



УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **124524** (13) **C2**
(51) МПК (2021.01)**C07D 403/12** (2006.01)**C07D 495/04** (2006.01)**A01N 43/54** (2006.01)

A01P 3/00

A01P 7/02 (2006.01)

A01P 7/04 (2006.01)

A01P 1/00

A01P 5/00

НАЦІОНАЛЬНИЙ ОРГАН
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
ДЕРЖАВНЕ ПІДПРИЄМСТВО
"УКРАЇНСЬКИЙ ІНСТИТУТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ"

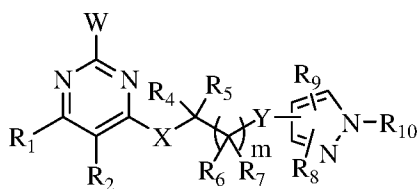
(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД

(21) Номер заявки: а 2017 12373	(72) Винахідник(и): Лю Чанлін (CN), Гуань Айін (CN), Ван Цзюньфен (CN), Сунь Сюйфен (CN), Лі Чжинянь (CN), Чжан Цзіньбо (CN), Бань Ланьфен (CN), Ма Сень (CN), Лань Цзе (CN), Ся Сяолі (CN), Ян Цзиньлун (CN)
(22) Дата подання заявки: 17.05.2016	
(24) Дата, з якої є чинними права інтелектуальної власності: 06.10.2021	
(31) Номер попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції: 201510252832.7	
(32) Дата подання попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції: 18.05.2015	
(33) Код держави-учасниці Паризької конвенції, до якої подано попередню заявку: CN	(73) Володілець (володільці): ШЕНЬЯН САЙНОКЕМ АГРОКЕМІКАЛЗ Р&Д КО., ЛТД., No.8-1 Shenliao Dong Road, Tiexi District Shenyang, Liaoning 110021, China (CN)
(41) Публікація відомостей про заявку: 26.02.2018, Бюл.№ 4	(74) Представник: Бочаров Максим Анатолійович, реєстр. №367
(46) Публікація відомостей про державну реєстрацію: 05.10.2021, Бюл.№ 40	
(86) Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору РСТ: PCT/CN2016/082291, 17.05.2016	(56) Перелік документів, взятих до уваги експертизою: CN 104378986 A, 25.02.2015 EP 1329160 A2, 23.07.2003 WO 9507278 A1, 16.03.1995 WO 2006/071988 A1, 06.07.2006 EP 0196524 A2, 08.10.1986

(54) СПОЛУКА ЗАМІЩЕНОГО ПІРАЗОЛУ, ЯКА МІСТИТЬ ПІРИМІДІНІЛ, ЇЇ ОДЕРЖАННЯ І ЗАСТОСУВАННЯ**(57) Реферат:**

Винахід стосується сполуки заміщеного піразолу, що містить піримідиніл, як показано у формулі I:

UA 124524 C2



I

причому така сполука має корисний спектр бактерицидної, інсектицидної й акарицидної активності, і має сильний контролюючий вплив на несправжню борошнисту росу огірків, борошнисту росу пшениці, іржу кукурудзи, пірикуляріоз рису, антракноз огірка тощо, а також виявляє гарну інсектицидну активність.

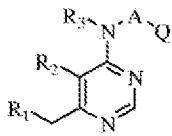
Галузь техніки, до якої належить винахід

Даний винахід стосується фунгіцидів, інсектицидів і акарицидів. Зокрема, одержання нових сполук заміщеного піразолу, що містить піримідиніл, і їхнього застосування.

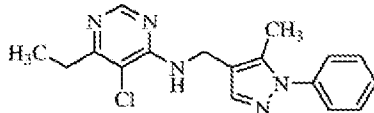
Передумови створення даного винаходу

- 5 У патенті WO9507278 описані сполуки заміщеного піразолу, який містить піримідиніл, що мають загальну формулу, і конкретні сполуки СК1 і СК2, застосовувані як фунгіциди, інсектициди і акарициди у сільському господарстві.

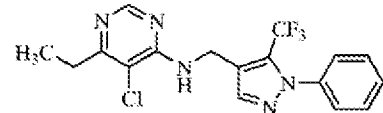
Загальна формула



Общая формула

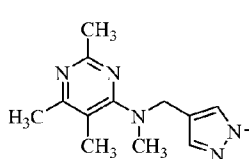


СК1

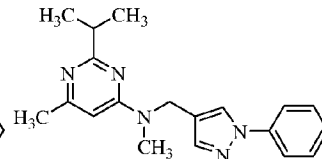


СК2

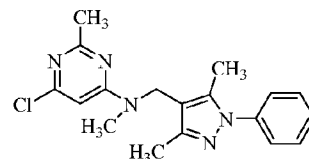
- 10 Наступні сполуки СК3, СК4 і СК5 були витягнуті з бази даних Scifinder без конкретного опису в літературних джерелах.



СК3



СК4



СК5

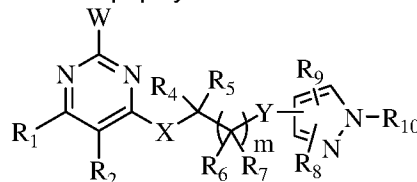
Однак у попередніх джерелах літератури відсутні повідомлення про сполуки заміщеного піразолу, що містить піримідиніл, представлених загальною формулою I, за даним винаходом.

- 15 Суть даного винаходу

Задачею даного винаходу є надання сполук заміщеного піразолу, що містить піримідиніл, і їхнього застосування, які можуть бути використані для одержання фунгіцидів, інсектицидів і акарицидів проти шкідливих грибів, бактерій, комах і кліщів у сільському господарстві або інших сферах.

- 20 Для рішення наведеної вище задачі приводиться детальний опис даного винаходу.

Даний винахід надає клас сполук заміщеного піразолу, що містить піримідиніл, які мають структуру, як представлено загальною формулою I:



I

де

- 25 R₁ вибраний з H, галогену, ціано, нітро, аміно, карбоксилу, C₁-C₁₂алкілу, галогенC₁-C₁₂алкілу, C₃-C₁₂циклоалкілу, C₁-C₁₂алкокси, галогенC₁-C₁₂алкокси, C₁-C₁₂алкілтіо, галогенC₁-C₁₂алкілтіо, C₁-C₁₂алкілсульфінілу, C₁-C₁₂алкілсульфонілу, C₂-C₁₂алкенілу, галогенC₂-C₁₂алкенілу, C₂-C₁₂алкінілу, галогенC₂-C₁₂алкінілу, C₃-C₁₂алкенокси, галогенC₃-C₁₂алкенокси, C₃-C₁₂алкінокси, галогенC₃-C₁₂алкінокси, C₁-C₁₂алкіламіно, ді(C₁-C₁₂алкіл)аміно, C₁-C₁₂алкіламінокарбонілу, галогенC₁-C₁₂алкіламінокарбонілу, C₁-C₁₂алкоксикарбонілу, галогенC₁-C₁₂алкоксикарбонілу, C₁-C₁₂алкоксіC₁-C₁₂алкілу або C₁-C₁₂алкілтіоC₁-C₁₂алкілу;

R₂ вибраний з H, галогену, ціано, нітро, аміно, карбоксилу, CHO, C₁-C₁₂алкілу, галогенC₁-C₁₂алкілу, C₁-C₁₂алкокси або галогенC₁-C₁₂алкокси;

- 30 R₁, R₂ і спряжене з ними піримідинове кільце також можуть утворювати п'ятичленне кільце, шестичленне кільце, семичленне кільце або восьмичленне кільце, що містить атом вуглецю, атом азоту, атом кисню або атом сірки;

X вибраний з NR₃, O або S;

Y вибраний з NR₃, O або S;

- 40 R₃ вибраний з H, OH, CHO, C₁-C₁₂алкілу, галогенC₁-C₁₂алкілу, C₁-C₁₂алкокси, галогенC₁-C₁₂алкокси, C₃-C₁₂циклоалкілу, C₁-C₁₂алкілтіо, C₂-C₁₂алкенілітіо, C₂-C₁₂алкенілу, C₂-C₁₂алкінілу, галогенC₂-C₁₂алкенілу, галогенC₂-C₁₂алкінілу, C₁-C₁₂алкоксіC₁-C₁₂алкілу, галогенC₁-C₁₂алкоксіC₁-C₁₂алкілу, C₁-C₁₂алкілтіоC₁-C₁₂алкілу, галогенC₁-C₁₂алкілтіоC₁-C₁₂алкілу, C₁-C₁₂алкілсульфінілу,

галогенC₁-C₁₂алкілсульфінілу, C₁-C₁₂алкілсульфонілу, галогенC₁-C₁₂алкілсульфонілу, C₁-C₁₂алкіламіносульфонілу, ді(C₁-C₁₂алкіл)аміносульфонілу, C₁-C₁₂алкілсульфоніламінокарбонілу, C₁-C₁₂алкілкарбоніламіносульфонілу, C₃-C₁₂циклоалкілоксикарбонілу, C₁-C₁₂алкілкарбонілу, галогенC₁-C₁₂алкілкарбонілу, C₁-C₁₂алкоксикарбонілу, галогенC₁-C₁₂алкоксикарбонілу, C₁-C₁₂алкілкарбонілC₁-C₁₂алкілу, C₁-C₁₂алкоксикарбонілC₁-C₁₂алкілу, C₁-C₁₂алкіламінокарбонілу, ді(C₁-C₁₂алкіл)амінокарбонілу, C₂-C₁₂алкеноксикарбонілу, C₂-C₁₂алкіноксикарбонілу, C₁-C₁₂алкоксіC₁-C₁₂алкоксикарбонілу, C₁-C₁₂алкіламінію, ді(C₁-C₁₂алкіл)амінію, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилкарбонілC₁-C₆алкілу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилоксикарбонілу, (гетеро)арилC₁-C₆алкілоксикарбонілу або (гетеро)арилC₁-C₆алкілу 1-5 наступними групами: галоген, нітро, ціано, C₁-C₆алкіл, галогенC₁-C₆алкіл, C₁-C₆алкокси або галогенC₁-C₆алкокси;

R₄, R₅ можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з H, галогену, C₁-C₁₂алкілу, галогенC₁-C₁₂алкілу, C₁-C₁₂алкокси або галогенC₁-C₁₂алкокси; або R₄, R₅ і їхній спряжений вуглець також можуть утворювати C₃-C₈ цикл;

R₆, R₇ можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з H, галогену, C₁-C₁₂алкілу, галогенC₁-C₁₂алкілу, C₁-C₁₂алкокси або галогенC₁-C₁₂алкокси; або R₆, R₇ і їхній спряжений вуглець також можуть утворювати C₃-C₈ цикл;

ціле число m вибране від 0 до 5;

R₈ вибраний з H, ціано, галогену, C₁-C₁₂алкілу, галогенC₁-C₁₂алкілу, C₁-C₁₂алкоксикарбонілу, галогенC₁-C₁₂алкоксикарбонілу, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R₁₁;

R₉ вибраний з H, ціано, галогену, C₁-C₁₂алкілу, галогенC₁-C₁₂алкілу, C₁-C₁₂алкоксикарбонілу, галогенC₁-C₁₂алкоксикарбонілу, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R₁₁;

R₁₀ вибраний з C₁-C₁₂алкілу, C₃-C₈циклоалкілу, галогенC₁-C₁₂алкілу, C₁-C₁₂алкілкарбонілу, галогенC₁-C₁₂алкілкарбонілу, C₁-C₁₂алкілсульфонілу, галогенC₁-C₁₂алкілсульфонілу, C₁-C₁₂алкоксикарбонілу, C₁-C₁₂алкоксіC₁-C₁₂алкілу, C₁-C₁₂алкоксикарбонілC₁-C₁₂алкілу, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R₁₁;

R₁₁ вибраний з галогену, OH, аміно, ціано, нітро, C₁-C₁₂алкілу, галогенC₁-C₁₂алкілу, C₁-C₁₂алкокси, галогенC₁-C₁₂алкокси, C₃-C₁₂циклоалкілу, C₁-C₁₂алкіламіно, галогенC₁-C₁₂алкіламіно, ді(C₁-C₁₂алкіл)аміно, галогенді(C₁-C₁₂алкіл)аміно, C(=O)NR₁₂R₁₃, C₁-C₁₂алкілтію, галогенC₁-C₁₂алкілтію, C₂-C₁₂алкенілу, C₂-C₁₂алкінілу, C₂-C₁₂алкенокси, галогенC₂-C₁₂алкенокси, C₂-C₁₂алкінокси, галогенC₂-C₁₂алкінокси, C₁-C₁₂алкілсульфонілу, галогенC₁-C₁₂алкілсульфонілу, C₁-C₁₂алкілкарбонілу, галогенC₁-C₁₂алкілкарбонілу, C₁-C₁₂алкоксикарбонілу, галогенC₁-C₁₂алкоксикарбонілу, C₁-C₁₂алкоксіC₁-C₁₂алкілу, C₁-C₁₂алкілтіюC₁-C₁₂алкілу, галогенC₁-C₁₂алкілтіюC₁-C₁₂алкілу, C₁-C₁₂алкоксикарбонілC₁-C₁₂алкілу, галогенC₁-C₁₂алкоксикарбонілC₁-C₁₂алкілу, C₁-C₁₂алкілтіюкарбонілC₁-C₁₂алкілу, галогенC₁-C₁₂алкілтіюкарбонілC₁-C₁₂алкілу, C₁-C₁₂алкілкарбонілокси, галогенC₁-C₁₂алкілкарбонілокси, C₁-C₁₂алкоксикарбонілокси, галогенC₁-C₁₂алкоксикарбонілокси, C₁-C₁₂алкілсульфонілокси, галогенC₁-C₁₂алкілсульфонілокси, C₁-C₁₂алкоксіC₁-C₁₂алкокси або галогенC₁-C₁₂алкоксіC₁-C₁₂алкокси;

R₁₂, R₁₃ можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з H, C₁-C₁₂алкілу або галогенC₁-C₁₂алкілу;

W вибраний з H, галогену, C₁-C₁₂алкілу, галогенC₁-C₁₂алкілу, C₃-C₈циклоалкілу, C₁-C₁₂алкокси, C₁-C₁₂алкілтію або C₁-C₁₂алкілсульфонілу;

місце зв'язування Y з піразольним кільцем знаходиться в положенні 3, положенні 4 або положенні 5, причому, коли Y зв'язаний у положенні 3 піразолу, R₈ знаходиться в положенні 4, R₉ знаходиться в положенні 5; коли Y зв'язаний у положенні 4 піразолу, R₈ знаходиться в положенні 3, R₉ знаходиться в положенні 5; коли Y зв'язаний у положенні 5 піразолу, R₈ знаходиться в положенні 3, R₉ знаходиться в положенні 4;

або солі, утворені зі сполук, представлених загальною формулою I.

У сполуках заміщеного піразолу, що містить піримідиніл, даного винаходу, переважні сполуки включають такі, де в загальній формулі I:

R₁ вибраний з H, галогену, ціано, нітро, аміно, карбоксилу, C₁-C₆алкілу, галогенC₁-C₆алкілу, C₃-C₆циклоалкілу, C₁-C₆алкокси, галогенC₁-C₆алкокси, C₁-C₆алкілтію, C₁-C₆алкілсульфінілу, C₁-C₆алкілсульфонілу, галогенC₁-C₆алкілтію, C₂-C₆алкенілу, галогенC₂-C₆алкенілу, C₂-C₆алкінілу,

галогенC₂-C₆алкінілу, C₃-C₆алкенокси, галогенC₃-C₆алкенокси, C₃-C₆алкінокси, галогенC₃-C₆алкінокси, C₁-C₆алкіламіно, ді(C₁-C₆алкіл)аміно, C₁-C₆алкіламінокарбонілу, галогенC₁-C₆алкіламінокарбонілу, C₁-C₆алкоксикарбонілу, галогенC₁-C₆алкоксикарбонілу, C₁-C₆алкоксіC₁-C₆алкілу або C₁-C₆алкілтіоC₁-C₆алкілу;

5 R₂ вибраний з Н, галогену, ціано, нітро, аміно, карбоксилу, СНО, C₁-C₆алкілу, галогенC₁-C₆алкілу, C₁-C₆алкокси або галогенC₁-C₆алкокси;

R₁, R₂ і спряжене з ними піримідинове кільце також можуть утворювати п'ятичленне кільце або шестичленне кільце, що містить атом вуглецю, атом азоту, атом кисню або атом сірки;

X вибраний з NR₃, О або S;

10 Y вибраний з NR₃, О або S;

R₃ вибраний з Н, ОН, СНО, C₁-C₆алкілу, галогенC₁-C₆алкілу, C₁-C₆алкокси, галогенC₁-C₆алкокси, C₃-C₆циклоалкілу, C₁-C₆алкілтіо, C₂-C₆алкеніліо, C₂-C₆алкенілу, C₂-C₆алкінілу, галогенC₂-C₆алкенілу, галогенC₂-C₆алкінілу, C₁-C₆алкоксіC₁-C₆алкілу, галогенC₁-C₆алкоксіC₁-C₆алкілу, C₁-C₆алкілтіоC₁-C₆алкілу, галогенC₁-C₆алкілтіоC₁-C₆алкілу, C₁-C₆алкілсульфінілу, галогенC₁-C₆алкілсульфінілу, C₁-C₆алкілсульфонілу, галогенC₁-C₆алкілсульфонілу, C₁-C₆алкіламіносульфонілу, ді(C₁-C₆алкіл)аміносульфонілу, C₁-C₆алкілсульфоніламінокарбонілу, C₁-C₆алкілкарбоніламіносульфонілу, C₃-C₆циклоалкілоксикарбонілу, C₁-C₆алкілкарбонілу, галогенC₁-C₆алкілкарбонілу, C₁-C₆алкоксикарбонілу, галогенC₁-C₆алкоксикарбонілу, C₁-C₆алкілкарбонілC₁-C₆алкілу, C₁-C₆алкоксикарбонілC₁-C₆алкілу, C₁-C₆алкіламінокарбонілу, ді(C₁-C₆алкіл)амінокарбонілу, C₂-C₆алкеноксикарбонілу, C₂-C₆алкіноксикарбонілу, C₁-C₆алкоксіC₁-C₆алкоксикарбонілу, C₁-C₆алкіламініотіо, ді(C₁-C₆алкіл)амініотіо, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилкарбонілC₁-C₆алкілу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилоксикарбонілу, (гетеро)арилC₁-C₆алкілоксикарбонілу або (гетеро)арилC₁-C₆алкілу 1-5 наступними групами: галоген, нітро, ціано, C₁-C₆алкіл, галогенC₁-C₆алкіл, C₁-C₆алкокси або

25 галогенC₁-C₆алкокси;

R₄, R₅ можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з Н, галогену, C₁-C₆алкілу, галогенC₁-C₆алкілу, C₁-C₆алкокси або галогенC₁-C₆алкокси; або R₄, R₅ і їхній спряжений вуглець також можуть утворювати C₃-C₆ цикл;

30 R₆, R₇ можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з Н, галогену, C₁-C₆алкілу, галогенC₁-C₆алкілу, C₁-C₆алкокси або галогенC₁-C₆алкокси; або R₆, R₇ і їхній спряжений вуглець також можуть утворювати C₃-C₆ цикл;

ціле число m вибране від 0 до 4;

R₈ вибраний з Н, ціано, галогену, C₁-C₆алкілу, галогенC₁-C₆алкілу, C₁-C₆алкоксикарбонілу, галогенC₁-C₆алкоксикарбонілу, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R₁₁;

35 R₉ вибраний з Н, ціано, галогену, C₁-C₆алкілу, галогенC₁-C₆алкілу, C₁-C₆алкоксикарбонілу, галогенC₁-C₆алкоксикарбонілу, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R₁₁;

40 R₁₀ вибраний з C₁-C₆алкілу, C₃-C₆циклоалкілу, галогенC₁-C₆алкілу, C₁-C₆алкілкарбонілу, галогенC₁-C₆алкілкарбонілу, C₁-C₆алкілсульфонілу, галогенC₁-C₆алкілсульфонілу, C₁-C₆алкоксикарбонілу, C₁-C₆алкоксіC₁-C₆алкілу, C₁-C₆алкоксикарбонілC₁-C₆алкілу, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R₁₁;

45 R₁₁ вибраний з галогену, ОН, аміно, ціано, нітро, C₁-C₆алкілу, галогенC₁-C₆алкілу, C₁-C₆алкокси, галогенC₁-C₆алкокси, C₃-C₆циклоалкілу, C₁-C₆алкіламіно, галогенC₁-C₆алкіламіно, ді(C₁-C₆алкіл)аміно, галогенді(C₁-C₆алкіл)аміно, C(=O)NR₁₂R₁₃, C₁-C₆алкілтіо, галогенC₁-C₆алкілтіо, C₂-C₆алкенілу, C₂-C₆алкінілу, C₂-C₆алкенокси, галогенC₂-C₆алкенокси, C₂-C₆алкінокси, галогенC₂-C₆алкінокси, C₁-C₆алкілсульфонілу, галогенC₁-C₆алкілсульфонілу, C₁-C₆алкілкарбонілу, галогенC₁-C₆алкілкарбонілу, C₁-C₆алкоксикарбонілу, галогенC₁-C₆алкоксикарбонілу, C₁-C₆алкоксіC₁-C₆алкілу, галогенC₁-C₆алкоксіC₁-C₆алкілу, C₁-C₆алкілтіоC₁-C₆алкілу, галогенC₁-C₆алкілтіоC₁-C₆алкілу, C₁-C₆алкоксикарбонілC₁-C₆алкілу, галогенC₁-C₆алкоксикарбонілC₁-C₆алкілу, C₁-C₆алкілтіокарбонілC₁-C₆алкілу, галогенC₁-C₆алкілтіокарбонілC₁-C₆алкілу, C₁-C₆алкілкарбонілокси, галогенC₁-C₆алкілкарбонілокси, C₁-C₆алкоксикарбонілокси, галогенC₁-C₆алкоксикарбонілокси, C₁-C₆алкілсульфонілокси, галогенC₁-C₆алкілсульфонілокси, C₁-C₆алкоксіC₁-C₆алкокси або галогенC₁-C₆алкоксіC₁-C₆алкокси;

R₁₂, R₁₃ можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з Н, C₁-C₆алкілу або галогенC₁-C₆алкілу;

60 W вибраний з Н, галогену, C₁-C₆алкілу, галогенC₁-C₆алкілу, C₃-C₆циклоалкілу, C₁-C₆алкокси,

C₁-C₆алкілтію або C₁-C₆алкілсульфонілу;

місце зв'язування Y з піразольним кільцем знаходиться в положенні 3, положенні 4 або положенні 5, причому, коли Y зв'язаний у положенні 3 піразолу, R₈ знаходиться в положенні 4, R₉ знаходиться в положенні 5; коли Y зв'язаний у положенні 4 піразолу, R₈ знаходиться в положенні 3, R₉ знаходиться в положенні 5; коли Y зв'язаний у положенні 5 піразолу, R₈ знаходиться в положенні 3, R₉ знаходиться в положенні 4;

або солі, утворені з переважних сполук, представлених загальною формулою I вище.

У сполуках заміщеного піразолу, що містить піримідиніл, даного винаходу, більш переважні сполуки включають такі, де в загальній формулі I:

R₁ вибраний з H, галогену, ціано, нітро, аміно, карбоксилу, C₁-C₄алкілу, галогенC₁-C₄алкілу, C₃-C₄циклоалкілу, C₁-C₄алкокси, галогенC₁-C₄алкокси, C₁-C₄алкілтію, C₁-C₄алкілсульфінілу, C₁-C₄алкілсульфонілу, галогенC₁-C₄алкілтію, C₂-C₄алкенілу, галогенC₂-C₄алкенілу, C₂-C₄алкінілу, галогенC₂-C₄алкінілу, C₃-C₄алкенокси, галогенC₃-C₄алкенокси, C₃-C₄алкінокси, галогенC₃-C₄алкінокси, C₁-C₄алкіламіно, ді(C₁-C₄алкіл)аміно, C₁-C₄алкіламінокарбонілу, галогенC₁-C₄алкіламінокарбонілу, C₁-C₄алкоксикарбонілу, галогенC₁-C₄алкоксикарбонілу, C₁-C₄алкоксіC₁-C₄алкілу або C₁-C₄алкілтіюC₁-C₄алкілу;

R₂ вибраний з H, галогену, ціано, нітро, аміно, карбоксилу, СНО, C₁-C₄алкілу, галогенC₁-C₄алкілу, C₁-C₄алкокси або галогенC₁-C₄алкокси;

R₁, R₂ і спряжене з ними піримідинове кільце також можуть утворювати п'ятичленне кільце або шестичленне кільце, що містить атом вуглецю, атом азоту, атом кисню або атом сірки;

X вибраний з NR₃, O або S;

R₃ вибраний з H, OH, СНО, C₁-C₄алкілу, галогенC₁-C₄алкілу, C₁-C₄алкокси, галогенC₁-C₄алкокси, C₃-C₄циклоалкілу, C₁-C₄алкілтію, C₂-C₄алкенілію, C₂-C₄алкенілу, C₂-C₄алкінілу, галогенC₂-C₄алкенілу, галогенC₂-C₄алкінілу, C₁-C₄алкоксіC₁-C₄алкілу, галогенC₁-C₄алкоксіC₁-C₄алкілу, C₁-C₄алкілтіюC₁-C₄алкілу, галогенC₁-C₄алкілтіюC₁-C₄алкілу, C₁-C₄алкілсульфінілу, галогенC₁-C₄алкілсульфінілу, C₁-C₄алкілсульфонілу, галогенC₁-C₄алкілсульфонілу, C₁-C₄алкіламіносульфонілу, ді(C₁-C₄алкіл)аміносульфонілу, C₁-C₄алкілсульфоніламінокарбонілу, C₁-C₄алкілкарбоніламіносульфонілу, C₃-C₄циклоалкілоксикарбонілу, C₁-C₄алкілкарбонілу, галогенC₁-C₄алкілкарбонілу, C₁-C₄алкоксикарбонілу, галогенC₁-C₄алкоксикарбонілу, C₁-C₄алкілкарбонілуC₁-C₄алкілу, C₁-C₄алкоксикарбонілуC₁-C₄алкілу, C₁-C₄алкіламінокарбонілу, ді(C₁-C₄алкіл)амінокарбонілу, C₂-C₄алкеноксикарбонілу, C₂-C₄алкіноксикарбонілу, C₁-C₄алкоксіC₁-C₄алкоксикарбонілу, C₁-C₄алкіламінію, ді(C₁-C₄алкіл)амінію, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилкарбонілуC₁-C₄алкілу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилоксикарбонілу, (гетеро)арилC₁-C₄алкілоксикарбонілу або (гетеро)арилC₁-C₄алкілу 1-5 наступними групами: галоген, нітро, ціано, C₁-C₄алкіл, галогенC₁-C₄алкіл, C₁-C₄алкокси або галогенC₁-C₄алкокси;

R₄, R₅ можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з H, галогену, C₁-C₄алкілу, галогенC₁-C₄алкілу, C₁-C₄алкокси або галогенC₁-C₄алкокси; або R₄, R₅ і їхній спряжений вуглець також можуть утворювати C₃-C₄ цикл;

R₆, R₇ можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з H, галогену, C₁-C₄алкілу, галогенC₁-C₄алкілу, C₁-C₄алкокси або галогенC₁-C₄алкокси; або R₆, R₇ і їхній спряжений вуглець також можуть утворювати C₃-C₄ цикл;

ціле число m вибране від 0 до 3;

R₈ вибраний з H, ціано, галогену, C₁-C₄алкілу, галогенC₁-C₄алкілу, C₁-C₄алкоксикарбонілу, галогенC₁-C₄алкоксикарбонілу, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R₁₁;

R₉ вибраний з H, ціано, галогену, C₁-C₄алкілу, галогенC₁-C₄алкілу, C₁-C₄алкоксикарбонілу, галогенC₁-C₄алкоксикарбонілу, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R₁₁;

R₁₀ вибраний з C₁-C₄алкілу, C₃-C₄циклоалкілу, галогенC₁-C₄алкілу, C₁-C₄алкілкарбонілу, галогенC₁-C₄алкілкарбонілу, C₁-C₄алкілсульфонілу, галогенC₁-C₄алкілсульфонілу, C₁-C₄алкоксикарбонілу, C₁-C₄алкоксіC₁-C₄алкілу, C₁-C₄алкоксикарбонілуC₁-C₄алкілу, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R₁₁;

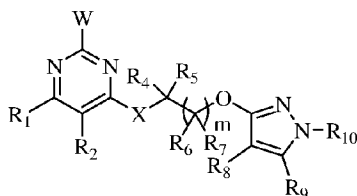
R₁₁ вибраний з галогену, OH, аміно, ціано, нітро, C₁-C₄алкілу, галогенC₁-C₄алкілу, C₁-C₄алкокси, галогенC₁-C₄алкокси, C₃-C₄циклоалкілу, C₁-C₄алкіламіно, галогенC₁-C₄алкіламіно, ді(C₁-C₄алкіл)аміно, галогенді(C₁-C₄алкіл)аміно, C(=O)NR₁₂R₁₃, C₁-C₄алкілтію, галогенC₁-C₄алкілтію, C₂-C₄алкенілу, C₂-C₄алкінілу, C₂-C₄алкенокси, галогенC₂-C₄алкенокси, C₂-

C₄алкінокси, галогенC₂-C₄алкінокси, C₁-C₄алкілсульфонілу, галогенC₁-C₄алкілсульфонілу, C₁-C₄алкілкарбонілу, галогенC₁-C₄алкілкарбонілу, C₁-C₄алкоксикарбонілу, галогенC₁-C₄алкоксикарбонілу, C₁-C₄алкоксіC₁-C₄алкілу, галогенC₁-C₄алкоксіC₁-C₄алкілу, C₁-C₄алкілтіоC₁-C₄алкілу, галогенC₁-C₄алкілтіоC₁-C₄алкілу, C₁-C₄алкоксикарбонілC₁-C₄алкілу, галогенC₁-C₄алкоксикарбонілC₁-C₄алкілу, C₁-C₄алкілтіокарбонілC₁-C₄алкілу, галогенC₁-C₄алкілтіокарбонілC₁-C₄алкілу, C₁-C₄алкілкарбонілокси, галогенC₁-C₄алкілкарбонілокси, C₁-C₄алкоксикарбонілокси, галогенC₁-C₄алкоксикарбонілокси, C₁-C₄алкілсульфонілокси, галогенC₁-C₄алкілсульфонілокси, C₁-C₄алкоксіC₁-C₄алкокси або галогенC₁-C₄алкоксіC₁-C₄алкокси;

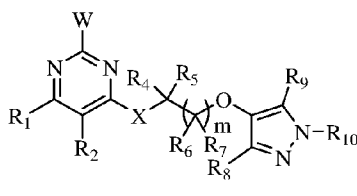
R₁₂, R₁₃ можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з H, C₁-C₄алкілу або галогенC₁-C₄алкілу;

W вибраний з H, галогену, C₁-C₄алкілу, галогенC₁-C₄алкілу, C₃-C₄циклоалкілу, C₁-C₄алкокси, C₁-C₄алкілтіо або C₁-C₄алкілсульфонілу;

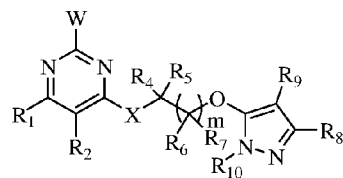
Y являє собою O, місце зв'язування Y з піразольним кільцем знаходиться в положенні 3, положенні 4 або положенні 5, причому, коли O зв'язаний у положенні 3 піразолу, R₈ знаходиться в положенні 4, R₉ знаходиться в положенні 5, загальна формула I являє собою загальну формулу I-1; коли Y зв'язаний у положенні 4 піразолу, R₈ знаходиться в положенні 3, R₉ знаходиться в положенні 5, загальна формула I являє собою загальну формулу I-2; коли Y зв'язаний у положенні 5 піразолу, R₈ знаходиться в положенні 3, R₉ знаходиться в положенні 4, загальна формула I являє собою загальну формулу I-3;



I-1



I-2



I-3

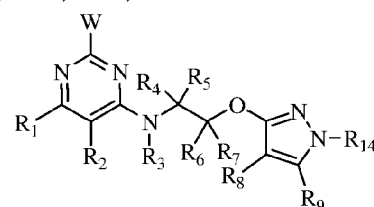
або солі, утворені з більш переважних сполук, представлених загальною формулою I вище.

У сполуках заміщеного піразолу, що містить піримідиніл, даного винаходу, більш переважні сполуки включають такі, де в загальній формулі I:

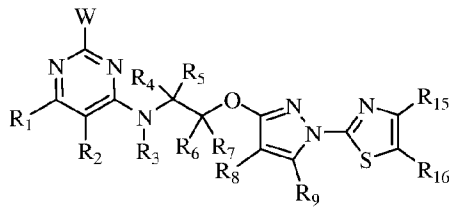
структури сполук загальної формули I-1 представлені загальними формулами I-1A, I-1B, I-1C, I-1D, I-1E, I-1F, I-1G, I-1H, I-1I, I-1J, I-1K, I-1L, I-1M, I-1N, I-4C, I-4F або I-4G;

структури сполук загальної формули I-2 представлені загальними формулами I-2A, I-2B, I-2C, I-2D, I-2E, I-2F або I-G;

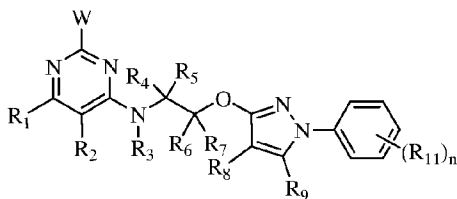
структури сполук загальної формули I-3 представлені загальними формулами I-3A, I-3B, I-3C, I-3D, I-3E, I-3F або I-3G:



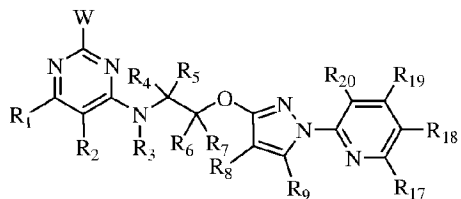
I-1A



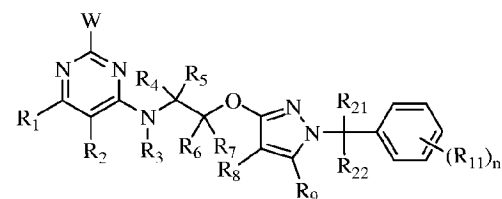
I-1B



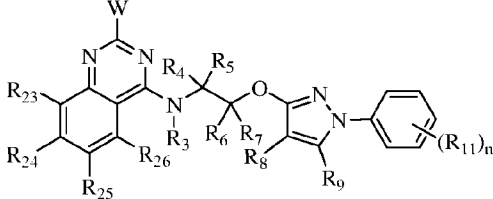
I-1C



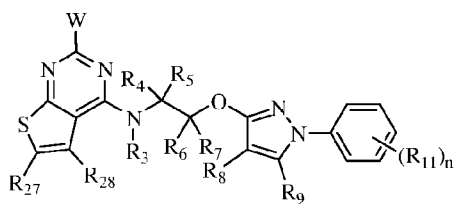
I-1D



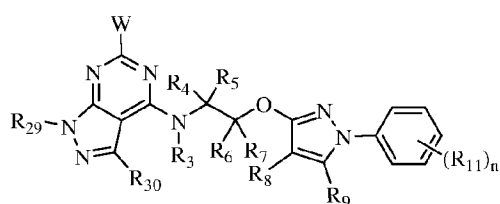
I-1E



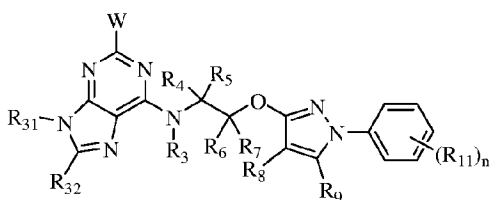
I-1F



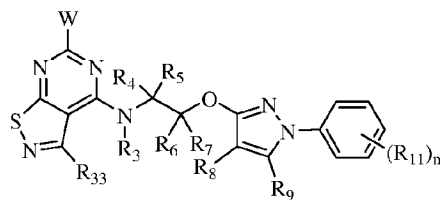
I-1G



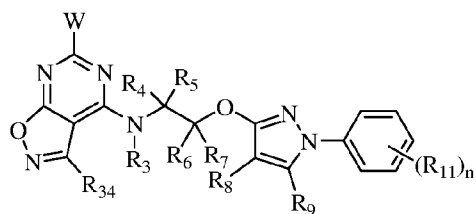
I-1H



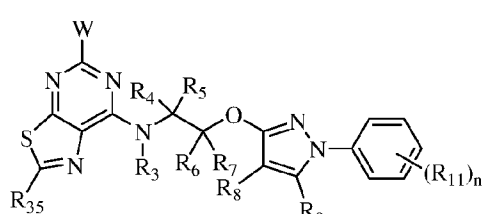
I-1I



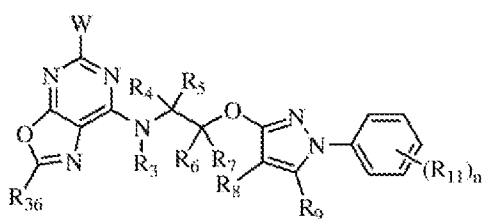
I-1J



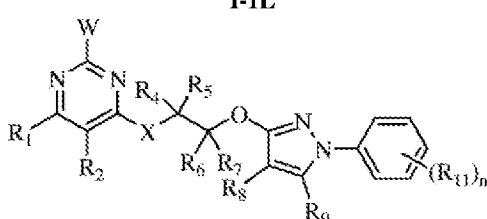
I-1K



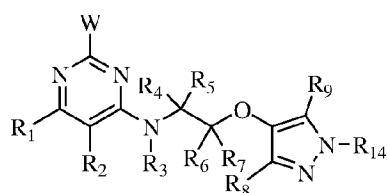
I-1L



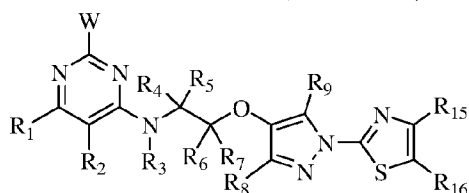
I-1M



I-1N (X=O или S)

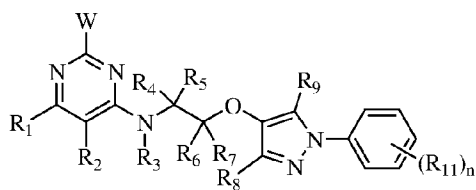


I-2A

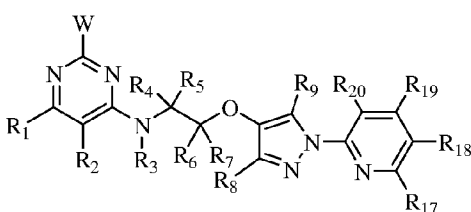


I-2B

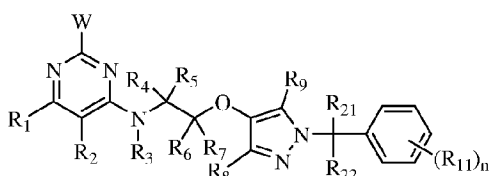
5



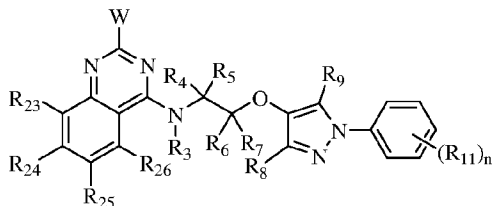
I-2C



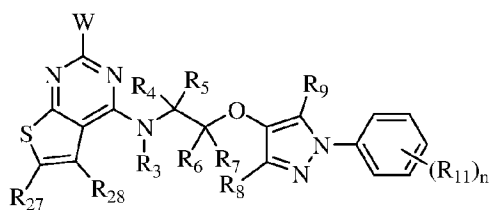
I-2D



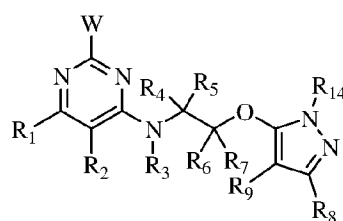
I-2E



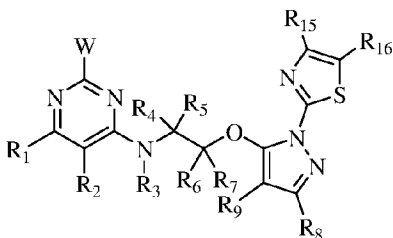
I-2F



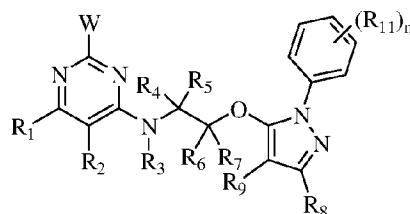
I-2G



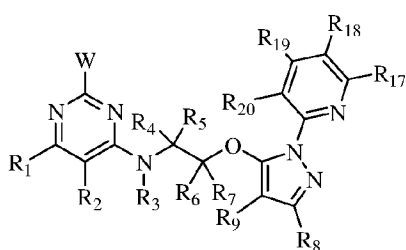
I-3A



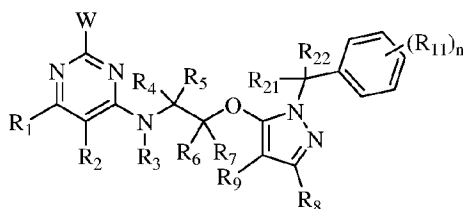
I-3B



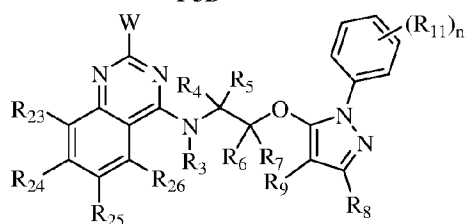
I-3C



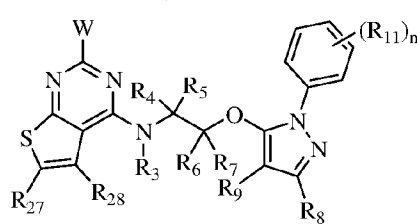
I-3D



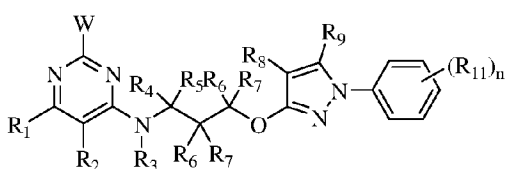
I-3E



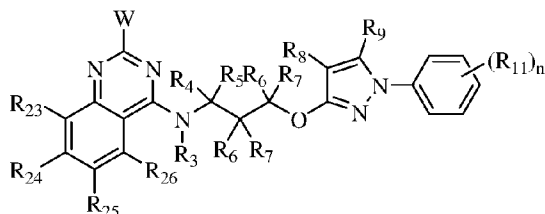
I-3F



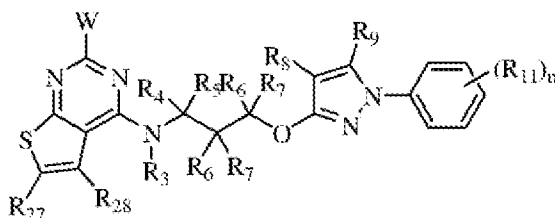
I-3G



I-4C



I-4F



I-4G

У загальних формулах I-1A, I-1B, I-1C, I-1D, I-1E, I-1F, I-1G, I-1H, I-1I, I-1J, I-1K, I-1L, I-1M, I-1N, I-4C, I-4F, I-4G, I-2A, I-2B, I-2C, I-2D, I-2E, I-2F, I-2G, I-3A, I-3B, I-3C, I-3D, I-3E, I-3F і I-3G:

10 R_1 вибраний з Н, галогену, ціано, нітро, аміно, карбоксилу, C_1 - C_4 алкілу, галоген C_1 - C_4 алкілу, C_3 - C_4 циклоалкілу, C_1 - C_4 алкокси, галоген C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 алкілтію, галоген C_1 - C_4 алкілтію, C_1 - C_4 алкілсульфонілу, C_1 - C_4 алкілсульфонілу, C_2 - C_4 алкенілу, галоген C_2 - C_4 алкенілу, C_2 - C_4 алкінілу, галоген C_2 - C_4 алкінілу, C_3 - C_4 алкенокси, галоген C_3 - C_4 алкенокси, C_3 - C_4 алкінокси, галоген C_3 - C_4 алкінокси, C_1 - C_4 алкіламіно, ді(C_1 - C_4 алкіл)аміно, C_1 - C_4 алкіламінокарбонілу, галоген C_1 - C_4 алкіламінокарбонілу, C_1 - C_4 алкоксикарбонілу, галоген C_1 - C_4 алкоксикарбонілу, C_1 - C_4 алкоксі C_1 - C_4 алкілу або C_1 - C_4 алкілтію C_1 - C_4 алкілу;

R₂ вибраний з Н, галогену, ціано, нітро, аміно, карбоксилу, СНО, С₁-С₄алкілу, галогенС₁-С₄алкілу, С₁-С₄алкокси або галогенС₁-С₄алкокси;

R₃ вибраний з Н, ОН, СНО, С₁-С₄алкілу, галогенС₁-С₄алкілу, С₁-С₄алкокси, галогенС₁-С₄алкокси, С₃-С₄циклоалкілу, С₁-С₄алкілтіо, С₂-С₄алкенілтіо, С₂-С₄алкенілу, С₂-С₄алкінілу, 5 галогенС₂-С₄алкенілу, галогенС₂-С₄алкінілу, С₁-С₄алкоксиС₁-С₄алкілу, галогенС₁-С₄алкоксиС₁-С₄алкілу, С₁-С₄алкілтіоС₁-С₄алкілу, галогенС₁-С₄алкілтіоС₁-С₄алкілу, С₁-С₄алкілсульфінілу, галогенС₁-С₄алкілсульфінілу, С₁-С₄алкілсульфонілу, галогенС₁-С₄алкілсульфонілу, С₁-С₄алкіламіносульфонілу, ді(С₁-С₄алкіл)аміносульфонілу, С₁-С₄алкілсульфоніламінокарбонілу, С₁-С₄алкілкарбоніламіносульфонілу, С₃-С₄циклоалкілоксикарбонілу, С₁-С₄алкілкарбонілу, 10 галогенС₁-С₄алкілкарбонілу, С₁-С₄алкоксикарбонілу, галогенС₁-С₄алкоксикарбонілу, С₁-С₄алкілкарбонілС₁-С₄алкілу, С₁-С₄алкоксикарбонілС₁-С₄алкілу, С₁-С₄алкіламінокарбонілу, ді(С₁-С₄алкіл)амінокарбонілу, С₂-С₄алкенілоксикарбонілу, С₂-С₄алкіноксикарбонілу, С₁-С₄алкоксиС₁-С₄алкоксикарбонілу, С₁-С₄алкіламініотіо, ді(С₁-С₄алкіл)амініотіо, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилкарбонілС₁-С₄алкілу, (гетеро)арилкарбонілу, 15 (гетеро)арилоксикарбонілу, (гетеро)арилС₁-С₄алкілоксикарбонілу або (гетеро)арилС₁-С₄алкілу 1-5 наступними групами: галогену, нітро, ціано, С₁-С₄алкілу, галогенС₁-С₄алкілу, С₁-С₄алкокси або галогенС₁-С₄алкокси;

R₄, R₅ можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з Н, галогену, С₁-С₄алкілу, галогенС₁-С₄алкілу, С₁-С₄алкокси або галогенС₁-С₄алкокси; або R₄, R₅ і їхній спряжений вуглець 20 також можуть утворювати С₃-С₄ цикл;

R₆, R₇ можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з Н, галогену, С₁-С₄алкілу, галогенС₁-С₄алкілу, С₁-С₄алкокси або галогенС₁-С₄алкокси; або R₆, R₇ і їхній спряжений вуглець також можуть утворювати С₃-С₄ цикл;

R₈ вибраний з Н, ціано, галогену, С₁-С₄алкілу, галогенС₁-С₄алкілу, С₁-С₄алкоксикарбонілу, 25 галогенС₁-С₄алкоксикарбонілу, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R₁₁;

R₉ вибраний з Н, ціано, галогену, С₁-С₄алкілу, галогенС₁-С₄алкілу, С₁-С₄алкоксикарбонілу, галогенС₁-С₄алкоксикарбонілу, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, 30 (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R₁₁;

R₁₁ вибраний з галогену, ОН, аміно, ціано, нітро, С₁-С₄алкілу, галогенС₁-С₄алкілу, С₁-С₄алкокси, галогенС₁-С₄алкокси, С₃-С₄циклоалкілу, С₁-С₄алкіламіно, галогенС₁-С₄алкіламіно, ді(С₁-С₄алкіл)аміно, галогенді(С₁-С₄алкіл)аміно, С(=О)NR₁₂R₁₃, С₁-С₄алкілтіо, галогенС₁-С₄алкілтіо, С₂-С₄алкенілу, С₂-С₄алкінілу, С₂-С₄алкенокси, галогенС₂-С₄алкенокси, С₂-С₄алкінокси, галогенС₂-С₄алкінокси, С₁-С₄алкілсульфонілу, галогенС₁-С₄алкілсульфонілу, С₁-С₄алкілкарбонілу, галогенС₁-С₄алкілкарбонілу, С₁-С₄алкоксикарбонілу, галогенС₁-С₄алкоксикарбонілу, галогенС₁-С₄алкоксиС₁-С₄алкілу, галогенС₁-С₄алкоксиС₁-С₄алкілу, С₁-С₄алкілтіоС₁-С₄алкілу, галогенС₁-С₄алкілтіоС₁-С₄алкілу, С₁-С₄алкоксикарбонілС₁-С₄алкілу, галогенС₁-С₄алкоксикарбонілС₁-С₄алкілу, С₁-С₄алкілтіокарбонілС₁-С₄алкілу, галогенС₁-С₄алкілтіокарбонілС₁-С₄алкілу, С₁-С₄алкілкарбонілокси, галогенС₁-С₄алкілкарбонілокси, С₁-С₄алкоксикарбонілокси, галогенС₁-С₄алкоксикарбонілокси, С₁-С₄алкілсульфонілокси, галогенС₁-С₄алкілсульфонілокси, С₁-С₄алкоксиС₁-С₄алкокси або галогенС₁-С₄алкоксиС₁-С₄алкокси; 40

ціле число n вибране від 0 до 5, причому, коли n дорівнює 0, бензольне кільце являє собою незаміщений феніл; коли n дорівнює більше ніж 1, групи R₁₁ можуть бути однаковими або різними; 45

R₁₂, R₁₃ можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з Н, С₁-С₄алкілу або галогенС₁-С₄алкілу;

R₁₄ вибраний з С₁-С₄алкілу, С₃-С₄циклоалкілу, галогенС₁-С₄алкілу, С₁-С₄алкілкарбонілу, галогенС₁-С₄алкілкарбонілу, С₁-С₄алкілсульфонілу, галогенС₁-С₄алкілсульфонілу, С₁-С₄алкоксикарбонілу, С₁-С₄алкоксиС₁-С₄алкілу або С₁-С₄алкоксикарбонілС₁-С₄алкілу; 50

R₁₅, R₁₆ можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з Н, галогену, аміно, ціано, нітро, С₁-С₄алкілу, галогенС₁-С₄алкілу, С₁-С₄алкокси, галогенС₁-С₄алкокси, С₁-С₄алкілтіо, галоген С₁-С₄алкілтіо, С₃-С₄циклоалкілу, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R₁₁; 55

R₁₇, R₁₈, R₁₉, R₂₀ можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з Н, галогену, ціано, нітро, С₁-С₄алкілу, галогенС₁-С₄алкілу, С₁-С₄алкокси або галогенС₁-С₄алкокси;

R₂₁, R₂₂ можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з Н, галогену, ОН, ціано, нітро, С₁-С₄алкілу, галогенС₁-С₄алкілу, С₁-С₄алкокси, галогенС₁-С₄алкокси, С₁-С₄алкілтіо, 60

галогенC₁-C₄алкілтію, C₃-C₄циклоалкілу, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R₁₁;

5 R₂₃, R₂₄, R₂₅, R₂₆ можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з H, галогену, OH, аміно, ціано, нітро, C₁-C₄алкілу, галогенC₁-C₄алкілу, C₁-C₄алкокси, галогенC₁-C₄алкокси або C₃-C₄циклоалкілу;

10 R₂₇, R₂₈ можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з H, галогену, C₁-C₄алкілу, галогенC₁-C₄алкілу, C₁-C₄алкокси, галогенC₁-C₄алкокси, C₁-C₄алкілтію, галогенC₁-C₄алкілтію, C₃-C₄циклоалкілу, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R₁₁;

15 R₂₉ вибраний з C₁-C₄алкілу, галогенC₁-C₄алкілу, C₃-C₄циклоалкілу, C₁-C₄алкілсульфонілу, галогенC₁-C₄алкілсульфонілу, C₁-C₄алкілкарбонілу, галогенC₁-C₄алкілкарбонілу, C₁-C₄алкоксикарбонілу, галогенC₁-C₄алкоксикарбонілу, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R₁₁;

20 R₃₀ вибраний з H, ціано, галогену, C₁-C₄алкілу, галогенC₁-C₄алкілу, C₁-C₄алкоксикарбонілу, галогенC₁-C₄алкоксикарбонілу, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R₁₁;

25 R₃₁ вибраний з C₁-C₄алкілу, галогенC₁-C₄алкілу, C₃-C₄циклоалкілу, C₁-C₄алкілсульфонілу, галогенC₁-C₄алкілсульфонілу, C₁-C₄алкілкарбонілу, галогенC₁-C₄алкілкарбонілу, C₁-C₄алкоксикарбонілу, галогенC₁-C₄алкоксикарбонілу, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R₁₁;

R₃₂ вибраний з H, ціано, галогену, C₁-C₄алкілу, галогенC₁-C₄алкілу, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R₁₁;

30 R₃₃, R₃₄ можуть бути вибрані відповідно з C₁-C₄алкілу, галогенC₁-C₄алкілу, C₃-C₄циклоалкілу, C₁-C₄алкілкарбонілу, галогенC₁-C₄алкілкарбонілу, C₁-C₄алкоксикарбонілу, галогенC₁-C₄алкоксикарбонілу, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R₁₁;

35 R₃₅, R₃₆ можуть бути вибрані відповідно з H, ціано, галогену, C₁-C₄алкілу, галогенC₁-C₄алкілу, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R₁₁;

W вибраний з H, галогену, C₁-C₄алкілу, галогенC₁-C₄алкілу, C₃-C₄циклоалкілу, C₁-C₄алкокси, галогенC₁-C₄алкокси або C₁-C₄алкілсульфонілу;

40 або солі, утворені з більш переважних сполук, представлених загальними формулами вище, із хлористоводневою кислотою, сірчаною кислотою, фосфорною кислотою, мурашиною кислотою, оцтовою кислотою, трифтороцтовою кислотою, щавлевою кислотою, метилсульфоною кислотою, п-толуолсульфоною кислотою, бензойною кислотою, алізариновою кислотою, малеїною кислотою, фумаровою кислотою, сорбіною кислотою, яблучною кислотою або лимонною кислотою.

У сполуках заміщеного піразолу, що містить піримідиніл, даного винаходу, більш переважні сполуки включають сполуки, представлені загальними формулами I-1A, I-1B, I-1C, I-1D, I-1E, I-1F, I-1G, I-1H, I-1I, I-1J, I-1K, I-1L, I-1M, I-1N, I-2A, I-2B, I-2C, I-2D, I-2E, I-2F, I-2G, I-3A, I-3B, I-3C, I-3D, I-3E, I-3F, I-3G, I-4C, I-4F або I-4G:

50 де

R₁ вибраний з H, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, NH₂, карбоксилу, CH₃, C₂H₅, н-C₃H₇, ізо-C₃H₇, н-C₄H₉, втор-C₄H₉, ізо-C₄H₉, трет-C₄H₉, CH₂F, CH₂Cl, CHF₂, CF₃, CH₂CF₃, CH₂OCH₃, CH₂OCH₂CH₃ або CH₂OCH₂CF₃;

55 R₂ вибраний з H, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, NH₂, карбоксилу, CHO, CH₃, C₂H₅, OCH₃, OC₂H₅ або OCH₂CF₃;

60 R₃ вибраний з H, OH, CHO, COCH₃, COC₂H₅, COC₃H₇, COCF₃, C₆H₅, CH₃, C₂H₅, н-C₃H₇, ізо-C₃H₇, н-C₄H₉, втор-C₄H₉, ізо-C₄H₉, трет-C₄H₉, CF₃, CH₂CF₃, OCH₃, OC₂H₅, OCH₂CF₃, , SCH₃, SC₂H₅, CH₂CH=CH₂, CH₂C≡CH, SO₂CH₃, SO₂CH₂CH₃, SO₂CH₂CF₃, SO₂NHCH₃, SO₂NHC₂H₅, SO₂N(CH₃)₂, SO₂N(C₂H₅)₂, CONHSO₂CH₃, COOCH₃, COOC₂H₅, COOC₃H₇-н, COOC₃H₇-ізо, CONHCH₃, CON(CH₃)₂, COOCH=CH₂, COOC≡CH, SNHCH₃, SNHC₂H₅ або SN(CH₃)₂;

R₄, R₅ можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з H, F, Cl, Br, I, CH₃, C₂H₅, н-С₃H₇, ізо-С₃H₇, н-С₄H₉, втор-С₄H₉, ізо-С₄H₉, трет-С₄H₉, ОСН₃, ОС₂H₅, н-С₃H₇O, ізо-С₃H₇O, н-С₄H₉O, втор-С₄H₉O, ізо-С₄H₉O або трет-С₄H₉O;

5 R₆, R₇ можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з H, F, Cl, Br, I, CH₃, C₂H₅, н-С₃H₇, ізо-С₃H₇, н-С₄H₉, втор-С₄H₉, ізо-С₄H₉, трет-С₄H₉, ОСН₃, ОС₂H₅, н-С₃H₇O, ізо-С₃H₇O, н-С₄H₉O, втор-С₄H₉O, ізо-С₄H₉O або трет-С₄H₉O;

R₈ вибраний з H, CN, F, Cl, Br, I, CH₃, C₂H₅ або CF₃;

R₉ вибраний з H, CN, F, Cl, Br, I, CH₃, C₂H₅ або CF₃;

10 R₁₁ вибраний з F, Cl, Br, I, CN, NH₂, NO₂, CH₃, C₂H₅, н-С₃H₇, ізо-С₃H₇, н-С₄H₉, втор-С₄H₉, ізо-С₄H₉, трет-С₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCl₂, ОСН₃, ОСН₂CH₃, н-С₃H₇O, ізо-С₃H₇O, н-С₄H₉O, втор-С₄H₉O, ізо-С₄H₉O, трет-С₄H₉O, OCF₃, ОСН₂CF₃, COOCH₃, COOC₂H₅, CONH₂, CONHCH₃, CONHC₂H₅ або CON(CH₃)₂;

15 ціле число n вибране від 0 до 5, причому, коли n дорівнює 0, бензольне кільце являє собою незаміщений феніл; коли n дорівнює більше ніж 1, групи R₁₁ можуть бути однаковими або різними;

R₁₄ вибраний з CH₃, C₂H₅, н-С₃H₇, ізо-С₃H₇, н-С₄H₉, втор-С₄H₉, ізо-С₄H₉, трет-С₄H₉, циклопропілу, циклобутилу, CH₂F, CH₂Cl, CHF₂, CF₃ або CH₂CF₃;

20 R₁₅, R₁₆ можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з H, F, Cl, Br, I, NH₂, CN, NO₂, CH₃, C₂H₅, н-С₃H₇, ізо-С₃H₇, н-С₄H₉, втор-С₄H₉, ізо-С₄H₉, трет-С₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCl₂, CH₂CF₃, ОСН₃, ОСН₂CH₃, н-С₃H₇O, ізо-С₃H₇O, н-С₄H₉O, втор-С₄H₉O, ізо-С₄H₉O, трет-С₄H₉O, OCF₃, ОСН₂CF₃, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R₁₁;

25 R₁₇, R₁₈, R₁₉, R₂₀ можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з H, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, CH₃, CF₃, ОСН₃ або OCF₃;

30 R₂₁, R₂₂ можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з H, F, Cl, Br, I, OH, CN, NO₂, CH₃, C₂H₅, н-С₃H₇, ізо-С₃H₇, н-С₄H₉, втор-С₄H₉, ізо-С₄H₉, трет-С₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCl₂, CH₂CF₃, ОСН₃, ОСН₂CH₃, н-С₃H₇O, ізо-С₃H₇O, н-С₄H₉O, втор-С₄H₉O, ізо-С₄H₉O, трет-С₄H₉O, OCF₃, ОСН₂CF₃, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R₁₁;

35 R₂₃, R₂₄, R₂₅, R₂₆ можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з H, F, Cl, Br, I, NH₂, CN, NO₂, CH₃, C₂H₅, н-С₃H₇, ізо-С₃H₇, н-С₄H₉, втор-С₄H₉, ізо-С₄H₉, трет-С₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCl₂, ОСН₃, ОСН₂CH₃, н-С₃H₇O, ізо-С₃H₇O, н-С₄H₉O, втор-С₄H₉O, ізо-С₄H₉O, трет-С₄H₉O, OCF₃ або ОСН₂CF₃;

40 R₂₇, R₂₈ можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з H, F, Cl, Br, I, CH₃, C₂H₅, н-С₃H₇, ізо-С₃H₇, н-С₄H₉, втор-С₄H₉, ізо-С₄H₉, трет-С₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCl₂, CH₂CF₃, ОСН₃, ОСН₂CH₃, н-С₃H₇O, ізо-С₃H₇O, н-С₄H₉O, втор-С₄H₉O, ізо-С₄H₉O, трет-С₄H₉O, OCF₃, ОСН₂CF₃, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R₁₁;

45 R₂₉ вибраний з CH₃, C₂H₅, н-С₃H₇, ізо-С₃H₇, н-С₄H₉, втор-С₄H₉, ізо-С₄H₉, трет-С₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCl₂, циклопропілу, SO₂CH₃, SO₂CH₂CH₃, COCH₃, СОС₂H₅, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R₁₁;

50 R₃₀ вибраний з H, CN, F, Cl, Br, I, CH₃, C₂H₅, н-С₃H₇, ізо-С₃H₇, н-С₄H₉, втор-С₄H₉, ізо-С₄H₉, трет-С₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCl₂, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R₁₁;

55 R₃₁ вибраний з CH₃, C₂H₅, н-С₃H₇, ізо-С₃H₇, н-С₄H₉, втор-С₄H₉, ізо-С₄H₉, трет-С₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCl₂, циклопропілу, SO₂CH₃, SO₂CH₂CH₃, COCH₃, СОС₂H₅, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R₁₁;

60 R₃₂ вибраний з H, CN, F, Cl, Br, I, CH₃, C₂H₅, н-С₃H₇, ізо-С₃H₇, н-С₄H₉, втор-С₄H₉, ізо-С₄H₉, трет-С₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCl₂, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R₁₁;

R₃₃, R₃₄ можуть бути вибрані відповідно з CH₃, C₂H₅, н-С₃H₇, ізо-С₃H₇, н-С₄H₉, втор-С₄H₉, ізо-С₄H₉, трет-С₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCl₂, циклопропілу, COCH₃, СОС₂H₅, COOCH₃, COOC₂H₅, COOCH₂CF₃, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу,

(гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R₁₁;

5 R₃₅, R₃₆ можуть бути вибрані відповідно з H, CN, F, Cl, Br, I, CH₃, C₂H₅, н-С₃H₇, ізо-С₃H₇, н-С₄H₉, втор-С₄H₉, ізо-С₄H₉, трет-С₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFC₂, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R₁₁;

W вибраний з H, F, Cl, Br, I, CH₃, C₂H₅, н-С₃H₇, ізо-С₃H₇, н-С₄H₉, втор-С₄H₉, ізо-С₄H₉, трет-С₄H₉, CH₂F, CH₂Cl, CHF₂, CF₃, CH₂CF₃, OCH₃, OC₂H₅, SCH₃, SC₂H₅, SO₂CH₃ або SO₂CH₂CH₃;

10 або солі, утворені з більш переважних сполук, представлених загальними формулами вище, із хлористоводневою кислотою, сірчаною кислотою, фосфорною кислотою, мурашиною кислотою, оцтовою кислотою, трифтороцтовою кислотою, щавлевою кислотою, метилсульфоною кислотою, п-толуолсульфоною кислотою, бензойною кислотою, алізариновою кислотою, малеїною кислотою, фумаровою кислотою, сорбіною кислотою, яблучною кислотою або лимонною кислотою.

15 У сполуках заміщеного піразолу, що містить піримідиніл, даного винаходу, більш переважні сполуки включають сполуки, представлені загальними формулами I-1C, I-1F, I-1G, I-2C, I-2F, I-2G, I-4C, I-4F або I-4G:

де

R₁ вибраний з H, F, Cl, Br, I, CH₃, C₂H₅ або CHF₂;

20 R₂ вибраний з H, F, Cl, Br, I, NO₂, NH₂, CHO, CH₃, C₂H₅, OCH₃ або OC₂H₅;

R₃ вибраний з H, CH₃, COCH₃, COCF₃, OCH₃, SCH₃, CH₂CH=CH₂, SO₂CH₃, SO₂NHCH₃, SO₂N(CH₃)₂, COOCH₃, CONHCH₃, CON(CH₃)₂, SNHCH₃ або SN(CH₃)₂;

R₄, R₅ можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з H, F, Cl, Br або CH₃;

R₆, R₇ являють собою H;

25 R₈ являє собою H;

R₉ являє собою H;

R₁₁ вибраний з F, Cl, Br, I, CN, NO₂, CH₃, CF₃, OCH₃ або OCF₃;

ціле число n вибране від 0 до 5, причому, коли n дорівнює 0, бензольне кільце являє собою незаміщений феніл; коли n дорівнює більше ніж 1, групи R₁₁ можуть бути однаковими або різними;

30 R₂₃, R₂₄, R₂₅, R₂₆ можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з H, F, Cl, Br, I або CH₃;

R₂₇, R₂₈ можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з H, F, Cl, Br або I;

W вибраний з H, F, Cl, Br, I або CH₃;

35 або солі, утворені з більш переважних сполук, представлених загальними формулами вище, із хлористоводневою кислотою, сірчаною кислотою, фосфорною кислотою, мурашиною кислотою, оцтовою кислотою, трифтороцтовою кислотою, щавлевою кислотою, метилсульфоною кислотою, п-толуолсульфоною кислотою, бензойною кислотою, алізариновою кислотою, малеїною кислотою, фумаровою кислотою, сорбіною кислотою, яблучною кислотою або лимонною кислотою.

40 У сполуках заміщеного піразолу, що містить піримідиніл, даного винаходу, найбільш переважні сполуки включають сполуки, представлені загальними формулами I-1C, I-1F, I-1G, I-2C, I-2G, I-4C, I-4F або I-4G:

де

45 R₁ вибраний з F, Cl, Br, I, CH₃, C₂H₅ або CHF₂;

R₂ вибраний з F, Cl, Br, I, NO₂, NH₂, CHO, CH₃ або OCH₃;

R₃ вибраний з H, CH₃, COCH₃, OCH₃, CH₂CH=CH₂, SO₂CH₃, COOCH₃, CONHCH₃, CON(CH₃)₂ або SN(CH₃)₂;

R₄, R₅ можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з H або CH₃;

50 R₆, R₇ являють собою H;

R₈ являє собою H;

R₉ являє собою H;

R₁₁ вибраний з F, Cl, Br, I, CN, NO₂, CH₃, CF₃, OCH₃ або OCF₃;

55 ціле число n вибране від 1 до 5, причому, коли n дорівнює більше ніж 1, групи R₁₁ можуть бути однаковими або різними;

R₂₃, R₂₄, R₂₅, R₂₆ являють собою H;

R₂₇ являє собою H;

R₂₈ являє собою H;

W вибраний з H, F, Cl, Br або I;

60 або солі, утворені з найбільш переважних сполук, представлених загальними формулами

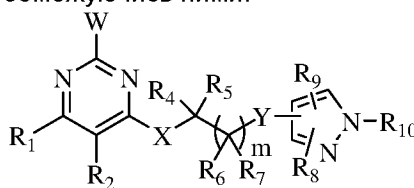
вище, із хлористоводневою кислотою, сірчаною кислотою, фосфорною кислотою, мурашиною кислотою, оцтовою кислотою, трифтороцтовою кислотою, щавлевою кислотою, метилсульфоною кислотою, п-толуолсульфоною кислотою, бензойною кислотою, алізариновою кислотою, малеїною кислотою, фумаровою кислотою, сорбіною кислотою, яблучною кислотою або лимонною кислотою.

Терміни, використані для визначення сполук загальної формули I, є наступними:

"Гало" або "галоген" означає фтор, хлор, або бром йод. "Алкіл" означає прямий або розгалужений алкільний ланцюг, такий як метил, етил, пропіл, ізопропіл або трет-бутил. "Циклоалкіл" означає заміщений або незаміщений циклічний алкіл, такий як циклопропіл, циклопентил або циклогексил. Замісником(ми) є метил, галоген і т. д. "Галогеналкіл" означає прямий або розгалужений алкільний ланцюг, у якому атоми водню можуть бути повністю або частково замінені галогеном, таку як хлорметил, дихлорметил, трихлорметил, фторметил, дифторметил, трифторметил і т.д. "Алкілсульфініл" означає алкіл з прямим або розгалуженим ланцюгом, зв'язаний у структурі за допомогою (-SO-), такий як метилсульфініл. "Галогеналкілсульфініл" означає алкілсульфініл з прямим або розгалуженим ланцюгом, у якому атоми водню можуть бути повністю або частково замінені галогеном. "Галогеналкілсульфоніл" означає алкілсульфоніл з прямим або розгалуженим ланцюгом, у якому атоми водню можуть бути повністю або частково замінені галогеном. "Алкіламініотіо" стосується -SNHCH₃, -SNHC₂H₅. "Діалкіламініотіо" стосується -SN(CH₃)₂, -SN(C₂H₅)₂. "Алкіламіносульфоніл" стосується алкіл-NH-SO₂-. "Діалкіламіносульфоніл" стосується (алкіл)₂-N-SO₂-. "Алкілсульфоніламінокарбоніл" стосується алкіл-SO₂-NH-CO-. "Алкілкарбоніламіносульфоніл" стосується алкіл-CO-NH-SO₂-. "Алкілкарбоніалкіл" стосується алкіл-CO-алкілу-. "Алкілсульфонілокси" стосується алкіл-S(O)₂-O-. "Галогеналкілсульфонілокси" означає ланцюг, у якому атоми водню можуть бути повністю або частково замінені галогеном, такий як CF₃-SO₂-O-. "Циклоалкілоксикарбоніл" означає циклопропілоксикарбоніл, циклогексилоксикарбоніл і т.д. "Алкокси" стосується прямого або розгалуженого алкільного ланцюга, зв'язаного в структурі атомом кисню. "Галогеналкокси" стосується прямого або розгалуженого алкокси ланцюга, у якому атоми водню можуть бути повністю або частково замінені галогеном, такого як хлорметокси, дихлорметокси, трихлорметокси, фторметокси, дифторметокси, трифторметокси, хлорфторметокси, трифторетокси і т.д. "Галогеналкоксикарбоніл" стосується алкоксикарбонілу з прямим або розгалуженим ланцюгом, у якому атоми водню можуть бути повністю або частково замінені галогеном, такий як ClCH₂CH₂OCO-, CF₃CH₂OCO- і т.д. "Алкокіалкіл" означає алкіл-O-алкіл-, такий як -CH₂OCH₃. "Галогеналкокіалкіл" стосується алкокіалкілу, у якому атоми водню можуть бути повністю або частково замінені галогеном, такого як -CH₂OCH₂CH₂Cl, -CH₂OCH₂CF₃ і т.д. "Алкоксикарбоніалкіл" стосується алкоксикарбоніалкілу-, такого як -CH₂COOCH₃. "Галогеналкоксикарбоніалкіл" стосується алкоксикарбоніалкілу, у якому алкоксикарбонільні атоми водню можуть бути повністю або частково замінені галогеном, таким як -CH₂COOCH₂CF₃. "Алкілкарбонілокси" означає -OCOCH₃, і т.д. "Галогеналкілкарбонілокси" стосується алкілкарбонілокси, у якому атоми водню можуть бути повністю або частково замінені галогеном, таким як -OCOCF₃ і т.д. "Алкоксикарбонілокси" стосується алкоксикарбонілокси, такого як -OCOOCH₃. "Галогеналкоксикарбонілокси" стосується алкоксикарбонілокси, у якому атоми водню можуть бути повністю або частково замінені галогеном, таким як -OCOOCH₂CF₃. "Алкілтіокарбоніалкіл" стосується алкілтіокарбоніалкілу-, такого як -CH₂COSCH₃. "Галогеналкілтіокарбоніалкіл" стосується алкілтіокарбоніалкілу, у якому атоми водню можуть бути повністю або частково замінені галогеном, таким як -CH₂COSCH₂CF₃. "Алкокіалкокси" означає -OCH₂OCH₃ і т.д. "Галогеналкокіалкокси" стосується алкокіалкокси, у якому атоми водню можуть бути повністю або частково замінені галогеном, таким як -OCH₂OCH₂CF₃. "Алкокіалкоксикарбоніл" стосується -COOCH₂CH₂OCH₃ і т.д. "Алкілтіо" стосується прямого або розгалуженого алкільного ланцюга, зв'язаного в структурі атомом сірки. "Галогеналкілтіо" стосується прямого або розгалуженого ланцюга алкілтіо, у якому атоми водню можуть бути повністю або частково замінені галогеном, такого як хлорметилтіо, дихлорметилтіо, трихлорметилтіо, фторметилтіо, дифторметилтіо, трифторметилтіо, хлорфторметилтіо і т.д. "Алкілтіоалкіл" означає алкіл-S-алкіл-, такий як -CH₂SCH₃. "Галогеналкілтіоалкіл" стосується алкілтіоалкілу, у якому атоми водню можуть бути повністю або частково замінені галогеном, таким як -CH₂SCH₂CH₂Cl, -CH₂SCH₂CF₃. "Алкіламіно" стосується прямого або розгалуженого алкільного ланцюга, зв'язаного в структурі атомом азоту. "Галогеналкіламіно" стосується прямого або розгалуженого алкіламіно ланцюга, у якому атоми водню можуть бути повністю або частково замінені галогеном. "Діалкіламіно" стосується такого, як -N(CH₃)₂, -N(CH₃CH₂)₂. "Дигалогеналкіламіно" стосується діалкіламіно, у якому атоми водню можуть бути повністю або частково замінені галогеном, таким як -N(CF₃)₂, -N(CH₂CF₃)₂. "Алкеніл" стосується прямого або

розгалуженого алкенільного ланцюга, такого як етеніл, 1-пропеніл, 2-пропеніл і різних ізомерів бутенілу, пентенілу і гексенілу. Алкеніл також включає полієн, такий як пропа-1,2-дієніл і гекса-2,4-дієніл. "Галогеналкеніл" стосується прямого або розгалуженого алкенільного ланцюга, у якому атоми водню можуть бути повністю або частково замінені галогеном. "Алкеноксил" стосується прямого або розгалуженого алкенільного ланцюга, зв'язаного в структурі киснем. "Галогеналкеноксил" означає алкеноксил з прямим або розгалуженим ланцюгом, у якому атоми водню можуть бути повністю або частково замінені галогеном. "Алкенілтїо" стосується прямого або розгалуженого ланцюга алкенілу, зв'язаного в структурі атомом сірки, такого як -SCH₂CH=CH₂. "Алкеноксилкарбоніл" означає CH₂=CHCH₂OCO- і т.д. "Алкініл" стосується прямого або розгалуженого ланцюга алкінілу, такого як етиніл, 1-пропініл, 2-пропініл і різних ізомерів бутинілу, пентинілу і гексинілу. Алкініл також включає групи, що містять більше ніж один потрійний зв'язок, такі як гекса-2,5-діїніл. "Галогеналкініл" стосується прямого або розгалуженого ланцюга алкінілу, у якому атоми водню можуть бути повністю або частково замінені галогеном. "Алкіноксил" стосується прямого або розгалуженого ланцюга алкінів, зв'язаного в структурі киснем. "Галогеналкіноксил" стосується прямого або розгалуженого ланцюга алкіноксиду, у якому атоми водню можуть бути повністю або частково замінені галогеном. "Алкіноксилкарбоніл" означає -COOCH₂C≡CH і т.д. "Алкілсульфоніл" означає алкіл з прямим або розгалуженим ланцюгом, зв'язаним в структурі за допомогою (-SO₂-), таким як метилсульфоніл. "Галогеналкілсульфоніл" означає алкілсульфініл з прямим або розгалуженим ланцюгом, у якому атоми водню можуть бути повністю або частково замінені галогеном. "Алкілкарбоніл" означає алкіл, зв'язаний у структурі карбонілом, такий як -COCH₃, -COCH₂CH₃. "Галогеналкілкарбоніл" означає алкілкарбоніл з прямим або розгалуженим ланцюгом, у якому атоми водню можуть бути повністю або частково замінені галогеном, такий як -COCF₃. "Алкоксикарбоніл" означає алкокси, зв'язаний у структурі карбонілом, такий як -COOCH₃, -COOCH₂CH₃. "Амінокарбоніл" означає NH₂CO-. "Алкіламінокарбоніл" означає алкіл-NH-CO-, такий як -CONHCH₃, -CONHCH₂CH₃. "Діалкіламінокарбоніл" означає -CON(CH₃)₂, -CON(CH₂CH₃)₂. "Арил" у (гетеро)арилі, (гетеро)арилалкілі, (гетеро)арилкарбонілі, (Гетеро)арилметилкарбонілі, (гетеро)арилкарбоніалкілі, (гетеро)арилоксикарбонілі, (гетеро)арилалкілоксикарбонілі включає феніл або нафтил і т.д. "Гетероарил" означає п'ятичленне кільце або шестичленне кільце, що містить один або більш N, O, S гетероатомів, таке як фурил, піразоліл, триазоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл, піридазиніл, триазиніл, хінолініл і т.д. "(Гетеро)арил" стосується фенілу і т.д. "(Гетеро)арилалкіл" означає бензил, фенілетил, 4-хлорбензил, 2-хлорпіридин-5-ілметил, 2-хлортіазол-5-ілметил і т.д. "(Гетеро)арилкарбоніл" стосується бензоїлу, 4-Cl-бензоїлу, і т.д. "(Гетеро)арилметилкарбоніл" стосується PhCH₂CO-. "(Гетеро)арилкарбоніалкіл" стосується PhCOCH₂-. "(Гетеро)арилоксикарбоніл" стосується феноксикарбонілу, п-хлорфеноксикарбонілу, п-нітрофеноксикарбонілу, нафтилоксикарбонілу і т.д. Арилалкілоксикарбоніл означає бензилоксикарбоніл, п-хлорбензилоксикарбоніл, п-трифторметилбензилоксикарбоніл і т.д. "(Гетеро)арилалкілоксикарбоніл" стосується -COOCH₂Ph, -COOCH₂-4-Cl-Ph і т.д.

У загальній формулі I деякі переважні замісники R₁, R₂, R₃(X=NR₃), R₄(R₅), R₆(R₇), R₈, R₉, R₁₀ і w окремо перераховані в таблиці 1, таблиці 2, таблиці 3, таблиці 4, таблиці 5, таблиці 6, таблиці 7, таблиці 8 і таблиці 9, але, не обмежуючись ними.



I

Таблиця 1

R₁ замісники

R ₁	R ₁	R ₁	R ₁
H	F	Cl	Br
I	CH ₃	C ₂ H ₅	н-С ₃ H ₇
ізо-С ₃ H ₇	н-С ₄ H ₉	втор-С ₄ H ₉	ізо-С ₄ H ₉
трет-С ₄ H ₉	CF ₃	CCl ₃	CHF ₂
CH ₂ Cl	CHBr ₂	CF ₃ CH ₂	CH(CH ₃)F
CH(CH ₃)Cl	CH(CH ₃)Br	C(CH ₃) ₂ F	CH=CH ₂
C≡CH	SCH ₃	SOCH ₃	SO ₂ CH ₃
CN	NO ₂	NH ₂	COOH
COOCH ₃	COOC ₂ H ₅	CH ₃ NH	C ₂ H ₅ NH
OCH ₃	OC ₂ H ₅	OCF ₃	OCH ₂ CH=CH ₂
OCH ₂ CH=CHCl	OCH ₂ C≡CH	OCH ₂ C≡C-I	OCH ₂ C≡CCH ₃
CONH ₂	CONHCH ₃	CON(CH ₃) ₂	NHCH ₃
NHC ₂ H ₅	N(CH ₃) ₂	N(C ₂ H ₅) ₂	CH ₂ OCH ₃
CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃
CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃			

Таблиця 2

R₂ замісники

R ₂	R ₂	R ₂	R ₂
H	F	Cl	Br
I	CN	NO ₂	NH ₂
CHO	CH ₃	C ₂ H ₅	н-С ₃ H ₇
ізо-С ₃ H ₇	н-С ₄ H ₉	втор-С ₄ H ₉	ізо-С ₄ H ₉
трет-С ₄ H ₉	OCH ₃	OC ₂ H ₅	OC ₃ H ₇ -н
OC ₃ H ₇ -ізо	OC ₄ H ₉ -н	OC ₄ H ₉ -ізо	OC ₄ H ₉ -трет
OCH ₂ F	OCHF ₂	OCF ₃	OCH ₂ CF ₃

Таблиця 3

R₃ замісники

R ₃	R ₃	R ₃	R ₃
H	OH	-C(=O)H	CBr ₃
CH ₃	C ₂ H ₅	н-С ₃ H ₇	ізо-С ₃ H ₇
н-С ₄ H ₉	ізо-С ₄ H ₉	трет-С ₄ H ₉	CCl ₃
CH ₂ Br	CHF ₂	CHBr ₂	CF ₃
CH ₂ Cl	CHCl ₂	CCl ₃	CH ₂ F
OCH ₃	OC ₂ H ₅	OCH(CH ₃) ₂	OC(CH ₃) ₃
OCF ₃	OCH ₂ CF ₃	OCH ₂ F	OCHF ₂
SCH ₃	SC ₂ H ₅	SCH ₂ CH=CH ₂	CH=CH ₂
CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CCl ₂	C≡CH	CH ₂ C≡CH
CH ₂ C≡C-I	CH ₂ OCH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₂ OCH ₂ Cl	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ Cl	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ Cl
CH ₂ SCH ₃	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃
CH ₂ SCH ₂ Cl	CH ₂ SCH ₂ CH ₂ Cl	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ Cl	SOCH ₃
SOC ₂ H ₅	SOCF ₃	SOCH ₂ CF ₃	SO ₂ CH ₃
SO ₂ C ₂ H ₅	SO ₂ CF ₃	SO ₂ CH ₂ CF ₃	SO ₂ NHCOCH ₃
SO ₂ NHCH ₃	SO ₂ N(CH ₃) ₃	CONHSO ₂ CH ₃	COCH ₃
COC ₂ H ₅	CO-н-С ₃ H ₇	CO-ізо-С ₃ H ₇	CO-н-С ₄ H ₉

Продовження таблиці 3

CO-ізо-C ₄ H ₉	CO-трет-C ₄ H ₉	COCF ₃	COCH ₂ Cl
COOCH ₃	COOC ₂ H ₅	COO-н-C ₃ H ₇	COO-трет-C ₄ H ₉
COOCF ₃	COOCH ₂ CH ₂ Cl	COOCH ₂ CF ₃	CH ₂ COOCH ₃
CH ₂ COOC ₂ H ₅	CH ₂ COCH ₃	CH ₂ COC ₂ H ₅	CONHCH ₃
CONHC ₂ H ₅	CONH-трет-C ₄ H ₉	CON(CH ₃) ₂	CON(C ₂ H ₅) ₂
COOCH ₂ CH=CH ₂	COOCH ₂ C≡CH	COOCH ₂ OCH ₃	COOCH ₂ CH ₂ OCH ₃
SNHCH ₃	SNHC ₂ H ₅	SN(CH ₃) ₂	SN(C ₂ H ₅) ₂
CO-O-	CO-O-	CO-O-	CO-O-
		CO-	CO-
CO-	CO-	CO-	CO-O-
CO-O-	CO-O-	CO-O-	CO-O-
CO-O-	CO-O-	CO-O-	CO-O-
CO-O-	CO-O-		

Таблиця 4

R₄(R₅) замісники

R ₄ (R ₅)	R ₄ (R ₅)	R ₄ (R ₅)	R ₄ (R ₅)
H	F	Cl	Br
I	CH ₃	C ₂ H ₅	н-C ₃ H ₇
ізо-C ₃ H ₇	н-C ₄ H ₉	втор-C ₄ H ₉	ізо-C ₄ H ₉
трет-C ₄ H ₉	CF ₃	CCl ₃	CHF ₂
CH ₂ Cl	CHBr ₂	CF ₃ CH ₂	CH(CH ₃)F
CH(CH ₃)Cl	CH(CH ₃)Br	C(CH ₃) ₂ F	OCH ₃
OC ₂ H ₅	н-C ₃ H ₇ O	ізо-C ₃ H ₇ O	н-C ₄ H ₉ O
втор-C ₄ H ₉ O	ізо-C ₄ H ₉ O	трет-C ₄ H ₉ O	OCF ₃
OCH ₂ CF ₃			
CR ₄ R ₅			

Таблиця 5

R₆(R₇) замісники

R ₆ (R ₇)	R ₆ (R ₇)	R ₆ (R ₇)	R ₆ (R ₇)
H	F	Cl	Br
I	CH ₃	C ₂ H ₅	n-C ₃ H ₇
ізо-C ₃ H ₇	n-C ₄ H ₉	втор-C ₄ H ₉	ізо-C ₄ H ₉
трет-C ₄ H ₉	CF ₃	CCl ₃	CHF ₂
CH ₂ Cl	CHBr ₂	CF ₃ CH ₂	CH(CH ₃)F
CH(CH ₃)Cl	CH(CH ₃)Br	C(CH ₃) ₂ F	OCH ₃
OC ₂ H ₅	n-C ₃ H ₇ O	ізо-C ₃ H ₇ O	n-C ₄ H ₉ O
втор-C ₄ H ₉ O	ізо-C ₄ H ₉ O	трет-C ₄ H ₉ O	OCF ₃
OCH ₂ CF ₃			
CR ₆ R ₇			
			

Таблиця 6

R₈ замісники

R ₈	R ₈	R ₈	R ₈
H	CN	CH ₃	C ₂ H ₅
n-C ₃ H ₇	ізо-C ₃ H ₇	n-C ₄ H ₉	втор-C ₄ H ₉
ізо-C ₄ H ₉	трет-C ₄ H ₉	CF ₃	CCl ₃
CHF ₂	CH ₂ F	CH ₂ Cl	CH ₂ CF ₃
CF ₂ CF ₃	COOCH ₃	Ph	Ph-4-Cl

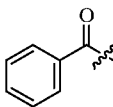
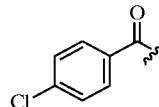
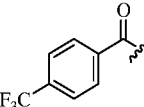
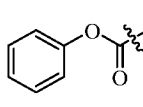
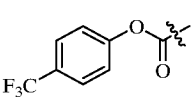
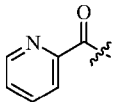
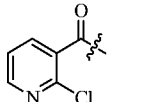
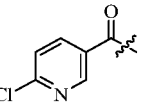
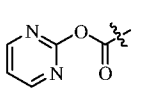
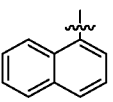
Таблиця 7

R₉ замісники

R ₉	R ₉	R ₉	R ₉
H	CN	CH ₃	C ₂ H ₅
n-C ₃ H ₇	ізо-C ₃ H ₇	n-C ₄ H ₉	втор-C ₄ H ₉
ізо-C ₄ H ₉	трет-C ₄ H ₉	CF ₃	CCl ₃
CHF ₂	CH ₂ F	CH ₂ Cl	CH ₂ CF ₃
CF ₂ CF ₃	COOCH ₃	Ph	Ph-4-Cl

Таблиця 8

R₁₀ замісники

R ₁₀	R ₁₀	R ₁₀	R ₁₀	R ₁₀
CH ₃	Et	n-Pr	i-Pr	n-Bu
i-Bu	s-Bu	трет-Bu	CH ₂ F	CHF ₂
CF ₃	CH ₂ CF ₃	COCH ₃	COEt	CO-n-Pr
CO-n-Bu	CO-трет-Bu	COCF ₃	CO ₂ CH ₃	CO ₂ Et
CO ₂ -n-Pr	CO ₂ -ізо-Pr	CO ₂ -трет-Bu	CO ₂ CH ₂ CF ₃	CH ₂ OCH ₃
				
				

Продовження таблиці 8

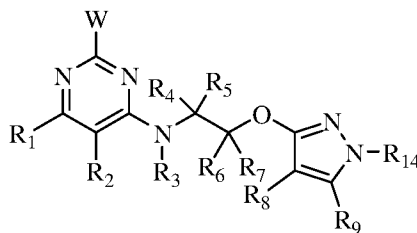
Таблиця 9

W замісники

W	W	W	W	W
H	i3o-C ₃ H ₇	CHF ₂	OCH ₃	SCH ₃
F	n-C ₄ H ₉	CHBr ₂	OC ₂ H ₅	SC ₂ H ₅
Cl	i3o-C ₄ H ₉	CF ₃	OC ₃ H ₇ -н	SC ₃ H ₇ -н
Br	CH ₃	CH(CH ₃)F	OC ₃ H ₇ -i3o	SC ₃ H ₇ -i3o
I	C ₂ H ₅	CH(CH ₃)Cl	OC ₄ H ₉ -н	SC ₄ H ₉ -н
	CHCl ₂	CH(CH ₃)Br	OC ₄ H ₉ -i3o	SC ₄ H ₉ -i3o
	CCl ₃	CH(n-C ₄ H ₉)F	OC ₄ H ₉ -трет	SC ₄ H ₉ -трет
		C(CH ₃) ₂ F	OCF ₃	SO ₂ CH ₃
		n-C ₃ H ₇	OCH ₂ CF ₃	трет-C ₄ H ₉

Деякі сполуки загальної формули I за даним винаходом також детально пояснені наступними сполуками, перерахованими в таблицях 10-128, але, не обмежуючись ними. У загальних формулах I-1A, I-1B, I-1C, I-1D, I-1E, I-1F, I-1G, I-1H, I-1I, I-1J, I-1K, I-1L, I-1M, I-1N, I-2A, I-2B, I-2C, I-2D, I-2E, I-2F, I-2G, I-3A, I-3B, I-3C, I-3D, I-3E, I-3F або I-3G W=R₆=R₇=R₈=R₉=R₂₃=R₂₄=R₂₅=R₂₆=R₂₇=H.

У загальній формулі I-IA:



I-1A

$R_1=Cl$, $R_2=Cl$, $R_3=R_4=R_5=H$, замісники R_{14} представлені в таблиці 10, ілюстративні сполуки позначені цифровими кодами 10-1-10-15.

5

Таблица 10

№	R_{14}	№	R_{14}	№	R_{14}
10-1	CH_3	10-2	C_2H_5	10-3	$n-C_3H_7$
10-4	$iso-C_3H_7$	10-5	$n-C_4H_9$	10-6	$втор-C_4H_9$
10-7	$iso-C_4H_9$	10-8	$трет-C_4H_9$	10-9	CF_3
10-10	CH_2CF_3	10-11	CF_2CF_3	10-12	
10-13		10-14		10-15	

Таблиця 11: де в загальній формулі I-IA $R_1=CH_3$, $R_2=Cl$, $R_3=R_4=R_5=H$, замісники R_{14} узгоджуються з представленими в таблиці 10 і відповідають значенням для сполук 10-1-10-15 у таблиці 10, у свою чергу, ілюстративні сполуки позначені цифровими кодами 11-1-11-15.

10

Таблиця 12: де в загальній формулі I-IA $R_1=C_2H_5$, $R_2=Cl$, $R_3=R_4=R_5=H$, замісники R_{14} узгоджуються з представленими в таблиці 10 і відповідають значенням для сполук 10-1-10-15 у таблиці 10, у свою чергу, ілюстративні сполуки позначені цифровими кодами 12-1-12-15.

Таблиця 13: де в загальній формулі I-IA $R_1=CHF_2$, $R_2=Cl$, $R_3=R_4=R_5=H$, замісники R_{14} узгоджуються з представленими в таблиці 10 і відповідають значенням для сполук 10-1-10-15 у таблиці 10, у свою чергу, ілюстративні сполуки позначені цифровими кодами 13-1-13-15.

15

Таблиця 14: де в загальній формулі I-IA $R_1=CF_3$, $R_2=Cl$, $R_3=R_4=R_5=H$, замісники R_{14} узгоджуються з представленими в таблиці 10 і відповідають значенням для сполук 10-1-10-15 у таблиці 10, у свою чергу, ілюстративні сполуки позначені цифровими кодами 14-1-14-15.

Таблиця 15: де в загальній формулі I-IA $R_1=Cl$, $R_2=Cl$, $R_3=R_4=H$, $R_5=CH_3$, замісники R_{14} узгоджуються з представленими в таблиці 10 і відповідають значенням для сполук 10-1-10-15 у таблиці 10, у свою чергу, ілюстративні сполуки позначені цифровими кодами 15-1-15-15.

20

Таблиця 16: де в загальній формулі I-IA $R_1=CH_3$, $R_2=Cl$, $R_3=R_4=H$, $R_5=CH_3$, замісники R_{14} узгоджуються з представленими в таблиці 10 і відповідають значенням для сполук 10-1-10-15 у таблиці 10, у свою чергу, ілюстративні сполуки позначені цифровими кодами 16-1-16-15.

25

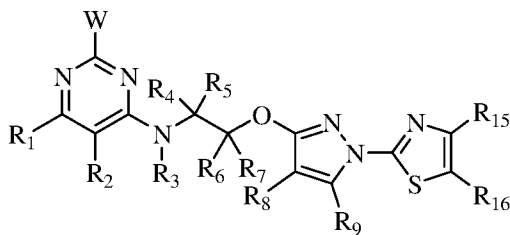
Таблиця 17: де в загальній формулі I-IA $R_1=C_2H_5$, $R_2=Cl$, $R_3=R_4=H$, $R_5=CH_3$, замісники R_{14} узгоджуються з представленими в таблиці 10 і відповідають значенням для сполук 10-1-10-15 у таблиці 10, у свою чергу, ілюстративні сполуки позначені цифровими кодами 17-1-17-15.

Таблиця 18: де в загальній формулі I-IA $R_1=CHF_2$, $R_2=Cl$, $R_3=R_4=H$, $R_5=CH_3$, замісники R_{14} узгоджуються з представленими в таблиці 10 і відповідають значенням для сполук 10-1-10-15 у таблиці 10, у свою чергу, ілюстративні сполуки позначені цифровими кодами 18-1-18-15.

30

Таблиця 19: де в загальній формулі I-IA $R_1=CF_3$, $R_2=Cl$, $R_3=R_4=H$, $R_5=CH_3$, замісники R_{14} узгоджуються з представленими в таблиці 10 і відповідають значенням для сполук 10-1-10-15 у таблиці 10, у свою чергу, ілюстративні сполуки позначені цифровими кодами 19-1-19-15.

У загальній формулі I-IB:

**I-1B**

$R_1=Cl$, $R_2=Cl$, $R_3=R_4=R_5=H$, замісники R_{15} і R_{16} представлені в таблиці 20, ілюстративні сполуки позначені цифровими кодами 20-1-20-10.

Таблиця 20

№	R_{15}	R_{16}
20-1	H	H
20-2	H	Br
20-3	H	CH ₃
20-4	H	NO ₂
20-5	H	CN
20-6	H	CF ₃
20-7	Cl	H
20-8	CH ₃	H
20-9	CF ₃	H
20-10	CF ₃	CO ₂ CH ₃

5

Таблиця 21: де в загальній формулі I-IB $R_1=CH_3$, $R_2=Cl$, $R_3=R_4=R_5=H$, замісники R_{15} і R_{16} узгоджуються з представленими в таблиці 20 і відповідають значенням для сполук 20-1-20-10 у таблиці 20, у свою чергу, ілюстративні сполуки позначені цифровими кодами 21-1-21-10.

10 Таблиця 22: де в загальній формулі I-IB $R_1=C_2H_5$, $R_2=Cl$, $R_3=R_4=R_5=H$, замісники R_{15} і R_{16} узгоджуються з представленими в таблиці 20 і відповідають значенням для сполук 20-1-20-10 у таблиці 20, у свою чергу, ілюстративні сполуки позначені цифровими кодами 22-1-22-10.

Таблиця 23: де в загальній формулі I-IB $R_1=CHF_2$, $R_2=Cl$, $R_3=R_4=R_5=H$, замісники R_{15} і R_{16} узгоджуються з представленими в таблиці 20 і відповідають значенням для сполук 20-1-20-10 у таблиці 20, у свою чергу, ілюстративні сполуки позначені цифровими кодами 23-1-23-10.

15 Таблиця 24: де в загальній формулі I-IB $R_1=CF_3$, $R_2=Cl$, $R_3=R_4=R_5=H$, замісники R_{15} і R_{16} узгоджуються з представленими в таблиці 20 і відповідають значенням для сполук 20-1-20-10 у таблиці 20, у свою чергу, ілюстративні сполуки позначені цифровими кодами 24-1-24-10.

20 Таблиця 25: де в загальній формулі I-IB $R_1=Cl$, $R_2=Cl$, $R_3=R_4=H$, $R_5=CH_3$, замісники R_{15} і R_{16} узгоджуються з представленими в таблиці 20 і відповідають значенням для сполук 20-1-20-10 у таблиці 20, у свою чергу, ілюстративні сполуки позначені цифровими кодами 25-1-25-10.

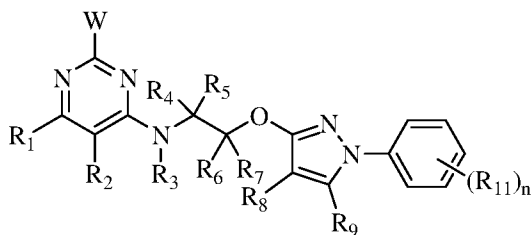
Таблиця 26: де в загальній формулі I-IB $R_1=CH_3$, $R_2=Cl$, $R_3=R_4=H$, $R_5=CH_3$, замісники R_{15} і R_{16} узгоджуються з представленими в таблиці 20 і відповідають значенням для сполук 20-1-20-10 у таблиці 20, у свою чергу, ілюстративні сполуки позначені цифровими кодами 26-1-26-10.

25 Таблиця 27: де в загальній формулі I-IB $R_1=C_2H_5$, $R_2=Cl$, $R_3=R_4=H$, $R_5=CH_3$, замісники R_{15} і R_{16} погодяться з представленими в таблиці 20 і відповідають значенням для сполук 20-1-20-10 у таблиці 20, у свою чергу, ілюстративні сполуки позначені цифровими кодами 27-1-27-10.

Таблиця 28: де в загальній формулі I-IB $R_1=CHF_2$, $R_2=Cl$, $R_3=R_4=H$, $R_5=CH_3$, замісники R_{15} і R_{16} узгоджуються з представленими в таблиці 20 і відповідають значенням для сполук 20-1-20-10 у таблиці 20, у свою чергу, ілюстративні сполуки позначені цифровими кодами 28-1-28-10.

30 Таблиця 29: де в загальній формулі I-IB $R_1=CF_3$, $R_2=Cl$, $R_3=R_4=H$, $R_5=CH_3$, замісники R_{15} і R_{16} узгоджуються з представленими в таблиці 20 і відповідають значенням для сполук 20-1-20-10 у таблиці 20, у свою чергу, ілюстративні сполуки позначені цифровими кодами 29-1-29-10.

У загальній формулі I-IC:



I-1C

$R_1=Cl$, $R_2=Cl$, $R_3=R_4=R_5=H$, замісники $(R_{11})_n$ представлені в таблиці 30, ілюстративні сполуки позначені цифровими кодами 30-1-30-279.

Таблиця 30

№	$(R_{11})_n$	№	$(R_{11})_n$	№	$(R_{11})_n$
30-1	H	30-2	2-F	30-3	3-F
30-4	4-F	30-5	2,3-2F	30-6	2,4-2F
30-7	2,5-2F	30-8	2,6-2F	30-9	3,4-2F
30-10	3,5-2F	30-11	2,3,4-3F	30-12	2,3,5-3F
30-13	2,4,5-3F	30-14	2,3,6-3F	30-15	2,4,6-3F
30-16	3,4,5-3F	30-17	2-Cl	30-18	3-Cl
30-19	4-Cl	30-20	2,3-2Cl	30-21	2,4-2Cl
30-22	2,5-2Cl	30-23	2,6-2Cl	30-24	3,4-2Cl
30-25	3,5-2Cl	30-26	2,3,4-3Cl	30-27	2,3,5-3Cl
30-28	2,4,5-3Cl	30-29	2,3,6-3Cl	30-30	2,4,6-3Cl
30-31	3,4,5-3Cl	30-32	2-Br	30-33	3-Br
30-34	4-Br	30-35	2,3-Br	30-36	2,4-2Br
30-37	2,5-2Br	30-38	2,6-2Br	30-39	3,4-2Br
30-40	3,5-2Br	30-41	2,3,4-3Br	30-42	2,3,5-3Br
30-43	2,4,5-3Br	30-44	2,3,6-3Br	30-45	2,4,6-3Br
30-46	3,4,5-3Br	30-47	2-CN	30-48	3-CN
30-49	4-CN	30-50	2-NO ₂	30-51	3-NO ₂
30-52	4-NO ₂	30-53	2,4-2NO ₂	30-54	2,4,6-3NO ₂
30-55	2-CH ₃	30-56	3-CH ₃	30-57	4-CH ₃
30-58	2,3-2CH ₃	30-59	2,4-2CH ₃	30-60	2,5-2CH ₃
30-61	2,6-2CH ₃	30-62	3,4-2CH ₃	30-63	3,5-2CH ₃
30-64	2-C ₂ H ₅	30-65	3-C ₂ H ₅	30-66	4-C ₂ H ₅
30-67	2-CF ₃	30-68	3-CF ₃	30-69	4-CF ₃
30-70	2-OCH ₃	30-71	3-OCH ₃	30-72	4-OCH ₃
30-73	2-SCH ₃	30-74	3-SCH ₃	30-75	4-SCH ₃
30-76	2-OCF ₃	30-77	3-OCF ₃	30-78	4-OCF ₃
30-79	2-SCF ₃	30-80	3-SCF ₃	30-81	4-SCF ₃
30-82	2-OC ₂ H ₅	30-83	3-OC ₂ H ₅	30-84	4-OC ₂ H ₅
30-85	2-NHCH ₃	30-86	3-NHCH ₃	30-87	4-NHCH ₃
30-88	2-N(CH ₃) ₂	30-89	3-N(CH ₃) ₂	30-90	4-N(CH ₃) ₂
30-91	2-COCH ₃	30-92	3-COCH ₃	30-93	4-COCH ₃
30-94	2-COC ₂ H ₅	30-95	3-COC ₂ H ₅	30-96	4-COC ₂ H ₅
30-97	2-SO ₂ CH ₃	30-98	3-SO ₂ CH ₃	30-99	4-SO ₂ CH ₃
30-100	2-OCHF ₂	30-101	3-OCHF ₂	30-102	4-OCHF ₂
30-103	2-SO ₂ C ₂ H ₅	30-104	3-SO ₂ C ₂ H ₅	30-105	4-SO ₂ C ₂ H ₅
30-106	2-CO ₂ CH ₃	30-107	3-CO ₂ CH ₃	30-108	4-CO ₂ CH ₃
30-109	2-CO ₂ C ₂ H ₅	30-110	3-CO ₂ C ₂ H ₅	30-111	4-CO ₂ C ₂ H ₅
30-112	2-CH ₂ OCH ₃	30-113	3-CH ₂ OCH ₃	30-114	4-CH ₂ OCH ₃
30-115	2-OCOCH ₃	30-116	3-OCOCH ₃	30-117	4-OCOCH ₃
30-118	2-OCOCH ₂ CH ₃	30-119	3-OCOCH ₂ CH ₃	30-120	4-OCOCH ₂ CH ₃
30-121	2-OCO ₂ CH ₃	30-122	3-OCO ₂ CH ₃	30-123	4-OCO ₂ CH ₃
30-124	2-OCH ₂ OCH ₃	30-125	3-OCH ₂ OCH ₃	30-126	4-OCH ₂ OCH ₃
30-127	2-OCF ₂ OCF ₃	30-128	3-OCF ₂ OCF ₃	30-129	4-OCF ₂ OCF ₃

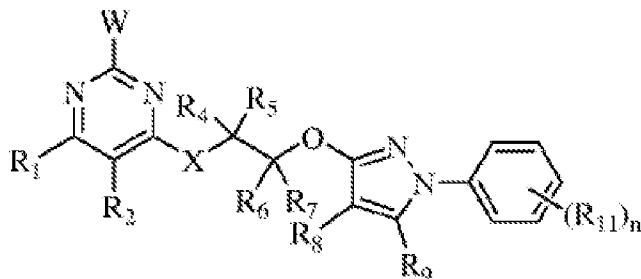
30-130	2-COPh	30-131	3-COPh	30-132	4-COPh
30-133	2-COCH ₂ Ph	30-134	3-COCH ₂ Ph	30-135	4-COCH ₂ Ph
30-136	2-NHPh	30-137	3-NHPh	30-138	4-NHPh
30-139	2-OPh	30-140	3-OPh	30-141	4-OPh
30-142	2-CONHPh	30-143	3-CONHPh	30-144	4-CONHPh
30-145	2-CO ₂ Ph	30-146	3-CO ₂ Ph	30-147	4-CO ₂ Ph
30-148	2-CONH ₂	30-149	3-CONH ₂	30-150	4-CONH ₂
30-151	2-Cl-4-F	30-152	2-Cl-4-Br	30-153	2-Cl-4-CH ₃
30-154	2-Cl-4-CF ₃	30-155	2-Cl-4-NO ₂	30-156	2-Cl-4-CN
30-157	2-Cl-4-OCF ₃	30-158	2-F-4-Cl	30-159	2-Br-4-Cl
30-160	2-CH ₃ -4-Cl	30-161	2-CF ₃ -4-Cl	30-162	2-NO ₂ -4-Cl
30-163	2-CN-4-Cl	30-164	2-OCF ₃ -4-Cl	30-165	2,6-2Cl-4-NO ₂
30-166	2,6-2Cl-4-CF ₃	30-167	2,6-2Cl-4-CN	30-168	2,6-2Cl-4-COCH ₃
30-169	2,6-2Cl-4-CONH ₂	30-170	2,4-2Cl-6-NO ₂	30-171	2,4-2Cl-6-CN
30-172	2,4-2Cl-6-CF ₃	30-173	2,4-2F-6-NO ₂	30-174	2,6-2F-4-NO ₂
30-175	2-NO ₂ -4-F	30-176	2-NO ₂ -4-Br	30-177	2-NO ₂ -4-CF ₃
30-178	2-NO ₂ -4-CN	30-179	2-NO ₂ -4-COCH ₃	30-180	2-NO ₂ -4-CONH ₂
30-181	2-NO ₂ -4-CH ₃	30-182	2-NO ₂ -4-OCH ₃	30-183	2-NO ₂ -4-SCH ₃
30-184	2-NO ₂ -4-NCH ₃	30-185	2-F-4-NO ₂	30-186	2-Br-4-NO ₂
30-187	2-CF ₃ -4-NO ₂	30-188	2-CN-4-NO ₂	30-189	2-COCH ₃ -4-NO ₂
30-190	2-CONH ₂ -4-NO ₂	30-191	2-CH ₃ -4-NO ₂	30-192	2-Cl-4-F-6-NO ₂
30-193	2-Cl-4-Br-6-NO ₂	30-194	2-Cl-4-CH ₃ -6-NO ₂	30-195	2-Cl-4-CF ₃ -6-NO ₂
30-196	2-Cl-4,6-2NO ₂	30-197	2-Cl-4-CN-6-NO ₂	30-198	2-Cl-4-OCF ₃ -6-NO ₂
30-199	2-F-4-Cl-6-NO ₂	30-200	2-Br-4-Cl-6-NO ₂	30-201	2-CH ₃ -4-Cl-6-NO ₂
30-202	2-CF ₃ -4-Cl-6-NO ₂	30-203	4-Cl-2,6-2NO ₂	30-204	2-CF ₃ -4-CN
30-205	2-CN-4-CF ₃	30-206	4-CF ₃ -2,6-2NO ₂	30-207	4-CN-2,6-2NO ₂
30-208	4-CH ₃ -2,6-2NO ₂	30-209	4-OCF ₃ -2,6-2NO ₂	30-210	4-OCH ₃ -2,6-2NO ₂
30-211	4-SCH ₃ -2,6-2NO ₂	30-212	4-NHCH ₃ -2,6-2NO ₂	30-213	4-F-2,6-2NO ₂
30-214	2-CF ₃ -4,6-2NO ₂	30-215	2-CN-4,6-2NO ₂	30-216	2-CH ₃ -4,6-2NO ₂
30-217	2-F-4,6-2NO ₂	30-218	2-OCF ₃ -4,6-2NO ₂	30-219	2-CF ₃ -4-Br
30-220	3-CF ₃ -4-NO ₂	30-221	2-CN-4-Cl-6-NO ₂	30-222	2-OCF ₃ -4-Cl-6-NO ₂
30-223	3-CF ₃ -4-CN	30-224	3-CN-4-CF ₃	30-225	2-CF ₃ -4-Br-6-NO ₂
30-226	3-NO ₂ -4-CF ₃	30-227	2-NO ₂ -4-CN-5-CF ₃	30-228	2-NO ₂ -4-CF ₃ -5-CN
30-229	4-OCF ₃ -2,6-2Br	30-230	2-CH ₃ -4-Cl-5-CH ₂ CO ₂ C ₂ H ₅	30-231	2,4-2Cl-3-CH ₃
30-232	2,4-2Cl-3-CH ₃ -6-NO ₂	30-233	2-Cl-3-CH ₃	30-234	2-CH ₃ -3-Cl
30-235	2-CH ₃ -3-Cl-4,6-2NO ₂	30-236	2-CH ₃ -3-Cl-4-NO ₂	30-237	2-CH ₃ -3-Cl-6-NO ₂
30-238	2-Cl-3-CH ₃ -4,6-2NO ₂	30-239	2-Cl-3-CH ₃ -4-NO ₂	30-240	2-Cl-3-CH ₃ -6-NO ₂
30-241	2-Br-4-NO ₂ -6-CN	30-242	3-Cl-4-CF ₃ -2,6-2NO ₂	30-243	2NO ₂ -4,5-2Cl
30-244	2-NO ₂ -3,5-2Cl	30-245	2,5-2Cl-4-NO ₂	30-246	2,5-2Cl-6-NO ₂
30-247	2,3-2Cl-4-NO ₂	30-248	2,3-2Cl-6-NO ₂	30-249	3,4-2Cl-2,6-2NO ₂
30-250	2,5-2Cl-4,6-2NO ₂	30-251	2,4,5-3Cl-6-NO ₂	30-252	2,3,4-3Cl-5-NO ₂
30-253	2,3,4-3Cl-6-NO ₂	30-254	2,3,5-3Cl-4,6-2CN	30-255	2,5-2Cl-4-OCF ₂ OCF ₃
30-256	2,6-2Br-4-NO ₂	30-257	2-F-4-NO ₂ -6-Cl	30-258	2-Cl-4-NO ₂ -6-SCN
30-259	2-Br-4-NO ₂ -6-Cl	30-260	2-Cl-4-NO ₂ -6-OCH ₃	30-261	2-Cl-4-NO ₂ -6-SCH ₃
30-262	2-Cl-4-NO ₂ -6-NHCH ₃	30-263	2-Cl-4-NO ₂ -6-SO ₂ CH ₃	30-264	2-Cl-4-SO ₂ CH ₃
30-265	2,6-2Cl-4-SO ₂ CH ₃	30-266	2,6-2Cl-4-CH ₃	30-267	2,6-2Cl-4-CO ₂ CH ₃
30-268	2,6-2Cl-4-CONHCH ₃	30-269	2,6-2Cl-4-CON(CH ₃) ₂	30-270	2,6-2Cl-4-CF(CF ₃) ₂
30-271	2-Cl-4-CF(CF ₃) ₂ -6-Br	30-272	2-F-4-CF(CF ₃) ₂ -6-Br	30-273	2-F-4-CF(CF ₃) ₂ -6-Cl
30-274	2,6-2F-4-CF(CF ₃) ₂ -6-Cl	30-275	2,4,5-3Cl-3,6-2CN	30-276	2,3,5-3F-4,6-2CN
30-277	2-SO ₂ NH ₂	30-278	3-SO ₂ NH ₂	30-279	4-SO ₂ NH ₂

Таблиця 30-1: де в загальній формулі I-IC R₁=Cl, R₂=CH₃, R₃=R₄=R₅=H, замісники (R₁₁)_n узгоджуються з представленими в таблиці 30 і відповідають значенням для сполук 30-1-30-279 у

свою чергу, ілюстративні сполуки позначені цифровими кодами 107-1-107-279.

Таблиця 108: де в загальній формулі I-1L $R_3=R_4=R_5=H$, $R_{35}=H$, замісники $(R_{11})_n$ узгоджуються з представленими в таблиці 30 і відповідають значенням для сполук 30-1-30-279 у таблиці 30, у свою чергу, ілюстративні сполуки позначені цифровими кодами 108-1-108-279.

5 Таблиця 109: де в загальній формулі I-1M $R_3=R_4=R_5=H$, $R_{36}=H$, замісники $(R_{11})_n$ узгоджуються з представленими в таблиці 30 і відповідають значенням для сполук 30-1-30-279 у таблиці 30, у свою чергу, ілюстративні сполуки позначені цифровими кодами 109-1-109-279.



I-IN (X=O або S)

10 Таблиця 110: де в загальній формулі I-1N $R_1=CH_3$, $R_2=Cl$, $R_3=R_4=R_5=H$, $X=O$, замісники $(R_{11})_n$ узгоджуються з представленими в таблиці 30 і відповідають значенням для сполук 30-1-30-279 у таблиці 30, у свою чергу, ілюстративні сполуки позначені цифровими кодами 110-1-110-279.

15 Таблиця 111: де в загальній формулі I-1N $R_1=C_2H_5$, $R_2=Cl$, $R_3=R_4=R_5=H$, $X=O$, замісники $(R_{11})_n$ узгоджуються з представленими в таблиці 30 і відповідають значенням для сполук 30-1-30-279 у таблиці 30, у свою чергу, ілюстративні сполуки позначені цифровими кодами 111-1-111-279.

Таблиця 112: де в загальній формулі I-1N $R_1=CHF_2$, $R_2=Cl$, $R_3=R_4=R_5=H$, $X=O$, замісники $(R_{11})_n$ узгоджуються з представленими в таблиці 30 і відповідають значенням для сполук 30-1-30-279 у таблиці 30, у свою чергу, ілюстративні сполуки позначені цифровими кодами 112-1-112-279.

20 Таблиця 113: де в загальній формулі I-1N $R_1=CH_3$, $R_2=Cl$, $R_3=R_4=R_5=H$, $X=S$, замісники $(R_{11})_n$ узгоджуються з представленими в таблиці 30 і відповідають значенням для сполук 30-1-30-279 у таблиці 30, у свою чергу, ілюстративні сполуки позначені цифровими кодами 113-1-113-279.

Таблиця 114: де в загальній формулі I-1N $R_1=C_2H_5$, $R_2=Cl$, $R_3=R_4=R_5=H$, $X=S$, замісники $(R_{11})_n$ узгоджуються з представленими в таблиці 30 і відповідають значенням для сполук 30-1-30-279 у таблиці 30, у свою чергу, ілюстративні сполуки позначені цифровими кодами 114-1-114-279.

30 Таблиця 115: де в загальній формулі I-1N $R_1=CHF_2$, $R_2=Cl$, $R_3=R_4=R_5=H$, $X=S$, замісники $(R_{11})_n$ узгоджуються з представленими в таблиці 30 і відповідають значенням для сполук 30-1-30-279 у таблиці 30, у свою чергу, ілюстративні сполуки позначені цифровими кодами 115-1-115-279.

У загальній формулі I-1C $R_1=CH_3$, $R_2=Cl$, $R_4=R_5=H$, $(R_{11})_n=4-CH_3$, замісники R_3 (за винятком H) представлені в таблиці 116, ілюстративні сполуки позначені цифровими кодами 116-1-116-140.

Таблиця 116

№	R_3	№	R_3	№	R_3	№	R_3
116-1	S-ізо- C_3H_7	116-2	OH	116-3	-C(=O)H	116-4	CBr_3
116-5	CH_3	116-6	C_2H_5	116-7	н- C_3H_7	116-8	ізо- C_3H_7
116-9	н- C_4H_9	116-10	ізо- C_4H_9	116-11	трет- C_4H_9	116-12	Cl_3
116-13	CH_2Br	116-14	CHF_2	116-15	$CHBr_2$	116-16	CF_3
116-17	CH_2Cl	116-18	$CHCl_2$	116-19	CCl_3	116-20	CH_2F
116-21	OCH_3	116-22	OC_2H_5	116-23	$OCH(CH_3)_2$	116-24	$OC(CH_3)_3$
116-25	OCF_3	116-26	OCH_2CF_3	116-27	OCH_2F	116-28	$OCHF_2$
116-29	SCH_3	116-30	SC_2H_5	116-31	$SCH_2CH=CH_2$	116-32	$CH=CH_2$
116-33	$CH_2CH=CH_2$	116-34	$CH_2CH=CCl_2$	116-35	$C\equiv CH$	116-36	$CH_2C\equiv CH$
116-37	$CH_2C\equiv C-I$	116-38	CH_2OCH_3	116-39	$CH_2OCH_2CH_3$	116-40	$CH_2CH_2OCH_3$
116-41	$CH_2CH_2OCH_2CH_3$	116-42	CH_2OCH_2Cl	116-43	$CH_2OCH_2CH_2Cl$	116-44	$CH_2CH_2OCH_2Cl$

116-45	CH_2SCH_3	116-46	$\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_3$	116-47	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_3$	116-48	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_3$
116-49	$\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{Cl}$	116-50	$\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$	116-51	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{Cl}$	116-52	SOCH_3
116-53	SOC_2H_5	116-54	SOCF_3	116-55	SOCH_2CF_3	116-56	SO_2CH_3
116-57	$\text{SO}_2\text{C}_2\text{H}_5$	116-58	SO_2CF_3	116-59	$\text{SO}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$	116-60	$\text{SO}_2\text{NHCOCH}_3$
116-61	SO_2NHCH_3	116-62	$\text{SO}_2\text{N}(\text{CH}_3)_3$	116-63	$\text{CONHSO}_2\text{CH}_3$	116-64	COCH_3
116-65	COC_2H_5	116-66	$\text{CO-н-}\text{C}_3\text{H}_7$	116-67	$\text{CO-изо-}\text{C}_3\text{H}_7$	116-68	$\text{CO-н-}\text{C}_4\text{H}_9$
116-69	$\text{CO-изо-}\text{C}_4\text{H}_9$	116-70	$\text{CO-трет-}\text{C}_4\text{H}_9$	116-71	COCF_3	116-72	COCH_2Cl
116-73	COOCH_3	116-74	COOC_2H_5	116-75	$\text{COO-н-}\text{C}_3\text{H}_7$	116-76	$\text{COO-трет-}\text{C}_4\text{H}_9$
116-77	COOCF_3	116-78	$\text{COOCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$	116-79	$\text{COOCH}_2\text{CF}_3$	116-80	$\text{CH}_2\text{COOCH}_3$
116-81	$\text{CH}_2\text{COOC}_2\text{H}_5$	116-82	CH_2COCH_3	116-83	$\text{CH}_2\text{COC}_2\text{H}_5$	116-84	CONHCH_3
116-85	CONHC_2H_5	116-86	$\text{CONH-трет-}\text{C}_4\text{H}_9$	116-87	$\text{CON}(\text{CH}_3)_2$	116-88	$\text{CON}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$
116-89	$\text{COOCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	116-90	$\text{COOCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	116-91	$\text{COOCH}_2\text{OCH}_3$	116-92	$\text{COOCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$
116-93	SNHCH_3	116-94	SNHC_2H_5	116-95	$\text{SN}(\text{CH}_3)_2$	116-96	$\text{SN}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$
116-97		116-98		116-99		116-100	
116-101		116-102		116-103		116-104	
116-105		116-106		116-107		116-108	
116-109		116-110		116-111		116-112	
116-113		116-114		116-115		116-116	
116-117		116-118		116-119		116-120	
116-121		116-122		116-123		116-124	
116-125		116-126		116-127		116-128	
116-129		116-130		116-131		116-132	
116-133		116-134		116-135		116-136	
116-137		116-138		116-139		116-140	

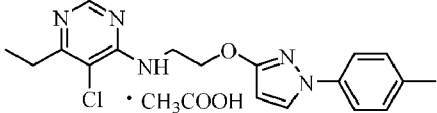
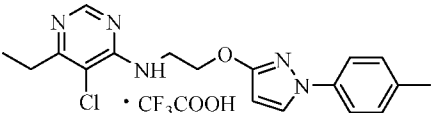
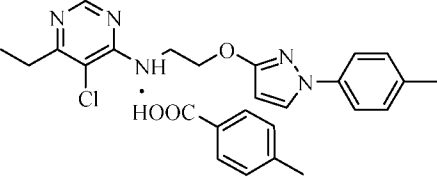
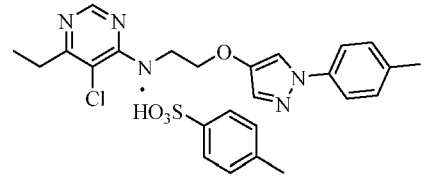
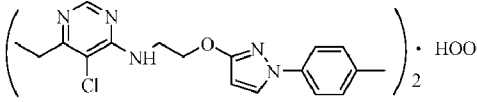
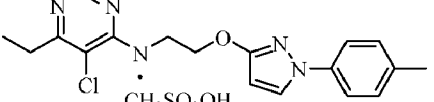
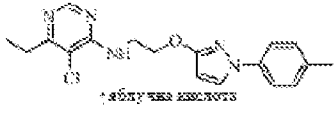
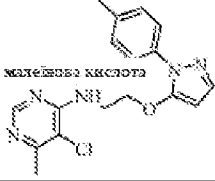
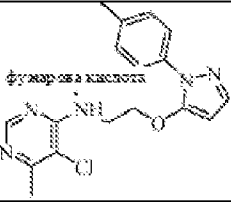
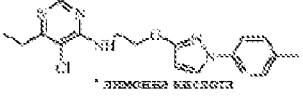
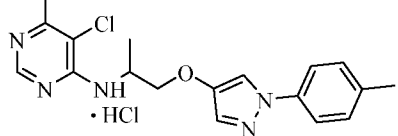
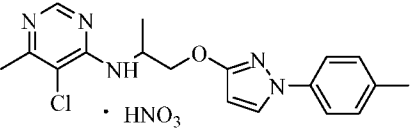
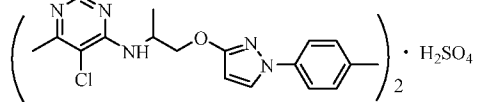
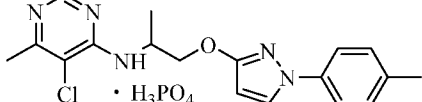
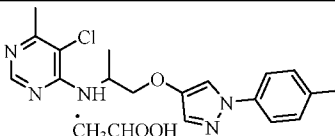
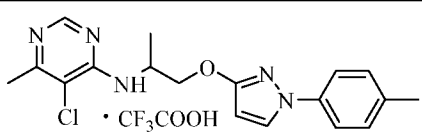
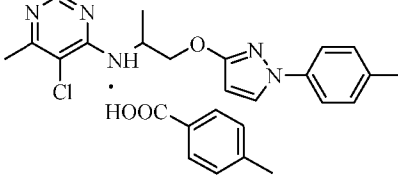
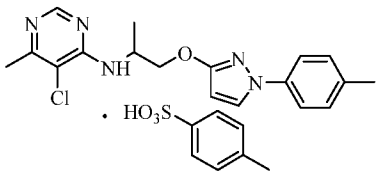
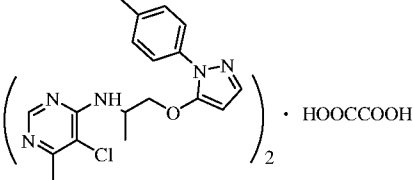
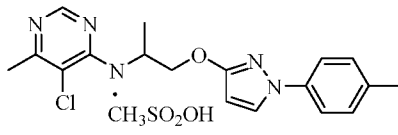
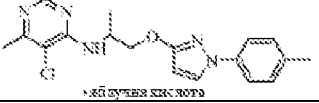
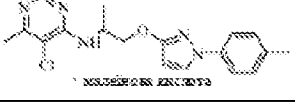
Солі деяких сполук за даним винаходом, які мають структуру, як представлено формулою I, перераховані в таблиці 117, але, не обмежуючись ними.

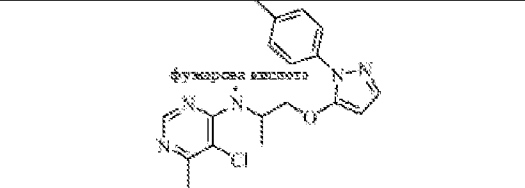
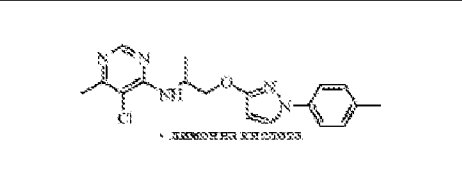
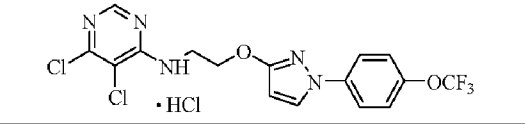
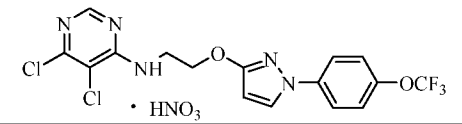
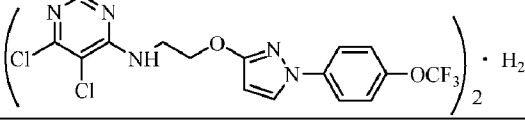
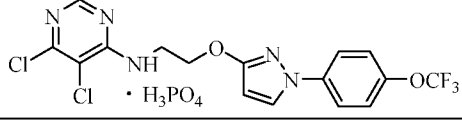
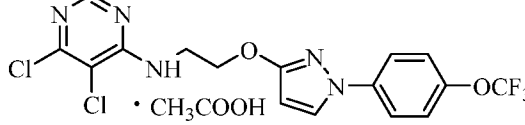
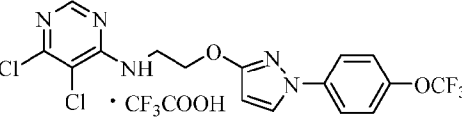
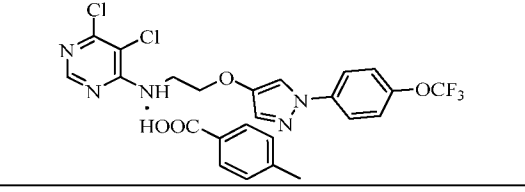
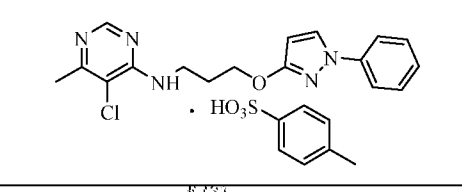
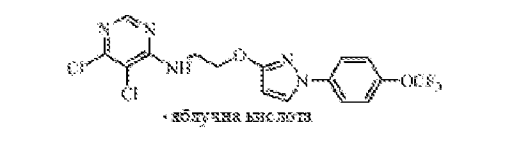
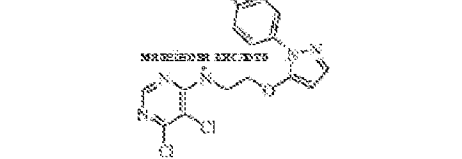
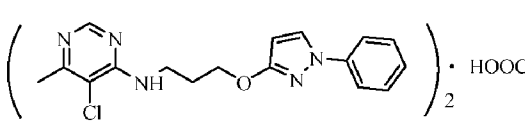
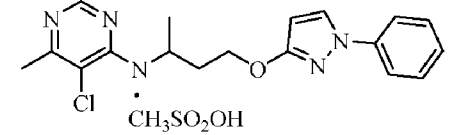
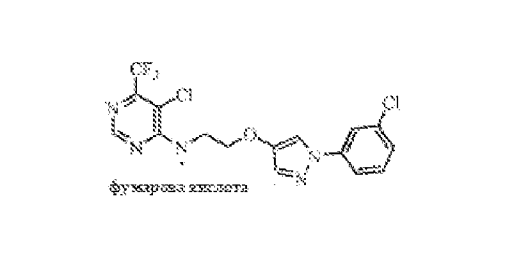
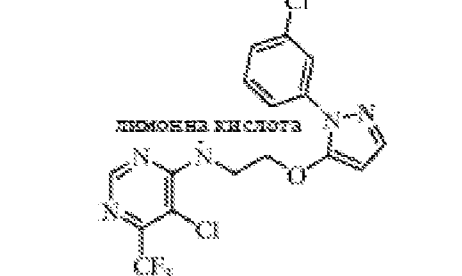
Таблица 117

Солі деяких сполук

№	Структура	№	Структура
117-1		117-2	
117-3		117-4	
117-5		117-6	
117-7		117-8	
117-9		117-10	
117-11		117-12	
117-13		117-14	
117-15		117-16	
117-17		117-18	
117-19		117-20	
117-21		117-22	

117-23		117-24	
117-25		117-26	
117-27		117-28	
117-29		117-30	
117-31		117-32	
117-33		117-34	
117-35		117-36	
117-37		117-38	
117-39		117-40	
117-41		117-42	
117-43		117-44	
117-45		117-46	

117-47		117-48	
117-49		117-50	
117-51		117-52	
117-53		117-54	
117-55		117-56	
117-57		117-58	
117-59		117-60	
117-61		117-62	
117-63		117-64	
117-65		117-66	
117-67		117-68	

117-69		117-70	
117-71		117-72	
117-73		117-74	
117-75KJ		117-76	
117-77		117-78	
117-79		117-80	
117-81		117-82	
117-83		117-84	

Таблиця 118: де в загальній формулі I-4C $R_1=Cl$, $R_2=Br$, $R_3=R_4=R_5=H$, замісники (R_{11}) $_n$ узгоджуються з представленими в таблиці 30 і відповідають значенням для сполук 30-1-30-279 у таблиці 30, у свою чергу, ілюстративні сполуки позначені цифровими кодами 118-1-118-279.

5 Таблиця 119: де в загальній формулі I-4C $R_1=Cl$, $R_2=NH_2$, $R_3=R_4=R_5=H$, замісники (R_{11}) $_n$ узгоджуються з представленими в таблиці 30 і відповідають значенням для сполук 30-1-30-279 у таблиці 30, у свою чергу, ілюстративні сполуки позначені цифровими кодами 119-1-119-279.

10 Таблиця 120: де в загальній формулі I-4C $R_1=Cl$, $R_2=NO_2$, $R_3=R_4=R_5=H$, замісники (R_{11}) $_n$ узгоджуються з представленими в таблиці 30 і відповідають значенням для сполук 30-1-30-279 у таблиці 30, у свою чергу, ілюстративні сполуки позначені цифровими кодами 120-1-120-279.

Таблиця 121: де в загальній формулі I-4C $R_1=Cl$, $R_2=CHO$, $R_3=R_4=R_5=H$, замісники (R_{11}) $_n$ узгоджуються з представленими в таблиці 30 і відповідають значенням для сполук 30-1-30-279 у таблиці 30, у свою чергу, ілюстративні сполуки позначені цифровими кодами 121-1-121-279.

15 Таблиця 122: де в загальній формулі I-4C $R_1=Cl$, $R_2=CH_3$, $R_3=R_4=R_5=H$, замісники (R_{11}) $_n$ узгоджуються з представленими в таблиці 30 і відповідають значенням для сполук 30-1-30-279 у

таблиці 30, у свою чергу, ілюстративні сполуки позначені цифровими кодами 122-1-122-279.

Таблиця 123: де в загальній формулі I-4C $R_1=Cl$, $R_2=OCH_3$, $R_3=R_4=R_5=H$, замісники $(R_{11})_n$ узгоджуються з представленими в таблиці 30 і відповідають значенням для сполук 30-1-30-279 у таблиці 30, у свою чергу, ілюстративні сполуки позначені цифровими кодами 123-1-123-279.

5 Таблиця 124: де в загальній формулі I-4C $R_1=CH_3$, $R_2=Cl$, $R_3=R_4=R_5=H$, замісники $(R_{11})_n$ узгоджуються з представленими в таблиці 30 і відповідають значенням для сполук 30-1-30-279 у таблиці 30, у свою чергу, ілюстративні сполуки позначені цифровими кодами 124-1-124-279.

Таблиця 125: де в загальній формулі I-4C $R_1=C_2H_5$, $R_2=Cl$, $R_3=R_4=R_5=H$, замісники $(R_{11})_n$ узгоджуються з представленими в таблиці 30 і відповідають значенням для сполук 30-1-30-279 у таблиці 30, у свою чергу, ілюстративні сполуки позначені цифровими кодами 125-1-125-279.

Таблиця 126: де в загальній формулі I-4C $R_1=CHF_2$, $R_2=Cl$, $R_3=R_4=R_5=H$, замісники $(R_{11})_n$ узгоджуються з представленими в таблиці 30 і відповідають значенням для сполук 30-1-30-279 у таблиці 30, у свою чергу, ілюстративні сполуки позначені цифровими кодами 126-1-126-279.

15 Таблиця 127: де в загальній формулі I-4F $R_3=R_4=R_5=H$, замісники $(R_{11})_n$ узгоджуються з представленими в таблиці 30 і відповідають значенням для сполук 30-1-30-279 у таблиці 30, у свою чергу, ілюстративні сполуки позначені цифровими кодами 127-1-127-279.

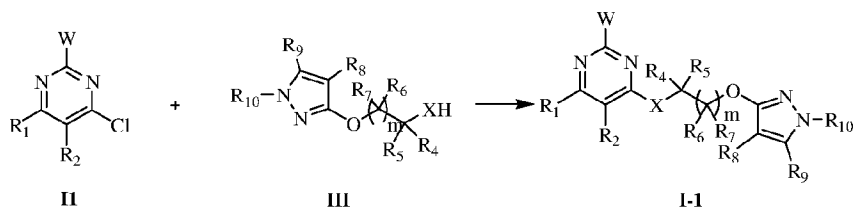
Таблиця 128: де в загальній формулі I-4G $R_3=R_4=R_5=H$, $R_{28}=Cl$, замісники $(R_{11})_n$ узгоджуються з представленими в таблиці 30 і відповідають значенням для сполук 30-1-30-279 у таблиці 30, у свою чергу, ілюстративні сполуки позначені цифровими кодами 128-1-128-279.

20 Сполуки за даним винаходом можуть бути отримані відповідно до наступних способів. Визначення кожного з замісників є таким, як приведено вище, якщо спеціально не зазначене інше.

Сполуки, представлені загальною формулою I, можуть бути отримані наступними двома способами, залежно від визначення Y:

25 (1) Коли Y являє собою O, залежно від положення сполучення атома кисню і піразольного кільця, спосіб одержання сполук, представлених загальною формулою I-1, I-2 і I-3, є наступним:

Спосіб одержання сполук, представлених загальною формулою I-1, представлений у такий спосіб:



30 Сполуки, представлені загальною формулою I-1, можуть бути отримані шляхом взаємодії проміжних сполук II і III у присутності прийнятної основи і розчинника.

Вказана прийнятна основа може бути вибрана з гідроксиду калію, гідроксиду натрію, карбонату натрію, карбонату калію, бікарбонату натрію, триетиламіну, піридину, метоксиду натрію, етоксиду натрію, гідриду натрію, трет-бутоксиду калію або трет-бутоксиду натрію і так далі.

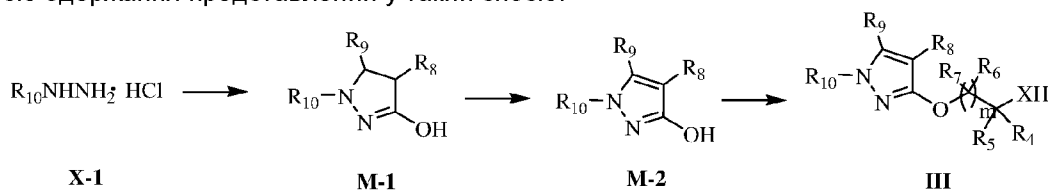
35 Дану взаємодію здійснюють у придатному розчиннику, і зазначений придатний розчинник може бути вибраний з тетрагідрофурану, 1,4-діоксану, ацетонітрилу, толуолу, ксилолу, бензолу, ДМФА, N-метилпіролідину, ДМСО, ацетону або бутанону, і так далі.

Придатна температура складає від кімнатної температури до температури кипіння даного розчинника, нормальна температура складає від 20 до 100 °C.

Час реакції складає інтервал від 30 хвилин до 20 годин, що звичайно складає 1-10 годин.

40 Проміжні сполуки II є комерційно доступними або одержують відповідно до методик, описаних у JP2000007662, US4977264, US6090815, US20040092402, JP09124613, US5468751, US4985426, US4845097, Journal of the American Chemical Society (1957), 79, 1455 або Journal of Chemical Society (1955), p. 3478-3481.

45 Проміжна сполука, представлена загальною формулою III, є ключовою проміжною сполукою, що використовується для одержання сполук, представлених загальною формулою I-1. Спосіб одержання представлений у такий спосіб:



Проміжні сполуки, представлені загальною формулою М-1, можуть бути отримані шляхом взаємодії проміжних сполук, представлених загальною формулою Х-1, з (не)заміщеним етилакрилатом при придатній температурі й у придатному розчиннику. Час реакції складає інтервал від 30 хвилин до 20 годин, що звичайно складає 1-10 годин, детальний опис даної методики зазначено в способах, описаних у CN103588708, WO9703969 і Organic & Biomolecular Chemistry (2011), 9(5), 1443-1453; сполуки М-2 можуть бути отримані з проміжних сполук, представлених загальною формулою М-1, реакцією окиснення, детальний опис якої зазначено в способах, описаних у DE19652516, WO9703969 і Bulletin of the Korean Chemical Society (2010), 31(11), 3341-3347; проміжні сполуки, представлені загальною формулою III, можуть бути отримані шляхом взаємодії проміжних сполук, представлених загальною формулою М-2, з відповідним галогенідом, детальний опис даної реакції зазначено в способах, описаних у US20100158860, WO2011133444 і Bioorganic & Medicinal Chemistry (2012), 20(20), 6109-6122.

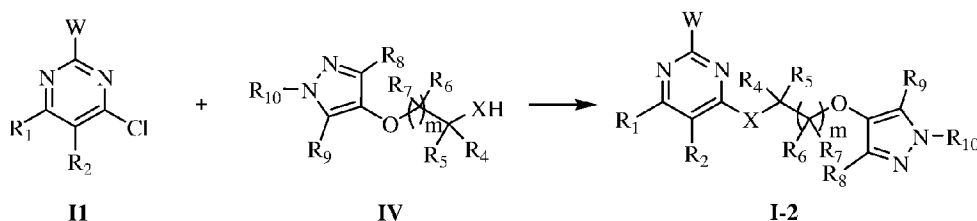
Джерелами проміжних сполук є наступні: проміжна сполука, представлена загальною формулою Х-1, є комерційно доступною або може бути отримана відповідно до загальноприйнятих способів.

Придатна температура реакції складає від 0 до 50 °С; час реакції складає інтервал від 30 хвилин до 20 годин, що звичайно складає 0,5-10 годин.

Придатний розчинник може бути вибраний з метилацетату, етилацетату, бензолу, толуолу, ксилолу, хлороформу, дихлорметану, води, тетрагідрофурану, ацетонітрилу, 1,4-діоксану, ДМФА, N-метилпіролідину або ДМСО і так далі.

Придатна кислота може бути вибрана з хлористоводневої кислоти, трифтороцтової кислоти, сірчаної кислоти, оцтової кислоти, пропіонової кислоти, масляної кислоти, щавлевою кислотою, адипінової кислоти, 1,10-декандикарбонової кислоти, лауринової кислоти, стеаринової кислоти, фумарової кислоти, малеїнової кислоти, бензойної кислоти або алізаринової кислоти.

Спосіб одержання сполук, представлених загальною формулою I-2, представлений у такий спосіб:



Сполуки, представлені загальною формулою I-2, можуть бути отримані шляхом взаємодії проміжних сполук II і IV у присутності прийнятної основи і розчинника.

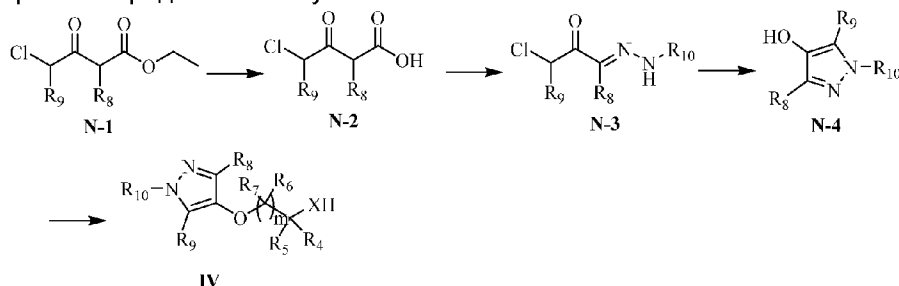
Зазначена прийнятна основа може бути вибрана з гідроксиду калію, гідроксиду натрію, карбонату натрію, карбонату калію, бікарбонату натрію, триетиламіну, піридину, метоксиду натрію, етоксиду натрію, гідриду натрію, трет-бутоксиду калію або трет-бутоксиду натрію і так далі.

Дану взаємодію здійснюють у придатному розчиннику, і зазначений придатний розчинник може бути вибраний з тетрагідрофурану, 1,4-діоксану, ацетонітрилу, толуолу, ксилолу, бензолу, ДМФА, N-метилпіролідину, ДМСО, ацетону або бутанону і так далі.

Придатна температура складає від кімнатної температури до температури кипіння даного розчинника, нормальна температура складає від 20 до 100 °С.

Час реакції складає інтервал від 30 хвилин до 20 годин, що звичайно складає 1-10 годин.

Проміжна сполука, представлена загальною формулою IV, є ключовою проміжною сполукою, що використовується для одержання сполук, представлених загальною формулою I-2. Спосіб одержання представлений у такий спосіб:



Проміжна сполука N-4 може бути отримана з вихідної сполуки N-1, як зазначено в способах, описаних у DE3012193, WO2010076553, Organic Preparations and Procedures International (2002), 34(1), 98-102 і Science of Synthesis (2002), 12, 15-225; Journal of Medicinal Chemistry (2016), 59(4),

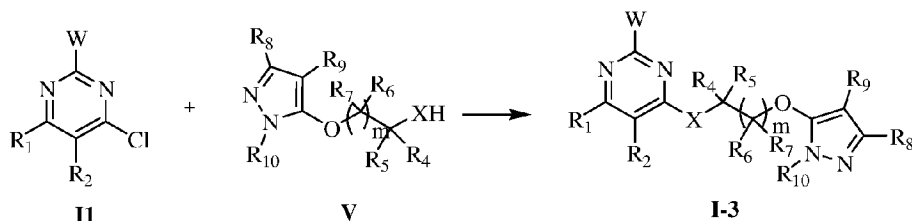
1370-1387; спосіб одержання сполуки IV зі сполуки N-4 є таким же, як одержання сполуки III зі сполуки M-2.

Придатний розчинник може бути вибраний з метанолу, етанолу, тетрагідрофурану, 1,4-діоксану, ацетонітрилу, толуолу, ксилолу, бензолу, ДМФА, ДМСО, ацетону або бутанону.

Придатний розчинник може бути вибраний із хлористоводневої кислоти, сірчаної кислоти або азотної кислоти.

Вказана прийнятна основа може бути вибрана з гідроксиду натрію, гідроксиду калію, метоксиду натрію, етоксиду натрію, трет-бутоксиду натрію або трет-бутоксиду калію і так далі.

Спосіб одержання сполук, представлених загальною формулою I-3, представлений у такий спосіб:



Сполуки, представлені загальною формулою I-3, можуть бути отримані шляхом взаємодії проміжних сполук II і V у присутності прийнятної основи і розчинника.

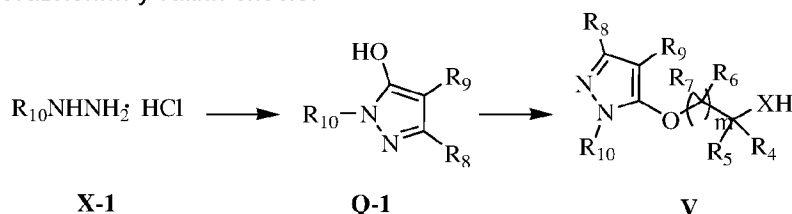
Вказана прийнятна основа може бути вибрана з гідроксиду калію, гідроксиду натрію, карбонату натрію, карбонату калію, бікарбонату натрію, триетиламіну, піридину, метоксиду натрію, етоксиду натрію, гідриду натрію, трет-бутоксиду калію або трет-бутоксиду натрію і так далі.

Дану взаємодію здійснюють у придатному розчиннику, і зазначений придатний розчинник може бути вибраний з тетрагідрофурану, 1,4-діоксану, ацетонітрилу, толуолу, ксилолу, бензолу, ДМФА, N-метилпіролідину, ДМСО, ацетону або бутанону і так далі.

Придатна температура складає від кімнатної температури до температури кипіння даного розчинника, нормальна температура складає від 20 до 100 °C.

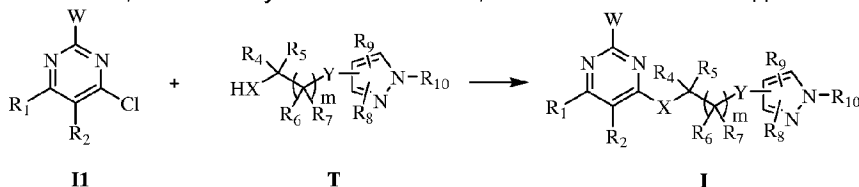
Час реакції складає інтервал від 30 хвилин до 20 годин, що звичайно складає 1-10 годин.

Проміжна сполука, представлена загальною формулою V, є ключовою проміжною сполукою, що використовується для одержання сполук, представлених загальною формулою I-3, спосіб одержання представлений у такий спосіб:



Проміжні сполуки Q-1 можуть бути отримані з вихідної сполуки X-1, як зазначено в способах, описаних у WO2009069044, WO2000031042, WO2008059370, Bioorganic & Medicinal Chemistry (2006), 14(14), 5061-5071 і так далі; спосіб одержання сполуки V зі сполуки Q-1 є таким же, як одержання сполуки III зі сполуки M-2.

(2) Одержання сполук, представлених загальною формулою I, представлено наступним чином, коли Y являє собою NR3 або S. Детальний опис методики одержання проміжної сполуки T зазначено в способах, описаних у WO2003049739, WO2000031072 і так далі:



Хоча сполуки, представлені загальною формулою I, і деякі сполуки, про які повідомлялося у відомому рівні техніки, належать до сполук заміщеного піразолу з піримідинілом, між ними існують ще деякі очевидні розходження в структурі. Завдяки цим відмінностям у структурі, сполуки даного винаходу набувають поліпшену фунгіцидну або інсектицидну/акарицидну активність.

Сполуки, представлені загальною формулою I, показують чудову активність як проти багатьох патогенів рослин/захворювань у сільському господарстві й в інших сферах, так і проти комах/кліщів. Тому технологічна схема за даним винаходом також включає застосування

сполук, представлених загальною формулою I, для одержання фунгіцидів, інсектицидів/акарицидів у сільському господарстві й інших сферах.

Даний винахід пояснюється наступними прикладами захворювань рослин, але, не обмежуючись ними.

- 5 Сполуки, представлені загальною формулою I, можуть бути використані для боротьби з такими захворюваннями рослин, як: ооміцетні захворювання, такі як несправжня борошниста роса (несправжня борошниста роса огірків, несправжня борошниста роса ріпаку, несправжня борошниста роса сої, несправжня борошниста роса буряка, несправжня борошниста роса цукрової тростини, несправжня борошниста роса тютюну, несправжня борошниста роса гороху,
- 10 несправжня борошниста роса мачульного гарбуза, несправжня борошниста роса китайського воскового гарбуза, несправжня борошниста роса дині, несправжня борошниста роса китайської капусти, несправжня борошниста роса шпинату, несправжня борошниста роса редьки, несправжня борошниста роса винограду, несправжня борошниста роса цибулі), біла іржа (біла іржа ріпаку, біла іржа китайської капусти), хвороба загнивання проростків (загнивання проростків ріпаку, загнивання проростків тютюну, загнивання проростків томата, загнивання проростків перцю, загнивання проростків баклажанів, загнивання проростків огірків, загнивання проростків бавовни), грибна гнилизна (ураження м'яким розкладанням перцю, бавовняна гнилизна мачульного гарбуза, бавовняна гнилизна китайського воскового гарбуза), гнилизна (фітофторозна гнилизна кормових бобів, фітофторозна гнилизна огірків, фітофторозна гнилизна гарбуза, фітофторозна гнилизна китайського воскового гарбуза, фітофторозна гнилизна кавуна, фітофторозна гнилизна дині, фітофторозна гнилизна перцю, фітофторозна гнилизна китайської зеленої цибулі, фітофторозна гнилизна часнику, фітофторозна гнилизна бавовни), картопляна гнилизна (картопляна гнилизна картоплі, картопляна гнилизна томата) і так далі; ураження, викликані *Deuteromycotina*, такі як зів'янення (фузаріоз солодкої картоплі, фузаріоз бавовни, зів'янення кунжуту, фузаріоз рицини, фузаріоз томата, фузаріоз квасолі, фузаріоз огірків, фузаріоз мачульного гарбуза, фузаріоз гарбуза, фузаріоз китайського воскового гарбуза, фузаріоз кавуна, фузаріоз дині, фузаріоз перцю, фузаріоз кормових бобів, фузаріоз ріпаку, фузаріоз сої), коренева гнилизна (коренева гнилизна перцю, коренева гнилизна баклажанів, фузарозна коренева гнилизна квасолі, фузарозна коренева гнилизна огірків, фузарозна коренева гнилизна китайського гіркового гарбуза, чорна коренева гнилизна бавовни, чорна (thielaviopsis) коренева гнилизна кормових бобів), ураження, що викликають поникнення (ушкодження гомілки стовбура бавовни, ушкодження гомілки стовбура кунжуту, ризоктоніозна гнилизна перцю, ризоктоніозна гнилизна огірків, ризоктоніозна гнилизна китайської капусти), антракноз (антракноз сорго, антракноз бавовни, антракноз кенафу, антракноз джуту, антракноз льону, антракноз тютюну, антракноз шовковичних, антракноз перцю, антракноз баклажанів, антракноз квасолі, антракноз огірків, антракноз китайського гіркового гарбуза, антракноз патисонів, антракноз китайського воскового гарбуза, антракноз кавуна, антракноз дині, антракноз лічі), вертицилієве в'янення (вертицилієве в'янення бавовни, вертицилієве в'янення соняшника, вертицилієве в'янення томата, вертицилієве в'янення перцю, вертицилієве в'янення баклажанів), парша (парша патисонів, парша китайського воскового гарбуза, парша дині), сіра плісень (сіра плісень коробочок бавовни, сіра плісень кенафу, сіра плісень томата, сіра плісень перцю, сіра плісень квасолі, сіра плісень селери, сіра плісень шпинату, сіра плісеньна гнилизна фрукта ківі), бура плямистість (бура плямистість бавовни, бура плямистість джуту, церкоспоріозна плямистість листя буряка, бура плямистість арахісу, бура плямистість листя перцю, церкоспоріозна плямистість листя китайського воскового гарбуза, бура плямистість сої, бура плямистість соняшника, аскохітозна плямистість гороху, бура плямистість кормових бобів), чорна плямистість (чорна плямистість льону, альтернаріозна плямистість листя ріпаку, чорна плямистість кунжуту, альтернаріозна плямистість листя соняшника, альтернаріозна плямистість листя рицини, верхня плямистість томатів, чорна плямистість плодів перцю, чорна плямистість баклажанів, плямистість листя квасолі, альтернаріозна плямистість огірків, альтернаріозна чорна плямистість листя селери, альтернаріозна чорна гнилизна моркви, плямистість листя моркви, альтернаріозна гнилизна яблук, бура плямистість арахісу), коренева гнилизна (септоріозна плямистість листя томата, септоріозна плямистість листя перцю, картопляна гнилизна селери), рання гнилизна (рання гнилизна томата, рання гнилизна перцю, рання гнилизна баклажанів, рання гнилизна картоплі, рання гнилизна селери), кільцева плямистість (зональна плямистість сої, кільцева плямистість кунжуту, зональна плямистість квасолі), плямистість листя (плямистість листя кунжуту, плямистість листя соняшника, альтернаріозна плямистість кавуна, альтернаріозна плямистість дині), суха гнилизна стебел (суха гнилизна стебел томата, ризоктоніозна гнилизна квасолі) і інші (гельмінтоспоріоз листя кукурудзи, почорніння ніжки кенафу, пірикуляріоз рису, почорніння стебла проса, вічкова плямистість
- 50 чорна плямистість листя селери, альтернаріозна чорна гнилизна моркви, плямистість листя моркви, альтернаріозна гнилизна яблук, бура плямистість арахісу), коренева гнилизна (септоріозна плямистість листя томата, септоріозна плямистість листя перцю, картопляна гнилизна селери), рання гнилизна (рання гнилизна томата, рання гнилизна перцю, рання гнилизна баклажанів, рання гнилизна картоплі, рання гнилизна селери), кільцева плямистість (зональна плямистість сої, кільцева плямистість кунжуту, зональна плямистість квасолі), плямистість листя (плямистість листя кунжуту, плямистість листя соняшника, альтернаріозна плямистість кавуна, альтернаріозна плямистість дині), суха гнилизна стебел (суха гнилизна стебел томата, ризоктоніозна гнилизна квасолі) і інші (гельмінтоспоріоз листя кукурудзи, почорніння ніжки кенафу, пірикуляріоз рису, почорніння стебла проса, вічкова плямистість
- 55 60

цукрової тростини, аспергільоз коробочок бавовнику, гнилизна кореневої шийки арахісу, плямистість стебла сої, чорна плямистість сої, альтернаріозна плямистість листя дині, павутинна плямистість арахісу, червона плямистість листя чаю, філостиктозна плямистість перцю, філостиктозна плямистість листя китайського воскового гарбуза, чорна гнилизна селери, серцеподібна гнилизна шпинату, плісень листя кенафу, бура плямистість листя кенафу, плямистість стебла джуту, церкоспозна плямистість сої, плямистість листя кунжуту, сіра плямистість листя рицини, бура плямистість листя чаю, церкоспоріозна плямистість листя баклажана, церкоспоріозна плямистість листя квасолі, церкоспоріозна плямистість листя китайського гірконого гарбуза, церкоспоріозна плямистість листя кавуна, суха гнилизна джуту, гнилизна коренів і стебел соняшника, вугільна гнилизна квасолі, мішенеподібна плямистість сої, викликана *Corynnespora* плямистість листя баклажана, мішенева, викликана *Corynnespora* плямистість листя огірків, плісень листя томата, викликана *Fulvia* плісень листя баклажанів, шоколадна плямистість кормових бобів) і так далі; ураження, викликані *Basidiomycete*, такі як іржа (смугаста іржа пшениці, іржа стебла пшениці, іржа листів пшениці, іржа арахісу, іржа соняшника, іржа цукрової тростини, іржа китайської зеленої цибулі, іржа цибулі, іржа проса, іржа сої), сажка (сажка кукурудзяного качана, сажка кукурудзи, сажка шовку сорго, сажка сорго, тверда сажка сорго, серцеподібна сажка проса, сажка цукрової тростини, іржа квасолі), і інші (наприклад, плямистість піхви пшениці і плямистість піхви рису) і так далі; ураження, викликані *Ascomycete*, такі як справжня борошниста роса (борошниста роса пшениці, справжня борошниста роса ріпаку, справжня борошниста роса кунжуту, справжня борошниста роса соняшника, справжня борошниста роса буряка, справжня борошниста роса баклажанів, справжня борошниста роса гороху, справжня борошниста роса мачульного гарбуза, справжня борошниста роса гарбуза, справжня борошниста роса патисонів, справжня борошниста роса китайського воскового гарбуза, справжня борошниста роса дині, справжня борошниста роса винограду, справжня борошниста роса кормових бобів), прілість (прілість льону, прілість ріпаку, прілість сої, прілість арахісу, прілість тютюну, прілість перцю, прілість баклажанів, прілість квасолі, прілість гороху, прілість огірків, прілість китайського гірконого гарбуза, прілість китайської воскового гарбуза, прілість кавуна, *stem* селери), парша (парша яблук, парша груші) і так далі.

Сполуки, представлені загальною формулою I, можуть бути використані для боротьби з такими комахами, як: жорсткокрилі, такі як довгоносик (*Acanthoscelides* spp.), зернівка квасолева (*Acanthoscelides obtectus*), вузькотіла златка сітчатокрила (*Agrilus planipennis*), дротяники (*Agriotes* spp.), азіатський вусань (*Anoplophora glabripennis*), квіткоїди (*Anthonomus* spp.), довгоносик бавовняний (*Anthonomus grandis*), гнойовики (*Aphidius* spp.), насіннеїди (*Apion* spp.), хрущі (*Apogonia* spp.), чорний кореневий жук роду *Atacnius* (*Atacnius sprctulus*), бурякова крихітка (*Atomaria linearis*), гарбузові жуки (*Aulacophora* spp.), довгоносик буряковий звичайний (*Bothynoderes punctiventris*), зернівки (*Bruchus* spp.), зернівка горохова (*Bruchus pisorum*), листовійка (*Cacoesia*), листовійка (*Cacoesia* spp.), зернівка чотириплямиста (*Callosobruchus maculatus*), блискітник напівжорсткокрилий (*Carpophilus hemipteras*), щитоноска кропив'яна (*Cassida vittata*), довгопорог жуки (*Cerosterna* spp.), жук листоїд (*Ceratomya*), жуки листоїди (*Ceratomya* spp.), листоїд бобовий (*Ceratomya trifurcata*), скритохоботники (*Ceutorhynchus* spp.), скритохоботник капустиний стручковий (*Ceutorhynchus assimilis*), скритохоботник ріпаковий насінний (*Ceutorhynchus napi*), листоїди (*Chaetocnema* spp.), жуки *Colaspis* (*Colaspis* spp.), жуки різаци (*Conoderus scalaris*), жуки різаци (*Conoderus stigmatus*), плодовий довгоносик (*Conotrachelus nenuphar*), хрущ блискучий зелений (*Cotinus nitidis*), цвіркун спаржевий (*Crioceris asparagi*), мукоїд рудий коротковусий (*Cryptolestes ferrugineus*), мукоїд малий (*Cryptolestes pusillus*), мукоїд турецький (*Cryptolestes turcicus*), ковалики (*Ctenicera* spp.), довгоносики (*Curculio* spp.), червоподібні личинки (*Cyclocephala* spp.), скритохоботник стебловий соняшника (*Cylindrocpturus adspersus*), скритохоботник манго-листовий (*Deporaus marginatus*), шкіроїд шинковий (*Dermestes lardarius*), шкіроїд плямистий (*Dermestes maculatus*), жуки діабротика, листоїди (*Diabrotica* spp.), мексиканське сонечко (*Epilachna varivcstis*), тютюновий хробак (*Faustinus cubae*), справжні довгоносики (*Hylobius pales*), довгоносики (*Hypera* spp.), довгоносик люцерновий (*Hypera postica*), гіперозний довгоносик (*Hyperdoes* spp.), довгоносик (*Hyperodes*), жук кавовий (*Hypothenemus hampei*), жуки короїди (*Ips* spp.), жук тютюновий (*Lasioderma serricorne*), колорадський жук (*Leptinotarsa decemlineata*), жук бурий (*Liogenys fuscus*), листоїд (*Liogenys suturalis*), довгоносик рисовий водяний (*Lissorhoptus oryzophilus*), деревні жуки/деревогризи (*Lyctus* spp.), бесуриньо-верді (*Maecolaspis jolivetii*), жуки (*Megascelis* spp.), ковалик звичайний (*Melanotus communis*), квіткоїди (*Meligethes* spp.), квіткоїд ріпаковий (*Meligethes aeneus*), хрущ травневий західний (*Melolontha melolontha*), вусань короткий (*Oberea brevis*), вусань горіховий (*Oberea linearis*), жук-носоріг пальмовий (*Oryctes rhinoceros*), хибносуринамський мукоїд (*Oryzaephilus Mercator*), суринамський мукоїд (*Oryzaephilus*

surinamensis), скосяри (*Otiorhynchus* spp.), п'явиця червоногруда листоїд (*Oulema melanopus*), п'явиця рисова (*Oulema oryzae*), жуки-довгоносики (*Pantomorus* spp.), травневий/червневий жук (*Phyllophaga* spp.), личинки хруща (*Phyllophaga cuyabana*), листоїди (*Phyllotreta* spp.), *Phynchites* spp., хрущик японський (*Popillia japonica*), шашіль зерновий великий (*Prostephanus truncatus*), шашіль зерновий (*Rhizopertha dominica*), жуки скарабеї (*Rhizotrogus* spp.), хрущ західний (European chafer), довгоносики (*Rhynchophorus* spp.), деревні жуки (*Scolytus* spp.), довгоносики (*Shenophorus* spp.), свинка горохова смугаста (*Sitona lineatus*), довгоносики зернові (*Sitophilus* spp.), довгоносик комірний (*Sitophilus granaries*), довгоносик рисовий (*Sitophilus oryzae*), шашіль хлібний (*Stegobium paniceum*), хрущаки борошняні (*Tribolium* spp.), хрущак каштановий (*Tribolium castaneum*), хрущак борошняний малий (*Tribolium confusum*), трогодерма мінлива (*Trogoderma variabile*), і жукелиця хлібна (*Zabrus tenebrioides*).

Шкірястокрили

Таргани (*Dictyoptera*), такі як тарган рудий (*Blattella germanica*), німецький тарган (German cockroach), тарган чорний (*Blatta orientalis*), тарган деревний (*Parcoblatta pennsylvanica*), тарган американський (*Periplaneta Americana*), тарган австралійський (*Periplaneta australasiae*), тарган коричневий (*Periplaneta brunnea*), тарган димчато-коричневий (*Periplaneta fuliginosa*), тарган суринамський (*Pycnoselus surinamensis*) і тарган коричневосмуговий (*Supella longipalpa*).

Двокрилі (*Diptera*), такі як комарі (*Aedes* spp.), молі-перстянки люцернові (*Agromyza frontella*), мінуючі мухи (*Agromyza* spp.), мухи плодові (*Anastrepha* spp.), муха плодова карибська (*Anastrepha suspensa*), комарі (*Anopheles* spp.), мушки плодові (*Bactrocera* spp.), східна динева муха (*Bactrocera cucurbitae*), східна плодова муха (*Bactrocera dorsalis*), плодові мухи (*Ceratitis* spp.), середземноморська плодова муха (*Ceratitis capitata*), оленячі мухи (*Chrysops* spp.), личинки м'ясної мухи (*Cochliomyia* spp.), галиці (*Contarinia* spp.), комарі (*Culex* spp.), галиці (*Dasineura* spp.), галиця капустяна (*Dasineura brassicae*), личинки мух (*Delia* spp.), личинки мухи паросткової (*Delia platura*), плодові мушки (*Drosophila* spp.), кімнатні мухи (*Fannia* spp.), кімнатна муха мала (*Fannia canicularis*), муха сходова (*Fannia scalaris*), гедзь-гачок (*Gasterophilus intestinalis*), листовійка авокадо (*Gracillia perseae*), жигалка коров'яча мала (*Haematobia irritans*), личинки мух справжніх (*Hylemyia* spp.), гедзь бичачий звичайний (*Hypoderma lineatum*), мінуючі мухи (*Liriomyza* spp.), муха мінуюча зміноподібна (*Liriomyza brassica*), вовноїд овечий (*Melophagus ovinus*), мухи справжні (*Musca* spp.), муха осіння (*Musca autumnalis*), муха кімнатна (*Musca domestica*), гедзь овечий (*Oestrus ovis*), мушка шведська (*Oscinella frit*), муха бурякова (*Pegomyia betae*), *Phorbia* spp., муха морквяна (*Psila rosae*), муха вишнева (*Rhagoletis cerasi*), муха яблучна (*Rhagoletis pomonella*), жовтогаряча зернова галиця (*Sitodiplosis mosellana*), жигалка осіння (*Stomoxys calcitrans*), кінські мухи (*Tabanus* spp.) і довгоніг (*Tipula* spp.).

Клопи (*Hemiptera*), такі як клоп-щитник (*Acrosternum hilare*), клоп-черепашка (*Blissus leucopterus*), клопик картопляний (*Calocoris porvegicus*), тропічний постільний клоп (*Cimex hemipterus*), постільний клоп (*Cimex lectularius*), *Dagbertus fasciatus*, щитник (*Dichelops furcatus*), червоний клоп бавовняний (*Dysdercus suturalis*), зелений і коричневий клопи (*Edessa meditabunda*), клоп-черепашка маврський (*Eurygaster maura*), щитник (*Euschistus heros*), клоп коричневий смердючий (*Euschistus servus*), москитний клоп (*Helopeltis antonii*), москитний клоп чайний індійський (*Helopeltis theivora*), клопи смердючі (*Lagynotomus* spp.), рисовий клоп (*Leptocorisa oratorius*), *Leptocorisa varicornis*, клопи-сліпняки (*Lygus* spp.), сліпняк західний матовий (*Lygus hesperus*), клоп рожевий (*Maconellicoccus hirsutus*), *Neurocolpus longirostris*, клоп овочевий зелений (*Nezara viridula*), сліпняки (*Phyllocoris* spp.), сліпняк каліфорнійський (*Phytocoris californicus*), *Phytocoris relativus*, *Piezodorus guildingi*, сліпняк чотирисмуговий (*Poecilopsus lineatus*), *Psallus vaccinicola*, *Pseudocysta perseae*, *Scaptocoris castanea* і триатомові клопи: кровосисні клопи/триатоміди (*Triatoma* spp.).

Попелиці, щитівки, білокрилки, цикадки (*Homoptera*), такі як попелиця горохова (*Acyrthosiphon pisum*), хермеси (*Adelges* spp.), білокрилка капустяна (*Aleurodes proletella*), *Aleurodicus disperses*, білокрилка шерстиста (*Aleurothrixus flecosus*), *Aluacaspis* spp., *Amrasca bigutella bigutella*, цикадки (*Aphrophora* spp.), червона помаранчева щитівка (*Aonidiella aurantii*), попелиці (*Aphis* spp.), попелиця бавовняна (*Aphis gossypii*), попелиця яблунева (*Aphis pomi*), попелиця картопляна (*Aulacorthum solani*), білокрилки (*Bemisia* spp.), *Bemisia argentifolii*, білокрилка тютюнова (*Bemisia tabaci*), попелиця ячмінна (*Brachycolus noxius*), попелиця аспарагусова (*Brachycorynclia asparagi*), *Brevinnia rehi*, попелиця капустяна (*Brevicoryne brassicae*), щитівки (*Ceroplastes* spp.), жибоцщитівка рубінова (*Ceroplastes rubens*), щитівки (*Chionaspis* spp.), щитівки (*Chrysomphalus* spp.), щитівки (*Coccus* spp.), попелиця рожева яблунева (*Dysaphis plantagine*), цикадки (*Empoasca* spp.), попелиця кров'яна яблунева (*Eriosoma lanigerum*), австралійський жолобчастий червчик (*Icerya purchasi*), цикадка мангова (*Idioscopus nitidulus*), цикадка темна мала (*Laodelphax striatellus*), *Lepidosaphes* spp., *Macrosiphum* spp.,

попелиця картопляна (*Macrosiphum euphorbiae*), попелиця зернова (*Macrosiphum granarium*), попелиця розанова зелена (*Macrosiphum rosae*), астра-лишайниця (*Macrosteles quadrilineatus*), *Mahanarva frimbiolata*, попелиця розанно-злакова (*Metopolophium dirhodum*), *Midis longicornis*, попелиця зелена персикова (*Myzus persicae*), цикадки (*Nephotettix* spp.), цикадка зелена (5 *Nephotettix cinctipes*), цикадка коричнева (*Nilaparvata lugens*), щитівка солом'яна (*Parlatoria pergandii*), щитівка чорна грушоподібна (*Parlatoria ziziphi*), дельфаціда кукурудзяна (*Peregrinus maidis*), пінниці (*Philaenus* spp.), філоксера виноградна (*Phylloxera vitifoliae*), несправжньощитівка ялинова (*Physokermes piceae*), червчики борошністі (*Planococcus* spp.), червчики борошністі (*Pseudococcus* spp.), червчик борошністий ананасовий (*Pseudococcus brevipennis*), щитівка каліфорнійська (*Quadraspidiotus perniciosus*), попелиці (*Rhaphalosiphum* spp.), попелиця кукурудзяна листова (*Rhaphalosiphum maidis*), попелиця черемхово-вишнева звичайна (*Rhaphalosiphum padi*), щитівки (*Saissetia* spp.), несправжньощитівка маслинна (*Saissetia oleae*), попелиця звичайна злакова (*Schizaphis graminum*), попелиця велика злакова (*Sitobion avenae*), цикадка білоспинна (*Sogatella furcifera*), попелиці (*Therioaphis* spp.), червчики (*Toumeyella* spp.), 15 попелиці (*Toksotera* spp.), білокрилки (*Trialeurodes* spp.), білокрилка теплична (*Trialeurodes vaporariorum*), смугастокрила білокрилка (*Trialeurodes abutiloneus*), щитівки (*Unaspis* spp.), щитівка східна цитрусова (*Unaspis yanonensis*) і *Zulia entreriana*.

Перетинчастокрили, мурахи, оси і бджоли (Hymenoptera), такі як мурахи-листорізи (*Acromyrmex* spp.), трач ріпаків (*Athalia rosae*), мурахи-листорізи (*Atta* spp.), мурахи-червиці (20 *Camponotus* spp.), трачі (*Diprion* spp.), мурахи (*Formica* spp.), мураха аргентинська (*Iridomyrmex humilis*), чорні мурахи (*Monomorium* spp.), маленька чорна мураха (*Monomorium minimum*), мураха фараонів (*Monomorium pharaonicum*), трачі (*Neodiprion* spp.), американські мурахи-женці (*Pogonomyrmex* spp.), паперові оси (*Polistes* spp.), вогненні мурахи (*Solenopsis* spp.), мураха домашня пахуча (*Tarapinoma sessile*), мурахи дернові (*Tetranomium* spp.), справжні оси 25 (*Vespa* spp.) і бджоли теслі (*Xylocopa* spp.).

Терміти (Isoptera), такі як *Coptotermes* spp., *Coptotermes curvignathus*, *Coptotermes frenchii*, тайваньський підземний терміт (*Coptotermes formosanus*), терміти-солдати з растром (*Coritermes* spp.), суходеревинні терміти (*Cryptotermes* spp.), пустельні жовтоногі терміти (*Heterotermes* spp.), *Heterotermes aureus*, суходеревні терміти (*Kaloterms* spp.), суходеревні 30 терміти (*Incisitermes* spp.), терміти-листоїди (*Macrotermes* spp.), суходеревні терміти (*Marginitermes* spp.), терміти-женці (*Microcerotermes* spp.), *Microtermes obesi*, *Procornitermes* spp., підземні терміти (*Reticulitermes* spp.), *Reticulitermes banyulensis*, *Reticulitermes grassei*, терміт жовтоногий (*Reticulitermes flavipes*), *Reticulitermes hageni*, терміт західний підземний (*Reticulitermes hesperus*), *Reticulitermes santoniensis*, *Reticulitermes speratus*, *Reticulitermes tibialis*, *Reticulitermes virginicus*, *Schedorhinotermes* spp. і *Zootermopsis* spp. 35

Лускокрилі метелики, метелики (Lepidoptera), такі як кроконова гусінь (*Achoea janata*), моли (*Adoxophyes* spp.), *Adoxophyes orana*, гусениці озимої совки (*Agrotis* spp.), совка епсилон (*Agrotis ipsilon*), гусінь совки бавовняної американської (*Alabama argillacea*), метелик (*Amorbia cuneana*), вогнівка (*Amyelosis transitella*), метелик (*Anacamptodes defecaria*), плоджерка урюкова (*Anarsia lineatella*), моль *jute looper* (*Anomis sabulijera*), совка оксамитних бобів (*Anticarsia gemmatilis*), 40 листовійка плодівих дерев (*Archips argyrospila*), листовійка розанова (*Archips rosana*), листовійки (*Argyrotaenia* spp.), листовійка цитрусова (*Argyrotaenia citrana*), совка-гамма (*Autographa gamma*), *Bonagota cranaodcs*, вогнівка рисова (*Borbo cinnara*), кривовуса міль бавовняна (*Bucculatrix thurberiella*), моли-мінери (*Caloptilia* spp.), *Capua reticulana*, плоджерка персикова (*Carposina niponensis*), *Chilo* spp., шашіль манговий (*Chlumetia transversa*), листовійка *oblique banded* (*Choristoneura rosaceana*), *Chrysodeixis* spp., трав'яна листовійка (*Snaphalocerus medinalis*), *Colias* spp., *Conpomorpha cramerella*, *Cossus cossus*, метелики лугові (*Crambus* spp.), плоджерка сливова (*Cydia funebrana*), плоджерка східна (*Cydia molesta*), гороховий метелик (*Cydia nigricana*), плоджерка яблунева (*Cydia pomonella*), *Darna diducta*, стовбурові сверляки 50 (*Diaphania* spp.), сверляки стебла (*Diatraea* spp.), сверляки стебла цукрової тростини (*Diatraea saccharalis*), метелик кукурудзяний південно-західний (*Diatraea graniosella*), коробкові хробаки (*Earias* spp.), шиповатий хробак (*Earias insulata*), листовійка *rough northern bollworm* (*Earias vitellii*), *Ecdytoporpha aurantianum*, зерновий шашіль (*Elasmopalpus lignosellus*), світло-коричнева яблучна міль (*Epiphyas postvittana*), вогнівки млинові (*Ephestia* spp.), вогнівка сухофруктова (*Ephestia cautella*), вогнівка тютюнова (*Ephestia elutella*), вогнівка млинова (*Ephestia kuehniella*), 55 *Epimeces* spp., *Epinotia aporema*, бананова товстоголовка (*Erionota thrax*), листовійка дворічна (*Eupoecilia ambiguella*), совки *army cutworm* (*Euxoa auxiliaris*), совки (*Feltia* spp.), стеблові сверляки (*Gortyna* spp.), східна плоджерка (*Grapholita molesta*), соевий метелик (*Hedylepta indicata*), совки (*Helicoverpa* spp.), совка бавовняна (*Helicoverpa armigera*), совка бавовняна 60 (*Helicoverpa zea*), совки (*Heliothis* spp.), гусінь совки тютюнової (*Heliothis virescens*), гусінь

вогнівки капустиної (*Hellula undalis*), сверляки кореневі (*Indarbela* spp.), томатна гостриця (*Keiferia lycopersicella*), сверляки плодів баклажана (*Leucinodes orbonalis*), *Leucoptera malifoliella*, *Lithocolletis* spp., гронова листовійка (*Lobesia botrana*), совки (*Loxagrotis* spp.), гусениці совки бобової (*Loxagrotis albicosta*), шовкопряд непарний (*Lymantria dispar*), яблунева біла міль-крихітка (*Lyonetia clerkella*), мішочниця олійної пальми (*Mahasena corbetti*), гусениці коконопрядів, що будують спільні павутинні гнізда (*Malacosoma* spp.), гусінь совки капустиної (*Mamestra brassicae*), вогнівка бобова (*Maruca testulalis*), мішочниця (*Metisa plana*), гусінь совки однокрапкової (*Mythimna unipuncta*), мала вогнівка (*Neoleucinodes elegantalis*), рисова вогнівка (*Nymphula depunctalis*), п'ядак зимовий (*Operophthera brumata*), метелик стебловий (*Ostrinia nubilalis*), *Oxydia vesulia*, листовійка кривовуса смородинова (*Pandemis cerasana*), листовійка кривовуса вербова (*Pandemis heparana*), *Papilio demodocus*, міль бавовняна (*Pectinophora gossypiella*), гусениці (*Peridroma* spp.), совка маргариткова або совка брудно-бура земляна (*Peridroma saucia*), міль біла кадова (*Perileucoptera coffeella*), міль картопляна мінуюча (*Phthorimaea operculella*), *Phyllocnistis citrella*, молі-мінери (*Phyllonorycter* spp.), білан (*Pieris rapae*), *Plathyrena scabra*, вогнівка комірна (*Plodia interpunctella*), міль серпокрила капустияна (*Plutella xylostella*), листовійка виноградна (*Polychrosis viteana*), *Prays endocarpis*, маслинна міль (*Prays oleae*), совки (*Pseudaletia* spp.), ратний хробак совки лугового (*Pseudaletia unipunctata*), соєва совка (*Pseudoplusia includens*), *Rachiplusia nu*, *Scirpophaga incertulas*, стеблові точильники (*Sesamia* spp.), шашіль стебловий рожевий (*Sesamia inferens*), *Sesamia nonagrioides*, *Setora nitens*, міль зернова комірна (*Sitotroga cerealella*), *Sparganothis pilleriana*, ратні хробаки (*Spodoptera* spp.), карадина - наземна мала совка (*Spodoptera exigua*), шашіль рожевий стебловий (*Spodoptera fugiperda*), похідний хробак (*Spodoptera oridania*), кореневі сверляки (*Synanthedon* spp.), *Thecla basilides*, *Thermisia gemmatilis*, міль платтяна (*Tineola bisselliella*), капустияна металовидка, совка ні (*Trichoplusia ni*), *Tuta absoluta*, *Yponomeuta* spp., деревниця кадова (*Zeuzera coffeae*) і деревниця в'їдлива (*Zeuzera pyrina*).

Пухоїди (Mallophaga), такі як волосоїд (*Bovicola ovis*), пухоїд пташиний (*Menacanthus stramineus*) і звичайна курчава воша (*Menopon gallinae*).

Прямокрили (Orthoptera), такі як безкрилий коник мормон (*Anabrus simplex*), капустиянки (*Gryllotalpidae*), *Locusta migratoria*, коники (*Melanoplus* spp.), коник вузьокрилий (*Microcentrum retinerve*), коники північноамериканські (*Pterophylla* spp.), сарана африканська (*Schistocerca gregaria*), коник вилхвостий (*Scudderella furcata*) і *Valanga nigricornis*. Кровосисні воші (*Sucking louse*), такі як кровосисні воші (*Haematopinus* spp.), воша овеча (*Linognathus setosus*), воша головна (*Pediculus humanus capitis*), воша платтяна (*Pediculus humanus humanus*) і воша лобкова (*Phthirus pubis*).

Блохи (*Siphonaptera*), такі як блоха собача (*Ctenocephalides canis*), блоха котяча (*Ctenocephalides felis*) і блоха людська (*Pulex irritans*).

Трипси (*Thysanoptera*), такі як трипс тютюновий (*Frankliniella fusca*), трипс квітковий західний (*Frankliniella occidentalis*), трипс томатний (*Frankliniella shultzei*), трипс кукурудзяний (*Frankliniella williamsi*), трипс тепличний (*Heliothrips haemorrhoidalis*), *Rhipiphorothrips cruentatus*, трипси (*Scirtothrips* spp.), трипс цитрусовий (*Scirtothrips citri*), трипс жовтий чайний (*Scirtothrips dorsalis*), *Taeniothrips rhopalantennalis* і *Thrips* spp.

Щетинохвостики (*Thysanura*), такі як лусочниці (*Lepisma saccharinum*) і термобії (*Thermobia domestica*).

Павукоподібні (Acarina), кліщі і кліщики, такі як трахеальний кліщ робочих бджіл (*Acarapsis woodi*), комірні кліщі (*Acarus* spp.), кліщ борошняний (*Acarus siro*), кліщик манговий (*Aceria mangiferae*), кліщі (*Aculops* spp.), кліщ іржавий (*Aculops lycopersici*), *Aculops pelekassi*, *Aculus pelekassi*, кліщ іржавий яблуневий (*Aculus schlechtendali*), зіркоподібний кліщ (*Amblyomma americanum*), кільчасті кліщі (*Boophilus* spp.), плоскотілка оранжерейна (*Brevipalpus obovatus*), червоно-чорний плоский кліщ (*Brevipalpus phoenicis*), підшкірні кліщі (*Demodex* spp.), тверді іксодові кліщі (*Dermacentor* spp.), кліщ іксодовий мінливий (*Dermacentor variabilis*), кліщ домашнього пилу (*Dermatophagoides pteronyssinus*), *Eotetranychus* spp., жовтий грабовий павутинний кліщ (*Eotetranychus carpini*), *Epitimerus* spp., *Eriophyes* spp., іксодові кліщі (*Ixodes* spp.), *Metatetranychus* spp., *Notoedres cati*, павутинні кліщі (*Oligonychus* spp.), чайний червоний павутинний кліщ (*Oligonychus coffee*), південний червоний павутинний кліщ (*Oligonychus ilicis*), червоні кліщі (*Panonychus* spp.), червоний цитрусовий кліщ (*Panonychus citri*), кліщ плодівий червоний (*Panonychus ulmi*), кліщик цитрусовий іржавий (*Phyllocoptruta oleivora*), оранжереєний прозорий кліщ (*Polyphagotarsonemus latus*), собачий бурий кліщ (*Rhipicephalus sanguineus*), цибулинні кліщі (*Rhizoglyphus* spp.), коростявий кліщ (*Sarcoptes scabiei*), кліщі авокадо (*Tegolophus perseiflorae*), павутинні кліщі (*Tetranychus* spp.), кліщ двоплямистий павутинний (*Tetranychus urticae*) і вератозний кліщ робочої бджоли (*Varroa destructor*).

Нематоди (Nematoda), такі як стеблові і листові, соснові деревні нематоди (*Aphelenchoides*

spp.), жалкі нематоди (*Belonolaimus* spp.), кільцеві нематоди (*Criconemella* spp.), серцеві собачі гельмінти (*Dirofilaria immitis*), стеблові і цибулинні нематоди (*Ditylenchus* spp.), гетеродериди (*Heterodera* spp.), цистоутворювальна нематода (*Heterodera zeae*), кореневі нематоди (*Hirschmanniella* spp.), ланцетоподібні нематоди (*Hoplolaimus* spp.), кореневі галоутворювальні нематоди (*Meloidogyne* spp.), південна коренева галова нематода (*Meloidogyne incognita*), онхоцерка (*Onchocerca volvulus*), кореневі і лугові нематоди (*Pratylenchus* spp.), струнці і свердловальні нематоди (*Radopholus* spp.), і ниркоподібна нематода (*Rotylenchus reniformis*).

Симфіли (*Symphyla*) багатоніжки, такі як *Scutigerebella immaculata*.

Завдяки їхнім позитивним характеристикам сполуки, зазначені вище, можуть з користю використовуватися при захисті сільськогосподарських і садівничих культур, домашніх і селекційних тварин, а також навколишнього середовища, відвідуваного людиною, від патогенів, шкідливих комах і кліщів.

Для того, щоб одержати бажаний ефект, дозування сполуки для застосування може варіюватися залежно від різних факторів, наприклад, використовуваної сполуки, захищуваних культур, типу шкідливого організму, ступеня зараження, кліматичних умов, методу нанесення й вибраної сполуки композиції.

Доза сполук в інтервалі від 10 г до 5 кг на гектар може забезпечити достатній контроль.

У свою чергу, об'єкт за даним винаходом також включає фунгіцидні, інсектицидні/акарицидні композиції, що містять сполуки загальної формули I як активний інгредієнт, і масовий відсоток інгредієнта в даній композиції складає 0,5-99 %. Фунгіцидні, інсектицидні/акарицидні композиції також містять носій, прийнятний у сільському господарстві, лісовому господарстві і громадській охороні здоров'я.

Композиції за даним винаходом можуть використовуватися у вигляді різних сполук. Звичайно, сполуки, які мають загальну формулу I, як активний інгредієнт можуть бути розчинені або дисперговані в носії або отримані у вигляді сполук, що можуть бути легко розпилені у вигляді фунгіцидів або інсектицидів. Наприклад, такі хімічні склади можуть бути виготовлені у вигляді змочуваного порошку, змішаного текучого масла, водної суспензії, водної емульсії, водного розчину або емульгованого концентрату і так далі. Таким чином, у дані композиції додають щонайменше рідкий або твердий носій і, при необхідності, може(можуть) бути додана(и) придатна(и) поверхнево-активна(и) речовина(и).

А також даний винахід надає способи боротьби з фітопатогенними грибами, шкідливими комахами і кліщами, шляхом нанесення композицій за даним винаходом на фітопатогенні гриби або ділянки їхнього розвитку. Придатна ефективна доза сполуки за даним винаходом звичайно складає діапазон від 10 г/га до 1000 г/га, переважно від 20 г/га до 500 г/га.

Для деяких застосувань у фунгіцидні, інсектицидні/акарицидні композиції за даним винаходом може бути доданий один або більше інших фунгіцидів, інсектицидів/акарицидів, гербіцидів, регуляторів росту рослин або добрив для надавання додаткових переваг і впливів.

Слід зазначити, що допускаються варіації і зміни в межах заявленого обсягу даного винаходу.

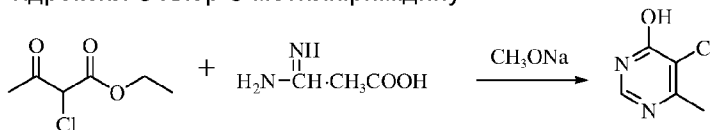
Детальний опис даного винаходу

Даний винахід проілюстрований наступними прикладами, але, не обмежуючись ними. (Усі вихідні речовини є комерційно доступними, якщо спеціально не зазначене інше.)

Приклади одержання

Приклад 1: Одержання проміжного 4,5-дихлор-6-метилпіримідину

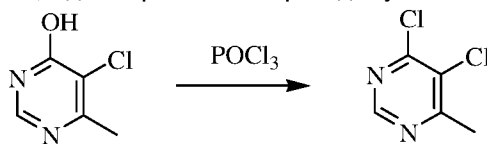
1) Одержання 4-гідроксил-5-хлор-6-метилпіримідину



Розчин 8,80 г (0,16 моль) CH_3ONa у метанолі повільно додавали в розчин 11,30 г (0,11 моль) формідамідацетату в 50 мл метанолу при кімнатній температурі при перемішуванні, отриману суміш перемішували після додавання протягом наступних 2 годин при кімнатній температурі. Після додавання 11,17 г (0,068 моль) етил 2-хлор-3-оксобутаноату, отриману суміш продовжували перемішувати протягом наступних 5-7 годин при кімнатній температурі. Після завершення реакції, яку відслідковували тонкошаровою хроматографією, отриману реакційну суміш концентрували при зниженому тиску, рН доводили до 5-6 додаванням HCl , і потім фільтрували з одержанням оранжево-жовтої твердої речовини, водну фазу екстрагували етилацетатом (3×50 мл), сушили над безводним сульфатом магнію, фільтрували і потім концентрували при зниженому тиску. Залишок розчиняли в 50 мл етилацетату, вистоявали протягом ночі, з одержанням 6,48 г оранжево-жовтої твердої речовини з виходом 66 %. Т.пл.

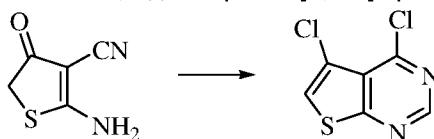
181~184°C.

2) Одержання проміжного 4,5-дихлор-6-метилпіримідину



50 мл POCl_3 по краплях додавали в розчин 14,5 г (0,1 моль) 4-гідроксил-5-хлор-6-метилпіримідину в 50 мл толуолу, отриману суміш після додавання кип'ятили зі зворотним холодильником протягом 5-7 годин. Після завершення реакції, яку відслідковували тонкошаровою хроматографією, отриману реакційну суміш концентрували при зниженому тиску для видалення толуолу і надлишку POCl_3 , і потім виливали в крижану воду. Водну фазу екстрагували етилацетатом (3×50 мл), органічні фази зливали, сушили над безводним сульфатом магнію, фільтрували і потім концентрували при зниженому тиску. Залишок очищали через силікагелеву колонку (етилацетат/петролейний ефір=1:5, як елюент), з одержанням 14,43 г жовтої рідини з виходом 88,5 %.

Приклад 2: Одержання проміжного 4,5-дихлортієно[2,3-d]піримідину



До розчину 2-аміно-4-оксо-4,5-дигідротієфен-3-карбонітрилу (70 г, 0,5 моль), розчиненого в 250 мл фосфорилтрихлориду, на крижаній бані додавали 38 мл ДМФА протягом близько 30 хвилин і піддавали взаємодії протягом 1 години при кімнатній температурі, потім нагрівали при 75 °C протягом 3 годин. Після завершення реакції, яку відслідковували тонкошаровою хроматографією, отриману суміш охолоджували до кімнатної температури і виливали в суміш лід-вода, водну фазу екстрагували етилацетатом (3×80 мл), органічні фази зливали, фільтрували, з одержанням 89,1 г 4,5-дихлортієно[2,3-d]піримідину у вигляді темно-сірої твердої речовини з виходом 86,9 %, т.пл. складала 160-161 °C.

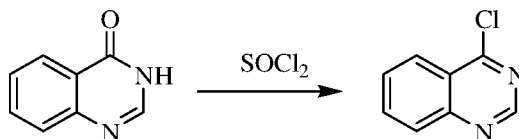
Приклад 3: Одержання проміжного 4-хлорхіназоліну

1) Одержання проміжного хіназолін-4(3H)-ону



2-Амінобензойну кислоту (13,7 г, 0,1 моль) і формамід (20 мл) вміщували в 250-мл тригорлу колбу, потім нагрівали при 140°C і піддавали взаємодії протягом 4-10 годин, і відслідковували за допомогою ТШХ (тонкошарова хроматографія) до повного завершення реакції. Коли розчин охолов до 100 °C, в умовах перемішування додавали 80 мл води, потім охолоджували до кімнатної температури, фільтрували, і отриману тверду речовину промивали безводним діетиловим ефіром, з одержанням 10,96 г хіназолін-4(3H)-ону у вигляді коричневої твердої речовини з виходом 75,1 %.

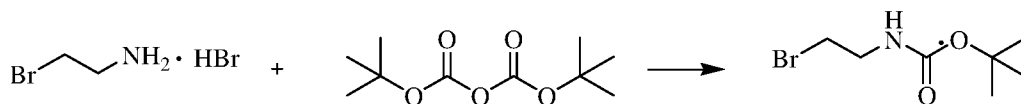
2) Одержання проміжного 4-хлорхіназоліну



Хіназолін-4(3H)-он (14,6 г, 0,1 моль) розчиняли в 50 мл сульфурилдихлориду і потім нагрівали при кип'ятінні зі зворотним холодильником протягом 4-6 годин. Після завершення реакції, яку відслідковували тонкошаровою хроматографією, отриману суміш виливали в крижану воду і перемішували протягом близько 30 хвилин, фільтрували, і отриману тверду речовину промивали безводним діетиловим ефіром, з одержанням 10,96 г 4-хлорхіназоліну у вигляді коричневої твердої речовини з виходом 92,7 %.

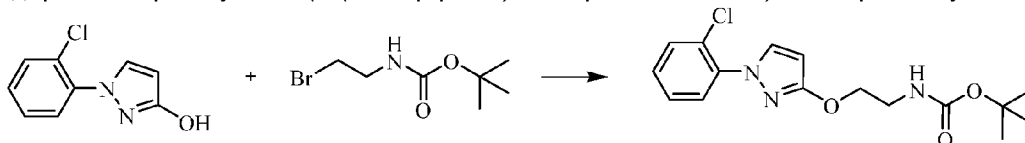
Приклад 4: Одержання проміжного гідрохлориду 2-(1-(4-хлорфеніл)-1H-піразол-3-ілокси)етанаміну

1) Одержання N-Вос-2-брометиламіну



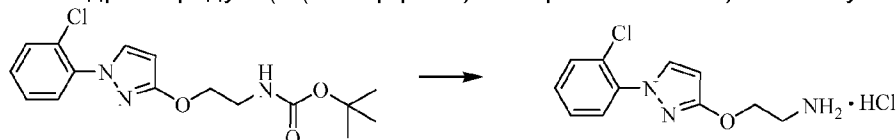
До розчин гідроброміду 2-брометиламіну 20,5 г (0,1 моль) і бікарбонату натрію 10,08 г (0,12 моль) у 80 мл тетрагідрофурану і 50 мл води по краплях додавали ди-трет-бутилдикарбонат 21,80 г (0,1 моль) при кімнатній температурі, потім отриману реакційну суміш продовжували перемішувати протягом 4-10 годин і відслідковували за допомогою ТШХ (тонкошарова хроматографія) до повного завершення реакції, надлишок розчинника випарювали при зниженому тиску. Потім отриману суміш виливали в (3×50 мл) етилацетату для відділення органічного шару, органічну фазу промивали 50 мл насиченого розчину солі, сушили й упарювали при зниженому тиску, з одержанням 21,84 г цільової проміжної сполуки у вигляді безбарвного масла з виходом 97,5 %.

2) Одержання трет-бутил 2-(1-(2-хлорфеніл)-1Н-піразол-3-ілокси)етилкарбамату



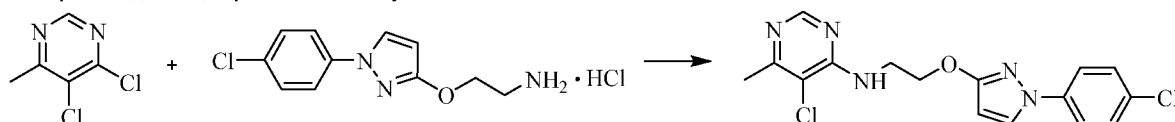
У розчин 2,24 г (0,01 моль) трет-бутил 2-брометилкарбамату і 1,94 г (0,01 моль) 1-(2-хлорфеніл)-1Н-піразол-3-олу (Organic Preparations and Procedures International, 34(1), 98-102; 2002) у 50 мл бутанону додавали 2,76 г (0,02 моль) карбонату калію. Отриману реакційну суміш продовжували перемішувати і нагрівали при кип'ятінні зі зворотним холодильником протягом 4-10 годин, і відслідковували за допомогою ТШХ (тонкошарова хроматографія) до повного завершення реакції, надлишок розчинника випарювали при зниженому тиску. Потім отриману суміш виливали в (3×50 мл) етилацетат для відділення органічного шару, органічну фазу промивали 50 мл насиченого розчину солі, сушили й упарювали при зниженому тиску, залишок очищали через силікагелеву колонку (етилацетат/петролейний ефір=1:6, як елюент), з одержанням 2,73 г трет-бутил 2-(1-(2-хлорфеніл)-1Н-піразол-3-ілокси)етилкарбамату у вигляді жовтої твердої речовини з виходом 81,1 %.

3) Одержання гідрохлориду 2-(1-(2-хлорфеніл)-1Н-піразол-3-ілокси)етанаміну



У розчин трет-бутил 2-(1-(2-хлорфеніл)-1Н-піразол-3-ілокси)етилкарбамату 3,37 г (0,01 моль) у 50 мл етилацетату по краплях додавали 6 мл концентрованої хлористоводневої кислоти. Отриману тверду речовину розчиняли, отриману реакційну суміш перемішували протягом 4-5 годин, і відслідковували за допомогою ТШХ (тонкошарова хроматографія) до повного завершення реакції, надлишок розчинника випарювали при зниженому тиску. Потім отриману суміш виливали в 10 мл дихлорметану, перемішували протягом півгодини і фільтрували, з одержанням 2,16 г цільової проміжної сполуки у вигляді білої твердої речовини.

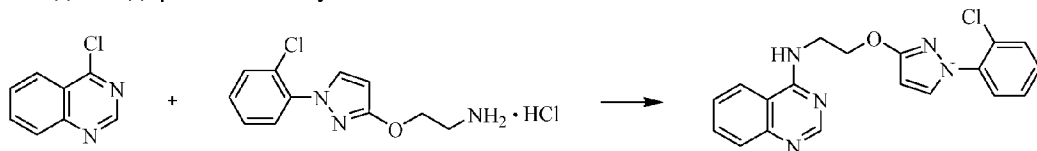
Приклад 5: Одержання сполуки 31-19



У розчин 1,62 г (0,01 моль) гідрохлориду 4,5-дихлор-6-метилпіримідину і 2,74 г (0,0 моль) 2-(1-(4-хлорфеніл)-1Н-піразол-3-ілокси)етанаміну в 50 мл толуолу додавали 4,45 г (0,022 моль) триетиламіну. Отриману реакційну суміш продовжували перемішувати і нагрівали при кип'ятінні зі зворотним холодильником протягом 4-10 годин, і відслідковували за допомогою ТШХ (тонкошарова хроматографія) до повного завершення реакції, надлишок розчинника випарювали при зниженому тиску. Потім отриману суміш виливали в (3×50 мл) етилацетату для відділення органічного шару, органічну фазу промивали 50 мл насиченого розчину солі, сушили й упарювали при зниженому тиску, залишок очищали через силікагелеву колонку (етилацетат/петролейний ефір=1:4, як елюент, кип'ятіння в межах 60-90°C), з одержанням 2,90 г сполуки 31-19 у вигляді білої твердої речовини з виходом 79,9 %.

¹H-ЯМР (300 МГц, внутрішній стандарт: TMS, розчинник: CDCl₃) δ (м. ч.): 2,44 (3H, с), 3,90-3,98 (2H, кв), 4,48 (2H, т), 5,93 (1H, д), 5,94 (1H, т), 7,37 (2H, дд), 7,52 (2H, дд), 7,71 (1H, д), 8,39 (1H, с).

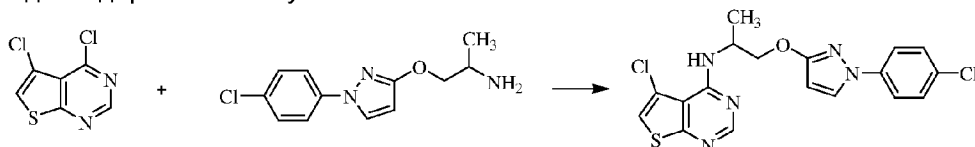
Приклад 6: Одержання сполуки 40-17



У розчин 1,64 г (0,01 моль) 4-хлорхіназоліну і 2,74 г (0,01 моль) гідрохлориду 2-(1-(2-хлорфеніл)-1H-піразол-3-ілокси)етанаміну в 50 мл толуолу додавали 4,45 г (0,022 моль) триетиламіну. Отриману реакційну суміш продовжували перемішувати і нагрівали при кип'ятінні зі зворотним холодильником протягом 4-10 годин, і відслідковували за допомогою ТШХ (тонкошарова хроматографія) до повного завершення реакції, надлишок розчинника випарювали при зниженому тиску. Потім отриману суміш виливали в (3×50 мл) етилацетату для відділення органічного шару, органічну фазу промивали 50 мл насиченого розчину солі, сушили й упарювали при зниженому тиску, залишок очищали через силікагелеву колонку (етилацетат/петролейний ефір=1:4, як елюент, кип'ятіння в межах 60-90°C), з одержанням 2,61 г сполуки 40-17 у вигляді білої твердої речовини з виходом 70,1 %. Т.пл. 186,6°C.

¹H-ЯМР (300 МГц, внутрішній стандарт: TMS, розчинник: CDCl₃) δ (м. ч.): 8,65 (с, 1H, хіназолін-3-H), 7,73 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-5-H), 7,40-7,72 (м, 5H, Ph-3,4,5,6-5H), 7,40-7,72 (м, 4H, хіназолін-5,6,7,8-4H), 5,97 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-4-H), 5,90 (с, 1H, NH), 4,63 (т, 2H, O-CH₂), 4,06 (м, 2H, N-CH₂).

Приклад 7: Одержання сполуки 44-19



У розчин 0,41 г (0,002 моль) 4,5-дихлортієно[2,3-d]піримідину і 0,51 г (0,002 моль) 1-(1-(4-хлорфеніл)-1H-піразол-3-ілокси)пропан-2-аміну в 50 мл толуолу додавали 0,45 г (0,011 моль) триетиламіну. Отриману реакційну суміш продовжували перемішувати і нагрівали при кип'ятінні зі зворотним холодильником протягом 4-10 годин, і відслідковували за допомогою ТШХ (тонкошарова хроматографія) до повного завершення реакції, надлишок розчинника випарювали при зниженому тиску. Потім отриману суміш виливали в (3×50 мл) етилацетату для відділення органічного шару, органічну фазу промивали 50 мл насиченого розчину солі, сушили й упарювали при зниженому тиску, залишок очищали через силікагелеву колонку (етилацетат/петролейний ефір=1:4, як елюент, кип'ятіння в межах 60-90°C), з одержанням 0,53 г сполуки 44-19 у вигляді білої твердої речовини з виходом 63,7 %.

¹H-ЯМР (300 МГц, внутрішній стандарт: TMS, розчинник: CDCl₃) δ (м. ч.): 1,48 (3H, д), 4,40-4,46 (2H, м), 4,85 (1H, кв), 5,95 (1H, д), 7,03 (1H, д), 7,26 (1H, с), 7,48 (2H, д), 7,51 (2H, д), 7,90 (1H, д), 8,47 (1H, с).

Інші сполуки за даним винаходом одержували відповідно до наведених вище прикладів.

Фізичні властивості і ¹H ЯМР спектр (¹H ЯМР, 300 МГц, внутрішній стандарт: TMS, м. ч.) деяких сполук даного винаходу були наступними:

Сполука 30-1-4: т.пл. 152,9°C. δ (CDCl₃) 8,29 (с, 1H, піримідин-H), 7,68 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-5-H), 7,51-7,56 (м, 2H, Ph-2,6-2H), 7,08-7,15 (м, 2H, Ph-3,5-2H), 5,91 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-4-H), 5,56 (с, 1H, NH), 4,49 (т, 2H, O-CH₂), 3,91-3,96 (м, 2H, N-CH₂), 2,05 (с, 3H, CH₃).

Сполука 30-1-19: т.пл. 156,1°C. δ (CDCl₃) 8,30 (с, 1H, піримідин-H), 7,72 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-5-H), 7,52 (д, J=9 Гц, 2H, Ph-2,6-2H), 7,39 (д, J=9 Гц, 2H, Ph-3,5-2H), 5,93 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-4-H), 5,50 (с, 1H, NH), 4,49 (т, 2H, O-CH₂), 3,94 (м, 2H, N-CH₂), 2,06 (с, 3H, CH₃).

Сполука 30-1-21: т.пл. 126,8°C. δ (CDCl₃) 8,28 (с, 1H, піримідин-H), 7,73 (д, J=2,7 Гц, 1H, піразол-5-H), 7,49-7,51 (м, 2H, Ph-3,6-H), 7,34 (д, 1H, Ph-5-H), 5,94 (д, J=2,7 Гц, 1H, піразол-4-H), 5,64 (с, 1H, NH), 4,47 (т, 2H, O-CH₂), 3,93 (м, 2H, N-CH₂), 2,04 (с, 3H, CH₃).

Сполука 30-1-25: т.пл. 172,7°C. δ (CDCl₃) 8,31 (с, 1H, піримідин-H), 7,73 (д, J=2,7 Гц, 1H, піразол-5-H), 7,50 (д, 2H, Ph-2,6-2H), 7,20 (с, 1H, Ph-4-H), 5,96 (д, J=2,7 Гц, 1H, піразол-4-H), 5,40 (с, 1H, NH), 4,50 (т, 2H, O-CH₂), 3,94-3,98 (м, 2H, N-CH₂), 2,11 (с, 3H, CH₃).

Сполука 30-1-30: т.пл. 175,9°C. δ (CDCl₃) 8,27 (с, 1H, піримідин-H), 7,47 (с, 2H, Ph-3,5-2H), 7,34 (д, J=2,7 Гц, 1H, піразол-5-H), 5,96 (д, J=2,7 Гц, 1H, піразол-4-H), 5,70 (с, 1H, NH), 4,45 (т, 2H, O-CH₂), 3,88-3,92 (м, 2H, N-CH₂), 2,06 (с, 3H, CH₃).

Сполука 30-1-49: т.пл. 170,8°C. δ (CDCl₃) 8,31 (с, 1H, піримідин-H), 7,82 (д, J=2,7 Гц, 1H, піразол-5-H), 7,65-7,73 (д, 4H, Ph), 6,00 (д, J=2,7 Гц, 1H, піразол-4-H), 5,34 (с, 1H, NH), 4,51 (т, 2H, O-CH₂), 3,93-3,99 (м, 2H, N-CH₂), 2,09 (с, 3H, CH₃).

Сполука 30-1-57: т.пл. 137,8°C. δ (CDCl₃) 8,29 (с, 1H, піримідин-Н), 7,70 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,45 (д, J=8,4 Гц, 2H, Ph-2,6-2H), 7,22 (д, J=8,4 Гц, 2H, Ph-3,5-2H), 5,89 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-4-Н), 5,70 (с, 1H, NH), 4,51 (т, 2H, O-CH₂), 3,90-3,95 (м, 2H, N-CH₂), 2,37 (с, 3H, PhCH₃), 2,03 (с, 3H, CH₃).

5 Сполука 30-1-78: масло. δ (CDCl₃) 8,30 (с, 1H, піримідин-Н), 7,68 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,51-7,60 (м, 2H, Ph-2,6-2H), 7,26-7,33 (м, 2H, Ph-3,5-2H), 5,93 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-4-Н), 5,46 (с, 1H, NH), 4,49 (т, 2H, O-CH₂), 3,92-3,97 (м, 2H, N-CH₂), 2,07 (с, 3H, CH₃).

Сполука 30-2-19: т.пл. 111,9°C. δ (CDCl₃) 8,17 (с, 1H, піримідин-Н), 7,72 (д, J=2,7 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,53 (д, J=6,9 Гц, 2H, Ph-2,6-2H), 7,38 (д, J=7,9 Гц, 2H, Ph-3,5-2H), 6,07 (с, 1H, NH), 5,92 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-4-Н), 4,48 (т, 2H, O-CH₂), 3,92 (м, 2H, N-CH₂), 3,74 (с, 3H, CH₃).

10 Сполука 30-3-19: масло. δ (CDCl₃) 10,35 (с, 1H, CHO), 8,45 (с, 1H, піримідин-Н), 7,70 (д, J=2,7 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,51 (д, J=9,3 Гц, 2H, Ph-2,6-2H), 7,37 (д, J=9,3 Гц, 2H, Ph-3,5-2H), 6,00 (с, 1H, NH), 5,93 (д, J=2,7 Гц, 1H, піразол-4-Н), 4,48 (т, 2H, O-CH₂), 4,05 (м, 2H, N-CH₂).

15 Сполука 30-4-19: т.пл. 143,7°C. δ (CDCl₃) 8,30 (с, 1H, піримідин-Н), 7,72 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,52 (д, J=8,7 Гц, 2H, Ph-2,6-2H), 7,38 (д, J=8,7 Гц, 2H, Ph-3,5-2H), 6,29 (с, 1H, NH), 5,93 (д, J=2,7 Гц, 1H, піразол-4-Н), 4,50 (т, 2H, O-CH₂), 3,94 (м, 2H, N-CH₂).

Сполука 31-4: т.пл. 139,2°C. δ (CDCl₃) 8,38 (с, 1H, піримідин-Н), 7,67 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,51-7,56 (м, 2H, Ph-2,6-2H), 7,07-7,13 (м, 2H, Ph-3,5-2H), 6,01 (с, 1H, NH), 5,91 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-4-Н), 4,48 (т, 2H, O-CH₂), 3,93-3,95 (м, 2H, N-CH₂), 2,43 (с, 3H, CH₃).

20 Сполука 31-18: т.пл. 146,7°C. δ (CDCl₃) 8,39 (с, 1H, піримідин-Н), 7,73 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,63 (с, 1H, Ph-2-Н), 7,43 (д, 1H, Ph-6-Н), 7,33 (т, 1H, Ph-5-Н), 7,19 (д, 1H, Ph-4-Н), 5,96 (с, 1H, NH), 5,94 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-4-Н), 4,50 (т, 2H, O-CH₂), 3,95 (м, 2H, N-CH₂), 2,44 (с, 3H, CH₃).

25 Сполука 31-21: т.пл. 155,6°C. δ (CDCl₃) 8,37 (с, 1H, піримідин-Н), 7,73 (д, J=2,7 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,53 (с, 1H, Ph-3-Н), 7,50 (д, J=1,8 Гц, 1H, Ph-6-Н), 7,34 (д, J=1,8 Гц, 1H, Ph-5-Н), 6,09 (с, 1H, NH), 5,94 (д, J=2,7 Гц, 1H, піразол-4-Н), 4,46 (т, 2H, O-CH₂), 3,93 (м, 2H, N-CH₂), 2,44 (с, 3H, CH₃).

Сполука 31-23: масло. δ (CDCl₃) 8,37 (с, 1H, піримідин-Н), 7,31-7,46 (м, 4H, піразол-5-Н, Ph), 6,12 (с, 1H, NH), 5,96 (д, 1H, піразол-4-Н), 4,45 (т, 2H, O-CH₂), 3,89-3,95 (м, 2H, N-CH₂), 2,45 (с, 3H, CH₃).

30 Сполука 31-25: т.пл. 144,1°C. δ (CDCl₃) 8,40 (с, 1H, піримідин-Н), 7,71 (д, J=2,7 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,49-7,51 (м, 2H, Ph-2,6-2H), 7,18 (с, 1H, Ph-4-Н), 5,96 (д, J=2,7 Гц, 1H, піразол-4-Н), 5,92 (с, 1H, NH), 4,49 (т, 2H, O-CH₂), 3,94-3,96 (м, 2H, N-CH₂), 2,45 (с, 3H, CH₃).

35 Сполука 31-30: масло. δ (CDCl₃) 8,37 (с, 1H, піримідин-Н), 7,46 (с, 2H, Ph-3,5-2H), 7,33 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-5-Н), 6,06 (с, 1H, NH), 5,96 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-4-Н), 4,43 (т, 2H, O-CH₂), 3,89-3,95 (м, 2H, N-CH₂), 2,46 (с, 3H, CH₃).

Сполука 31-49: т.пл. 187,0°C. δ (CDCl₃) 8,39 (с, 1H, піримідин-Н), 7,80 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,69 (с, 4H, Ph), 6,00 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-4-Н), 5,91 (с, 1H, NH), 4,50 (т, 2H, O-CH₂), 3,92-3,98 (м, 2H, N-CH₂), 2,44 (с, 3H, CH₃).

40 Сполука 31-57: т.пл. 127,3°C. δ (CDCl₃) 8,38 (с, 1H, піримідин-Н), 7,69 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,46 (д, J=8,7 Гц, 2H, Ph-2,6-2H), 7,19 (д, J=8,7 Гц, 2H, Ph-3,5-2H), 6,04 (с, 1H, NH), 5,89 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-4-Н), 4,48 (т, 2H, O-CH₂), 3,91-3,96 (м, 2H, N-CH₂), 2,43 (с, 3H, CH₃), 2,36 (с, 3H, PhCH₃).

45 Сполука 31-69: т.пл. 171,0°C. δ (CDCl₃) 8,39 (с, 1H, піримідин-Н), 7,81 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,62-7,70 (м, 4H, Ph-2,3,5,6-4H), 5,98 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-4-Н), 5,95 (с, 1H, NH), 4,50 (т, 2H, O-CH₂), 3,96 (м, 2H, N-CH₂), 2,43 (с, 3H, CH₃).

Сполука 31-78: т.пл. 134,7°C. δ (CDCl₃) 8,39 (с, 1H, піримідин-Н), 7,72 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,58-7,62 (м, 2H, Ph-2,6-2H), 7,26-7,29 (м, 2H, Ph-3,5-2H), 5,96 (с, 1H, NH), 5,94 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-4-Н), 4,49 (т, 2H, O-CH₂), 3,92-3,98 (м, 2H, N-CH₂), 2,44 (с, 3H, CH₃).

50 Сполука 32-1: т.пл. 92,2°C. δ (CDCl₃) 8,43 (с, 1H, піримідин-Н), 7,75 (д, J=2,7 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,59 (д, J=8,4 Гц, 2H, Ph-2,6-2H), 7,41 (м, 2H, Ph-3,5-2H), 7,22 (м, 1H, Ph-4-Н), 6,05 (с, 1H, NH), 5,92 (д, J=2,7 Гц, 1H, піразол-4-Н), 4,50 (т, 2H, O-CH₂), 3,95 (м, 2H, N-CH₂), 2,76 (м, 2H, CH₂), 1,24 (т, 3H, CH₃).

55 Сполука 32-4: т.пл. 123,9°C. δ (CDCl₃) 8,43 (с, 1H, піримідин-Н), 7,67 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,51-7,56 (м, 2H, Ph-2,6-2H), 7,07-7,13 (м, 2H, Ph-3,5-2H), 6,01 (с, 1H, NH), 5,91 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-4-Н), 4,78 (т, 2H, O-CH₂), 3,91-3,96 (м, 2H, N-CH₂), 2,73-2,80 (м, 2H, CH₂), 1,24 (т, 3H, CH₃).

Сполука 32-17: т.пл. 75,4°C. δ (CDCl₃) 8,42 (с, 1H, піримідин-Н), 7,74 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,57 (д, 1H, Ph-6-Н), 7,48 (д, J=1,5 Гц, 1H, Ph-3-Н), 7,26-7,36 (м, 2H, Ph-4,5-2H), 6,09 (с, 1H,

NH), 5,94 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-4-Н), 4,47 (т, 2H, O-CH₂), 3,93 (м, 2H, N-CH₂), 2,77 (м, 2H, CH₂), 1,25 (т, 3H, CH₃).

5 Сполука 32-18: т.пл. 100,9°C. δ (CDCl₃) 8,44 (с, 1H, піримідин-Н), 7,73 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,64 (с, 1H, Ph-2-Н), 7,45 (д, 1H, Ph-6-Н), 7,33 (т, 1H, Ph-5-Н), 7,18 (д, 1H, Ph-4-Н), 5,99 (с, 1H, NH), 5,94 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-4-Н), 4,49 (т, 2H, O-CH₂), 3,95 (м, 2H, N-CH₂), 2,77 (м, 2H, CH₂), 1,27 (т, 3H, CH₃).

Сполука 32-19: т.пл. 138,6°C. δ (CDCl₃) 1,24(3H, т), 2,71-2,82(2H, кв), 3,90-3,98(2H, кв), 4,49(2H, т), 5,93(1H, д), 6,01(1H, т), 7,37(2H, д), 7,53(2H, д), 7,72(1H, д), 8,44(1H, с).

10 Сполука 32-21: т.пл. 97,6°C. δ (CDCl₃) 8,41 (с, 1H, піримідин-Н), 7,73 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,51 (с, 1H, Ph-3-Н), 7,49 (д, 1H, Ph-6-Н), 7,28 (д, 1H, Ph-5-Н), 6,09 (с, 1H, NH), 5,95 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-4-Н), 4,46 (т, 2H, O-CH₂), 3,94 (м, 2H, N-CH₂), 2,76 (м, 2H, CH₂), 1,25 (т, 3H, CH₃).

Сполука 32-23: масло. δ (CDCl₃) 8,41 (с, 1H, піримідин-Н), 7,27-7,46 (м, 4H, піразол-5-Н, Ph), 6,12 (с, 1H, NH), 5,96 (д, 1H, піразол-4-Н), 4,45 (т, 2H, O-CH₂), 3,90-3,95 (м, 2H, N-CH₂), 2,73-2,82 (м, 2H, CH₂), 1,22-1,28 (м, 3H, CH₃).

15 Сполука 32-25: т.пл. 104,9°C. δ (CDCl₃) 8,46 (с, 1H, піримідин-Н), 7,71 (д, J=2,7 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,49 (с, 2H, Ph-2,6-2H), 7,17 (с, 1H, Ph-4-Н), 5,98 (с, 1H, NH), 5,96 (д, J=2,7 Гц, 1H, піразол-4-Н), 4,49 (т, 2H, O-CH₂), 3,93-3,96 (м, 2H, N-CH₂), 2,77-2,80 (м, 2H, CH₂), 1,25 (т, 3H, CH₃).

20 Сполука 32-30: масло. δ (CDCl₃) 8,42 (с, 1H, піримідин-Н), 7,46 (с, 2H, Ph-3,5-2H), 7,33 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-5-Н), 6,05 (с, 1H, NH), 5,96 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-4-Н), 4,43 (т, 2H, O-CH₂), 3,89-3,95 (м, 2H, N-CH₂), 2,74-2,82 (м, 2H, CH₂), 1,26 (т, 3H, CH₃).

Сполука 32-49: т.пл. 145,1°C. δ (CDCl₃) 8,44 (с, 1H, піримідин-Н), 7,80 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,69 (с, 4H, Ph), 6,00 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-4-Н), 5,91 (с, 1H, NH), 4,51 (т, 2H, O-CH₂), 3,93-3,98 (м, 2H, N-CH₂), 2,72-2,78 (м, 2H, CH₂), 1,21-1,28 (м, 3H, CH₃).

25 Сполука 32-57: т.пл. 112,5°C. δ (CDCl₃) 8,43 (с, 1H, піримідин-Н), 7,69 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,46 (д, J=8,7 Гц, 2H, Ph-2,6-2H), 7,19 (д, J=8,7 Гц, 2H, Ph-3,5-2H), 6,04 (с, 1H, NH), 5,89 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-4-Н), 4,48 (т, 2H, O-CH₂), 3,91-3,97 (м, 2H, N-CH₂), 2,72-2,80 (м, 2H, CH₂), 2,36 (с, 3H, CH₃), 1,24 (т, 3H, CH₃).

30 Сполука 32-69: т.пл. 119,9°C. δ (CDCl₃) 8,44 (с, 1H, піримідин-Н), 7,81 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,64-7,68 (м, 4H, Ph-2,3,5,6-4H), 5,98 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-4-Н), 5,95 (с, 1H, NH), 4,51 (т, 2H, O-CH₂), 3,96 (м, 2H, N-CH₂), 2,77 (м, 2H, CH₂), 1,24 (т, 3H, CH₃).

35 Сполука 32-78: т.пл. 102,1°C. δ (CDCl₃) 8,45 (с, 1H, піримідин-Н), 7,66 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,52-7,62 (м, 2H, Ph-2,6-2H), 7,28-7,33 (м, 2H, Ph-3,5-2H), 5,98 (с, 1H, NH), 5,94 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-4-Н), 4,49 (т, 2H, O-CH₂), 3,94-3,96 (м, 2H, N-CH₂), 2,75-2,78 (м, 2H, CH₂), 1,24 (т, 3H, CH₃).

Сполука 33-1: т.пл. 73,6°C. δ (CDCl₃) 8,23 (с, 1H, піримідин-Н), 7,75 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,59 (д, J=8,4 Гц, 2H, Ph-2,6-2H), 7,42 (м, 2H, Ph-3,5-2H), 7,23 (м, 1H, Ph-4-Н), 6,70 (т, 1H, CHF₂), 6,22 (с, 1H, NH), 5,90 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-4-Н), 4,36 (т, 2H, O-CH₂), 3,75 (м, 2H, N-CH₂).

40 Сполука 33-4: т.пл. 115,2°C. δ (CDCl₃) 8,56 (с, 1H, піримідин-Н), 7,67 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,51-7,56 (м, 2H, Ph-2,6-2H), 7,07-7,14 (м, Ph-3,5-2H), 6,69 (т, J=5 3,4 Гц, 1H, CF₂H), 6,43 (с, 1H, NH), 5,91 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-4-Н), 4,52 (т, 2H, O-CH₂), 3,95-4,01 (м, 2H, N-CH₂).

45 Сполука 33-18: т.пл. 99,3°C. δ (CDCl₃) 8,56 (с, 1H, піримідин-Н), 7,74 (д, J=2,7 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,64 (с, 1H, Ph-2-Н), 7,44 (д, 1H, Ph-6-Н), 7,33 (т, 1H, Ph-5-Н), 7,18 (д, 1H, Ph-4-Н), 6,70 (т, 1H, CHF₂), 6,37 (с, 1H, NH), 5,94 (д, J=2,7 Гц, 1H, піразол-4-Н), 4,53 (т, 2H, O-CH₂), 3,99 (м, 2H, N-CH₂).

Сполука 33-19: т.пл. 142,8°C. δ (CDCl₃) 4,00-4,05 (2H, кв), 4,56 (2H, т), 5,96 (1H, с), 6,50 (1H, с), 6,75 (1H, т), 7,40 (2H, д), 7,51 (2H, д), 7,75 (1H, с), 8,60 (1H, с).

50 Сполука 33-21: т.пл. 136,5°C. δ (CDCl₃) 8,55 (с, 1H, піримідин-Н), 7,72 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,51 (с, 1H, Ph-3-Н), 7,49 (д, 1H, Ph-6-Н), 7,35 (д, 1H, Ph-5-Н), 6,70 (т, 1H, CHF₂), 6,39 (с, 1H, NH), 5,94 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-4-Н), 4,49 (т, 2H, O-CH₂), 3,97 (м, 2H, N-CH₂).

Сполука 33-25: т.пл. 126,5°C. δ (CDCl₃) 8,58 (с, 1H, піримідин-Н), 7,72 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,49-7,51 (м, 2H, Ph-2,6-2H), 7,19 (д, 1H, Ph-4-Н), 6,72 (т, J=53,40 Гц, 1H, CF₂H), 6,30 (с, 1H, NH), 5,96 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-4-Н), 4,53 (т, 2H, O-CH₂), 3,97-4,03 (м, 2H, N-CH₂).

55 Сполука 33-30: т.пл. 132,9°C. δ (CDCl₃) 8,54 (с, 1H, піримідин-Н), 7,47 (с, 2H, Ph-3,5-2H), 7,34 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-5-Н), 6,73 (т, J=53,7 Гц, 1H, CF₂H), 6,52 (с, 1H, NH), 5,96 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-4-Н), 4,46 (т, 2H, O-CH₂), 3,94-3,99 (м, 2H, N-CH₂).

Сполука 33-49: т.пл. 151,7°C. δ (CDCl₃) 8,57 (с, 1H, піримідин-Н), 7,82 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,70 (с, 4H, Ph), 6,70 (т, J=53,70 Гц, 1H, CF₂H), 6,52 (с, 1H, NH), 6,01 (д, J=2,4 Гц,

1H, піразол-4-Н), 4,54 (т, 2H, O-CH₂), 3,98-4,03 (м, 2H, N-CH₂).

Сполука 33-57: т.пл. 106,6°C. δ (CDCl₃) 8,56 (с, 1H, піримідин-Н), 7,71 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,46 (д, J=8,4 Гц, 2H, Ph-2,6-2H), 7,21 (д, J=8,4 Гц, 2H, Ph-3,5-2H), 6,69 (т, J=54,00 Гц, 1H, CF₂H), 6,52 (с, 1H, NH), 5,89 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-4-Н), 4,53 (т, 2H, O-CH₂), 3,95-4,00 (м, 2H, N-CH₂), 2,37 (с, 3H, CH₃).

Сполука 33-69: т.пл. 122,3°C. δ (CDCl₃) 8,57 (с, 1H, піримідин-Н), 7,81 (д, J=2,7 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,01-7,64 (м, 4H, Ph-2,3,5,6-4H), 6,70 (т, 1H, CHF₂), 6,31 (с, 1H, NH), 5,98 (д, J=2,7 Гц, 1H, піразол-4-Н), 4,54 (т, 2H, O-CH₂), 4,00 (м, 2H, N-CH₂).

Сполука 35-19: δ (CDCl₃) 1,42 (3H, д), 4,38 (2H, д), 4,65 (1H, с), 5,93 (1H, д), 6,06-6,08 (1H, м), 7,38 (2H, д), 7,51 (2H, д), 7,71 (1H, д), 8,28 (1H, с).

Сполука 36-19: т.пл. 80-82°C. δ (CDCl₃) 1,42 (3H, д), 2,42 (3H, с), 4,37 (2H, д), 4,65-4,67 (1H, м), 5,91 (1H, с), 5,93 (1H, д), 7,36 (2H, д), 7,53 (2H, д), 7,70 (1H, д), 8,40 (1H, с).

Сполука 37-19: δ (CDCl₃) 1,24 (3H, т), 1,42 (3H, д), 2,73-2,77 (2H, кв), 4,37 (2H, д), 4,39 (1H, с), 5,78-5,82 (1H, м), 5,93 (1H, д), 7,38 (2H, д), 7,52 (2H, д), 7,70 (1H, д), 8,43 (1H, с).

Сполука 40-1: масло. δ (CDCl₃) 8,66 (с, 1H, хіназолін-3-Н), 7,76 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,72-7,75 (м, 5H, Ph-2,3,4,5,6-5H), 7,72-7,75 (м, 4H, хіназолін-5,6,7,8-4H), 6,22 (с, 1H, NH), 5,90 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-4-Н), 4,36 (т, 2H, O-CH₂), 3,75 (м, 2H, N-CH₂).

Сполука 40-4: т.пл. 155,7°C. δ (CDCl₃) 8,67 (с, 1H, хіназолін-3-Н), 7,82 (д, 1H, хіназолін-6-Н), 7,67 (д, J=2,7 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,53-7,65 (м, 4H, Ph-2,6-2H, хіназолін-7,8-Н), 7,10-7,19 (м, 3H, Ph-3,5-2H, хіназолін-9-Н), 6,95 (с, 1H, NH), 5,94 (д, J=2,7 Гц, 1H, =CH), 4,62 (т, 2H, CH₂), 4,05-4,10 (м, 2H, CH₂).

Сполука 40-18: т.пл. 146,1°C. δ (CDCl₃) 8,68 (с, 1H, хіназолін-3-Н), 7,74 (д, J=2,7 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,63-7,71 (м, 4H, Ph-2, 4,5,6-4H), 7,31-7,54 (м, 4H, хіназолін-5,6,7,8-4H), 6,78 (с, 1H, NH), 5,96 (д, J=2,7 Гц, 1H, піразол-4-Н), 4,63 (т, 2H, O-CH₂), 4,10 (м, 2H, N-CH₂).

Сполука 40-19: т.пл. 176,4°C. δ (CDCl₃) 4,10-4,15 (2H, кв), 4,67 (2H, т), 5,99 (1H, с), 7,11 (1H, с), 7,44 (2H, д), 7,58 (2H, д), 7,66 (1H, д), 7,71-7,76 (2H, д), 7,90 (1H, д), 8,70 (1H, с).

Сполука 40-21: т.пл. 141,7°C. δ (CDCl₃) 8,66 (с, 1H, хіназолін-3-Н), 7,72 (д, J=2,7 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,80-7,83 (м, 3H, Ph-3,5,6-3H), 7,51-7,58 (м, 4H, хіназолін-5,6,7,8-4H), 6,90 (с, 1H, NH), 5,97 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-4-Н), 4,59 (т, 2H, O-CH₂), 4,08 (м, 2H, N-CH₂).

Сполука 40-25: т.пл. 199,9°C. δ (CDCl₃) 8,69 (с, 1H, хіназолін-3-Н), 7,83 (д, 1H, хіназолін-6-Н), 7,73 (д, J=3,0 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,65-7,66 (м, 2H, хіназолін-7,8-Н), 7,51-7,52 (м, 2H, Ph-2,6-2H), 7,30-7,36 (м, 1H, хіназолін-7,8-Н), 7,21-7,22 (м, 1H, Ph-4-Н), 6,56 (с, 1H, NH), 5,99 (д, J=3,0 Гц, 1H, піразол-4-Н), 4,62 (т, 2H, O-CH₂), 4,09-4,14 (м, 2H, N-CH₂).

Сполука 40-30: т.пл. 170,5°C. δ (CDCl₃) 8,66 (с, 1H, хіназолін-3-Н), 7,52-7,84 (м, 3H, хіназолін-6,7,9-3H), 7,46 (с, 2H, Ph-3,5-2H), 7,35 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,24 (т, 1H, хіназолін-8-1H), 5,99 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-4-Н), 4,57 (т, 2H, O-CH₂), 4,04-4,09 (м, 2H, N-CH₂).

Сполука 40-49: масло. δ (CDCl₃) 8,68 (с, 1H, хіназолін-3-Н), 7,83 (д, 1H, хіназолін-6-Н), 7,81 (д, J=3,0 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,64-7,76 (м, 5H, хіназолін-7,8,9-Н, Ph-2,6-2H), 7,31 (д, 2H, Ph-3,5-2H), 6,47 (с, 1H, NH), 6,02 (д, J=3,0 Гц, 1H, піразол-4-Н), 4,62 (т, 2H, O-CH₂), 4,09-4,15 (м, 2H, N-CH₂).

Сполука 40-57: т.пл. 178,7°C. δ (CDCl₃) 8,66 (с, 1H, хіназолін-3-Н), 7,78 (д, 1H, хіназолін-6-Н), 7,70 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,58-7,67 (м, 3H, хіназолін-7,8,9-Н), 7,50 (д, J=8,4 Гц, 2H, Ph-2,6-2H), 7,10 (д, J=8,4 Гц, 2H, Ph-3,5-2H), 5,92 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-4-Н), 4,64 (т, 2H, O-CH₂), 4,05-4,10 (м, 2H, N-CH₂), 2,40 (с, 3H, CH₃).

Сполука 40-69: т.пл. 170,1°C. δ (CDCl₃) 8,68 (с, 1H, хіназолін-3-Н), 7,81 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,62-7,71 (м, 4H, Ph-2,3,5,6-4H), 7,62-7,71 (м, 4H, хіназолін-5,6,7,8-4H), 6,62 (с, 1H, NH), 6,00 (д, J=2,7 Гц, 1H, піразол-4-Н), 4,64 (т, 2H, O-CH₂), 4,11 (м, 2H, N-CH₂).

Сполука 42-1: т.пл. 129,7°C. δ (CDCl₃) 8,48 (с, 1H, піримідин-Н), 7,74 (д, J=2,7 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,57 (д, J=8,4 Гц, 2H, Ph-2,6-2H), 7,40 (м, 2H, Ph-3,5-2H), 7,19 (м, 1H, Ph-4-Н), 7,03 (с, 1H, тієно-Н), 6,98 (с, 1H, NH), 5,92 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-4-Н), 4,55 (т, 2H, O-CH₂), 4,08 (м, 2H, N-CH₂).

Сполука 42-4: т.пл. 132,2°C. δ (CDCl₃) 8,48 (с, 1H, піримідин-Н), 7,67 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,49-7,55 (м, 2H, Ph-2,6-2H), 7,04-7,13 (м, 2H, Ph-3,5-2H), 6,97 (с, 1H, тієно-Н), 6,92 (с, 1H, NH), 5,92 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-4-Н), 4,53 (т, 2H, O-CH₂), 4,04-4,10 (м, 2H, N-CH₂).

Сполука 42-17: т.пл. 122,4°C. δ (CDCl₃) 8,47 (с, 1H, піримідин-Н), 7,74 (д, J=2,4 Гц, 1H, піразол-5-Н), 7,54 (д, J=7,5 Гц, 1H, Ph-6-Н), 7,48 (д, J=7,5 Гц, 1H, Ph-3-Н), 7,31-7,36 (м, 2H, Ph-4,5-2H), 7,05 (с, 1H, тієно-Н), 7,01 (с, 1H, NH), 5,94 (д, J=2,1 Гц, 1H, піразол-4-Н), 4,53 (т, 2H, O-CH₂), 4,07 (м, 2H, N-CH₂).

Сполука 42-18: т.пл. 100,1°C. δ (CDCl₃) 8,48 (с, 1H, піримідин-Н), 7,72 (д, J=2,7 Гц, 1H,

піразол-5-Н), 7,61 (с, 1Н, Ph-2-Н), 7,43 (д, 1Н, Ph-6-Н), 7,31 (т, 1Н, Ph-5-Н), 7,17 (д, 1Н, Ph-4-Н), 7,04 (с, 1Н, тієно-Н), 6,95 (с, 1Н, NH), 5,94 (д, J=2,7 Гц, 1Н, піразол-4-Н), 4,55 (т, 2Н, O-CH₂), 4,08 (м, 2Н, N-CH₂).

5 Сполука 42-21: т.пл. 123,1°C. δ (CDCl₃) 8,47 (с, 1Н, піримідин-Н), 7,73 (д, J=2,4 Гц, 1Н, піразол-5-Н), 7,48-7,51 (м, 2Н, Ph-3,6-2Н), 7,32 (д, 1Н, Ph-5-Н), 7,05 (с, 1Н, тієно-Н), 6,97 (с, 1Н, NH), 5,94 (д, J=2,4 Гц, 1Н, піразол-4-Н), 4,51 (т, 2Н, O-CH₂), 4,06 (м, 2Н, N-CH₂).

Сполука 42-25: масло. δ (CDCl₃) 8,49 (с, 1Н, піримідин-Н), 7,71 (д, J=2,4 Гц, 1Н, піразол-5-Н), 7,43-7,49 (м, 2Н, Ph-2,6-2Н), 7,14-7,19 (м, 1Н, Ph-4-Н), 7,06 (с, 1Н, тіофен-Н), 6,94 (с, 1Н, NH), 5,96 (д, J=2,4 Гц, 1Н, піразол-4-Н), 4,55 (т, 2Н, O-CH₂), 4,05-4,11 (м, 2Н, N-CH₂).

10 Сполука 42-30: масло. δ (CDCl₃) 8,46 (с, 1Н, піримідин-Н), 7,45 (с, 2Н, Ph-3,5-2Н), 7,32 (д, J=2,4 Гц, 1Н, піразол-5-Н), 7,06 (с, 1Н, тіофен-Н), 6,98 (с, 1Н, NH), 5,96 (д, J=2,4 Гц, 1Н, піразол-4-Н), 4,47 (т, 2Н, O-CH₂), 4,04-4,07 (м, 2Н, N-CH₂).

15 Сполука 42-49: т.пл. 164,9°C. δ (CDCl₃) 8,49 (с, 1Н, піримідин-Н), 7,80 (д, J=2,4 Гц, 1Н, піразол-5-Н), 7,63-7,67 (м, 4Н, Ph), 7,04 (с, 1Н, тіофен-Н), 6,90 (с, 1Н, NH), 6,01 (д, J=2,4 Гц, 1Н, піразол-4-Н), 4,57 (т, 2Н, O-CH₂), 4,07-4,10 (м, 2Н, N-CH₂).

Сполука 42-57: т.пл. 113,4°C. δ (CDCl₃) 8,48 (с, 1Н, піримідин-Н), 7,68 (д, J=2,7 Гц, 1Н, піразол-5-Н), 7,44 (д, J=8,4 Гц, 2Н, Ph-2,6-2Н), 7,19 (д, J=8,4 Гц, 2Н, Ph-3,5-2Н), 7,03 (с, 1Н, тіофен-Н), 6,03 (с, 1Н, NH), 5,89 (д, J=2,7 Гц, 1Н, піразол-4-Н), 4,54 (т, 2Н, O-CH₂), 4,04-4,10 (м, 2Н, N-CH₂), 2,36 (с, 3Н, CH₃).

20 Сполука 42-69: т.пл. 149,7°C. δ (CDCl₃) 8,48 (с, 1Н, піримідин-Н), 7,79 (д, J=2,4 Гц, 1Н, піразол-5-Н), 7,65 (м, 4Н, Ph-2,3,5,6-4Н), 7,03 (с, 1Н, тієно-Н), 6,92 (с, 1Н, NH), 5,98 (д, J=2,4 Гц, 1Н, піразол-4-Н), 4,57 (т, 2Н, O-CH₂), 4,09 (м, 2Н, N-CH₂).

25 Сполука 42-78: масло. δ (CDCl₃) 8,49 (с, 1Н, піримідин-Н), 7,96 (д, J=2,4 Гц, 1Н, піразол-5-Н), 7,71-7,74 (м, 2Н, Ph-2,6-2Н), 7,29-7,33 (м, 2Н, Ph-3,5-2Н), 7,16 (с, 1Н, тіофен-Н), 6,96 (с, 1Н, NH), 5,94 (д, J=2,4 Гц, 1Н, піразол-4-Н), 4,55 (т, 2Н, O-CH₂), 4,07-4,09 (м, 2Н, N-CH₂).

Сполука 57-4: δ (CDCl₃) 2,47 (3Н, с), 3,92 (2Н, д), 4,14 (2Н, т), 5,78 (1Н, с), 7,13 (2Н, т), 7,55 (1Н, с), 7,56-7,59 (3Н, м), 8,39 (1Н, с).

30 Сполука 57-19 : т.пл. 130,0°C. δ (CDCl₃): 8,41 (с, 1Н, піримідин-Н), 7,58 (с, 1Н, піразол-5-Н), 7,56 (д, J=9,0 Гц, 2Н, Ph-2,6-2Н), 7,50 (с, 1Н, піразол-3-Н), 7,40 (д, J=9,0 Гц, 2Н, Ph-3,5-2Н), 5,85 (с, 1Н, NH), 4,14 (т, 2Н, O-CH₂), 3,95-3,90 (м, 2Н, N-CH₂), 2,46 (т, 3Н, CH₃).

Сполука 58-19: т.пл. 134,7°C. δ (CDCl₃): 8,45 (с, 1Н, піримідин-Н), 7,60 (с, 1Н, піразол-5-Н), 7,56 (д, J=9,0 Гц, 2Н, Ph-2,6-2Н), 7,50 (с, 1Н, піразол-3-Н), 7,40 (д, J=9,0 Гц, 2Н, Ph-3,5-2Н), 5,82 (с, 1Н, NH), 4,15 (т, 2Н, O-CH₂), 3,95-3,90 (м, 2Н, N-CH₂), 2,84-2,77 (м, 2Н, CH₂), 1,27 (т, 3Н, CH₃).

35 Сполука 59-19: т.пл. 125,7°C. δ (CDCl₃): 8,58 (с, 1Н, піримідин-Н), 7,58 (с, 1Н, піразол-5-Н), 7,56 (д, J=9,0 Гц, 2Н, Ph-2,6-2Н), 7,50 (с, 1Н, піразол-3-Н), 7,40 (д, J=9,0 Гц, 2Н, Ph-3,5-2Н), 6,74 (т, J=54 Гц, 1Н, CF₂H), 6,08 (с, 1Н, NH), 4,16 (т, 2Н, O-CH₂), 4,01-3,96 (м, 2Н, N-CH₂).

Сполука 68-19 : т.пл. 119,2°C. δ (CDCl₃): 8,49 (с, 1Н, піримідин-Н), 7,60 (с, 1Н, піразол-5-Н), 7,55 (д, J=8,7 Гц, 2Н, Ph-2,6-2Н), 7,51 (с, 1Н, піразол-3-Н), 7,39 (д, J=8,7 Гц, 2Н, Ph-3,5-2Н), 7,01 (с, 1Н, тіофен-Н), 6,97 (с, 1Н, NH), 4,22 (т, 2Н, O-CH₂), 4,07-4,02 (м, 2Н, N-CH₂).

40 Сполука 59-21: масло. δ (CDCl₃) 8,54 (с, 1Н, піримідин-Н), 8,01 (с, 1Н, Ph-3-Н), 7,57 (с, 1Н, піразол-5-Н), 7,49-7,52 (м, 2Н, Ph-6-Н, піразол-3-Н), 7,35 (дд, 1Н, Ph-5-Н), 6,73 (т, J=53,7 Гц, 1Н, CF₂H), 6,25 (с, 1Н, NH), 4,11 (т, 2Н, O-CH₂), 3,75-3,81 (м, 2Н, N-CH₂), 2,13-2,18 (м, 2Н, CH₂).

Сполука 68-4: δ (CDCl₃) 4,03-4,04 (2Н, кв), 4,20 (2Н, т), 7,10 (1Н, с), 7,12-7,15 (2Н, м), 7,25 (1Н, д), 7,52-7,58 (4Н, м), 8,48 (1Н, с).

45 Сполука 116-5: δ (CDCl₃) 8,43 (с, 1Н, піримідин-Н), 7,68 (д, J=2,7 Гц, 1Н, піразол-5-Н), 7,49-7,54 (м, 2Н, Ph-2,6-2Н), 7,34-7,39 (м, 2Н, Ph-3,5-2Н), 5,86 (д, J=2,7 Гц, 1Н, піразол-4-Н), 4,56 (т, 2Н, O-CH₂), 4,03 (т, 2Н, N-CH₂), 3,22 (с, 3Н, NCH₃), 2,79-2,87 (м, 2Н, CH₂), 1,26 (т, 3Н, CH₃).

50 Сполука 118-69: т.пл. 83,5°C. δ (CDCl₃) 8,28 (с, 1Н, піримідин-Н), 7,81 (д, J=2,7 Гц, 1Н, піразол-5-Н), 7,65-7,72 (м, 4Н, Ph-2,3,5,6-4Н), 6,15 (с, 1Н, NH), 5,97 (д, J=2,7 Гц, 1Н, піразол-4-Н), 4,44 (т, 2Н, O-CH₂), 3,75 (м, 2Н, N-CH₂), 2,16 (м, 2Н, CH₂).

Сполука 119-69: масло. δ (CDCl₃) 8,07 (с, 1Н, піримідин-Н), 7,81 (д, J=2,4 Гц, 1Н, піразол-5-Н), 7,65-7,72 (м, 4Н, Ph-2,3,5,6-4Н), 5,98 (д, J=3 Гц, 1Н, піразол-4-Н), 5,43 (с, 1Н, NH), 4,43 (т, 2Н, O-CH₂), 3,72 (м, 2Н, N-CH₂), 3,44 (с, 2Н, NH₂), 2,17 (м, 2Н, CH₂).

55 Сполука 120-69: масло. δ (CDCl₃) 8,10 (с, 1Н, піримідин-Н), 7,80 (д, J=3 Гц, 1Н, піразол-5-Н), 7,64-7,72 (м, 4Н, Ph-2,3,5,6-4Н), 6,03 (д, J=3 Гц, 1Н, піразол-4-Н), 5,99 (с, 1Н, NH), 4,43 (т, 2Н, O-CH₂), 3,84 (м, 2Н, N-CH₂), 2,17 (м, 2Н, CH₂).

Сполука 121-69: т.пл. 96,0°C. δ (CDCl₃) 10,38 (с, 1Н, CHO), 9,47 (с, 1Н, NH), 8,42 (с, 1Н, піримідин-Н), 7,81 (д, 1Н, піразол-5-Н), 7,65-7,73 (м, 4Н, Ph-2,3,5,6-4Н), 6,03 (д, 1Н, піразол-4-Н), 4,41 (т, 2Н, O-CH₂), 3,84 (м, 2Н, N-CH₂), 2,18 (м, 2Н, CH₂).

60 Сполука 122-69: т.пл. 94,1°C. δ (CDCl₃) 8,28 (с, 1Н, піримідин-Н), 7,82 (д, J=2,4 Гц, 1Н,

піразол-5-Н), 7,65-7,72 (м, 4Н, Ph-2,3,5,6-4Н), 5,95 (д, J=2,7 Гц, 1Н, піразол-4-Н), 5,35 (с, 1Н, NH), 4,44 (т, 2Н, O-CH₂), 3,74 (м, 2Н, N-CH₂), 2,18 (м, 2Н, CH₂), 2,14 (с, 3Н, CH₃).

5 Сполука 123-69: масло. δ (CDCl₃) 8,15 (с, 1Н, піримідин-Н), 7,81 (д, J=2,7 Гц, 1Н, піразол-5-Н), 7,68-7,73 (м, 4Н, Ph-2,3,5,6-4Н), 5,96 (д, J=2,7 Гц, 1Н, піразол-4-Н), 5,89 (с, 1Н, NH), 4,41 (т, 2Н, O-CH₂), 3,85 (с, 3Н, CH₃), 3,71 (м, 2Н, N-CH₂), 2,16 (м, 2Н, CH₂).

Сполука 124-19: т.пл. 140,1°C. δ (CDCl₃) 8,36 (с, 1Н, піримідин-Н), 7,70 (д, J=2,7 Гц, 1Н, піразол-5-Н), 7,53 (д, J=9,0 Гц, 2Н, Ph-2,6-2Н), 7,37 (д, J=9,3 Гц, 2Н, Ph-3,5-2Н), 5,91 (д, J=2,7 Гц, 1Н, піразол-4-Н), 5,87 (с, 1Н, NH), 4,41 (т, 2Н, O-CH₂), 3,70-3,75 (м, 2Н, N-CH₂), 2,45 (с, 3Н), 2,12-2,17 (м, 2Н, CH₂).

10 Сполука 125-19: δ (CDCl₃) 8,42 (с, 1Н, піримідин-Н), 7,70 (д, J=2,7 Гц, 1Н, піразол-5-Н), 7,51-7,55 (м, 2Н, Ph-2,6-2Н), 7,35-7,39 (м, 2Н, Ph-3,5-2Н), 5,91 (д, J=2,7 Гц, 1Н, піразол-4-Н), 5,88 (с, 1Н, NH), 4,41 (т, 2Н, O-CH₂), 3,69-3,75 (м, 2Н, N-CH₂), 2,75-2,80 (м, 2Н, CH₃-CH₂), 2,12-2,18 (м, 2Н, CH₂), 1,26 (т, 3Н, CH₃).

15 Сполука 125-69: т.пл. 94,3°C. δ (CDCl₃) 8,42 (с, 1Н, піримідин-Н), 7,81 (д, J=2,4 Гц, 1Н, піразол-5-Н), 7,65-7,73 (м, 4Н, Ph-2,3,5,6-4Н), 5,97 (д, J=2,7 Гц, 1Н, піразол-4-Н), 5,89 (с, 1Н, NH), 4,43 (т, 2Н, O-CH₂), 3,73 (м, 2Н, N-CH₂), 2,78 (м, 2Н, CH₂ CH₃), 2,17 (м, 2Н, CH₂), 1,26 (т, 3Н, CH₃).

Сполука 126-19: т.пл. 132,9°C. δ (CDCl₃) 8,54 (с, 1Н, піримідин-Н), 7,70 (д, J=2,7 Гц, 1Н, піразол-5-Н), 7,51-7,55 (м, 2Н, Ph-2,6-2Н), 7,35-7,40 (м, 2Н, Ph-3,5-2Н), 6,71 (т, 1Н, CHF₂), 6,23 (с, 1Н, NH), 5,91 (д, J=2,7 Гц, 1Н, піразол-4-Н), 4,43 (т, 2Н, O-CH₂), 3,73-3,79 (м, 2Н, N-CH₂), 2,13-2,19 (м, 2Н, CH₂).

Сполука 126-69: масло. δ (CDCl₃) 8,54 (с, 1Н, піримідин-Н), 7,82 (д, J=2,7 Гц, 1Н, піразол-5-Н), 7,65-7,73 (м, 4Н, Ph-2,3,5,6-4Н), 6,74 (т, 1Н, CHF₂), 6,29 (с, 1Н, NH), 5,97 (д, J=2,7 Гц, 1Н, піразол-4-Н), 4,45 (т, 2Н, O-CH₂), 3,79 (м, 2Н, N-CH₂), 2,18 (м, 2Н, CH₂).

25 Сполука 127-19: т.пл. 165,7°C. δ (CDCl₃) 8,66 (с, 1Н, хіназолін-3-Н), 7,81 (д, J=2,7 Гц, 1Н, піразол-5-Н), 7,70-7,78 (м, 4Н, хіназолін-5,6,7,8-4Н), 7,52 (дд, 2Н, Ph-2Н), 7,37 (дд, 2Н, Ph-2Н), 6,07 (с, 1Н, NH), 5,92 (д, J=2,7 Гц, 1Н, піразол-4-Н), 4,31 (т, 2Н, O-CH₂), 3,43-3,53 (м, 2Н, N-CH₂), 2,02-2,08 (м, 2Н, CH₂).

30 Сполука 127-69: т.пл. 149,7°C. δ (CDCl₃) 8,67 (с, 1Н, хіназолін-3-Н), 7,82 (д, J=2,4 Гц, 1Н, піразол-5-Н), 7,65-7,81 (м, 4Н, Ph-2,3,5,6-4Н), 7,65-7,81 (м, 4Н, хіназолін-5,6,7,8-4Н), 6,50 (с, 1Н, NH), 5,98 (д, J=2,7 Гц, 1Н, піразол-4-Н), 4,50 (т, 2Н, O-CH₂), 3,89 (м, 2Н, N-CH₂), 2,26 (м, 2Н, CH₂).

35 Сполука 128-19: δ (CDCl₃) 8,46 (с, 1Н, піримідин-Н), 7,70 (д, J=2,7 Гц, 1Н, піразол-5-Н), 7,50-7,54 (м, 2Н, Ph-2,6-2Н), 7,34-7,40 (м, 2Н, Ph-3,5-2Н), 7,05 (с, 1Н, тiazол-Н), 6,92 (с, 1Н, NH), 5,91 (д, J=2,7 Гц, 1Н, піразол-4-Н), 4,43 (т, 2Н, O-CH₂), 3,82-3,90 (м, 2Н, N-CH₂), 2,17-2,27 (м, 2Н, CH₂).

Сполука 128-69: т.пл. 123,5°C. δ (CDCl₃) 8,46 (с, 1Н, піримідин-Н), 7,81 (д, J=2,4 Гц, 1Н, піразол-5-Н), 7,64-7,71 (м, 4Н, Ph-2,3,5,6-4Н), 7,06 (с, 1Н, тієно-Н), 6,92 (с, 1Н, NH), 5,96 (д, J=2,7 Гц, 1Н, піразол-4-Н), 4,46 (т, 2Н, O-CH₂), 3,86 (м, 2Н, N-CH₂), 2,23 (м, 2Н, CH₂).

40 Тест на біологічну активність показав гарну активність проти багатьох патогенів, шкідливих комах і кліщів в сфері сільського господарства.

Приклад 8: Фунгіцидне тестування

Зразки сполук за даним винаходом тестували на фунгіцидну активність *in vitro* або захисну активність *in vivo*. Результати фунгіцидного тестування були наступними.

(1) Визначення фунгіцидної активності *in vitro*

45 Спосіб являв собою наступне: У даному тесті використовували тест із високою пропускнуою здатністю. Сполуку розчиняли в придатному розчиннику, для приведення тестованого розчину до необхідної концентрації. Розчинник вибирали з ацетону, метанолу, ДМФА і так далі, відповідно до його здатності розчиняти зразок. Не залежно від стану мікроорганізму, тестований розчин і суспензію патогенів додавали в клітини 96-клітинної живильної культури, що потім вміщували в бокс із постійною температурою. Через 24 години, розвиток або ріст патогенів можуть бути досліджені візуально, і активність *in vitro* сполуки обчислювали на основі розвитку або росту при контрольній обробці.

Активності *in vitro* (показник інгібування) деяких сполук були наступними:

Показник інгібування проти пірикуляріозу рису:

55 при дозуванні 25 ч./млн., показник інгібування в сполук 30-1-4, 31-4, 31-78, 32-1, 32-4, 32-21, 32-57, 32-78, 33-4, 33-18, 35-19, 36-19, 37-19, 40-4, 40-18, 40-57, 40-69, 42-1, 42-4, 42-18, 42-21, 42-57, 42-69, 42-78, 44-19, 57-4, 59-21, 68-4 і так далі складав більше ніж 80 % проти пірикуляріозу рису. При порівнянні, показник інгібування в сполук СК1, СК2, СК3, СК4 і СК5 складав 0; при дозуванні 8,3 ч./млн., показник інгібування в сполук 31-4, 36-19, 40-4, 40-18, 40-57, 42-1, 42-18, 42-21, 42-57, 42-69, 44-19, 57-4, 59-21, 68-4, 128-69 і так далі складав більше ніж

80 % проти пірикуляріозу рису; при дозуванні 2,8 ч./млн., показник інгібування в сполук 36-19, 42-1, 42-18, 42-21, 42-69, 44-19, 57-4, 59-21, 68-4 і так далі складав більше ніж 80 % проти пірикуляріозу рису.

Показник інгібування проти сірої плісені огірків:

5 при дозуванні 25 ч./млн., показник інгібування в сполук 36-19, 40-19, 44-19, 57-4, 59-21, 68-4 і так далі складав більше ніж 80 % проти сірої плісені огірків. При порівнянні, показник інгібування в сполук СК1, СК2, СК3, СК4 і СК5 складав 0.

(2) Визначення захисної активності *in vivo*

10 Метод являв собою наступне: У даному тесті використовували суцільну рослину. Сполуку розчиняли в придатному розчиннику, з одержанням маточного розчину. Придатний розчинник вибирали з ацетону, метанолу, ДМФА і так далі, відповідно до його здатності розчиняти зразок. Об'ємна витрата розчинника і тестований розчин (об./об.) дорівнювала або складала менше ніж 5 %. Маточний розчин розбавляли водою, що містить 0,1 % tween-80, з одержанням тестованого розчину необхідної концентрації. Тестований розчин розпилювали на рослину-хазяїна за допомогою спеціального пульверизатора для рослин. Рослину інокулювали грибом через 24 години. Відповідно до заражувальних характеристик грибка, рослину зберігали у вологій камері, а потім переводили в парник після завершення інфікування. Безпосередньо в парник вміщували й інші рослини. Активність сполуки визначали візуально, через, загалом, 7 днів.

20 Захисна активність *in vivo* деяких сполук була наступною:

Захисна активність проти несправжньої борошнистої роси огірків *in vivo*:

при дозуванні 400 ч./млн., сполуки 30-1-4, 30-1-49, 30-1-57, 31-4, 31-19, 31-18, 31-21, 31-49, 31-57, 31-69, 32-4, 32-18, 32-19, 32-21, 32-49, 33-18, 33-19, 33-21, 35-19, 36-19, 40-4, 40-18, 40-19, 40-21, 40-57, 42-1, 42-18, 42-21, 42-49, 42-57, 42-69, 42-78, 44-19, 57-4, 57-19, 58-19, 59-19, 25 66-19, 68-19, 68-4 і так далі показали більше ніж 80 % захист проти несправжньої борошнистої роси огірків; при дозуванні 100 ч./млн., сполуки 30-1-19, 30-1-21, 30-1-30, 30-2-19, 31-4, 31-18, 31-19, 31-21, 31-23, 31-30, 31-69, 32-4, 32-17, 32-18, 32-19, 32-21, 32-30, 33-18, 33-19, 33-21, 33-30, 33-49, 33-57, 35-19, 36-19, 40-1, 40-4, 40-17, 40-18, 40-19, 40-21, 40-30, 42-1, 42-17, 42-18, 42-21, 42-69, 44-19, 123-69, 125-69, 126-69, 127-69, 128-69 і так далі показали більше ніж 80 % захист проти несправжньої борошнистої роси огірків; при дозуванні 25 ч./млн., сполуки 30-1-19, 30-1-21, 30-1-30, 30-2-19, 31-18, 31-19, 31-21, 31-23, 31-30, 31-69, 32-4, 32-19, 32-30, 33-18, 33-19, 33-21, 33-30, 33-49, 33-57, 35-19, 36-19, 40-4, 40-17, 40-18, 40-19, 40-21, 40-30, 42-1, 42-17, 42-18, 42-21, 42-69, 44-19 і так далі показали більше ніж 80 % захист проти несправжньої борошнистої роси огірків; при дозуванні 12,5 ч./млн., сполуки 30-2-19, 31-23, 32-19, 32-30, 33-21, 35 33-30, 33-49, 33-57, 35-19, 36-19, 40-4, 40-18, 40-19, 42-21 і так далі показали більше ніж 80 % захист проти несправжньої борошнистої роси огірків; при дозуванні 6,25 ч./млн., сполуки 30-2-19, 31-23, 32-19, 32-30, 33-21, 33-30, 33-49, 33-57, 35-19, 36-19, 40-4, 40-18, 40-19, 42-21 і так далі показали більше ніж 80 % захист проти несправжньої борошнистої роси огірків.

Захисна активність проти борошнистої роси пшениці *in vivo*:

40 при дозуванні 400 ч./млн., сполуки 30-1-57, 30-1-21, 30-2-19, 31-18, 31-21, 31-30, 31-49, 31-57, 31-69, 31-78, 32-1, 32-17, 32-18, 32-19, 32-21, 32-30, 32-49, 32-69, 32-78, 33-4, 33-19, 33-21, 33-30, 33-49, 33-57, 33-69, 35-19, 36-19, 37-19, 40-19, 40-21, 40-69, 42-4, 42-17, 42-18, 42-21, 42-49, 42-57, 42-69, 42-78, 44-19, 57-19, 58-19, 59-19, 66-19, 68-19, 59-21, 118-69, 119-69, 122-69, 123-69, 125-69, 126-69, 127-69, 128-69 і так далі показали більше ніж 80 % захист проти борошнистої роси пшениці; при дозуванні 100 ч./млн., сполуки 30-1-21, 30-2-19, 31-30, 31-69, 32-17, 32-19, 32-21, 32-30, 32-49, 32-69, 33-4, 33-19, 33-30, 33-49, 33-57, 33-69, 36-19, 37-19, 42-17, 42-57, 42-69, 44-19, 59-21, 118-69, 119-69, 122-69, 123-69, 125-69, 126-69, 127-69, 128-69 і так далі показали більше ніж 80 % захист проти борошнистої роси пшениці; при дозуванні 25 ч./млн., сполуки 30-2-19, 31-30, 31-69, 32-21, 32-30, 32-69, 33-4, 33-19, 33-30, 33-49, 33-57, 33-69, 50 36-19, 37-19, 42-69, 44-19, 118-69, 119-69, 122-69, 123-69, 125-69, 126-69, 127-69, 128-69 і так далі показали більше ніж 80 % захист проти борошнистої роси пшениці; при дозуванні 6,25 ч./млн., сполуки 30-2-19, 31-69, 32-69, 33-4, 33-19, 33-49, 33-57, 33-69, 36-19, 37-19, 42-69, 44-19, 118-69, 123-69, 126-69, 128-69 і так далі показали більше ніж 80 % захист проти борошнистої роси пшениці.

55 Захисна активність проти іржі кукурудзи *in vivo*:

при дозуванні 400 ч./млн., сполуки 31-49, 31-57, 31-69, 32-4, 32-18, 32-19, 32-49, 32-57, 32-69, 32-78, 33-4, 33-19, 33-69, 36-19, 37-19, 40-18, 40-21, 42-18, 42-21, 42-4, 42-69, 42-78, 44-19, 57-4, 59-21, 68-4 і так далі показали більше ніж 80 % захист проти іржі кукурудзи; при дозуванні 100 ч./млн., сполуки 31-69, 31-57, 32-49, 32-57, 32-69, 33-4, 33-69, 37-19, 42-18, 42-69, 44-19, 57-4 і так далі показали більше ніж 80 % захист проти іржі кукурудзи; при дозуванні 25 ч./млн.,

сполуки 32-49, 32-57, 32-69, 37-19, 42-69 і так далі показали більше ніж 80 % захист проти іржі кукурудзи; при дозуванні 6,25 ч./млн., сполуки 32-49, 37-19, 42-69 і так далі показали більше ніж 80 % захист проти іржі кукурудзи.

Захисна активність проти антракнозу огірків in vivo:

- 5 при дозуванні 400 ч./млн., сполуки 31-4, 31-19, 31-49, 31-57, 32-4, 32-18, 32-19, 32-49, 33-4, 33-19, 40-4, 40-19, 40-57, 42-1, 42-49, 42-69 і так далі показали більше ніж 80 % захист проти антракнозу огірків; при дозуванні 100 ч./млн., сполуки 31-19, 31-49, 31-57, 32-4, 32-18, 32-19, 32-49, 33-4, 33-19, 40-4, 40-19, 40-57, 42-1, 42-49, 118-69, 122-69, 123-69, 126-69, 127-69 і так далі показали більше ніж 80 % захист проти антракнозу огірків; при дозуванні 25 ч./млн., сполуки 31-19, 31-49, 31-57, 32-4, 32-49, 33-4, 32-19, 40-19, 40-57, 42-1, 42-49, 42-69, 122-69, 123-69, 126-69, 127-69 і так далі показали більш чим 80 % захист проти антракнозу огірків; при дозуванні 6,25 ч./млн., сполуки 31-57, 32-19, 32-49, 40- і 42-1 показали 90 % захист проти антракнозу огірків.

(3) Порівняльні результати тестування деяких сполук і контрастів

- 15 Порівняльні тести здійснювали між деякими сполуками і контрастами. Результати тестування перераховані в таблицях 129-132 (*///* у наступних таблицях позначає "не тестували").

Таблиця 129

Порівняльний тест на захисну активність проти
несправжньої борошнистої роси огірків при 25 мг/л

Сполука №	Захисна активність (%)	Сполука №	Захисна активність (%)	Сполука №	Захисна активність (%)	Сполука №	Захисна активність (%)
30-1-19	95	32-17	70	35-19	100	42-18	100
30-1-21	100	32-18	60	36-19	100	42-21	100
30-1-30	98	32-19	100	40-1	70	42-69	80
30-2-19	98	32-21	70	40-4	100	44-19	100
31-18	95	32-30	100	40-17	70	126-69	70
31-19	100	33-18	85	40-18	100	127-69	70
31-21	90	33-19	95	40-19	96	CK1	20
31-23	100	33-21	100	40-21	100	CK2	20
31-30	100	33-30	100	40-30	100	CK3	0
31-69	100	33-49	100	42-1	100	CK4	0
32-4	95	33-57	100	42-17	100	CK5	0

Таблиця 130

Порівняльний тест на захисну активність проти борошнистої роси пшениці при 100 мг/л

Сполука №	Захисна активність (%)	Сполука №	Захисна активність (%)	Сполука №	Захисна активність (%)
30-2-19	100	33-49	100	122-69	100
31-30	98	33-57	100	123-69	100
31-69	100	33-69	100	125-69	100
32-19	100	35-19	70	126-69	100
32-21	100	36-19	100	127-69	100
32-30	100	37-19	95	128-69	100
32-69	100	42-69	100	CK2	50
33-4	100	44-19	100	CK3	0
33-19	100	118-69	100	CK4	0
33-30	100	119-69	100	CK5	0

Таблиця 131

Порівняльний тест на захисну активність проти іржі кукурудзи

Сполука №	Контрольна дія проти іржі кукурудзи (%)	
	100 мг/л	25 мг/л
32-57	98	85
32-69	90	85
37-19	100	90
42-69	90	85
СК3	20	0
СК4	0	0
СК5	70	60

Таблиця 132

Порівняльний тест на захисну активність проти антракнозу огірків при 100 мг/л

Сполука №	Захисна активність (%)	Сполука №	Захисна активність (%)	Сполука №	Захисна активність (%)
31-19	90	33-4	85	122-69	85
31-49	85	33-19	100	123-69	90
31-57	98	40-19	100	126-69	95
32-4	90	40-57	98	127-69	92
32-18	85	42-1	95	СК3	0
32-19	100	42-69	95	СК4	0
32-49	100	118-69	80	СК5	0

Приклад 9: Тест на біоактивність проти комах і кліщів

5 Визначення інсектицидної активності в сполук за даним винаходом проти деяких комах здійснювали за наступною методикою:

Сполуки розчиняли в змішаному розчиннику (ацетон:метанол=1:1), і розбавляли до необхідної концентрації водою, що містить 0,1 % tween 80.

10 Як мішень використовували капустяну міль, совку, попелицю персикову і червоний павутинний кліщ з використанням методу обприскування пульверизатором для проведення інсектицидного біоаналізу.

(1) Тест на біоактивність проти капустяної молі

15 Метод обприскування пульверизатором: Листя капусти перетворювали в пластинки діаметром 2 см за допомогою штампа. Тестовий розчин (0,5 мл) розприскували пульверизатором при тиску 0,7 кг/см² по обидва боки кожної пластинки. 10 личинок на другій стадії розвитку вводили в чашки Петрі після дискової пластинки листка, висушеної на повітрі, і кожну обробку проводили в 3 повторях. Потім комах витримували в камері спостереження (25 °С, 60~70 % В.В.). Проводили оцінку, і смертність розраховували через 72 години.

Деякі результати тестування проти молі капустяної:

20 При дозуванні 600 ч./млн., сполуки 33-19, 37-19 і так далі показали 100 % знищення молі капустяної.

(2) Тест на біоактивність проти зеленої попелиці персикової

25 Методика: фільтрувальний папір вміщували в чашки Петрі для культур (діаметр=6 см), і на фільтрувальний папір крапали воду для забезпечення вологи. Зеленої попелицю персикову (*Myzus Persicae* Sulzer) утримували на капусті. Листя (діаметр=3 см) приблизно з 15-30 попелицями вводили в чашки для культур. У тесті на біоактивність використовували метод обприскування листя пульверизатором, при тиску, який дорівнює 10 ф./кв.дюйм (0,7 кг/см²), об'єм розчину для обприскування складав 0,5 мл. Дослідження проводили при трьох постійних температурах 25±1°С у кабіні інкубатора з 60±5 % ВВ. Обстежували виживаність попелиці через 30 48 год. і розраховували рівень смертності.

При дозуванні 600 ч./млн., сполуки 31-49, 32-17, 32-21, 32-30, 32-33, 32-57, 33-21, 33-57, 37-19, 42-1, 42-57, 59-21 і так далі показали більше ніж 80 % знищення зеленої попелиці персикової; при дозуванні 100 ч./млн., сполуки 32-21, 33-21, 37-19 і так далі показали більше ніж 80 % знищення зеленої попелиці персикової; при дозуванні 5 ч./млн., сполука 33-21 показала 100 % знищення зеленої попелиці персикової.

(3) Тест на біоактивність проти червоного павутинного кліща

Методика: Брالی пагони кормових бобів із двома листками в горщику, здорових дорослих червоних павутинних кліщів інокулювали на листки. Дорослих кліщів підраховували і потім обприскували пульверизатором при тиску 0,7 кг/см² і при дозі 0,5 мл. Для кожної обробки проводили 3 повтори. Потім їх витримували в камері стандартних спостережень. Проводили оцінку, і смертність розраховували через 72 години.

Тест на біоактивність проти червоного павутинного кліща:

при дозуванні 600 ч./млн., сполуки 30-1-57, 30-2-19, 31-23, 32-17, 32-21, 32-23, 32-30, 32-57, 32-78, 33-4, 33-57, 36-19, 37-19, 40-4, 42-17, 42-57, 42-78, 44-19, 59-21 і так далі показали більше ніж 80 % знищення червоного павутинного кліща; при дозуванні 100 ч./млн., сполуки 32-21, 32-57, 36-19, 37-19, 42-57, 44-19 і так далі показали більше ніж 80 % знищення червоного павутинного кліща; при дозуванні 10 ч./млн., обидві сполуки 32-57 і 37-19 показали більше ніж 80 % знищення червоного павутинного кліща.

(4) Результати порівняльних тестів деяких сполук і контрастними

Порівняльні тести здійснювали між деякими сполуками і контрастними. Результати тестування перераховані в таблицях 133-135 (*///* у наступних таблицях позначає "не тестували").

Таблиця 133

Порівняльні тести проти молі капустяної

Сполука №	Інсектицидна активність проти молі капустяної (%)
	600 мг/л
33-19	100
37-19	100
СК1	43
СК2	20
СК3	0
СК4	0
СК5	0

Таблиця 134

Порівняльні тести проти попелиці персикової

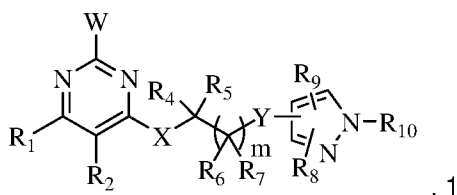
Сполука №	Інсектицидна активність проти попелиці персикової (%)
	100 мг/л
33-21	100
37-19	84
СК1	0
СК3	30
СК4	0
СК5	22

Порівняльні тести проти червоного павутинного кліща

Сполука №	Інсектицидна активність проти червоного павутинного кліща (%)	
	600 мг/л	100 мг/л
32-57	100	100
36-19	100	98
37-19	100	100
44-19	100	100
СК3	56	///
СК4	59	///
СК5	58	///

ФОРМУЛА ВИНАХОДУ

- 5 1. Сполука заміщеного піразолу, яка містить піримідиніл, представлена загальною формулою I:



де:

- 10 R₁, R₂ і спряжене з ними піримідинове кільце утворюють п'ятичленне кільце, шестичленне кільце, семичленне кільце або восьмичленне кільце, що містить атом вуглецю, атом азоту, атом кисню або атом сірки;
 X вибраний з NR₃ або S;
 Y вибраний з NR₃, O або S;
 15 R₃ вибраний з H, OH, CHO, C₁-C₁₂алкілу, галогенC₁-C₁₂алкілу, C₁-C₁₂алкокси, галогенC₁-C₁₂алкокси, C₃-C₁₂циклоалкілу, C₁-C₁₂алкілтіо, C₂-C₁₂алкенілтіо, C₂-C₁₂алкенілу, C₂-C₁₂алкінілу, галогенC₂-C₁₂алкенілу, галогенC₂-C₁₂алкінілу, C₁-C₁₂алкоксіC₁-C₁₂алкілу, галогенC₁-C₁₂алкоксіC₁-C₁₂алкілу, C₁-C₁₂алкілтіоC₁-C₁₂алкілу, галогенC₁-C₁₂алкілтіоC₁-C₁₂алкілу, C₁-C₁₂алкілсульфінілу, галогенC₁-C₁₂алкілсульфінілу, C₁-C₁₂алкілсульфонілу, галогенC₁-C₁₂алкілсульфонілу, C₁-C₁₂алкіламіносульфонілу, ді(C₁-C₁₂алкіл)аміносульфонілу, C₁-C₁₂алкілсульфоніламінокарбонілу, C₁-C₁₂алкілкарбоніламіносульфонілу, C₃-C₁₂циклоалкілоксикарбонілу, C₁-C₁₂алкілкарбонілу, галогенC₁-C₁₂алкілкарбонілу, C₁-C₁₂алкоксикарбонілу, галогенC₁-C₁₂алкоксикарбонілу, C₁-C₁₂алкілкарбонілC₁-C₁₂алкілу, C₁-C₁₂алкоксикарбонілC₁-C₁₂алкілу, C₁-C₁₂алкіламінокарбонілу, ді(C₁-C₁₂алкіл)амінокарбонілу, C₂-C₁₂алкеноксикарбонілу, C₂-C₁₂алкіноксикарбонілу, C₁₂алкоксіC₁-C₁₂алкоксикарбонілу, C₁-C₁₂алкіламінію, ді(C₁-C₁₂алкіл)амінію, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилкарбонілC₁-C₆алкілу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилоксикарбонілу, (гетеро)арилC₁-C₆алкілоксикарбонілу або (гетеро)арилC₁-C₆алкілу 1-5 наступними групами: галоген, нітро, ціано, C₁-C₆алкіл, галогенC₁-C₆алкіл, C₁-C₆алкокси або галогенC₁-C₆алкокси;
 20 R₄, R₅ можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з H, галогену, C₁-C₁₂алкілу, галогенC₁-C₁₂алкілу, C₁-C₁₂алкокси або галогенC₁-C₁₂алкокси; або R₄, R₅ і їхній спряжений вуглець також можуть утворювати C₃-C₈ цикл;
 R₆, R₇ можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з H, галогену, C₁-C₁₂алкілу, галогенC₁-C₁₂алкілу, C₁-C₁₂алкокси або галогенC₁-C₁₂алкокси; або R₆, R₇ і їхній спряжений вуглець також можуть утворювати C₃-C₈ цикл;
 25 ціле число m вибране від 0 до 5;
 R₈ вибраний з H, ціано, галогену, C₁-C₁₂алкілу, галогенC₁-C₁₂алкілу, C₁-C₁₂алкоксикарбонілу, галогенC₁-C₁₂алкоксикарбонілу, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R₁₁;
 30 R₉ вибраний з H, ціано, галогену, C₁-C₁₂алкілу, галогенC₁-C₁₂алкілу, C₁-C₁₂алкоксикарбонілу, галогенC₁-C₁₂алкоксикарбонілу, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або

(гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R_{11} ;

R_{10} вибраний з C_1 - C_{12} алкілу, C_3 - C_8 циклоалкілу, галоген C_1 - C_{12} алкілу, C_1 - C_{12} алкілкарбонілу, галоген C_1 - C_{12} алкілкарбонілу, C_1 - C_{12} алкілсульфонілу, галоген C_1 - C_{12} алкілсульфонілу, C_1 - C_{12} алкоксикарбонілу, C_1 - C_{12} алкоксі C_1 - C_{12} алкілу, C_1 - C_{12} алкоксикарбоніл C_1 - C_{12} алкілу, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R_{11} ;

R_{11} вибраний з галогену, OH, аміно, ціано, нітро, C_1 - C_{12} алкілу, галоген C_1 - C_{12} алкілу, C_1 - C_{12} алкокси, галоген C_1 - C_{12} алкокси, C_3 - C_{12} циклоалкілу, C_1 - C_{12} алкіламіно, галоген C_1 - C_{12} алкіламіно, ді(C_1 - C_{12} алкіл)аміно, галогенді(C_1 - C_{12} алкіл)аміно, $C(=O)NR_{12}R_{13}$, C_1 - C_{12} алкілтіо, галоген C_1 - C_{12} алкілтіо, C_2 - C_{12} алкенілу, C_2 - C_{12} алкінілу, C_2 - C_{12} алкенокси, галоген C_2 - C_{12} алкенокси, C_2 - C_{12} алкінокси, галоген C_2 - C_{12} алкінокси, C_1 - C_{12} алкілсульфонілу, галоген C_1 - C_{12} алкілсульфонілу, C_1 - C_{12} алкілкарбонілу, галоген C_1 - C_{12} алкілкарбонілу, C_1 - C_{12} алкоксикарбонілу, галоген C_1 - C_{12} алкоксикарбонілу, C_1 - C_{12} алкоксі C_1 - C_{12} алкілу, галоген C_1 - C_{12} алкоксі C_1 - C_{12} алкілу, C_1 - C_{12} алкілтіо C_1 - C_{12} алкілу, галоген C_1 - C_{12} алкілтіо C_1 - C_{12} алкілу, C_1 - C_{12} алкоксикарбоніл C_1 - C_{12} алкілу, галоген C_1 - C_{12} алкоксикарбоніл C_1 - C_{12} алкілу, C_1 - C_{12} алкілтіокарбоніл C_1 - C_{12} алкілу, галоген C_1 - C_{12} алкілтіокарбоніл C_1 - C_{12} алкілу, C_1 - C_{12} алкілкарбонілокси, галоген C_1 - C_{12} алкілкарбонілокси, C_1 - C_{12} алкоксикарбонілокси, галоген C_1 - C_{12} алкоксикарбонілокси, C_1 - C_{12} алкілсульфонілокси, галоген C_1 - C_{12} алкілсульфонілокси, C_1 - C_{12} алкоксі C_1 - C_{12} алкокси або галоген C_1 - C_{12} алкоксі C_1 - C_{12} алкокси;

R_{12} , R_{13} можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з H, C_1 - C_{12} алкілу або галоген C_1 - C_{12} алкілу;

W вибраний з H, галогену, C_1 - C_{12} алкілу, галоген C_1 - C_{12} алкілу, C_3 - C_8 циклоалкілу, C_1 - C_{12} алкокси, C_1 - C_{12} алкілтіо або C_1 - C_{12} алкілсульфонілу;

місцем зв'язування Y з піразольним кільцем є положення 3, положення 4 або положення 5; причому, коли Y зв'язаний у положенні 3 піразолу, R_8 знаходиться в положенні 4, R_9 знаходиться в положенні 5; коли Y зв'язаний у положенні 4 піразолу, R_8 знаходиться в положенні 3, R_9 знаходиться в положенні 5; коли Y зв'язаний у положенні 5 піразолу, R_8 знаходиться в положенні 3, R_9 знаходиться у положенні 4;

або солі, утворені зі сполук, представлених загальною формулою I.

2. Сполука заміщеного піразолу, що містить піримідиніл, за п. 1, де в загальній формулі I:

R_1 , R_2 і спряжене з ними піримідинове кільце утворюють п'ятичленне кільце або шестичленне кільце, що містить атом вуглецю, атом азоту, атом кисню або атом сірки;

X вибраний з NR_3 або S;

Y вибраний з NR_3 , O або S;

R_3 вибраний з H, OH, CHO, C_1 - C_6 алкілу, галоген C_1 - C_6 алкілу, C_1 - C_6 алкокси, галоген C_1 - C_6 алкокси, C_3 - C_6 циклоалкілу, C_1 - C_6 алкілтіо, C_2 - C_6 алкенілітіо, C_2 - C_6 алкенілу, C_2 - C_6 алкінілу, галоген C_2 - C_6 алкенілу, галоген C_2 - C_6 алкінілу, C_1 - C_6 алкоксі C_1 - C_6 алкілу, галоген C_1 - C_6 алкоксі C_1 - C_6 алкілу, C_1 - C_6 алкілтіо C_1 - C_6 алкілу, галоген C_1 - C_6 алкілтіо C_1 - C_6 алкілу, C_1 - C_6 алкілсульфінілу, галоген C_1 - C_6 алкілсульфінілу, C_1 - C_6 алкілсульфонілу, галоген C_1 - C_6 алкілсульфонілу, C_1 - C_6 алкіламіносульфонілу, ді(C_1 - C_6 алкіл)аміносульфонілу, C_1 - C_6 алкілсульфоніламінокарбонілу, C_1 - C_6 алкілкарбоніламіносульфонілу, C_3 - C_6 циклоалкілоксикарбонілу, C_1 - C_6 алкілкарбонілу, галоген C_1 - C_6 алкілкарбонілу, C_1 - C_6 алкоксикарбонілу, галоген C_1 - C_6 алкоксикарбонілу, C_1 - C_6 алкілкарбоніл C_1 - C_6 алкілу, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл C_1 - C_6 алкілу, C_1 - C_6 алкіламінокарбонілу, ді(C_1 - C_6 алкіл)амінокарбонілу, C_2 - C_6 алкеноксикарбонілу, C_2 - C_6 алкіноксикарбонілу, C_1 - C_6 алкоксі C_1 - C_6 алкоксикарбонілу, C_1 - C_6 алкіламініотіо, ді(C_1 - C_6 алкіл)амініотіо, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилкарбоніл C_1 - C_6 алкілу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилоксикарбонілу, (гетеро)арил C_1 - C_6 алкілоксикарбонілу або (гетеро)арил C_1 - C_6 алкілу

1-5 наступними групами: галоген, нітро, ціано, C_1 - C_6 алкіл, галоген C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 алкокси або галоген C_1 - C_6 алкокси;

R_4 , R_5 можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з H, галогену, C_1 - C_6 алкілу, галоген C_1 - C_6 алкілу, C_1 - C_6 алкокси або галоген C_1 - C_6 алкокси; або R_4 , R_5 і їхній спряжений вуглець також можуть утворювати C_3 - C_6 цикл;

R_6 , R_7 можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з H, галогену, C_1 - C_6 алкілу, галоген C_1 - C_6 алкілу, C_1 - C_6 алкокси або галоген C_1 - C_6 алкокси; або R_6 , R_7 і їхній спряжений вуглець також можуть утворювати C_3 - C_6 цикл;

ціле число m вибране від 0 до 4;

R_8 вибраний з H, ціано, галогену, C_1 - C_6 алкілу, галоген C_1 - C_6 алкілу, C_1 - C_6 алкоксикарбонілу, галоген C_1 - C_6 алкоксикарбонілу, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або

- (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R_{11} ;
 R_9 вибраний з Н, ціано, галогену, C_1 - C_6 алкілу, галоген C_1 - C_6 алкілу, C_1 - C_6 алкоксикарбонілу, галоген C_1 - C_6 алкоксикарбонілу, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або
 5 (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R_{11} ;
 R_{10} вибраний з C_1 - C_6 алкілу, C_3 - C_6 циклоалкілу, галоген C_1 - C_6 алкілу, C_1 - C_6 алкілкарбонілу, галоген C_1 - C_6 алкілкарбонілу, C_1 - C_6 алкілсульфонілу, галоген C_1 - C_6 алкілсульфонілу, C_1 - C_6 алкоксикарбонілу, C_1 - C_6 алкоксі C_1 - C_6 алкілу, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл C_1 - C_6 алкілу, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу,
 10 (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R_{11} ;
 R_{11} вибраний з галогену, ОН, аміно, ціано, нітро, C_1 - C_6 алкілу, галоген C_1 - C_6 алкілу, C_1 - C_6 алкокси, галоген C_1 - C_6 алкокси, C_3 - C_6 циклоалкілу, C_1 - C_6 алкіламіно, галоген C_1 - C_6 алкіламіно, ді(C_1 - C_6 алкіл)аміно, галогенді(C_1 - C_6 алкіл)аміно, $C(=O)NR_{12}R_{13}$, C_1 - C_6 алкілтіо, галоген C_1 - C_6 алкілтіо, C_2 - C_6 алкенілу, C_2 - C_6 алкінілу, C_2 - C_6 алкенокси, галоген C_2 - C_6 алкенокси, C_2 - C_6 алкінокси, галоген C_2 - C_6 алкінокси, C_1 - C_6 алкілсульфонілу, галоген C_1 - C_6 алкілсульфонілу, C_1 - C_6 алкілкарбонілу, галоген C_1 - C_6 алкілкарбонілу, C_1 - C_6 алкоксикарбонілу, галоген C_1 - C_6 алкоксикарбонілу, C_1 - C_6 алкоксі C_1 - C_6 алкілу, галоген C_1 - C_6 алкоксі C_1 - C_6 алкілу, C_1 - C_6 алкілтіо C_1 - C_6 алкілу, галоген C_1 - C_6 алкілтіо C_1 - C_6 алкілу, C_1 - C_6 алкоксикарбоніл C_1 - C_6 алкілу, галоген C_1 - C_6 алкоксикарбоніл C_1 - C_6 алкілу, C_1 - C_6 алкілтіокарбоніл C_1 - C_6 алкілу, галоген C_1 - C_6 алкілтіокарбоніл C_1 - C_6 алкілу, C_1 - C_6 алкілкарбонілокси, галоген C_1 - C_6 алкілкарбонілокси, C_1 - C_6 алкоксикарбонілокси, галоген C_1 - C_6 алкоксикарбонілокси, C_1 - C_6 алкілсульфонілокси, галоген C_1 - C_6 алкілсульфонілокси, C_1 - C_6 алкоксі C_1 - C_6 алкокси або галоген C_1 - C_6 алкоксі C_1 - C_6 алкокси;
 20 R_{12} , R_{13} можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з Н, C_1 - C_6 алкілу або галоген C_1 - C_6 алкілу;
 W вибраний з Н, галогену, C_1 - C_6 алкілу, галоген C_1 - C_6 алкілу, C_3 - C_6 циклоалкілу, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 алкілтіо або C_1 - C_6 алкілсульфонілу;
 25 місцем зв'язування Y з піразольним кільцем є положення 3, положення 4 або положення 5; причому, коли Y зв'язаний у положенні 3 піразолу, R_8 знаходиться в положенні 4, R_9 знаходиться в положенні 5; коли Y зв'язаний у положенні 4 піразолу, R_8 знаходиться в положенні 3, R_9 знаходиться в положенні 5; коли Y зв'язаний у положенні 5 піразолу, R_8 знаходиться в положенні 3, R_9 знаходиться у положенні 4.
 3. Сполука заміщеного піразолу, що містить піримідиніл, за п. 2, де в загальній формулі I:
 R_1 , R_2 і спряжене з ними піримідинове кільце утворюють п'ятичленне кільце або шестичленне кільце, що містить атом вуглецю, атом азоту, атом кисню або атом сірки;
 35 X вибраний з NR_3 або S ;
 R_3 вибраний з Н, ОН, CHO , C_1 - C_4 алкілу, галоген C_1 - C_4 алкілу, C_1 - C_4 алкокси, галоген C_1 - C_4 алкокси, C_3 - C_4 циклоалкілу, C_1 - C_4 алкілтіо, C_2 - C_4 алкенілітіо, C_2 - C_4 алкенілу, C_2 - C_4 алкінілу, галоген C_2 - C_4 алкенілу, галоген C_2 - C_4 алкінілу, C_1 - C_4 алкоксі C_1 - C_4 алкілу, галоген C_1 - C_4 алкоксі C_1 - C_4 алкілу, C_1 - C_4 алкілтіо C_1 - C_4 алкілу, галоген C_1 - C_4 алкілтіо C_1 - C_4 алкілу, C_1 - C_4 алкілсульфінілу, галоген C_1 - C_4 алкілсульфінілу, C_1 - C_4 алкілсульфонілу, галоген C_1 - C_4 алкілсульфонілу, C_1 - C_4 алкіламіносульфонілу, ді(C_1 - C_4 алкіл)аміносульфонілу, C_1 - C_4 алкілсульфоніламінокарбонілу, C_1 - C_4 алкілкарбоніламіносульфонілу, C_3 - C_4 циклоалкілоксикарбонілу, C_1 - C_4 алкілкарбонілу, галоген C_1 - C_4 алкілкарбонілу, C_1 - C_4 алкоксикарбонілу, галоген C_1 - C_4 алкоксикарбонілу, C_1 - C_4 алкілкарбоніл C_1 - C_4 алкілу, C_1 - C_4 алкоксикарбоніл C_1 - C_4 алкілу, C_1 - C_4 алкіламінокарбонілу, ді(C_1 - C_4 алкіл)амінокарбонілу, C_2 - C_4 алкенілоксикарбонілу, C_2 - C_4 алкіноксикарбонілу, C_1 - C_4 алкоксі C_1 - C_4 алкоксикарбонілу, C_1 - C_4 алкіламініотіо, ді(C_1 - C_4 алкіл)амініотіо, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилкарбоніл C_1 - C_4 алкілу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилоксикарбонілу, (гетеро)арил C_1 - C_4 алкілоксикарбонілу або (гетеро)арил C_1 - C_4 алкілу
 40 1-5 наступними групами: галоген, нітро, ціано, C_1 - C_4 алкіл, галоген C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 алкокси або галоген C_1 - C_4 алкокси;
 R_4 , R_5 можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з Н, галогену, C_1 - C_4 алкілу, галоген C_1 - C_4 алкілу, C_1 - C_4 алкокси або галоген C_1 - C_4 алкокси; або R_4 , R_5 і їхній спряжений вуглець також можуть утворювати C_3 - C_4 цикл;
 R_6 , R_7 можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з Н, галогену, C_1 - C_4 алкілу, галоген C_1 - C_4 алкілу, C_1 - C_4 алкокси або галоген C_1 - C_4 алкокси; або R_6 , R_7 і їхній спряжений вуглець також можуть утворювати C_3 - C_4 цикл;
 55 ціле число m вибране від 0 до 3;
 R_8 вибраний з Н, ціано, галогену, C_1 - C_4 алкілу, галоген C_1 - C_4 алкілу, C_1 - C_4 алкоксикарбонілу, галоген C_1 - C_4 алкоксикарбонілу, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або
 60 (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R_{11} ;

(гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R_{11} ;

R_9 вибраний з Н, ціано, галогену, C_1 - C_4 алкілу, галоген C_1 - C_4 алкілу, C_1 - C_4 алкоксикарбонілу, галоген C_1 - C_4 алкоксикарбонілу, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або

5 (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R_{11} ;

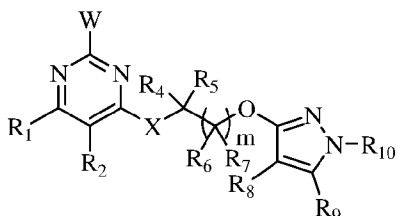
R_{10} вибраний з C_1 - C_4 алкілу, C_3 - C_4 циклоалкілу, галоген C_1 - C_4 алкілу, C_1 - C_4 алкілкарбонілу, галоген C_1 - C_4 алкілкарбонілу, C_1 - C_4 алкілсульфонілу, галоген C_1 - C_4 алкілсульфонілу, C_1 - C_4 алкоксикарбонілу, C_1 - C_4 алкоксі C_1 - C_4 алкілу, C_1 - C_4 алкоксикарбоніл C_1 - C_4 алкілу, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R_{11} ;

R_{11} вибраний з галогену, ОН, аміно, ціано, нітро, C_1 - C_4 алкілу, галоген C_1 - C_4 алкілу, C_1 - C_4 алкокси, галоген C_1 - C_4 алкокси, C_3 - C_4 циклоалкілу, C_1 - C_4 алкіламіно, галоген C_1 - C_4 алкіламіно, ді(C_1 - C_4 алкіл)аміно, галогенді(C_1 - C_4 алкіл)аміно, $C(=O)NR_{12}R_{13}$, C_1 - C_4 алкілтіо, галоген C_1 - C_4 алкілтіо, C_2 - C_4 алкенілу, C_2 - C_4 алкінілу, C_2 - C_4 алкенокси, галоген C_2 - C_4 алкенокси, C_2 - C_4 алкінокси, галоген C_2 - C_4 алкінокси, C_1 - C_4 алкілсульфонілу, галоген C_1 - C_4 алкілсульфонілу, C_1 - C_4 алкілкарбонілу, галоген C_1 - C_4 алкілкарбонілу, C_1 - C_4 алкоксикарбонілу, галоген C_1 - C_4 алкоксикарбонілу, C_1 - C_4 алкоксі C_1 - C_4 алкілу, галоген C_1 - C_4 алкоксі C_1 - C_4 алкілу, C_1 - C_4 алкілтіо C_1 - C_4 алкілу, галоген C_1 - C_4 алкілтіо C_1 - C_4 алкілу, C_1 - C_4 алкоксикарбоніл C_1 - C_4 алкілу, галоген C_1 - C_4 алкоксикарбоніл C_1 - C_4 алкілу, C_1 - C_4 алкілтіокарбоніл C_1 - C_4 алкілу, галоген C_1 - C_4 алкілтіокарбоніл C_1 - C_4 алкілу, C_1 - C_4 алкілкарбонілокси, галоген C_1 - C_4 алкілкарбонілокси, C_1 - C_4 алкоксикарбонілокси, галоген C_1 - C_4 алкоксикарбонілокси, C_1 - C_4 алкілсульфонілокси, галоген C_1 - C_4 алкілсульфонілокси, C_1 - C_4 алкоксі C_1 - C_4 алкокси або галоген C_1 - C_4 алкоксі C_1 - C_4 алкокси;

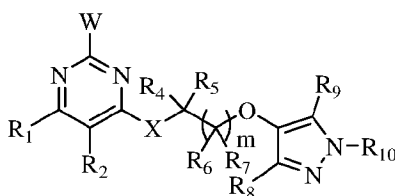
R_{12} , R_{13} можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з Н, C_1 - C_4 алкілу або галоген C_1 - C_4 алкілу;

25 W вибраний з Н, галогену, C_1 - C_4 алкілу, галоген C_1 - C_4 алкілу, C_3 - C_4 циклоалкілу, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 алкілтіо або C_1 - C_4 алкілсульфонілу;

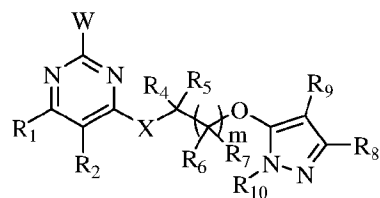
Y являє собою О, місцем зв'язування Y з піразольним кільцем є положення 3, положення 4 або положення 5, причому, коли Y зв'язаний у положенні 3 піразолу, R_8 знаходиться в положенні 4, R_9 знаходиться в положенні 5, загальна формула I являє собою загальну формулу I-1; коли Y зв'язаний у положенні 4 піразолу, R_8 знаходиться в положенні 3, R_9 знаходиться в положенні 5, загальна формула I являє собою загальну формулу 1-2; коли Y зв'язаний у положенні 5 піразолу, R_8 знаходиться в положенні 3, R_9 знаходиться в положенні 4, загальна формула I являє собою загальну формулу I-3:



I-1

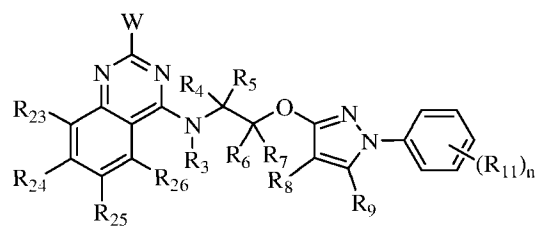


I-2

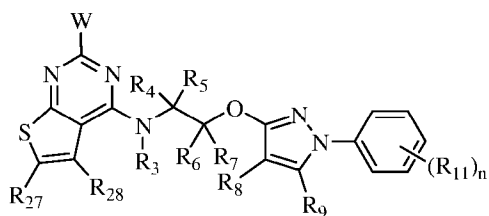


I-3

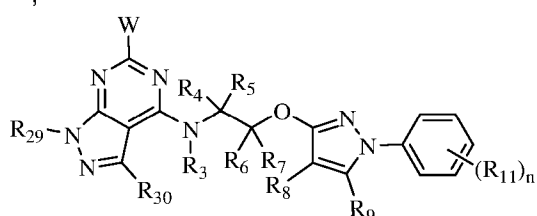
4. Сполука заміщеного піразолу, що містить піримідиніл, за п. 3, де структура сполуки загальної формули I-1 представлена загальними формулами I-1F, I-1G, I-1H, I-1I, I-1J, I-1K, I-1L, I-1M, I-4F або I-4G; структура сполуки загальної формули 1-2 представлена загальними формулами I-2F, I-2G; структура сполуки загальної формули 1-3 представлена загальними формулами I-3F або I-3G:



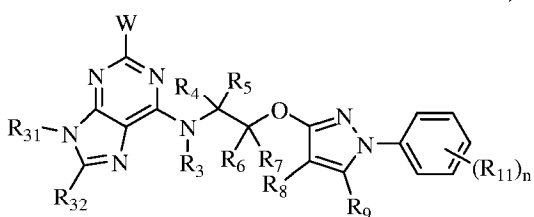
I-1F



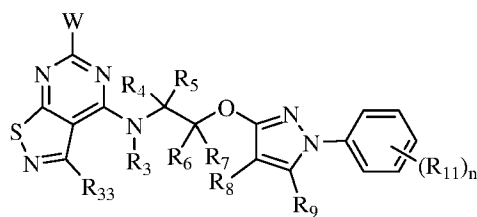
I-1G



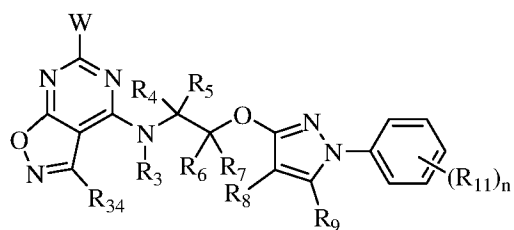
I-1H



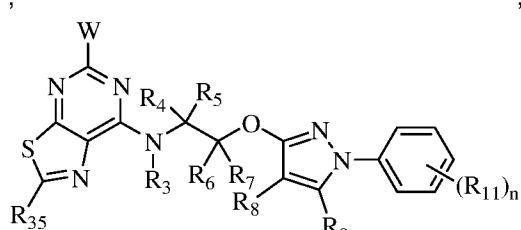
I-1I



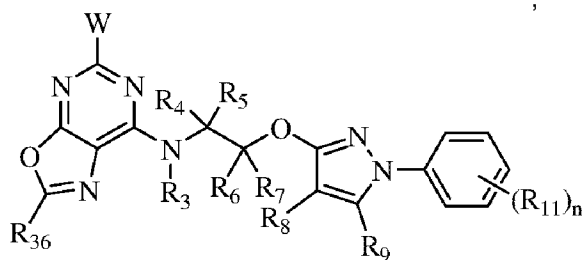
I-1J



I-1K

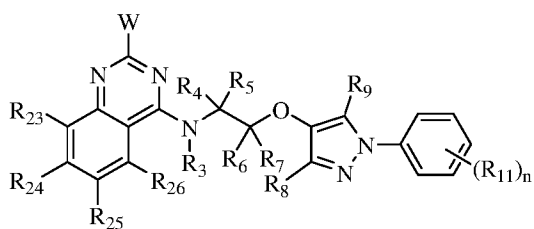


I-1L

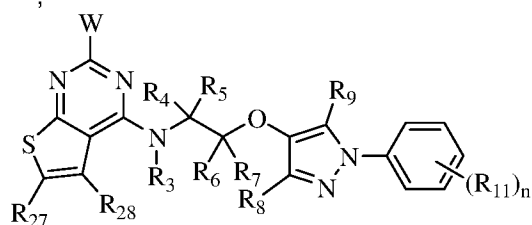


I-1M

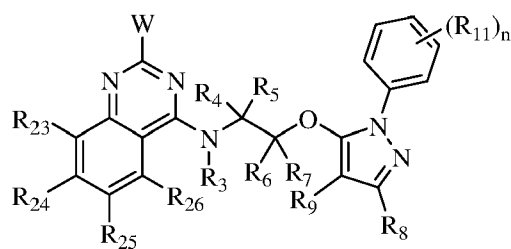
5



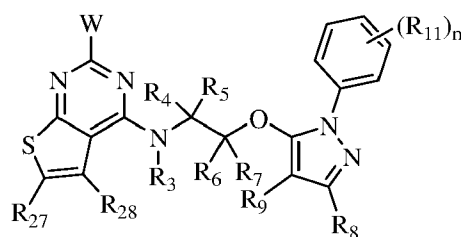
I-2F



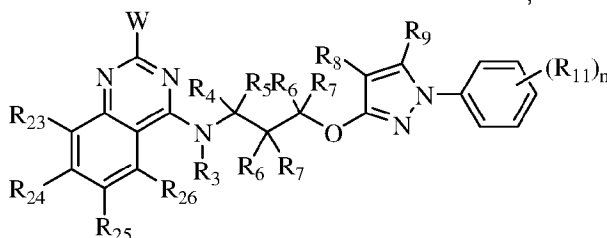
I-2G



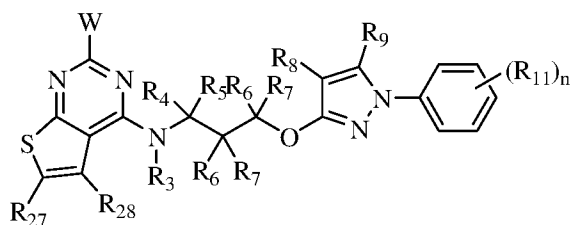
I-3F



I-3G



I-4F



I-4G

5 де:

- R₃ вибраний з Н, ОН, СНО, С₁-С₄алкілу, галогенС₁-С₄алкілу, С₁-С₄алкокси, галогенС₁-С₄алкокси, С₃-С₄циклоалкілу, С₁-С₄алкілтію, С₂-С₄алкенілію, С₂-С₄алкенілу, С₂-С₄алкінілу, галогенС₂-С₄алкенілу, галогенС₂-С₄алкінілу, С₁-С₄алкоксіС₁-С₄алкілу, галогенС₁-С₄алкоксіС₁-С₄алкілу, С₁-С₄алкілтіюС₁-С₄алкілу, галогенС₁-С₄алкілтіюС₁-С₄алкілу, С₁-С₄алкілсульфінілу, галогенС₁-С₄алкілсульфінілу, С₁-С₄алкілсульфонілу, галогенС₁-С₄алкілсульфонілу, С₁-С₄алкілсульфоніламінокарбонілу, С₁-С₄алкілкарбоніламіносульфонілу, С₃-С₄циклоалкілоксикарбонілу, С₁-С₄алкілкарбонілу, галогенС₁-С₄алкілкарбонілу, С₁-С₄алкоксикарбонілу, галогенС₁-С₄алкоксикарбонілу, С₁-С₄алкілкарбонілуС₁-С₄алкілу, С₁-С₄алкоксикарбонілуС₁-С₄алкілу, С₁-С₄алкіламінокарбонілу, ді(С₁-С₄алкіл)амінокарбонілу, С₂-С₄алкенілоксикарбонілу, С₂-С₄алкіноксикарбонілу, С₁-С₄алкоксіС₁-С₄алкоксикарбонілу, С₁-С₄алкіламінію, ді(С₁-С₄алкіл)амінію, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилкарбонілуС₁-С₄алкілу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилоксикарбонілу, (гетеро)арилС₁-С₄алкілоксикарбонілу або (гетеро)арилС₁-С₄алкілу 1-5 наступними групами: галоген, нітро, ціано, С₁-С₄алкіл, галогенС₁-С₄алкіл, С₁-С₄алкокси або галогенС₁-С₄алкокси;
- R₄, R₅ можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з Н, галогену, С₁-С₄алкілу, галогенС₁-С₄алкілу, С₁-С₄алкокси або галогенС₁-С₄алкокси; або R₄, R₅ і їхній спряжений вуглець також можуть утворювати С₃-С₄ цикл;
- R₆, R₇ можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з Н, галогену, С₁-С₄алкілу, галогенС₁-С₄алкілу, С₁-С₄алкокси або галогенС₁-С₄алкокси; або R₆, R₇ і їхній спряжений вуглець також можуть утворювати С₃-С₄ цикл;
- R₈ вибраний з Н, ціано, галогену, С₁-С₄алкілу, галогенС₁-С₄алкілу, С₁-С₄алкоксикарбонілу, галогенС₁-С₄алкоксикарбонілу, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R₁₁;
- R₉ вибраний з Н, ціано, галогену, С₁-С₄алкілу, галогенС₁-С₄алкілу, С₁-С₄алкоксикарбонілу, галогенС₁-С₄алкоксикарбонілу, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R₁₁;
- R₁₁ вибраний з галогену, ОН, аміно, ціано, нітро, С₁-С₄алкілу, галогенС₁-С₄алкілу, С₁-С₄алкокси, галогенС₁-С₄алкокси, С₃-С₄циклоалкілу, С₁-С₄алкіламіно, галогенС₁-С₄алкіламіно, ді(С₁-

[illegible]

R₃₅, R₃₆ можуть бути вибрані відповідно з H, ціано, галогену, C₁-C₄алкілу, галогенC₁-C₄алкілу, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R₁₁;

5 W вибраний з H, галогену, C₁-C₄алкілу, галогенC₁-C₄алкілу, C₃-C₄циклоалкілу, C₁-C₄алкокси, галогенC₁-C₄алкокси або C₁-C₄алкілсульфонілу;

солями, представленими загальною формулою I, є солі, утворені зі сполук, представлених загальними формулами I-1F, I-1G, I-1H, I-1I, I-1J, I-1K, I-1L, I-1M, I-2F, I-2G, I-3F, I-3G, I-4F або I-4G, із хлористоводневою кислотою, сірчаною кислотою, фосфорною кислотою, мурашиною кислотою, оцтовою кислотою, трифтороцтовою кислотою, щавлевою кислотою, метилсульфоновою кислотою, п-толуолсульфоновою кислотою, бензойною кислотою, алізариновою кислотою, малеїною кислотою, фумаровою кислотою, сорбіною кислотою, яблучною кислотою або лимонною кислотою.

5. Сполука заміщеного піразолу, що містить примідиніл, за п. 4, де в загальних формулах I-1F, I-1G, I-1H, I-1I, I-1J, I-1K, I-1L, I-1M, I-2F, I-2G, I-3F, I-3G, I-4F або I-4G:

15 R₃ вибраний з H, OH, CHO, COCH₃, COC₂H₅, COC₃H₇, COCF₃, C₆H₅, CH₃, C₂H₅, н-C₃H₇, ізо-C₃H₇, н-C₄H₉, втор-C₄H₉, ізо-C₄H₉, трет-C₄H₉, CF₃, CH₂CF₃, OCH₃, OC₂H₅, OCH₂CF₃, , SCH₃, SC₂H₅, CH₂CH=CH₂, CH₂C≡CH, SO₂CH₃, SO₂CH₂CH₃, SO₂CH₂CF₃, SO₂NHCH₃, SO₂NHC₂H₅, SO₂N(CH₃)₂, SO₂N(C₂H₅)₂, CONHSO₂CH₃, COOCH₃, COOC₂H₅, COOC₃H₇-н, COOC₃H₇-ізо, CONHCH₃, CON(CH₃)₂, COOCH=CH₂, COOC≡CH, SNHCH₃, SNHC₂H₅ або SN(CH₃)₂;

20 R₄, R₅ можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з H, F, Cl, Br, I, CH₃, C₂H₅, н-C₃H₇, ізо-C₃H₇, н-C₄H₉, втор-C₄H₉, ізо-C₄H₉, трет-C₄H₉, OCH₃, OC₂H₅, н-C₃H₇O, ізо-C₃H₇O, н-C₄H₉O, втор-C₄H₉O, ізо-C₄H₉O або трет-C₄H₉O;

25 R₆, R₇ можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з H, F, Cl, Br, I, CH₃, C₂H₅, н-C₃H₇, ізо-C₃H₇, н-C₄H₉, втор-C₄H₉, ізо-C₄H₉, трет-C₄H₉, OCH₃, OC₂H₅, н-C₃H₇O, ізо-C₃H₇O, н-C₄H₉O, втор-C₄H₉O, ізо-C₄H₉O або трет-C₄H₉O;

R₈ вибраний з H, CN, F, Cl, Br, I, CH₃, C₂H₅ або CF₃;

R₉ вибраний з H, CN, F, Cl, Br, I, CH₃, C₂H₅ або CF₃;

30 R₁₁ вибраний з F, Cl, Br, I, CN, NH₂, NO₂, CH₃, C₂H₅, н-C₃H₇, ізо-C₃H₇, н-C₄H₉, втор-C₄H₉, ізо-C₄H₉, трет-C₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCI₂, OCH₃, OCH₂CH₃, н-C₃H₇O, ізо-C₃H₇O, н-C₄H₉O, втор-C₄H₉O, ізо-C₄H₉O, трет-C₄H₉O, OCF₃, OCH₂CF₃, COOCH₃, COOC₂H₅, CONH₂, CONHCH₃, CONHC₂H₅ або CON(CH₃)₂;

ціле число n вибране від 0 до 5, причому, коли n дорівнює 0, бензольне кільце являє собою незаміщений феніл; коли n дорівнює більше ніж 1, групи R₁₁ можуть бути однаковими або різними;

35 R₁₄ вибраний з CH₃, C₂H₅, н-C₃H₇, ізо-C₃H₇, н-C₄H₉, втор-C₄H₉, ізо-C₄H₉, трет-C₄H₉, циклопропілу, циклобутилу, CH₂F, CH₂Cl, CHF₂, CF₃ або CH₂CF₃;

40 R₁₅, R₁₆ можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з H, F, Cl, Br, I, NH₂, CN, NO₂, CH₃, C₂H₅, н-C₃H₇, ізо-C₃H₇, н-C₄H₉, втор-C₄H₉, ізо-C₄H₉, трет-C₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCI₂, CH₂CF₃, OCH₃, OCH₂CH₃, н-C₃H₇O, ізо-C₃H₇O, н-C₄H₉O, втор-C₄H₉O, ізо-C₄H₉O, трет-C₄H₉O, OCF₃, OCH₂CF₃, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R₁₁;

45 R₁₇, R₁₈, R₁₉, R₂₀ можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з H, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, CH₃, CF₃, OCH₃ або OCF₃;

50 R₂₁, R₂₂ можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з H, F, Cl, Br, I, OH, CN, NO₂, CH₃, C₂H₅, н-C₃H₇, ізо-C₃H₇, н-C₄H₉, втор-C₄H₉, ізо-C₄H₉, трет-C₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCI₂, CH₂CF₃, OCH₃, OCH₂CH₃, н-C₃H₇O, ізо-C₃H₇O, н-C₄H₉O, втор-C₄H₉O, ізо-C₄H₉O, трет-C₄H₉O, OCF₃, OCH₂CF₃, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R₁₁;

55 R₂₃, R₂₄, R₂₅, R₂₆ можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з H, F, Cl, Br, I, NH₂, CN, NO₂, CH₃, C₂H₅, н-C₃H₇, ізо-C₃H₇, н-C₄H₉, втор-C₄H₉, ізо-C₄H₉, трет-C₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCI₂, OCH₃, OCH₂CH₃, н-C₃H₇O, ізо-C₃H₇O, н-C₄H₉O, втор-C₄H₉O, ізо-C₄H₉O, трет-C₄H₉O, OCF₃ або OCH₂CF₃;

60 R₂₇, R₂₈ можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з H, F, Cl, Br, I, CH₃, C₂H₅, н-C₃H₇, ізо-C₃H₇, н-C₄H₉, втор-C₄H₉, ізо-C₄H₉, трет-C₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCI₂, CH₂CF₃, OCH₃, OCH₂CH₃, н-C₃H₇O, ізо-C₃H₇O, н-C₄H₉O, втор-C₄H₉O, ізо-C₄H₉O, трет-C₄H₉O, OCF₃, OCH₂CF₃, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами

- R₁₁;
 R₂₉ вибраний з CH₃, C₂H₅, н-С₃H₇, ізо-С₃H₇, н-С₄H₉, втор-С₄H₉, ізо-С₄H₉, трет-С₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCI₂, циклопропілу, SO₂CH₃, SO₂CH₂CH₃, COCH₃, COC₂H₅, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу,
 5 (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R₁₁;
 R₃₀ вибраний з H, CN, F, Cl, Br, I, CH₃, C₂H₅, н-С₃H₇, ізо-С₃H₇, н-С₄H₉, втор-С₄H₉, ізо-С₄H₉, трет-С₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCI₂, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R₁₁;
 10 R₃₁ вибраний з CH₃, C₂H₅, н-С₃H₇, ізо-С₃H₇, н-С₄H₉, втор-С₄H₉, ізо-С₄H₉, трет-С₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCI₂, циклопропілу, SO₂CH₃, SO₂CH₂CH₃, COCH₃, COC₂H₅, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R₁₁;
 R₃₂ вибраний з H, CN, F, Cl, Br, I, CH₃, C₂H₅, н-С₃H₇, ізо-С₃H₇, н-С₄H₉, втор-С₄H₉, ізо-С₄H₉, трет-С₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCI₂, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R₁₁;
 15 R₃₃, R₃₄ можуть бути вибрані відповідно з CH₃, C₂H₅, н-С₃H₇, ізо-С₃H₇, н-С₄H₉, втор-С₄H₉, ізо-С₄H₉, трет-С₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCI₂, циклопропілу, COCH₃, COC₂H₅, COOCH₃, COOC₂H₅, COOCH₂CF₃, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R₁₁;
 20 R₃₅, R₃₆ можуть бути вибрані відповідно з H, CN, F, Cl, Br, I, CH₃, C₂H₅, н-С₃H₇, ізо-С₃H₇, н-С₄H₉, втор-С₄H₉, ізо-С₄H₉, трет-С₄H₉, CF₃, CCl₃, CF₂Cl, CFCI₂, незаміщеного або додатково заміщеного (гетеро)арилу, (гетеро)арилметилу, (гетеро)арилкарбонілу, (гетеро)арилметилкарбонілу або (гетеро)арилоксикарбонілу 1-5 групами R₁₁;
 25 W вибраний з H, F, Cl, Br, I, CH₃, C₂H₅, н-С₃H₇, ізо-С₃H₇, н-С₄H₉, втор-С₄H₉, ізо-С₄H₉, трет-С₄H₉, CH₂F, CH₂Cl, CHF₂, CF₃, CH₂CF₃, OCH₃, OC₂H₅, SCH₃, SC₂H₅, SO₂CH₃ або SO₂CH₂CH₃; солями, представленими загальною формулою I, є солі, утворені зі сполук, представлених загальними формулами I-1F, I-1G, I-1H, I-1I, I-1J, I-1K, I-1L, I-1M, I-2F, I-2G, I-3F, I-3G, I-4F або I-4G, із хлористоводневою кислотою, сірчаною кислотою, фосфорною кислотою, мурашиною кислотою, оцтовою кислотою, трифтороцтовою кислотою, щавлевою кислотою, метилсульфоною кислотою, п-толуолсульфоною кислотою, бензойною кислотою, алізариновою кислотою, малеїною кислотою, фумаровою кислотою, сорбіною кислотою, яблучною кислотою або лимонною кислотою.
 30 6. Сполука заміщеного піразолу, що містить піримідиніл, за п. 5, де в загальних формулах I-1F, I-1G, I-2F, I-2G, I-4F або I-4G:
 R₃ вибраний з H, CH₃, COCH₃, COCF₃, OCH₃, SCH₃, CH₂CH=CH₂, SO₂CH₃, SO₂NHCH₃, SO₂N(CH₃)₂, COOCH₃, CONHCH₃, CON(CH₃)₂, SNHCH₃ або SN(CH₃)₂;
 40 R₄, R₅ можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з H, F, Cl, Br або CH₃;
 R₆, R₇ являють собою H;
 R₈ являє собою H;
 R₉ являє собою H;
 R₁₁ вибраний з F, Cl, Br, I, CN, NO₂, CH₃, CF₃, OCH₃ або OCF₃;
 45 ціле число n вибране від 0 до 5, причому, коли n дорівнює 0, бензольне кільце являє собою незаміщений феніл; коли n дорівнює більше ніж 1, групи R₁₁ можуть бути однаковими або різними;
 R₂₃, R₂₄, R₂₅, R₂₆ можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з H, F, Cl, Br, I або CH₃;
 50 R₂₇, R₂₈ можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з H, F, Cl, Br або I;
 W вибраний з H, F, Cl, Br, I або CH₃;
 солями, представленими загальною формулою I, є солі, утворені зі сполук, представлених загальними формулами I-1F, I-1G, I-2F, I-2G, I-4F або I-4G, із хлористоводневою кислотою, сірчаною кислотою, фосфорною кислотою, мурашиною кислотою, оцтовою кислотою, трифтороцтовою кислотою, щавлевою кислотою, метилсульфоною кислотою, п-толуолсульфоною кислотою, бензойною кислотою, алізариновою кислотою, малеїною кислотою, фумаровою кислотою, сорбіною кислотою, яблучною кислотою або лимонною кислотою.
 55 7. Сполука заміщеного піразолу, що містить піримідиніл, за п. 5, де в загальних формулах I-1F, I-1G, I-2G, I-4F або I-4G:
 60

- R_3 вибраний з H, CH_3 , $COCH_3$, OCH_3 , $CH_2CH=CH_2$, SO_2CH_3 , $COOCH_3$, $CONHCH_3$, $CON(CH_3)_2$ або $SN(CH_3)_2$;
 R_4 , R_5 можуть бути однаковими або різними, вибрані відповідно з H або CH_3 ;
 R_6 , R_7 являють собою H;
- 5 R_8 являє собою H;
 R_9 являє собою H;
 R_{11} вибраний з F, Cl, Br, I, CN, NO_2 , CH_3 , CF_3 , OCH_3 або OCF_3 ;
 ціле число n вибране від 1 до 5, причому, коли n дорівнює більше ніж 1, групи R_{11} можуть бути однаковими або різними;
- 10 R_{23} , R_{24} , R_{25} , R_{26} являють собою H;
 R_{27} являє собою H;
 R_{28} являє собою Cl;
 W вибраний з H, F, Cl, Br або I;
- 15 солями, представленими загальною формулою I, є солі, утворені зі сполук, представлених загальними формулами I-1F, I-1G, I-2G, I-4F або I-4G, із хлористоводневою кислотою, сірчаною кислотою, фосфорною кислотою, мурашиною кислотою, оцтовою кислотою, трифтороцтовою кислотою, щавлевою кислотою, метилсульфоною кислотою, п-толуолсульфоною кислотою, бензойною кислотою, алізариновою кислотою, малеїною кислотою, фумаровою кислотою, сорбіною кислотою, яблучною кислотою або лимонною кислотою.
- 20 8. Застосування сполуки заміщеного піразолу, що містить піримідиніл, за будь-яким одним з пп. 1-7 для одержання фунгіцидів, інсектицидів/акарицидів для сільського господарства й інших галузей.
9. Фунгіцидна, інсектицидна/акарицидна композиція, яка містить як активний інгредієнт сполуку заміщеного піразолу, що містить піримідиніл, представлена загальною формулою I, за будь-яким одним з пп. 1-7 і прийнятний носій, де масовий відсоток активного інгредієнта в даній композиції становить 0,1-99 %.
- 25 10. Застосування композиції за п. 9 для одержання фунгіцидів, інсектицидів/акарицидів для сільського господарства або інших галузей.