,3H), 7.11(м,2H), 6.84(т,2H), 5.12 (с,2H),3.96(с,3H), 3.415(с,3H), 2.24 (с,3H)
14	δ 7.65(д,1H), 7.45 (м,2H), 7.23 (м,1H), 7.10(м, 2H), 6.82(т,1H), 6.78(д,1H), 5.08(с,2H), 4.29(м,2H), 3.41 (с,3H), 2.24 (с,3H), 1.31(т,3H)
17	δ 7.6-7.45(м,5H), 7.20(м,1H), 7.14(д,2H), 5.27(д,1H), 5.16(д,1H), 3.46(с,3H), 2.34(с,3H), 2.16(с,3H)
19	δ 7.6(д, 1H),7.5(м, 3H),7.4(т, 1H),7.25(м, 1H),7.15(д,2H), 5.26(д,1H), 5.20(д,1H),3.48(с,3H), 2.41(с,3H), 2.43(с,3H), 2.18(с,3H)
20	δ 7.62(м,2H), 7.5(м,2H), 7.35-7.2(м,4H), 5.25(д,1H), 5.15(д,1H), 3.48(с,3H), 3.02(м,2H), 2.85(м,2H)
21	δ 7.42(м,2H), 7.10(м,1H), 7.06(м,3H), 6.99(т,1H), 6.68(д,2H), 3.37(с,3H), 2.51(с,3H)
23	δ 8.01(с,1H),7.61(д,1H),7.52(м,4H),7.35(м,3H),7.25(д,1H), 5.23(д,1H), 5.15(д,1H), 3.49(с,3H)
24	δ 7.6(м,2H), 7.5-7.4(м,3H), 7.3-7.2(м,3H), 5.24(д,1H), 5.20(д,1H), 3.48(с,3H), 2.40(с,3H)
25	δ 7.6-7.4(м,4H),7.35(м,2H),7.2(м,2H),7.0(д,2H),6.6(м,3H), 5.04(д,1H), 5.00(д,1H), 3.45(с,3H)
26	δ 7.6(д,1H), 7.45(м,2H),7.33(т,2H), 7.19(м,2H),7.10(т,1H), 7.01(д,2H), 6.6(м,3H), 5.03(м,2H), 3.87(с,3H), 3.39(с,3H)
35	δ 7.6-7.4 (м, 7H), 7.23(д,1H), 5.28(д,1H), 5.17(д,1H), 3.46(с,3H), 2.14(с,3H)
36	δ 7.80(д,2H), 7.65-7.45(м,6H), 7.36(д,2H), 7.30(м,1H), 7.25(м,1H),

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

Таблица Е (продолжение)

	7.10(т,1Н),5.15(д,1Н),5.10(д,1Н),3.45(с,2Н)
38	δ 7.77(д,2Н), 7.6(м,2Н),7.47(м,4Н),7.35(м,3Н), 7.25(м,1Н), 7.10(м,1Н), 5.13(д,1Н),5.12(д,1 Н),3.89(с,3Н),3.38(с, 3Н)
39	δ 8.03(с,1Н), 7.70(д,1Н), 7.53(м,2Н), 7.35-7.25(м,5Н), 5.06(с,2Н), 3.46(с,3Н)
40	δ 7.6-7.5(м,3Н), 7.24(м,1Н), 7.13(с,1Н), 7.02(д,1Н), 6.78(д,1Н), 5.96(с,2Н), 5.26(д,IH), 5.14(д,IH),3.48(с,3Н), 2.13(с, 3Н)
41	δ 8.04(с,1Н), 7.8(м,1Н), 7.45(м,2Н), 7.35-7.25(м,5Н), 5.10(с,2Н), 3.86(с,3Н), 3.41(с,3Н)
42	δ 7.58(м,1Н),7.43(м,2Н),7.25(м,1Н), 7.15(м,1Н), 7.02(д,1Н), 6.76(д,1Н), 5.96(с,2Н), 5.22(д,1Н),5.18(д,1Н), 3.89(с,3Н), 3.42(с,3Н), 2.15(с,3Н)
43	δ 8.40(с,1Н),7.6(м,1Н),7.5-7.4(м,5Н),7.3(д,1Н),7.18(м,2Н), 6.38(с,1Н), 3.45(с,3Н)
45	δ 7.55(д,1Н), 7.40(м,3Н),7.20(м,4Н),5.21(д,1Н),3.87(с,3Н), 3.42(с,3Н), 2.24(с,3Н)
47	δ 7.6-7.2(м,9Н), 5.4-5.2(м,2Н), 3.87,3.83(с,3Н), 3.41, 3.40(с,3Н)
48	δ 7.6(м,3Н), 7.44(м,2Н),7.35(м,2Н),7 25(м,1Н),5.26(д,1 Н), 5.22(д,1Н), 3.88(с,3Н), 3.49(с,3Н), 2.20(с,3Н)
49	δ 7.5(д, 1Н), 7.40(м, 4Н), 7.23(м, 2Н), 7.18(д, 1Н), 5.26(д, 1Н), 5.21(д,1Н),3.88(с,3Н),3.41(с,3Н), 2.36(с,3Н), 2.19(с,3Н)
50	δ 7.56(м,3Н),7.45(м,2Н),7.25(м,1Н),6.86(д,2Н), 5.24(д,1Н), 5.19(д,1Н), 3.88(с,3Н),3.81(с,3Н), 3.41(с,3Н), 2.17(с,3Н)
51	δ 7.5(м,2Н),7.45(м,3Н),7.3(м,3Н), 5.27(д,1Н), 5.22(д,1Н), 3.89(с,3Н)
52	δ 8.02,8.01(с,1Н),7.8,7.7(м,1Н),7.45(м,2Н),7.35(м,4Н), 7.25(м,2Н), 5.25(м,1Н), 3.88,3.74(с,3Н), 3.45,3.39(с,3Н), 1.62-1.56(м,3Н)
53	δ 8.04(с,1Н), 7.81(м,1Н), 7.45(м,5Н), 7.38-7.18(м,5Н), 5.18(с,2Н), 3.86(с,3Н),3.42(с,3Н), 2.38(с,3Н)

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

Продолжение таблицы показателей Е

59 δ 7.5(м,1Н),7.44(м,2Н),7.22(м,1Н),4.60(д,1Н),4.36(д,1Н), 3,96(с,3Н), 3.47(с,3Н).

61 δ 7.70(м,2Н),7.60(м,2Н),7.43(м.3Н),7.23(м,1Н), 5.30(д,1Н), 5.25(д,1Н), 3.85(с,3Н), 3.41(с, 3Н).

68 δ 7.60(д,1Н),7.5-7.4(м,2Н), 7.4-7.2(м,5Н), 5.20(д,2Н), 3.89(с, 3Н), 3.40(с,3Н), 2.18(м,1Н), 0.90(м,2Н),0,60(м,2Н).

70 δ два изомера: 7.75-7.40(м,8Н), [5.29(с) и 5.22(м)] (2Н), [3,58(с) и 3,55(с)] (3Н), [2,88(с) и 2.83(с)] (3Н), [2,23(с) и 2.17(с)] (3Н).

82 δ 7.60(д,1Н), 7.45(м, 2Н), 7.25(м, 1Н), 7.20(с,2Н),7.00 (с,1Н), 5.25(д,1Н), 5,21 (д,1Н), 3.88(с,3Н), 3.41(с,3Н), 2.32(с,6Н), 2.18(с,3Н).

83 δ 7.89(с,1Н), 7.80(д,1Н), 7.60(м.2Н),7.43(м.3Н), 7.25(м,1Н), 5.28(д,1Н), 5.24(д,1Н), 3.90(с,3Н), 3.42(с,3Н),2.19(с,3Н).

56 δ 7.47-7.45(м,1Н), 7.39-7.27(м,3Н), 5.09(с,2Н),3.95(с,3Н), 3,43(с,3Н),1.79-1.68(м,9Н), 1.31-1.20 (м,5Н).

57 δ 7.45-7.55(д,1Н), 7.30-7.35(м,3Н), 6.45(д,1Н),6.05(д,1Н), 5.26(с,2Н), 3.96(с,3Н), 3.43(с,3Н), 2.33(с,3Н),2.13(с,3Н).

88 δ 7.63(м,3Н),7.40(м,5Н), 7.20(м,1Н), 5.12(АВ кв,2Н),3.94 (д,3Н), 3.875(с,3Н), 3.41(с,3Н).

91 δ 7.85(с,1Н), 7.75(д,1Н), 7.4-7.7(м,5Н), 7.3(д,1Н),7.05 (т,1Н), 5.23(м,2Н), 3.34(с,3Н),2.19(с,3Н).

97 δ 8.11(д,2Н), 7.85(д,1Н), 7.77(д,2Н), 7.6-7.5(м,1Н), 7.5-7.4(м,2Н), 3.89(с, 3Н), 3.43(с, 3Н).

98 δ 3.38 (с,3Н), 3.85(с,3Н), 6.7-6.9 (м,3Н), 6.95(м,1Н), 7.1(м,1Н), 7.2-7.4(м,5Н),7.5(м,1Н),7.6(м,1Н).

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

Таблица E(продолжение)

99 δ 3.38(с,3Н),3.84(с,3Н),6.71-6.78(м,3Н),7.0-7.1(м,2Н),7.2-7.4(м,5Н),7.54(м,1Н),7.95(дв.д,1Н,J=1.7,8.0).

100 δ 3.39(с,3Н), 3.85(с,3Н), 6.87(т,1Н ,J=2.2), 6.92-6.96(м,2Н), 7.08(д,1Н,J=8.2), 7.17-7.26(м,2Н), 7.3-7.4(м,3Н), 8.3-8.4 (м,2Н).

103 δ 3.40(с,3Н), 3.84(с,3Н), 6.9-7.0(м,3Н), 7.0-7.1(м,2Н) 7.2-7.3(м,1Н), 7.35-7.40(м,3Н), 8.55(д,2Н,J=4.7).

107 δ 8.19(д,2Н), 7.65-7.50(м,2Н), 7.49(с,2Н), 7.17(д,2Н),6.57 т,1Н), 3.78(с,3Н), 3.36(с,3Н).

108 δ 7.86(д,1Н), 7.77(м,1Н), 7.55(м,1Н), 7.44(м,2Н), 7.23(д,1Н), 6.95(д,1Н), 5.24(кв,2Н),4.44(кв,2Н), 3.9(с,3Н), 3.4(с,3Н), 2.18(с,3Н).

110 δ 7.53(м,2Н), 7.45(м,2Н), 3.81(с,3Н), 3.40(с,3Н), 2.15(м,1Н), 1.0(м,4Н).

111 δ 7.49(с,1Н), 7.4(м,1Н), 7.3(д,1Н), 7.1(м,2Н),5.19(дв.д,2Н), 3.90(с,3Н), 3.44(с,3Н).

116 δ 7.55(м,2Н), 7.45(м,2Н), 3.89(с,3Н), 3.42(с,3Н), 3.40 (с,3Н).

118 δ 7.85(1Н), 7.65(м,2Н), 7.4(м,2Н), 7.25(м,2Н), 4.6(м,2Н), 3.94(с,3Н), 3.39(с,3Н).

119 δ 3.38(с,3Н), 3.86(с,3Н), 6.8-6.9(м,2Н), 7.0-7.1(м,2Н), 7.15(м,1Н), 7.2-7.3(м,1Н), 7.4-7.5(м,3Н),8.35(м,1Н), 8.6(м,1Н).

120 δ 3.39(с,3Н), 3.85(с,3Н), 6.86(д,1Н,J=6.5), 6.85-6.95(м,3Н), 7.04(дв.д,1Н,J=1.2,8.3), 7.25(м,1Н), 7.30-7.45(м,4Н).

123 δ 8.05(с,1Н), 7.65(д,1Н), 7.60(м,1Н), 7.55(м,1Н), 7.45(м,2Н), 7.35(м,1Н), 3.78(с,3Н), 3.36(с,3Н).

125 δ 3.38(с,3Н), 3.86(с,3Н), 6.68(д,1Н,J=8.5), 6.80(м,1Н), 6.82-6.91(м,3Н), 7.07(дв.д,1Н,J=1.0,8.2), 7.2(м,1Н),

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

Таблица E(продолжение)

7.3-7.5(м,4H).

126 δ 3.40 (с,3H)6 3.83(с,3H), 6.6(м,1H),6.65(м,1H), 6.80 (м,1H), 7.00(м,1H), 7.2-7.3 (м,2H), 7.35-7.40(м,2H), 7.55-7.60(м, 1H),8.19(д,2H,J=8,2).

128 δ 7.57(м,2H), 7.44(м,2H), 7.24(м,2H),7.05(д,1H),5,21 (кв,2H), 3.89(с,3H), 3.4(с,3H), 3,02 (м,2H), 2,15 (с,3H), 1.95(м,2H), 1.33 (с,6H).

130 δ 7,54(м,2H),7,46(м,2H), 7,33(с,1H), 7,24(м,3H), 4,09 (с,2H), 3.73(с,3H), 3.39(с,3H).

132 [м Me_2SO-d_6]: δ 7.75(д,1H), 7.65(м,2H),7.55(т,1H), 3.80(с, 3H), 3.5(м,4H), 3.27(с,3H), 1.15 (м,6H).

133 δ 7.51 (м,5H), 7.26(м,3H), 5.23 (кв,2H), 3.89(с,3H), 3.41(с,3H), 2.43(с,3H), 2,17(с,3H).

134 δ 7.55(м,2H), 7.5(м,2H), 7.45(д,2H), 6.67(т,1H),4.43 (кв.,4H),3.81(с,3H), 3.33(с,3H).

135 δ 8.0(с,2H), 7.85(с,1H), 7.55(д,1H), 7.45(м,2H), 7.3 (1H), 7.2(т,1H), 5.45(м,2H),5.3(м,2H), 3.42(с,3H), 2.22(с, 3H).

138 δ 8.02(дв.д,1H), 7.68(м,2H), 7.52(т,1H), 7.44(с,1H), 7.26(с,1H), 3.49(с,3H).

139 δ 7.88(м,1H), 7.74(д,1H), 7.50(м,5H), 7.24(м,1H),5.25 (кв., 2H), 3.9(с,3H), 3.41(с,3H),2.75(с,3H),2.23(с,3H).

140 δ 8.17(с,1H), 7.9(м,2H), 7.53(м,2H), 7.43(м,2H), 7.22 (м, 1H), 5.26(кв.,2H), 3.9(с,3H), 3.4(с,3H),3.08(с.3H), 2.22(с.3H).

142 δ 7.42(м,4H),6.42(с,1H), 4.61(кв.,2H), 3.83(с,3H),3.3 (с,3H), 2.4(с,3H).

144 δ 7.54(м, 2H), 7.46(м,2H),7.41(м,1H), 7.24(м,2H),4.22

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

Таблица E(продолжение)

(с,2H),3.78(с,3H), 3.39(с,3H).

146 δ 8.31(с,1H), 8.0(м,1H), 7.7(д,1H),7.5(т,1H),7.4(т,1H), 7.2-7.3 (м,9H,включая $CHCl_3$), 7.0(с.2H),5.37(с,2H), 5.1-5.3(АВкв,2H), 3.47(с,3H).

148 δ 8.73(м,7H), 3.94(с,3H), 3.86(с,3H),3.36(с,3H).

152 δ 7.6(д,1H),7.4-7.5(м,3H), 7.3(д,1H), 7.2(д,1H),6.7(д.1H), 5.2(кв ,2H), 4.9-5.0(м,1H), 3.89(с,3H),3.41(с,3H),3.3 (м,1H), 2.8(м,1H), 2.16(с,3H), 1.4(д,3H).

154 δ 7.80(д,1H,Аг-H); 7.46-7.26(м,8H,Аг-H); 7.10(д,1H, алкен-H); 6.90(д, 1H, алкен-H); 3.92 (с,3H, $N-CH_3$); 3.49 (с,3H,OCH_3).

156 δ 7.40-7.20(м,7H), 6.67(с,1H), 4.00(с,3H),3.87(с,3H), 3.42(с,3H), 2.39(с,3H), 2.28 (с,3H).

157 δ 7.7-7.3(м, 5H); 7.0-6.8(м,2H); 3.82(с,3H);3.41(с,3H); 1.36(с,9H).

159 δ 8.1(д,1H),8.0(с,1H), 7.65-7.4 (м,4H), 7.3(м,1H),3.79 (с,3H), 3.36(с,3H).

163 δ 8.40(двт,1H), 8.145(д,1H), 7.82(д,2H), 7.75(д,1H), 7.62(д,1H), 7.48(т,1H), 5.32(АВкв, 2H), 3.51(с,3H), 2.24(с,3H).

165 δ 7.48(д,2H),7.32(д,1H), 7.21(д,2H), 5.16(д,2H),3.86(с,3H), 3.46(д,3H), 2.47(д,3H), 2.10(д,6H).

166 δ 8.74(д,1H), 8.10(с,1H), 7.48(м,4H), 5.23(с,2H),4.46 (д,1H), 4.35(д,1H), 3.93(с,3H), 3.43(с,3H), 2.33(с,3H).

167 δ 7,85(с,1H), 7.80(д,1H), 7.68(с,1H),7.60(д,1H),7.52 (д,1H),7.52(д,1H),7.50-7.42(м,1H), 7.22(с,1H),5.23 (АВкв,2H),3.89(с,3H), 3.40(с,3H), 3.15(с,1H),2.22(с,3H).

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

Таблица 1

№ Соединения	Испытание A	Испытание B	Испытание C	Испытание D	Испытание E	Испытание F
1	57	79	0	0	17	68
2	86	93	0	0	100	0
3	57	79	0	61	100	68
4	0	0	0	0	100	0
5	99	100	0	46	100	43
6	98	100	36	85	100	42
7	73	9	0	33	5	3
8	0	0	0	0	35	46
9	0	0	0	0	35	0
10	35	3	0	43	78	0
11	100	100	0	64	100	50
12	95	97	0	47	92	71
13	98	100	0	0	69 **	63
14	78	81	0	0	0	0
15	100	100	0	63	100	36
16	92	57	0	0	0	0
17**	78	91	0	0	36	44
18	52	0	0	0	0	0

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

продолжение таблицы 1(испытаний)

19	0	0	0	0	0	62
20	63	84	0	26	99	65
21	-	-	-	-	-	-
22	38	100	0	47	100	47
23	38	89	0	0	100	0
24	0	98	97	47	100	70
25	0	84	88	16	100	0
26	72	100	0	73	100	44
27	72	93	0	16	100	2
28	83	97	19	59	100	0
29	16	97	0	25	8	0
30	95	96	0	47	100	47
31	89	99	0	46	100	0
32	60	53	0	0	100	47
33	95	98	0	77	100	0
34	90	100	88	64	100	0
35	0	97	0	0	99	9
36	63	93	62	46	100	0
37	98	100	93	63	100	48
38	0	99	73	26	100	0
39	32	85	73	0	45	0
40	59	97	93	0	76	49
41	97	100	0	0	100	0
42	92	100	62	64	100	68
43	97	99	50	26	97	0
44	73	100	0	47	100	69
45	94	100	0	0	100	47

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

продолжение таблицы 1 (испытаний)

46	100	100	100	93	100	0
47	96	100	0	0	100	0
48	100	100	0	47	100	0
49	100	100	88	86	100	47
50	92	100	97	77	-	45
51	100	100	100	97	-	89
54	94	86	0	25	-	0
55	98	99	53	96	95**	0
56	100	100	51	74	18*	96
57	84	97	74	0	7*	66
58	92	57	0	0	0	0
59	35	0	0	0	0	0
60	100	100	99	93	100**	9
61	99	93	0	63	4*	0
62	91	93	32	22	0*	56
63	0	93	0	0	32*	0

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

продолжение таблицы 1 (испытаний)

64	0	85	0	0	20*	0
65	61	99	0	39	0*	0
66	95	99	0	24	0*	42
67	100	99	91	45	72*	0
68	99	100	94	85	98*	0
69	77	84	0	0	0*	42
70	0	93	0	24	9*	0
71	93	93	53	0	10*	64
72	28	66	0	0	2*	73
73	100	100	97	25	98*	73
74	99	100	74	43	2*	60
75	99	100	100	96	99*	81
76	87	100	90	0	8*	68
77	100	100	100	99	100*	68
78	99	100	100	85	74*	89
79	100	100	97	99	100*	41
80	90	98	32	20	22*	89
81	100*	89	0	43	17*	65
82	98	100	97	97	100*	5
83	100	100	53	82	87*	40
84	100	100	32	86	98*	66
85	85	100	0	85	100*	74
86	99*	99*	0*	–	66*	–
87	100	96	74	75	100*	88
88	94	81	0	21	0*	64
89	94	85	74	45	13*	69
90	100	100	86	23	77*	0
91	91	85	0	20	54*	0
92	72	13	0	0	18*	42
93	35	99	32	77	43*	44
94	91	97	0	86	94*	44
95	0	93	0	86	46*	3
96	0	97	0	77	30*	44

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

продолжение таблицы 1 (испытаний)

97	77	85	0	77	79*	3
98	100	100	91	86	99*	0
99	99	100	74	86	91*	0
100	0	100	53	24	18*	60
101	99	100	74	46	99*	82
102	100	100	53	0	61*	0
103	36	99	0	11	7*	0
104	72	99	32	10	21*	68
105	99	99	53	91	86*	42
106	100	99	97	91	100*	68
107	100	99	100	96	94*	94
108	100	99	86	72	50*	94
109	75	97	53	0	19*	80
110	98***	97***	0***	75***	36*	65***
111	0	67	0	22	2*	0
112	98	100	53	64	77*	41
113	0	68	0	85	–	0
114	18	86	0	12	5*	0
115	50	94	0	37	5*	0
116	0	86	0	20	–	0
117	84	100	94	64	76*	0
118	98	100	75	96	100**	0
119	95	94	53	85	12****	0
120	36	86	0	85	31*	0
121	75	94	74	15	11*	0
122	61	86	0	60	53*	81
123	99	100	85	75	5*	31
124	99	99	75	84	55**	7
125	95	100	93	99	100*	0
126	0	67	50	54	37*	0
127	77	26	50	91	24*	77
128	67*	98*	58**	41**	63*	–
129	100	100	90	92	7*	55

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

продолжение таблицы 1 (испытаний)

130	96	99	53	ND	100*	0
131	98	100	94	89	–	94
132	99	100	86	91	25*	0
133	97	100	74	1	87*	0
134	97	97	0	0	16*	0
135	100	0	0	25	–	0
136	94	100	0	23	11*	0
137	99	97	0	–	15*	0
138	68	0	0	0	7*	0
139	–	100	0**	0	6*	0
140	–	99	0**	21	19*	0
141	38**	100	–	61	–	0
142	100	66	0	0	26*	0
143	90*	0*	0*	0	25*	0
144	98	100	91	ND	100*	0
145	94	100	53	ND	74*	83
146	84	0	0	0	–	0
147	0	84	53	23	–	0
148	28*	7*	0*	–	12*	–
149	95	99	86	81	–	48
150	0	86	32	70	–	0
151	63	86	0	38	–	0
152	100	100	86	92	100*	0
153	0	0	0	22	10*	0
154	87	97	32	ND	11*	0
155	99**	100**	99**	76**	100*	85**
156	97	97	0	0	8*	98
157	70*	29*	0*	–	7*	–
158	61	3	0	61	100	0
159	95	97	32	82	10*	79
160	100	100	96	85	94*	0
161	99	99	74	0	10*	77
162	60	28	0	0	3*	55

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1

продолжение таблицы 1 (испытаний)

163	-	67	0**	21	31**	0
164	-	100	72**	21	100*	0
165	99**	99	99	0	100*	0
166	61	93	0*	0	23*	48
167	100	100	91	0	91*	8
168	99	100	94	64	100*	92

* Испытано при 10 млн$^{-1}$

** Испытано при 40 млн$^{-1}$

*** Испытано при 100 млн$^{-1}$

**** Испытано при 5 млн$^{-1}$

ND- показатели не определены

RU 2126392 C1

RU 2126392 C1