



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(51) МПК
C07D 231/14 (2006.01)
C07C 211/52 (2006.01)
C07D 231/16 (2006.01)
A01N 43/56 (2006.01)
A01N 43/78 (2006.01)
A01P 7/02 (2006.01)

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ

(21), (22) Заявка: 2008109214/04, 11.08.2006

(24) Дата начала отсчета срока действия патента:
11.08.2006

(30) Конвенционный приоритет:
12.08.2005 JP 2005-234405
07.11.2005 JP 2005-322531
18.04.2006 JP 2006-114937

(45) Опубликовано: 10.12.2009 Бюл. № 34

(56) Список документов, цитированных в отчете о
поиске: RU 2003134631 А, 10.05.2005. СА 2537124
А1, 10.03.2005. ЕР 1253128 А1, 30.10.2002. US
6316503 В1, 13.11.2001. ЕР 1006102 А2,
07.06.2000. СА 2395113 А1, 28.06.2001. RU
2194704 С2, 20.12.2002.

(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную
фазу: 12.03.2008

(86) Заявка РСТ:
JP 2006/316198 (11.08.2006)

(87) Публикация РСТ:
WO 2007/020986 (22.02.2007)

Адрес для переписки:
129090, Москва, ул. Б.Спасская, 25, стр.3,
ООО "Юридическая фирма Городиский и
Партнеры", пат.пов. Е.Е.Назиной

(72) Автор(ы):

ФУРУЯ Такаси (JP),
КАННО Хидео (JP),
МАТИЯ Козо (JP),
СУВА Акиюки (JP),
ЯСОКАВА Нориаки (JP),
ФУДЗИОКА Синсукэ (JP)

(73) Патентообладатель(и):

НИХОН НОХИЯКУ КО.,ЛТД. (JP)

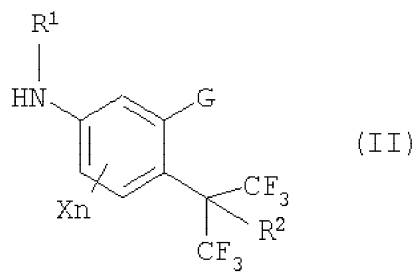
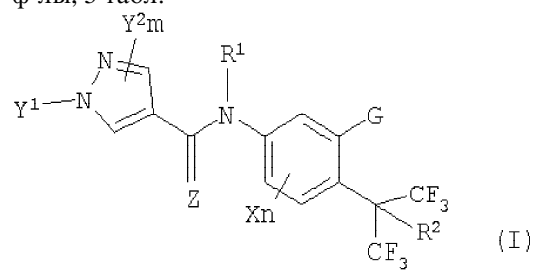
(54) ЗАМЕЩЕННОЕ АНИЛИДНОЕ ПРОИЗВОДНОЕ ПИРАЗОЛКАРБОНОВОЙ КИСЛОТЫ
ИЛИ ЕГО СОЛЬ, ЕГО ПРОМЕЖУТОЧНОЕ СОЕДИНЕНИЕ, АГЕНТ ДЛЯ ПРИМЕНЕНИЯ В
СЕЛЬСКОМ ХОЗЯЙСТВЕ И САДОВОДСТВЕ И ЕГО ПРИМЕНЕНИЕ

(57) Реферат:

Описываются замещенные
пиразолкарбокسانيлидные производные
формулы (I), где R¹ представляет собой H,
алкил, алкилкарбонил, алкенилкарбонил,
фенилалкил, фенилкарбонил; R² представляет
собой H, галоген, алкокси; G представляет
собой алкил, алкенил; Z представляет собой O;
X представляет собой H, галоген, алкил; Y¹

представляет собой алкил, алкенил; Y²
представляет собой галоген, C₁-C₆алкил, n
равно 1 или 2; и p равно 1, и их соли, акарицид
для сельского хозяйства, в качестве которого
используют пиразолкарбокسانيлидные
производные формулы (I) и способ его
применения. Описывается также
промежуточное соединение формулы (II) и
1,3-диметил-5-трифторметилпиразол-4-карбон

вая кислота. Техническим результатом является получение новых акарицидов, полезных в сельском хозяйстве. 5 н. и 7 з.п. ф-лы, 5 табл.



RU 2375348 C1

RU 2375348 C1



FEDERAL SERVICE
FOR INTELLECTUAL PROPERTY,
PATENTS AND TRADEMARKS

(51) Int. Cl.
C07D 231/14 (2006.01)
C07C 211/52 (2006.01)
C07D 231/16 (2006.01)
A01N 43/56 (2006.01)
A01N 43/78 (2006.01)
A01P 7/02 (2006.01)

(12) ABSTRACT OF INVENTION

(21), (22) Application: **2008109214/04, 11.08.2006**

(24) Effective date for property rights:
11.08.2006

(30) Priority:
12.08.2005 JP 2005-234405
07.11.2005 JP 2005-322531
18.04.2006 JP 2006-114937

(45) Date of publication: **10.12.2009 Bull. 34**

(85) Commencement of national phase: **12.03.2008**

(86) PCT application:
JP 2006/316198 (11.08.2006)

(87) PCT publication:
WO 2007/020986 (22.02.2007)

Mail address:
129090, Moskva, ul. B.Spasskaja, 25, str.3, OOO
"Juridicheskaja firma Gorodisskij i Partnery",
pat.pov. E.E.Nazinoj

(72) Inventor(s):

FURUJa Takasi (JP),
KANNO Khideo (JP),
MATIJJa Kozo (JP),
SUVA Akijuki (JP),
JaSOKAVA Noriaki (JP),
FUDZIOKA Sinsuke (JP)

(73) Proprietor(s):

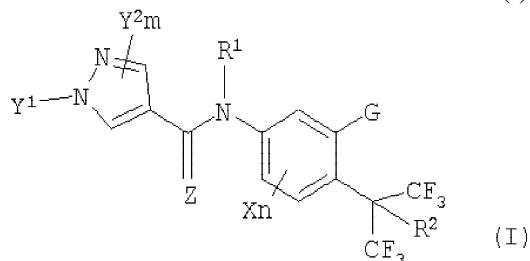
NIKhON NOKhIJJaKU KO.,LTD. (JP)

(54) SUBSTITUTED ANILIDE DERIVATIVE OF PYRAZOLE-CARBONIC ACID OR ITS SALT, ITS INTERMEDIATE COMPOUND, AGENT FOR APPLICATION IN AGRICULTURE AND GARDENING AND ITS APPLICATION

(57) Abstract:

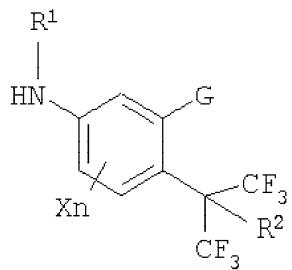
FIELD: agriculture.

SUBSTANCE: substituted pyrazole-carbonic anilide derivatives of formula (I)



are described, where R^1 represents H, alkyl, alkyl carbonyl, alkenyl carbonyl, phenyl alkyl, phenyl carbonyl; R^2 represents H, halogen, alkoxy; G represents alkyl, alkenyl; Z represents O; X represents H, halogen, alkyl; Y^1 represents alkyl,

alkenyl; Y^2 represents halogen, C_1-C_6 alkyl, m is equal to 1 or 2; and n is equal to 1, and their salts, acaricide for agriculture, such as pyrazole carbonic anilide derivatives of formula (I) and method for its application. Intermediate compound of formula (II)



(II)

is also

described, as well as 1.3-dimethyl-5-trifluoromethylpyrazole-4-carbonic acid.

EFFECT: improved use of new acaricides.

12 cl, 5 tbl, 20 ex

R U 2 3 7 5 3 4 8 C 1

R U 2 3 7 5 3 4 8 C 1

Настоящее изобретение относится к замещенным пиразолкарбоксамидным производным или к их солям, к их промежуточным соединениям и к агентам для сельского хозяйства, в частности к инсектицидам или акарицидам, содержащим указанные соединения в качестве активного ингредиента, и к способу их применения.

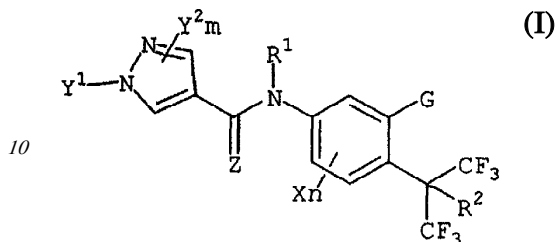
Обычно замещенные пиразолкарбоксамидные производные, сходные с настоящим изобретением, как известно, полезны в качестве инсектицидов, фунгицидов или акарицидов для сельского хозяйства (например, заявки на патент Японии JP-A-2003-48878, JP-A-2004-189738 и JP-A-2004-269515). В заявке на патент Японии JP-A-2003-48878 описаны замещенные пиразолкарбоксамидные производные. Однако заместители в анилиновом остатке по большей части ограничиваются заместителями в положении 2, заместитель в положении 3 представляет собой только метильную группу, и соединение, описываемое в настоящем изобретении, где алкильная группа, имеющая 2 или более атомов углерода, введена в положение 3, не включено в список указанных соединений. Более того, форма с метильной группой в положении 3, конкретно описанная в ней, не показывает акарицидной активности. В заявке на патент Японии JP-A-2004-189738 описаны замещенные пиразолкарбоксамидные производные. Однако заместители в анилиновом остатке ограничиваются алкоксигруппой, алкилтиогруппой и алкиламиногруппой, и соединение, описываемое в настоящем изобретении, где алкильная группа, имеющая 2 или более атомов углерода, непосредственно введена в положение 3, даже не включено в указанный список соединений. В заявке на патент Японии JP-A-2004-269515 описаны замещенные пиразолкарбоксамидные производные. Однако описано только амидное соединение с гетероциклиламином, и замещенные пиразолкарбоксамидные производные настоящего изобретения не описаны.

При выращивании сельскохозяйственных и садовых растений вред, наносимый вредными насекомыми, по-прежнему остается серьезной проблемой, и разработка новых агентов для сельского хозяйства, в частности разработка инсектицидов и акарицидов, является желательной вследствие генерирования вредных насекомых, устойчивых к известным агентам и тому подобное. Поскольку являются востребованными различные сельскохозяйственные работы, экономящие труд, вследствие увеличения численности пожилых работников сельского хозяйства, требуется также создание агентов для сельского хозяйства со свойствами, пригодными для таких сельскохозяйственных работ с экономией труда, в частности инсектицидов и акарицидов.

Авторы настоящего изобретения продолжили широкие исследования по разработке новых агентов для сельского хозяйства, в частности инсектицидов и акарицидов, и обнаружили, что в широком диапазоне соединений, описанных в указанном выше предшествующем уровне, замещенные пиразолкарбоксамидные производные, представленные формулой (I), где пиразольное кольцо выбрано как остаток гетероциклической карбоновой кислоты, и конкретный заместитель введен в анилиновый остаток в положении 3, демонстрируют превосходный контролирующий эффект в качестве акарицидов, как правило, не предсказуемый по содержанию, описанному в указанных выше ссылках на предшествующий уровень. Кроме того, авторы обнаружили, что промежуточные соединения указанного соединения, то есть замещенные анилиновые производные, представленные формулой (II), и 1,3-диметил-5-трифторметилпиразол-4-карбоновая кислота или ее соль являются новыми соединениями, неизвестными в ссылках на предшествующий уровень, и являются полезными в качестве промежуточных соединений для получения различных

производных, обладающих физиологической активностью, таких как фармацевтические препараты, пестициды и тому подобное, и таким образом завершили настоящее изобретение.

Соответственно, настоящее изобретение относится к замещенным пиразолкарбоксамидным производным, представленным формулой (I):



где R¹ представляет собой 1а) атом водорода, 2а) C₁-C₈алкильную группу, 3а) галогенC₁-C₆алкильную группу, 4а) C₁-C₆алкилкарбонильную группу, 5а) галогенC₁-C₆алкилкарбонильную группу, 6а) C₂-C₆алкенилкарбонильную группу, 7а) галогенC₂-C₆алкенилкарбонильную группу, 8а) C₁-C₆алкилкарбонилC₁-C₆алкильную группу, 9а) C₃-C₆циклоалкильную группу, 10а) галогенC₃-C₆циклоалкильную группу, 11а) C₃-C₆циклоалкилC₁-C₆алкильную группу, 12а) галогенC₃-C₆циклоалкилC₁-C₆алкильную группу, 13а) C₂-C₆алкенильную группу, 14а) галогенC₂-C₆алкенильную группу, 15а) C₂-C₆алкинильную группу, 16а) галогенC₂-C₆алкинильную группу, 17а) C₁-C₁₀алкоксиC₁-C₆алкильную группу, 18а) галогенC₁-C₆алкоксиC₁-C₆алкильную группу, 19а) C₂-C₆алкенилоксиC₁-C₆алкильную группу, 20а) C₁-C₆алкоксиC₁-C₆алкоксиC₁-C₆алкильную группу, 21а) C₁-C₆алкилтиоC₁-C₆алкильную группу, 22а) галогенC₁-C₆алкилтиоC₁-C₆алкильную группу, 23а) C₁-C₆алкилсульфинилC₁-C₆алкильную группу, 24а) галогенC₁-C₆алкилсульфинилC₁-C₆алкильную группу, 25а) C₁-C₆алкилсульфонилC₁-C₆алкильную группу, 26а) галогенC₁-C₆алкилсульфонилC₁-C₆алкильную группу, 27а) моноC₁-C₆алкиламиноC₁-C₆алкильную группу, 28а) диC₁-C₆алкиламиноC₁-C₆алкильную группу, где алкильные группы являются одинаковыми или различными, 29а) фенилC₁-C₆алкоксиC₁-C₆алкильную группу, 30а) замещенную фенилC₁-C₆алкоксиC₁-C₆алкильную группу, имеющую на кольце один или несколько одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена, б) цианогруппы, с) нитрогруппы, d) C₁-C₆алкильной группы, е) галогенC₁-C₆алкильной группы, f) C₁-C₆алкоксигруппы, g) галогенC₁-C₆алкоксигруппы, h) C₁-C₆алкилтиогруппы, i) галогенC₁-C₆алкилтиогруппы, j) C₁-C₆алкилсульфинильной группы, k) галогенC₁-C₆алкилсульфинильной группы, l) C₁-C₆алкилсульфонильной группы, m) галогенC₁-C₆алкилсульфонильной группы, n) моноC₁-C₆алкиламиногруппы, o) диC₁-C₆алкиламиногруппы, где алкильные группы являются одинаковыми или различными, и p) C₁-C₆алкоксикарбонильной группы, 31а) C₁-C₁₆алкоксикарбонильную группу, 32а) C₁-C₆алкоксиC₁-C₆алкоксикарбонильную группу, 33а) галогенC₁-C₆алкоксикарбонильную группу, 34а) C₂-C₆алкенилоксикарбонильную

35

40

45

50

- группу, 35а) C_1-C_6 алкилтиокарбонильную группу, 36а) моно C_1-C_6 алкиламинокарбонильную группу, 37а) ди C_1-C_6 алкиламинокарбонильную группу, где алкильные группы являются одинаковыми или различными, 38а)
- 5 C_1-C_6 алкоксикарбонил C_1-C_6 алкильную группу, 39а) C_1-C_6 алкилсульфонильную группу, 40а) галоген C_1-C_6 алкилсульфонильную группу, 41а) циано C_1-C_6 алкильную группу, 42а) фенил C_1-C_6 алкильную группу, 43а) замещенную фенил C_1-C_6 алкильную группу, имеющую на кольце один или несколько одинаковых или различных
- 10 заместителей, выбранных из а) атома галогена, б) цианогруппы, с) нитрогруппы, d) C_1-C_6 алкильной группы, е) галоген C_1-C_6 алкильной группы, f) C_1-C_6 алкоксигруппы, g) галоген C_1-C_6 алкоксигруппы, h) C_1-C_6 алкилтиогруппы, i) галоген C_1-C_6 алкилтиогруппы, j) C_1-C_6 алкилсульфинильной группы, k)
- 15 галоген C_1-C_6 алкилсульфинильной группы, l) C_1-C_6 алкилсульфонильной группы, m) галоген C_1-C_6 алкилсульфонильной группы, n) моно C_1-C_6 алкиламиногруппы, о) ди C_1-C_6 алкиламиногруппы, где алкильные группы являются одинаковыми или различными, и р) C_1-C_6 алкоксикарбонильной группы, 44а) фенилкарбонильную группу, 45а)
- 20 замещенную фенилкарбонильную группу, имеющую на кольце один или несколько одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена, б) цианогруппы, с) нитрогруппы, d) C_1-C_6 алкильной группы, е) галоген C_1-C_6 алкильной группы, f) C_1-C_6 алкоксигруппы, g) галоген C_1-C_6 алкоксигруппы, h)
- 25 C_1-C_6 алкилтиогруппы, i) галоген C_1-C_6 алкилтиогруппы, j) C_1-C_6 алкилсульфинильной группы, k) галоген C_1-C_6 алкилсульфинильной группы, l) C_1-C_6 алкилсульфонильной группы, m) галоген C_1-C_6 алкилсульфонильной группы, n) моно C_1-C_6 алкиламиногруппы, о)
- 30 ди C_1-C_6 алкиламиногруппы, где алкильные группы являются одинаковыми или различными, и р) C_1-C_6 алкоксикарбонильной группы, 46а) гетероциклкарбонильную группу, 47а) замещенную гетероциклкарбонильную группу, имеющую на кольце один или несколько одинаковых или различных
- 35 заместителей, выбранных из а) атома галогена, б) цианогруппы, с) нитрогруппы, d) C_1-C_6 алкильной группы, е) галоген C_1-C_6 алкильной группы, f) C_1-C_6 алкоксигруппы, g) галоген C_1-C_6 алкоксигруппы, h) C_1-C_6 алкилтиогруппы, i) галоген C_1-C_6 алкилтиогруппы, j) C_1-C_6 алкилсульфинильной группы, k)
- 40 галоген C_1-C_6 алкилсульфинильной группы, l) C_1-C_6 алкилсульфонильной группы, m) галоген C_1-C_6 алкилсульфонильной группы, n) моно C_1-C_6 алкиламиногруппы, о) ди C_1-C_6 алкиламиногруппы, где алкильные группы являются одинаковыми или различными, и р) C_1-C_6 алкоксикарбонильной группы, 48а) феноксикарбонильную
- 45 группу, 49а) замещенную феноксикарбонильную группу, имеющую на кольце один или несколько одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена, б) цианогруппы, с) нитрогруппы, d) C_1-C_6 алкильной группы, е) галоген C_1-C_6 алкильной группы, f) C_1-C_6 алкоксигруппы, g)
- 50 галоген C_1-C_6 алкоксигруппы, h) C_1-C_6 алкилтиогруппы, i) галоген C_1-C_6 алкилтиогруппы, j) C_1-C_6 алкилсульфинильной группы, k) галоген C_1-C_6 алкилсульфинильной группы, l) C_1-C_6 алкилсульфонильной группы, m)

галогенC₁-C₆алкилсульфонильной группы, н) моноC₁-C₆алкиламиногруппы, о) диC₁-C₆алкиламиногруппы, где алкильные группы являются одинаковыми или различными, и р) C₁-C₆алкоксикарбонильной группы, 50а) феноксиC₁-C₆алкилкарбонильную

5 группу, 51а) замещенную феноксиC₁-C₆алкилкарбонильную группу, имеющую на кольце один или несколько одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена, б) цианогруппы, с) нитрогруппы, д) C₁-C₆алкильной группы, е) галогенC₁-C₆алкильной группы, ф) C₁-C₆алкоксигруппы, г)

10 галогенC₁-C₆алкоксигруппы, h) C₁-C₆алкилтиогруппы, и) галогенC₁-C₆алкилтиогруппы, j) C₁-C₆алкилсульфинильной группы, к) галогенC₁-C₆алкилсульфинильной группы, л) C₁-C₆алкилсульфонильной группы, м) галогенC₁-C₆алкилсульфонильной группы, н) моноC₁-C₆алкиламиногруппы, о) диC₁-C₆алкиламиногруппы, где алкильные группы являются одинаковыми или различными, и р) C₁-C₆алкоксикарбонильной группы, 52а) феноксиC₁-C₆алкилкарбонильную группу, 53а) замещенную феноксиC₁-C₆алкилкарбонильную группу, имеющую на кольце один или несколько одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена, б)

20 цианогруппы, с) нитрогруппы, д) C₁-C₆алкильной группы, е) галогенC₁-C₆алкильной группы, ф) C₁-C₆алкоксигруппы, г) галогенC₁-C₆алкоксигруппы, h) C₁-C₆алкилтиогруппы, и) галогенC₁-C₆алкилтиогруппы, j) C₁-C₆алкилсульфинильной группы, к) галогенC₁-C₆алкилсульфинильной группы, л) C₁-C₆алкилсульфонильной

25 группы, м) галогенC₁-C₆алкилсульфонильной группы, н) моноC₁-C₆алкиламиногруппы, о) диC₁-C₆алкиламиногруппы, где алкильные группы являются одинаковыми или различными, и р) C₁-C₆алкоксикарбонильной группы, 54а) диC₁-C₆алкилфосфоногруппу, где алкильные группы являются одинаковыми или различными, 55а) диC₁-C₆алкилфосфонотиогруппу, где алкильные группы являются одинаковыми или различными, 56а) N-C₁-C₆алкил-N-C₁-C₆алкоксикарбониламинотиогруппу, 57а) N-C₁-C₆алкил-N-C₁-C₆алкоксикарбонилC₁-C₆алкиламинотиогруппу, 58а)

35 диC₁-C₆алкиламинотиогруппу, где алкильные группы являются одинаковыми или различными, 59а) C₃-C₆циклоалкилкарбонильную группу, 60а) галогенC₃-C₆циклоалкилкарбонильную группу, 61а) C₁-C₆алкилC₃-C₆циклоалкилкарбонильную группу, 62а) галогенC₁-C₆алкилC₃-C₆циклоалкилкарбонильную группу, 63а) феноксиC₁-C₆алкилкарбонильную группу, 64а) замещенную феноксиC₁-C₆алкилкарбонильную группу, имеющую на кольце один или несколько

45 одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена, б) цианогруппы, с) нитрогруппы, д) C₁-C₆алкильной группы, е) галогенC₁-C₆алкильной группы, ф) C₁-C₆алкоксигруппы, г) галогенC₁-C₆алкоксигруппы, h) C₁-C₆алкилтиогруппы, и) галогенC₁-C₆алкилтиогруппы, j) C₁-C₆алкилсульфинильной группы, к) галогенC₁-C₆алкилсульфинильной группы, л) C₁-C₆алкилсульфонильной

50 группы, м) галогенC₁-C₆алкилсульфонильной группы, н) моноC₁-C₆алкиламиногруппы, о)

- диС₁-С₆алкиламиногруппы, где алкильные группы являются одинаковыми или различными, и р) С₁-С₆алкоксикарбонильной группы, 65а)
- фенилС₃-С₆циклоалкилкарбонильную группу, 66а) замещенную
- 5 фенилС₃-С₆циклоалкилкарбонильную группу, имеющую на кольце один или несколько одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена, б) цианогруппы, с) нитрогруппы, d) С₁-С₆алкильной группы, е) галогенС₁-С₆алкильной группы, f) С₁-С₆алкоксигруппы, g)
- 10 галогенС₁-С₆алкоксигруппы, h) С₁-С₆алкилтиогруппы, i) галогенС₁-С₆алкилтиогруппы, j) С₁-С₆алкилсульфинильной группы, k) галогенС₁-С₆алкилсульфинильной группы, l) С₁-С₆алкилсульфонильной группы, m) галогенС₁-С₆алкилсульфонильной группы, n) моноС₁-С₆алкиламиногруппы, о) диС₁-С₆алкиламиногруппы, где алкильные группы являются одинаковыми или различными,
- 15 и р) С₁-С₆алкоксикарбонильной группы, 67а)
- С₃-С₆циклоалкилС₁-С₆алкилкарбонильную группу, 68а)
- С₁-С₆алкоксиС₁-С₆алкилкарбонильную группу, 69а)
- 20 галогенС₃-С₆циклоалкилС₁-С₆алкилкарбонильную группу, 70а)
- феноксиС₁-С₆алкоксикарбонильную группу, 71а) замещенную феноксиС₁-С₆алкоксикарбонильную группу, имеющую на кольце один или несколько
- 25 одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена, б) цианогруппы, с) нитрогруппы, d) С₁-С₆алкильной группы, е) галогенС₁-С₆алкильной группы, f) С₁-С₆алкоксигруппы, g) галогенС₁-С₆алкоксигруппы, h) С₁-С₆алкилтиогруппы, i) галогенС₁-С₆алкилтиогруппы, j) С₁-С₆алкилсульфинильной группы, k) галогенС₁-С₆алкилсульфинильной группы, l) С₁-С₆алкилсульфонильной группы, m) галогенС₁-С₆алкилсульфонильной группы, n)
- 30 моноС₁-С₆алкиламиногруппы, о) диС₁-С₆алкиламиногруппы, где алкильные группы являются одинаковыми или различными, и р) С₁-С₆алкоксикарбонильной группы,
- 35 72а) С₁-С₆алкилкарбонилоксиС₁-С₆алкильную группу, 73а)
- С₁-С₆алкилкарбонилС₁-С₆алкилкарбонильную группу или 74а)
- С₁-С₆алкоксикарбонилС₁-С₆алкилкарбонильную группу;
- R² представляет собой 1b) атом водорода, 2b) атом галогена, 3b) С₁-С₆алкильную
- 40 группу, 4b) галогенС₁-С₆алкильную группу, 5b) цианогруппу, 6b) гидроксигруппу, 7b) С₁-С₆алкоксигруппу, 8b) галогенС₁-С₆алкоксигруппу, 9b) С₁-С₆алкоксиС₁-С₃алкоксигруппу, 10b) галогенС₁-С₆алкоксиС₁-С₃алкоксигруппу, 11b) С₁-С₆алкилтиоС₁-С₃алкоксигруппу, 12b)
- 45 галогенС₁-С₆алкилтиоС₁-С₃алкоксигруппу, 13b)
- С₁-С₆алкилсульфинилС₁-С₃алкоксигруппу, 14b)
- галогенС₁-С₆алкилсульфинилС₁-С₃алкоксигруппу, 15b)
- С₁-С₆алкилсульфонилС₁-С₃алкоксигруппу, 16b)
- 50 галогенС₁-С₆алкилсульфонилС₁-С₃алкоксигруппу, 17b)
- моноС₁-С₆алкиламиноС₁-С₃алкоксигруппу, 18b)
- диС₁-С₆алкиламиноС₁-С₃алкоксигруппу, где алкильные группы являются

одинаковыми или различными, 19b) C_1-C_6 алкилтиогруппу, 20b) галоген C_1-C_6 алкилтиогруппу, 21b) C_1-C_6 алкилсульфинильную группу, 22b) галоген C_1-C_6 алкилсульфинильную группу, 23b) C_1-C_6 алкилсульфонильную группу, 24b) галоген C_1-C_6 алкилсульфонильную группу, 25b) аминогруппу, 26b) моно C_1-C_6 алкиламиногруппу, 27b) ди C_1-C_6 алкиламиногруппу, где алкильные группы являются одинаковыми или различными, 28b) феноксигруппу, 29b) замещенную феноксигруппу, имеющую на кольце один или несколько одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена, б) цианогруппы, с) нитрогруппы, d) C_1-C_6 алкильной группы, е) галоген C_1-C_6 алкильной группы, f) C_1-C_6 алкоксигруппы, g) галоген C_1-C_6 алкоксигруппы, h) C_1-C_6 алкилтиогруппы, i) галоген C_1-C_6 алкилтиогруппы, j) C_1-C_6 алкилсульфинильной группы, k) галоген C_1-C_6 алкилсульфинильной группы, l) C_1-C_6 алкилсульфонильной группы, m) галоген C_1-C_6 алкилсульфонильной группы, n) моно C_1-C_6 алкиламиногруппы, о) ди C_1-C_6 алкиламиногруппы, где алкильные группы являются одинаковыми или различными, и р) C_1-C_6 алкоксикарбонильной группы, 30b) фенилтиогруппу, 31b) замещенную фенилтиогруппу, имеющую на кольце один или несколько одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена, б) цианогруппы, с) нитрогруппы, d) C_1-C_6 алкильной группы, е) галоген C_1-C_6 алкильной группы, f) C_1-C_6 алкоксигруппы, g) галоген C_1-C_6 алкоксигруппы, h) C_1-C_6 алкилтиогруппы, i) галоген C_1-C_6 алкилтиогруппы, j) C_1-C_6 алкилсульфинильной группы, k) галоген C_1-C_6 алкилсульфинильной группы, l) C_1-C_6 алкилсульфонильной группы, m) галоген C_1-C_6 алкилсульфонильной группы, n) моно C_1-C_6 алкиламиногруппы, о) ди C_1-C_6 алкиламиногруппы, где алкильные группы являются одинаковыми или различными, и р) C_1-C_6 алкоксикарбонильной группы, 32b) фенилсульфинильную группу, 33b) замещенную фенилсульфинильную группу, имеющую на кольце один или несколько одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена, б) цианогруппы, с) нитрогруппы, d) C_1-C_6 алкильной группы, е) галоген C_1-C_6 алкильной группы, f) C_1-C_6 алкоксигруппы, g) галоген C_1-C_6 алкоксигруппы, h) C_1-C_6 алкилтиогруппы, i) галоген C_1-C_6 алкилтиогруппы, j) C_1-C_6 алкилсульфинильной группы, k) галоген C_1-C_6 алкилсульфинильной группы, j) C_1-C_6 алкилсульфонильной группы, m) галоген C_1-C_6 алкилсульфонильной группы, n) моно C_1-C_6 алкиламиногруппы, о) ди C_1-C_6 алкиламиногруппы, где алкильные группы являются одинаковыми или различными, и р) C_1-C_6 алкоксикарбонильной группы, 34b) фенилсульфонильную группу, 35b) замещенную фенилсульфонильную группу, имеющую на кольце один или несколько одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена, б) цианогруппы, с) нитрогруппы, d) C_1-C_6 алкильной группы, е) галоген C_1-C_6 алкильной группы, f) C_1-C_6 алкоксигруппы, g) галоген C_1-C_6 алкоксигруппы, h) C_1-C_6 алкилтиогруппы, i) галоген C_1-C_6 алкилтиогруппы, j) C_1-C_6 алкилсульфинильной группы, k) галоген C_1-C_6 алкилсульфинильной группы, l) C_1-C_6 алкилсульфонильной группы, m) галоген C_1-C_6 алкилсульфонильной группы, n) моно C_1-C_6 алкиламиногруппы, о) ди C_1-C_6 алкиламиногруппы, где алкильные группы являются одинаковыми или различными,

и р) C_1 - C_6 алкоксикарбонильной группы, 36b) фенил C_1 - C_6 алкоксигруппу или 37b) замещенную фенил C_1 - C_6 алкоксигруппу, имеющую на кольце один или несколько одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена, б) цианогруппы, с) нитрогруппы, d) C_1 - C_6 алкильной группы, е) галоген C_1 - C_6 алкильной группы, f) C_1 - C_6 алкоксигруппы, g) галоген C_1 - C_6 алкоксигруппы, h) C_1 - C_6 алкилтиогруппы, i) галоген C_1 - C_6 алкилтиогруппы, j) C_1 - C_6 алкилсульфинильной группы, к) галоген C_1 - C_6 алкилсульфинильной группы, л) C_1 - C_6 алкилсульфонильной группы, m) галоген C_1 - C_6 алкилсульфонильной группы, n) моно C_1 - C_6 алкиламиногруппы, о) ди C_1 - C_6 алкиламиногруппы, где алкильные группы являются одинаковыми или различными, и р) C_1 - C_6 алкоксикарбонильной группы;

G представляет собой 1с) C_2 - C_{10} алкильную группу, 2с) галоген C_2 - C_{10} алкильную группу, 3с) C_3 - C_{10} алкенильную группу, 4с) галоген C_3 - C_{10} алкенильную группу, 5с) C_3 - C_{10} алкинильную группу, 6с) галоген C_3 - C_{10} алкинильную группу, 7с) C_3 - C_{10} циклоалкильную группу, 8с) замещенную C_3 - C_{10} циклоалкильную группу, имеющую на кольце один или несколько одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена, б) C_1 - C_6 алкильной группы и с) галоген C_1 - C_6 алкильной группы, 9с) C_3 - C_{10} циклоалкенильную группу, 10с) замещенную C_3 - C_{10} циклоалкенильную группу, имеющую на кольце один или несколько одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена, б) C_1 - C_6 алкильной группы и с) галоген C_1 - C_6 алкильной группы, 11с) C_3 - C_8 циклоалкил C_1 - C_6 алкильную группу или 12с) галоген C_3 - C_8 циклоалкил C_1 - C_6 алкильную группу;

Z представляет собой атом кислорода или атом серы;

X могут быть одинаковыми или различными и представляют собой 1d) атом водорода, 2d) атом галогена, 3d) цианогруппу, 4d) нитрогруппу, 5d) C_1 - C_6 алкильную группу или 6d) галоген C_1 - C_6 алкильную группу;

Y¹ представляет собой 1е) атом водорода, 2е) C_1 - C_6 алкильную группу, 3е) галоген C_1 - C_6 алкильную группу, 4е) C_2 - C_6 алкенильную группу, 5е) галоген C_2 - C_6 алкенильную группу, 6е) C_2 - C_6 алкинильную группу, 7е) галоген C_2 - C_6 алкинильную группу, 8е) C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_6 алкильную группу, 9е) гидроксигруппу, 10е) C_1 - C_6 алкилкарбонилокси C_1 - C_6 алкильную группу, 11е) C_3 - C_6 циклоалкильную группу, 12е) галоген C_3 - C_6 циклоалкильную группу, 13е) C_3 - C_6 циклоалкил C_1 - C_6 алкильную группу, 14е) галоген C_3 - C_6 циклоалкил C_1 - C_6 алкильную группу, 15е) C_1 - C_6 алкилсульфонильную группу, 16е) галоген C_1 - C_6 алкилсульфонильную группу, 17е) C_1 - C_6 алкилтио C_1 - C_6 алкильную группу, 18е) галоген C_1 - C_6 алкилтио C_1 - C_6 алкильную группу, 19е) C_1 - C_6 алкилсульфинил C_1 - C_6 алкильную группу, 20е) галоген C_1 - C_6 алкилсульфинил C_1 - C_6 алкильную группу, 21е) C_1 - C_6 алкилсульфонил C_1 - C_6 алкильную группу, 22е) галоген C_1 - C_6 алкилсульфонил C_1 - C_6 алкильную группу, 23е) моно C_1 - C_6 алкиламино C_1 - C_6 алкильную группу, 24е) ди C_1 - C_6 алкиламино C_1 - C_6 алкильную группу, где алкильные

группы являются одинаковыми или различными, 25e) фенильную группу, 26e) замещенную фенильную группу, имеющую на кольце один или несколько одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена, б) цианогруппы, с) нитрогруппы, d) C_1 - C_6 алкильной группы, е) галоген C_1 - C_6 алкильной группы, f) C_1 - C_6 алкоксигруппы, g) галоген C_1 - C_6 алкоксигруппы, h) C_1 - C_6 алкилтиогруппы, i) галоген C_1 - C_6 алкилтиогруппы, j) C_1 - C_6 алкилсульфинильной группы, k) галоген C_1 - C_6 алкилсульфонильной группы, m) галоген C_1 - C_6 алкилсульфонильной группы, n) моно C_1 - C_6 алкиламиногруппы, о) ди C_1 - C_6 алкиламиногруппы, где алкильные группы являются одинаковыми или различными, и р) C_1 - C_6 алкоксикарбонильной группы;

Y^2 могут быть одинаковыми или различными и представляют собой 1f) атом водорода, 2f) атом галогена, 3f) цианогруппу, 4f) нитрогруппу, 5f) гидроксильную группу, 6f) меркаптогруппу, 7f) аминогруппу, 8f) карбоксильную группу, 9f) C_1 - C_6 алкильную группу, 10f) галоген C_1 - C_6 алкильную группу, 11f) C_2 - C_6 алкенильную группу, 12f) галоген C_2 - C_6 алкенильную группу, 13f) C_2 - C_6 алкинильную группу, 14f) галоген C_2 - C_6 алкинильную группу, 15f) три C_1 - C_6 алкилсиллил C_2 - C_6 алкинильную группу, где алкильные группы являются одинаковыми или различными, 16f) фенил C_2 - C_6 алкинильную группу, 17f) C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_6 алкильную группу, 18f) гидрокси C_1 - C_6 алкильную группу, 19f) C_1 - C_6 алкилкарбонилокси C_1 - C_6 алкильную группу, 20f) C_3 - C_6 циклоалкильную группу, 21f) галоген C_3 - C_6 циклоалкильную группу, 22f) C_3 - C_6 циклоалкил C_1 - C_6 алкильную группу, 23f) галоген C_3 - C_6 циклоалкил C_1 - C_6 алкильную группу, 24f) C_1 - C_6 алкоксигруппу, 25f) галоген C_1 - C_6 алкоксигруппу, 26f) C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_6 алкоксигруппу, 27f) галоген C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_6 алкоксигруппу, 28f) фенил C_1 - C_6 алкоксигруппу, 29f) C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_6 алкильную группу, 30f) галоген C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_6 алкильную группу, 31f) C_1 - C_6 алкилтиогруппу, 32f) галоген C_1 - C_6 алкилтиогруппу, 33f) C_1 - C_6 алкилсульфинильную группу, 34f) галоген C_1 - C_6 алкилсульфинильную группу, 35f) C_1 - C_6 алкилсульфонильную группу, 36f) галоген C_1 - C_6 алкилсульфонильную группу, 37f) C_1 - C_6 алкилтио C_1 - C_6 алкильную группу, 38f) галоген C_1 - C_6 алкилтио C_1 - C_6 алкильную группу, 39f) C_1 - C_6 алкилсульфинил C_1 - C_6 алкильную группу, 40f) галоген C_1 - C_6 алкилсульфинил C_1 - C_6 алкильную группу, 41f) C_1 - C_6 алкилсульфонил C_1 - C_6 алкильную группу, 42f) галоген C_1 - C_6 алкилсульфонил C_1 - C_6 алкильную группу, 43f) моно C_1 - C_6 алкиламиногруппу, 44f) ди C_1 - C_6 алкиламиногруппу, где алкильные группы являются одинаковыми или различными, 45f) фениламиногруппу, 46f) моно C_1 - C_6 алкиламино C_1 - C_6 алкильную группу, 47f) ди C_1 - C_6 алкиламино C_1 - C_6 алкильную группу, где алкильные группы являются одинаковыми или различными, 48f) фенильную группу, 49f) замещенную фенильную группу, имеющую на кольце один или несколько одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена, б) цианогруппы, с) нитрогруппы, d) C_1 - C_6 алкильной группы, е) галоген C_1 - C_6 алкильной группы, f) C_1 - C_6 алкоксигруппы, g)

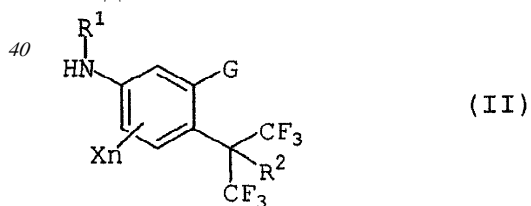
галогенC₁-C₆алкоксигруппы, h) C₁-C₆алкилтиогруппы, i)
 галогенC₁-C₆алкилтиогруппы, j) C₁-C₆алкилсульфинильной группы, k)
 галогенC₁-C₆алкилсульфинильной группы, l) C₁-C₆алкилсульфонильной группы, m)
 5 галогенC₁-C₆алкилсульфонильной группы, n) моноC₁-C₆алкиламиногруппы, о) диC₁-C₆
 алкиламиногруппы, где алкильные группы являются одинаковыми или различными,
 и р) C₁-C₆алкоксикарбонильной группы, 50f) феноксигруппу, 51f) замещенную
 феноксигруппу, имеющую на кольце один или несколько одинаковых или различных
 10 заместителей, выбранных из а) атома галогена, б) цианогруппы, с) нитрогруппы, d)
 C₁-C₆алкильной группы, е) галогенC₁-C₆алкильной группы, f) C₁-C₆алкоксигруппы, g)
 галогенC₁-C₆алкоксигруппы, h) C₁-C₆алкилтиогруппы, i)
 галогенC₁-C₆алкилтиогруппы, j) C₁-C₆алкилсульфинильной группы, k)
 15 галогенC₁-C₆алкилсульфинильной группы, l) C₁-C₆алкилсульфонильной группы, m)
 галогенC₁-C₆алкилсульфонильной группы, n) моноC₁-C₆алкиламиногруппы, о) диC₁-C₆
 алкиламиногруппы, где алкильные группы являются одинаковыми или различными,
 и р) C₁-C₆алкоксикарбонильной группы, 52f) гетероциклическую группу или 53f)
 20 замещенную гетероциклическую группу, имеющую на кольце один или несколько
 одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена, б)
 цианогруппы, с) нитрогруппы, d) C₁-C₆алкильной группы, е) галогенC₁-C₆алкильной
 группы, f) C₁-C₆алкоксигруппы, g) галогенC₁-C₆алкоксигруппы, h)
 25 C₁-C₆алкилтиогруппы, i) галогенC₁-C₆алкилтиогруппы, j) C₁-C₆алкилсульфинильной
 группы, k) галогенC₁-C₆алкилсульфинильной группы, l) C₁-C₆алкилсульфонильной
 группы, m) галогенC₁-C₆алкилсульфонильной группы, n)
 моноC₁-C₆алкиламиногруппы, о) диC₁-C₆алкиламиногруппы, где алкильные группы
 30 являются одинаковыми или различными, и р) C₁-C₆алкоксикарбонильной группы;

m равно 1 или 2; и

n равно целому числу от 1 до 3,

их солям и агентам для сельского хозяйства, содержащим соединение в качестве
 35 активного ингредиента, и к способам их применения.

В дополнение, настоящее изобретение также относится к замещенным анилиновым
 производным, представленным формулой (II), которые являются промежуточными
 соединениями:



45 где R¹ представляет собой 1а) атом водорода, 2а) C₁-C₈алкильную группу, 3а)
 галогенC₁-C₆алкильную группу, 4а) C₁-C₆алкилкарбонильную группу, 5а) галогенC₁-C₆
 алкилкарбонильную группу, 6а) C₂-C₆алкенилкарбонильную группу, 7а)
 галогенC₂-C₆алкенилкарбонильную группу, 8а) C₁-C₆алкилкарбонилC₁-C₆алкильную
 50 группу, 9а) C₃-C₆циклоалкильную группу, 10а) галогенC₃-C₆циклоалкильную группу,
 11а) C₃-C₆циклоалкилC₁-C₆алкильную группу, 12а)
 галогенC₃-C₆циклоалкилC₁-C₆алкильную группу, 13а) C₂-C₆алкенильную группу, 14а)

- галогенC₂-C₆алкенильную группу, 15а) C₂-C₆алкинильную группу, 16а)
галогенC₂-C₆алкинильную группу, 17а) C₁-C₁₀ алкоксиC₁-C₆алкильную группу, 18а)
галогенC₁-C₆алкоксиC₁-C₆алкильную группу, 19а) C₂-C₆алкенилоксиC₁-C₆алкильную
5 группу, 20а) C₁-C₆алкоксиC₁-C₆алкоксиC₁-C₆алкильную группу, 21а)
C₁-C₆алкилтиоC₁-C₆алкильную группу, 22а) галогенC₁-C₆алкилтиоC₁-C₆алкильную
группу, 23а) C₁-C₆алкилсульфинилC₁-C₆алкильную группу, 24а)
галогенC₁-C₆алкилсульфинилC₁-C₆алкильную группу, 25а)
10 C₁-C₆алкилсульфонилC₁-C₆алкильную группу, 26а)
галогенC₁-C₆алкилсульфонилC₁-C₆алкильную группу, 27а) моноC₁-C₆алкиламино C₁-C₆
алкильную группу, 28а) диC₁-C₆алкиламиноC₁-C₆алкильную группу, где алкильные
группы являются одинаковыми или различными, 29а)
15 фенилC₁-C₆алкоксиC₁-C₆алкильную группу, 30а) замещенную
фенилC₁-C₆алкоксиC₁-C₆алкильную группу, имеющую на кольце один или несколько
одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена, б)
цианогруппы, с) нитрогруппы, d) C₁-C₆алкильной группы, е) галогенC₁-C₆алкильной
20 группы, f) C₁-C₆алкоксигруппы, g) галогенC₁-C₆алкоксигруппы, h)
C₁-C₆алкилтиогруппы, i) галогенC₁-C₆алкилтиогруппы, j) C₁-C₆алкилсульфинильной
группы, k) галогенC₁-C₆алкилсульфинильной группы, l) C₁-C₆алкилсульфонильной
группы, m) галогенC₁-C₆алкилсульфонильной группы, n)
25 моноC₁-C₆алкиламиногруппы, о) диC₁-C₆алкиламиногруппы, где алкильные группы
являются одинаковыми или различными, и р) C₁-C₆алкоксикарбонильной группы,
31а) C₁-C₁₆алкоксикарбонильную группу, 32а)
C₁-C₆алкоксиC₁-C₆алкоксикарбонильную группу, 33а)
30 галогенC₁-C₆алкоксикарбонильную группу, 34а) C₂-C₆алкенилоксикарбонильную
группу, 35а) C₁-C₆алкилтиокарбонильную группу, 36а)
моноC₁-C₆алкиламинокарбонильную группу, 37а) диC₁-C₆алкиламинокарбонильную
35 группу, где алкильные группы являются одинаковыми или различными, 38а)
C₁-C₆алкоксикарбонилC₁-C₆алкильную группу, 39а) C₁-C₆алкилсульфонильную
группу, 40а) галогенC₁-C₆алкилсульфонильную группу, 41а) цианоC₁-C₆алкильную
группу, 42а) фенилC₁-C₆алкильную группу, 43а) замещенную фенилC₁-C₆алкильную
40 группу, имеющую на кольце один или несколько одинаковых или различных
заместителей, выбранных из а) атома галогена, б) цианогруппы, с) нитрогруппы, d)
C₁-C₆алкильной группы, е) галогенC₁-C₆алкильной группы, f) C₁-C₆алкоксигруппы, g)
галогенC₁-C₆алкоксигруппы, h) C₁-C₆алкилтиогруппы, i)
45 галогенC₁-C₆алкилтиогруппы, j) C₁-C₆алкилсульфинильной группы, k)
галогенC₁-C₆алкилсульфинильной группы, l) C₁-C₆алкилсульфонильной группы, m)
галогенC₁-C₆алкилсульфонильной группы, n) моноC₁-C₆алкиламиногруппы, о) диC₁-C₆
алкиламиногруппы, где алкильные группы являются одинаковыми или различными,
50 и р) C₁-C₆алкоксикарбонильной группы, 44а) фенилкарбонильную группу, 45а)
замещенную фенилкарбонильную группу, имеющую на кольце один или несколько
одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена, б)
цианогруппы, с) нитрогруппы, d) C₁-C₆алкильной группы, е) галогенC₁-C₆алкильной

группы, f) C_1-C_6 алкоксигруппы, г) галоген C_1-C_6 алкоксигруппы, h)
 C_1-C_6 алкилтиогруппы, и) галоген C_1-C_6 алкилтиогруппы, j) C_1-C_6 алкилсульфинильной
 группы, k) галоген C_1-C_6 алкилсульфинильной группы, l) C_1-C_6 алкилсульфонильной
 5 группы, m) галоген C_1-C_6 алкилсульфонильной группы, n)
 моно C_1-C_6 алкиламиногруппы, о) ди C_1-C_6 алкиламиногруппы, где алкильные группы
 являются одинаковыми или различными, и р) C_1-C_6 алкоксикарбонильной группы, 46а)
 гетероциклкарбонильную группу, 47а) замещенную гетероциклкарбонильную
 10 группу, имеющую на кольце один или несколько одинаковых или различных
 заместителей, выбранных из а) атома галогена, б) цианогруппы, с) нитрогруппы, d)
 C_1-C_6 алкильной группы, е) галоген C_1-C_6 алкильной группы, f) C_1-C_6 алкоксигруппы, г)
 галоген C_1-C_6 алкоксигруппы, h) C_1-C_6 алкилтиогруппы, и)
 15 галоген C_1-C_6 алкилтиогруппы, j) C_1-C_6 алкилсульфинильной группы, k)
 галоген C_1-C_6 алкилсульфинильной группы, l) C_1-C_6 алкилсульфонильной группы, m)
 галоген C_1-C_6 алкилсульфонильной группы, n) моно C_1-C_6 алкиламиногруппы, о) ди C_1-C_6
 C_1-C_6 алкиламиногруппы, где алкильные группы являются одинаковыми или различными,
 20 и р) C_1-C_6 алкоксикарбонильной группы, 48а) феноксикарбонильную группу, 49а)
 замещенную феноксикарбонильную группу, имеющую на кольце один или несколько
 одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена, б)
 цианогруппы, с) нитрогруппы, d) C_1-C_6 алкильной группы, е) галоген C_1-C_6 алкильной
 25 группы, f) C_1-C_6 алкоксигруппы, г) галоген C_1-C_6 алкоксигруппы, h)
 C_1-C_6 алкилтиогруппы, и) галоген C_1-C_6 алкилтиогруппы, j) C_1-C_6 алкилсульфинильной
 группы, k) галоген C_1-C_6 алкилсульфинильной группы, l) C_1-C_6 алкилсульфонильной
 группы, m) галоген C_1-C_6 алкилсульфонильной группы, n)
 30 моно C_1-C_6 алкиламиногруппы, о) ди C_1-C_6 алкиламиногруппы, где алкильные группы
 являются одинаковыми или различными, и р) C_1-C_6 алкоксикарбонильной группы, 50а)
 фенокси C_1-C_6 алкилкарбонильную группу, 51а) замещенную
 фенокси C_1-C_6 алкилкарбонильную группу имеющую на кольце один или несколько
 35 одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена, б)
 цианогруппы, с) нитрогруппы, d) C_1-C_6 алкильной группы, е) галоген C_1-C_6 алкильной
 группы, f) C_1-C_6 алкоксигруппы, г) галоген C_1-C_6 алкоксигруппы, h)
 C_1-C_6 алкилтиогруппы, и) галоген C_1-C_6 алкилтиогруппы, j) C_1-C_6 алкилсульфинильной
 40 группы, k) галоген C_1-C_6 алкилсульфинильной группы, l) C_1-C_6 алкилсульфонильной
 группы, m) галоген C_1-C_6 алкилсульфонильной группы, n)
 моно C_1-C_6 алкиламиногруппы, о) ди C_1-C_6 алкиламиногруппы, где алкильные группы
 являются одинаковыми или различными, и р) C_1-C_6 алкоксикарбонильной группы, 52а)
 45 фенилсульфонильную группу, 53а) замещенную фенилсульфонильную группу,
 имеющую на кольце один или несколько одинаковых или различных заместителей,
 выбранных из а) атома галогена, б) цианогруппы, с) нитрогруппы, d) C_1-C_6 алкильной
 группы, е) галоген C_1-C_6 алкильной группы, f) C_1-C_6 алкоксигруппы, г)
 50 галоген C_1-C_6 алкоксигруппы, h) C_1-C_6 алкилтиогруппы, и)
 галоген C_1-C_6 алкилтиогруппы, j) C_1-C_6 алкилсульфинильной группы, k)
 галоген C_1-C_6 алкилсульфинильной группы, l) C_1-C_6 алкилсульфонильной группы, m)

- галогенC₁-C₆алкилсульфонильной группы, п) моноC₁-C₆алкиламиногруппы, о) диC₁-C₆алкиламиногруппы, где алкильные группы являются одинаковыми или различными, и р) C₁-C₆алкоксикарбонильной группы, 54а) диC₁-C₆алкилфосфоногруппу, где алкильные группы являются одинаковыми или различными, 55а) диC₁-C₆алкилфосфотиогруппу, где алкильные группы являются одинаковыми или различными, 56а) N-C₁-C₆алкил-N-C₁-C₆алкоксикарбониламинотиогруппу, 57а) N-C₁-C₆алкил-N-C₁-C₆алкоксикарбонилC₁-C₆алкиламинотиогруппу, 58а)
- 10 диC₁-C₆алкиламинотиогруппу, где алкильные группы являются одинаковыми или различными, 59а) C₃-C₆циклоалкилкарбонильную группу, 60а) галогенC₃-C₆циклоалкилкарбонильную группу, 61а) C₁-C₆алкилC₃-C₆циклоалкилкарбонильную группу, 62а)
- 15 галогенC₁-C₆алкилC₃-C₆циклоалкилкарбонильную группу, 63а) фенилC₁-C₆алкилкарбонильную группу, 64а) замещенную фенилC₁-C₆алкилкарбонильную группу, имеющую на кольце один или несколько
- 20 одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена, б) цианогруппы, с) нитрогруппы, d) C₁-C₆алкильной группы, е) галогенC₁-C₆алкильной группы, f) C₁-C₆алкоксигруппы, g) галогенC₁-C₆алкоксигруппы, h) C₁-C₆алкилтиогруппы, и) галогенC₁-C₆алкилтиогруппы, j) C₁-C₆алкилсульфинильной группы, к) галогенC₁-C₆алкилсульфинильной группы, l) C₁-C₆алкилсульфонильной
- 25 группы, m) галогенC₁-C₆алкилсульфонильной группы, н) моноC₁-C₆алкиламиногруппы, о) диC₁-C₆алкиламиногруппы, где алкильные группы являются одинаковыми или различными, и р) C₁-C₆алкоксикарбонильной группы, 65а) фенилC₃-C₆циклоалкилкарбонильную группу, 66а) замещенную
- 30 фенилC₃-C₆циклоалкилкарбонильную группу, имеющую на кольце один или несколько одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена, б) цианогруппы, с) нитрогруппы, d) C₁-C₆алкильной группы, е) галогенC₁-C₆алкильной группы, f) C₁-C₆алкоксигруппы, g) галогенC₁-C₆алкоксигруппы, h) C₁-C₆алкилтиогруппы, и) галогенC₁-C₆алкилтиогруппы, j) C₁-C₆алкилсульфинильной группы, к) галогенC₁-C₆алкилсульфинильной группы, l) C₁-C₆алкилсульфонильной группы, m) галогенC₁-C₆алкилсульфонильной группы, н) моноC₁-C₆алкиламиногруппы, о) диC₁-C₆алкиламиногруппы, где алкильные группы являются одинаковыми или различными, и р) C₁-C₆алкоксикарбонильной группы, 67а) C₃-C₆циклоалкилC₁-C₆алкилкарбонильную группу, 68а)
- 45 C₁-C₆алкоксиC₁-C₆алкилкарбонильную группу, 69а) галогенC₃-C₆циклоалкилC₁-C₆алкилкарбонильную группу, 70а) феноксиC₁-C₆алкоксикарбонильную группу, 71а) замещенную феноксиC₁-C₆алкоксикарбонильную группу, имеющую на кольце один или несколько
- 50 одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена, б) цианогруппы, с) нитрогруппы, d) C₁-C₆алкильной группы, е) галогенC₁-C₆алкильной группы, f) C₁-C₆алкоксигруппы, g) галогенC₁-C₆алкоксигруппы, h)

- C_1-C_6 алкилтиогруппы, и) галоген C_1-C_6 алкилтиогруппы, j) C_1-C_6 алкилсульфинильной группы, k) галоген C_1-C_6 алкилсульфинильной группы, l) C_1-C_6 алкилсульфонильной группы, m) галоген C_1-C_6 алкилсульфонильной группы, n)
- 5 моно C_1-C_6 алкиламиногруппы, о) ди C_1-C_6 алкиламиногруппы, где алкильные группы являются одинаковыми или различными, и р) C_1-C_6 алкоксикарбонильной группы, 72a) C_1-C_6 алкилкарбонилокси C_1-C_6 алкильную группу, 73a) C_1-C_6 алкилкарбонил C_1-C_6 алкилкарбонильную группу или 74a)
- 10 C_1-C_6 алкоксикарбонил C_1-C_6 алкилкарбонильную группу; R^2 представляет собой 1b) атом водорода, 2b) атом галогена, 3b) C_1-C_6 алкильную группу, 4b) галоген C_1-C_6 алкильную группу, 5b) цианогруппу, 6b) гидроксигруппу, 7b) C_1-C_6 алкоксигруппу, 8b) галоген C_1-C_6 алкоксигруппу, 9b)
- 15 C_1-C_6 алкокси C_1-C_3 алкоксигруппу, 10b) галоген C_1-C_6 алкокси C_1-C_3 алкоксигруппу, 11b) C_1-C_6 алкилтио C_1-C_3 алкоксигруппу, 12b) галоген C_1-C_6 алкилтио C_1-C_3 алкоксигруппу, 13b)
- 20 C_1-C_6 алкилсульфинил C_1-C_3 алкоксигруппу, 14b) галоген C_1-C_6 алкилсульфинил C_1-C_3 алкоксигруппу, 15b) C_1-C_6 алкилсульфонил C_1-C_3 алкоксигруппу, 16b) галоген C_1-C_6 алкилсульфонил C_1-C_3 алкоксигруппу, 17b)
- 25 моно C_1-C_6 алкиламино C_1-C_3 алкоксигруппу, 18b) ди C_1-C_6 алкиламино C_1-C_3 алкоксигруппы, где алкильные группы являются одинаковыми или различными, 19b) C_1-C_6 алкилтиогруппу, 20b) галоген C_1-C_6 алкилтиогруппу, 21b) C_1-C_6 алкилсульфинильную группу, 22b)
- 30 галоген C_1-C_6 алкилсульфинильную группу, 23b) C_1-C_6 алкилсульфонильную группу, 24b) галоген C_1-C_6 алкилсульфонильную группу, 25b) аминогруппу, 26b) моно C_1-C_6 алкиламиногруппу, 27b) ди C_1-C_6 алкиламиногруппу, где алкильные группы являются одинаковыми или различными, 28b) феноксигруппу, 29b) замещенную
- 35 феноксигруппу, имеющую на кольце один или несколько одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена, б) цианогруппы, с) нитрогруппы, d) C_1-C_6 алкильной группы, е) галоген C_1-C_6 алкильной группы, f) C_1-C_6 алкоксигруппы, g) галоген C_1-C_6 алкоксигруппы, h) C_1-C_6 алкилтиогруппы, и)
- 40 галоген C_1-C_6 алкилтиогруппы, j) C_1-C_6 алкилсульфинильной группы, k) галоген C_1-C_6 алкилсульфинильной группы, l) C_1-C_6 алкилсульфонильной группы, m) галоген C_1-C_6 алкилсульфонильной группы, n) моно C_1-C_6 алкиламиногруппы, о) ди C_1-C_6 алкиламиногруппы, где алкильные группы являются одинаковыми или различными,
- 45 и р) C_1-C_6 алкоксикарбонильной группы, 30b) фенилтиогруппу, 31b) замещенную фенилтиогруппу, имеющую на кольце один или несколько одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена, б) цианогруппы, с) нитрогруппы, d) C_1-C_6 алкильной группы, е) галоген C_1-C_6 алкильной группы, f) C_1-C_6 алкоксигруппы, g)
- 50 галоген C_1-C_6 алкоксигруппы, h) C_1-C_6 алкилтиогруппы, и) галоген C_1-C_6 алкилтиогруппы, j) C_1-C_6 алкилсульфинильной группы, k) галоген C_1-C_6 алкилсульфинильной группы, l) C_1-C_6 алкилсульфонильной группы, m)

галогенC₁-C₆алкилсульфонильной группы, н) моноC₁-C₆алкиламиногруппы, о) диC₁-C₆алкиламиногруппы, где алкильные группы являются одинаковыми или различными, и р) C₁-C₆алкоксикарбонильной группы, 32b) фенилсульфинильную группу, 33b) замещенную фенилсульфинильную группу, имеющую на кольце один или несколько одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена, б) цианогруппы, с) нитрогруппы, d) C₁-C₆алкильной группы, е) галогенC₁-C₆алкильной группы, f) C₁-C₆алкоксигруппы, г) галогенC₁-C₆алкоксигруппы, h) C₁-C₆алкилтиогруппы, и) галогенC₁-C₆алкилтиогруппы, j) C₁-C₆алкилсульфинильной группы, k) галогенC₁-C₆алкилсульфинильной группы, l) C₁-C₆алкилсульфонильной группы, m) галогенC₁-C₆алкилсульфонильной группы, н) моноC₁-C₆алкиламиногруппы, о) диC₁-C₆алкиламиногруппы, где алкильные группы являются одинаковыми или различными, и р) C₁-C₆алкоксикарбонильной группы, 34b) фенилсульфонильную группу, 35b) замещенную фенилсульфонильную группу, имеющую на кольце один или несколько одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена, б) цианогруппы, с) нитрогруппы, d) C₁-C₆алкильной группы, е) галогенC₁-C₆алкильной группы, f) C₁-C₆алкоксигруппы, г) галогенC₁-C₆алкоксигруппы, h) C₁-C₆алкилтиогруппы, и) галогенC₁-C₆алкилтиогруппы, j) C₁-C₆алкилсульфинильной группы, k) галогенC₁-C₆алкилсульфинильной группы, l) C₁-C₆алкилсульфонильной группы, m) галогенC₁-C₆алкилсульфонильной группы, н) моноC₁-C₆алкиламиногруппы, о) диC₁-C₆алкиламиногруппы, где алкильные группы являются одинаковыми или различными, и р) C₁-C₆алкоксикарбонильной группы, 36b) фенилC₁-C₆алкоксигруппу или 37b) замещенную фенилC₁-C₆алкоксигруппу, имеющую на кольце один или несколько одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена, б) цианогруппы, с) нитрогруппы, d) C₁-C₆алкильной группы, е) галогенC₁-C₆алкильной группы, f) C₁-C₆алкоксигруппы, г) галогенC₁-C₆алкоксигруппы, h) C₁-C₆алкилтиогруппы, и) галогенC₁-C₆алкилтиогруппы, j) C₁-C₆алкилсульфинильной группы, k) галогенC₁-C₆алкилсульфинильной группы, l) C₁-C₆алкилсульфонильной группы, m) галогенC₁-C₆алкилсульфонильной группы, н) моноC₁-C₆алкиламиногруппы, о) диC₁-C₆алкиламиногруппы, где алкильные группы являются одинаковыми или различными, и р) C₁-C₆алкоксикарбонильной группы;

G представляет собой 1с) C₂-C₁₀алкильную группу, 2с) галогенC₂-C₁₀алкильную группу, 3с) C₃-C₁₀алкенильную группу, 4с) галогенC₃-C₁₀алкенильную группу, 5с) C₃-C₁₀алкинильную группу, 6с) галогенC₃-C₁₀алкинильную группу, 7с) C₃-C₁₀циклоалкильную группу, 8с) замещенную C₃-C₁₀циклоалкильную группу, имеющую на кольце один или несколько одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена, б) C₁-C₆алкильной группы и с) галогенC₁-C₆алкильной группы, 9с) C₃-C₁₀циклоалкенильную группу, 10с) замещенную C₃-C₁₀циклоалкенильную группу, имеющую на кольце один или несколько одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена, б) C₁-C₆алкильной группы и с) галогенC₁-C₆алкильной группы, 11е) C₃-C₈циклоалкилC₁-C₆алкильную группу или 12с) галогенC₃-C₈циклоалкилC₁-C₆алкильную группу;

X могут быть одинаковыми или различными и представляют собой 1d) атом водорода, 2d) атом галогена, 3d) цианогруппу, 4d) нитрогруппу, 5d) C_1-C_6 алкильную группу или 6d) галоген C_1-C_6 алкильную группу;

5 n равно целому числу от 1 до 3,
к их солям и к 1,3-диметил-5-трифторметилпиразол-4-карбоновой кислоте и к ее солям.

10 В определениях замещенного пиразолкарбоксамидного производного формулы (I) и замещенного анилинового производного формулы (II) настоящего изобретения, "галоген", " C_1-C_6 алкил", " C_1-C_6 алкоксил", " C_2-C_6 алкенил", " C_2-C_6 алкинил" или "гетероциклическая группа" и тому подобное, каждый из заместителей имеет следующее значение.

15 "Галоген" или "атом галогена" означает атом хлора, атом брома, атом йода или атом фтора.

" C_1-C_6 алкил" представляет собой алкил с линейной и разветвленной цепью, имеющий 1-6 атомов углерода, такой как метил, этил, н-пропил, изопропил, н-бутил, изобутил, втор-бутил, трет-бутил, н-пентил, изопентил, неопентил, трет-пентил,
20 2-метилбутил, 1-этилпропил, н-гексил, 2-этилбутил и тому подобное.

" C_1-C_6 алкил" представляет собой алкил с линейной и разветвленной цепью, имеющий 1-8 атомов углерода, такой как метил, этил, н-пропил, изопропил, н-бутил, изобутил, втор-бутил, трет-бутил, н-пентил, изопентил, неопентил, трет-пентил,
25 2-метилбутил, 1-этилпропил, н-гексил, 2-этилбутил, н-гептил, н-октил, 2-этилгексил и тому подобное.

" C_2-C_{10} алкил" представляет собой алкил с линейной и разветвленной цепью, имеющий 2-10 атомов углерода, такой как этил, н-пропил, изопропил, н-бутил, изобутил, втор-бутил, трет-бутил, н-пентил, изопентил, неопентил, трет-пентил,
30 2-метилбутил, н-гексил, 2-этилбутил, 1-этилпропил, н-гептил, н-октил, 2-этилгексил, н-нонил, н-децил и тому подобное.

" C_3-C_6 циклоалкил" представляет собой циклический алкил, имеющий 3-6 атомов углерода, такой как циклопропил, циклобутил, циклопентил, циклогексил и тому
35 подобное.

" C_3-C_8 циклоалкил" представляет собой циклический алкил, имеющий 3-8 атомов углерода, такой как циклопропил, циклобутил, циклопентил, циклогексил, циклооктил и тому подобное.

40 " C_3-C_{10} циклоалкил" представляет собой циклический алкил, имеющий 3-10 атомов углерода, такой как циклопропил, циклобутил, циклопентил, циклогексил, циклооктил, циклодецил и тому подобное.

" C_3-C_{10} циклоалкенил" представляет собой циклический алкенил, имеющий 3-10 атомов углерода, такой как циклопропенил, циклобутенил, циклопентенил,
45 циклогексенил, циклооктенил, циклодеценил и тому подобное.

" C_1-C_3 алкокси" представляет собой алкокси, где ее алкильный остаток представляет собой алкил с линейной и разветвленной цепью, имеющий 1-3 атома углерода, такую как метокси, этокси, пропокси, изопропокси и тому подобное.

50 " C_1-C_6 алкокси" представляет собой алкокси, где алкильный остаток представляет собой указанный выше " C_1-C_6 алкил", такой как метокси, этокси, н-пропокси, изопропокси, н-бутокси, изобутокси, втор-бутокси, трет-бутокси, н-пентилокси, изопентилокси, неопентилокси, трет-пентилокси, 2-метилбутокси, 1-этилпропокси,

гексилокси, 2-этилбутокс и тому подобное.

"C₁-C₁₀ алкокси" представляет собой алкокси, где алкильный остаток представляет собой алкил с линейной и разветвленной цепью, имеющий 1-10 атомов углерода, такой как метокси, этокси, н-пропокси, изопропокси, н-бутокс, изобутокс, втор-бутокс, трет-бутокс, н-пентилокси, изопентилокси, неопентилокси, трет-пентилокси, 2-метилбутокс, 1-этилпропокси, гексилокси, 2-этилбутокс, н-гептилокси, н-октилокси, 2-этилгексилокси, н-нонилокси, н-децилокси и тому подобное.

"C₁-C₁₆ алкокси" представляет собой алкокси, где алкильный остаток представляет собой алкил с линейной и разветвленной цепью, имеющий 1-16 атомов углерода, такой как метокси, этокси, н-пропокси, изопропокси, н-бутокс, изобутокс, втор-бутокс, трет-бутокс, н-пентилокси, изопентилокси, неопентилокси, трет-пентилокси, 2-метилбутокс, 1-этилпропокси, гексилокси, 2-этилбутокс, н-гептилокси, н-октилокси, 2-этилгексилокси, н-нонилокси, н-децилокси, н-ундецилокси, н-додэцилокси, н-тридецилокси, н-тетрадецилокси, н-пентадецилокси, н-гексадецилокси и тому подобное.

"C₂-C₆ алкенил" представляет собой алкенил с линейной и разветвленной цепью, имеющий 2-6 атомов углерода, который имеет по меньшей мере одну двойную связь, такой как винил, 1-пропенил, аллил, 1-бутенил, 2-бутенил, 3-бутенил, 2-пентенил, 2-метил-1-пропенил, 2,4-пентадиенил, 3-гексенил и тому подобное.

"C₃-C₁₀ алкенил" представляет собой алкенил с линейной и разветвленной цепью, имеющий 3-10 атомов углерода, который имеет по меньшей мере одну двойную связь, такой как 1-бутенил, 2-бутенил, 3-бутенил, 2-пентенил, 2,4-пентадиенил, 3-гексенил, 3-гептенил, 3-октенил, 3-ноненил, 3-деценил и тому подобное.

"C₂-C₆ алкинил" представляет собой алкинил с линейной и разветвленной цепью, имеющий 2-6 атомов углерода, который имеет по меньшей мере одну тройную связь, такой как этинил, 2-пропинил, 1-бутинил, 2-бутинил, 3-бутинил, 2-пентинил, 3-гексинил и тому подобное.

"C₃-C₁₀ алкинил" представляет собой алкинил с линейной и разветвленной цепью, имеющий 3-10 атомов углерода, который имеет по меньшей мере одну тройную связь, такой как 1-бутинил, 2-бутинил, 3-бутинил, 2-пентинил, 3-гексинил, 3-гептинил, 3-октинил, 3-нонинил, 3-децинил и тому подобное.

Числа в "C₂-C₆", "C₃-C₁₀" и тому подобное, показывают диапазон числа атомов углерода, такой как 2-6 атомов углерода и 3-10 атомов углерода.

Кроме того, рассмотренные выше определения могут применяться к группам, к которым присоединены приведенные выше заместители. Например, "галогенC₁-C₆ алкил" означает алкильную группу с линейной или разветвленной цепью, имеющую 1-6 атомов углерода, которая замещена одним или несколькими одинаковыми или различными атомами галогена, такую как хлорметил, 2-хлорэтил, 2,2,2-трихлорэтил, 3-хлорпропил, 2-хлор-1,1-диметилэтил, 1-бром-1-метилэтил, дифторметил, трифторметил, 2,2,2-трифторэтил, перфторгексил и тому подобное.

"Гетероциклическая группа" и "гетероциклил" представляют собой 5- или 6-членные гетероциклические группы, имеющие один или несколько гетероатомов, выбранных из атома кислорода, атома серы и атома азота, включая, например, пиридинильную группу, пиридин-N-оксидную группу, пиримидинильную группу, фурильную группу, тетрагидрофурильную группу, тиенильную группу, тетрагидротиенильную группу, тетрагидропиранильную группу, тетрагидротиопиранильную группу, оксазолильную группу, изоксазолильную группу, оксадиазолильную группу, тиазолильную группу,

изотиазолильную группу, тиadiaзолильную группу, имидазолильную группу, триазолильную группу и пиразолильную группу.

5 Соль замещенного пиразолкарбоксамидного производного, представленного формулой (I) настоящего изобретения, включает соль щелочного металла (лития, натрия, калия и тому подобное); соль щелочно-земельного металла (кальция, магния и
10 тому подобное); соль аммония и соль органического амина (метиламина, триэтиламина, диэтиламина, пиперидина, пиридина и тому подобное) или кислотно-аддитивную соль. Кислотно-аддитивная соль включает, например, карбоксилат, такой как ацетат, пропионат, оксалат, трифторацетат, бензоат и тому
15 подобное; сульфонат, такой как метансульфонат, трифторметансульфонат, п-толуолсульфонат и тому подобное; соль неорганической кислоты, такую как гидрохлорид, сульфат, нитрат, карбонат и тому подобное.

В замещенных пиразолкарбоксамидных производных, представленных
15 формулой (I) настоящего изобретения, R¹ предпочтительно представляет собой 1а) атом водорода, 2а) C₁-C₆ алкильную группу, 3а) галогенC₁-C₆ алкильную группу, 4а) C₁-C₆ алкилкарбонильную группу, 5а) галогенC₁-C₆ алкилкарбонильную группу, 6а) C₂-C₆ алкенилкарбонильную группу, 13а) C₂-C₆ алкенильную группу, 17а)
20 C₁-C₁₀ алкоксиC₁-C₆ алкильную группу, 18а) галогенC₁-C₆ алкоксиC₁-C₆ алкильную группу, 19а) C₂-C₆ алкенилоксиC₁-C₆ алкильную группу, 20а) C₁-C₆ алкоксиC₁-C₆ алкоксиC₁-C₆ алкильную группу, 29а)
25 фенилC₁-C₆ алкоксиC₁-C₆ алкильную группу, 30а) замещенную фенилC₁-C₆ алкоксиC₁-C₆ алкильную группу, имеющую на кольце один или несколько одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена, б) цианогруппы, с) нитрогруппы, d) C₁-C₆ алкильной группы, е) галогенC₁-C₆ алкильной
30 группы, f) C₁-C₆ алкоксигруппы, g) галогенC₁-C₆ алкоксигруппы, h) C₁-C₆ алкилтиогруппы, i) галогенC₁-C₆ алкилтиогруппы, j) C₁-C₆ алкилсульфинильной группы, k) галогенC₁-C₆ алкилсульфинильной группы, l) C₁-C₆ алкилсульфонильной группы, m) галогенC₁-C₆ алкилсульфонильной группы, n)
35 моноC₁-C₆ алкиламиногруппы, о) диC₁-C₆ алкиламиногруппы, где алкильные группы являются одинаковыми или различными, и р) C₁-C₆ алкоксикарбонильной группы, 31а) C₁-C₁₆ алкоксикарбонильную группу, 32а) C₁-C₆ алкоксиC₁-C₆ алкоксикарбонильную группу, 33а)
40 галогенC₁-C₆ алкоксикарбонильную группу, 34а) C₂-C₆ алкенилоксикарбонильную группу, 35а) C₁-C₆ алкилтиокарбонильную группу, 42а) фенилC₁-C₆ алкильную группу, 43а) замещенную фенилC₁-C₆ алкильную группу, имеющую на кольце один или несколько одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена,
45 б) цианогруппы, с) нитрогруппы, d) C₁-C₆ алкильной группы, е) галогенC₁-C₆ алкильной группы, f) C₁-C₆ алкоксигруппы, g) галогенC₁-C₆ алкоксигруппы, h) C₁-C₆ алкилтиогруппы, i) галогенC₁-C₆ алкилтиогруппы, j) C₁-C₆ алкилсульфинильной группы, k)
50 галогенC₁-C₆ алкилсульфинильной группы, l) C₁-C₆ алкилсульфонильной группы, m) галогенC₁-C₆ алкилсульфонильной группы, n) моноC₁-C₆ алкиламиногруппы, о) диC₁-C₆ алкиламиногруппы, где алкильные группы являются одинаковыми или различными,

- группы, е) галоген C_1-C_6 алкильной группы, ф) C_1-C_6 алкоксигруппы, г)
галоген C_1-C_6 алкоксигруппы, h) C_1-C_6 алкилтиогруппы, i)
галоген C_1-C_6 алкилтиогруппы, j) C_1-C_6 алкилсульфинильной группы, к)
5 галоген C_1-C_6 алкилсульфинильной группы, л) C_1-C_6 алкилсульфонильной группы, м)
галоген C_1-C_6 алкилсульфонильной группы, н) моно C_1-C_6 алкиламиногруппы, о) ди C_1-C_6
алкиламиногруппы, где алкильные группы являются одинаковыми или различными,
и р) C_1-C_6 алкоксикарбонильной группы, 58а) ди C_1-C_6 алкиламинотиогруппу, где
10 алкильные группы являются одинаковыми или различными, 59а)
 C_3-C_6 циклоалкилкарбонильную группу, 61а)
 C_1-C_6 алкил C_3-C_6 циклоалкилкарбонильную группу, 63а)
фенил C_1-C_6 алкилкарбонильную группу, 64а) замещенную
15 фенил C_1-C_6 алкилкарбонильную группу, имеющую на кольце один или несколько
одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена, б)
цианогруппы, с) нитрогруппы, d) C_1-C_6 алкильной группы, е) галоген C_1-C_6 алкильной
группы, ф) C_1-C_6 алкоксигруппы, г) галоген C_1-C_6 алкоксигруппы, h)
20 C_1-C_6 алкилтиогруппы, i) галоген C_1-C_6 алкилтиогруппы, j) C_1-C_6 алкилсульфинильной
группы, к) галоген C_1-C_6 алкилсульфинильной группы, л) C_1-C_6 алкилсульфонильной
группы, м) галоген C_1-C_6 алкилсульфонильной группы, н)
25 моно C_1-C_6 алкиламиногруппы, о) ди C_1-C_6 алкиламиногруппы, где алкильные группы
являются одинаковыми или различными, и р) C_1-C_6 алкоксикарбонильной группы, 65а)
фенил C_3-C_6 циклоалкилкарбонильную группу, 66а) замещенную
фенил C_3-C_6 циклоалкилкарбонильную группу, имеющую на кольце один или
30 несколько одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена,
б) цианогруппы, с) нитрогруппы, d) C_1-C_6 алкильной группы, е)
галоген C_1-C_6 алкильной группы, ф) C_1-C_6 алкоксигруппы, г)
галоген C_1-C_6 алкоксигруппы, h) C_1-C_6 алкилтиогруппы, i)
35 галоген C_1-C_6 алкилтиогруппы, j) C_1-C_6 алкилсульфинильной группы, к)
галоген C_1-C_6 алкилсульфинильной группы, л) C_1-C_6 алкилсульфонильной группы, м)
галоген C_1-C_6 алкилсульфонильной группы, н) моно C_1-C_6 алкиламиногруппы, о) ди C_1-C_6
алкиламиногруппы, где алкильные группы являются одинаковыми или различными,
40 и р) C_1-C_6 алкоксикарбонильной группы, 68а) C_1-C_6 алкокси C_1-C_6 алкилкарбонильную
группу, 73а) C_1-C_6 алкилкарбонил C_1-C_6 алкилкарбонильную группу или 74а)
 C_1-C_6 алкоксикарбонил C_1-C_6 алкилкарбонильную группу, и более предпочтительно, 1а)
атом водорода, 4а) C_1-C_6 алкилкарбонильную группу, 5а)
45 галоген C_1-C_6 алкилкарбонильную группу, 17а) C_1-C_{10} алкокси C_1-C_6 алкильную группу,
18а) галоген C_1-C_6 алкокси C_1-C_6 алкильную группу, 31а) C_1-C_{16} алкоксикарбонильную
группу, 33а) галоген C_1-C_6 алкоксикарбонильную группу или 68а)
 C_1-C_6 алкокси C_1-C_6 алкилкарбонильную группу.
50 R^2 предпочтительно представляет собой 1б) атом водорода, 2б) атом галогена, 6б)
гидроксигруппу, 7б) C_1-C_6 алкоксигруппу или 8б) галоген C_1-C_6 алкоксигруппу, и более
предпочтительно, 1б) атом водорода или 7б) C_1-C_6 алкоксигруппу.

G предпочтительно представляет собой 1с) C_2-C_{10} алкильную группу, 3с) C_3-C_{10} алкенильную группу или 11е) C_3-C_8 циклоалкил C_1-C_6 алкильную группу, и более предпочтительно, 1с) C_2-C_{10} алкильную группу.

5 X предпочтительно представляет собой 1d) атом водорода, 2d) атом галогена или 5d) C_1-C_6 алкильную группу, и более предпочтительно, 1d) атом водорода.

Z предпочтительно представляет собой атом кислорода.

10 Y^1 предпочтительно представляет собой 2е) C_1-C_6 алкильную группу, 3е) галоген C_1-C_6 алкильную группу или 4е) C_2-C_6 алкенильную группу, и более предпочтительно, 2е) C_1-C_6 алкильную группу.

15 Y^2 предпочтительно представляет собой 1f) атом водорода, 2f) атом галогена, 9f) C_1-C_6 алкильную группу, 10f) галоген C_1-C_6 алкильную группу или 31f) C_1-C_6 алкилтиогруппу, и более предпочтительно, 1f) атом водорода, 2f) атом галогена, 9f) C_1-C_6 алкильную группу или 10) галоген C_1-C_6 алкильную группу.

m предпочтительно равно 2.

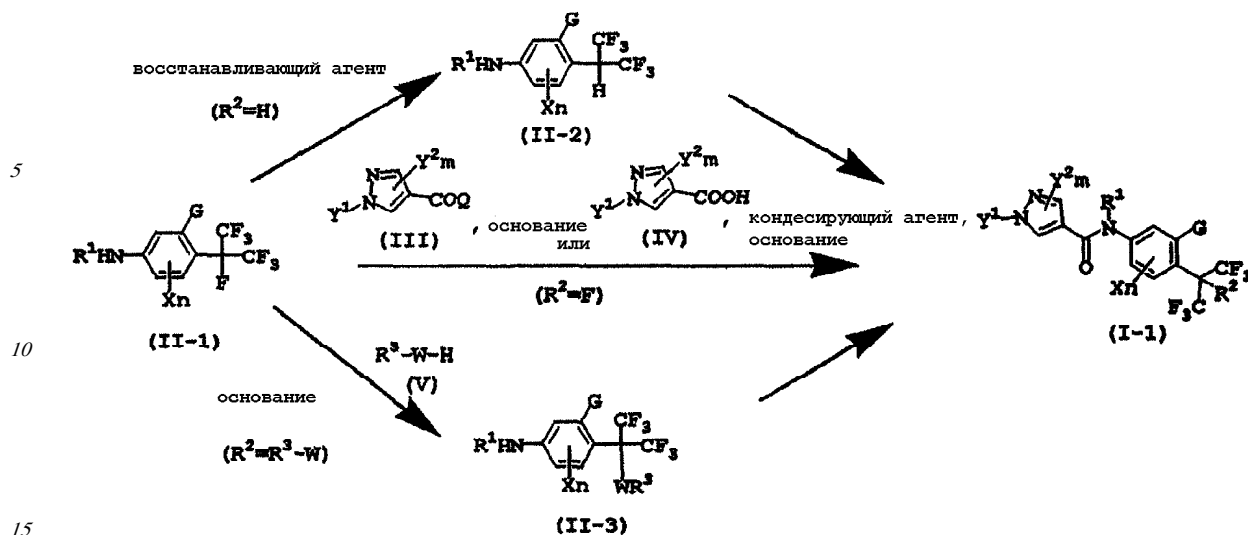
20 В дополнение, соль замещенного анилинового производного, представленного формулой (II), предпочтительно представляет собой кислотнo-аддитивную соль, включая, например, карбоксилат, такой как ацетат, пропионат, оксалат, трифторацетат, бензоат и тому подобное; сульфонат, такой как метансульфонат, трифторметансульфонат, п-толуолсульфонат и тому подобное; соль неорганической 25 кислоты, такую как гидрохлорид, сульфат, нитрат, карбонат и тому подобное.

30 Соль 1,3-диметил-5-трифторметилпиразол-4-карбоновой кислоты настоящего изобретения включает соль щелочного металла (лития, натрия, калия и тому подобное); соль щелочноземельного металла (кальция, магния и тому подобное); соль аммония и соль органического амина (метиламина, триэтиламина, диэтанолamina, пиперидина, пиридина и тому подобное).

35 Замещенное пиразолкарбоксамидное производное, представленное формулой (I), или его промежуточное соединение, то есть замещенное анилиновое производное, представленное формулой (II), настоящего изобретения, может иметь один или несколько асимметричных центров в структурной формуле, и кроме того, могут присутствовать два или более оптических изомеров и диастереомеров. Как следствие, настоящее изобретение полностью охватывает каждый оптический изомер и смеси с 40 любым их соотношением. В дополнение, замещенное пиразолкарбоксамидное производное, представленное формулой (I), настоящего изобретения может иметь два типа геометрических изомеров, полученных из двойной связи C-C в структурной формуле. Настоящее изобретение охватывает все геометрические изомеры и смеси, содержащие их, при любом соотношении. Кроме того, настоящее изобретение охватывает их гидраты.

45 Репрезентативные способы получения замещенного пиразолкарбоксамидного производного, представленного формулой (I), и замещенного анилинового производного, представленного формулой (II), как его промежуточного соединения, иллюстрируется ниже, но настоящее изобретение не должно рассматриваться как ограничиваемое ими.

50 **Способ получения 1**



15 (где G, R^1 , X, n, Y^1 , Y^2 и m являются такими, как определено выше, и R^3 представляет собой атом водорода, C_1 - C_6 алкильную группу, галоген C_1 - C_6 алкильную группу, фенильную группу, замещенную фенильную группу или фенил C_1 - C_4 алкильную группу; W представляет собой -O-, -S- или -N(R^4)-, где R^4 представляет собой атом водорода, C_1 - C_6 алкильную группу, галоген C_1 - C_6 алкильную группу, фенильную группу, замещенную фенильную группу или фенил C_1 - C_4 алкильную группу, и Q представляет собой атом галогена или C_1 - C_6 алкоксильную группу).

20

25

30 Среди замещенных пиразолкарбоксанилидных производных, представленных формулой (I), замещенное пиразолкарбоксанилидное производное (I-1), где Z представляет собой O, и R^2 представляет собой атом водорода, атом фтора или WR^3 , где W и R^3 являются такими, как определено выше, может быть получено путем взаимодействия анилинового производного, представленного формулами (II-1)-(II-3), с галоидангидридом пиразолкарбоновой кислоты или эфиром пиразолкарбоновой кислоты, представленной формулой (III), в присутствии или в отсутствие основания, в инертном растворителе, или путем взаимодействия анилинового производного, представленного формулами (II-1)-(II-3), с пиразолкарбоновой кислотой, представленной формулой (IV), в присутствии конденсирующего агента, в присутствии или в отсутствие основания, в инертном растворителе, и могут быть использованы любые обычные способы получения амидов.

35

40

Анилиновое производное, представленное формулой (II-2), может быть получено восстановлением анилинового производного, представленного формулой (II-1), в присутствии восстанавливающего агента, в инертном растворителе.

45 Анилиновое производное, представленное формулой (II-3), может быть получено путем взаимодействия анилинового производного, представленного формулой (II-1), со спиртовым производным, тиольным производным или аминовым производным, представленным формулой (V), в присутствии или в отсутствие основания, в инертном растворителе.

Формула (II-1) \rightarrow формула (II-2)

50 Пример восстанавливающего агента, который может быть использован в настоящей реакции, включает гидриды металлов, такие как литийалюминийгидрид, борогидрид лития, борогидрид натрия, диизобутилалюминийгидрид, натрий-бис-(2-метоксиэтокси)алюминийгидрид и тому подобное, металл, такой как

литий и тому подобное, или соли металлов и тому подобное. Количество восстанавливающего агента, который может быть использован, выбирают соответствующим образом в пределах от эквивалентного количества до избыточного количества по отношению к анилиновому производному, представленного формулой (II-1).

Примеры инертного растворителя, который может быть использован в настоящей реакции и может быть любым, пока он заметно не тормозит ход настоящей реакции, включают ароматические углеводороды, такие как бензол, толуол, ксилол и тому подобное; галогенированные углеводороды, такие как метилхлорид, хлороформ, четыреххлористый углерод и тому подобное; галогенированные ароматические углеводороды, такие как хлорбензол, дихлорбензол и тому подобное; простые эфиры с прямой цепью или циклические, такие как простой диэтиловый эфир, диоксан, тетрагидрофуран и тому подобное, или диметилсульфоксид и тому подобное, и такие инертные растворители могут быть использованы по отдельности или в комбинации двух или нескольких видов.

Температура реакции может находиться в пределах от комнатной температуры до температуры кипения инертного растворителя, который может быть использован, и время реакции может находиться в пределах от нескольких минут до 50 часов, в зависимости от масштаба реакции и температуры реакции.

После завершения реакции желаемое соединение может быть выделено из реакционной смеси обычными методами, и желаемое соединение может быть подвергнуто очистке с использованием перекристаллизации или колоночной хроматографии и тому подобное, если это необходимо. Желаемое соединение может быть использовано на последующей стадии реакции без выделения из реакционной смеси.

Формула (II-1) → формула (II-3)

Пример основания, которое может быть использовано в настоящей реакции, включает гидриды металлов, такие как гидрид лития, гидрид натрия, гидрид калия и тому подобное; алкоголяты металлов, такие как метоксид натрия, этоксид натрия, трет-бутоксид калия и тому подобное; и металлоалкилы, такие как н-бутиллитий, втор-бутиллитий, трет-бутиллитий и тому подобное. Количество основания, которое может быть использовано, может быть выбрано соответствующим образом, в пределах от эквивалентного количества до избыточного количества по отношению к анилиновому производному, представленному формулой (II-1).

Примеры инертного растворителя, который может быть использован в настоящей реакции и может быть любым, пока он заметно не тормозит ход настоящей реакции, включают ароматические углеводороды, такие как бензол, толуол, ксилол и тому подобное; спирты, такие как метанол, этанол и тому подобное; простые эфиры с прямой цепью или циклические, такие как простой диэтиловый эфир, 1,2-диметоксиэтан, диоксан, тетрагидрофуран и тому подобное, и такие инертные растворители могут быть использованы по отдельности или в комбинации двух или нескольких видов.

Температура реакции может находиться в пределах от -70°C до температуры кипения инертного растворителя, который может быть использован, и время реакции может находиться в пределах от нескольких минут до 50 часов, в зависимости от масштаба реакции и температуры реакции.

После завершения реакции, желаемое соединение может быть выделено из реакционной смеси обычными методами, и желаемое соединение может быть

подвергнуто очистке с использованием перекристаллизации или колоночной хроматографии и тому подобное, если это необходимо. Желаемое соединение может быть использовано на последующей стадии реакции без выделения из реакционной смеси.

5 Формула (II-1), (II-2) или (II-3) → формула (I-1)

Примеры конденсирующего агента, который может быть использован в настоящей реакции, включают диэтилцианофосфат (DEPC), карбонилдиимидазол (CDI), 1,3-дициклогексилкарбодиимид (DCC), хлорформиаты, 2-хлор-1-метилпиридиниййодид
10 и тому подобное.

В качестве основания, которое может быть использовано в настоящей реакции, включено неорганическое основание или органическое основание, и примеры неорганического основания включают гидроксиды щелочного металла, такие как гидроксид натрия, гидроксид калия и тому подобное; гидриды щелочного металла,
15 такие как гидрид натрия, гидрид калия и тому подобное; соли щелочного металла и спирта, такие как этоксид натрия, трет-бутоксид калия и тому подобное; карбонаты, такие как карбонат натрия, карбонат калия, бикарбонат натрия и тому подобное; и пример органических оснований включает триэтиламин, пиридин, DBU и тому
20 подобное. Количество основания, которое может быть использовано, может быть выбрано в пределах от эквивалентного количества до избыточного количества по отношению к производному пиразолкарбоновой кислоты, представленному формулой (III) или (IV).

Примеры инертного растворителя, который может быть использован в настоящей реакции и может быть любым, пока он заметно не тормозит хода настоящей реакции, включают ароматические углеводороды, такие как бензол, толуол, ксилол и тому
25 подобное; галогенированные углеводороды, такие как метилхлорид, хлороформ, четыреххлористый углерод и тому подобное; галогенированные ароматические углеводороды, такие как хлорбензол, дихлорбензол и тому подобное; простые эфиры с прямой цепью или циклические, такие как простой диэтиловый эфир, диоксан,
30 тетрагидрофуран и тому подобное; сложные эфиры, такие как этилацетат и тому подобное; амиды, такие как диметилформаид, диметилацетамид и тому подобное; диметилсульфоксид; 1,3-диметил-2-имидазолидинон; ацетон, метилэтилкетон и тому
35 подобное. Такие инертные растворители могут быть использованы по отдельности или в комбинации двух или нескольких видов.

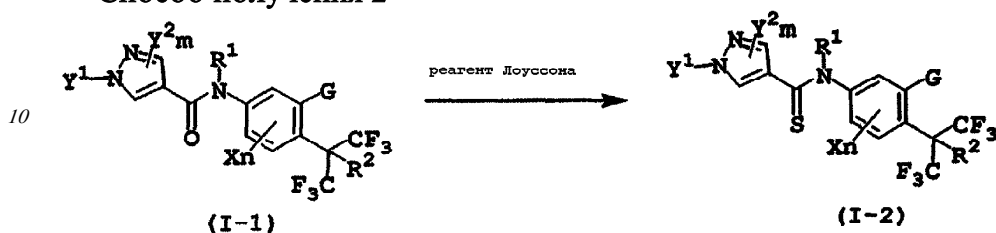
Поскольку настоящая реакция является эквимольной реакцией, каждый реагент может быть использован в равном молярном количестве, однако любой из реагентов
40 также может быть использован в избытке. Температура реакции может находиться в пределах от комнатной температуры до температуры кипения инертного растворителя, который может быть использован, и время реакции может находиться в пределах от нескольких минут до 48 часов, в зависимости от масштаба реакции и температуры реакции.

45 После завершения реакции желаемое соединение может быть выделено из реакционной смеси обычными методами, и желаемое соединение может быть подвергнуто очистке с использованием перекристаллизации или колоночной хроматографии и тому подобное, если это необходимо.

50 Анилиновое производное, представленное формулой (II-1), в качестве исходного вещества настоящей реакции, может быть получено в соответствии со способом получения, описанным в заявках на патент Японии JP-A-11-302233, JP-A-2001-122836 или JP-A-2006-8675.

Производное пиразолкарбоновой кислоты, представленное формулами (III) или (IV), может быть получено в соответствии с несколькими способами, описанными в известной литературе (например, Aust. J. Chem., 1983, 36, 135-147, Synthesis, 1986, 753-755, заявки на патент Японии JP-A-52-87168, JP-A-63-452 64, JP-A-1-106866 и тому подобное).

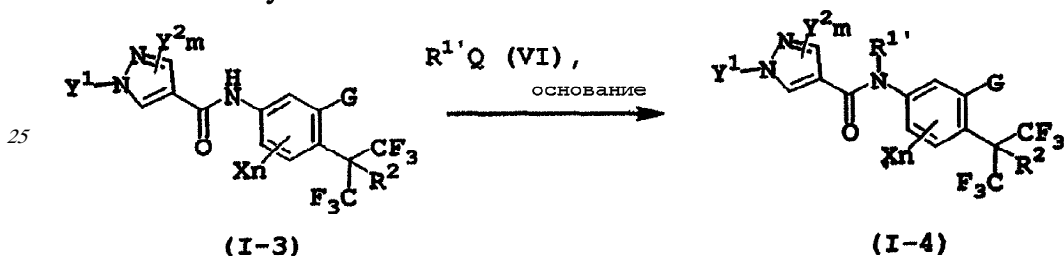
Способ получения 2



(где G, R¹, R², X, n, Y¹, Y² и m являются такими, как определено выше).

Среди замещенных пиразолкарбоксамидных производных, представленных формулой (I), замещенное пиразолкарбоксамидное производное (1-2), где Z представляет собой S, может быть получено путем взаимодействия амидного производного, представленного (I-1), с реагентом Лоуссона в соответствии с известным способом (Tetrahedron Lett., 21 (42), 4061 (1980)).

Способ получения 3



(где G, R², X, n, Y¹, Y², m и Q являются такими, как определено выше, и R^{1'} является таким, как определено выше, за исключением атома водорода).

Среди замещенных пиразолкарбоксамидных производных, представленных формулой (I), замещенное пиразолкарбоксамидное производное (I-4), где R¹ является иным, чем атом водорода, может быть получено путем взаимодействия амидного производного, представленного формулой (I-3), с галогенидным производным или сложноэфирным производным, представленным формулой (VI), в присутствии или в отсутствие основания, в инертном растворителе.

Примеры основания, которое может быть использовано в настоящей реакции, включают гидроксиды металлов, такие как гидроксид натрия, гидроксид калия и тому подобное; карбонаты, такие как карбонат натрия, карбонат калия, бикарбонат натрия и тому подобное; гидриды металлов, такие как гидрид лития, гидрид натрия, гидрид калия и тому подобное; алкоголяты металлов, такие как метоксид натрия, этоксид натрия, трет-бутоксид калия и тому подобное; алкилметаллы, такие как н-бутиллитий, втор-бутиллитий, трет-бутиллитий и тому подобное. Количество основания, которое может быть использовано, может быть выбрано соответствующим образом в пределах от эквивалентного количества до избыточного количества по отношению к амидному производному, представленному формулой (I-3).

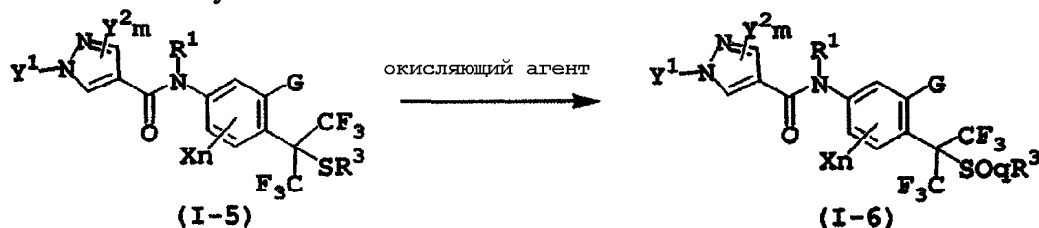
Примеры инертного растворителя, который может быть использован в настоящей реакции и может быть любым, пока он заметно не тормозит ход настоящей реакции, включают ароматические углеводороды, такие как бензол, толуол, ксилол и тому

подобное; спирты, такие как метанол, этанол и тому подобное; простые эфиры с прямой цепью или циклические, такие как простой диэтиловый эфир, 1,2-диметоксиэтан, диоксан, тетрагидрофуран и тому подобное; амиды, такие как диметилформамид, диметилацетамид и тому подобное; диметилсульфоксид; 1,3-диметил-2-имидазолидинон и тому подобное. Такие инертные растворители могут быть использованы по отдельности или в комбинации двух или нескольких видов.

Температура реакции может находиться в пределах от -70°C до температуры кипения инертного растворителя, который может быть использован, и время реакции может находиться в пределах от нескольких минут до 50 часов, в зависимости от масштаба реакции и температуры реакции.

После завершения реакции желаемое соединение может быть выделено из реакционной смеси обычными методами, и желаемое соединение может быть подвергнуто очистке с использованием перекристаллизации или колоночной хроматографии и тому подобное, если это необходимо.

Способ получения 4



(где G , R^1 , R^3 , X , n , Y^1 , Y^2 и m являются такими, как определено выше, и q равно 1 или 2).

Замещенные пиразолкарбоксамидные производные, представленные формулой (I-6), могут быть получены путем взаимодействия сульфидного производного, представленного формулой (I-5), которое может быть получено по способу получения 1, с окисляющим агентом, в присутствии инертного растворителя.

Примеры инертного растворителя, который может быть использован в настоящей реакции, включают галогенированные углеводороды, такие как метиленхлорид, хлороформ и тому подобное; ароматические углеводороды, такие как толуол, ксилол и тому подобное; галогенированные ароматические углеводороды, такие как фторбензол, хлорбензол, дихлорбензол и тому подобное; кислоты, такие как уксусная кислота и тому подобное; спирты, такие как метанол, этанол, пропанол и тому подобное.

Примеры окисляющего агента включают *m*-пероксихлорбензойную кислоту, перуксусную кислоту, метапериодат калия, гидроперсульфат калия (оксон), перекись водорода и тому подобное. Количество окисляющего агента, который может быть использован, может быть выбрано соответствующим образом в пределах от 0,5 до 3 эквивалентов по отношению к сульфидному производному, представленному формулой (I-5).

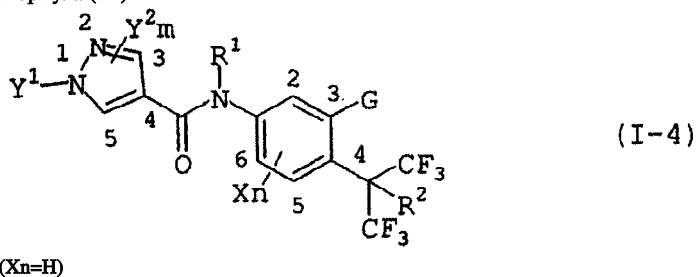
Температура реакции может находиться в пределах от -50°C до температуры кипения инертного растворителя, который может быть использован, и время реакции может находиться в пределах от нескольких минут до 24 часов, в зависимости от масштаба реакции и температуры реакции.

После завершения реакции желаемое соединение может быть выделено из реакционной смеси обычными методами, и желаемое соединение может быть подвергнуто очистке с использованием перекристаллизации или колоночной хроматографии и тому подобное, если это необходимо.

Конкретные соединения замещенных пиразолкарбоксамидных производных, представленных формулой (I), проиллюстрированы в таблицах 1 и 2, конкретные соединения замещенных анилиновых производных, представленных формулой (II), проиллюстрированы в таблице 3, и замещенные производные пиразолкарбоновой кислоты, представленные формулой (IV), проиллюстрированы в таблице 4, однако настоящее изобретение не должно рассматриваться как ограничиваемое ими.

В столбце "свойство" таблицы 1 и таблицы 2 показана температура плавления (°C) или коэффициент преломления (n_D (°C)) и для соединений, описанных как аморфные или пастообразные, их данные ¹H-ЯМР показаны в таблице 5. В таблицах, "n-" означает нормальный, и "i-" означает изо, "t-" означает третичный, "c-" означает цикло, "Me" означает метильную группу, "Et" означает этильную группу, "Pr" означает пропильную группу, "Bu" означает бутильную группу, "Pen" означает пентильную группу, "Hex" означает гексильную группу, "Ph" означает фенильную группу, "Bn" означает бензильную группу, "Ac" означает ацетильную группу и "Pyr" означает пиразинильную группу.

Таблица 1
Формула (I-4)



(Xn=H)

No.	G	Y ¹	Y ² _m	R ¹	R ²	Свойства
1-1	Et	Me	3,5-Me ₂	H	H	72-75
1-2	Et	Me	3,5-Me ₂	Ac	H	
1-3	Et	Me	3,5-Me ₂	H	OMe	129-131
1-4	Et	Me	3,5-Me ₂	Ac	OMe	1,5028(25,4)
1-5	Et	Me	3,5-Me ₂	COEt	OMe	
1-6	Et	Me	3,5-Me ₂	CO-c-Pr	OMe	118,8-121,6
1-7	Et	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ OMe	OMe	
1-8	Et	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ OEt	OMe	1,4889(24,2)
1-9	Et	Me	3,5-Me ₂	COOMe	OMe	
1-10	Et	Me	3,5-Me ₂	COOEt	OMe	77,2-79,2
1-11	Et	Me	3,5-Me ₂	COO-n-Pr	OMe	
1-12	Et	Me	3,5-Me ₂	COO-i-Bu	OMe	1,4895(25,4)
1-13	Et	Me	3,5-Me ₂	H	OEt	110-113
1-14	Et	Me	3,5-Me ₂	Ac	OEt	
1-15	Et	Me	3,5-Me ₂	COEt	OEt	90-91
1-16	Et	Me	3,5-Me ₂	CO-c-Pr	OEt	119-120
1-17	Et	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ OMe	OEt	
1-18	Et	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ OEt	OEt	
1-19	Et	Me	3,5-Me ₂	COOMe	OEt	
1-20	Et	Me	3,5-Me ₂	COOEt	OEt	
1-21	Et	Me	3,5-Me ₂	COO-n-Pr	OEt	

RU 2 375 348 C1

5	1-22	Et	Me	3,5-Me ₂	COO-i-Bu	OEt	
	1-23	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	H	1,4768(21,8)
	1-24	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	H	132-134
	1-25	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OMe	57-60
	1-26	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OMe	1,4736(24,6)
	1-27	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	COEt	OMe	134-135
	1-28	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-c-Pr	OMe	1,4830(26,2)
10	1-29	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ OMe	OMe	
	1-30	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ OEt	OMe	
	1-31	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOMe	OMe	128-130
	1-32	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOEt	OMe	1,4697(25,9)
15	1-33	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	COO-n-Pr	OMe	
	1-34	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	COO-i-Bu	OMe	1,4681(26,2)
	1-35	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OEt	142-145
	1-36	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OEt	1,4720(24,5)
	1-37	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	COEt	OEt	1,4710(26,9)
20	1-38	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	co-c-Pr	OEt	
	1-39	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ OMe	OEt	

25	1-40	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ OEt	OEt	
	1-41	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOMe	OEt	
	1-42	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOEt	OEt	
	1-43	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	COO-n-Pr	OEt	
	1-44	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	COO-i-Bu	OEt	
30	1-45	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	H	H	167-168
	1-46	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	Ac	H	
	1-47	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	H	OMe	184-185
	1-48	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	Ac	OMe	1,4953(25,0)
35	1-49	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	COEt	OMe	1,4982(34,2)
	1-50	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	CO-c-Pr	OMe	
	1-51	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ OMe	OMe	1,4979(22,1)
	1-52	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ OEt	OMe	1,4942(22,7)
40	1-53	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	COOMe	OMe	1,4980(22,7)
	1-54	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	COOEt	OMe	1,4952(23,0)
	1-55	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	COO-n-Pr	OMe	
	1-56	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	COO-i-Bu	OMe	1,4933(23,2)
45	1-57	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	H	OEt	178-179
	1-58	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	Ac	OEt	
	1-59	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	COEt	OEt	1,4980(22,7)
	1-60	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	CO-c-Pr	OEt	
50	1-61	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ OMe	OEt	
	1-62	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ OEt	OEt	
	1-63	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	COCMe	OEt	
	1-64	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	COOEt	OEt	

RU 2 375 348 C1

	1-65	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	COO-n-Pr	OEt	
	1-66	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	COO-i-Bu	OEt	
	1-67	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	H	131-133
5	1-68	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	H	
	1-69	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OMe	124
	1-70	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OMe	1,4711(25,6)
	1-71	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COEt	OMe	1,4700(26,8)
10	1-72	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-c-Pr	OMe	1,4795(25,5)
	1-73	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ OMe	OMe	
	1-74	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ OEt	OMe	1,4658(26,9)
	1-75	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOMe	OMe	126-128
15	1-76	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOEt	OMe	1,4671(26,9)
	1-77	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COO-n-Pr	OMe	
	1-78	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COO-i-Bu	OMe	1,4645(26,9)
	1-79	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OEt	
	1-80	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OEt	
20	1-81	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COEt	OEt	
	1-82	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-c-Pr	OEt	
	1-83	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ OMe	OEt	
	1-84	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ OEt	OEt	
25	1-85	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOMe	OEt	
	1-86	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOEt	OEt	
	1-87	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COO-n-Pr	OEt	
	1-88	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COO-i-Bu	OEt	
30	1-89	n-Bu	Me	3,5-Me ₂	H	H	150-151,5
	1-90	n-Bu	Me	3,5-Me ₂	Ac	H	
	1-91	n-Bu	Me	3,5-Me ₂	H	OMe	196-197
	1-92	n-Bu	Me	3,5-Me ₂	Ac	OMe	
35	1-93	n-Bu	Me	3,5-Me ₂	H	OEt	
	1-94	n-Bu	Me	3,5-Me ₂	Ac	OEt	
	1-95	n-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	H	83-85
40	1-96	n-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	H	
	1-97	n-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OMe	
	1-98	n-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OMe	
	1-99	n-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OEt	
45	1-100	n-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OEt	
	1-101	i-Bu	Me	3-Me	H	H	141-144
	1-102	i-Bu	Me	3-Me	Et	OMe	1,4916(23,7)
	1-103	i-Bu	Me	3-Me	Ac	OMe	1,4961(26,4)
	1-104	i-Bu	Me	3-Me	COEt	OMe	1,4973(26,2)
	1-105	i-Bu	Me	3-Me	CO-c-Pr	OMe	1,5014(25,5)
50	1-106	i-Bu	Me	3-Me	CO(4-Me-Ph)	OMe	аморфный
	1-107	i-Bu	Me	3-Me	CO(4-NO ₂ -Ph)	OMe	аморфный
	1-108	i-Bu	Me	3-Me	COOMe	OMe	95,5-97,8
	1-109	i-Bu	Me	3-Me	COOEt	OMe	84,6-86,2

RU 2 375 348 C1

	1-110	i-Bu	Me	3-Me	COO-n-Pr	OMe	86,7-88,4
	1-111	i-Bu	Me	3-Me	COO-i-Bu	OMe	91,8-94,0
	1-112	i-Bu	Me	3-Me	CH ₂ OMe	OMe	1,4919(24,0)
5	1-113	i-Bu	Me	3-Me	CH ₂ OEt	OMe	1,4920(24,4)
	1-114	i-Bu	Me	3-CF ₃	H	H	172-174
	1-115	i-Bu	Me	3-CF ₃	AC	H	
	1-116	i-Bu	Me	3-CF ₃	H	OMe	аморфный
10	1-117	i-Bu	Me	3-CF ₃	Ac	OMe	
	1-118	i-Bu	Me	3-CF ₃	H	OEt	
	1-119	i-Bu	Me	3-CF ₃	Ac	OEt	
	1-120	i-Bu	Et	3-CF ₃	H	H	175-176
	1-121	i-Bu	Me	5-CF ₃	H	H	155-156
15	1-122	i-Bu	Me	5-SMe	H	H	107-110
	1-123	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	H	H	148-151
	1-124	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	SO ₂ (4-F-Ph)	H	аморфный
	1-125	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	AC	H	1,5021(22,5)
20	1-126	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COEt	H	143,1-148,8
	1-127	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COPh	H	51,3-65,3
	1-128	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COCH ₂ CMe ₃	H	1,4859(22,0)
	1-129	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ OEt	H	1,4882(23,8)
25	1-130	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ O(CH ₂) ₇ Me	H	1,4854(22,0)
	1-131	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	H	1,4889(21,9)
	1-132	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ OBn	H	1,5212(21,9)
	1-133	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COOCH ₂ Cl	H	121,1-124,8
30	1-134	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COOCH ₂ CCl ₃	H	143,1-145,6
	1-135	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COO(CH ₂) ₂ CH ₂ Cl	H	117,1-121,4
	1-136	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COO-i-Bu	H	122,2-138,0
	1-137	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COO-t-Bu	H	39,2
	1-138	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COO(CH ₂) ₂ OMe	H	1,4750(23,5)
35	1-139	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COO(CH ₂) ₁₅ Me	H	90,5-92,1
	1-140	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	Ac	OMe	1,5016(23,3)
	1-141	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COEt	OMe	1,4981(23,5)
40	1-142	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	82,5-83
	1-143	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COPh	OMe	1,5219(23,7)
	1-144	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ OMe	OMe	1,4944(23,1)
	1-145	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ OEt	OMe	1,4892(22,2)
	1-146	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	OMe	1,4885(25,1)
45	1-147	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COOMe	OMe	1,4926(23,2)
	1-148	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COOEt	OMe	1,4894(23,2)
	1-149	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COOCH ₂ Cl	OMe	1,4941(21,5)
	1-150	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COO-n-Pr	OMe	1,4928(22,2)
50	1-151	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COO-i-Pr	OMe	1,4884(23,0)
	1-152	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COO-i-Bu	OMe	1,4829(22,3)
	1-153	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COOCH ₂ CMe ₃	OMe	1,4864(23,0)

RU 2 375 348 C1

	1-154	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COO(CH ₂) ₂ OMe	OMe	1,4959(23,0)
	1-155	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	H	OMe	189-190
	1-156	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	Et	OMe	аморфный
5	1-157	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ CCl ₃	OMe	1,4939(22,2)
	1-158	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	Ac	OEt	1,4940(26,4)
	1-159	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COEt	OEt	1,4921(26,5)
	1-160	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CO-i-Pr	OEt	пастообразный
10	1-161	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COPh	OEt	
	1-162	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ OMe	OEt	
	1-163	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ OEt	OEt	
	1-164	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	OEt	
15	1-165	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COOMe	OEt	
	1-166	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COOEt	OEt	
	1-167	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COOCH ₂ Cl	OEt	
	1-168	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COO-n-Pr	OEt	
	1-169	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COO-i-Pr	OEt	
20	1-170	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COO-i-Bu	OEt	
	1-171	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COOCH ₂ CM ₃	OEt	
	1-172	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COO(CH ₂) ₂ OMe	OEt	
	1-173	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	H	OEt	165-166
25	1-174	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	Et	OEt	
	1-175	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ CCl ₃	OEt	
	1-176	i-Bu	Et	3,5-Me ₂	H	H	127-128
	1-177	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	H	F	136,5-137,5
30	1-178	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	Et	H	1,4904(25,7)
	1-179	i-Bu	Me	3-Me-5-F	H	H	169,5-171
	1-180	i-Bu	Me	3-Me-5-F	H	OMe	135-137
	1-181	i-Bu	Me	3-Me-5-F	Et	OMe	1,4825(26,0)
	1-182	i-Bu	Me	3-Me-5-F	Ac	OMe	86,4
35	1-183	i-Bu	Me	3-Me-5-F	COPh	OMe	124,1-130,8
	1-184	i-Bu	Me	3-Me-5-F	COOMe	OMe	64,5-80,5
	1-185	i-Bu	Me	3-Me-5-F	COO-i-Bu	OMe	1,4789(23,7)
	1-186	i-Bu	Me	3-Me-5-F	COO(CH ₂) ₂ OMe	OMe	1,4857(22,3)
	1-187	i-Bu	Me	3-Me-5-F	CH ₂ OEt	OMe	1,4804(23,8)
40	1-188	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	H	H	160-161
	1-189	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	H	OMe	144-146
	1-190	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	Me	OMe	1,4919(25,6)
	1-191	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	Et	OMe	1,4938(26,0)
	1-192	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	CH ₂ OMe	OMe	1,4961(26,0)
45	1-193	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	CH ₂ OEt	OMe	1,4932(25,6)
	1-194	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	COOMe	OMe	1,4883(25,6)
	1-195	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	COOEt	OMe	1,4915(26,0)
	1-196	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	COO-i-Bu	OMe	1,4850(25,6)
	1-197	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	COO(CH ₂) ₂ OMe	OMe	1,4946(26,0)
50	1-198	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	AC	OMe	102,6-102,8
	1-199	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	COEt	OMe	101,8-104,2
	1-200	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	COPh	OMe	1,5210(26,0)
	1-201	i-Bu	Et	3-Me-5-Cl	H	H	104,5-106
	1-202	i-Bu	Me	3-Me-5-I	H	H	152-153

RU 2 375 348 C1

5	1-203	i-Bu	Me	3-Me-5-CF ₃	H	OMe	88-89
	1-204	i-Bu	Me	3-Me-5-CF ₃	Ac	OMe	1,4710(25,7)
	1-205	i-Bu	Me	3-Me-5-CF ₃	COOMe	OMe	1,4672(25,7)
	1-206	i-Bu	Me	3-Me-5-CF ₃	CH ₂ OEt	OMe	1,4652(25,7)
	1-207	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	H	1,4869(23,4)
10	1-208	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	H	152-152,5
	1-209	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOMe	H	148,5-150
	1-210	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ OEt	H	1,4623(22,8)
	1-211	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OMe	138-139
	1-212	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOMe	OMe	1,4729(20,7)
15	1-213	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOEt	OMe	1,4695(20,7)
	1-214	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOCH ₂ CH=CH ₂	OMe	1,4742(24,5)
	1-215	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	COO(CH ₂) ₂ Me	OMe	1,4685(20,7)
	1-216	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	COO(CH ₂) ₃ Me	OMe	1,4689(24,5)
	1-217	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	COO-i-Bu	OMe	1,4669(22,6)
20	1-218	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOPh	OMe	50-55
	1-219	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	COO(CH ₂) ₂ OMe	OMe	1,4691(22,3)
	1-220	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	COSMe	OMe	1,4870(24,9)
	1-221	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	COSEt	OMe	1,4862(24,9)
	1-222	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ OMe	OMe	1,4669(22,4)
25	1-223	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ OEt	OMe	108-110
	1-224	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OMe	1,4720(20,6)
	1-225	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-C-Pr	OMe	1,4735(24,8)
	1-226	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OEt	
	1-227	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OEt	
30	1-228	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Cl	H	H	136-137
	1-229	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Cl	Ac	H	
	1-230	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Cl	H	OMe	130-132
	1-231	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Cl	Ac	OMe	
	1-232	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Cl	H	OEt	
35	1-233	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Cl	Ac	OEt	
	1-234	(CH ₂) ₄ Me	Me	3,5-Me ₂	H	H	128-130
	1-235	(CH ₂) ₄ Me	Me	3,5-Me ₂	Ac	H	
	1-236	(CH ₂) ₄ Me	Me	3,5-Me ₂	H	OMe	
	1-237	(CH ₂) ₄ Me	Me	3,5-Me ₂	Ac	OMe	
40	1-238	(CH ₂) ₄ Me	Me	3,5-Me ₂	H	OEt	
	1-239	(CH ₂) ₄ Me	Me	3,5-Me ₂	Ac	OEt	
	1-240	(CH ₂) ₄ Me	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	H	
	1-241	(CH ₂) ₄ Me	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	H	
	1-242	(CH ₂) ₄ Me	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OMe	
45	1-243	(CH ₂) ₄ Me	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OMe	
	1-244	(CH ₂) ₄ Me	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OEt	
	1-245	(CH ₂) ₄ Me	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OEt	

RU 2 375 348 C1


5	1-246	CH ₂ CMe ₃	Me	3,5-Me ₂	H	H	174-176
	1-247	CH ₂ CMe ₃	Me	3,5-Me ₂	Ac	H	
	1-248	CH ₂ CMe ₃	Me	3,5-Me ₂	H	OMe	
	1-249	CH ₂ CMe ₃	Me	3,5-Me ₂	Ac	OMe	
	1-250	CH ₂ CMe ₃	Me	3,5-Me ₂	H	OEt	
	1-251	CH ₂ CMe ₃	Me	3,5-Me ₂	Ac	OEt	
	1-252	CH ₂ CMe ₃	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	H	
10	1-253	CH ₂ CMe ₃	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	H	
	1-254	CH ₂ CMe ₃	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OMe	
	1-255	CH ₂ CMe ₃	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OMe	
	1-256	CH ₂ CMe ₃	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OEt	
	1-257	CH ₂ CMe ₃	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OEt	
15	1-258	CH ₂ CH(Me)Et	Me	3,5-Me ₂	H	H	67-70
	1-259	CH ₂ CH(Me)Et	Me	3,5-Me ₂	Ac	H	
	1-260	CH ₂ CH(Me)Et	Me	3,5-Me ₂	H	OMe	158-160
	1-261	CH ₂ CH(Me)Et	Me	3,5-Me ₂	Ac	OMe	
20	1-262	CH ₂ CH(Me)Et	Me	3,5-Me ₂	H	OEt	
	1-263	CH ₂ CH(Me)Et	Me	3,5-Me ₂	Ac	OEt	

25	1-264	CH ₂ CH(Me)Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	H	
	1-265	CH ₂ CH(Me)Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	H	
	1-266	CH ₂ CH(Me)Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OMe	143-144
	1-267	CH ₂ CH(Me)Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OMe	
	1-268	CH ₂ CH(Me)Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OEt	
30	1-269	CH ₂ CH(Me)Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OEt	
	1-270	CH ₂ CHEt ₂	Me	3,5-Me ₂	H	H	67-70
	1-271	CH ₂ CHEt ₂	Me	3,5-Me ₂	Ac	H	
	1-272	CH ₂ CHEt ₂	Me	3,5-Me ₂	H	OMe	
35	1-273	CH ₂ CHEt ₂	Me	3,5-Me ₂	Ac	OMe	
	1-274	CH ₂ CHEt ₂	Me	3,5-Me ₂	H	OEt	
	1-275	CH ₂ CHEt ₂	Me	3,5-Me ₂	Ac	OEt	
	1-276	CH ₂ CHEt ₂	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	H	
40	1-277	CH ₂ CHEt ₂	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	H	
	1-278	CH ₂ CHEt ₂	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OMe	
	1-279	CH ₂ CHEt ₂	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OMe	
	1-280	CH ₂ CHEt ₂	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OEt	
45	1-281	CH ₂ CHEt ₂	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OEt	
	1-282	(CH ₂) ₂ CHMe ₂	Me	3,5-Me ₂	H	H	152-153
	1-283	(CH ₂) ₂ CHMe ₂	Me	3,5-Me ₂	Ac	H	
	1-284	(CH ₂) ₂ CHMe ₂	Me	3,5-Me ₂	H	OMe	166-167
	1-285	(CH ₂) ₂ CHMe ₂	Me	3,5-Me ₂	Ac	OMe	1,4925(21,8)
50	1-286	(CH ₂) ₂ CHMe ₂	Me	3,5-Me ₂	H	OEt	
	1-287	(CH ₂) ₂ CHMe ₂	Me	3,5-Me ₂	Ac	OEt	
	1-288	(CH ₂) ₂ CHMe ₂	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	H	

RU 2 375 348 C1

5	1-289	(CH ₂) ₂ CHMe ₂	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	H	
	1-290	(CH ₂) ₂ CHMe ₂	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OMe	138-140
	1-291	(CH ₂) ₂ CHMe ₂	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OMe	
	1-292	(CH ₂) ₂ CHMe ₂	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OEt	
	1-293	(CH ₂) ₂ CHMe ₂	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OEt	
	1-294	(CH ₂) ₇ Me	Me	3,5-Me ₂	H	H	1,5052(23,3)
	1-295	(CH ₂) ₇ Me	Me	3,5-Me ₂	Ac	H	
10	1-296	(CH ₂) ₇ Me	Me	3,5-Me ₂	H	OMe	
	1-297	(CH ₂) ₇ Me	Me	3,5-Me ₂	Ac	OMe	
	1-298	(CH ₂) ₇ Me	Me	3,5-Me ₂	H	OEt	
	1-299	(CH ₂) ₇ Me	Me	3,5-Me ₂	Ac	OEt	
15	1-300	(CH ₂) ₇ Me	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	H	
	1-301	(CH ₂) ₇ Me	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	H	
	1-302	(CH ₂) ₇ Me	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OMe	
	1-303	(CH ₂) ₇ Me	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OMe	
	1-304	(CH ₂) ₇ Me	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OEt	
20	1-305	(CH ₂) ₇ Me	Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OEt	
	1-306	n-Pr	Me	3-Me-5-CF ₃	H	H	141-143
	1-307	n-Pr	Me	3-Me-5-CF ₃	H	OMe	152-153
	1-308	n-Pr	Me	3-Me-5-CF ₃	Ac	OMe	1,4688(25,6)
25	1-309	n-Pr	Me	3-Me-5-CF ₃	Ac	H	112-113
	1-310	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ OMe	H	1,4690(25,9)
	1-311	i-Bu	Me	3-Me-5-F	COOCH ₂ CH ₂ Cl	OMe	1,4966(24,7)
	1-312	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COOCH ₂ CH ₂ Cl	OMe	1,5039(24,8)
30	1-313	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COCH ₂ CMe ₃	OMe	1,4914(24,8)
	1-314	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CO-c-Pr	OMe	1,5061(24,9)
	1-315	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	COEt	H	171-173
	1-316	i-Bu	ClCH ₂ CH ₂	3,5-Me ₂	H	OMe	170-171
35	1-317	i-Bu	ClCH ₂ CH ₂	3,5-Me ₂	Ac	OMe	1,4955(24,8)
	1-318	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CO-n-Pr	OMe	1,4943(24,8)
	1-319	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CO-t-Bu	OMe	113-115
40	1-320	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CO(4-MeO-Ph)	OMe	1,5198(25,3)
	1-321	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CO(4-Me-Ph)	OMe	1,5139(25,0)
	1-322	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CO(4-Cl-Ph)	OMe	51-64
	1-323	n-Pr	Me	3-Me-5-CF ₃	COEt	OMe	1,4705(26,8)
45	1-324	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CO(3-Cl-Ph)	OMe	1,5266(25,4)
	1-325	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CO(3-Me-Ph)	OMe	1,5182(25,5)
	1-326	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CO(3-MeO-Ph)	OMe	1,5165(26,5)
	1-327	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CO(2-Me-Ph)	OMe	88-128
	1-328	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CO(2-Cl-Ph)	OMe	121-122
50	1-329	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CO(2-MeO-Ph)	OMe	57-83
	1-330	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COCH=CH ₂	OMe	1,5088(24,5)
	1-331	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COCHClMe	OMe	аморфный


RU 2 375 348 C1

	1-332	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CO(3-Me-2-Pyr)	OMe	52-64
	1-333	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	SNEt ₂	OMe	
	1-334	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-i-Pr	H	161-163
5	1-335	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-i-Pr	OMe	1,4680(26,4)
	1-336	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CO-t-Pen	OMe	95-96
	1-337	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COCH ₂ OMe	OMe	1,4939(26,5)
	1-338	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CO(4-CF ₃ -Ph)	OMe	54
10	1-339	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COCH ₂ Ph	OMe	
	1-340	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COCH=CMe ₂	OMe	1,5091(26,5)
	1-341	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COCH=CHMe	OMe	1,5082(26,5)
	1-342	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COCH ₂ CH ₂ COOEt	OMe	100-101
	1-343	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOCH ₂ CH=CH ₂	OMe	1,4728(27,0)
15	1-344	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-t-Bu	OMe	1,4715(26,9)
	1-345	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-n-Pr	OMe	1,4660(26,8)
	1-346	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOCH ₂ CH ₂ OMe	OMe	1,4695(26,2)
	1-347	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-t-Bu	OMe	1,4730(26,2)
20	1-348	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COCMe ₂ CH ₂ Cl	OMe	1,5062(26,7)
	1-349	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CO-c-Pen	OMe	1,5019(26,8)
	1-350	i-Bu	CH=CH ₂	3,5-Me ₂	H	OMe	124-130
	1-351	i-Bu	CH=CH ₂	3,5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	1,5044(25,8)
25	1-352	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CO(2,4-Cl ₂ -Ph)	OMe	1,5220(26,1)
	1-353	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CO(3,4-Cl ₂ -Ph)	OMe	53
	1-354	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	1,5075(25,1)
	1-355	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-i-Pr	OMe	1,4741(25,8)
30	1-356	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOCH ₂ CH=CH ₂	OMe	1,4781(25,9)
	1-357	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	CO-t-Bu	OMe	1,4888(26,0)
	1-358	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	CO(4-Cl-Ph)	OMe	41
	1-359	Et	Me	3,5-Me ₂	n-Pen	OMe	1,4897(25,0)
35	1-360	Et	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ (4-F-Ph)	OMe	107,9
	1-361	Et	Me	3,5-Me ₂	CO-c-Bu	OMe	1,4939(32,1)
	1-362	Et	Me	3,5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	100,3-103,4
	1-363	Et	Me	3,5-Me ₂	CO-s-Bu	OMe	1,5031(22,9)
40	1-364	Et	Me	3,5-Me ₂	CO-t-Bu	OMe	108
	1-365	Et	Me	3,5-Me ₂	COCMe ₂ Et	OMe	1,4983(20,5)
	1-366	Et	Me	3,5-Me ₂	COCH ₂ OMe	OMe	1,4958(21,6)
	1-367	Et	Me	3,5-Me ₂	COCHEt ₂	OMe	1,4991(21,8)
	1-368	Et	Me	3,5-Me ₂	CO-c-Pen	OMe	1,4977(30,5)
45	1-369	Et	Me	3,5-Me ₂	CO-c-Hex	OMe	1,4934(25,2)
	1-370	Et	Me	3,5-Me ₂	COCH ₂ OPh	OMe	аморфный
	1-371	Et	Me	3,5-Me ₂	COCH ₂ -t-Bu	OMe	1,4962(32,1)
	1-372	Et	Me	3,5-Me ₂	CO(4-CF ₃ -Ph)	OMe	1,5023(32,2)
50	1-373	Et	Me	3,5-Me ₂		OMe	1,4211(32,0)
	1-374	Et	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe	OMe	1,4892(31,0)

RU 2 375 348 C1

5	1-375	Et	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ O-i-Pr	OMe	1,4855(30,2)
	1-376	Et	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ O-i-Bu	OMe	1,4849(33,2)
	1-377	Et	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ O-n-Pr	OMe	1,4982(23,1)
	1-378	Et	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ O-n-Bu	OMe	1,4940(23,2)
	1-379	Et	Me	3,5-Me ₂	COOCH ₂ CCl ₃	OMe	145,2-145,8
10	1-380	Et	Me	3,5-Me ₂	COO-n-Pen	OMe	1,4960(20,2)
	1-381	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	COEt	H	127-128
	1-382	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-c-Bu	OMe	1,4818(19,1)
	1-383	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-s-Bu	OMe	1,4701(24,4)
	1-384	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	COCHEt ₂	OMe	1,4724(24,3)
15	1-385	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ O-n-Bu	OMe	1,4670(23,7)
	1-386	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ O-i-Bu	OMe	1,4659(21,8)
	1-387	Et	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ O-n-Pr	OMe	1,4672(21,8)
	1-388	Et	Me	3-Me-5-Cl	H	OMe	127,3-128,5
	1-389	Et	Me	3-Me-5-Cl	CO-i-Pr	OMe	134,1-135,4
20	1-390	Et	Me	3-Me-5-Cl	CO-c-Bu	OMe	136,1-137,2
	1-391	Et	Me	3-Me-5-Cl	CO-t-Bu	OMe	108,6-110,4
	1-392	Et	Me	3-Me-5-Cl	COO-i-Bu	OMe	1,4931(32,1)
	1-393	Et	Me	3-Me-5-Cl	CH ₂ O-i-Pr	OMe	1,4884(30,5)
	1-394	Et	Me	3-Me-5-Cl	CH ₂ O-n-Bu	OMe	1,4875(29,1)
25	1-395	Et	Me	3-Me	H	OMe	183,8-185,4
	1-396	Et	Me	3-Me	CO-i-Pr	OMe	114,4-114,9
	1-397	Et	Me	3-Me	CO-c-Pen	OMe	1,4975(31,0)
	1-398	Et	Me	3-Me	CH ₂ O-i-Pr	OMe	1,4902(23,4)
	1-399	Et	Me	3,5-Me ₂	CO-n-Pr	OEt	1,4932(23,0)
30	1-400	Et	Me	3,5-Me ₂	CO-i-Pr	OEt	80-81
	1-401	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	COOCH ₂ CH=CH ₂	OMe	1,4841(23,7)
	1-402	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	COOCH ₂ CHEt-n-Bu	OMe	1,4894(23,8)
	1-403	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	COCH ₂ OMe	OMe	пастообразный
	1-404	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	Me	OMe	1,4983(22,0)
35	1-405	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	Et	OMe	1,4970(20,0)
	1-406	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	1,5019(23,2)
	1-407	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	(CH ₂) ₇ Me	OMe	1,4880(23,5)
	1-408	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOMe	H	140-145
	1-409	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COOEt	H	129-130
40	1-410	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	COEt	H	140-145
	1-411	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-i-Pr	H	135-137
	1-412	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ O-n-Pr	OMe	1,4673(21,8)
	1-413	n-Pr	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ O-t-Bu	OMe	1,4669(21,7)
	1-414	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	Me	OMe	пастообразный
45	1-415	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	n-Pr	OMe	пастообразный
	1-416	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	70-71
	1-417	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ (4-NO ₂ -Ph)	OMe	пастообразный
	1-418	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ Ph	OMe	90-97
	1-419	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ (4-Me-Ph)	OMe	пастообразный
50	1-420	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ O-n-Pr	OMe	59-65

RU 2 375 348 C1

5	1-421	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ O-n-Bu	OMe	пастообразный
	1-422	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ O-i-Pr	OMe	пастообразный
	1-423	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ O-i-Bu	OMe	80-82
	1-424	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ O-t-Bu	OMe	пастообразный
	1-425	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ O-s-Bu	OMe	пастообразный
	1-426	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	OMe	пастообразный
	1-427	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ OCH ₂ CH=CH ₂	OMe	пастообразный
10	1-428	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ O(CH ₂) ₇ Me	OMe	пастообразный
	1-429	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CO-c-Bu	OMe	пастообразный
	1-430	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CO-s-Bu	OMe	106,1-107,8
15	1-431	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COCHEt ₂	OMe	97,2-101,8
	1-432	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COCMe ₂ Br	OMe	93-106
	1-433	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CO-c-Hex	OMe	1,5035(24,7)
	1-434	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ (2,4,6-Cl ₃ -Ph)	OMe	64,2-66,7
20	1-435	i-Bu	Me	3,5-Me ₂		OMe	1,4991(20,5)
	1-436	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COCHMeOMe	OMe	1,4977(20,6)
	1-437	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COCMe ₂ OMe	OMe	1,4906(23,6)
	1-438	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COOPh	OMe	135,3-136,1
25	1-439	i-Bu	Me	3-Me-5-CF ₃	COO-i-Bu	OMe	1,4733(21,2)
	1-440	i-Bu	Me	3-Me-5-CF ₃	CO-t-Bu	OMe	1,4745(21,2)
	1-441	i-Bu	Me	3-Me-5-CF ₃	CO-i-Pr	OMe	1,4722(32,1)
	1-442	i-Bu	Me	3-Me-5-CF ₃	CO-c-Pr	OMe	1,4780(32,0)
30	1-443	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	COEt	OMe	1,4727(24,1)
	1-444	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-i-Pr	OMe	1,4720(24,2)
	1-445	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ O-n-Pr	OMe	1,4658(22,7)
	1-446	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ O-n-Bu	OMe	1,4670(22,5)
35	1-447	i-Bu	Me	3-CF ₃ -5-Me	CH ₂ O-i-Bu	OMe	1,4625(21,9)
	1-448	i-Bu	Me	3-Me-5-F	CO-t-Bu	OMe	аморфный
	1-449	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	CO-i-Pr	OMe	124-124,4
	1-450	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	CO-t-Bu	OMe	1,4860(31,4)
	1-451	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	CO-c-Bu	OMe	114-115,3
40	1-452	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	COCH ₂ OMe	OMe	аморфный
	1-453	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	CO-c-Pen	OMe	136,2-137
	1-454	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	CH ₂ O-n-Pr	OMe	1,4887(31,6)
	1-455	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	CH ₂ O-i-Bu	OMe	60,7-64,7
45	1-456	i-Bu	Me	3-Me	CO-i-Pr	OMe	67,3-68,2
	1-457	i-Bu	Me	3-Me	CO-t-Bu	OMe	124,1-125,5
	1-458	i-Bu	Me	3-Me	CO-s-Bu	OMe	1,4914(32,0)
	1-459	i-Bu	Me	3-Me	CO-c-Bu	OMe	83-88,6
	1-460	i-Bu	Me	3-Me	CO-c-Pen	OMe	1,4990(31,7)
50	1-461	i-Bu	Me	3-Me	COCHEt ₂	OMe	1,4905(28,5)
	1-462	i-Bu	Me	3-Me	CH ₂ O-i-Pr	OMe	1,4817(31,7)
	1-463	i-Bu	H	3,5-Me ₂	H	OMe	82,8-90,5
	1-464	i-Bu	Et	3,5-Me ₂	H	OMe	162-163
	1-465	i-Bu	CH ₂ CF ₃	3,5-Me ₂	H	OMe	176-177

RU 2 375 348 C1

5	1-466	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CO-i-Pr	F	1,4860(22,7)
	1-467	CH ₂ CHMeEt	Me	3,5-Me ₂	COEt	OMe	1,4929(20,1)
	1-468	CH ₂ CHMeEt	Me	3,5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	1,4910(20,0)
	1-469	n-Bu	Me	3,5-Me ₂	COEt	OMe	1,4895(20,6)
	1-470	n-Bu	Me	3,5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	1,4835(18,9)
	1-471	CH ₂ CH-c-Pen	Me	3-CF ₃ -5-Me	H	H	200-201
	1-472	CH ₂ CH ₂ CHMe ₂	Me	3,5-Me ₂	COEt	OMe	1,4960(20,5)
10	1-473	CH ₂ CH ₂ CHMe ₂	Me	3,5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	1,4950(21,6)
	1-474	Et	i-Pr	3,5-Me ₂	H	OEt	173-174
	1-475	Et	i-Pr	3,5-Me ₂	Ac	OEt	88-89
	1-476	Et	Me	3,5-Me ₂	H	O-n-Pr	104-105
	1-477	Et	Me	3,5-Me ₂	CO-n-Pr	O-n-Pr	1,4833(33,0)
15	1-478	Et	Me	3,5-Me ₂	CO-i-Pr	O-n-Pr	1,4919(33,0)
	1-479	Et	Me	3,5-Me ₂	CO-t-Bu	O-n-Pr	1,4848(32,0)
	1-480	Et	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ OEt	O-n-Pr	1,4729(23,5)

20	1-481	Et	Me	3-I-5-Me	H	H	134-135
	1-482	Et	Me	3,5-Me ₂	COCHMeCOEt	OEt	
	1-483	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	CO-n-Pr	OMe	1,4959(31,2)
	1-484	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	CO-s-Bu	OMe	1,4960(32,3)
25	1-485	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	CO-c-Pen	OMe	1,4880(29,0)
	1-486	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ O-n-Pr	OMe	1,4869(28,0)
	1-487	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ O-i-Pr	OMe	1,4819(29,3)
	1-488	n-Pr	Me	3-Me-5-Cl	H	OMe	135,4-139,0
	1-489	n-Pr	Me	3-Me-5-Cl	CO-i-Pr	OMe	128,1-128,2
30	1-490	n-Pr	Me	3-Me-5-Cl	CO-s-Bu	OMe	99,2-99,7
	1-491	n-Pr	Me	3-Me-5-Cl	CO-c-Pr	OMe	123,0-123,9
	1-492	n-Pr	Me	3-Me-5-Cl	CO-c-Pen	OMe	141,7-142,1
	1-493	n-Pr	Me	3-Me-5-Cl	CH ₂ OEt	OMe	1,4954(20,7)
35	1-494	n-Pr	Me	3-I-5-Me	H	H	183-185
	1-495	n-Pr	Me	3-Me	H	OMe	146,8-147,0
	1-496	n-Pr	Me	3-Me	CO-i-Pr	OMe	61,6-62,9
	1-497	n-Pr	Me	3-Me	CO-s-Bu	OMe	1,4960(22,2)
	1-498	n-Pr	Me	3-Me	CO-c-Pen	OMe	1,4991(22,1)
40	1-499	n-Pr	Me	3-Me	CH ₂ O-n-Pr	OMe	1,4864(22,8)
	1-500	n-Pr	Me	3-Me	CH ₂ O-i-Pr	OMe	1,4863(22,4)
	1-501	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	CO-n-Pr	OEt	1,4892(22,7)
	1-502	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	CO-i-Pr	OEt	1,4910(22,8)
	1-503	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	H	O-n-Pr	158-159,5
45	1-504	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	COEt	O-n-Pr	1,4975(20,5)
	1-505	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	CO-n-Pr	O-n-Pr	1,4940(20,5)
	1-506	n-Pr	Me	3,5-Me ₂	CO-i-Pr	O-n-Pr	1,4960(20,6)
	1-507	i-Bu	CH ₂ CF ₃	3,5-Me ₂	COEt	OMe	137-138
50	1-508	i-Bu	CH ₂ CF ₃	3,5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	
	1-509	i-Bu	i-Pr	3,5-Me ₂	H	OMe	166-167
	1-510	i-Bu	i-Pr	3,5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	107-108
	1-511	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	H	F	143,2-144,7



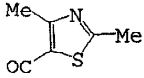
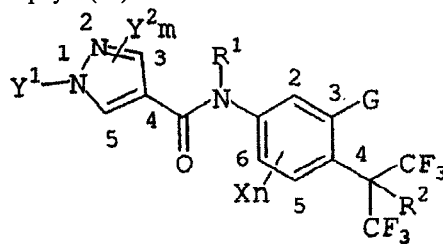
	1-512	i-Bu	Me	3-Me-5-Cl	CO-i-Pr	F	1,4888(23,0)
	1-513	i-Bu	Me	3-Cl-5-Me	H	OMe	153-161
	1-514	i-Bu	Me	3-Cl-5-Me	CO-i-Pr	OMe	пастообразный
5	1-515	i-Bu	Me	3-Cl-5-Me	CH ₂ O-i-Pr	OMe	пастообразный
	1-516	i-Bu	Me	3-Cl-5-Me	COOMe	OMe	аморфный
	1-517	i-Bu	Me	3-Br-5-Me	H	OMe	172-174
	1-518	i-Bu	Me	3-Br-5-Me	CO-i-Pr	OMe	пастообразный
	1-519	i-Bu	Me	3-Br-5-Me	CH ₂ O-i-Pr	OMe	пастообразный
10	1-520	i-Bu	Me	3-I-5-Me	H	H	178-183
	1-521	i-Bu	Me	3-Br-5-Me	COOMe	OMe	пастообразный
	1-522	i-Bu	Me	3-I-5-Me	H	OMe	аморфный
	1-523	i-Bu	Me	3-I-5-Me	COOMe	OMe	пастообразный
	1-524	i-Bu	Me	3-I-5-Me	CO-i-Pr	OMe	пастообразный
15	1-525	i-Bu	Me	3-I-5-Me	CH ₂ OEt	OMe	100-103
	1-526	i-Bu	Me	3-I-5-Me	CH ₂ O-i-Pr	OMe	100-102
	1-527	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ CH=CMe ₂	OMe	81-83
	1-528	CH=CMe ₂	Me	3,5-Me ₂	H	OMe	
	1-529	i-Bu	Me	5-CF ₃	H	OMe	170
20	1-530	i-Bu	Me	5-CF ₃	CO-i-Pr	OMe	1,4680(22,8)
	1-531	i-Bu	Et	3,5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	1,4913(23,0)
	1-532	CH=CMe ₂	Me	3,5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	
25	1-533	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CO-n-Pr	OEt	1,4870(22,5)
	1-534	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	H	O-n-Pr	138-139
	1-535	i-Bu	Me	3-I	H	OMe	210-218
	1-536	i-Bu	Me	3-Br	H	OMe	203
30	1-537	i-Bu	Me	3-Cl	H	OMe	174-182
	1-538	i-Bu	Me	3,5-Cl ₂	H	OMe	132
	1-539	i-Bu	Me	3-I	CO-i-Pr	OMe	пастообразный
	1-540	i-Bu	Me	3-Br	CO-i-Pr	OMe	пастообразный
	1-541	i-Bu	Me	3-Cl	CO-i-Pr	OMe	пастообразный
35	1-542	i-Bu	Me	3-CF ₃	CO-i-Pr	OMe	пастообразный
	1-543	i-Bu	Me	3,5-Cl ₂	CO-i-Pr	OMe	113-114
40	1-544	i-Bu	Me	3,5-Me ₂		F	аморфный
	1-545	i-Bu	Me	3,5-Me ₂		F	аморфный
	1-546	i-Bu	Me	3,5-Me ₂		OMe	150,4-151,2
45	1-547	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ OAc	OMe	94-95
	1-548	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ OC(=O)Et	OMe	99
	1-549	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	CH ₂ OC(O)-i-Pr	OMe	112
	1-550	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COSMe	OMe	
50	1-551	i-Bu	Me	3,5-Me ₂	COSEt	OMe	

Таблица 2
Формула (I-4)



(I-4)

(Y¹=Me)

No.	G	Xn	Y ² _m	R ¹	R ²	Свойства
2-1	Et	6-Me	3,5-Me ₂	H	H	
2-2	Et	6-Me	3,5-Me ₂	Ac	H	
2-3	Et	6-Me	3,5-Me ₂	H	OMe	
2-4	Et	6-Me	3,5-Me ₂	Ac	OMe	
2-5	Et	6-Me	3,5-Me ₂	H	OEt	
2-6	Et	6-Me	3,5-Me ₂	Ac	OEt	
2-7	Et	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	H	H	
2-8	Et	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	H	
2-9	Et	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OMe	
2-10	Et	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OMe	
2-11	Et	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OEt	
2-12	Et	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OEt	
2-13	n-Pr	6-Me	3,5-Me ₂	H	H	128-131
2-14	n-Pr	6-Me	3,5-Me ₂	Ac	H	
2-15	n-Pr	6-Me	3,5-Me ₂	H	OMe	132-134
2-16	n-Pr	6-Me	3,5-Me ₂	Ac	OMe	1,4905(25,9)

2-17	n-Pr	6-Me	3,5-Me ₂	H	OEt	154-155
2-18	n-Pr	6-Me	3,5-Me ₂	Ac	OEt	
2-19	n-Pr	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	H	H	
2-20	n-Pr	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	H	
2-21	n-Pr	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OMe	104-106
2-22	n-Pr	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OMe	1,4751(26,7)
2-23	n-Pr	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OEt	152-153
2-24	n-Pr	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	Ac	OEt	
2-25	n-Pr	6-Me	3-Me-5-Cl	H	OMe	127-128,5
2-26	n-Pr	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	COEt	OMe	151-152
2-27	i-Bu	6-Cl	3,5-Me ₂	H	OMe	106-109
2-28	i-Bu	6-Cl	3,5-Me ₂	Ac	OMe	аморфный
2-29	Et	6-Me	3,5-Me ₂	CO-c-Pr	OMe	138-140
2-30	Et	6-Me	3,5-Me ₂	COEt	OMe	132-134
2-31	Et	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-n-Pr	OMe	1,4960(26,6)
2-32	n-Pr	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	COOMe	OMe	165-166
2-33	i-Bu	6-Me	3,5-Me ₂	H	OMe	126-127
2-34	n-Pr	6-Me	3,5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	1,4955(33,5)
2-35	n-Pr	6-Me	3,5-Me ₂	CO-t-Bu	OMe	128,5-130,2

2-36	n-Pr	6-Me	3,5-Me ₂	COCHEt ₂	OMe	1,4918(32,6)
2-37	n-Pr	6-Me	3,5-Me ₂	COO-i-Bu	OMe	1,4870(30,1)
2-38	i-Bu	6-Me	3,5-Me ₂	COEt	OMe	аморфный
2-39	Et	6-Me	3,5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	1,4952(32,0)
2-40	n-Pr	6-Me	3-Me	H	OMe	аморфный
2-41	n-Pr	6-Me	3-Me	CO-i-Pr	OMe	пастообразный
2-42	n-Pr	6-Me	3,5-Me ₂	CO-i-Pr	OEt	111-112
2-43	i-Bu	6-Me	3,5-Me ₂	CO-i-Pr	OMe	38-42
2-44	n-Pr	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	CO-i-Pr	OMe	155
2-45	i-Bu	6-Me	3-CF ₃ -5-Me	H	OMe	68-70
2-46	n-Pr	6-Me	3,5-Me ₂	H	OH	192-195

15

20

25

30

35

Таблица 3
Формула (II)

(II)

(R¹=H)

No	G	Xn	R ²	¹ H-ЯМР[CDCl ₃ /TMS, δ значение (м.д.)]
3-1	n-Pr	6-Me	F	7,09 (с, 1H), 6,54 (с, 1H), 3,76 (ушир.с, 2H), 2,63 (м, 2H), 2,13 (с, 3H), 1,58 (м, 2H), 0,96 (т, 3H)
3-2	n-Pr	6-Me	H	7,18 (с, 1H), 6,54 (с, 1H), 4,45-4,20 (ушир., 2H), 4,27 (м, 1H), 2,50 (дд, 2H), 2,14 (с, 3H), 1,57 (м, 2H), 0,98 (т, 3H)
3-3	n-Pr	6-Me	OMe	7,10 (с, 1H), 6,66 (с, 1H), 3,72 (ушир.с, 2H), 3,42 (с, 3H), 2,84 (м, 2H), 2,14 (с, 3H), 1,61 (м, 2H), 1,00 (т, 3H)
3-4	Et	6-Me	F	7,09 (с, 1H), 6,56 (с, 1H), 3,78 (ушир.с, 2H), 2,71 (м, 2H), 2,14 (с, 3H), 1,19 (тд, 3H)
3-5	Et	6-Me	OMe	7,10 (с, 1H), 6,68 (с, 1H), 3,75 (ушир.с, 2H), 3,41 (с, 3H), 2,91 (дд, 2H), 2,15 (с, 3H), 1,22 (т, 3H)
3-6	Et	H	O-n-Pr	7,22 (д, 1H), 6,67 (д, 1H), 6,52 (дд, 1H), 3,80 (ушир., 2H), 3,46 (т, 2H), 2,92 (дд, 2H), 1,69 (дд, 2H), 1,21 (т, 3H), 0,94 (т, 3H)
3-7	n-Pr	H	O-n-Pr	7,22 (д, 1H), 6,66 (д, 1H), 6,51 (дд, 1H), 3,78 (ушир., 2H), 3,47 (т, 2H), 2,85 (м, 2H), 1,70 (дд, 2H), 1,60 (м, 2H), 1,00 (т, 3H), 0,94 (т, 3H)
3-8	i-Bu	H	O-n-Pr	7,24 (д, 1H), 6,70 (д, 1H), 6,53 (дд, 1H), 3,79 (ушир.с, 2H), 3,47 (т, 2H), 2,81 (д, 2H), 2,10 (м, 1H), 1,70 (м, 2H), 0,95 (т, 3H), 0,91 (д, 6H)

40

45

Таблица 4
Формула (IV)

(IV)

No	Y ¹	Y ^{2m}	Температура плавления (°C)
4-1	Me	3-Me-5-CF ₃	124-125,5

50

Таблица 5

No.	¹ H-ЯМР[CDCl ₃ /TMS, δ значение (м.д.)]
1-106	7,61 (д, 2H), 7,52 (д, 1H), 7,17 (м, 4H), 7,11 (м, 1H), 3,69 (с, 3H), 3,47(с, 3H), 2,86(д, 2H), 2,39 (с, 3H), 2,37 (с, 3H), 1,96 (м, 1H), 0,73 (д, 6H)

	1-107	8,27 (д, 2Н), 7,83 (д, 2Н), 7,59 (д, 1Н), 7,22 (д, 1Н), 7,17 (м, 1Н), 6,97 (с, 1Н), 3,66 (с, 3Н), 3,51 (с, 3Н), 2,91 (д, 2Н), 2,36(с, 3Н), 1,97 (м, 1Н), 0,77 (д, 6Н)
	1-116	8,04 (с, 1Н), 7,73 (ушир., 1Н), 7,72 (д, 1Н), 7,50 (д, 1Н), 7,43 (дд, 1Н), 4,01 (с, 3Н), 3,47 (с, 3Н), 2,93 (д, 2Н), 2,21 (м, 1Н), 0,94 (д, 6Н)
5	1-124	7,80 (дд, 2Н), 7,49 (д, 1Н), 7,13 (дд, 2Н), 7,02 (дд, 1Н), 6,89 (д, 1Н), 4,40-4,31 (м, 1Н), 3,57 (с, 3Н), 2,42 (д, 2Н), 2,28 (с, 3Н), 2,22 (с, 3Н), 1,70-1,59 (м, 1Н), 0,78 (д, 6Н)
	1-156	7,41 (д, 1Н), 7,01(дд, 1Н), 6,96 (д, 1Н), 3,98 (дд, 2Н), 3,56 (с, 3Н), 3,44(с, 3Н), 2,79(д, 2Н), 2,06 (с, 3Н), 2,00 (с, 3Н), 1,86 (м, 1Н), 1,25 (дд, 3Н), 0,74 (д, 6Н)
	1-160	7,47 (д, 1Н), 7,16-7,05 (м, 2Н), 3,67 (с, 3Н), 3,60 (дд, 2Н), 3,04 (м, 1Н), 2,88 (д, 2Н), 2,37 (с, 3Н), 2,25 (с, 3Н), 1,97 (м, 1Н), 1,31 (т, 3Н), 1,26 (д, 6Н), 0,77 (д, 6Н)
10	1-331	7,48 (д, 1Н), 7,10 (д, 1Н), 7,08 (с, 1Н), 5,11 (кв, 1Н), 3,64 (с, 3Н), 3,45 (с, 3Н), 2,96 (дд, 1Н), 2,74 (дд, 1Н), 2,31 (с, 3Н), 2,24 (с, 3Н), 1,92 (м, 1Н), 1,77 (д, 3Н), 0,84 (д, 3Н), 0,65 (д, 3Н)
	1-370	7,41 (д, 1Н), 7,28 (м, 2Н), 7,08 (д, 1Н), 6,98 (м, 2Н), 6,84 (м, 2Н), 4,98 (с, 2Н), 3,63 (с, 3Н), 3,40 (с, 3Н), 2,96 (кв, 2Н), 2,18 (с, 3Н), 2,14 (с, 3Н), 1,26 (т, 3Н)
	1-403	7,43 (д, 1Н), 7,14 (д, 1Н), 7,18 (м, 1Н), 4,32 (с, 2Н), 3,66 (с, 3Н), 3,43 (с, 3Н), 3,39 (с, 3Н), 2,92 (м, 2Н), 2,31 (с, 3Н), 2,23 (с, 3Н), 1,51 (м, 2Н), 0,94 (т, 3Н)
15	1-414	7,41 (д, 1Н), 7,01 (м, 2Н), 3,58 (с, 3Н), 3,48 (с, 3Н), 3,44 (с, 3Н), 2,79 (д, 2Н), 2,06 (с, 3Н), 2,00 (с, 3Н), 1,85 (м, 1Н), 0,76 (д, 6Н)
	1-415	7,39 (д, 1Н), 7,00 (дд, 1Н), 6,97 (д, 1Н), 3,88 (м, 2Н), 3,56 (с, 3Н), 3,44 (с, 3Н), 2,78 (д, 2Н), 2,05 (с, 3Н), 2,00 (с, 3Н), 1,84 (м, 1Н), 1,66 (м, 2Н), 0,95 (т, 3Н), 0,75 (д, 6Н)
	1-417	8,18 (д, 2Н), 7,50 (д, 2Н), 7,38 (д, 1Н), 6,95 (дд, 1Н), 6,88 (д, 1Н), 5,22 (с, 2Н), 3,58 (с, 3Н), 3,41 (с, 3Н), 2,73 (д, 2Н), 2,08 (с, 3Н), 1,99 (с, 3Н), 1,73 (м, 1Н), 0,70 (д, 6Н)
20	1-419	7,33 (д, 1Н), 7,23 (д, 2Н), 6,93 (дд, 1Н), 6,89 (д, 1Н), 6,83 (д, 2Н), 5,06 (с, 2Н), 3,79 (с, 3Н), 3,56 (с, 3Н), 3,40 (с, 3Н), 2,73 (д, 2Н), 2,05 (с, 3Н), 2,01 (с, 3Н), 1,74 (м, 1Н), 0,70 (д, 6Н)
	1-421	7,40 (д, 1Н), 7,16 (м, 2Н), 5,30 (с, 2Н), 3,61 (т, 2Н), 3,59 (с, 3Н), 3,43 (с, 3Н), 2,80 (д, 2Н), 2,09 (с, 3Н), 2,04 (с, 3Н), 1,87 (м, 1Н), 1,59 (м, 2Н), 1,37 (м, 2Н), 0,91 (т, 3Н), 0,76 (д, 6Н)
	1-422	7,39 (д, 1Н), 7,18 (м, 2Н), 5,31 (с, 2Н), 3,91 (м, 1Н), 3,59 (с, 3Н), 3,43 (с, 3Н), 2,80 (д, 2Н), 2,08 (с, 3Н), 2,04 (с, 3Н), 1,87 (м, 1Н), 1,22 (д, 6Н), 0,77 (д, 6Н)
25	1-424	7,39 (д, 1Н), 7,23 (м, 2Н), 5,23 (с, 2Н), 3,58 (с, 3Н), 3,43 (с, 3Н), 2,80 (д, 2Н), 2,07 (с, 6Н), 1,89 (м, 1Н), 1,26 (с, 9Н), 0,78 (д, 6Н)
	1-425	7,39 (д, 1Н), 7,17 (м, 2Н), 5,43 (д, 1Н), 5,22 (д, 1Н), 3,68 (м, 1Н), 3,59 (с, 3Н), 3,43 (с, 3Н), 2,80 (д, 2Н), 2,08 (с, 3Н), 2,04 (с, 3Н), 1,87 (м, 1Н), 1,46-1,63 (м, 2Н), 1,20 (д, 3Н), 0,89 (т, 3Н), 0,77 (дд, 6Н)
	1-426	7,42 (д, 1Н), 7,10 (м, 2Н), 5,43 (с, Н), 4,14 (кв, 2Н), 3,58 (с, 3Н), 3,44 (с, 3Н), 2,80 (д, 2Н), 2,05(с, 3Н), 2,01 (с, 3Н), 1,85 (м, 1Н), 0,76 (д, 6Н)
30	1-427	7,40 (д, 1Н), 7,17 (дд, 1Н), 7,13 (д, 1Н), 5,87-5,98 (м, 1Н), 5,32 (с, 2Н), 5,29 (дд, 1Н), 5,20 (дд, 1Н), 4,16 (д, 2Н), 3,59 (с, 3Н), 3,44 (с, 3Н), 2,80 (д, 2Н), 2,09 (с, 3Н), 2,04 (с, 3Н), 1,87 (м, 1Н), 0,76 (д, 6Н)
	1-428	7,39 (д, 1Н), 7,15 (м, 2Н), 5,30 (с, 2Н), 3,60 (т, 2Н), 3,59 (с, 3Н), 3,43 (с, 3Н), 2,80 (д, 2Н), 2,09 (с, 3Н), 2,04 (с, 3Н), 1,88 (м, 1Н), 1,60 (м, 2Н), 1,27 (м, 10Н), 0,88 (т, 3Н), 0,77 (д, 6Н)
	1-429	7,49 (д, 1Н), 7,12 (д, 1Н), 7,08 (дд, 1Н), 3,68 (с, 3Н), 3,46 (м, 1Н), 3,46 (с, 3Н), 2,88 (д, 2Н), 2,40 (м, 2Н), 2,35 (с, 3Н), 2,25 (с, 3Н), 1,84-2,11 (м, 5Н), 0,80 (д, 6Н)
35	1-448	7,49 (д, 1Н), 7,06 (д, 1Н), 6,98 (м, 1Н), 3,64 (с, 3Н), 3,47 (с, 3Н), 2,86 (д, 2Н), 2,39 (с, 3Н), 1,95 (м, 1Н), 1,38 (с, 9Н), 0,76 (д, 6Н)
	1-452	7,49 (д, 1Н), 7,18 (д, 1Н), 7,13 (м, 1Н), 4,31 (с, 2Н), 3,71 (с, 3Н), 3,46 (с, 3Н), 3,42(с, 3Н), 2,88 (д, 2Н), 2,32 (с, 3Н), 2,03 (м, 1Н), 0,79 (д, 6Н)
	1-514	7,53 (д, 1Н), 7,27 (д, 1Н), 7,16 (дд, 1Н), 3,72 (с, 3Н), 3,48 (с, 3Н), 2,92 (д, 2Н), 2,88 (м, 1Н), 2,43 (с, 3Н), 2,07 (м, 1Н), 1,21 (д, 6Н), 0,84 (д, 6Н)
40	1-515	7,41 (д, 1Н), 7,21 (с, 1Н), 7,19 (д, 1Н), 5,28 (с, 2Н), 3,92 (м, 1Н), 3,63 (с, 3Н), 3,44 (с, 3Н), 2,82 (д, 2Н), 2,19 (с, 3Н), 1,94 (м, 1Н), 1,21 (д, 6Н), 0,79 (д, 6Н)
	1-516	7,55 (д, 1Н), 7,32 (д, 1Н), 7,16 (дд, 1Н), 3,79 (с, 3Н), 3,76 (с, 3Н), 3,49 (с, 3Н), 2,94 (д, 2Н), 2,47 (с, 3Н), 2,14 (м, 1Н), 0,92 (д, 6Н)
	1-518	7,53 (д, 1Н), 7,28 (д, 1Н), 7,18 (дд, 1Н) 3,74 (с, 3Н), 3,47 (с, 3Н), 2,92 (м, 1Н), 2,91 (д, 2Н), 2,42 (с, 3Н), 2,07 (м, 1Н), 1,23 (д, 6Н), 0,84 (д, 6Н)
45	1-519	7,42 (д, 1Н), 7,22 (д, 1Н), 7,21 (с, 1Н), 5,28 (с, 2Н), 3,94 (м, 1Н), 3,63 (с, 3Н), 3,44 (с, 3Н), 2,82 (д, 2Н), 2,14 (с, 3Н), 1,95 (м, 1Н), 1,21 (д, 6Н), 0,79 (д, 6Н)
	1-521	7,56 (д, 1Н), 7,35 (д, 1Н), 7,19 (дд, 1Н), 3,81 (с, 3Н), 3,76 (с, 3Н), 3,50 (с, 3Н), 2,94 (д, 2Н), 2,47 (с, 3Н), 2,14 (м, 1Н), 0,92 (д, 6Н)
	1-522	8,17 (ушир., 1Н), 7,78 (д, 1Н), 7,47-7,53 (м, 2Н), 3,84 (с, 3Н), 3,47 (с, 3Н), 2,93 (д, 2Н), 2,62 (с, 3Н), 2,24 (м, 1Н), 0,95 (д, 6Н)
	1-523	7,57 (д, 1Н), 7,39 (д, 1Н), 7,22 (дд, 1Н), 3,84 (с, 3Н), 3,76 (с, 3Н), 3,50 (с, 3Н), 2,95 (д, 2Н), 2,46 (с, 3Н), 2,15 (м, 1Н), 0,92 (д, 6Н)
50	1-524	7,51 (д, 1Н), 7,27 (д, 1Н), 7,20 (дд, 1Н), 3,74 (с, 3Н), 3,46 (с, 3Н), 2,99 (м, 1Н), 2,90 (д, 2Н), 2,37 (с, 3Н), 2,07 (м, 1Н), 1,26 (д, 6Н), 0,82 (д, 6Н)
	1-539	7,55 (д, 1Н), 7,16 (д, 1Н), 7,11 (дд, 1Н), 6,87 (с, 1Н), 3,73 (с, 3Н), 3,48 (с, 3Н), 3,31 (м, 1Н), 2,89 (д, 2Н), 2,04 (м, 1Н), 1,27 (д, 6Н), 0,79 (д, 6Н)

5	1-540	7,55 (д, 1Н), 7,20 (д, 1Н), 7,12 (дд, 1Н), 7,05 (с, 1Н), 3,72 (с, 3Н), 3,49 (с, 3Н), 3,22 (м, 1Н), 2,90 (д, 2Н), 2,05 (м, 1Н), 1,26 (д, 6Н), 0,81 (д, 6Н)
	1-541	7,56 (д, 1Н), 7,21 (д, 1Н), 7,15 (с, 1Н), 7,12 (дд, 1Н), 3,72 (с, 3Н), 3,49 (с, 3Н), 3,17 (м, 1Н), 2,91 (д, 2Н), 2,05 (м, 1Н), 1,25 (д, 6Н), 0,82 (д, 6Н)
	1-542	7,57 (д, 1Н), 7,17 (д, 1Н), 7,09 (дд, 1Н), 7,06 (с, 1Н), 3,78 (с, 3Н), 3,49 (с, 3Н), 3,26 (м, 1Н), 2,90 (д, 2Н), 2,03 (м, 1Н), 1,24 (д, 6Н), 0,78 (д, 6Н)
	1-544	7,51 (д, 1Н), 7,16 (м, 1Н), 6,97 (д, 1Н), 3,82 (с, 3Н), 3,65 (с, 3Н), 2,63 (т, 2Н), 2,27 (с, 3Н), 2,24 (с, 3Н), 2,10 (с, 3Н), 2,00 (с, 3Н), 1,67 (м, 1Н), 0,81 (д, 6Н)
	1-545	7,47 (д, 1Н), 7,34(д, 1Н), 7,11 (м, 1Н), 6,94(д, 1Н), 6,86 (д, 1Н), 3,67(с, 3Н), 2,60(т, 2Н), 2,51(с, 3Н), 2,38 (с, 3Н), 2,28 (с, 3Н), 1,73 (м, 1Н), 0,75 (д, 6Н)
10	2-28	7,62 (с, 1Н), 7,25 (с, 1Н), 3,71 (с, 3Н), 3,50 (с, 3Н), 2,88 (д, 2Н), 2,38 (с, 3Н), 2,32 (с, 3Н), 2,24 (с, 3Н), 2,02 (м, 1Н), 0,85 (д, 6Н)
	2-38	7,41 (с, 1Н), 7,12 (с, 1Н), 3,72 (с, 3Н), 3,48 (с, 3Н), 2,88 (д, 2Н), 2,38 (с, 3Н), 2,30 (с, 3Н), 2,24 (с, 3Н), 2,40-2,30 (м, 2Н), 2,04 (м, 1Н), 1,4 (т, 3Н), 0,85 (д, 6Н)
	2-40	8,26 (с, 1Н), 7,82 (с, 1Н), 7,27 (ушир., 2Н), 3,90 (с, 3Н), 3,45 (с, 3Н), 2,95 (м, 2Н), 2,57 (с, 3Н), 2,32 (с, 3Н), 1,71 (м, 2Н), 1,02 (т, 3Н)
15	2-41	7,37 (с, 1Н), 7,10 (с, 1Н), 6,30 (с, 1Н), 3,59 (с, 3Н), 3,47 (с, 3Н), 3,43 (м, 1Н), 2,92 (ушир., 2Н), 2,48 (с, 3Н), 2,17 (с, 3Н), 1,55 (ушир. 2Н), 1,28 (д, 6Н), 0,94 (т, 3Н)

Инсектициды или акарициды для сельского хозяйства, содержащие замещенное пиразолкарбоксамидное производное, представленное формулой (I), или соль настоящего изобретения в качестве активного ингредиента, являются полезными для борьбы с различными вредными насекомыми, такими как вредные насекомые для сельского хозяйства, вредные насекомые для сохраняемого зерна, вредные санитарные насекомые, нематоды и тому подобное, которые приносят вред необрушенному рису, фруктовым деревьям, растениям другим сельскохозяйственным культурам, цветам и декоративным растениям, и тому подобное. Они имеют заметное инсектицидное воздействие, например, на LEPIDOPTERA, включая листовертку фруктовых деревьев (*Adoxophes orana fasciata*), малую чайную листовертку (*Adoxophyes* sp.), плодоядку маньчжурскую яблонную (*Grapholita inopinata*), листовертку восточную персиковую (*Grapholita molesta*), плодоядку соевую (*Leguminivoraglycinivorella*), листовертку тутовую (*Olethreutes mori*), листовертку чайную (*Caloptilia thevivor*), *Caloptilia* sp. (*Caloptilia zachrysa*), яблонную минирующую моль (*Phy Honor yet er ringonie I la*), горностаевую моль (*Spulerrina astaurota*), репницу (*Piers rapae crucivora*), гусеницу листовертки-почкоеда табачного (*Heliothis* sp.), плодоядку яблонную (*Laspey resia pomonella*), моль капустную (*Plutella xylostella*), побеговую моль бурю (*Argyresthia conjugella*), побеговую моль персиковую (*Carposina niponensis*), рисовую пьявицу (*Chilo suppressalis*), рисовую листовертку (*Snaphalocrocis medinalis*), огневку шоколадную (*Ephestia elutella*), тутовую огневку (*Glyphodes pyloalis*), стеблевую рисовую огневку (*Scirpophaga incertulas*), толстоголовку рисовую (*Parnara guttata*), рисовую совку (*Pseudaletia separata*), огневку розовую (*Sesamia inferens*), совку литуру (*Spodoptera litura*), совку малую (*Spodoptera exigua*) и тому подобное;

HEMIPTERA, включая цикадку шеститочечную (*Macrostoteles fascifrons*), весеннюю рисовую цикадку (*Nephotettix cincticeps*), бурю рисовую цикадку (*Nilaparvata lugens*), белоспинную рисовую цикадку (*Sogatellafurcifera*), восточную листоблошку (*Diaphorina citri*), белокрылку полосатую (*Aleurolibustaonabae*), табачную белокрылку (*Bemisia tabaci*), белокрылку тепличную (*Trialeurodes vaporariorum*), тлю горчичную листовую (*Lipaphiserysimi*), зеленую персиковую тлю (*Myzuspersicae*), ложнощитовку восковую (*Ceroplastes ceriferus*), пульвинарию цитрусовую (*Pulvinaria aurantii*), щитовку японскую камфорную (*Pseudaonidia duplex*), щитовку калифорнийскую (*Corastockaspisperniciosa*), восточную цитрусовую щитовку (*Unaspisyanonensis*) и тому подобное;

TYLENCHIDA, включая хрущика блестяще-рыжего (*Anomala rufocuprea*), японского жука (*Popilliajaponica*), точильщика табачного малого (*Lasioderma serricorne*),

древогрыза темно-бурого (Lyctus brunneus), коровку крапчатую (Epilachnavigintiotopunctata), китайскую зерновку (Callosobruchus chinensis), овощного долгоносика (Listroderescostirostris), кукурузного долгоносика (Sitophilus zeamais), долгоносика-цветоеда хлопкового (Anthonomus grandis), долгоносика рисового водяного (Lissorhoptrus oryzophilus), листоеда тыквенного (Aulacophora femoralis), листоеда рисового (Oulearaa oryzae), жука-блошку полосатую (Phyllotreta striolata), большого соснового лубоеда (Tomicus piniperda), колорадского жука (Leptinotarsa decemlineata), зерновку бобовую мексиканскую (Epilachna varivestis), кукурузных жуков (Diabrotica sp.) и тому подобное;

DIPTERA, включая муху дынную (Dacus(Zeugodacus)cucurbitae), муху восточную фруктовую (Dacus(Вactrocera) dorsalis), рисовую минирующую моль (Agnomyza oryzae), муху луковую (Delia antiqua), муху ростковую (Delia platura), галлицы (Asphondylia sp.) и тому подобное;

TYLENCHIDA, включая корневые нематоды (Pratylenchus sp.), цистообразующие картофельные нематоды (Globodera rostochiensis), корневые галловые нематоды (Meloidogyne sp.), цитрусовые нематоды (Tylenchulus semipenetrans), Aphelenchus sp. (Aphelenchus avenae), хризантемную нематоду (Aphelenchoides ritzemabosi) и тому подобное; и

ACARINA, включая красного цитрусового клеща (Panonychuscitri), красного плодового клеща (Panonychus ulna), красного паутиного клеща (Tetranychus cinnabarinus), клеща Канзавы (Tetranychus Kanzawai Kishida), клещика паутиного двупятнистого (Tetranychus urticae Koch), красного чайного галлового клеща (Acaphylla theae), красного цитрусового галлового клеща (Aculopspelekassi), ложного красного клещика (Calacarus carinatus), грушевого галлового клеща (Epitrimerus pyri) и тому подобное.

Замещенное пиразолкарбоксамидное производное, представленное формулой (I), или его соли, настоящего изобретения предпочтительно используется в качестве инсектицидов или акарицидов для сельского хозяйства. Однако соединение демонстрирует превосходное контролирующее воздействие против различных вредных насекомых, таких как вредные насекомые для леса и древесины, вредные насекомые для животноводства, санитарные вредные насекомые и тому подобное, и могут быть использованы в качестве агентов для борьбы с вредителями в различных широких областях. Примеры вредных насекомых включают: Tabanidae, такие как Tabanus rufidens Bigot; Muscidae, такие как муха комнатная (Musca domestica uicina MACQUART); Gasterophilidae, такие как желудочные оводы (Gasterophilus intestinalis); Hypodermatidae, такие как овод бычий (Hypodermabovis L.); Phoridae, такие как Megaselia spiracularis; Culicidae, такие как бледный кулекс (Culex pipiens pallens), Anopheles sinensis, тигровый комар (Aedes albopictus) и Aedes japonicus; Pulicidae, такие как блоха кошачья (Ctenocephalides felis), блоха собачья (Ctenocephalides canis), блоха человечья (Pulex irritans); Ixodidae, такие как Ixodes ovatus Neumann; Lymantriidae, такие как Euproctis similes; Rhynchophoridae, такие как рисовый долгоносик (Sitophilus zeamais); Vespidae, такие как Vespa simillima xanthoptera Cameron; Blattellidae, такие как рыжие тараканы (Blattella germanica); Blattidae, такие как таракан американский (Periplaneta americana) и Periplaneta japonica; Pthiridae, такие как вши (Phthirus pubis); Termitidae, такие как японские термиты (Reticulitermes speratus) и домашние термиты (Coptotermes formosanus); и Ixodidae, такие как Ixodes persulcatus; и Macronyssidae, такие как тропические крысиные клещи (Ornithonyssus bacoti).

Агенты для сельского хозяйства, в частности инсектициды или акарициды для

сельского хозяйства, содержащие замещенное пиразолкарбоксамидное производное, представленное формулой (I), или его соль настоящего изобретения в качестве активного ингредиента, обладают заметным контролирующим воздействием на приведенных выше вредных насекомых, которые приносят вред сельскохозйственным растениям на рисовых чеках, суходольным сельскохозйственным растениям, фруктовым деревьям, растениям и другим сельскохозйственным культурам, цветам и декоративным растениям и тому подобное. По этой причине, желаемое воздействие инсектицидов для сельского хозяйства настоящего изобретения может быть продемонстрировано путем нанесения агентов на рисовые чеки, на поле, фруктовые деревья, растения, другие сельскохозйственные культуры, семена цветов и декоративных растений, воду в рисовых чеках, черенки и листья или на почву, в то время года, когда ожидается появление вредных насекомых, перед их появлением или во время, когда подтверждается их появление.

Растения, для которых может использоваться агент для сельского хозяйства настоящего изобретения, не являются конкретно ограниченными и включают, например, растения, показанные ниже.

Зерновые культуры (например, рис (*Oryza sativa*), ячмень (*Hordeum vulgare*), пшеницу (*Triticum aestivum* L.), рожь (*Secale cereale*), овес (*Avena*), маис (*Zea mays* L.), гаолян и тому подобное); бобовые (соевые бобы, фасоль лучистую, конские бобы, фасоль, арахис и тому подобное); фруктовые деревья и плоды (яблоки, плоды цитрусовых, груши, виноград, персики, сливы, вишни, грецкий орех, миндаль, банан, клубнику и тому подобное); овощи (капусту, томаты, шпинат, брокколи, салат-латук, лук, лук-батун, зеленый перец и тому подобное); корнеплоды (морковь, картофель, потаты, редис, корень лотоса, репу и тому подобное); технические сельскохозйственные культуры (хлопок, лен (*Linum usitatissimum*), бумажную шелковицу (*Broussonetia kasinoki* SIEB), эджвортю бумагоносную (*Edgeworthia papyrifera*), рапс (*Brassica napus* L.), свеклу (*Beta vulgaris*), хмель, сахарный тростник (*Saccharum officinarum*), сахарную свеклу (*Beta vulgaris var. saccharifera*), оливки, каучук, кофе, табак, чай и тому подобное); тыквенные (тыкву, огурец, арбуз, дыню и тому подобное); траву (садовую траву, сорго, тимофеевку луговую, клевер, люцерну и тому подобное); траву (зойсию японскую, жестковолосистые травы и тому подобное); растения для пряностей (лаванду (*Lavandula officinalis* CHAIX), розмарин, тимьян, петрушку, перец, имбирь и тому подобное); и цветы (хризантемы, розы, орхидеи и тому подобное).

Недавно стали развиваться генномодифицированные рекомбинантные сельскохозйственные культуры (растения, стойкие к гербицидам, растения, стойкие к вредным насекомым, у которых инкорпорирован ген генерирования инсектицидного токсина, стойкие к заболеваниям растения, у которых инкорпорирован ген продуцирования индуктора стойкости к заболеваниям, растения с улучшенным вкусом, растения с улучшенными свойствами консервирования, растения с улучшенной урожайностью и тому подобное), технология с использованием половых феромонов насекомых (химикалии, разрушающие феромоны листоверток, капустной совки и тому подобное), IPM (встроенного контроля вредителей) с использованием природных врагов насекомых, и композиции пестицидов настоящего изобретения могут быть использованы в комбинации или в системе вместе с такими технологиями.

Агент для сельского хозяйства настоящего изобретения, как правило, готовится в удобных для использования формах, в соответствии с обычным

способом приготовления агрохимикалиев.

То есть, замещенное пиразолкарбоксамидное производное, представленное формулой (I), или соль настоящего изобретения и, необязательно, вспомогательное
5 вещество смешивают с подходящим для использования инертным носителем в соответствующей пропорции и приготавливаются в форме соответствующего препарата, такого как суспензия, эмульгируемый концентрат, растворимый концентрат, смачиваемый порошок, диспергируемые в воде гранулы, гранулы, мелкодисперсный порошок, таблетки, упаковка или тому подобное, путем
10 растворения, диспергирования, суспендирования, смешивания, импрегнации, адсорбции или прилипания.

Инертный носитель, используемый в настоящем изобретении, может быть либо твердым, либо жидким. В качестве материала, используемого в качестве твердого носителя, могут быть приведены соевая мука, зерновая мука, древесная мука, мука из
15 коры, опилки, порошкообразные табачные черенки, измельченные в порошок скорлупки грецких орехов, отруби, порошкообразная целлюлоза, жмых, смолы, такие как порошкообразные синтетические полимеры и тому подобное, глины (например, каолин, бентонит и кислотная глина), тальки (например, тальк и пиррофиллит),
20 порошки или хлопья окиси кремния (например, диатомовая земля, кремниевый песок, слюда и белый углерод [синтетическая высокодисперсная кремниевая кислота, называемая также мелкодисперсной гидратированной окисью кремния или гидратированной кремниевой кислотой, некоторые коммерчески доступные продукты содержат силикат кальция в качестве главного компонента]), неорганические или
25 минеральные порошки, такие как активированный уголь, порошкообразная сера, пемза, кальцинированная диатомовая земля, измельченный кирпич, зола, песок, карбонат кальция, фосфат кальция и тому подобное, пластиковые носители, такие как полиэтилен, полипропилен, поли(винилиденхлорид) и тому подобное, химические
30 удобрения (например, сульфат аммония, фосфат аммония, нитрат аммония, мочевины и хлорид аммония) и компост. Такие носители могут быть использованы по отдельности или в виде смеси двух или более их видов.

Материал, используемый в качестве жидкого носителя, выбирают из материалов, которые сами растворяют или которые, даже без такого растворения, способны к
35 диспергированию активного ингредиента с помощью адьюванта. Ниже представлены конкретные примеры жидкого носителя, который может быть использован по отдельности или в виде смеси двух или нескольких видов: вода, спирты (например, метанол, этанол, изопропанол, бутанол и этиленгликоль), кетоны (например, ацетон, метилэтилкетон, метилизобутилкетон, диизобутилкетон и циклогексанон), простые
40 эфиры (например, простой этиловый эфир, диоксан, целлосоль, простой дипропиловый эфир и тетрагидрофуран), алифатические углеводороды (например, керосин и минеральные масла), ароматические углеводороды (например, бензол, толуол, ксилол, растворитель нефти и алкилнафталины), галогенированные
45 углеводороды (например, дихлорэтан, хлороформ, четыреххлористый углерод и хлорбензол), сложные эфиры (например, этилацетат, диизопропилфталат, дибутилфталат и диоктилфталат), амиды (например, диметилформамид, диэтилформамид и диметилацетамид), нитрилы (например, ацетонитрил) и
50 диметилсульфоксид.

Ниже представлены конкретные примеры адьюванта, который используется в зависимости от предназначения или по отдельности, или в комбинации двух или нескольких видов, или, в некоторых случаях, может не использоваться вообще.

Для эмульгирования, диспергирования, растворения и/или смачивания соединения в качестве активного ингредиента используется поверхностно-активное вещество. В качестве поверхностно-активного вещества могут быть приведены простые полиоксиэтиленалкиловые эфиры, простые полиоксиэтиленалкилариловые эфиры, сложные полиоксиэтиленовые эфиры высших жирных кислот, полиоксиэтиленрезонаты, полиоксиэтиленсорбитанмонолаурат, полиоксиэтиленсорбитан моноолеат, алкиларилсульфонат, продукты конденсации нафталинсульфоновых кислот, лигнинсульфонаты и сложные сульфатные эфиры высших спиртов.

Кроме того, для стабилизации дисперсии соединения в качестве активного ингредиента, чтобы сделать его липким и/или связать его, также могут быть использованы адъюванты, приведенные ниже, а именно могут быть использованы такие адъюванты как казеин, желатин, крахмал, метилцеллюлоза, карбоксиметилцеллюлоза, аравийская камедь, поли(виниловые спирты), терпентин, масло из высевок, бентонит и лигнинсульфонаты.

Для улучшения сыпучести твердого продукта могут быть использованы следующие адъюванты, а именно, такие как воски, стеараты, алкилфосфаты и тому подобное.

Адъюванты, такие как продукты конденсации нафталинсульфоновых кислот и поликонденсаты фосфатов, могут быть использованы в качестве активатора пластификации для диспергируемых продуктов.

Адъюванты, такие как силиконовые масла, также могут быть использованы в качестве противовспенивающего агента.

Адъюванты, такие как 1,2-бензизотиазолин-3-он, п-хлор-м-ксиленол, бутил-п-гидроксibenзоат, также могут быть добавлены в качестве консерванта.

Кроме того, если это необходимо, могут быть добавлены также функциональные распределяющие агенты, усилители активности, такие как ингибитор метаболического разложения, подобный пиперонилбутоксиду, агенты антифризы, такие как пропиленгликоль, антиоксиданты, такие как ВНТ, поглотители ультрафиолета и другие добавки.

Содержание соединения в качестве активного ингредиента может изменяться при необходимости, и соединение в качестве активного ингредиента может быть использовано в пропорции, выбранной соответствующим образом, в пределах от 0,01 до 90 частей массовых на 100 частей агентов для сельского хозяйства. Например, в мелкодисперсных порошках или гранулах подходящее для использования содержание соединения в качестве активного ингредиента составляет от 0,01 до 50 мас.%. В эмульгируемом концентрате или смачиваемых порошках оно также составляет от 0,01 до 50 мас.%.

Агент для сельского хозяйства настоящего изобретения используется для борьбы с разнообразными вредными насекомыми следующим образом: его применяют к сельскохозяйственной культуре, на которой, как ожидается, появятся вредные насекомые, или к такому месту, где появление и рост вредных насекомых является нежелательным, как таковой или после соответствующего разбавления водой или суспендирования в воде или тому подобном, в количестве, эффективном для борьбы с вредными насекомыми.

Применяемая дозировка агента для сельского хозяйства настоящего изобретения изменяется в зависимости от различных факторов, таких как цель, вредные насекомые, с которыми должны бороться, состояния роста растения, тенденция к появлению вредных насекомых, погода, условия окружающей среды, форма препарата, способ

нанесения, место нанесения и время нанесения. Она может выбираться соответствующим образом в пределах от 0,001 г до 10 кг, предпочтительно от 0,01 г до 1 кг (в терминах соединения в качестве активного ингредиента) на 10 аров, в зависимости от целей.

5 Агент для сельского хозяйства настоящего изобретения может использоваться в смеси с другими инсектицидами, акарицидами, нематоцидами, фунгицидами, биотическими пестицидами для сельского хозяйства или подобным, для расширения
10 как спектра контролируемых видов вредных насекомых, так и периода времени, когда возможно эффективное нанесение, или для уменьшения дозировки. Кроме того, инсектицид для сельского хозяйства настоящего изобретения может использоваться в смеси с гербицидами, регуляторами роста растений, удобрениями или подобным, в зависимости от ситуаций с применением.

15 В качестве других инсектицидов, акарицидов и нематоцидов для сельского хозяйства, которые используют для указанной выше цели, могут быть приведены такие инсектициды, акарициды и нематоциды для сельского хозяйства, как этион, трихлорфон, метамидофос, ацефат, дихлорвос, мевинфос, монокротофос, малатион, диметоат, формотион, мекарбам, вамидотион, тиометон, дисульфотон, оксидепрофос,
20 налед, метилпаратион, фенитротион, цианофос, пропафос, фентион, протиофос, профенофос, изофенфос, темефос, фентоат, диметилвинфос, хлорфенвинфос, тетрахлорвинфос, фоксим, изоксатион, пираклофос, метидатион, хлорпирифос, хлорпирифосметил, пиридафентион, диазинон, пиримифосметил, фосалон, фосмет, диоксабензофос, хиналфос, тербуфос, этопрофос, кадусафос, месульфенфос,
25 спиродиклофен, метафлумизон, флубендиамид, DPS (NK-0795), фосфокарб, фенамифос, изоамидофос, фостиазат, исазофос, этопрофос, фентион, фоститетан, дихлофентион, тионазин, сульпрофос, фенсульфотион, диамидафос, пиретрин, аллетрин, праллетрин, ресметрин, перметрин, тефлутрин, бифентрин, фенпропатрин, циперметрин, α-циперметрин, цигалотрин, λ-цигалотрин, дельтаметрин, акринатрин,
30 фенвалерат, эсфенвалерат, циклопротрин, этофенпрокс, галфенпрокс, силафлуофен, флуцитринат, флувалинат, меторнил, оксамил, тиодикарб, алдикарб, аланикарб, картап, метолкарб, ксиликарб, пропоксур, феноксикарб, фенобукарб, этиофенкарб, фенотиокарб, бифеназат, ВРМС, карббарил, принтикарб, карбофуран, карбосульфат,
35 фуратиокарб, бенфуракарб, альдоксикарб, диафентиоурон, дифлубензулон, тефлубензулон, гексафлумурон, новалурон, луфенурон, флуфеноксурон, хлорфлуазурон, фенбутатин оксид, гидроксид трициклогексилолова, олеат натрия, олеат калия, метопрен, гидропрен, бинапакрил, амитраз, дикофол, керзен,
40 хлорбензилат, бромпропилат, тетрадифон, бенсультап, бензоксимат, тебуфенозид, метоксифенозид, пиридалил, хромафенозид, пропаргит, ацехинозил, эндосульфат, диофенолан, хлорфенапил, фенпироксимат, тольфенпирад, фипронил, тебуфенпирад, триазамат, этоксазол, гекситиахокс, никотин сульфат, нитенпирам, ацетамиприд, тиаклоприд, имидаклоприд, тиаметоксам, клотианидин, динотефуран, флуазинам,
45 пирипроксифен, гидраметилнон, пиримидифен, пиридабен, циромазин, ТРІС (трипропил изоцианурат), пиметрозин, клофентезин, бупрофедин, тиоциклам, фензахин, хинометионат, индоксакарб, комплексы полинактина, милбемектин, абамектин, емаектин-бензоат, спинозад, ВТ (*Bacillus thuringiensis*), азадирактин,
50 ротенон, гидроксипропил крахмал, левамизол гидрохлорид, метам-натрий, морантель татрат, дазомет, трихламид, пастеуриа пенетранс, *Monacrosporium-phytophagum* и тому подобное.

В качестве фунгицидов для сельского хозяйства, используемых для такой же цели,

как указано выше, могут быть приведены такие фунгициды для сельского хозяйства, как сера, сернистая известь, основной сульфат меди, ипробенфос, эдифенфос, толклофос-метил, тирам, полкарбамат, зинеб, манеб, манкозеп, пропинеб, тиофанат, тиофанатметил, беномил, иминоктадин ацетат, иминокутадин альбещилат, мепронил, флутоланил, пенцикурон, фураметпил, тифузамид, металаксил, оксадиксил, капропамид, дихлофлунамид, флусульфамид, хлорталонил, крезоксим-метил, феноксанил, химексазол, этридиазол, фторимид, процимидон, винклозолин, ипродион, триадимефон, битертанол, трифлумизол, ипконазол, флуконазол, пропиконазол, дифенокназол, миклобутанил, тетраконазол, гексаконазол, тебуконазол, тиадинил, имибенконазол, проклораз, пефуразоат, ципроконазол, изопротиолан, фенаримол, пириметанил, меранипирим, пирифенокс, флуазинам, трифорин, дикломезин, азоксистробин, тиадиазин, каптан, пробеназол, ацибензолар-S-метил, фталид, трициклазол, пирохилон, хинометионат, оксолиновая кислота, дитианон, касугамицин, валидомицин, полиоксин, бластицидин, стрептомицин и тому подобное.

Подобным образом, в качестве гербицидов, могут быть приведены такие гербициды, как глифосат, сульфосат, глифосинат, биалафос, бутамифос, эспрокарб, просулкарб, бентиокарб, пирибутикарб, асулам, линурон, димрон, изоурон, бенсульфурон метил, циклосульфамурон, циносульфурон, пиразосульфурон этил, азимсульфурон, имазосульфурон, тенилхлор, алахлор, претилахлор, кломепроп, этобензанид, мефенацет, пендиметалин, бифенокс, ацифлурфен, лактфен, цигалофор-бутил, иоксинил, бромбутид, аллоксидим, сетоксидим, напропамид, инданофан, пиразолат, бензофенап, пирафлуфен-этил, имазапил, сульфентразон, кафенстрол, бентоксазон, оксадиазон, паракуат, дикуат, пириминобак, симазин, атразин, диметаметрин, триазифлам, бенфлесат, флутиацет-метил, хизалофор-этил, бентазон, пероксид кальция и тому подобное.

Относительно биотических пестицидов, такое же воздействие, как указано выше, может ожидаться при использовании агента для сельского хозяйства настоящего изобретения в смеси, например, с вирусными препаратами, приготовленными из вируса ядерного полиэдроза (NPV), вируса гранулеза (GV), вируса цитоплазматического полиэдроза (CPV), вируса энтомопекс (EPV) и тому подобное; с микробными пестицидами, используемыми в качестве инсектицидов или нематицидов, такими как Monacrosporium phymatophagum, Steinernema carpocapsae, Steirxernema kushidai, Pasteuria penetrans и тому подобное; микробными пестицидами, используемыми в качестве фунгицидов, такими как Trichoderma lignorum, Agrobacterium radiobactor, непатогенная Erwinia carotovora, Bacillus subtilis и тому подобное; и биотическими пестицидами, используемыми в качестве гербицидов, такими как Xanthomonas campestris и тому подобное.

В дополнение, агент для сельского хозяйства настоящего изобретения может использоваться в сочетании с биотическими пестицидами, включая природных врагов, таких как осы-паразиты (Encarsia formosa), осы-паразиты (Aphidius colemani), галлообразующие насекомые (Aphidoletes aphidimyza), осы-паразиты (Diglyphus isaea), клещи-паразиты (Dacnusa sibirica), хищные клещики (Phytoseiulus persimilis), хищные клещики (Amblyseius cucumeris), хищные клопы (Orius sauteri) и тому подобное; микробными пестицидами, такими как Beauveria brongniartii, и тому подобное; и феромонами, такими как (Z)-10-тетрадеценилацетат, (E,Z)-4,10-тетрадекадиенилацетат, (Z)-8-додеценилацетат, (Z)-11-тетрадеценилацетат, (Z)-13-икозен-10-он и тому подобное.

Примеры

Замещенные пиразолкарбоксамидные производные, представленные формулой (I), и замещенное анилиновое производное, представленное формулой (II), и замещенная пиразолкарбоновая кислота, представленная формулой (IV), которые являются промежуточными соединениями настоящего изобретения, описаны далее со ссылками на примеры, которые не должны рассматриваться в качестве ограничивающих.

Пример 1

Получение 1,3-диметил-5-трифторметилпиразол-4-карбоновой кислоты (соединение № 4-1)

4-Йод-1,3-диметил-5-трифторметилпиразол (8,7 г, 30 ммоль) растворяют в тетрагидрофуране (87 мл) и медленно добавляют раствор (1,6М, 28 мл) н-бутиллития в гексане в атмосфере аргона при охлаждении смесью сухой лед/ацетон (не выше -60°C). После перемешивания при -70°C в течение 30 мин смесь постепенно нагревают до комнатной температуры, продувая ее диоксидом углерода. Реакционную смесь выливают в воду, органический слой удаляют и водный слой подкисляют хлористоводородной кислотой. Водный слой экстрагируют этилацетатом. Органический слой промывают водой, сушат над сульфатом магния и концентрируют при пониженном давлении. Полученные неочищенные кристаллы промывают гексаном, с получением желаемого соединения (4,67 г) в виде кристаллов.

Выход 74%.

Свойство: температура плавления 124-125,5°C.

Пример 2

Получение

N-{3-изобутил-4-[1-метокси-2,2,2-трифтор-1-(трифторметил)этил]фенил}-1,5-диметил-3-трифторметилпиразол-4-карбоксамид (соединение № 1-211)

1,5-Диметил-3-трифторметилпиразол-4-карбоновую кислоту (2,09 г, 10 ммоль) растворяют в тионилхлориде и смесь нагревают при кипячении с обратным холодильником в течение 3 час. Смесь концентрируют при пониженном давлении с получением 1,5-диметил-3-трифторметилпиразол-4-карбонилхлорида. Полученный карбонилхлорид добавляют к раствору 3-изобутил-4-[1-метокси-2,2,2-трифтор-1-(трифторметил)этил]анилина (3,29 г, 10 ммоль) и триэтиламина (3,03 г, 30 ммоль) в тетрагидрофуране (30 мл) и смесь нагревают при кипячении с обратным холодильником в течение 2 час. Реакционную смесь разбавляют этилацетатом, промывают водой и сушат над сульфатом магния. После концентрирования при пониженном давлении полученный остаток очищают колоночной хроматографией на силикагеле (гексан:этилацетат=1:1), с получением желаемого соединения (3,64 г) в виде кристаллов.

Выход 70%.

Свойство: температура плавления 138-139°C.

Пример 3

Получение

N-метоксиметил-N-{3-изобутил-4-[1-метокси-2,2,2-трифтор-1-(трифторметил)этил]фенил}-1,5-диметил-3-трифторметилпиразол-4-карбоксамид (соединение № 1-222)

Гидрид натрия (32 мг, 60%, 0,8 ммоль) суспендируют в тетрагидрофуране (10 мл) и добавляют по каплям раствор

N-{3-изобутил-4-[1-метокси-2,2,2-трифтор-1-(трифторметил)этил]фенил}-1,5-диметил-3-трифторметилпиразол-4-карбоксамид (250 мг, 0,48 ммоль) в

тетрагидрофуране (5 мл). После перемешивания при комнатной температуре в течение 30 мин добавляют раствор простого хлорметилметилового эфира (64 мг, 0,8 ммоль) в тетрагидрофуране (2 мл) и смесь перемешивают в течение 5 час.

5 Реакционную смесь выливают в разбавленную хлористоводородную кислоту и экстрагируют этилацетатом. Органический слой промывают водой, сушат над сульфатом магния, концентрируют при пониженном давлении и полученный остаток очищают колоночной хроматографией на силикагеле (гексан:этилацетат=2:1) с получением желаемого соединения (238 мг).

10 Выход: 88%.

Свойство: n_D 1,4669 (22,4°C).

Пример 4

Получение

15 **2-метил-5-н-пропил-4-[1,2,2,2-тетрафтор-1-(трифторметил)этил]анилина (соединение № 3-1)**

5-н-Пропил-2-метиланилин (14,9 г, 0,1 моль) разбавляют смешанным растворителем (300 мл) простой трет-бутилметилового эфира-вода (1:1) и последовательно добавляют гептафторизопропилоид (29,6 г, 0,1 моль), гидросульфат тетрабутиламмония (3,4 г, 0,01 моль), бикарбонат натрия (8,4 г, 0,1 моль) и дитионит натрия (17 г, 0,1 моль). Смесь перемешивают в течение ночи при комнатной температуре. Реакционную смесь разбавляют гексаном, промывают дважды 3 н хлористоводородной кислотой и промывают водным раствором бикарбоната натрия и насыщенным раствором соли. Органический слой сушат над сульфатом магния и концентрируют при пониженном давлении. Остаток очищают хроматографией на силикагеле (гексан:этилацетат=5:1) с получением желаемого соединения (28,5 г).

Выход: 90%.

30 Свойство: $^1\text{H-NMR}$ [CDCl_3/TMS , значение δ (м.д.)] 7,09 (с, 1H), 6,54 (с, 1H), 3,76 (ушир.с, 2H), 2,63 (м, 2H), 2,13 (м, 3H), 1,58 (м, 2H), 0,96 (т, 3H).

Пример 5

Получение

35 **4-[1-метокси-2,2,2-трифтор-1-(трифторметил)этил]-2-метил-5-н-пропиланилина (соединение № 3-3)**

2-Метил-5-н-пропил-4-[1,2,2,2-тетрафтор-1-(трифторметил)этил]анилин (1,6 г, 5 ммоль) растворяют в 28% растворе (9,6 г) метоксида натрия в метаноле и смесь нагревают при кипячении с обратным холодильником в течение 3 час. После того как ей дают возможность охладиться, реакционную смесь выливают в воду со льдом и экстрагируют этилацетатом. Органический слой промывают водой, сушат над сульфатом магния и концентрируют при пониженном давлении. Полученный остаток очищают колоночной хроматографией на силикагеле (гексан:этилацетат=5:1) с получением желаемого соединения (1,31 г).

45 Выход: 79%.

Свойство: $^1\text{H-NMR}$ [CDCl_3/TMS , значение δ (м.д.)] 7,10 (с, 1H), 6,66 (с, 1H), 3,72 (ушир.с, 2H), 3,42 (с, 3H), 2,84 (м, 2H), 2,14 (с, 3H), 1,61 (м, 2H), 1,00 (т, 3H).

Пример 6

50 **Получение 2-метил-5-н-пропил-4-[2,2,2-трифтор-1-(трифторметил)этил]анилина (соединение № 3-2)**

2-Метил-5-н-пропил-4-[1,2,2,2-тетрафтор-1-(трифторметил)этил]анилин (1,6 г, 5

ммоль) растворяют в диметилсульфоксиде (20 мл), добавляют небольшими порциями борогидрид натрия (378 мг, 10 ммоль) и смесь перемешивают при 60°C в течение 5 час. Добавляют лед небольшими порциями к реакционной смеси и затем добавляют уксусную кислоту по каплям. Реакционную смесь разбавляют этилацетатом, органический слой промывают 4 раза водой, сушат над сульфатом магния и концентрируют при пониженном давлении, с получением желаемого соединения (1,47 г).

Выход: 99%.

Свойство: $^1\text{H-NMR}$ [CDCl_3/TMS , значение δ (м.д.)] 7,18 (с, 1H), 6,54 (с, 1H), 4,45-4,20 (ушир., 2H), 4,27 (м, 1H), 2,50 (дд, 2H), 2,14 (с, 3H), 1,57 (м, 2H), 0,98 (т, 3H).

Пример 7

Получение

N-{4-[1-метокси-2,2,2-трифтор-1-(трифторметил)этил]-2-метил-5-н-пропилфенил}-1,3,5-триметилпиразол-4-карбоксамида (соединение № 2-15)

1,3,5-Триметилпиразол-4-карбонилхлорид (172 мг, 1 ммоль), 4-[1-метокси-2,2,2-трифтор-1-(трифторметил)этил]-2-метил-5-н-пропиланилин (329 мг, 1 ммоль) и триэтиламин (303 мг, 3 ммоль) растворяют в тетрагидрофуране (10 мл) и смесь нагревают при кипячении с обратным холодильником в течение 3 час.

Реакционную смесь разбавляют этилацетатом и промывают водой. Органический слой сушат над безводным сульфатом магния и концентрируют при пониженном давлении.

Полученный остаток очищают колоночной хроматографией на силикагеле (гексан:этилацетат=1:2), с получением желаемого соединения (360 мг).

Выход: 77%.

Свойство: температура плавления 132-134°C.

Пример 8

Получение

N-ацетил-N-{4-[1-метокси-2,2,2-трифтор-1-(трифторметил)этил]-2-метил-5-н-пропилфенил}-1,3,5-триметилпиразол-4-карбоксамида (соединение № 2-16)

Гидрид натрия (32 мг, 60%, 0,8 ммоль) суспендируют в тетрагидрофуране (10 мл) и добавляют по каплям раствор

N-{4-[1-метокси-2,2,2-трифтор-1-(трифторметил)этил]-2-метил-5-н-пропилфенил}-1,3,5-триметилпиразол-4-карбоксамида (250 мг, 0,53 ммоль) в тетрагидрофуране (5 мл). После перемешивания при комнатной температуре в течение 30 мин добавляют раствор уксусного ангидрида (80 мг, 0,78 ммоль) в тетрагидрофуране (2 мл) и смесь перемешивают в течение одного дня. Реакционную смесь выливают в разбавленную хлористоводородную кислоту и смесь экстрагируют этилацетатом. Органический слой промывают водой, сушат над сульфатом магния, концентрируют при пониженном давлении и полученный остаток очищают колоночной хроматографией на силикагеле (гексан:этилацетат=1:3) с получением желаемого соединения (139 мг).

Выход: 52%.

Свойство: n_D 1,4905 (25,9°C).

Пример 9

Получение

N-{2-метил-5-н-пропил-4-[2,2,2-трифтор-1-(трифторметил)этил]фенил-2-метил-5-н-пропилфенил}-1,3,5-триметилпиразол-4-карбоксамида (соединение № 2-13)

По методике примера 7, за исключением того, что

2-метил-5-н-пропил-4-[2,2,2-трифтор-1-(трифторметил)этил]анилин используют вместо 4-[1-метокси-2,2,2-трифтор-1-(трифторметил)этил]-2-метил-5-н-пропиланилина, реакцию осуществляют в течение 3 час с получением желаемого соединения.

Выход: 66%.

Свойство: температура плавления 128-131°C.

Пример 10

Получение

N-{3-изобутил-4-[1-метокси-2,2,2-трифтор-1-(трифторметил)этил]фенил}-1,3,5-триметилпиразол-4-карбоксамида (соединение № 1-155)

1,3,5-триметилпиразол-4-карбонилхлорид (3,93 г, 22,8 ммоль), 3-изобутил-4-[1-метокси-2,2,2-трифтор-1-(трифторметил)этил]анилин (5,0 г, 15,2 ммоль) и триэтиламин (3,07 г, 30,4 ммоль) растворяют в тетрагидрофуране (100 мл) и смесь нагревают при кипячении с обратным холодильником в течение 5 час.

Реакционную смесь разбавляют этилацетатом и промывают водой. Органический слой сушат над безводным сульфатом магния и концентрируют при пониженном давлении. Полученные неочищенные кристаллы промывают простым эфиром с получением желаемого соединения (5,62 г).

Выход: 80%.

Свойство: температура плавления 189-190°C.

Пример 11

Получение

N-этоксиметил-N-{3-изобутил-4-[1-метокси-2,2,2-трифтор-1-(трифторметил)этил]фенил}-1,3,5-триметилпиразол-4-карбоксамида (соединение № 1-145)

Гидрид натрия (29 мг, 60%, 0,73 ммоль) суспендируют в тетрагидрофуране (10 мл) и добавляют по каплям раствор

N-{3-изобутил-4-[1-метокси-2,2,2-трифтор-1-(трифторметил)этил]фенил}-1,3,5-триметилпиразол-4-карбоксамида (260 мг, 0,48 ммоль) в тетрагидрофуране (5 мл). После перемешивания при комнатной температуре в течение 30 мин добавляют раствор простого хлорметилэтилового эфира (70 мг, 0,73 ммоль) в тетрагидрофуране (2 мл) и смесь перемешивают в течение одного дня. Реакционную смесь выливают в разбавленную хлористоводородную кислоту и смесь экстрагируют этилацетатом. Органический слой промывают водой, сушат над сульфатом магния, концентрируют при пониженном давлении и полученный остаток очищают колоночной хроматографией на силикагеле (гексан:этилацетат=1:3) с получением желаемого соединения (200 мг).

Выход: 69%.

Свойство: n_D^{20} 1,4892 (22,4°C).

Пример 12

Получение

N-изобутилоксикарбонил-N-{3-изобутил-4-[1-метокси-2,2,2-трифтор-1-(трифторметил)этил]фенил}-1,3,5-триметилпиразол-4-карбоксамида (соединение № 1-152)

Гидрид натрия (29 мг, 60%, 0,73 ммоль) суспендируют в тетрагидрофуране (10 мл) и добавляют по каплям раствор

N-{3-изобутил-4-[1-метокси-2,2,2-трифтор-1-(трифторметил)этил]фенил}-1,3,5-триметилпиразол-4-карбоксамида (260 мг, 0,48 ммоль) в тетрагидрофуране (5 мл). После перемешивания при комнатной температуре в течение 30 мин добавляют

раствор изобутилхлоркарбоната (100 мг, 0,73 ммоль) в тетрагидрофуране (2 мл) и смесь перемешивают в течение одного дня. Реакционную смесь выливают в разбавленную хлористоводородную кислоту и экстрагируют этилацетатом. Органический слой промывают водой, сушат над сульфатом магния, концентрируют при пониженном давлении и полученный остаток очищают колоночной хроматографией на силикагеле (гексан:этилацетат=1:1) с получением желаемого соединения (280 мг).

Выход: 91%.

Свойство: n_D 1,4829 (22,3°C).

Пример 13

Получение

N-{3-изобутил-4-[2,2,2-трифтор-1-(трифторметил)этил]фенил}-1,3,5-триметилпиразол-4-карбоксамида (соединение № 1-123)

1,3,5-Триметилпиразол-4-карбонилхлорид (2,09 г, 10,0 ммоль), 3-изобутил-4-[2,2,2-трифтор-1-(трифторметил)этил]анилин (2,0 г, 6,69 ммоль) и триэтиламин (1,35 г, 13,4 ммоль) растворяют в тетрагидрофуране (60 мл) и смесь нагревают при кипячении с обратным холодильником в течение 5 час. Реакционную смесь разбавляют этилацетатом и промывают водой. Органический слой сушат над безводным сульфатом магния, концентрируют при пониженном давлении и полученный остаток очищают колоночной хроматографией на силикагеле (гексан:этилацетат=1:3) с получением желаемого соединения (2,41 г).

Выход: 77%.

Свойство: температура плавления 148-151°C.

Пример 14

Получение

N-ацетил-N-{3-изобутил-4-[2,2,2-трифтор-1-(трифторметил)этил]фенил}-1,3,5-триметилпиразол-4-карбоксамида (соединение № 1-125)

Гидрид натрия (38 мг, 60%, 0,96 ммоль) суспендируют в тетрагидрофуране (10 мл) и добавляют по каплям раствор

N-{3-изобутил-4-[2,2,2-трифтор-1-(трифторметил)этил]фенил}-

1,3,5-триметилпиразол-4-карбоксамида (300 мг, 0,64 ммоль) в тетрагидрофуране (5 мл). После перемешивания при комнатной температуре в течение 30 мин добавляют раствор ацетилхлорида (75 мг, 0,96 ммоль) в тетрагидрофуране (2 мл) и смесь перемешивают в течение одного дня. Реакционную смесь выливают в разбавленную хлористоводородную кислоту и экстрагируют этилацетатом. Органический слой промывают водой, сушат над сульфатом магния, концентрируют при пониженном давлении и полученный остаток очищают колоночной хроматографией на силикагеле (гексан:этилацетат=1:3) с получением желаемого соединения (90 мг).

Выход: 28%.

Свойство: n_D 1,5021 (22,5°C).

Сравнительный пример получения 1

4-йод-1,3-диметил-5-трифторметилпиразол

Йод (30 г) растворяют в 60% серной кислоте (дымящая, 80 г) и медленно добавляют 1,3-диметил-5-трифторметилпиразол (13,12 г, 80 ммоль) при охлаждении на льду. Смесь перемешивают при 0°C в течение 2 час. Реакционную смесь выливают в воду со льдом и экстрагируют этилацетатом. Органический слой промывают водным тиосульфатом натрия и насыщенным раствором соли, сушат над сульфатом магния и концентрируют при пониженном давлении. Полученные неочищенные кристаллы

промывают гексаном с получением желаемого соединения (20 г) в виде кристаллов.

Выход 86%.

Свойство: ^1H -ЯМР [CDCl_3/TMS , значение δ (м.д.)] 3,98 (с, 3H), 2,26 (с, 3H).

5 Конкретные примеры приготовления и пример исследования настоящего изобретения описаны ниже, но они не должны рассматриваться как ограничивающие объем настоящего изобретения.

Как использовано в примерах, термины "часть" и "части" являются частями по массе.

10 **Пример приготовления 1**

Каждое соединение из перечисленных в табл.1 или табл.2	10 ч
Ксилол	70 ч
15 N-метилпирролидон	10 ч
Смесь простого полиоксиэтиленнонилфенилового эфира и алкилбензолсульфоната кальция	10 ч

Эмульгируемый концентрат готовят путем однородного перемешивания указанных выше ингредиентов для растворения.

20 **Пример приготовления 2**

Каждое соединение из перечисленных в табл.1 или табл.2	3 ч
Порошок глины	82 ч
25 Порошок диатомовой земли	15 ч

Мелкодисперсный порошок готовят путем однородного перемешивания и измельчения указанных выше ингредиентов.

30 **Пример приготовления 3**

Каждое соединение из перечисленных в табл.1 или табл.2	5 ч
Смешанный порошок бентонита и глины	90 ч
Кальций лигнинсульфонат	5 ч

35 Гранулы готовят путем однородного смешивания указанных выше ингредиентов и замешивания полученной смеси вместе с соответствующим количеством воды с последующим гранулированием и сушкой.

Пример приготовления 4

40 Каждое соединение из перечисленных в табл.1 или табл.2	20 ч
Смесь каолина и синтетической высокодисперсной кремниевой кислоты	75 ч
Смесь простого нонилфенилового эфира полиоксиэтилена и алкилбензолсульфоната кальция	5 частей

45 Смачиваемый порошок готовят путем однородного смешивания и измельчения указанных выше ингредиентов.

Пример исследования 1:

Акарицидное действие на клещик паутинный двупятнистый (*Tetranychus urticae*)

50 Диск листа фасоли обыкновенной диаметром 2 см помещают на влажную фильтровальную бумагу. Десять взрослых самцов клещика паутинного двупятнистого инокулируют на каждый диск листа и опыляют 50 мл исследуемого раствора, полученного путем разбавления препарата, содержащего каждое из соединений,

перечисленных в табл.1 или табл.2, в качестве активного ингредиента, для установления каждой из концентраций при 500 ч./млн, 50 ч./млн и 5 ч./млн. Через два дня после обработки считают выживших клещей. Скорректированную смертность вычисляют с помощью следующего уравнения, и акарицидную активность оценивают в соответствии с критерием, показанным ниже. Эксперимент осуществляют двукратно при условиях, при 25°C.

$$\text{Скорректированная смертность (\%)} = \frac{\text{Количество выживших клещей в необработанной группе} - \text{Количество выживших клещей в обработанной группе}}{\text{Количество выживших клещей в необработанной группе}} \times 100$$

Критерий:

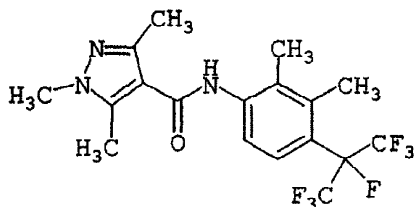
A --- Скорректированная смертность 100%

B --- Скорректированная смертность 99-90%

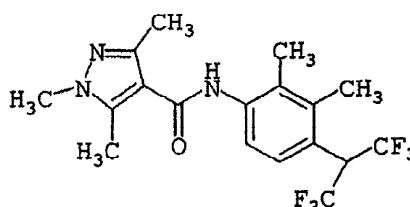
C --- Скорректированная смертность 89-80%

D --- Скорректированная смертность 79-50%

В качестве сравнительных соединений используют соединения №№ 1-163 и 1-164, описанные в заявке на патент Японии JP-A-2003-48878.



(1-163)



(1-164)

В результате приведенного выше исследования соединения №№ 1-1, 1-3, 1-4, 1-6, 1-8, 1-10, 1-12, 1-13, 1-15, 1-16, (1-25)-(1-28), 1-31, (1-34)-(1-37), 1-45, (1-47)-(1-49), (1-51)-(1-54), 1-56, 1-57, 1-59, 1-67, (1-69)-(1-72), (1-74)-(1-76), 1-89, (1-101)-(1-114), (1-120)-(1-160), (1-176)-(1-225), 1-228, 1-234, 1-246, 1-258, 1-260, 1-266, 1-270, 1-282, 1-285, 1-294, (1-306)-(1-325), (1-327)-(1-332), (1-335)-(1-337), (1-339)-(1-342), (1-344)-(1-358), (1-361)-(1-373), (1-375)-(1-380), (1-382)-(1-384), (1-386)-(1-389), (1-391)-(1-394), 1-396, (1-399)-(1-406), (1-412)-(1-416), (1-420)-(1-423), (1-425)-(1-427), (1-429)-(1-433), (1-435)-(1-439), (1-441)-(1-445), 1-448, (1-450)-(1-452), (1-454)-(1-463), (1-467)-(1-470), 1-473, 1-477, 1-478, (1-482)-(1-487), (1-489)-(1-493), (1-496)-(1-502), 1-510, 1-514, 1-515, 1-518, 1-519, (1-523)-(1-527), 1-531, (1-539)-(1-541), (1-546)-(1-549), 2-13, (2-15)-(2-17), (2-21)-(2-23), 2-25, 2-34, (2-36)-(2-39), (2-41)-(2-43) и 2-45 настоящего изобретения показывают активность А при любой концентрации, 500 ч./млн, 50 ч./млн и 5 ч./млн, и соединения №№ 1-23, 1-32, 1-78, 1-173, 1-284, 1-326, 1-334, 1-338, 1-343, 1-385, (1-397)-(1-398), 1-408, 1-410, 1-417, 1-440, 1-447, 1-449, 1-464, 1-472, 1-475, 1-476, 1-479, 1-480, (1-504)-(1-506), 1-509, 1-521, 1-529, 1-530, 1-533, 1-542, (2-26)-(2-33), 2-40 и 2-46 показывают активность А при любой концентрации, 500 ч./млн и 50 ч./млн. В противоположность этому, оба контрольные соединения не показывают акарицидной активности даже при концентрации 500 ч./млн.

В соответствии с настоящим изобретением, могут быть получены агенты для сельского хозяйства, в частности, инсектициды и акарициды, обладающие превосходными свойствами по сравнению с обычными технологиями.

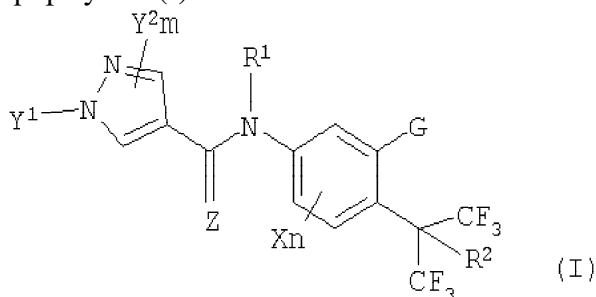
Настоящая заявка основывается на заявках на патент №№ 234405/2005, 322531/2005 и 114937/2006, поданных в Японии, содержание которых включено в данное описание посредством ссылок.

Хотя настоящее изобретение показано и описано со ссылками на его предпочтительные варианты осуществления, специалистам в данной области будет понятно, что могут быть произведены различные изменения в форме и в деталях без отклонения от объема настоящего изобретения, охваченного прилагаемой формулой изобретения.

Все патенты, патентные публикации и другие публикации, идентифицированные или приведенные в данном описании, включены посредством ссылок во всей их полноте.

Формула изобретения

1. Замещенное пиразолкарбоксамидное производное, представленное формулой (I):



где R^1 представляет собой 1а) атом водорода, 2а) C_1 - C_8 алкильную группу, 3а) галоген C_1 - C_6 алкильную группу, 4а) C_1 - C_6 алкилкарбонильную группу, 5а) галоген C_1 - C_6 алкилкарбонильную группу, 6а) C_2 - C_6 алкенилкарбонильную группу, 13а) C_2 - C_6 алкенильную группу, 17а) C_1 - C_{10} алкокси C_1 - C_6 алкильную группу, 18а) галоген C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_6 алкильную группу, 19а) C_2 - C_6 алкенилокси C_1 - C_6 алкильную группу, 20а) C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_6 алкильную группу, 29а) фенил C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_6 алкильную группу, 31а) C_1 - C_{16} алкоксикарбонильную группу, 32а) C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_6 алкоксикарбонильную группу, 33а) галоген C_1 - C_6 алкоксикарбонильную группу, 34а) C_2 - C_6 алкенилоксикарбонильную группу, 35а) C_1 - C_6 алкилтиокарбонильную группу, 42а) фенил C_1 - C_6 алкильную группу, 43а) замещенную фенил C_1 - C_6 алкильную группу, имеющую на кольце один или несколько одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена, с) нитрогруппы и d) C_1 - C_6 алкильной группы, 44а) фенилкарбонильную группу, 45а) замещенную фенилкарбонильную группу, имеющую на кольце один или несколько одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена, с) нитрогруппы, d) C_1 - C_6 алкильной группы, е) галоген C_1 - C_6 алкильной группы и f) C_1 - C_6 алкоксигруппы, 47а) замещенную гетероциклическую карбонильную группу, выбранную из пиразинкарбонильной группы, пиразолкарбонильной группы, тиофенкарбонильной группы и тиазолкарбонильной группы, имеющую на кольце один или несколько одинаковых или различных заместителей, выбранных из d) C_1 - C_6 алкильной группы, 48а) феноксикарбонильную группу, 50а) фенокси C_1 - C_6 алкилкарбонильную группу, 53а) замещенную фенилсульфонильную группу, имеющую на кольце один или несколько одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена, 58а) ди C_1 - C_6 алкиламинотиогруппу, где алкильные группы являются одинаковыми или различными, 59а) C_3 - C_6 циклоалкилкарбонильную группу, 61а)

- C_1-C_6 алкил C_3-C_6 циклоалкилкарбонильную группу, 63а)
 фенил C_1-C_6 алкилкарбонильную группу, 65а) фенил C_3-C_6 циклоалкилкарбонильную
 группу, 68а) C_1-C_6 алкокси C_1-C_6 алкилкарбонильную группу, 72а)
 5 C_1-C_6 алкилкарбонил C_1-C_6 алкильную группу, 73а)
 C_1-C_6 алкилкарбонил C_1-C_6 алкилкарбонильную группу или 74а)
 C_1-C_6 алкоксикарбонил C_1-C_6 алкилкарбонильную группу;
 R^2 представляет собой 1b) атом водорода, 2b) атом галогена или 7b)
 10 C_1-C_6 алкоксигруппу;
 G представляет собой 1 с) C_2-C_{10} алкильную группу, 3с) C_3-C_{10} алкенильную группу
 или 11 с) C_3-C_8 циклоалкил C_1-C_6 алкильную группу;
 Z представляет собой атом кислорода;
 15 X могут быть одинаковыми или различными и представляют собой Id) атом
 водорода, 2d) атом галогена или 5d) C_1-C_6 алкильную группу;
 Y^1 представляет собой 2е) C_1-C_6 алкильную группу, 3е) галоген C_1-C_6 алкильную
 группу или 4е) C_2-C_6 алкенильную группу;
 20 Y^2 могут быть одинаковыми или различными и представляют собой 2f) атом
 галогена,
 9f) C_1-C_6 алкильную группу, 10f) галоген C_1-C_6 алкильную группу или 31f)
 C_1-C_6 алкилтиогруппу;
 25 m равно 1 или 2; и
 n равно 1,
 или его соль.
2. Замещенное пиразолкарбоксамидное производное по п.1, где R^1 представляет
 30 собой 1а) атом водорода, 2а) C_1-C_8 алкильную группу, 3а) галоген C_1-C_6 алкильную
 группу, 4а) C_1-C_6 алкилкарбонильную группу, 5а) галоген C_1-C_6 алкилкарбонильную
 группу, 6а) C_2-C_6 алкенилкарбонильную группу, 13а) C_2-C_6 алкенильную группу, 17а) C
 $1-C_{10}$ алкокси C_1-C_6 алкильную группу, 18а) галоген C_1-C_6 алкокси C_1-C_6 алкильную
 35 группу, 19а) C_2-C_6 алкенилокси C_1-C_6 алкильную группу, 20а)
 C_1-C_6 алкокси C_1-C_6 алкокси C_1-C_6 алкильную группу, 29а)
 фенил C_1-C_6 алкокси C_1-C_6 алкильную группу, 31а) C_1-C_{16} алкоксикарбонильную
 группу, 32а) C_1-C_6 алкокси C_1-C_6 алкоксикарбонильную группу, 33а)
 40 галоген C_1-C_6 алкоксикарбонильную группу, 34а) C_2-C_6 алкенилоксикарбонильную
 группу, 35а) C_1-C_6 алкилтиокарбонильную группу, 42а) фенил C_1-C_6 алкильную
 группу, 43а) замещенную фенил C_1-C_6 алкильную группу, имеющую на кольце один
 или несколько одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома
 45 галогена, с) нитрогруппы и d) C_1-C_6 алкильной группы, 44а) фенилкарбонильную
 группу, 45а) замещенную фенилкарбонильную группу, имеющую на кольце один или
 несколько одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена,
 с) нитрогруппы, d) C_1-C_6 алкильной группы, е) галоген C_1-C_6 алкильной группы и f)
 50 C_1-C_6 алкоксигруппы, 47а) замещенную гетероциклкарбонильную группу,
 выбранную из пиразинкарбонильной группы, пиразолкарбонильной группы,
 тиофенкарбонильной группы и тиазолкарбонильной группы, имеющую на кольце

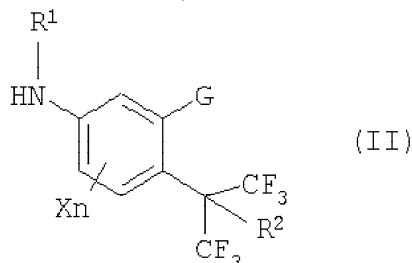
- один или несколько одинаковых или различных заместителей, выбранных из d) C_1 - C_6 алкильной группы, 48a) феноксикарбонильную группу, 50a) фенокси C_1 - C_6 алкилкарбонильную группу, 53a) замещенную фенилсульфонильную
- 5 группу, имеющую на кольце один или несколько одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена, 58a) ди C_1 - C_6 алкиламиногруппу, где алкильные группы являются одинаковыми или различными, 59a) C_3 - C_6 циклоалкилкарбонильную группу, 61 а)
- 10 C_1 - C_6 алкил C_3 - C_6 циклоалкилкарбонильную группу, 63a) фенил C_1 - C_6 алкилкарбонильную группу, 65a) фенил C_3 - C_6 циклоалкилкарбонильную группу, 68a) C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_6 алкилкарбонильную группу, 73a) C_1 - C_6 алкилкарбонил C_1 - C_6 алкилкарбонильную группу или 74a)
- 15 C_1 - C_6 алкоксикарбонил C_1 - C_6 алкилкарбонильную группу, или его соль.
3. Замещенное пиразолкарбоксамидное производное по п.1 или 2, где R^2 представляет собой 1b) атом водорода, 2b) атом галогена или 7b) C_1 - C_6 алкоксигруппу.
- 20 4. Замещенное пиразолкарбоксамидное производное по п.1 или 2, где G представляет собой 1 с) C_2 - C_{10} алкильную группу, 3с) C_3 - C_{10} алкенильную группу или 11 с) C_3 - C_8 циклоалкил C_1 - C_6 алкильную группу, или его соль.
5. Замещенное пиразолкарбоксамидное производное по п.1 или 2, где X
- 25 представляет собой 1d) атом водорода, 2d) атом галогена или 5d) C_1 - C_6 алкильную группу, или его соль.
6. Замещенное пиразолкарбоксамидное производное по п.1 или 2, где Z представляет собой атом кислорода;
- 30 Y^1 представляет собой 2e) C_1 - C_6 алкильную группу, 3e) галоген C_1 - C_6 алкильную группу или 4e) C_2 - C_6 алкенильную группу;
- Y^2 могут быть одинаковыми или различными и представляют собой 2f) атом галогена,
- 35 9f) C_1 - C_6 алкильную группу, 10f) галоген C_1 - C_6 алкильную группу или 31f) C_1 - C_6 алкилтиогруппу, или его соль.
7. Замещенное пиразолкарбоксамидное производное по п.1, где R^1 представляет собой 1a) атом водорода, 4a) C_1 - C_6 алкилкарбонильную группу, 5a)
- 40 галоген C_1 - C_6 алкилкарбонильную группу, 17a) C_1 - C_{10} алкокси C_1 - C_6 алкильную группу, 18a) галоген C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_6 алкильную группу, 31a) C_1 - C_{16} алкоксикарбонильную группу, 33a) галоген C_1 - C_6 алкоксикарбонильную группу или 68a) C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_6 алкилкарбонильную группу;
- 45 R^2 представляет собой 1b) атом водорода или 7b) C_1 - C_6 алкоксигруппу;
- G представляет собой 1с) C_2 - C_{10} алкильную группу;
- Z представляет собой атом кислорода;
- X представляет собой 1d) атом водорода;
- 50 Y^1 представляет собой 2e) C_1 - C_6 алкильную группу;
- Y^2 могут быть одинаковыми или различными и представляют собой 2f) атом галогена,

9f) C_1 - C_6 алкильную группу или 10f) галоген C_1 - C_6 алкильную группу или его соль.

8. Акарицид для сельского хозяйства, содержащий замещенное пиразолкарбоксамидное производное по пп.1-7 или его соль в качестве активного ингредиента.

9. Способ применения акарицида для сельского хозяйства, который включает обработку целевого растения или почвы эффективным количеством акарицида для сельского хозяйства по п.8 для борьбы с вредными организмами на полезных растениях.

10. Замещенное анилиновое производное, представленное формулой (II):



R^1 представляет собой 1а) атом водорода, 2а) C_1 - C_8 алкильную группу, 3а) галоген C_1 - C_6 алкильную группу, 4а) C_1 - C_6 алкилкарбонильную группу, 5а) галоген C_1 - C_6 алкилкарбонильную группу, 6а) C_2 - C_6 алкенилкарбонильную группу, 13а) C_2 - C_6 алкенильную группу, 17а) C_1 - C_{10} алкокси C_1 - C_6 алкильную группу, 18а) галоген C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_6 алкильную группу, 19а) C_2 - C_6 алкенилокси C_1 - C_6 алкильную группу, 20а) C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_6 алкильную группу, 29а) фенил C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_6 алкильную группу, 31а) C_1 - C_{16} алкоксикарбонильную группу, 32а) C_1 - C_6 алкокси C_1 - C_6 алкоксикарбонильную группу, 33а) галоген C_1 - C_6 алкоксикарбонильную группу, 34а) C_2 - C_6 алкенилоксикарбонильную группу, 35а) C_1 - C_6 алкилтиокарбонильную группу, 42а) фенил C_1 - C_6 алкильную группу, 43а) замещенную фенил C_1 - C_6 алкильную группу, имеющую на кольце один или несколько одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена, с) нитрогруппы и d) C_1 - C_6 алкильной группы, 44а) фенилкарбонильную группу, 45 а) замещенную фенилкарбонильную группу, имеющую на кольце один или несколько одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена, с) нитрогруппы, d) C_1 - C_6 алкильной группы, е) галоген C_1 - C_6 алкильной группы и f) C_1 - C_6 алкоксигруппы, 47а) замещенную гетероциклкарбонильную группу, выбранную из пиразинкарбонильной группы, пиразолкарбонильной группы, тиофенкарбонильной группы и тиазолкарбонильной группы, имеющую на кольце один или несколько одинаковых или различных заместителей, выбранных из d) C_1 - C_6 алкильной группы, 48а) феноксикарбонильную группу, 50а) фенокси C_1 - C_6 алкилкарбонильную группу, 53а) замещенную фенилсульфонильную группу, имеющую на кольце один или несколько одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена, 58а) ди C_1 - C_6 алкиламинотиогруппу, где алкильные группы являются одинаковыми или различными, 59а) C_3 - C_6 циклоалкилкарбонильную группу, 61а) C_1 - C_6 алкил C_3 - C_6 циклоалкилкарбонильную группу, 63а) фенил C_1 - C_6 алкилкарбонильную группу, 65а) фенил C_3 - C_6 циклоалкилкарбонильную

группу, 68a) C_1-C_6 алкокси C_1-C_6 алкилкарбонильную группу, 72a)

C_1-C_6 алкилкарбонилокси C_1-C_6 алкильную группу, 73a)

C_1-C_6 алкилкарбонил C_1-C_6 алкилкарбонильную группу или 74a)

5 C_1-C_6 алкоксикарбонил C_1-C_6 алкилкарбонильную группу;

R^2 представляет собой 1b) атом водорода, 2b) атом галогена или 7b)

C_1-C_6 алкоксигруппу;

10 G представляет собой 1c) C_2-C_{10} алкильную группу, 3c) C_3-C_{10} алкенильную группу или 11c) C_3-C_8 циклоалкил C_1-C_6 алкильную группу;

X могут быть одинаковыми или различными и представляют собой 1d) атом водорода, 2d) атом галогена или 5d) C_1-C_6 алкильную группу;

n равно 1,

15 или его соль.

11. Замещенное анилиновое производное по п.10, где R^1 представляет собой 1a) атом водорода, 2a) C_1-C_6 алкильную группу, 3a) галоген C_1-C_6 алкильную группу, 4a)

C_1-C_6 алкилкарбонильную группу, 5a) галоген C_1-C_6 алкилкарбонильную группу, 17a) C

20 C_1-C_6 алкокси C_1-C_6 алкильную группу, 18a) галоген C_1-C_6 алкокси C_1-C_6 алкильную группу, 31a) C_1-C_{16} алкоксикарбонильную группу, 33a)

галоген C_1-C_6 алкоксикарбонильную группу, 44a) фенилкарбонильную группу или 45a)

замещенную фенилкарбонильную группу, имеющую на кольце один или несколько

25 одинаковых или различных заместителей, выбранных из а) атома галогена, б)

цианогруппы, с) нитрогруппы, d) C_1-C_6 алкильной группы, е) галоген C_1-C_6 алкильной группы и f) C_1-C_6 алкоксигруппы;

R^2 представляет собой 1b) атом водорода, 2b) атом галогена или 7b)

30 C_1-C_6 алкоксигруппу;

G представляет собой 1c) C_2-C_{10} алкильную группу; и

X представляет собой 1d) атом водорода или 5d) C_1-C_6 алкильную группу, или его соль.

35 12. 1,3-Диметил-5-трифторметилпиразол-4-карбоновая кислота или его соль.

40

45

50