



УКРАЇНА

(19) UA (11) 35563 (13) C2

(51) 6 A01N37/28, 37/52, 43/40, 43/58,  
C07C251/22, 251/74, 251/78МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ  
І НАУКИ УКРАЇНИДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ  
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ  
ВЛАСНОСТІОПИС  
ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД

(54) ПОХІДНІ N-АРИЛГІДРАЗИНУ, СПОСІБ ЇХ ОДЕРЖАННЯ, СПОСІБ ПРИГНІЧЕННЯ КОМАХ ТА КОМПОЗИЦІЯ ДЛЯ ПРИГНІЧЕННЯ КОМАХ

(21) 93003777

(22) 27.12.1993

(24) 16.04.2001

(31) 07/998.101, 07/998.104, 07/998.105

(32) 29.12.1992, 29.12.1992, 29.12.1992

(33) US, US, US

(46) 16.04.2001, Бюл. № 3, 2001 р.

(72) Ферч Джозеф Августус, US, Кун Девід  
Джордж, US, Хант Девід Аллен, US, Л'ю Альберт  
Чін, US, Гроностайскі Сінтіа Емма, US

(73) АМЕРІКАН ЦІАНАМІД КОМПАНІ, US

(56) FR 2186024, 1974.

US 3879542, 1975.

US 3879543, 1975.

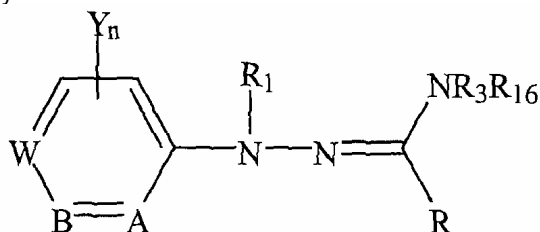
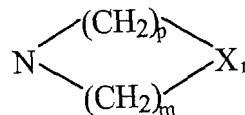
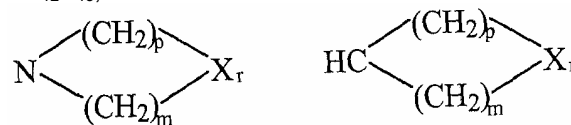
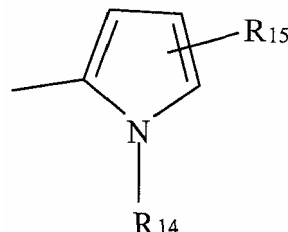
SU 578821, 1977.

JP 63-152355, 1988.

FR 2105698, 1972.

SU 214541, 1968.

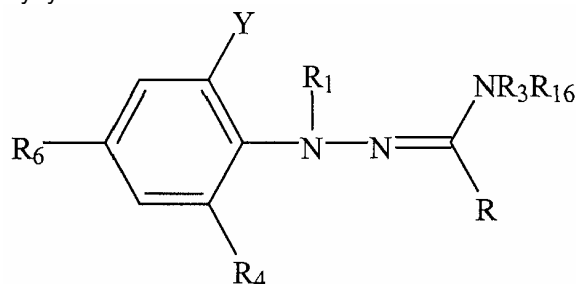
(57) 1. Производные N-арилгидразина общей формулы:

где А представляет C-R<sub>4</sub>; В представляет C-R<sub>5</sub>; W представляет C-R<sub>6</sub>; Y представляет галоген, водород; n равно целому числу из 0, 1 или 2;R представляет C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>алкил, необязательно замещенный одним-тремя галогенами, фенилом, необязательно замещенным одним-тремя галогенами;C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub> циклоалкил, необязательно замещенный одним или более галогенами,C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкилом, фенилом, необязательно замещенным одним-тремя галогенами;R<sub>1</sub> представляет водород;R<sub>3</sub> и R<sub>16</sub>, независимо друг от друга представляют водород, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> алкил, необязательно замещенный одним или более галогенами, R<sub>10</sub>, R<sub>11</sub>, пиридилом, фенилом, необязательно замещенным одним или более галогенами; C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub> алкенил, C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>-циклоалкил, необязательно замещенный галогеном; фенил, необязательно замещенный галогеном или галоген-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-алкоксигруппой; или фурфурил; илиR<sub>3</sub> и R<sub>16</sub> взятые вместе с атомом азота образуют кольцо, представленное структуройR<sub>4</sub>, R<sub>5</sub>, R<sub>6</sub> независимо друг от друга представляют собой водород, галоген, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкил, при условии, что R<sub>4</sub> и один из R<sub>3</sub> или R<sub>16</sub>, являются отличными от водорода, R<sub>10</sub> представляет NR<sub>12</sub>R<sub>13</sub>,R<sub>11</sub>, представляетR<sub>12</sub>, R<sub>13</sub>, R<sub>14</sub>, R<sub>15</sub> независимо друг от друга представляют водород, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкил;X представляет О или NR<sub>14</sub>,

r означает 0 или 1,

p и m независимо друг от друга равны целому числу 1 или 2, при условии, что сумма p+m+r должна быть равна 4 или 5, в качестве инсектицидных средств.

2. Соединение по п. 1, имеющее структурную формулу:

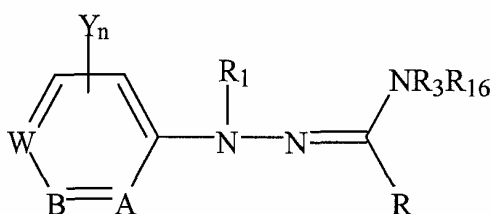


(13) C2

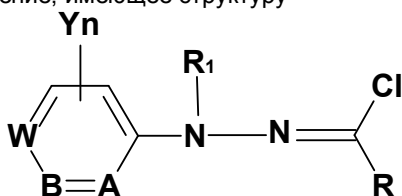
(11) 35563

(19) UA

где R представляет C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-алкил;  
 R<sub>1</sub> представляет водород;  
 R<sub>3</sub> представляет C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-алкил, фенил, необязательно замещенный галогеном или галоген C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-алкоксигруппой; или фурурил;  
 R<sub>16</sub> представляет водород, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-алкил;  
 R<sub>4</sub>, R<sub>6</sub> независимо друг от друга представляют водород, галоген, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкил;  
 Y представляет галоген, водород, при условии, что R<sub>4</sub> должен быть отличен от водорода.  
 3. Соединение по п. 2, представляющее собой N-этил-2,2-диметилпропионамид, 2-(2,6-дихлор-α, α, α-трифтор-р-толил)гидразон.  
 4. Способ получения соединения, имеющего структуру:

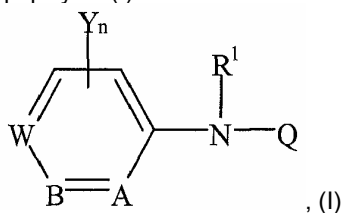


где A, B, W, Y, n, R, R<sub>1</sub>, R<sub>3</sub> и R<sub>16</sub>, имеют значения, определенные в п. 1, **отличающийся** тем, что соединение, имеющее структуру

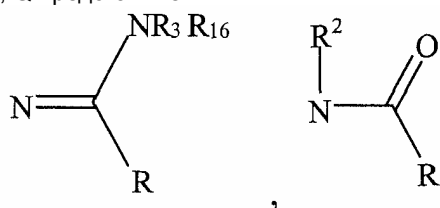


подвергают взаимодействию с, по крайней мере, одним молярным эквивалентом амина формулы HNR<sub>3</sub>R<sub>16</sub>.

5. Способ подавления насекомых, включающий контактирование указанных вредителей или их корма, места обитания или размножения с производным гидразина, **отличающийся** тем, что в качестве производного гидразина используют соединение формулы (I)

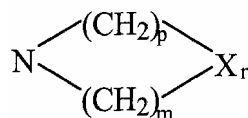


где A представляет C-R<sub>4</sub> или N; B представляет C-R, или N; W представляет C-R<sub>6</sub> при условии, что когда все из A, B и W отличны от N, тогда R не может быть фенилом или замещенным фенилом; Y представляет галоген, n равно целому из 0, 1 или 2, Q представляет

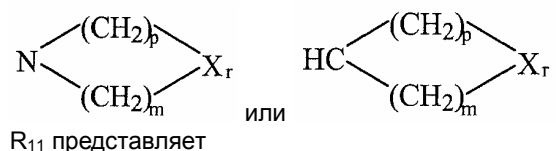


R представляет C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>алкил, необязательно замещенный одним или более галогенами, фенилом, необязательно замещенным одним-тремя

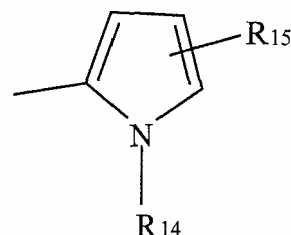
галогенами;  
 C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>-циклоалкил, необязательно замещенный одним или более галогенами,  
 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкилом, фенилом;  
 фенил, необязательно замещенный одним или более галогеном;  
 R<sub>1</sub> и R<sub>2</sub> представляют водород;  
 R<sub>3</sub> и R<sub>16</sub> независимо друг от друга представляют водород, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-алкил, необязательно замещенный одним или более галогенами, CONR<sub>7</sub>R<sub>8</sub>, R<sub>10</sub>, R<sub>11</sub>, фенилом, необязательно замещенным одним или более галогеном, или пиридилом; фенил, необязательно замещенный галогеном или галоген-C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-алкоксигруппой, или фурурил, C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-алкенил, C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>-циклоалкил, или  
 R<sub>3</sub> и R<sub>16</sub> могут, взятые вместе с атомом азота, образовывать кольцо, представленное структурой



R<sub>4</sub>, R<sub>5</sub> и R<sub>6</sub> независимо друг от друга представляют водород, галоген, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкил;  
 R<sub>7</sub>, R<sub>8</sub> независимо друг от друга представляют водород, R<sub>10</sub> представляет NR<sub>12</sub>R<sub>13</sub>,

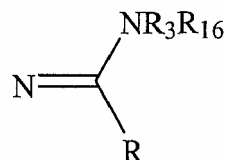


R<sub>11</sub> представляет



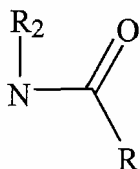
R<sub>12</sub>, R<sub>13</sub>, R<sub>14</sub> и R<sub>15</sub> каждый независимо представляет водород или C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкил;  
 X представляет O или NR<sub>14</sub>, r представляет целое число из 0 или 1, p и m независимо каждый равны целому числу 1 или 2, при условии, что сумма p+m+r должна быть равна 4 или 5, его соли при соединения кислоты в пестицидно-эффективном количестве.

6. Способ по п. 5, **отличающийся** тем, что Q представляет



7. Способ по п. 6, **отличающийся** тем, что A представляет C-R<sub>4</sub>, B представляет CH, Y представляет галоген, n равно 1, R<sub>4</sub> и R<sub>6</sub> независимо друг от друга представляют галоген или C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил, замещенный одним или более галогенами, и R, R<sub>3</sub> и R<sub>16</sub> независимо друг от друга представляют водород или C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> алкил.

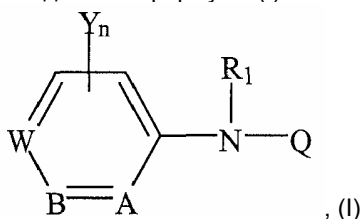
8. Способ по п. 5, **отличающийся** тем, что Q представляет



9. Способ по п. 8, **отличающийся** тем, что R представляет C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил, A представляет C-R<sub>4</sub>, B представляет C-R<sub>5</sub>, Y представляет галоген, n равно 1, R<sub>4</sub> представляет водород, и R<sub>5</sub> представляет C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил, замещенный одним или более галогенами.

10. Способ по п. 9, **отличающийся** тем, что соединение представляет собой 2,2-диметилпропионовую кислоту, 2-(2,6-дихлор-α,α,α-трифтор-р-толил)гидразин.

11. Композиция для подавления насекомых содержащая инертный жидкий или твердый носитель и производное гидразина, **отличающаяся** тем, что в качестве производного гидразина она содержит соединение формулы (I)

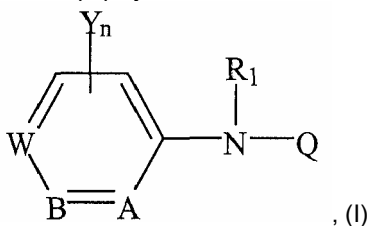


Некоторые вредители из числа насекомых и клещей являются пагубными и наносят ежегодно громадные потери посевам сельскохозяйственных культур, хранимым продуктам и здоровью человека и животных. Целью данного изобретения является разработка замещенных производных N-арилгидразина, которые являются эффективными средствами контроля вредных насекомых и клещей.

Другой целью данного изобретения является разработка способа защиты важных агрономических посевов от вреда и ущерба, наносимого насекомыми и клещами вредителями.

Дополнительной целью данного изобретения является разработка инсектицидных и акарицидных композиций.

Настоящее изобретение касается разработки способа контроля за насекомыми и клещами, который включает контактирование указанных насекомых или клещей, или их корма, грунта, в котором они находятся, или их жилища с инсектицидно эффективным количеством производного N-арилгидразина формулы I

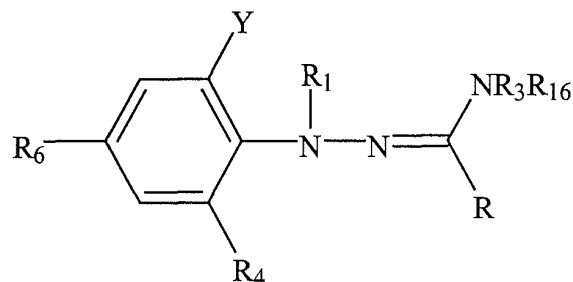


в которой

A представляет C-R<sub>4</sub> или N;

B представляет C-R<sub>5</sub> или N;

где A, B, W, Y, n, R<sub>1</sub> и Q определены в п. 5, при условии, что когда все из A, B и W отличны от N, то R не может быть фенилом или замещенным фенилом, в пестицидно-эффективном количестве. 12. Композиция по п. 11, **отличающаяся** тем, что соединение формулы (I) имеет структуру

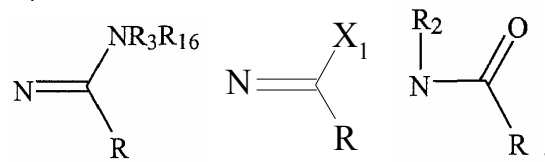


и R представляет C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> алкил, R<sub>1</sub> представляет водород, R<sub>3</sub> представляет C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-алкил, R<sub>16</sub> представляет водород или C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> алкил и R<sub>4</sub>, R<sub>6</sub> и Y независимо друг от друга представляют водород, галоген, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкил.

W представляет C-R или N, при условии, что один из A, B или W должен быть отличен от N.

Y представляет водород, галоген, CN, NO<sub>2</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси или, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкокси; n равно целому из 0, 1 или 2;

Q представляет

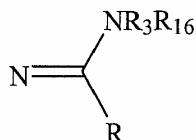


R представляет водород, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-алкил, необязательно замещенный одним или более галогенами, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкилом, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкил)SO<sub>x</sub>, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкил)SO<sub>x</sub>, фенилом, необязательно замещенным одним-трем галогенами, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилом, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилом, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкил)SO<sub>x</sub>, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкил)SO<sub>x</sub>, NO<sub>2</sub> или CN группами, или фенокси, необязательно замещенным одним-трем галогенами, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилом, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилом, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкил)SO<sub>x</sub>, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкил)SO<sub>x</sub>, NO<sub>2</sub> или CN группами.

C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub> циклоалкил, необязательно замещенный одним или более галогенами, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкилом, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> галогеналкилом, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкил)SO<sub>x</sub>, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкил)SO<sub>x</sub>, фенилом, необязательно замещенным одним-трем галогенами, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилом, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилом, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкокси, NO<sub>2</sub> или CN группами, или фенокси, необязательно

фенилом, необязательно замещенным одним или

Кроме того, настоящим изобретение касается получения N-ариамидразонов формулы I, в которой A, B, W, Y, n и R<sub>1</sub> имеют вышеуказанные значения, а Q представляет



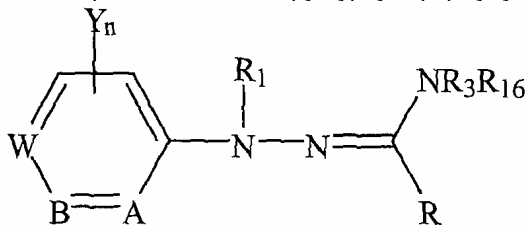
при условии, что когда все A, B и W отличны от N, тогда R и один из R<sub>3</sub> или R<sub>16</sub> должны быть отличными от водорода, и при дополнительном условии, что, когда один из A, B или W представляет N, то Y, R<sub>4</sub>, R<sub>5</sub> или R<sub>6</sub> должны быть отличными от C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> алкила.

Также предусматриваются композиции и способы для защиты растущих растений от нападения и заражения насекомыми и клещами.

Множество насекомых и клещей наносят большой экономический ущерб, повреждая и уничтожая посевы сельскохозяйственных культур и других ценных растений, содействуя распространению и росту бактерий, грибов, вирусов, которые приводят к болезням растений, и уничтожая или снижая ценность хранимых пищевых продуктов, других продуктов или имущества. Насекомые и клещи представляют некоторые из самых больших проблем фермеров во всем мире. Потребность в альтернативном и эффективном контроле насекомых и клещей является глобальной проблемой.

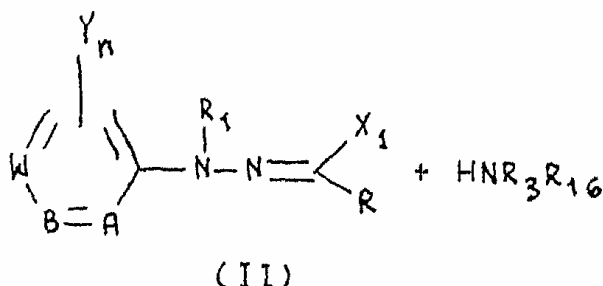
Было обнаружено, что замещенные производные N-арилгидразона формулы I являются особенно эффективными инсектицидными и акарицидными средствами, в частности, против Coleoptera, Lepidoptera и Acarina.

Соединения амидразона формулы Ia настоящего изобретения имеют структурную формулу



(Ia)

в которой A, B, W, Y, n, R, R<sub>1</sub>, R<sub>3</sub> и R<sub>16</sub> имеют вы-



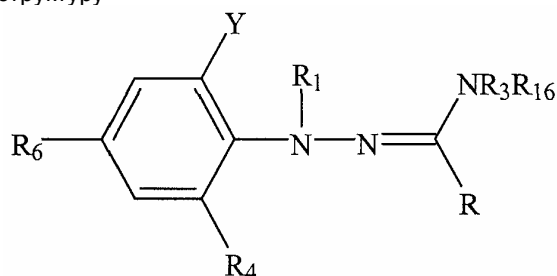
(II)

Соединения формулы II можно получить путем взаимодействия подходящего арилгидразина формулы III с соответствующим хлорангидридом кислоты, RCOCl для получения N-арилгидразина формулы IV и взаимодействия гидразида форму-

шеуказанные значения. Термин галоген, используемый в описании и формуле изобретения, означает хлор, фтор, бром или йод. Термин соли присоединения кислоты означает соли, образуемые кислотами, хорошо известными, такими как хлорид водорода, бромид водорода, биосульфат водорода, сульфат геми-водорода и т.л. В вышеуказанном опеределнии, когда n равно 0, то Y означает водород.

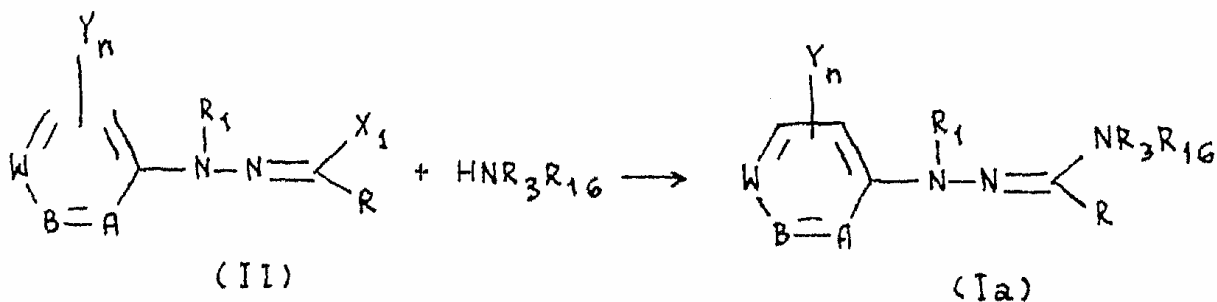
Предпочтительными соединениями изобретения являются такие, в которых R, R<sub>3</sub> и R<sub>16</sub> независимы друг от друга представляют водород или C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкил, A представляет C-R<sub>4</sub>, B представляет C-R<sub>5</sub>, W представляет C-R<sub>6</sub>, Y представляет галоген, и n равно 1. Особенно предпочтительными соединениями являются те, в которых R<sub>1</sub> представляет водород, R<sub>4</sub> представляет галоген, R<sub>5</sub> представляет водород и/или R<sub>6</sub> представляет C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкил, замещенный одним или более галогенами, предпочтительно трифторметил.

Другими предпочтительными соединениями изобретения являются соединения, имеющие структуру



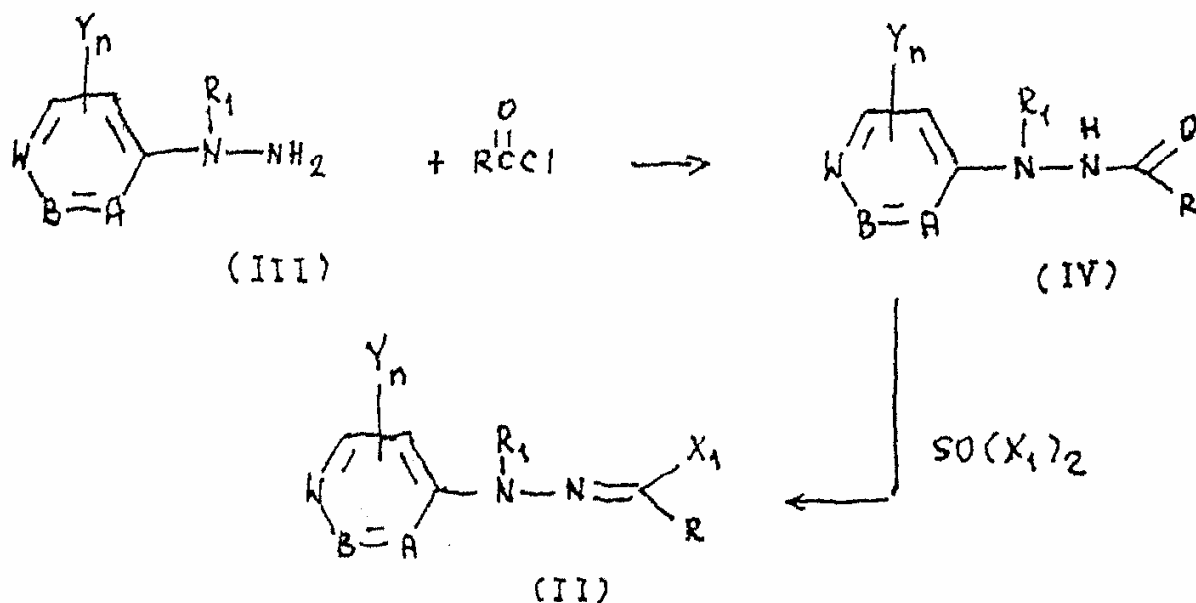
в которой R представляет C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-алкил; R<sub>1</sub> представляет водород или C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкил; R<sub>16</sub> представляет водород или C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-алкил; и R<sub>4</sub>, R<sub>6</sub> и Y независимо друг от друга представляют водород, галоген, CN, NO<sub>2</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкокси.

N-ариламидразоны формулы Ia можно получить путем взаимодействия хлорангидрида кислоты, гидразона (гидразинойл хлорид) формулы II с аминным соединением HNR<sub>3</sub>R<sub>16</sub>, как показано на схеме процесса I.



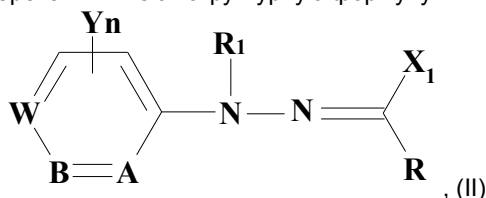
(Ia)

лы IV с галогенирующим агентом, таким как тионил галогенид, для получения желаемого продукта -N-арилгидразинойл галогенида формулы II. Реакция показана на схеме процесса II.



Замещенные производные N-арилгидразина настоящего изобретения являются эффективными для подавления вредителей-насекомых и клещей. Указанные соединения являются также эффективными для защиты растущих или убранных посевов сельскохозяйственных культур от нападения и заражения такими вредителями.

Соединения, используемые в предлагаемом способе, включают N-арилгидразинойл галогениды формулы II. Инсектицидные и акарицидные гидразинойл галогениды формулы II настоящего изобретения имеют структурную формулу



в которой A, B, W, Y, n, R, R<sub>1</sub>, и X<sub>1</sub> имеют вышеуказанные значения.

Предпочтительными соединениями формулы II являются такие соединения, в которых R<sub>1</sub> представляет водород, A представляет C-R<sub>4</sub>, B представляет C-R<sub>5</sub>, W представляет C-R<sub>6</sub>, Y представляет галоген или нитро, а n равно 1. Особенно предпочтительными являются соединения, в которых R<sub>4</sub> представляет галоген, R<sub>5</sub> представляет водород, и R<sub>6</sub> представляет C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкил, замещенный одним или более галогенами, предпочтительно трифторметил.

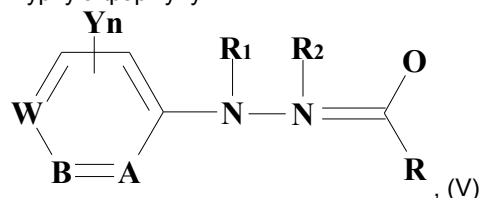
Другими предпочтительными соединениями формулы II являются соединения, в которых R представляет необязательно замещенный C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub> циклоалкил или C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub> галогеналкил, предпочтительно C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> галогеналкил.

Соединения формулы II, в которых X<sub>1</sub> пред-

ставляет фтор, можно получить из соединений формулы II, в которых X<sub>1</sub> представляет хлор или бром, путем галогенообменной реакции, используя фторид натрия или фторид водорода, как это описывается Марчем в Advanced Organic Chemistry, 4 изд. (1992), стр. 438

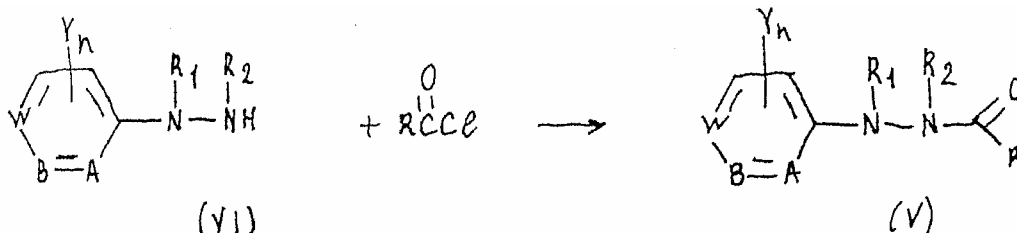
Дополнительные соединения, используемые в способе изобретения, включают замещенные карбоновые кислоты, N-арилгидразиды формулы V.

Инсектицидные и акарицидные N-арилгидразиды формулы V настоящего изобретения имеют структурную формулу



Предпочтительными соединениями формулы V являются такие соединения, в которых R представляет водород или C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкил, A представляет C-R<sub>4</sub>, B представляет C-R<sub>5</sub>, W представляет C-R<sub>6</sub>, Y представляет галоген или нитро, а n равно 1. Особенно предпочтительными N-арилгидразидами формулы V являются такие, в которых R<sub>4</sub> представляет галоген, R<sub>5</sub> представляет водород, и R<sub>6</sub> представляет C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкил, замещенный одним или более галогенами, предпочтительно трифторметил.

Соединения формулы V можно получить путем взаимодействия подходящего арилгидразина формулы IV с соответствующим хлорангидридом кислоты, RCOCl, с получением N-арилгидразида формулы V. Реакция показана на технологической схеме процесса III.



Растущие или убранные посевы сельскохозяйственных культур можно защитить от инфицирования или атаки вредоносных насекомых или клещей путем нанесения на листву сельскохозяйственных культур, или на почву или воду, в которой они растут, пестицидно эффективного количества производного N-арилгидразина формулы I.

На практике для защиты растений от нападения и заражения насекомыми и клещами обычно бывает эффективным примерно 10-10000 м.д., предпочтительно примерно 100-5000 ч/млн. соединения формулы I, диспергированного в жидком носителе, при нанесении на растения или на почву или воду, в которой они растут. Нанесение на почву соединений формулы I является особенно эффективным для контроля стадий постзародышевого развития Coleoptera и Diptera. Нанесение, такое как нанесение с помощью распыления, композиций изобретения обычно является эффективным при расходах, составляющих примерно 0,125-250 кг/га. Конечно, предполагается, что в зависимости от преобладающих окружающих обстоятельств, таких как плотность популяции, степень заражения, стадия роста растений, почвенные условия, погодные условия и т.п., можно использовать более высокие или более низкие дозы расхода при нанесении производных N-арилгидразина.

Предпочтительно использовать соединения формулы I вместе или в комбинации с другими средствами биологического и химического контроля, включающими другие инсектициды, нематодициды,

акарициды, моллюскициды, фунгициды и бактерициды, такие, как нуклеарные вирусы полиэд-роза, пирролы, арипирролы, галогенбензоилмочевины, пиретроиды, карбаматы, фосфаты и т.п.

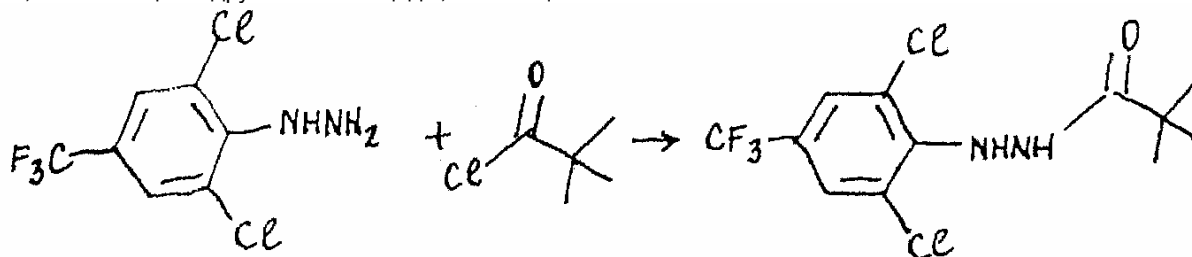
Обычными препаративными формами, пригодными для производных N-арилгидразина формулы I, являются гранулированные композиции, текучие композиции, смачиваемые порошки, дусты, микроэмульсии, эмульгируемые концентраты и т.п. Пригодными являются все композиции, которые приспособлены для нанесения на почву, воду и листву и обеспечивают эффективную защиту растений. Композиции изобретения включают производные N-арилгидразина формулы I, смешанные с инертным твердым или жидким носителем.

Когда композиции изобретения необходимо применять в обработках в комбинации с другими биологическими или химическими средствами, композицию можно наносить в виде смеси компонентов, или можно наносить последовательно.

Для более ясного понимания изобретения ниже приведены конкретные примеры осуществления изобретения. Эти примеры являются просто иллюстративными, и их не следует рассматривать никоим образом как ограничивающие объем и основополагающие принципы изобретения.

#### Пример 1

Получение 2-(2,6-дихлор- $\alpha,\alpha,\alpha$ -трифтор-*p*-толил)гидразид 2,2-диметилпропионовой кислоты



Раствор 2,6-дихлор-4-(трифторметил)фенилгидразина (50,0 г, 0,20 моль) в метиленхлориде обрабатывали по каплям триметилацетилхлоридом (30,6 г, 0,254 моль), перемешивали в течение 30 минут, обрабатывали 10% водным NaOH и перемешивали в течение 3 часов. Фазы разделяли: органическую фазу промывали водой, высушивали над  $MgSO_4$  и выпаривали in vacuo с получением не совсем белого остатка. Твердое вещество перекристаллизовывали из 1,2-дихлорэтана с получением указанного продукта в виде белого твердого вещества, 55 г (82% выход), точка плавления

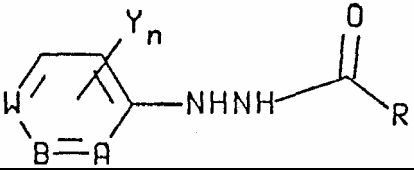
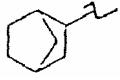
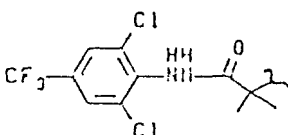
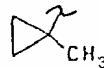
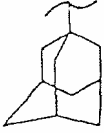
140-141°C, идентифицировано с помощью спектральных анализов  $^1H$ NMR,  $^{13}C$ NMR, и YR.

#### Примеры 2-42

Получение замещенных производных N-арилгидразина.

При использовании по существу той же самой процедуры, что описана в вышеприведенном примере 1, и замене соответствующих арилгидразина и хлорангидрида кислоты, были получены соединения, приведенные в таблице 1, которые идентифицировали с помощью спектральных анализов  $^1H$ NMR,  $^{13}C$ NMR, и YR.

Таблица 1

Номер примера						Точка плавления °C
Example Number	A	B	W	Yn	R	mp °C
2	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub> -	135-136
3	C-Cl	CH	C-Cl	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	124-125,5
4	C-Cl	CH	CH	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	114-115
5	C-Br	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Br	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	118-120
6	C-Br	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Br	CH <sub>3</sub>	173-175
7	C-Br	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Br	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	181-184
8	C-CH <sub>3</sub>	CH	C-Cl	H	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	103-106
9	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> CCH <sub>2</sub>	125-127
10	C-Cl	CH	C-Cl	6-Cl	pClC <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	183-190
11	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH	158-159
12	C-Cl	CH	C-Cl	6-Cl	cyclopropyl циклопропил	186-188
13	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	121-123
14	C-H	CH	C-CF <sub>3</sub>	H	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	136-139
15	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	H	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	143-145
16	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl		125-127
17	C-Cl	C-Cl	C-Cl	5,6 - diCl 5,6 - диCl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	
18	N	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	151-151,5
19	C-Cl	CH	C-Cl	6-Cl		138-140
20	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	pClC <sub>6</sub> H <sub>4</sub> OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	137-139
21	C-CF <sub>3</sub>	CH	CH	H	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	93-100
22	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl		101-103
23	C-Cl	CH	C-Cl	6-Cl	cyclohexyl циклогексил	133-139
24	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	104-105
25	C-Cl	CH	C-Cl	6-Cl	CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub>	131-132
26	C-Cl	CH	C-Cl	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH	164-165
27	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	cyclopropyl циклопропил	172-174
28	C-Cl	CH	C-Cl	6-Cl	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	132-134
29	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl		160-162
30	C-Br	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Br	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	140-141
31	C-Cl	CH	C-Cl	6-Cl	CH <sub>3</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	



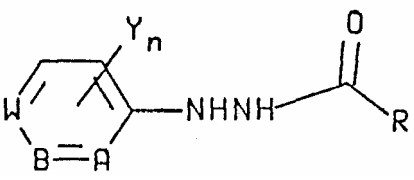
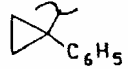
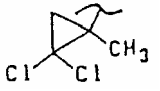
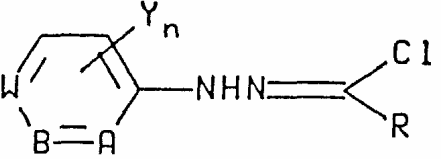
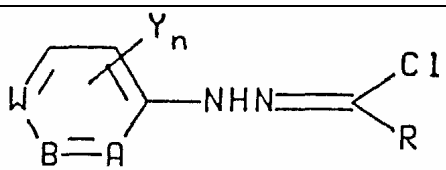
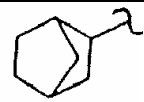
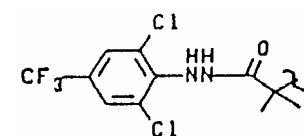
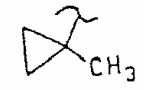
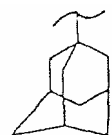
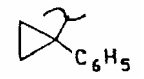
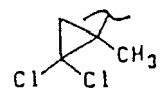
Номер примера						Точка плавления °C
Example Number	A	B	W	Yn	R	mp °C
32	N	N	C-Cl	H	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	178-182
33	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl		121-123
34	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	pClC <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	105-107
35	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	ClCH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	119-120
36	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl		174-175
37	C-Cl	CH	C-Cl	6-Cl	ClCH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	124-125
38	C-Cl	CH	CH	5-CF <sub>3</sub>	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	170-177,5
39	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	1-methylcyclohexyl 1-метилциклогексил	105-107
40	CH	C-CF <sub>3</sub>	CH	H	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	158-160
41	C-F	C-F	C-F	5,6 - diF 5,6 - диF	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	154-157
42	C-Br	CH	C-F	6-Br	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	118-120

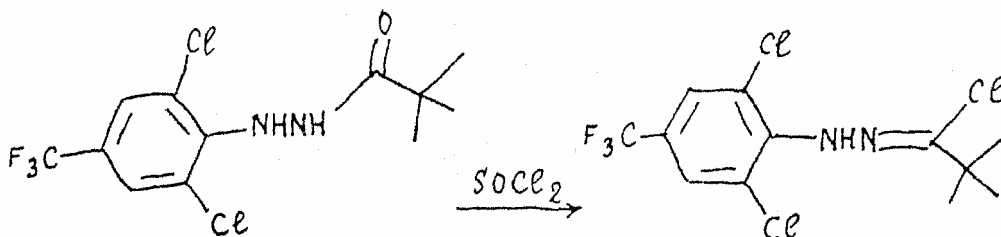
Таблица 2

Номер примера						Точка плавления °C
Example Number	A	B	W	Yn	R	mp °C
44	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub>	44,5-45,5
45	C-Cl	CH	C-Cl	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	
46	C-Cl	CH	CH	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	
47	C-Br	CH	C-F	6-Br	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	
48	C-Br	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Br	CH <sub>3</sub>	
49	C-Br	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Br	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	120
50	C-Cl	CH	C-Cl	H	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	
51	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> CCH <sub>2</sub>	
52	C-Cl	CH	C-Cl	6-Cl	pClC <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	
53	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH	
54	C-Cl	CH	C-Cl	6-Cl	супропроул циклопропил	
55	C-Cl	CH	C-CF	6-Cl	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
56	C-H	CH	C-CF <sub>3</sub>	H	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	
57	C-Cl	CH	C-CF	H	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	

Номер примера						Точка плавления °C
Example Number	A	B	W	Yn	R	mp °C
58	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl		
59	C-Cl	C-Cl	C-Cl	5,6 - diCl 5,6 - диCl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	
60	N	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	
61	C-Cl	CH	C-Cl	6-Cl		
62	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	pClC <sub>6</sub> H <sub>4</sub> OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
63	C-CF <sub>3</sub>	CH	CH	H	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	
64	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl		
65	C-Cl	C-CH	C-Cl	6-Cl	cyclohexyl циклогексил	
66	C-Cl	C-CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
67	C-Cl	CH	C-Cl	6-Cl	CF <sub>3</sub> CF <sub>2</sub>	
68	C-Cl	CH	C-Cl	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH	
69	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	cyclopropyl циклопропил	
70	C-Cl	CH	C-Cl	6-Cl	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
71	C-Cl	CH	C-CF	6-Cl		110-111
72	C-Br	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Br	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	
73	C-Cl	CH	C-Cl	6-Cl	CH <sub>3</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
74	N	N	C-Cl	H	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	
75	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl		
76	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	pClC <sub>6</sub> H <sub>4</sub> OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	85-88
77	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	ClCH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
78	C-Cl	CH	CCF <sub>3</sub>	6-Cl		71-73
79	C-Cl	CH	C-Cl	6-Cl	ClCH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	
80	C-Cl	CH	CH	5-CF <sub>3</sub>	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	
81	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	1-methylcyclohexyl 1-метилциклогексил	
82	CH	C-CF <sub>3</sub>	CH	H	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	
83	CH	CH	CH	5-F	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	
84	C-Br	CH	C-F	6-Br	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	

Пример 43

Получение 1-хлор-2,2-диметилпропиональде-

гида 2-(2,6-дихлор- $\alpha,\alpha,\alpha$ -трифтор-*p*-толил)гидра-

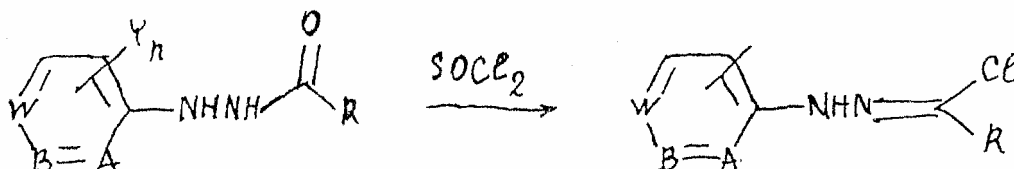
Смесь 2,2-диметил-2-(2,6-дихлор- $\alpha,\alpha,\alpha$ -трифтор-*p*-толил)гидразид пропионовой кислоты (50,0 г, 0,152 моль) и тионилхлорида (53,8 г, 0,452 моль) в толуоле нагревали при температуре дефлегмации в течение 8 часов, охлаждали до комнатной температуры и выпаривали *in vacuo* с получением масляного остатка.

Масло растворяли в гексанах и пропускали через осадок на фильтре из силикагеля. Осадок на фильтре промывали несколькими порциями

гексанов. Фильтраты собирали и выпаривали *in vacuo* с получением указанного продукта в виде желтого масла, 47,2 г (90% выход), идентифицированного с помощью спектральных анализов  $^1\text{H}$  ЯМР,  $^{13}\text{C}$  ЯМР и ИК.

Примеры 44-84

Получение замещенных хлоридов N-арил-гидразиноила.

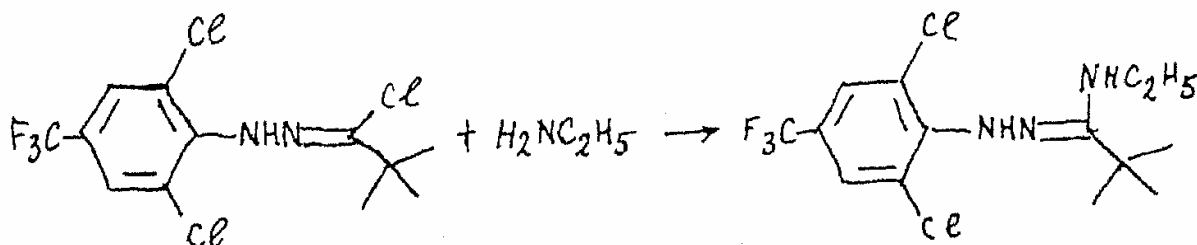


Используя по существу ту же процедуру, что и в примере 43, и заменяя соответствующие гидразидные основы, получали соединения, представленные в таблице 2, идентифицированные с помощью спектральных анализов  $^1\text{H}$  ЯМР,  $^{13}\text{C}$  ЯМР

и ИК.

Пример 85

Получение N-этил-2,2-диметилпропионамида, 2-(2,6-дихлор- $\alpha,\alpha,\alpha$ -трифтор-*p*-толил)гидразона

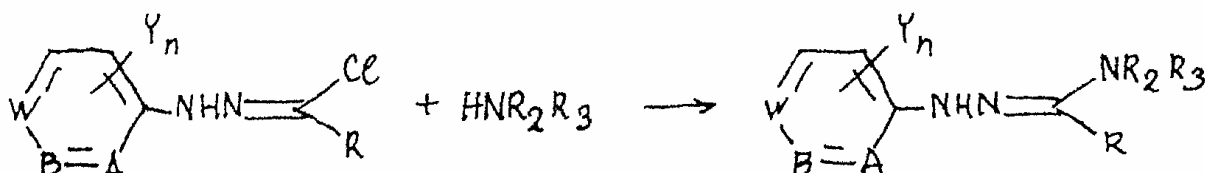


Раствор (2,6-дихлор- $\alpha,\alpha,\alpha$ -трифтор-*p*-толил)гидразон 1-хлор-2,2-диметилпропиональдегида (20,0 г, 0,0575 моль) в тетрагидрофуране обрабатывали по каплям 70% водным этиламином (28,0 г, 0,144 моль) при комнатной температуре, перемешивали в течение 1 часа и выпаривали *in vacuo* с получением полутвердого остатка. Полутвердое вещество диспергировали в эфире и воде.

Фазы разделяли: органическую фазу промывали водой, высушивали над  $\text{MgSO}_4$  и выпаривали *in vacuo* с получением указанного продукта в виде желтого масла, 19,8 г (97% выход), идентифицированного с помощью спектральных анализов  $^1\text{H}$  ЯМР,  $^{13}\text{C}$  ЯМР и ИК.

Примеры 86-169

Получение замещенных N-ариламидразонов.



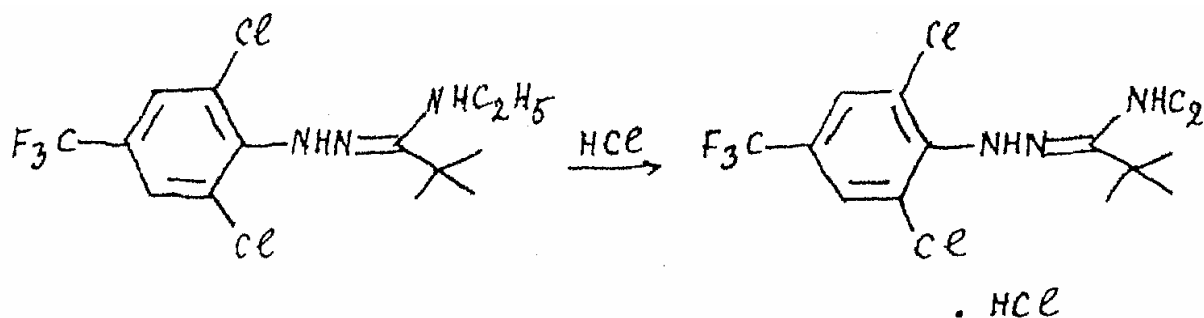
Используя по существу ту же процедуру, что и в примере 85, и заменяя соответствующие гидразиноилхлорид и подходящий амин, получали соединения, представленные в таблице 3, которые идентифицировали с помощью спектральных анализов  $^1\text{H}$  ЯМР,  $^{13}\text{C}$  ЯМР и ИК.

Соли гидрохлорида изобретения можно полу-

чить в соответствии с процедурой, изложенной ниже.

Пример 146

Получение N-этил-2,2-диметилпропионамида, 2-(2,6-дихлор- $\alpha,\alpha,\alpha$ -трифтор-*p*-толил)гидразона гидрохлорида

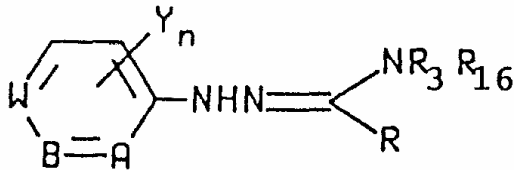
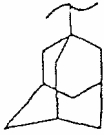
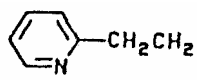
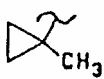
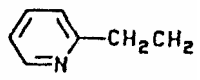
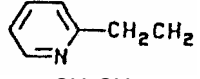


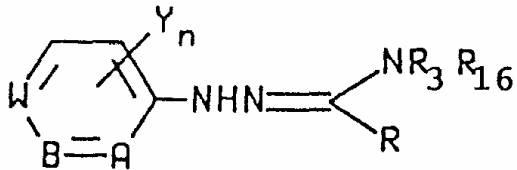
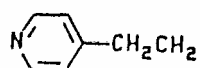
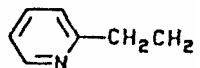

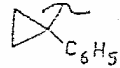
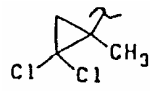
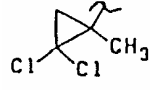
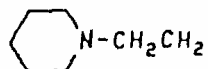
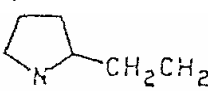
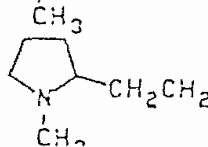
Перемешиваемую смесь N-этил-2,2-диметилпропионамид, 2-(2,6-дихлор- $\alpha, \alpha, \alpha$ -трифтор-*p*-толил)гидразона (0,1 г, 2,8 моль) и гексана барботировали HCl газом в течение 30 минут. Получен-

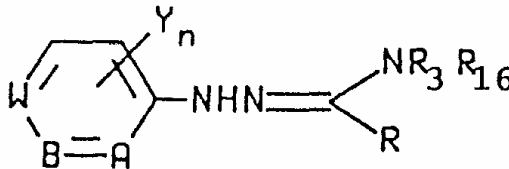
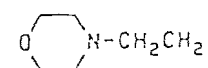
ную реакционную смесь фильтровали с получением указанного соединения в виде белого твердого вещества, 1,13 г, точка плавления 202-202,5°C.

Таблица 3

Номер примера								Точка плавления °C
Example Number	A	B	W	Yn	R	R <sub>3</sub>	R <sub>16</sub>	mp °C
86	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	pClC <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	
87	C-Cl	CH	C-Cl	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	H	
88	C-Cl	CH	C-Cl	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	H	48-50
89	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> CCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	H	
90	C-Cl	CH	C-Cl	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH	суслопропул циклопропил	H	
91	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> CCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	H	
92	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	H	62-64
93	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	H	
94	C-Br	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Br	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	H	
95	C-Br	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Br	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	H	
96	C-Br	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Br	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> CH <sub>2</sub>	H	
97	C-Br	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Br	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	furfuryl фурфурил	H	
98	C-Br	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	H	
99	C-Br	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Br	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	H	
100	C-Cl	CH	C-Cl	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	H	H	131-135
101	C-Cl	CH	C-Cl	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	61-63
102	C-Cl	CH	C-Cl	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	H	
103	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	H	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	H	
104	C-Cl	CH	CH	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	H	
105	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	H	H	100-102,5
106	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	CH <sub>3</sub>	H	78-79,5
107	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	
108	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	H	
109	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	H	67,5-68,5
110	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub>	H	
111	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -		

Номер при- мера								Точка плав- ле- ния °C
Example Number	A	B	W	Yn	R	R <sub>3</sub>	R <sub>16</sub>	mp °C
112	C-Cl	CH	C-Cl	6-Cl	cyclopropyl циклопропил	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	H	65-67
113	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	H	
114	C-Br	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Br	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH	H	
115	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	H	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -		
116	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	
117	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	H	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	H	
118	C-Cl	CH	C-Cl	6-Cl	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	H	
119	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	H	
120	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	H	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -		
121	CH	CH	C-CF <sub>3</sub>	H	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	H	
122	CH	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CHCH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	H	86,5- 88,5
123	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -		
124	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	cyclohexyl циклогексил	H	
125	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	H	
126	C-Br	CH	C-F	6-Br	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	H	
127	C-Cl	C-Cl	C-Cl	5,6-diCl 5,6-диCl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	H	63-65
128	C-Cl	CH	C-Cl	6-Cl	CH <sub>3</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	H	
129	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl		CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	H	
130	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	CH <sub>3</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	H	
131	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH	H	
132	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C		H	
133	C-Cl	CH	C-Cl	6-Cl	pClC <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH	H	124- 127
134	C-Cl	CH	C-Cl	6-Cl	pClC <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	H	127- 132
135	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	H	
136	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl		CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	H	74-75
137	C- CF <sub>3</sub>	CH	CH	H	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	H	
138	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	H	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	H	
139	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	H	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C		H	
140	CH	CH	C-CF	H	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C		H	
141	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	pClC <sub>6</sub> H <sub>4</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	H	

Номер при- мера								Точка плав- ле- ния °C
Example Number	A	B	W	Yn	R	R <sub>3</sub>	R <sub>16</sub>	mp °C
142	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> CH(CH <sub>3</sub> )	H	
143	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> NCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	H	
144	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	
145	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C		H	100,5 - 101,5
146*	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	H	202- 202,5
147	C-Br	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Br	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C		H	
148	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl		CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	H	
149	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl		CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	H	
150	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	H	
151	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> CH <sub>2</sub>	H	
152	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	
153	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl		CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	H	
154	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl		(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH	H	
155	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	ClCH <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	pCF <sub>3</sub> OC <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	203- 205
156	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	neopentyl неопентил	H	
157	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	H <sub>2</sub> NCOCHC(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	160- 162
158	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C		H	
159	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	pClC <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	H	
160	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C		H	
161	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C		H	
162	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	CH <sub>3</sub> (CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> CH(CH <sub>3</sub> )	H	
163	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub> N(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> CH(CH <sub>3</sub> )	H	
164	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	CH-CHCH	H	
165	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	1-methylcyclohexyl 1-метилциклогексил	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	H	
166	C-Cl	CH	CH	5-CF <sub>3</sub>	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	H	

Номер при- мера								Точка плав- ле- ния °C
Example Number	A	B	W	Yn	R	R <sub>3</sub>	R <sub>16</sub>	mp °C
167	C-F	C-F	C-F	5,6-diF	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	H	
168	C-Br	CH	C-F	5,6-диF 6-Br	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C	CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	H	
169	C-Cl	CH	C-CF <sub>3</sub>	6-Cl	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> C		H	

\* Hydrochloride salt  
Соль гидрохлорида

#### Пример 170

Инсектицидная и акарицидная оценка производных N-арилгидразина

Испытываемые растворы получали путем растворения испытуемого соединения в 35% смеси ацетона в воде с получением концентрации 10.000 м.д. Последующие разбавления водой делали по мере необходимости.

*Spodoptera eridania*, личинки в 3-ей стадии, южный червь (armyworm)

Лист лимской фасоли Sieva, выросший до 7-8 см в длину, погружали в испытуемый раствор при перемешивании в течение 3 секунд и высушивали в вытяжном шкафу. Затем лист помещали в чашку Петри 100×10 мм, содержащую увлажненную фильтровальную бумагу на дне и десять гусениц в 3-ей возрастной стадии. На 3 и 5 дни делали наблюдения смертности, снижения в потреблении пищи, или других помех по сравнению с обычным развитием.

*Tetranychus urticae* (штамм, устойчивый к ОР), 2-пятнистый красный клещик.

Выбирали растения лимской фасоли Sieva с первичными листьями, выросшими до 7-8 см и вырезали, оставляя по одному растению на горшок. От зараженного листа, взятого из основной колонии, отрезали маленький кусочек и помещали на каждый лист испытуемых растений. Это делали примерно за 2 часа до обработки, чтобы позволить клещикам двигаться по испытуемому растению и отложить яйца. Размер отрезаемого зараженного листа меняли для получения примерно 100 клещиков на лист. Во время проверяемой обработки кусочек листа, используемый для переноса клещиков, удаляли и выбрасывали. Вновь зараженные клещиком растения погружали в испытуемый раствор на 3 секунды при перемешивании и ставили в вытяжной шкаф для сушки. Через 2 дня один лист снимали и подсчитывали смертность. Через 5 дней снимали другой лист и делали наблюдения смертности яиц и/или вновь появившихся личинок.

*Diabrotica undecimpunctata howardi*, южная личинка, повреждающая корни зерновых, в 3-ей возрастной стадии.

Один куб.см мелкоизмельченного талька помещали в 30 мл широкогорлую стеклянную банку с завинчивающейся крышкой. Один мл соответствующего испытуемого раствора в ацетоне капали из пипетки на тальк, чтобы получить 1,25 мг активного ингредиента на банку. Банки подвергали действию слабого потока воздуха до тех пор, пока ацетон не испарялся. Высушенный тальк разрыхляли, добавляли 1 куб.см зерен проса в качестве корма для насекомых, и в каждую банку добавляли 25 мл влажной почвы. Банку закрывали, а содержимое тщательно перемешивали на вихревом смесителе. Вслед за этим в каждую банку добавляли десять личинок, повреждающих корни, в 3-ей возрастной стадии, и банки неплотно закрывали, чтобы имелся воздухообмен для личинок. Обработки проводили в течение 6 дней, делая подсчеты смертности. Найденные личинки считались мертвыми, поскольку они быстро разлагаются и их нельзя обнаружить. Концентрации, использовавшиеся в этом испытании, соответствовали приблизительно 50 кг/га.

Испытания оценивались в соответствии со шкалой, приведенной ниже, а полученные данные приведены в таблицах 4, 5 и 6.

#### Шкала оценки

Оценка	% смертности
0	нет эффекта
1	10-25
2	26-35
3	36-45
4	46-55
5	56-65
6	66-75
7	76-85
8	86-99
9	100

Инсектицидная и акарицидная оценка N-ариламидразонов  
Insecticidal and Acaricidal Evaluation of N-Arylamidrazones

Соединение (прим. №) Compound (Ex. №)	Червь Armyworm <sup>1</sup> (300 ppm) м.д.	% Mortality % смертности	
		2-пятн. клещик 2-Spotted Mite <sup>2</sup> (300 ppm) м.д.	Корневая личинка Corn Rootworm <sup>3</sup> (50 kg/ha) 50 кг/га
85	0	0	100
86	100	0	80
87	40	90	100
88	-	-	-
89	0	0	100
90	0	0	20
91	0	80	100
92	0	0	100
93	0	0	100
94	-	80	100
95	80	0	100
96	100	40	80
97	0	0	100
98	40	0	40
100	0	40	0
101	0	0	60
102	0	60	100
103	40	0	100
104	0	90	50
105	20	0	90
106	40	0	100
107	-	-	100
108	90	50	100
109	0	0	50
110	0	0	100
111	100	40	90
112	40	100	20
113	20	100	100
114	40	100	100
115	0	0	100
116	20	50	100
117	20	0	100
118	50	70	100
119	100	50	90
120	-	30	20
121	80	40	100
122	0	0	40
123	0	0	60
124	50	80	100



Соединение (прим. №)	% Mortality % смертности		
Compound (Ex. №)	Червь Armyworm <sup>1</sup> (300 ppm) м.д.	2-пятн. клещик 2-Spotted Mite <sup>2</sup> (300 ppm) м.д.	Корневая личинка Corn Rootworm <sup>3</sup> (50 kg/ha) 50 кг/га
125	0	30	100
126	0	80	90
128	0	0	30
129	100	40	0
130	80	80	100
131	70	0	100
132	-	40	100
133	-	0	0
134	0	30	0
135	0	0	0
136	0	70	100
137	0	0	100
138	0	0	100
139	0	70	100
140	0	0	50
141	100	0	0
142	0	0	100
143	0	0	100
144	0	0	100
145	0	0	100
146	0	0	100
147	0	0	100
148	50	0	100
149	100	80	80
150	0	60	100
152	80	0	100
153	100	0	100
156	-	0	100
157	0	0	100
158	40	0	100
159	0	0	100
160	0	0	100
161	0	0	-
162	0	100	100
163	0	0	100
164	0	0	100
167	0	0	100
168	0	80	90
169	0	0	100

<sup>1</sup>Armyworm is 3rd instar larvae, southern armyworm<sup>2</sup>2-Spotted Mite is 2-spotted spider mite (OP-resistant)<sup>3</sup>Corn Rootworm is 3rd instar southern corn rootworm

<sup>1</sup>представляет личинку 3-ей стадии, южный червь (armyworm)

<sup>2</sup>2-пятнистый клещик представляет собой 2-пятнистого красного клещика (устойчив к ОР)

<sup>3</sup>Корневая личинка представляет собой южную личинку, повреждающую корни зерновых, в 3-ей стадии

Таблица 5

Инсектицидная и акарицидная оценка N-арилгидразидов  
Insecticidal and Acaricidal Evaluation of N-Arylhydrazides

Соединение (прим. №)	% Mortality % смертности		
Compound (Ex. №)	Червь Armyworm <sup>1</sup> (300 ppm) м.д.	2-пятн. клещик 2-Spotted Mite <sup>2</sup> (300 ppm) м.д.	Корневая личинка Corn Rootworm <sup>3</sup> (50 kg/ha) 50 кг/га
1	8	0	9
2	0	0	7
3	-	-	9
4	0	0	7
5	0	0	8
6	0	0	0
7	0	0	0
8	5	0	8
9	0	0	0
10	1	9	3
11	1	0	9
12	4	0	4
13	0	9	3
14	7	0	7
15	9	0	3
16	0	0	0
17	1	3	0
18	2	0	6
19	9	0	0
20	0	0	0
21	0	0	7
22	0	0	0
23	0	0	0
24	0	0	0
25	9	0	8
26	0	0	0
27	4	0	6
28	2	0	0
29	3	0	0
30	0	2	4
31	0	0	0
32	1	0	0
33	0	0	0
34	8	0	2
35	5	0	0
36	8	0	0

Продолжение таблицы 5

Соединение (прим. №)	% Mortality % смертности		
Compound (Ex. №)	Червь Armyworm <sup>1</sup> (300 ppm) м.д.	2-пятн. клещик 2-Spotted Mite <sup>2</sup> (300 ppm) м.д.	Корневая личинка Corn Rootworm <sup>3</sup> (50 kg/ha) 50 кг/га
37	4	0	0
39	0	0	0
40	9	0	9
41	3	0	9
42	0	2	4

<sup>1</sup>Armyworm is 3rd instar larvae, southern armyworm

<sup>2</sup>2-Spotted Mite is 2-spotted spider mite (OP-resistant)

<sup>3</sup>Corn Rootworm is 3rd instar southern corn rootworm

<sup>1</sup>представляет личинку 3-ей стадии, южный червь (armyworm)

<sup>2</sup>2-пятнистый клещик представляет собой 2-пятнистого красного клещика (устойчив к ОР)

<sup>3</sup>Корневая личинка представляет собой южную личинку, повреждающую корни зерновых, в 3-ей стадии

Таблица 6

Инсектицидная и акарицидная оценка замещенных N-арилгидразиной галогенидов  
Insecticidal and Acaricidal Evaluation of Substituted N-Arylhydrazinoyl Halides

Соединение (прим. №)	% Mortality % смертности		
Compound (Ex. №)	Червь Armyworm <sup>1</sup> (300 ppm) м.д.	2-пятн. клещик 2-Spotted Mite <sup>2</sup> (300 ppm) м.д.	Корневая личинка Corn Rootworm <sup>3</sup> (50 kg/ha) 50 кг/га
78	90	90	0
54	80	100	0
58	0	0	0
59	0	100	0
64	-	90	100
66	80	100	20
71	90	90	30
73	50	100	0
77	100	90	80
79	100	100	100

<sup>1</sup>Armyworm is 3rd instar larvae, southern armyworm

<sup>2</sup>2-Spotted Mite is 2-spotted spider mite (OP-resistant)

<sup>3</sup>Corn Rootworm is 3rd instar southern corn rootworm

<sup>1</sup>представляет личинку 3-ей стадии, южный червь (armyworm)

<sup>2</sup>2-пятнистый клещик представляет собой 2-пятнистого красного клещика (устойчив к ОР)

<sup>3</sup>Корневая личинка представляет собой южную личинку, повреждающую корни зерновых, в 3-ей стадии

---

ДП "Український інститут промислової власності" (Укрпатент)  
Україна, 01133, Київ-133, бульв. Лесі Українки, 26  
(044) 295-81-42, 295-61-97

---

Підписано до друку \_\_\_\_\_ 2001 р. Формат 60х84 1/8.  
Обсяг \_\_\_\_\_ обл.-вид. арк. Тираж 50 прим. Зам. \_\_\_\_\_

---

УкрІНТЕІ, 03680, Київ-39 МСП, вул. Горького, 180.  
(044) 268-25-22

---