



УКРАЇНА

(19) UA (11) 82681 (13) C2
(51) МПК (2006)

C07D 207/34 (2007.01)

C07C 211/45 (2007.01)

A01N 43/06 (2007.01)

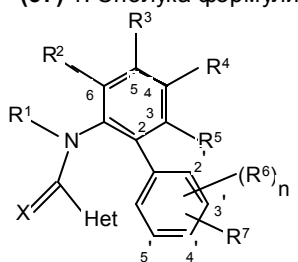
A01P 3/00

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ
І НАУКИ УКРАЇНИДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІОПИС
ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД

(54) БІФЕНІЛЬНІ ПОХІДНІ, ПРОМІЖНА СПОЛУКА, КОМПОЗИЦІЯ ДЛЯ БОРОТЬБИ З МІКРООРГАНІЗМАМИ ТА СПОСІБ БОРОТЬБИ ІЗ ЗАРАЖЕННЯМ АБО ПОПЕРЕДЖЕННЯ ЗАРАЖЕННЯ КУЛЬТУРНИХ РОСЛИН ФІТОПАТОГЕННИМИ МІКРООРГАНІЗМАМИ

1

(21) а200507289
(22) 15.12.2003
(24) 12.05.2008
(86) РСТ/ЕР2003/014248, 15.12.2003
(31) 0230155.4
(32) 24.12.2002
(33) GB
(46) 12.05.2008, Бюл.№ 9, 2008 р.
(72) ЕРЕНФРОЙНД ЙОЗЕФ, АТ/СН, ЛАМБЕРТ КЛЕМЕНС, ДЕ/СН, ТОБЛЕР ХАНС, ВАЛТЕР ХАРАЛЬД, ДЕ/СН
(73) СІНГЕНТАПАРТІСІПЕЙШНС АГ
(56) SU 526285, А3, 14.12.1976
DE 10215292, А1, 28.08.2003
DE 10204391, А1, 14.08.2003
DE 10204390, А1, 14.08.2003
JP 2001302605, А, 31.10.2001
US 3 928 364, А, 23.12.1975
US 4 036 989, А, 19.07.1975
WO 0208197, А1, 31.01.2002
US 4 016 214, А, 05.04.1977
TETRAHEDRON LETTERS, vol. 32, 1976, pp. 2761-2764
ARZNEIMITTEL FORSCHUNG, vol. 38, no. 10, 1988, pp. 1454-1460
JOURNAL OF ORGANIC CHEMISTRY, vol. 42, no. 10, 1977, pp. 1780-1783
JOURNAL OF THE AMERICAN CHEMICAL SOCIETY, vol. 68, 1946, pp. 1159-1161
EUROPEAN JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, vol. 22, 1987, pp. 45-57
(57) 1. Сполука формули (I)



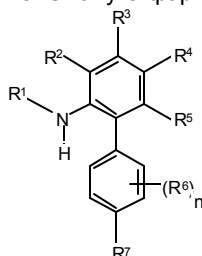
у якій

2

Het означає піразольне, пірольне або тiazольне кільце, причому кільце заміщене за допомогою 1, 2 або 3 груп R^y;
R¹ означає водень,
R², R³, R⁴ та R⁵ незалежно означають водень або фтор;
кожний R⁶ незалежно означає галоген, метил або CF₃;
R⁷ означає C≡C(Y¹);
кожний R^y незалежно означає галоген, C₁-С₃алкіл або C₁-С₃галогеналкіл;
Х означає О;
Y¹ означає водень, галоген, C₁-С₆алкіл, що необов'язково містить один або більшу кількість замісників, незалежно вибраних із групи, яка містить галогени, C₃-С₇циклоалкіл, що необов'язково містить один або більшу кількість замісників, незалежно вибраних із групи, яка включає галогени або три(C₁-C₄)алкілсиліл; та
n дорівнює 0 або 1.

2. Сполука формули (I) за п. 1, вибрана з [4'-(3,3-диметил-бут-1-иніл)-біфеніл-2-іл]-аміду 3-дифторметил-1-метил-1Н-піразол-4-карбонової кислоти та [4'-(1-пропініл)-біфеніл-2-іл]-аміду 3-дифторметил-1-метил-1Н-піразол-4-карбонової кислоти.

3. Сполука формули (II)



(II)

(I)

у якій R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ та n є такими, як визначено в п. 1.

4. Композиція для боротьби з мікроорганізмами та попередження нападу шкідників і зараження ними рослин, у якій активним інгредієнтом є сполука формули (I) за п. 1 разом з придатним носієм.

(13) C2

(11) 82681

(19) UA

5. Спосіб боротьби із зараженням або попередження зараження культурних рослин фітопатогенними мікроорганізмами шляхом нанесення спо-

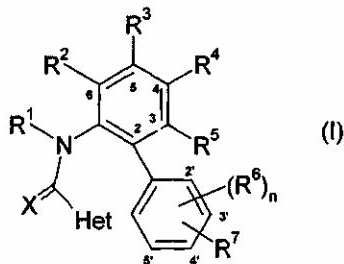
луки формули (I) за п. 1 на рослини, їх частини або місце їх виростання.

Даний винахід стосується нових карбоксамідних похідних, як активних інгредієнтів, які проявляють мікробіцидну активність, зокрема, фунгіцидну активність. Даний винахід також стосується одержання цих активних інгредієнтів, нових дифенільних похідних, які застосовуються як проміжні продукти при одержанні активних інгредієнтів, одержання цих нових проміжних продуктів, агрохімічних композицій, які містять принаймні один з цих нових активних інгредієнтів, одержання цих композицій та застосування цих активних інгредієнтів або композицій у сільському господарстві або садівництві для боротьби із зараженням рослин фітопатогенними мікроорганізмами, краще - грибами, або його попередження.

Фунгіцидно активні карбоксамідні похідні розкриті в [JP2001072510, JP2001072508, JP2001072507 та JP2001302605].

Деякі аміно- або галогензаміщені дифенільні похідні розкриті в [DE2205732 та JP2001302605].

Даний винахід стосується сполуки формули (I):



у якій Het означає 5- або 6-членне гетероциклічне кільце, що містить від 1 до 3 гетероатомів, кожний з яких незалежно вибраний із групи, яка включає кисень, азот та сірку, за умови, що кільце не є 1,2,3-триазолом, кільце заміщене за допомогою 1, 2 або 3 груп R^i ; R^1 означає водень, форміл, $\text{CO-C}_1\text{-C}_4\text{алкіл}$, $\text{COO-C}_1\text{-C}_4\text{алкіл}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{алкокси(C}_1\text{-C}_4\text{)алкіл}$, $\text{CO-C}_1\text{-C}_4\text{алкіл енокси(C}_1\text{-C}_4\text{)алкіл}$, пропаргіл або аленіл; всі R^2 , R^3 , R^4 та R^5 незалежно означають водень, галоген, метил або CF_3 ; всі R^6 незалежно означають галоген, метил або CF_3 ; R^7 означає $(\text{Z})_m\text{C}\equiv\text{C}(\text{Y}^1)$, $(\text{Z})_m\text{C}(\text{Y}^1)=\text{C}(\text{Y}^2)(\text{Y}^3)$ або $\text{три(C}_1\text{-C}_4\text{)алкілсиліл}$; всі R^i незалежно означають галоген, $\text{C}_1\text{-C}_3\text{алкіл}$, $\text{C}_1\text{-C}_3\text{галогеналкіл}$, $\text{C}_1\text{-C}_3\text{алкокси(C}_1\text{-C}_3\text{)алкіл}$ або ціаногрупу; X означає O або S; всі Y^1 , Y^2 та Y^3 незалежно означають водень, галоген, $\text{C}_1\text{-C}_6\text{алкіл}$ [що необов'язково містить один або більшу кількість замісників, незалежно вибраних із групи, яка включає галоген, гідроксигрупу, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{алкоксигрупу}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{галогеналкоксигрупу}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{алкілтіогрупу}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{галогеналкілтіогрупу}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{алкіламіногрупу}$, $\text{ди(C}_1\text{-C}_4\text{)алкіл аміногрупу}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{алкоксикарбоніл}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{алкоксикарбонілоксигрупу}$ та $\text{три(C}_1\text{-C}_4\text{)алкілсиліл}$], $\text{C}_2\text{-C}_4\text{алкеніл}$ [що необов'язково містить один або більшу кількість замісників, неза-

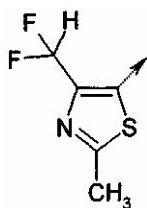
лежно вибраних із групи, яка включає галогени], $\text{C}_2\text{-C}_4\text{алкініл}$ [що необов'язково містить один або більшу кількість замісників, незалежно вибраних із групи, яка включає галогени], $\text{C}_3\text{-C}_7\text{циклоалкіл}$ [що необов'язково містить один або більшу кількість замісників, незалежно вибраних із групи, яка включає галоген, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{алкіл}$ та $\text{C}_1\text{-C}_4\text{галогеналкіл}$] або $\text{три(C}_1\text{-C}_4\text{)алкілсиліл}$; Z означає $\text{C}_1\text{-C}_4\text{алкіл}$ [що необов'язково містить один або більшу кількість замісників, незалежно вибраних із групи, яка включає гідроксигрупу, ціаногрупу, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{алкоксигрупу}$, галоген, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{галогеналкіл}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{галогеналкоксигрупу}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{алкілтіогрупу}$, COOH та $\text{COO-C}_1\text{-C}_4\text{алкіл}$]; m дорівнює 0 або 1; та n дорівнює 0, 1 або 2.

В одному конкретному варіанті виконання даний винахід стосується сполуки формули (I), яка визначена вище, у якій всі Y^1 , Y^2 та Y^3 незалежно означають водень, галоген, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{алкіл}$ [що необов'язково містить один або більшу кількість замісників, незалежно вибраних із групи, яка включає галоген, гідроксигрупу, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{алкоксигрупу}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{галогеналкоксигрупу}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{алкілтіогрупу}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{галогеналкілтіогрупу}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{алкіламіногрупу}$, $\text{ди(C}_1\text{-C}_4\text{)алкіламіногрупу}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{алкоксикарбоніл}$ та $\text{три(C}_1\text{-C}_4\text{)алкілсиліл}$], $\text{C}_1\text{-C}_4\text{алкеніл}$ [що необов'язково містить один або більшу кількість замісників, незалежно вибраних із групи, яка включає галогени], $\text{C}_2\text{-C}_4\text{алкініл}$ [що необов'язково містить один або більшу кількість замісників, незалежно вибраних із групи, яка включає галогени], $\text{C}_3\text{-C}_7\text{циклоалкіл}$ [що необов'язково містить один або більшу кількість замісників, незалежно вибраних із групи, яка включає галоген, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{алкіл}$ та $\text{C}_1\text{-C}_4\text{галогеналкіл}$] або $\text{три(C}_1\text{-C}_4\text{)алкілсиліл}$.

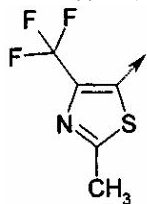
В одному варіанті виконання даний винахід стосується сполуки формули (I), яка визначена вище, у якій Z означає $\text{C}_1\text{-C}_4\text{алкіл}$ [що необов'язково містить один або більшу кількість замісників, незалежно вибраних із групи, яка включає гідроксигрупу, ціаногрупу, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{алкоксигрупу}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{галогеналкоксигрупу}$, $\text{C}_1\text{-C}_4\text{алкілтіогрупу}$, COOH та $\text{COO-C}_1\text{-C}_4\text{алкіл}$].

В одному варіанті виконання даний винахід стосується сполуки формули (I), яка визначена вище, за умови, що R не означає $\text{C}_2\text{-C}_6\text{алкеніл}$, якщо X означає O; R^1 означає водень; один з R^2 , R^3 , R^4 та R^5 означає фтор, а всі інші означають водень; n дорівнює 1; та Het означає

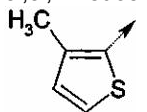
В іншому варіанті виконання даний винахід стосується сполуки формули (I), яка визначена вище, за умови, що R^7 не означає $\text{C}_2\text{-C}_6\text{алкеніл}$, якщо X означає O; всі R^1 , R^2 , R^3 , R^4 та R^5 означають водень; та Het означає



В іншому варіанті виконання даний винахід стосується сполуки формули (I), яка визначена вище, за умови, що R^7 не означає C_2-C_6 алкеніл, якщо X означає O ; всі R^1 , R^2 , R^3 , R^4 та R^5 означають водень; n дорівнює 1; та Het означає



У ще одному варіанті виконання даний винахід стосується сполуки формули (I), яка визначена вище, за умови, що R^7 не означає C_2-C_6 алкеніл у положенні 4, якщо X означає O ; всі R^1 , R^3 та R^5 означають водень; R^2 та R^4 всі незалежно означають водень або фтор; n дорівнює O ; або n дорівнює 1; або n дорівнює 2 та 2 незалежних замісника R^6 знаходяться у положеннях 2',3' або 2',5' або 3',5'; і Het означає



Галоген означає фтор, хлор, бром або йод [краще - фтор, хлор або бром].

Кожний алкільний фрагмент має лінійний або розгалужений ланцюг й означає, наприклад, метил, етил, n -пропіл, n -бутил, ізопропіл, n -бутил, втор-бутил, ізобутил або трет-бутил. Аналогічно, кожний алкіленовий фрагмент має лінійний або розгалужений ланцюг.

Галогеналкільні фрагменти є алкільними фрагментами, які заміщені одними або більшою кількістю однакових або різних атомів галогенів та означають, наприклад, CF_3 , CF_2Cl , CHF_2 , CH_2F , CCl_3 , CF_3CH_2 , CHF_2CH_2 , CH_2FCH_2 , CH_3CHF або CH_3CF_2 .

Алкенільні та алкінільні фрагменти можуть знаходитись у вигляді лінійних або розгалужених ланцюгів. Алкенільні фрагменти, якщо це можливо, можуть знаходитись в (E) або (Z) конфігурації. Прикладами є вініл, аліл, етиніл і пропаргіл.

Циклоалкіл включає циклопропіл, циклобутил, цикlopентил, циклогексил та циклогептил.

В три(C_1-C_4)алкілсилільній та у ди(C_1-C_4)алкіламіногрупі кожен алкільний фрагмент вибирається незалежно.

У даному описі Me означає метил та Et означає етил.

Краще, якщо Het означає піразол, пірол, тіофен, фуран, тіазол, ізотіазол, оксазол, ізоксазол, піридин, піразин, піримідин, піридазин, 5,6-дигідропіран або 5,6-дигідро-1,4-оксатин [більш краще - піразол, пірол, тіофен, фуран, тіазол, оксазол, піридин, піримідин, піридазин або 5,6-

дигідропіран; ще більш краще - піразол, пірол, піридин або тіазол; та найкраще - піразол, пірол або тіазол].

В одному варіанті виконання краще, якщо Het означає піразол, пірол, тіофен, фуран, тіазол, ізоксазол, ізоксазол, піразин, піримідин, піридазин, 5,6-дигідропіран або 5,6-дигідро-1,4-оксатин [більш краще - піразол, пірол, тіофен, фуран, тіазол, оксазол, піримідин, піридазин або 5,6-дигідропіран та найкраще - піразол, пірол або тіазол].

Краще, якщо R^1 означає водень, пропаргіл, алеліл, форміл, $COMe$, $COEt$ або $COCH_2OMe$.

Більш краще, якщо R^1 означає водень.

Краще, якщо R^2 означає водень.

Краще, якщо R^3 означає водень.

Краще, якщо R^4 означає водень.

Краще, якщо R^5 означає водень або галоген.

Більш краще, якщо R^5 означає водень або фтор.

Найкраще, якщо R^5 означає водень.

В одному варіанті виконання даного винаходу R^7 означає три(C_1-C_4)алкілсиліл.

Краще, якщо Y^1 , Y^2 та Y^3 незалежно означають водень, галоген, C_1-C_6 алкіл, C_1-C_3 галогеналкіл, C_1-C_4 (галогеналкокси) C_1-C_4 алкіл, C_1-C_4 (галогеналкілтіо) C_1-C_4 алкіл, триметилсиліл, C_2-C_4 алкеніл, C_2-C_4 галогеналкеніл або C_3-C_6 циклоалкіл (що необов'язково містить один або більшу кількість замісників, незалежно вибраних із групи, яка включає галоген та C_1-C_2 алкіл).

Краще, якщо Z означає C_1-C_2 алкілен [який необов'язково може містити один або більшу кількість замісників, незалежно вибраних із групи, яка включає галоген, C_1-C_4 галогеналкці та C_1-C_4 галогеналкоксигрупу].

Краще, якщо R^7 знаходиться в положенні 4.

Краще, якщо R^7 означає вініл [що необов'язково містить від 1 до 3 замісників, незалежно вибраних із групи, яка включає галоген, C_1-C_4 алкіл, C_1-C_3 галогеналкіл, C_3-C_6 циклоалкіл (що необов'язково містить від 1 до 5 замісників, незалежно вибраних із групи, яка включає галоген, CH_3 та C_1-C_2 галогеналкіл) і триметилсиліл], етиніл, що необов'язково містить 1 замісник, незалежно вибраний із групи, яка включає циклопропіл, циклопентил і циклогексил (кожний з яких необов'язково містить від 1 до 5 замісників, незалежно вибраних із групи, яка включає галоген, CH_3 та C_1-C_2 галогеналкіл), галоген, C_1-C_6 алкіл, C_1-C_4 галогеналкіл, C_2-C_4 алкеніл, C_2-C_4 галогеналкеніл і три(C_1-C_4)алкілсиліл], аліл [що необов'язково містить від 1 до 3 замісників, незалежно вибраних із групи, яка включає галоген, CH_3 , C_1-C_2 галогеналкіл та триметилсиліл], пропаргіл [що необов'язково містить від 1 до 3 замісників, незалежно вибраних із групи, яка включає галоген, C_1-C_4 алкіл, C_1-C_2 галогеналкіл та триметилсиліл] або три(C_1-C_4)алкілсиліл.

В одному конкретному варіанті виконання R^7 краще означає вініл [що необов'язково містить від 1 до 3 замісників, незалежно вибраних із групи, яка включає галоген, C_1-C_4 алкіл, C_1-C_3 галогеналкіл, C_3-C_6 циклоалкіл та триметилсиліл], етиніл [що необов'язково містить 1 замісник, незалежно виб-

Якщо R³ означає замісник біля атомі азоту, то краще, якщо він означає C₁-С₃алкіл, C₁-С₃галогеналкіл або метоксиметилен; більш краще – C₁-С₂алкіл, CF₃, CF₂Cl, CHF₂, CH₂F або метоксиметилен; ще більш краще – метил, CHF₂ або метоксиметилен; ще більш краще – метил або метоксиметилен; і найкраще – метил.

Краще, якщо атоми вуглецю в кільці Het, які не зв'язані з атомом, заміщеним за допомогою CXNR¹, незалежно є незаміщеними або заміщені за допомогою R^y.

Якщо R^y означає замісник біля атому вуглецю, що не зв'язаний з атомом, заміщеним за допомогою CXNR¹, то краще, якщо він означає галоген, C₁-C₃алкіл, C₁-C₃галогеналкіл або метоксиметилен; більш краще - хлор, метоксиметилен, CH₃, CHF₂ або CF₃; ще більш краще - хлор, CH₃, CHF₂ або CF₃; та найкраще - CH₃ або CF₃. У кільці Het можуть бути 1 або 2 атоми вуглецю, з'єднані з атомом, заміщеним за допомогою CXNR¹; краще, щоб такі атоми були незалежно не заміщені або заміщені за допомогою R^y.

Якщо R^y означає замісник біля атому вуглецю, що зв'язаний з атомом, який заміщений за допомогою CXNR¹, то краще, якщо він означає галоген, C₁-C₃алкіл або C₁-C₃галогеналкіл; більш краще - хлор, фтор, бром, C₁-C₂алкіл, CF₃, CF₂Cl, CHF₂, CH₂F; та найкраще - хлор, фтор, бром, метил, CF₃, CHF₂ або CH₂F.

Якщо в кільці Het є тільки 1 атом вуглецю, зв'язаний з атомом, заміщеним за допомогою CXNR¹, то більш краще, якщо цей атом вуглецю заміщений за допомогою R^y.

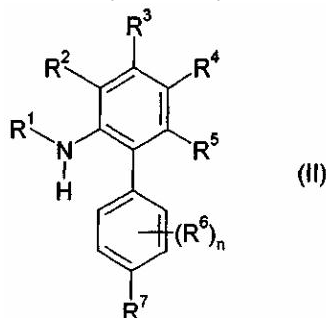
Якщо в кільці Het є 2 атоми вуглецю, що зв'язані з атомом, заміщеним за допомогою CXNR¹, то більш краще, якщо один такий атом вуглецю заміщений за допомогою R^y, а другий атом вуглецю є незаміщеним або заміщений за допомогою фтору, хлору або метилу.

Краще, якщо m дорівнює 0.

Краще, якщо n дорівнює 0.

Краще, якщо X означає O.

Сполуки формули (II):

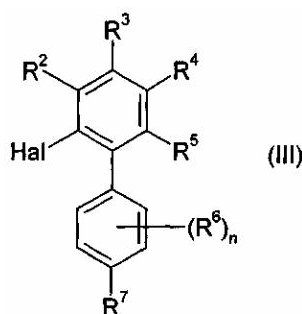


у якій R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ та n є такими, як визначено вище для сполуки формули (I), також є новими [за винятком сполуки формули (II), у якій всі R¹, R², R³, R⁴ та R⁵ означають водень, n дорівнює 0 та R⁷ означає CH=CHCH₂CO₂H] та застосовуються як проміжні продукти для одержання сполуки формули (I).

Тому в іншому варіанті виконання даний винахід стосується сполуки формули (II), у якій R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ та n є такими, як визначено вище для сполуки формули (I) за умови, що, якщо всі R¹, R², R³, R⁴ та R⁵ означають водень та n дорівнює 0, то R⁷ не означає CH=CHCH₂CO₂H.

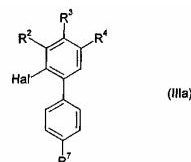
Кращі значення R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ та n для сполуки формули (II) є такими, як визначено вище для сполуки формули (I).

Більшість сполук формули (III):



у якій R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ та n є такими, як визначено вище для сполуки формули (I) та Hal означає бром, хлор або йод, також є новими та застосовуються як проміжні продукти для одержання сполуки формули (I).

Деякі сполуки формули (III) вже є відомими; у таблиці 0 наведені відомі сполуки формули (IIIa), у якій Hal, R², R³, R⁴ та R⁷ є такими, як визначено в таблиці 0.



Таблиця 0

Hal	R ²	R ³	R ⁴	R ⁷
Cl	Cl	H	H	C(CH ₃)=CH-CH ₂ -OH
Br	H	Me	H	C(CF ₃)=CF ₂
Br	H	Me	Br	C(CF ₃)=CF ₂
Cl	H	H	H	C≡CH
Cl	H	H	H	CH=CH-CH ₂ -CH ₂ -OH
Cl	H	H	H	C(CH ₃)=CH-CH ₂ -OH
Cl	H	H	H	C(CH ₃)=CH-C(=O)-OC ₂ H ₅
Cl	H	H	H	C(CH ₃)=CH-CH(OH)CH ₃
Cl	H	H	H	CH=CH-CH(OH)CH ₃

Тому в іншому варіанті виконання даний винахід стосується сполуки формули (III), у якій R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ та n є такими, як визначено вище для сполуки формули (I) та Hal означає бром, хлор або йод; за умови, що ця сполука не є сполукою формули (IIIa) у таблиці 0.

Кращі значення R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷ та n для сполуки формули (III) є такими, як визначено вище для сполуки формули (I).

Краще, якщо Hal означає бром або хлор.

Більш краще, якщо Hal означає бром.

Сполуки формул (I), (II) та (III) можуть існувати у вигляді різних геометричних або оптичних ізомерів або в різних таутомерних формах. Для кожної формули в обсяг даного винаходу входять всі такі ізомери та таутомери та їх суміші у всіх співвідношеннях, а також ізотопозаміщені форми, такі як дейтеровані сполуки.

Сполуки, що наведені нижче в таблицях від 1 до 13, ілюструють сполуки пропонувані в даному винаході.

Таблиця 1

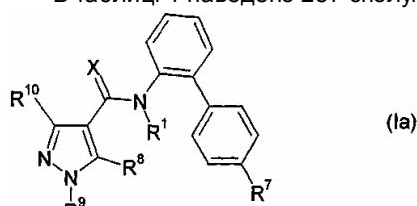
Сполука №	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	X
1.01	H	C=CH	H	Me	CF ₃	O
1.02	H	C=CH	H	Me	CF ₃	S
1.03	H	C=CH	H	Me	CF ₂ H	O
1.04	пропаргіл	C=CH	H	Me	CF ₃	O
1.05	H	C=CH	F	Me	Me	O
1.06	H	C=CH	H	CH ₂ OMe	CF ₃	O
1.07	аленіл	C=CH	H	Me	CF ₃	O
1.08	H	C=CSiMe ₃	H	Me	CF ₃	O
1.09	H	C=CSiMe ₃	H	Me	CF ₃	S
1.10	H	C=CSiMe ₃	H	Me	CF ₂ H	O
1.11	H	C=CSiMe ₃	F	Me	Me	O
1.12	H	C=CCl	H	Me	CF ₃	O
1.13	H	C=CCl	H	Me	CF ₂ H	O
1.14	H	C=CCl	F	Me	Me	O
1.15	H	C=CBr	H	Me	CF ₃	O
1.16	H	C=CBr	H	Me	CF ₂ H	O
1.17	H	C=CBr	F	Me	Me	O
1.18	H	C=CCF ₃	H	Me	CF ₃	O
1.19	H	C=CCF ₃	H	Me	CF ₂ H	O
1.20	H	C=CCF ₃	F	Me	Me	O
1.21	аленіл	C=CCF ₃	H	Me	CF ₃	O
1.22	H	CH=CH ₂	H	Me	CF ₃	O
1.23	H	CH=CH ₂	H	Me	CF ₃	S
1.24	H	CH=CH ₂	H	Me	CF ₂ H	O
1.25	пропаргіл	CH=CH ₂	H	Me	CF ₃	O
1.26	H	CH=CH ₂	F	Me	Me	O
1.27	H	CH=CH ₂	H	CH ₂ OMe	CF ₃	O
1.28	аленіл	CH=CH ₂	H	Me	CF ₃	O
1.29	H	CH=CF ₂	H	Me	CF ₃	O
1.30	H	CH=CF ₂	H	Me	CF ₂ H	O
1.31	H	CH=CF ₂	F	Me	Me	O
1.32	H	CH=CCl ₂	H	Me	CF ₃	O
1.33	H	CH=CCl ₂	H	Me	CF ₂ H	O
1.34	H	CH=CCl ₂	F	Me	Me	O
1.35	H	CH=CBr ₂	H	Me	CF ₃	O
1.36	H	CH=CBr ₂	H	Me	CF ₂ H	O
1.37	H	CH=CBr ₂	F	Me	Me	O
1.38	H	CF=CF ₂	H	Me	CF ₃	O
1.39	H	CF=CF ₂	H	Me	CF ₂ H	O
1.40	H	CF=CF ₂	F	Me	Me	O
1.41	H	CCl=CH ₂	H	Me	CF ₃	O
1.42	H	CCl=CH ₂	H	Me	CF ₂ H	O
1.43	H	CCl=CH ₂	F	Me	Me	O
1.44	H	CBr=CH ₂	H	Me	CF ₃	O
1.45	H	CBr=CH ₂	H	Me	CF ₂ H	O
1.46	H	CBr=CH ₂	F	Me	Me	O
1.47	H	CF=CHF	H	Me	CF ₃	O
1.48	H	CF=CHF	H	Me	CF ₂ H	O
1.49	H	CF=CHF	F	Me	Me	O
1.50	H	CH=CHSiMe ₃	H	Me	CF ₃	O
1.51	H	CH=CHSiMe ₃	H	Me	CF ₂ H	O
1.52	H	CH=CHSiMe ₃	F	Me	Me	O
1.53	H	CH=CHCF ₃	H	Me	CF ₃	O
1.54	H	CH=CHCF ₃	H	Me	CF ₂ H	O
1.55	H	CH=CHCF ₃	F	Me	Me	O
1.56	H	CH=CClCF ₃	H	Me	CF ₃	O
1.57	H	CH=CClCF ₃	H	Me	CF ₂ H	O
1.58	H	CH=CClCF ₃	F	Me	Me	O
1.59	H	CH ₂ C=CH	H	Me	CF ₃	O
1.60	H	CH ₂ C=CH	H	Me	CF ₂ H	O
1.61	H	CH ₂ C=CH	F	Me	Me	O
1.62	H	CH ₂ C=CH	H	CH ₂ OMe	CF ₃	O
1.63	H	CH ₂ C=CSiMe ₃	H	Me	CF ₃	O
1.64	H	CH ₂ C=CSiMe ₃	H	Me	CF ₂ H	O
1.65	H	CH ₂ C=CSiMe ₃	F	Me	Me	O
1.66	H	C=CCMe ₃	H	Me	CF ₃	O
1.67	H	C=CCMe ₃	H	Me	CF ₂ H	O
1.68	H	C=CCMe ₃	F	Me	Me	O
1.69	H	C=CMe	H	Me	CF ₃	O
1.70	H	C=CMe	H	Me	CF ₂ H	O

1.71	H	C=CMe	F	Me	Me	O
1.72	COMe	C=CH	H	Me	CF ₃	O
1.73	H	C=CH	H	CF ₂ H	CF ₂ H	O
1.74	H	C=CH	H	CF ₂ H	CF ₃	O
1.75	H	C=CH	H	Me	CH ₂ F	O
1.76	H	C=CSiMe ₃	H	Me	CH ₂ F	O
1.77	H	C=C(циклопропіл)	H	Me	CF ₃	O
1.78	H	C=C(циклопропіл)	H	Me	CHF ₂	O
1.79	H	SiMe ₃	H	Me	CH ₂ F	O
1.80	H	SiMe ₃	H	Me	CF ₃	O
1.81	H	SiMe ₃	H	Me	CHF ₂	O
1.82	H	C=CF	H	Me	CF ₃	O
1.83	H	C=CF	H	Me	CF ₂ H	O
1.84	H	C=CF	F	Me	Me	O
1.85	H	C=CCF ₂ Cl	H	Me	CF ₃	O
1.86	H	C=CCF ₂ Cl	H	Me	CF ₂ H	O
1.87	H	C=CCF ₂ Cl	F	Me	Me	O
1.88	H	C=CCF ₂ H	H	Me	CF ₃	O
1.89	H	C=CCF ₂ H	H	Me	CF ₂ H	O
1.90	H	C=CCF ₂ H	F	Me	Me	O
1.91	H	C=CCF ₂ Br	H	Me	CF ₃	O
1.92	H	C=CCF ₂ Br	H	Me	CF ₂ H	O
1.93	H	C=CCF ₂ Br	F	Me	Me	O
1.94	H	C=CCH ₂ F	H	Me	CF ₃	O
1.95	H	C=CCH ₂ F	H	Me	CF ₂ H	O
1.96	H	C=CCH ₂ F	F	Me	Me	O
1.97	H	C=CCH(Me)F	H	Me	CF ₃	O
1.98	H	C=CCH(Me)F	H	Me	CF ₂ H	O
1.99	H	C=CCH(Me)F	F	Me	Me	O
1.100	H	C=CC(Me) ₂ F	H	Me	CF ₃	O
1.101	H	C=CC(Me) ₂ F	H	Me	CF ₂ H	O
1.102	H	C=CC(Me) ₂ F	F	Me	Me	O
1.103	H	C=CCH ₂ C(Me) ₃	H	Me	CF ₃	O
1.104	H	C=CCH ₂ C(Me) ₃	H	Me	CF ₂ H	O
1.105	H	C=CCH ₂ C(Me) ₃	F	Me	Me	O
1.106	H	C=CCH(Me) ₂	H	Me	CF ₃	O
1.107	H	C=CCH(Me) ₂	H	Me	CF ₂ H	O
1.108	H	C=CCH(Me) ₂	F	Me	Me	O
1.109	H	C=CCH ₂ CH(Me) ₂	H	Me	CF ₃	O
1.110	H	C=CCH ₂ CH(Me) ₂	H	Me	CF ₂ H	O
1.111	H	C=CCH ₂ CH(Me) ₂	F	Me	Me	O
1.112	H	CH ₂ C=CCMe ₃	H	Me	CF ₃	O
1.113	H	CH ₂ C=CCMe ₃	H	Me	CF ₂ H	O
1.114	H	CH ₂ C=CCMe ₃	F	Me	Me	O
1.115	H	CF ₂ C=CCMe ₃	H	Me	CF ₃	O
1.116	H	CF ₂ C=CCMe ₃	H	Me	CF ₂ H	O
1.117	H	CF ₂ C=CCMe ₃	F	Me	Me	O
1.118	H	CF ₂ C=CMe	H	Me	CF ₃	O
1.119	H	CF ₂ C=CMe	H	Me	CF ₂ H	O
1.120	H	CF ₂ C=CMe	F	Me	Me	O
1.121	H	CF ₂ C=CH	H	Me	CF ₃	O
1.122	H	CF ₂ C=CH	H	Me	CF ₂ H	O
1.123	H	CF ₂ C=CH	F	Me	Me	O
1.124	H	CMe ₂ C=CH	H	Me	CF ₃	O
1.125	H	CMe ₂ C=CH	H	Me	CF ₂ H	O
1.126	H	CMe ₂ C=CH	F	Me	Me	O
1.127	H	CHFC=CH	H	Me	CF ₃	O
1.128	H	CHFC=CH	H	Me	CF ₂ H	O
1.129	H	CHFC=CH	F	Me	Me	O
1.130	H	CHMeC=CH	H	Me	CF ₃	O
1.131	H	CHMeC=CH	H	Me	CF ₂ H	O
1.132	H	CHMeC=CH	F	Me	Me	O
1.133	H	CH(CF ₃)C=CH	H	Me	CF ₃	O
1.134	H	CH(CF ₃)C=CH	H	Me	CF ₂ H	O
1.135	H	CH(CF ₃)C=CH	F	Me	Me	O
1.136	H	C=C (1-F-циклопентил)	H	Me	CF ₃	O
1.137	H	C=C (1-F-циклопентил)	H	Me	CHF ₂	O
1.138	H	C=CCH ₂ OMe	H	Me	CF ₃	O
1.139	H	C=CCH ₂ OMe	H	Me	CF ₂ H	O
1.140	H	C=CCH ₂ OMe	F	Me	Me	O
1.141	H	C=CCMe ₂ OMe	H	Me	CF ₃	O
1.142	H	C=CCMe ₂ OMe	H	Me	CF ₂ H	O
1.143	H	C=CCMe ₂ OMe	F	Me	Me	O
1.144	H	C=CCMe ₂ OCOMe	H	Me	CF ₃	O
1.145	H	C=CCMe ₂ OCOMe	H	Me	CF ₂ H	O
1.146	H	C=CCF ₂ Me	H	Me	CF ₃	O
1.147	H	C=CCF ₂ Me	H	Me	CF ₂ H	O
1.148	H	C=CCF ₂ Me	F	Me	Me	O

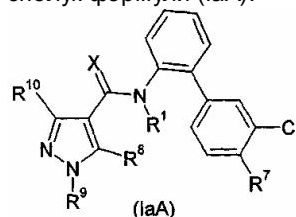
1.149	H	C=CC(Me)=CH ₂	H	Me	CF ₃	O
1.150	H	C=CC(Me)=CH ₂	H	Me	CF ₂ H	O
1.151	H	CH=CFCl	H	Me	CF ₃	O
1.152	H	CH=CFCl	H	Me	CF ₂ H	O
1.153	H	CH=CFCl	F	Me	Me	O
1.154	H	CH=CFBr	H	Me	CF ₃	O
1.155	H	CH=CFBr	H	Me	CF ₂ H	O
1.156	H	CH=CFBr	F	Me	Me	O
1.157	H	CH=CHBr	H	Me	CF ₃	O
1.158	H	CH=CHBr	H	Me	CF ₂ H	O
1.159	H	CH=CHBr	F	Me	Me	O
1.160	H	CH=CHF	H	Me	CF ₃	O
1.161	H	CH=CHF	H	Me	CF ₂ H	O
1.162	H	CH=CHF	F	Me	Me	O
1.163	H	CM=CHCF ₃	H	Me	CF ₃	O
1.164	H	CM=CHCF ₃	H	Me	CF ₂ H	O
1.165	H	CM=CHCF ₃	F	Me	Me	O
1.166	H	CH=CFCF ₃	H	Me	CF ₃	O
1.167	H	CH=CFCF ₃	H	Me	CF ₂ H	O
1.168	H	CH=CFCF ₃	F	Me	Me	O
1.169	H	CH=CBrCF ₃	H	Me	CF ₃	O
1.170	H	CH=CBrCF ₃	H	Me	CF ₂ H	O
1.171	H	CH=CBrCF ₃	F	Me	Me	O
1.172	H	CH=CHC ₂ F ₅	H	Me	CF ₃	O
1.173	H	CH=CHC ₂ F ₅	H	Me	CF ₂ H	O
1.174	H	CH=CHC ₂ F ₅	F	Me	Me	O
1.175	H	CH=CHCl	H	Me	CF ₃	O
1.176	H	CH=CHCl	H	Me	CF ₂ H	O
1.177	H	CH=CHCl	F	Me	Me	O
1.178	H	CH=C(CF ₃) ₂	H	Me	CF ₃	O
1.179	H	CH=C(CF ₃) ₂	H	Me	CF ₂ H	O
1.180	H	CH=C(CF ₃) ₂	F	Me	Me	O
1.181	H	CM=CFCI	H	Me	CF ₃	O
1.182	H	CM=CFCI	H	Me	CF ₂ H	O
1.183	H	CM=CFCI	F	Me	Me	O
1.184	H	CM=CFBr	H	Me	CF ₃	O
1.185	H	CM=CFBr	H	Me	CF ₂ H	O
1.186	H	CM=CFBr	F	Me	Me	O
1.187	H	CM=CF ₂	H	Me	CF ₃	O
1.188	H	CM=CF ₂	H	Me	CF ₂ H	O
1.189	H	CM=CF ₂	F	Me	Me	O
1.190	H	CM=CCl ₂	H	Me	CF ₃	O
1.191	H	CM=CCl ₂	H	Me	CF ₂ H	O
1.192	H	CM=CCl ₂	F	Me	Me	O
1.193	H	CM=CBr ₂	H	Me	CF ₃	O
1.194	H	CM=CBr ₂	H	Me	CF ₂ H	O
1.195	H	CM=CBr ₂	F	Me	Me	O
1.196	H	CM=CFCF ₃	H	Me	CF ₃	O
1.197	H	CM=CFCF ₃	H	Me	CF ₂ H	O
1.198	H	CM=CFCF ₃	F	Me	Me	O
1.199	H	CM=CCICF ₃	H	Me	CF ₃	O
1.200	H	CM=CCICF ₃	H	Me	CF ₂ H	O
1.201	H	CM=CCICF ₃	F	Me	Me	O
1.202	H	CCF ₃ =CF ₂	H	Me	CF ₃	O
1.203	H	CCF ₃ =CF ₂	H	Me	CF ₂ H	O
1.204	H	CCF ₃ =CF ₂	F	Me	Me	O
1.205	H	CCF ₃ =CCl ₂	H	Me	CF ₃	O
1.206	H	CCF ₃ =CCl ₂	H	Me	CF ₂ H	O
1.207	H	CCF ₃ =CCl ₂	F	Me	Me	O
1.208	H	CCF ₃ =CBr ₂	H	Me	CF ₃	O
1.209	H	CCF ₃ =CBr ₂	H	Me	CF ₂ H	O
1.210	H	CCF ₃ =CBr ₂	F	Me	Me	O
1.211	H	CCF ₃ =CH ₂	H	Me	CF ₃	O
1.212	H	CCF ₃ =CH ₂	H	Me	CF ₂ H	O
1.213	H	CCF ₃ =CH ₂	F	Me	Me	O
1.214	H	CCF ₃ =CFBr	H	Me	CF ₃	O
1.215	H	CCF ₃ =CFBr	H	Me	CF ₂ H	O
1.216	H	CCF ₃ =CFBr	F	Me	Me	O
1.217	H	CCF ₃ =CHF	H	Me	CF ₃	O
1.218	H	CCF ₃ =CHF	H	Me	CF ₂ H	O
1.219	H	CCF ₃ =CHF	F	Me	Me	O
1.220	H	CCF ₃ =CFCl	H	Me	CF ₃	O
1.221	H	CCF ₃ =CFCl	H	Me	CF ₂ H	O
1.222	H	CCF ₃ =CFCl	F	Me	Me	O
1.223	H	CCF ₃ =CHCl	H	Me	CF ₃	O
1.224	H	CCF ₃ =CHCl	H	Me	CF ₂ H	O
1.225	H	CCF ₃ =CHCl	F	Me	Me	O
1.226	H	CH=CFCF ₂ Cl	H	Me	CF ₃	O
1.227	H	CH=CFCF ₂ Cl	H	Me	CF ₂ H	O
1.228	H	CH=CFCF ₂ Cl	F	Me	Me	O
1.229	H	CH=CCICF ₂ Cl	H	Me	CF ₃	O
1.230	H	CH=CCICF ₂ Cl	H	Me	CF ₂ H	O
1.231	H	CH=CCICF ₂ Cl	F	Me	Me	O
1.232	H	CH ₂ CF=CF ₂	H	Me	CF ₃	O
1.233	H	CH ₂ CF=CF ₂	H	Me	CF ₂ H	O
1.234	H	CH ₂ CF=CF ₂	F	Me	Me	O

1.235	H	CF=CFBr	H	Me	CF ₃	O
1.236	H	CF=CFBr	H	Me	CF ₂ H	O
1.237	H	CF=CFBr	F	Me	Me	O
1.238	H	CH ₂ CH=CF ₂	H	Me	CF ₃	O
1.239	H	CH ₂ CH=CF ₂	H	Me	CF ₂ H	O
1.240	H	CH ₂ CH=CF ₂	F	Me	Me	O
1.241	H	CH ₂ CH=CCl ₂	H	Me	CF ₃	O
1.242	H	CH ₂ CH=CCl ₂	H	Me	CF ₂ H	O
1.243	H	CH ₂ CH=CCl ₂	F	Me	Me	O
1.244	H	CH ₂ CH=CBr ₂	H	Me	CF ₃	O
1.245	H	CH ₂ CH=CBr ₂	H	Me	CF ₂ H	O
1.246	H	CH ₂ CH=CBr ₂	F	Me	Me	O
1.247	H	CCl=CF ₂	H	Me	CF ₃	O
1.248	H	CCl=CF ₂	H	Me	CF ₂ H	O
1.249	H	CCl=CF ₂	F	Me	Me	O
1.250	H	C=CCMe ₂ OH	H	Me	CF ₃	O
1.251	H	C=CCMe ₂ OH	H	Me	CF ₂ H	O
1.252	H	C=CSi(Me ₂)CMe ₃	H	Me	CF ₃	O
1.253	H	C=CSi(Me ₂)CMe ₃	H	Me	CF ₂ H	O
1.254	H	C=CCH ₂ SiMe ₃	H	Me	CF ₃	O
1.255	H	C=CCH ₂ SiMe ₃	H	Me	CF ₂ H	O
1.256	H	C=CCH ₂ SiMe ₃	F	Me	Me	O
1.257	H	C=CCMe ₃	H	CF ₂ H	CF ₃	O
1.258	H	C=CCH ₂ CF ₃	H	Me	CF ₃	O
1.259	H	C=CCH ₂ CF ₃	H	Me	CF ₂ H	O
1.260	H	C=CCH ₂ CF ₃	F	Me	Me	O
1.261	H	C=CCMe ₃	H	CF ₂ H	CF ₂ H	O
1.262	H	C=CCH ₂ CH ₃	H	Me	CF ₃	O
1.263	H	C=CCH ₂ CH ₃	H	Me	CF ₂ H	O
1.264	H	C=CCH ₂ CH ₃	F	Me	Me	O
1.265	H	C=CCF=CF ₂	H	Me	CF ₃	O
1.266	H	C=CCF=CF ₂	H	Me	CF ₂ H	O
1.267	H	C=CCHFCI	H	Me	CF ₃	O
1.268	H	C=CCHFCI	H	Me	CF ₂ H	O
1.269	H	C=CCHFCI	F	Me	Me	O
1.270	H	CH=CF ₂ CF ₃	H	Me	CF ₃	O
1.271	H	CH=CF ₂ CF ₃	H	Me	CF ₂ H	O
1.272	H	CH=CF ₂ CF ₃	F	Me	Me	O
1.273	H	C=CCF ₂ CH ₂ CH ₃	H	Me	CF ₃	O
1.274	H	C=CCF ₂ CH ₂ CH ₃	H	Me	CF ₂ H	O
1.275	H	C=CCF ₂ CH ₂ CH ₃	F	Me	Me	O
1.276	H	C=CCHFC ₂ CH ₃	H	Me	CF ₃	O
1.277	H	C=CCHFC ₂ CH ₃	H	Me	CF ₂ H	O
1.278	H	C=CCHFC ₂ CH ₃	F	Me	Me	O
1.279	H	C=CCF(CF ₃) ₂	H	Me	CF ₃	O
1.280	H	C=CCF(CF ₃) ₂	H	Me	CF ₂ H	O
1.281	H	C=CCF(CF ₃) ₂	F	Me	Me	O
1.282	H	CH=CCIC ₂ F ₅	H	Me	CF ₃	O
1.283	H	CH=CCIC ₂ F ₅	H	Me	CF ₂ H	O
1.284	H	CH=CCIC ₂ F ₅	F	Me	Me	O
1.285	H	C=CC ₂ F ₅	H	Me	CF ₃	O
1.286	H	C=CC ₂ F ₅	H	Me	CF ₂ H	O
1.287	H	C=CC ₂ F ₅	F	Me	Me	O

В таблиці 1 наведено 287 сполук формули (Ia):

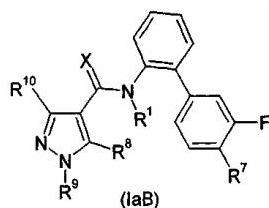


у якій R¹, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰ та X є такими, як визначено в таблиці 1. В таблиці 1 наведено 287 сполук формули (IaA):

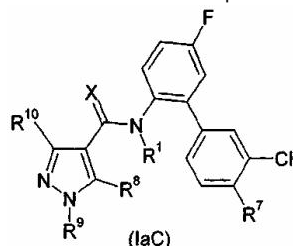


у якій R¹, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰ та X є такими, як визначено в таблиці 1.

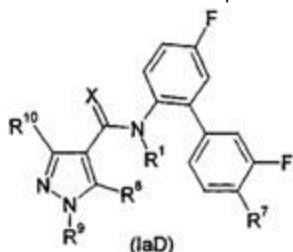
В таблиці 1 наведено 287 сполук формули (IaB), у якій R¹, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰ та X є такими, як визначено в таблиці 1.



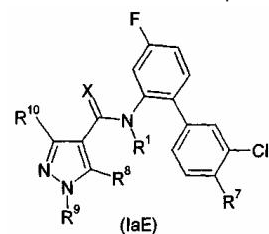
В таблиці 1 наведено 287 сполук формули (IaC), у якій R^1 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} та X є такими, як визначено в таблиці 1.



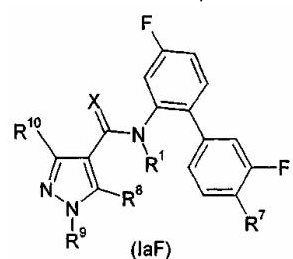
В таблиці 1 наведено 287 сполук формули (IaD), у якій R^1 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} та X є такими, як визначено в таблиці 1.



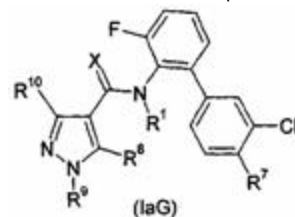
В таблиці 1 наведено 287 сполук формули (IaE), у якій R^1 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} та X є такими, як визначено в таблиці 1.



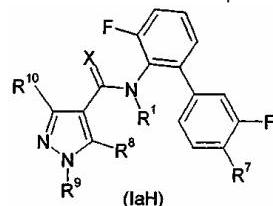
В таблиці 1 наведено 287 сполук формули (IaF), у якій R^1 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} та X є такими, як визначено в таблиці 1.



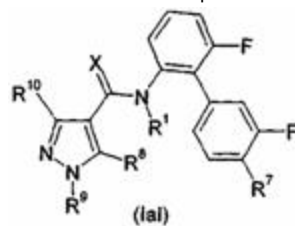
В таблиці 1 наведено 287 сполук формули (IaG), у якій R^1 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} та X є такими, як визначено в таблиці 1.



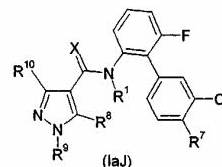
В таблиці 1 наведено 287 сполук формули (IaH), у якій R^1 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} та X є такими, як визначено в таблиці 1.



В таблиці 1 наведено 287 сполук формули (IaI), у якій R^1 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} та X є такими, як визначено в таблиці 1.



В таблиці 1 наведено 287 сполук формули (IaJ), у якій R^1 , R^7 , R^8 , R^9 , R^{10} та X є такими, як визначено в таблиці 1.



Таблиця 2

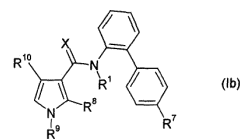
Сполука №	R^1	R^7	R^8	R^9	R^{10}	X
2.01	H	$C\equiv CH$	H	Me	CF_3	O
2.02	H	$C\equiv CH$	H	Me	CF_3	S
2.03	H	$C\equiv CH$	H	Me	CF_2H	O
2.04	пропаргіл	$C\equiv CH$	H	Me	CF_3	O
2.05	H	$C\equiv CH$	F	Me	Me	O
2.06	H	$C\equiv CH$	H	CH_2OMe	CF_3	O
2.07	аленіл	$C\equiv CH$	H	Me	CF_3	O
2.08	H	$C\equiv CSiMe_3$	H	Me	CF_3	O

2.09	H	C=CSiMe ₃	H	Me	CF ₃	S
2.10	H	C=CSiMe ₃	H	Me	CF ₂ H	O
2.11	H	C=CSiMe ₃	F	Me	Me	O
2.12	H	C=CCl	H	Me	CF ₃	O
2.13	H	C=CCl	H	Me	CF ₂ H	O
2.14	H	C=CCl	F	Me	Me	O
2.15	H	C=CBr	H	Me	CF ₃	O
2.16	H	C=CBr	H	Me	CF ₂ H	O
2.17	H	C=CBr	F	Me	Me	O
2.18	H	C=CCF ₃	H	Me	CF ₃	O
2.19	H	C=CCF ₃	H	Me	CF ₂ H	O
2.20	H	C=CCF ₃	F	Me	Me	O
2.21	аленіл	C=CCF ₃	H	Me	CF ₃	O
2.22	H	CH=CH ₂	H	Me	CF ₃	O
2.23	H	CH=CH ₂	H	Me	CF ₃	S
2.24	H	CH=CH ₂	H	Me	CF ₂ H	O
2.25	пропаргіл	CH=CH ₂	H	Me	CF ₃	O
2.26	H	CH=CH ₂	F	Me	Me	O
2.27	H	CH=CH ₂	H	CH ₃ OMe	CF ₃	O
2.28	аленіл	CH=CH ₂	H	Me	CF ₃	O
2.29	H	CH=CF ₂	H	Me	CF ₃	O
2.30	H	CH=CF ₂	H	Me	CF ₂ H	O
2.31	H	CH=CF ₂	F	Me	Me	O
2.32	H	CH=CCl ₂	H	Me	CF ₃	O
2.33	H	CH=CCl ₂	H	Me	CF ₂ H	O
2.34	H	CH=CCl ₂	F	Me	Me	O
2.35	H	CH=CBr ₂	H	Me	CF ₃	O
2.36	H	CH=CBr ₂	H	Me	CF ₂ H	O
2.37	H	CH=CBr ₂	F	Me	Me	O
2.38	H	CF=CF ₂	H	Me	CF ₃	O
2.39	H	CF=CF ₂	H	Me	CF ₂ H	O
2.40	H	CF=CF ₂	F	Me	Me	O
2.41	H	CCl=CH ₂	H	Me	CF ₃	O
2.42	H	CCl=CH ₂	H	Me	CF ₂ H	O
2.43	H	CCl=CH ₂	F	Me	Me	O
2.44	H	CBr=CH ₂	H	Me	CF ₃	O
2.45	H	CBr=CH ₂	H	Me	CF ₂ H	O
2.46	H	CBr=CH ₂	F	Me	Me	O
2.47	H	CF=CHF	H	Me	CF ₃	O
2.48	H	CF=CHF	H	Me	CF ₂ H	O
2.49	H	CF=CHF	F	Me	Me	O
2.50	H	CH=CHSiMe ₃	H	Me	CF ₃	O
2.51	H	CH=CHSiMe ₃	H	Me	CF ₂ H	O
2.52	H	CH=CHSiMe ₃	F	Me	Me	O
2.53	H	CH=CHCF ₃	H	Me	CF ₃	O
2.54	H	CH=CHCF ₃	H	Me	CF ₂ H	O
2.55	H	CH=CHCF ₃	F	Me	Me	O
2.56	H	CH=CClCF ₃	H	Me	CF ₃	O
2.57	H	CH=CClCF ₃	H	Me	CF ₂ H	O
2.58	H	CH=CClCF ₃	F	Me	Me	O
2.59	H	CH ₂ C=CH	H	Me	CF ₃	O
2.60	H	CH ₂ C=CH	H	Me	CF ₂ H	O
2.61	H	CH ₂ C=CH	F	Me	Me	O
2.62	H	CH ₂ C=CH	H	CH ₃ OMe	CF ₃	O
2.63	H	CH ₂ C=CSiMe ₃	H	Me	CF ₃	O
2.64	H	CH ₂ C=CSiMe ₃	H	Me	CF ₂ H	O
2.65	H	CH ₂ C=CSiMe ₃	F	Me	Me	O
2.66	H	C=CCMe ₃	H	Me	CF ₃	O
2.67	H	C=CCMe ₃	H	Me	CF ₂ H	O
2.68	H	C=CCMe ₃	F	Me	Me	O
2.69	H	C=CMe	H	Me	CF ₃	O
2.70	H	C=CMe	H	Me	CF ₂ H	O
2.71	H	C=CMe	F	Me	Me	O
2.72	COMe	C=CH	H	Me	CF ₃	O
2.73	H	C=CH	H	CF ₂ H	CF ₂ H	O
2.74	H	C=CH	H	CF ₂ H	CF ₃	O
2.75	H	C=CH	H	Me	CH ₂ F	O
2.76	H	C=CSiMe ₃	H	Me	CH ₂ F	O
2.77	H	C=C(циклопропіл)	H	Me	CF ₃	O
2.78	H	C=C(циклопропіл)	H	Me	CHF ₂	O
2.79	H	SiMe ₃	H	Me	CH ₂ F	O
2.80	H	SiMe ₃	H	Me	CF ₃	O
2.81	H	SiMe ₃	H	Me	CHF ₂	O
2.82	H	C=CF	H	Me	CF ₃	O
2.83	H	C=CF	H	Me	CF ₂ H	O
2.84	H	C=CF	F	Me	Me	O
2.85	H	C=CCF ₂ Cl	H	Me	CF ₃	O
2.86	H	C=CCF ₂ Cl	H	Me	CF ₂ H	O
2.87	H	C=CCF ₂ Cl	F	Me	Me	O
2.88	H	C=CCF ₂ H	H	Me	CF ₃	O
2.89	H	C=CCF ₂ H	H	Me	CF ₂ H	O
2.90	H	C=CCF ₂ H	F	Me	Me	O
2.91	H	C=CCF ₂ Br	H	Me	CF ₃	O

2.92	H	C=CCF ₂ Br	H	Me	CF ₂ H	O
2.93	H	C=CCF ₂ Br	F	Me	Me	O
2.94	H	C=CCH ₂ F	H	Me	CF ₃	O
2.95	H	C=CCH ₂ F	H	Me	CF ₂ H	O
2.96	H	C=CCH ₂ F	F	Me	Me	O
2.97	H	C=CCH(Me)F	H	Me	CF ₃	O
2.98	H	C=CCH(Me)F	H	Me	CF ₂ H	O
2.99	H	C=CCH(Me)F	F	Me	Me	O
2.100	H	C=CC(Me) ₂ F	H	Me	CF ₃	O
2.101	H	C=CC(Me) ₂ F	H	Me	CF ₂ H	O
2.102	H	C=CC(Me) ₂ F	F	Me	Me	O
2.103	H	C=CCH ₂ C(Me) ₃	H	Me	CF ₃	O
2.104	H	C=CCH ₂ C(Me) ₃	H	Me	CF ₂ H	O
2.105	H	C=CCH ₂ C(Me) ₃	F	Me	Me	O
2.106	H	C=CCH(Me) ₂	H	Me	CF ₂ H	O
2.107	H	C=CCH(Me) ₂	H	Me	CF ₂ H	O
2.108	H	C=CCH(Me) ₂	F	Me	Me	O
2.109	H	C=CCH ₂ CH(Me) ₂	H	Me	CF ₂ H	O
2.110	H	C=CCH ₂ CH(Me) ₂	H	Me	CF ₂ H	O
2.111	H	C=CCH ₂ CH(Me) ₂	F	Me	Me	O
2.112	H	CH ₂ C=CCMe ₃	H	Me	CF ₃	O
2.113	H	CH ₂ C=CCMe ₃	H	Me	CF ₂ H	O
2.114	H	CH ₂ C=CCMe ₃	F	Me	Me	O
2.115	H	CF ₂ C=CCMe ₃	H	Me	CF ₃	O
2.116	H	CF ₂ C=CCMe ₃	H	Me	CF ₂ H	O
2.117	H	CF ₂ C=CCMe ₃	F	Me	Me	O
2.118	H	CF ₂ C=CMe	H	Me	CF ₃	O
2.119	H	CF ₂ C=CMe	H	Me	CF ₂ H	O
2.120	H	CF ₂ C=CCMe	F	Me	Me	O
2.121	H	CF ₂ C=CH	H	Me	CF ₃	O
2.122	H	CF ₂ C=CH	H	Me	CF ₂ H	O
2.123	H	CF ₂ C=CH	F	Me	Me	O
2.124	H	CM ₂ C=CH	H	Me	CF ₃	O
2.125	H	CM ₂ C=CH	H	Me	CF ₂ H	O
2.126	H	CM ₂ C=CH	F	Me	Me	O
2.127	H	CHFC=CH	H	Me	CF ₃	O
2.128	H	CHFC=CH	H	Me	CF ₂ H	O
2.129	H	CHFC=CH	F	Me	Me	O
2.130	H	CHMeC=CH	H	Me	CF ₃	O
2.131	H	CHMeC=CH	H	Me	CF ₂ H	O
2.132	H	CHMeC=CH	F	Me	Me	O
2.133	H	CH(CF ₃)C=CH	H	Me	CF ₃	O
2.134	H	CH(CF ₃)C=CH	H	Me	CF ₂ H	O
2.135	H	CH(CF ₃)C=CH	F	Me	Me	O
2.136	H	C=C (1-Ф-циклопентил)	H	Me	CF ₃	O
2.137	H	C=C (1-Ф-циклопентил)	H	Me	CHF ₂	O
2.138	H	C=CCH ₂ OMe	H	Me	CF ₃	O
2.139	H	C=CCH ₂ OMe	H	Me	CF ₂ H	O
2.140	H	C=CCH ₂ OMe	F	Me	Me	O
2.141	H	C=CCMe ₂ OMe	H	Me	CF ₃	O
2.142	H	C=CCMe ₂ OMe	H	Me	CF ₂ H	O
2.143	H	C=CCMe ₂ OMe	F	Me	Me	O
2.144	H	C=CCMe ₂ OCOMe	H	Me	CF ₃	O
2.145	H	C=CCMe ₂ OCOMe	H	Me	CF ₂ H	O
2.146	H	C=CCF ₂ Me	H	Me	CF ₃	O
2.147	H	C=CCF ₂ Me	H	Me	CF ₂ H	O
2.148	H	C=CCF ₂ Me	F	Me	Me	O
2.149	H	C=CC(Me)=CH ₂	H	Me	CF ₃	O
2.150	H	C=CC(Me)=CH ₂	H	Me	CF ₂ H	O
2.151	H	CH=CFCl	H	Me	CF ₃	O
2.152	H	CH=CFCl	H	Me	CF ₂ H	O
2.153	H	CH=CFCl	F	Me	Me	O
2.154	H	CH=CFBr	H	Me	CF ₃	O
2.155	H	CH=CFBr	H	Me	CF ₂ H	O
2.156	H	CH=CFBr	F	Me	Me	O
2.157	H	CH=CHBr	H	Me	CF ₃	O
2.158	H	CH=CHBr	H	Me	CF ₂ H	O
2.159	H	CH=CHBr	F	Me	Me	O
2.160	H	CH=CHF	H	Me	CF ₃	O
2.161	H	CH=CHF	H	Me	CF ₂ H	O
2.162	H	CH=CHF	F	Me	Me	O
2.163	H	CM ₂ =CHCF ₃	H	Me	CF ₃	O
2.164	H	CM ₂ =CHCF ₃	H	Me	CF ₂ H	O
2.165	H	CM ₂ =CHCF ₃	F	Me	Me	O
2.166	H	CH=CFCF ₃	H	Me	CF ₃	O
2.167	H	CH=CFCF ₃	H	Me	CF ₂ H	O
2.168	H	CH=CFCF ₃	F	Me	Me	O
2.169	H	CH=CBrCF ₃	H	Me	CF ₃	O
2.170	H	CH=CBrCF ₃	H	Me	CF ₂ H	O
2.171	H	CH=CBrCF ₃	F	Me	Me	O

2.172	H	CH=CHC ₂ F ₅	H	Me	CF ₃	O
2.173	H	CH=CHC ₂ F ₅	H	Me	CF ₂ H	O
2.174	H	CH=CHC ₂ F ₅	F	Me	Me	O
2.175	H	CH=CHCl	H	Me	CF ₃	O
2.176	H	CH=CHCl	H	Me	CF ₂ H	O
2.177	H	CH=CHCl	F	Me	Me	O
2.178	H	CH=C(CF ₃) ₂	H	Me	CF ₃	O
2.179	H	CH=C(CF ₃) ₂	H	Me	CF ₂ H	O
2.180	H	CH=C(CF ₃) ₂	F	Me	Me	O
2.181	H	CMe=CFCI	H	Me	CF ₃	O
2.182	H	CMe=CFCI	H	Me	CF ₂ H	O
2.183	H	CMe=CFCI	F	Me	Me	O
2.184	H	CMe=CFBr	H	Me	CF ₃	O
2.185	H	CMe=CFBr	H	Me	CF ₂ H	O
2.186	H	CMe=CFBr	F	Me	Me	O
2.187	H	CMe=CF ₂	H	Me	CF ₃	O
2.188	H	CMe=CF ₂	H	Me	CF ₂ H	O
2.189	H	CMe=CF ₂	F	Me	Me	O
2.190	H	CMe=CCl ₂	H	Me	CF ₃	O
2.191	H	CMe=CCl ₂	H	Me	CF ₂ H	O
2.192	H	CMe=CCl ₂	F	Me	Me	O
2.193	H	CMe=CBr ₂	H	Me	CF ₃	O
2.194	H	CMe=CBr ₂	H	Me	CF ₂ H	O
2.195	H	CMe=CBr ₂	F	Me	Me	O
2.196	H	CMe=CFCF ₃	H	Me	CF ₃	O
2.197	H	CMe=CFCF ₃	H	Me	CF ₂ H	O
2.198	H	CMe=CFCF ₃	F	Me	Me	O
2.199	H	CMe=CCICF ₃	H	Me	CF ₃	O
2.200	H	CMe=CCICF ₃	H	Me	CF ₂ H	O
2.201	H	CMe=CCICF ₃	F	Me	Me	O
2.202	H	CCF ₃ =CF ₂	H	Me	CF ₃	O
2.203	H	CCF ₃ =CF ₂	H	Me	CF ₂ H	O
2.204	H	CCF ₃ =CF ₂	F	Me	Me	O
2.205	H	CCF ₃ =CCl ₂	H	Me	CF ₃	O
2.206	H	CCF ₃ =CCl ₂	H	Me	CF ₂ H	O
2.207	H	CCF ₃ =CCl ₂	F	Me	Me	O
2.208	H	CCF ₃ =CBr ₂	H	Me	CF ₃	O
2.209	H	CCF ₃ =CBr ₂	H	Me	CF ₂ H	O
2.210	H	CCF ₃ =CBr ₂	F	Me	Me	O
2.211	H	CCF ₃ =CH ₂	H	Me	CF ₃	O
2.212	H	CCF ₃ =CH ₂	H	Me	CF ₂ H	O
2.213	H	CCF ₃ =CH ₂	F	Me	Me	O
2.214	H	CCF ₃ =CFBr	H	Me	CF ₃	O
2.215	H	CCF ₃ =CFBr	H	Me	CF ₂ H	O
2.216	H	CCF ₃ =CFBr	F	Me	Me	O
2.217	H	CCF ₃ =CHF	H	Me	CF ₃	O
2.218	H	CCF ₃ =CHF	H	Me	CF ₂ H	O
2.219	H	CCF ₃ =CHF	F	Me	Me	O
2.220	H	CCF ₃ =CFCI	H	Me	CF ₃	O
2.221	H	CCF ₃ =CFCI	H	Me	CF ₂ H	O
2.222	H	CCF ₃ =CFCI	F	Me	Me	O
2.223	H	CCF ₃ =CHCl	H	Me	CF ₃	O
2.224	H	CCF ₃ =CHCl	H	Me	CF ₂ H	O
2.225	H	CCF ₃ =CHCl	F	Me	Me	O
2.226	H	CH=CF ₂ Cl	H	Me	CF ₃	O
2.227	H	CH=CF ₂ Cl	H	Me	CF ₂ H	O
2.228	H	CH=CF ₂ Cl	F	Me	Me	O
2.229	H	CH=CCICF ₂ Cl	H	Me	CF ₃	O
2.230	H	CH=CCICF ₂ Cl	H	Me	CF ₂ H	O
2.231	H	CH=CCICF ₂ Cl	F	Me	Me	O
2.232	H	CH ₂ CF=CF ₂	H	Me	CF ₃	O
2.233	H	CH ₂ CF=CF ₂	H	Me	CF ₂ H	O
2.234	H	CH ₂ CF=CF ₂	F	Me	Me	O
2.235	H	CF=CFBr	H	Me	CF ₃	O
2.236	H	CF=CFBr	H	Me	CF ₂ H	O
2.237	H	CF=CFBr	F	Me	Me	O
2.238	H	CH ₂ CH=CF ₂	H	Me	CF ₃	O
2.239	H	CH ₂ CH=CF ₂	H	Me	CF ₂ H	O
2.240	H	CH ₂ CH=CF ₂	F	Me	Me	O
2.241	H	CH ₂ CH=CCl ₂	H	Me	CF ₃	O
2.242	H	CH ₂ CH=CCl ₂	H	Me	CF ₂ H	O
2.243	H	CH ₂ CH=CCl ₂	F	Me	Me	O
2.244	H	CH ₂ CH=CBr ₂	H	Me	CF ₃	O
2.245	H	CH ₂ CH=CBr ₂	H	Me	CF ₂ H	O
2.246	H	CH ₂ CH=CBr ₂	F	Me	Me	O
2.247	H	CCl=CF ₂	H	Me	CF ₃	O
2.248	H	CCl=CF ₂	H	Me	CF ₂ H	O
2.249	H	CCl=CF ₂	F	Me	Me	O

В таблиці 2 наведено 249 сполук формули (Ib), у якій R¹, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰ та X є такими, як визначено в таблиці 2.



Таблиця 3

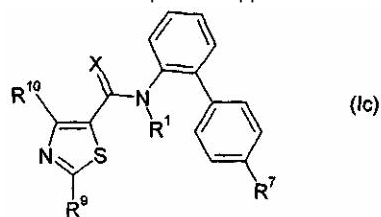
Сполука №	R ¹	R ⁷	R ⁹	R ¹⁰	X
3.01	H	C=CH	Me	CF ₃	O
3.02	H	C=CH	Me	CF ₃	S
3.03	H	C=CH	Me	CF ₂ H	O
3.04	пропаргіл	C=CH	Me	CF ₃	O
3.05	H	C=CH	Me	Me	O
3.06	H	C=CH	CH ₂ O Me	CF ₃	O
3.07	аленіл	C=CH	Me	CF ₃	O
3.08	H	C=CSiMe ₃	Me	CF ₃	O
3.09	H	C=CSiMe ₃	Me	CF ₃	S
3.10	H	C=CSiMe ₃	Me	CF ₂ H	O
3.11	H	C=CSiMe ₃	Me	Me	O
3.12	H	C=CCl	Me	CF ₃	O
3.13	H	C=CCl	Me	CF ₂ H	O
3.14	H	C=CCl	Me	Me	O
3.15	H	C=CBr	Me	CF ₃	O
3.16	H	C=CBr	Me	CF ₂ H	O
3.17	H	C=CBr	Me	Me	O
3.18	H	C=CCF ₃	Me	CF ₃	O
3.19	H	C=CCF ₃	Me	CF ₂ H	O
3.20	H	C=CCF ₃	Me	Me	O
3.21	аленіл	C=CCF ₃	Me	CF ₃	O
3.22	H	CH=CH ₂	Me	CF ₃	O
3.23	H	CH=CH ₂	Me	CF ₃	S
3.24	H	CH=CH ₂	Me	CF ₂ H	O
3.25	пропаргіл	CH=CH ₂	Me	CF ₃	O
3.26	H	CH=CH ₂	Me	Me	O
3.27	H	CH=CH ₂	CH ₂ O Me	CF ₃	O
3.28	аленіл	CH=CH ₂	Me	CF ₃	O
3.29	H	CH=CF ₂	Me	CF ₂ H	O
3.30	H	CH=CF ₂	Me	CF ₂ H	O
3.31	H	CH=CF ₂	Me	Me	O
3.32	H	CH=CCl ₂	Me	CF ₃	O
3.33	H	CH=CCl ₂	Me	CF ₂ H	O
3.34	H	CH=CCl ₂	Me	Me	O
3.35	H	CH=CBr ₂	Me	CF ₃	O
3.36	H	CH=CBr ₂	Me	CF ₂ H	O
3.37	H	CH=CBr ₂	Me	Me	O
3.38	H	CF=CF ₂	Me	CF ₃	O
3.39	H	CF=CF ₂	Me	CF ₂ H	O
3.40	H	CF=CF ₂	Me	Me	O
3.41	H	CCl=CH ₂	Me	CF ₃	O
3.42	H	CCl=CH ₂	Me	CF ₂ H	O
3.43	H	CCl=CH ₂	Me	Me	O
3.44	H	CBr=CH ₂	Me	CF ₃	O
3.45	H	CBr=CH ₂	Me	CF ₂ H	O
3.46	H	CBr=CH ₂	Me	Me	O
3.47	H	CF=CHF	Me	CF ₃	O
3.48	H	CF=CHF	Me	CF ₂ H	O
3.49	H	CF=CHF	Me	Me	O
3.50	H	CH=CHSiMe ₃	Me	CF ₃	O
3.51	H	CH=CHSiMe ₃	Me	CF ₂ H	O
3.52	H	CH=CHSiMe ₃	Me	Me	O
3.53	H	CH=CHCF ₃	Me	CF ₃	O
3.54	H	CH=CHCF ₃	Me	CF ₂ H	O
3.55	H	CH=CHCF ₃	Me	Me	O
3.56	H	CH=CCICF ₃	Me	CF ₃	O
3.57	H	CH=CCICF ₃	Me	CF ₂ H	O
3.58	H	CH=CCICF ₃	Me	Me	O
3.59	H	CH ₂ C=CH	Me	CF ₃	O
3.60	H	CH ₂ C=CH	Me	CF ₂ H	O
3.61	H	CH ₂ C=CH	Me	Me	O
3.62	H	CH ₂ C=CH	CH ₂ O Me	CF ₃	O
3.63	H	CH ₂ C=CSiMe ₃	Me	CF ₃	O
3.64	H	CH ₂ C=CSiMe ₃	Me	CF ₂ H	O
3.65	H	CH ₂ C=CSiMe ₃	Me	Me	O
3.66	H	C=CCMe ₃	Me	CF ₃	O
3.67	H	C=CCMe ₃	Me	CF ₂ H	O
3.68	H	C=CCMe ₃	Me	Me	O
3.69	H	C=CMe	Me	CF ₃	O
3.70	H	C=CMe	Me	CF ₂ H	O
3.71	H	C=CMe	Me	Me	O
3.72	COMe	C=CH	Me	CF ₃	O
3.73	H	C=CH	CF ₂ H	CF ₂ H	O

3.74	H	C=CH	CF ₂ H	CF ₃	O
3.75	H	C=CH	Me	CH ₂ F	O
3.76	H	C=CSiMe ₃	Me	CH ₂ F	O
3.77	H	C=C(циклопропіл)	Me	CF ₃	O
3.78	H	C=C(циклопропіл)	Me	CHF ₂	O
3.79	H	SiMe ₃	Me	CH ₂ F	O
3.80	H	SiMe ₃	Me	CF ₃	O
3.81	H	SiMe ₃	Me	CHF ₂	O
3.82	H	C=CF	Me	CF ₃	O
3.83	H	C=CF	Me	CF ₂ H	O
3.84	H	C=CF	Me	Me	O
3.85	H	C=CCF ₂ Cl	Me	CF ₃	O
3.86	H	C=CCF ₂ Cl	Me	CF ₂ H	O
3.87	H	C=CCF ₂ Cl	Me	Me	O
3.88	H	C=CCF ₂ H	Me	CF ₃	O
3.89	H	C=CCF ₂ H	Me	CF ₂ H	O
3.90	H	C=CCF ₂ H	Me	Me	O
3.91	H	C=CCF ₂ Br	Me	CF ₃	O
3.92	H	C=CCF ₂ Br	Me	CF ₂ H	O
3.93	H	C=CCF ₂ Br	Me	Me	O
3.94	H	C=CCH ₂ F	Me	CF ₃	O
3.95	H	C=CCH ₂ F	Me	CF ₂ H	O
3.96	H	C=CCH ₂ F	Me	Me	O
3.97	H	C=CCH(Me)F	Me	CF ₃	O
3.98	H	C=CCH(Me)F	Me	CF ₂ H	O
3.99	H	C=CCH(Me)F	Me	Me	O
3.100	H	C=CC(Me) ₂ F	Me	CF ₃	O
3.101	H	C=CC(Me) ₂ F	Me	CF ₂ H	O
3.102	H	C=CC(Me) ₂ F	Me	Me	O
3.103	H	C=CCH ₂ C(Me) ₃	Me	CF ₃	O
3.104	H	C=CCH ₂ C(Me) ₃	Me	CF ₂ H	O
3.105	H	C=CCH ₂ C(Me) ₃	Me	Me	O
3.106	H	C=CCH(Me) ₂	Me	CF ₃	O
3.107	H	C=CCH(Me) ₂	Me	CF ₂ H	O
3.108	H	C=CCH(Me) ₂	Me	Me	O
3.109	H	C=CCH ₂ CH(Me) ₂	Me	CF ₃	O
3.110	H	C=CCH ₂ CH(Me) ₂	Me	CF ₂ H	O
3.111	H	C=CCH ₂ CH(Me) ₂	Me	Me	O
3.112	H	CH ₂ C=CCMe ₃	Me	CF ₃	O
3.113	H	CH ₂ C=CCMe ₃	Me	CF ₂ H	O
3.114	H	CH ₂ C=CCMe ₃	Me	Me	O
3.115	H	CF ₂ C=CCMe ₃	Me	CF ₃	O
3.116	H	CF ₂ C=CCMe ₃	Me	CF ₂ H	O
3.117	H	CF ₂ C=CCMe ₃	Me	Me	O
3.118	H	CF ₂ C=CMe	Me	CF ₃	O
3.119	H	CF ₂ C=CMe	Me	CF ₂ H	O
3.120	H	CF ₂ C=CCMe	Me	Me	O
3.121	H	CF ₂ C=CH	Me	CF ₃	O
3.122	H	CF ₂ C=CH	Me	CF ₂ H	O
3.123	H	CF ₂ C=CH	Me	Me	O
3.124	H	CMe ₂ C=CH	Me	CF ₃	O
2.125	H	CMe ₂ C=CH	Me	CF ₂ H	O
3.126	H	CMe ₂ C=CH	Me	Me	O
3.127	H	CHFC=CH	Me	CF ₃	O
3.128	H	CHFC=CH	Me	CF ₂ H	O
3.129	H	CHFC=CH	Me	Me	O
3.130	H	CHMeC=CH	Me	CF ₃	O
3.131	H	CHMeC=CH	Me	CF ₂ H	O
3.132	H	CHMeC=CH	Me	Me	O
3.133	H	CH(CF ₃)C=CH	Me	CF ₃	O
3.134	H	CH(CF ₃)C=CH	Me	CF ₂ H	O
3.135	H	CH(CF ₃)C=CH	Me	Me	O
3.136	H	C=C(1-F-циклопентил)	Me	CF ₃	O
3.137	H	C=C(1-F-циклопентил)	Me	CHF ₂	O
3.138	H	C=CCH ₂ OMe	Me	CF ₃	O
3.139	H	C=CCH ₂ OMe	Me	CF ₂ H	O
3.140	H	C=CCH ₂ OMe	Me	Me	O
3.141	H	C=CCMe ₂ OMe	Me	CF ₃	O
3.142	H	C=CCMe ₂ OMe	Me	CF ₂ H	O
3.143	H	C=CCMe ₂ OMe	Me	Me	O
3.144	H	C=CCMe ₂ OCOMe	Me	CF ₃	O
3.145	H	C=CCMe ₂ OCOMe	Me	CF ₂ H	O
3.146	H	C=CCF ₂ Me	Me	CF ₃	O
3.147	H	C=CCF ₂ Me	Me	CF ₂ H	O
3.148	H	C=CCF ₂ Me	Me	Me	O
3.149	H	C=CC(Me)=CH ₂	Me	CF ₃	O
3.150	H	C=CC(Me)=CH ₂	Me	CF ₂ H	O
3.151	H	CH=CFCl	Me	CF ₃	O
3.152	H	CH=CFCl	Me	CF ₂ H	O
3.153	H	CH=CFCl	Me	Me	O
3.154	H	CH=CFBr	Me	CF ₃	O
3.155	H	CH=CFBr	Me	CF ₂ H	O
3.156	H	CH=CFBr	Me	Me	O

3.157	H	CH=CHBr	Me	CF ₃	O
3.158	H	CH=CHBr	Me	CF ₂ H	O
3.159	H	CH=CHBr	Me	Me	O
3.160	H	CH=CHF	Me	CF ₃	O
3.161	H	CH=CHF	Me	CF ₂ H	O
3.162	H	CH=CHF	Me	Me	O
3.163	H	CMe=CHCF ₃	Me	CF ₃	O
3.164	H	CMe=CHCF ₃	Me	CF ₂ H	O
3.165	H	CMe=CHCF ₃	Me	Me	O
3.166	H	CH=CFCF ₃	Me	CF ₃	O
3.167	H	CH=CFCF ₃	Me	CF ₂ H	O
3.168	H	CH=CFCF ₃	Me	Me	O
3.169	H	CH=CBrCF ₃	Me	CF ₃	O
3.170	H	CH=CBrCF ₃	Me	CF ₂ H	O
3.171	H	CH=CBrCF ₃	Me	Me	O
3.172	H	CH=CHCF ₂ F ₅	Me	CF ₃	O
3.173	H	CH=CHCF ₂ F ₅	Me	CF ₂ H	O
3.174	H	CH=CHCF ₂ F ₅	Me	Me	O
3.175	H	CH=CHCl	Me	CF ₃	O
3.176	H	CH=CHCl	Me	CF ₂ H	O
3.177	H	CH=CHCl	Me	Me	O
3.178	H	CH=C(CF ₃) ₂	Me	CF ₃	O
3.179	H	CH=C(CF ₃) ₂	Me	CF ₂ H	O
3.180	H	CH=C(CF ₃) ₂	Me	Me	O
3.181	H	CMe=CFCl	Me	CF ₃	O
3.182	H	CMe=CFCl	Me	CF ₂ H	O
3.183	H	CMe=CFCl	Me	Me	O
3.184	H	CMe=CFBr	Me	CF ₃	O
3.185	H	CMe=CFBr	Me	CF ₂ H	O
3.186	H	CMe=CFBr	Me	Me	O
3.187	H	CMe=CF ₂	Me	CF ₃	O
3.188	H	CMe=CF ₂	Me	CF ₂ H	O
3.189	H	CMe=CF ₂	Me	Me	O
3.190	H	CMe=CCl ₂	Me	CF ₃	O
3.191	H	CMe=CCl ₂	Me	CF ₂ H	O
3.192	H	CMe=CCl ₂	Me	Me	O
3.193	H	CMe=CBBr ₂	Me	CF ₃	O
3.194	H	CMe=CBBr ₂	Me	CF ₂ H	O
3.195	H	CMe=CBBr ₂	Me	Me	O
3.196	H	CMe=CFCF ₃	Me	CF ₃	O
3.197	H	CMe=CFCF ₃	Me	CF ₂ H	O
3.198	H	CMe=CFCF ₃	Me	Me	O
3.199	H	CMe=CClCF ₃	Me	CF ₃	O
3.200	H	CMe=CClCF ₃	Me	CF ₂ H	O
3.201	H	CMe=CClCF ₃	Me	Me	O
3.202	H	CCF ₃ =CF ₂	Me	CF ₃	O
3.203	H	CCF ₃ =CF ₂	Me	CF ₂ H	O
3.204	H	CCF ₃ =CF ₂	Me	Me	O
3.205	H	CCF ₃ =CCl ₂	Me	CF ₃	O
3.206	H	CCF ₃ =CCl ₂	Me	CF ₂ H	O
3.207	H	CCF ₃ =CCl ₂	Me	Me	O
3.208	H	CCF ₃ =CBBr ₂	Me	CF ₃	O
3.209	H	CCF ₃ =CBBr ₂	Me	CF ₂ H	O
3.210	H	CCF ₃ =CBBr ₂	Me	Me	O
3.211	H	CCF ₃ =CH ₂	Me	CF ₃	O
3.212	H	CCF ₃ =CH ₂	Me	CF ₂ H	O
3.213	H	CCF ₃ =CH ₂	Me	Me	O
3.214	H	CCF ₃ =CFBr	Me	CF ₃	O
3.215	H	CCF ₃ =CFBr	Me	CF ₂ H	O
3.216	H	CCF ₃ =CFBr	Me	Me	O
3.217	H	CCF ₃ =CHF	Me	CF ₃	O
3.218	H	CCF ₃ =CHF	Me	CF ₂ H	O
3.219	H	CCF ₃ =CHF	Me	Me	O
3.220	H	CCF ₃ =CFCl	Me	CF ₃	O
3.221	H	CCF ₃ =CFCl	Me	CF ₂ H	O
3.222	H	CCF ₃ =CFCl	Me	Me	O
3.223	H	CCF ₃ =CHCl	Me	CF ₃	O
3.224	H	CCF ₃ =CHCl	Me	CF ₂ H	O
3.225	H	CCF ₃ =CHCl	Me	Me	O
3.226	H	CH=CFCF ₂ Cl	Me	CF ₃	O
3.227	H	CH=CFCF ₂ Cl	Me	CF ₂ H	O
3.228	H	CH=CFCF ₂ Cl	Me	Me	O
3.229	H	CH=CClCF ₂ Cl	Me	CF ₃	O
3.230	H	CH=CClCF ₂ Cl	Me	CF ₂ H	O
3.231	H	CH=CClCF ₂ Cl	Me	Me	O
3.232	H	CH ₂ CF=CF ₂	Me	CF ₃	O
3.233	H	CH ₂ CF=CF ₂	Me	CF ₂ H	O
3.234	H	CH ₂ CF=CF ₂	Me	Me	O
3.235	H	CF=CFBr	Me	CF ₃	O
3.236	H	CF=CFBr	Me	CF ₂ H	O
3.237	H	CF=CFBr	Me	Me	O
3.238	H	CH ₂ CH=CF ₂	Me	CF ₃	O
3.239	H	CH ₂ CH=CF ₂	Me	CF ₂ H	O
3.240	H	CH ₂ CH=CF ₂	Me	Me	O
3.241	H	CH ₂ CH=CCl ₂	Me	CF ₃	O
3.242	H	CH ₂ CH=CCl ₂	Me	CF ₂ H	O
3.243	H	CH ₂ CH=CCl ₂	Me	Me	O
3.244	H	CH ₂ CH=CBBr ₂	Me	CF ₃	O

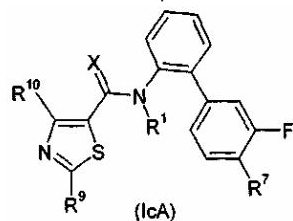
3.245	H	CH ₂ CH=CBr ₂	Me	CF ₂ H	O
3.246	H	CH ₂ CH=CBr ₂	Me	Me	O
3.247	H	CCl=CF ₂	Me	CF ₃	O
3.248	H	CCl=CF ₂	Me	CF ₂ H	O
3.249	H	CCl=CF ₂	Me	Me	O
3.250	H	C=CCMe ₂ OH	Me	CF ₃	O
3.251	H	C=CCH ₂ CH ₃	Me	CF ₂ H	O
3.252	H	C=CCH ₂ CH ₃	Me	Me	O
3.253	H	C=CCH ₂ CH ₃	Me	CF ₃	O
3.254	H	C=CCF=CF ₂	Me	CF ₃	O
3.255	H	C=CCF=CF ₂	Me	CF ₂ H	O
3.256	H	C=CCHFCI	Me	CF ₃	O
3.257	H	C=CCHFCI	Me	CF ₂ H	O
3.258	H	C=CCHFCI	Me	Me	O
3.259	H	CH=CFC ₂ F ₃	Me	CF ₃	O
3.260	H	CH=CFC ₂ F ₃	Me	CF ₂ H	O
3.261	H	CH=CFC ₂ F ₃	Me	Me	O
3.262	H	C=CCF ₂ CH ₂ CH ₃	Me	CF ₃	O
3.263	H	C=CCF ₂ CH ₂ CH ₃	Me	CF ₂ H	O
3.264	H	C=CCF ₂ CH ₂ CH ₃	Me	Me	O
3.265	H	C=CCHFCCH ₂ CH ₃	Me	CF ₃	O
3.266	H	C=CCHFCCH ₂ CH ₃	Me	CF ₂ H	O
3.267	H	C=CCHFCCH ₂ CH ₃	Me	Me	O
3.268	H	C=CCF(CF ₃) ₂	Me	CF ₃	O
3.269	H	C=CCF(CF ₃) ₂	Me	CF ₂ H	O
3.270	H	C=CCF(CF ₃) ₂	Me	Me	O
3.271	H	CH=CCIC ₂ F ₃	Me	CF ₃	O
3.272	H	CH=CCIC ₂ F ₃	Me	CF ₂ H	O
3.273	H	CH=CCIC ₂ F ₃	Me	Me	O
3.274	H	C=CC ₂ F ₅	Me	CF ₃	O
3.275	H	C=CC ₂ F ₅	Me	CF ₂ H	O
3.276	H	C=CC ₂ F ₅	Me	Me	O

В таблиці 3 наведено 276 сполук формули (Ic):

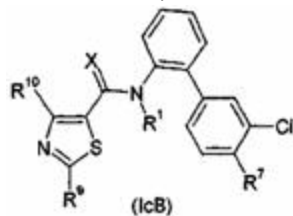


у якій R¹, R⁷, R⁹, R¹⁰ та X є такими, як визначено в таблиці 3.

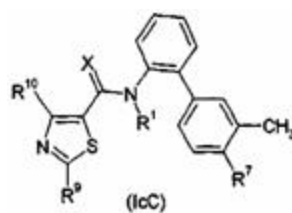
В таблиці 3 наведено 276 сполук формули (IcA), у якій R¹, R⁷, R⁹, R¹⁰ та X є такими, як визначено в таблиці 3.



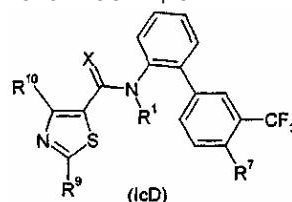
В таблиці 3 наведено 276 сполук формули (IcB), у якій R¹, R⁷, R⁹, R¹⁰ та X є такими, як визначено в таблиці 3.



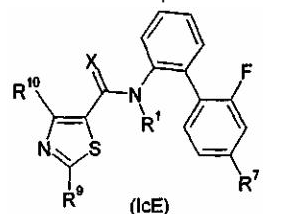
В таблиці 3 наведено 276 сполук формули (IcC), у якій R¹, R⁷, R⁹, R¹⁰ та X є такими, як визначено в таблиці 3.



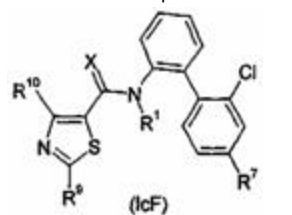
В таблиці 3 наведено 276 сполук формули (IcD), у якій R¹, R⁷, R⁹, R¹⁰ та X є такими, як визначено в таблиці 3.



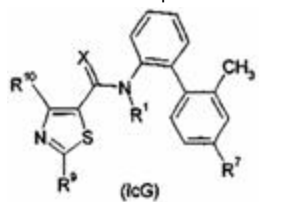
В таблиці 3 наведено 276 сполук формули (IcE), у якій R¹, R⁷, R⁹, R¹⁰ та X є такими, як визначено в таблиці 3.



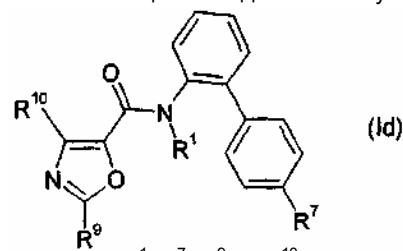
В таблиці 3 наведено 276 сполук формули (IcF), у якій R¹, R⁷, R⁹, R¹⁰ та X є такими, як визначено в таблиці 3.



В таблиці 3 наведено 276 сполук формули (IcG), у якій R¹, R⁷, R⁹, R¹⁰ та X є такими, як визначено в таблиці 3.



В таблиці 4 наведено 3 сполуки формули (Id):

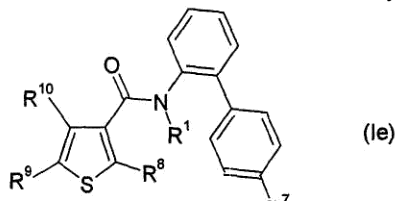


у якій R¹, R⁷, R⁹ та R¹⁰ є такими, як визначено в таблиці 4.

Таблиця 4

Сполука №	R ¹	R ⁷	R ⁹	R ¹⁰
4.01	H	C=CH	Me	CF ₃
4.02	H	C=CSiMe ₃	Me	CF ₃
4.03	H	CH=CH ₂	Me	CF ₃

В таблиці 5 наведено 15 сполук формули (Ie):

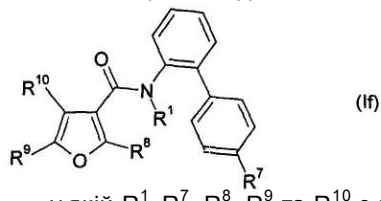


у якій R¹, R⁷, R⁸, R⁹ та R¹⁰ є такими, як визначено в таблиці 5.

Таблиця 5

Сполука №	R ¹	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰
5.01	H	C=CH	H	H	CF ₃
5.02	H	C=CH	Me	Me	Me
5.03	H	C=CH	H	Me	CF ₃
5.04	H	C=CH	Me	Me	H
5.05	COMe	C=CH	Me	Me	H
5.06	COMe	C=CH	Me	Me	Me
5.07	COEt	C=CH	Me	Me	Me
5.08	H	C=CSiMe ₃	H	H	CF ₃
5.09	H	C=CSiMe ₃	Me	Me	Me
5.10	H	C=CSiMe ₃	H	Me	CF ₃
5.11	H	C=CSiMe ₃	Me	Me	H
5.12	H	C=CSiMe ₃	H	H	CF ₃
5.13	H	CH=CH ₂	Me	Me	Me
5.14	H	CH=CH ₂	H	Me	CF ₃
5.15	H	CH=CH ₂	Me	Me	H

В таблиці 6 наведено 15 сполук формули (If):

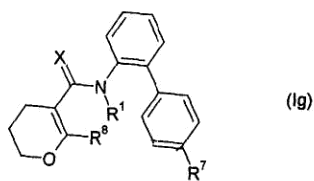


у якій R¹, R⁷, R⁸, R⁹ та R¹⁰ є такими, як визначено в таблиці 6.

Таблиця 6

Сполука №	R ¹	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰
6.01	H	C=CH	H	H	CF ₃
6.02	H	C=CH	Me	Me	Me
6.03	H	C=CH	H	Me	CF ₃
6.04	H	C=CH	Me	Me	H
6.05	COMe	C=CH	Me	Me	H
6.06	COMe	C=CH	Me	Me	Me
6.07	COEt	C=CH	Me	Me	Me
6.08	H	C=CSiMe ₃	H	H	CF ₃
6.09	H	C=CSiMe ₃	Me	Me	Me
6.10	H	C=CSiMe ₃	H	Me	CF ₃
6.11	H	C=CSiMe ₃	Me	Me	H
6.12	H	C=CSiMe ₃	H	H	CF ₃
6.13	H	CH=CH ₂	Me	Me	Me
6.14	H	CH=CH ₂	H	Me	CF ₃
6.15	H	CH=CH ₂	Me	Me	H

В таблиці 7 наведено 10 сполук формули (Ig):

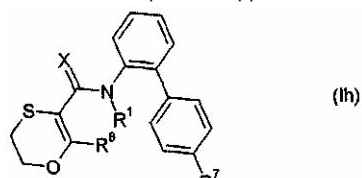


у якій R¹, R⁷, R⁸ та X є такими, як визначено в таблиці 7.

Таблиця 7

Сполука №	R ¹	R ⁷	R ⁸	X
7.01	H	C=CH	CF ₃	O
7.02	H	C=CH	Me	O
7.03	H	C=CH	CF ₃	S
7.04	COMe	C=CH	Me	O
7.05	H	C=CSiMe ₃	CF ₃	O
7.06	H	C=CSiMe ₃	Me	O
7.07	H	CH=CH ₂	CF ₃	O
7.08	H	CH=CH ₂	CF ₃	O
7.09	пропаргіл	CH=CH ₂	Me	O
7.10	аленіл	CH=CH ₂	Me	O

В таблиці 8 наведено 10 сполук формули (Ih):



у якій R¹, R⁷, R⁸ та X є такими, як визначено в таблиці 8.

Таблиця 8

Сполука №	R ¹	R ⁷	R ⁸	X
8.01	H	C=CH	CF ₃	O
8.02	H	C=CH	Me	O
8.03	H	C=CH	CF ₃	S
8.04	COMe	C=CH	Me	O
8.05	H	C=CSiMe ₃	CF ₃	O
8.06	H	C=CSiMe ₃	Me	O
8.07	H	CH=CH ₂	CF ₃	O
8.08	H	CH=CH ₂	CF ₃	O
8.09	пропаргіл	CH=CH ₂	Me	O
8.10	аленіл	CH=CH ₂	Me	O

Таблиця 9

Сполука №	R ¹	R ⁷	R ⁸
9.01	H	C=CH	Cl
9.02	H	C=CH	CF ₃
9.03	COMe	C=CH	Cl
9.04	H	C=CH	Br
9.05	COCH ₂ OMe	C=CH	Cl
9.06	H	C=CSiMe ₃	Cl
9.07	H	C=CSiMe ₃	CF ₃
9.08	H	C=CSiMe ₃	Br
9.09	H	CH=CH ₂	CF ₃
9.10	H	CH=CH ₂	Br
9.11	H	CH=CH ₂	Cl
9.12	H	CH=CH ₂	CH ₃
9.13	пропаргіл	CH=CH ₂	Cl
9.14	аленіл	CH=CH ₂	Cl
9.15	H	C=CCl	Cl
9.16	H	C=CCl	CF ₃
9.17	H	C=CCl	Br
9.18	H	C=CBr	Cl
9.19	H	C=CBr	CF ₃
9.20	H	C=CBr	Br
9.21	H	C=CCF ₃	Cl
9.22	H	C=CCF ₃	CF ₃
9.23	H	C=CCF ₃	Br
9.24	H	CH=CF ₂	CF ₃
9.25	H	CH=CF ₂	Br

9.26	H	CH=CF ₂	Cl
9.27	H	CCl=CH ₂	CF ₃
9.28	H	CCl=CH ₂	Br
9.29	H	CCl=CH ₂	Cl
9.30	H	CBr=CH ₂	CF ₃
9.31	H	CBr=CH ₂	Br
9.32	H	CBr=CH ₂	Cl
9.33	H	CF=CHF	CF ₃
9.34	H	CF=CHF	Br
9.35	H	CF=CHF	Cl
9.36	H	CH=CHCF ₃	CF ₃
9.37	H	CH=CHCF ₃	Br
9.38	H	CH=CHCF ₃	Cl
9.39	H	CH=CClCF ₃	CF ₃
9.40	H	CH=CClCF ₃	Br
9.41	H	CH=CClCF ₃	Cl
9.42	H	CH ₂ C=CH	CF ₃
9.43	H	CH ₂ C=CH	Br
9.44	H	CH ₂ C=CH	Cl
9.45	H	CH ₂ C=CSiMe ₃	CF ₃
9.46	H	CH ₂ C=CSiMe ₃	Br
9.47	H	CH ₂ C=CSiMe ₃	Cl
9.48	H	C=Me	CF ₃
9.49	H	C=Me	Br
9.50	H	C=Me	Cl
9.51	H	CH=CCl ₂	CF ₃
9.52	H	CH=CCl ₂	Br
9.53	H	CH=CCl ₂	Cl
9.54	H	CH=CHSiMe ₃	CF ₃
9.55	H	CH=CHSiMe ₃	Br
9.56	H	CH=CHSiMe ₃	Cl
9.57	H	C=C(циклопропіл)	Cl
9.58	H	SiMe ₃	Cl
9.59	H	C=CCMe ₃	Cl
9.60	H	CH=CBF ₂	CF ₃
9.61	H	CH=CBF ₂	Br
9.62	H	CH=CBF ₂	Cl
9.63	H	CF=CF ₂	CF ₃
9.64	H	CF=CF ₂	Br
9.65	H	CF=CF ₂	Cl
9.66	H	C=CCMe ₃	CF ₃
9.67	H	C=CCMe ₃	Br
9.68	аленіл	C=CCMe ₃	Cl

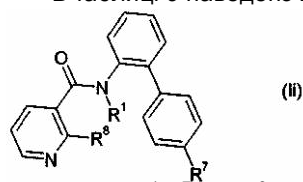
9.69	H	C=C(циклопропіл)	CF ₃
9.70	H	C=C(циклопропіл)	Br
9.71	H	C=CF	CF ₃
9.72	H	C=CF	Br
9.73	H	C=CF	Cl
9.74	H	C=CCF ₂ Cl	Cl
9.75	H	C=CCF ₂ Cl	CF ₃
9.76	H	C=CCF ₂ Cl	Br
9.77	H	C=CCF ₂ H	Cl
9.78	H	C=CCF ₂ H	CF ₃
9.79	H	C=CCF ₂ H	Br
9.80	H	C=CCF ₂ Br	Cl
9.81	H	C=CCF ₂ Br	CF ₃
9.82	H	C=CCF ₂ Br	Br
9.83	H	C=CCH ₂ F	Cl
9.84	H	C=CCH ₂ F	CF ₃
9.85	H	C=CCH ₂ F	Br
9.86	H	C=CCH(Me)F	Cl
9.87	H	C=CCH(Me)F	CF ₃
9.88	H	C=CCH(Me)F	Br
9.89	H	C=CC(Me) ₂ F	Cl
9.90	H	C=CC(Me) ₂ F	CF ₃
9.91	H	C=CC(Me) ₂ F	Br
9.92	H	C=CCH ₂ CMe ₃	Cl
9.93	H	C=CCH ₂ CMe ₃	Br
9.94	H	C=CCHMe ₂	CF ₃
9.95	H	C=CCHMe ₂	Br
9.96	H	C=CCHMe ₂	Cl
9.97	H	C=CCH ₂ CHMe ₂	CF ₃
9.98	H	C=CCH ₂ CHMe ₂	Br
9.99	H	C=CCH ₂ CHMe ₂	Cl
9.100	H	CF ₂ C=Me	CF ₃
9.101	H	CF ₂ C=Me	Br
9.102	H	CF ₂ C=Me	Cl
9.103	H	CF ₂ C=CH	CF ₃
9.104	H	CF ₂ C=CH	Br
9.105	H	CF ₂ C=CH	Cl
9.106	H	CHFC=CH	CF ₃
9.107	H	CHFC=CH	Br
9.108	H	CHFC=CH	Cl
9.109	H	C=C(1-F-циклопентил)	CF ₃

9.110	H	C=C(1-F-циклопентил)	Br
9.111	H	C=C(1-F-циклопентил)	Cl
9.112	H	C=CCH ₂ OMe	Cl
9.113	H	C=CCH ₂ OMe	Br
9.114	H	C=CCH ₂ OMe	CF ₃
9.115	H	C=CCMe ₂ OMe	Cl
9.116	H	C=CCMe ₂ OMe	Br
9.117	H	C=CCMe ₂ OMe	CF ₃
9.118	H	C=CCMe ₂ OCOMe	Cl
9.119	H	C=CCMe ₂ OCOMe	Br
9.120	H	C=CCMe ₂ OCOMe	CF ₃
9.121	H	C=CCF ₂ Me	Cl
9.122	H	C=CCF ₂ Me	Br
9.123	H	C=CCF ₂ Me	CF ₃
9.124	H	CH=CFCl	CF ₃
9.125	H	CH=CFCl	Br
9.126	H	CH=CFCl	Cl
9.127	H	CH=CFBr	CF ₃
9.128	H	CH=CFBr	Br
9.129	H	CH=CFBr	Cl
9.130	H	CH=CHBr	CF ₃
9.131	H	CH=CHBr	Br
9.132	H	CH=CHBr	Cl
9.133	H	CMe=CHCF ₃	CF ₃
9.134	H	CMe=CHCF ₃	Br
9.135	H	CMe=CHCF ₃	Cl
9.136	H	CH=CFCF ₃	CF ₃
9.137	H	CH=CFCF ₃	Br
9.138	H	CH=CFCF ₃	Cl
9.139	H	CH=CBF ₂	CF ₃
9.140	H	CH=CBF ₂	Br
9.141	H	CH=CBF ₂	Cl
9.142	H	CH=CHC ₂ F ₅	CF ₃
9.143	H	CH=CHC ₂ F ₅	Br
9.144	H	CH=CHC ₂ F ₅	Cl
9.145	H	CH=CHCl	CF ₃
9.146	H	CH=CHCl	Br
9.147	H	CH=CHCl	Cl
9.148	H	CH=C(CF ₃) ₂	Cl
9.149	H	CMe=CFCl	CF ₃
9.150	H	CMe=CFCl	Br
9.151	H	CMe=CFCl	Cl
9.152	H	CMe=CFBr	CF ₃



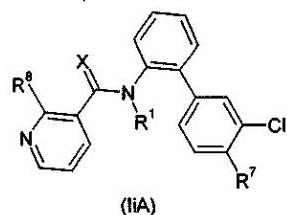


В таблиці 9 наведено 212 сполук формули (II):



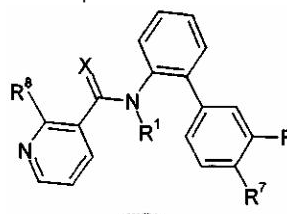
у якій R^1, R^7 та R^8 є такими, як визначено в таблиці 9.

В таблиці 9 наведено 212 сполук формули (IIA), у якій R^1, R^7 та R^8 є такими, як визначено в таблиці 9.



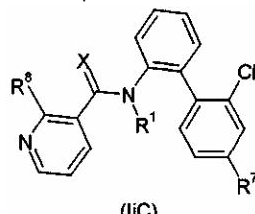
(IIB)

В таблиці 9 наведено 212 сполук формули (IIB), у якій R^1, R^7 та R^8 є такими, як визначено в таблиці 9.



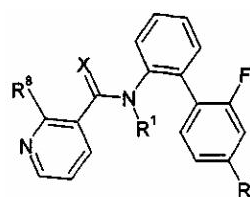
(IIC)

В таблиці 9 наведено 212 сполук формули (IIC), у якій R^1, R^7 та R^8 є такими, як визначено в таблиці 9.



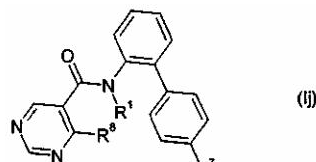
(IID)

В таблиці 9 також наведено 212 сполук формули (IID), у якій R^1, R^7 та R^8 є такими, як визначено в таблиці 9.



(Ij)

В таблиці 10 наведено 14 сполук формули (Ij):

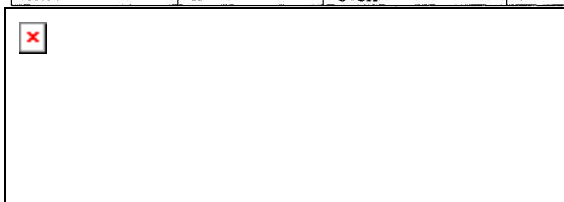


(Ij)

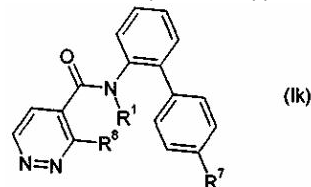
у якій R^1, R^7 та R^8 є такими, як визначено в таблиці 10.

Таблиця 10

Сполука №	R^1	R^7	R^8
10.01	H	C=CH	Cl
10.02	H	C=CH	CF ₃
10.03	COMe	C=CH	Cl
10.04	H	C=CH	Br



В таблиці 11 наведено 14 сполук формули (Ik):



(Ik)

у якій R^1, R^7 та R^8 є такими, як визначено в таблиці 11.

Таблиця 11

Сполука №	R^1	R^7	R^8
11.01	H	C=CH	Cl
11.02	H	C=CH	CF ₃
11.03	COMe	C=CH	Cl
11.04	H	C=CH	Br
11.05	COCH ₂ OMe	C=CH	Cl
11.06	H	C=CSiMe ₃	Cl
11.07	H	C=CSiMe ₃	CF ₃
11.08	H	C=CSiMe ₃	Br
11.09	H	CH=CH ₂	CF ₃
11.10	H	CH=CH ₂	Br
11.11	H	CH=CH ₂	Cl
11.12	H	CH=CH ₂	CH ₃
11.13	пропаргіл	CH=CH ₂	Cl
11.14	аленіл	CH=CH ₂	Cl

В таблиці 12 наведено 94 сполуки формули (II), у якій всі R^2, R^3, R^4 та R^5 означають водень; п дорівнює 0; та R^1 та R^7 є такими, як визначено в таблиці 12.

Таблиця 12

Сполука №	R ¹	R ⁷
12.01	H	C=CH
12.02	H	C=CSiMe ₃
12.03	H	C=CCF ₃
12.04	H	C=CCl
12.05	H	CH=CH ₂
12.06	H	CH=CF ₂
12.07	H	CH=CCl ₂
12.08	H	CH=CBF ₂
12.09	H	CF=CF ₂
12.10	H	CCl=CH ₂
12.11	H	CF=CHF
12.12	H	CH=CHCF ₃
12.13	H	CH=CClCF ₃
12.14	H	CH ₂ C=CH
12.15	H	C=CCMe ₃
12.16	CHO	C=CMe
12.17	H	C=C(циклопропіл)
12.18	H	SiMe ₃
12.19	H	C=CBBr
12.20	H	CBBr=CH ₂
12.21	H	CH=CHSiMe ₃
12.22	H	CH ₂ C=CSiMe ₃
12.23	H	C=CMe
12.24	H	C=CF
12.25	H	C=CCF ₂ Cl
12.26	H	C=CCF ₂ H
12.27	H	C=CCF ₂ Br
12.28	H	C=CCH ₂ F
12.29	H	C=CCH(Me)F
12.30	H	C=CC(Me) ₂ F
12.31	H	C=CCH ₂ C(Me) ₃
12.32	H	C=CCH(Me) ₂
12.33	H	C=CCH ₂ CH(Me) ₂
12.34	H	CH ₂ C=CCMe ₃
12.35	H	CF ₂ C=CCMe ₃
12.36	H	CF ₂ C=CMMe
12.37	H	CF ₂ C=CH
12.38	H	CMMe ₂ C=CH
12.39	H	CHFC=CH
12.40	H	CHMeC=CH
12.41	H	CH(CF ₃)C=CH
12.42	H	C=C(1-F-циклопентил)
12.43	H	C=CCH ₂ OMe
12.44	H	C=CCMe ₂ OMe
12.45	H	C=CCMe ₂ OCOMe
12.46	H	C=CCF ₂ Me
12.47	H	C=CC(Me)=CH ₂
12.48	H	CH=CFCI
12.49	H	CH=CFBr
12.50	H	CH=CHBr
12.51	H	CH=CHF
12.52	H	CMMe=CHCF ₃
12.53	H	CH=CFCF ₃
12.54	H	CH=CBBrCF ₃
12.55	H	CH=CHC ₂ F ₅
12.56	H	CH=CHCl
12.57	H	CH=C(CF ₃) ₂
12.58	H	CMMe=CFCI
12.59	H	CMMe=CFBr
12.60	H	CMMe=CF ₂
12.61	H	CMMe=CCl ₂
12.62	H	CMMe=CBBr ₂
12.63	H	CMMe=CFCF ₃
12.64	H	CMMe=CClCF ₃
12.65	H	CCF ₃ =CF ₂
12.66	H	CCF ₃ =CCl ₂
12.67	H	CCF ₃ =CCl ₂
12.68	H	CCF ₃ =CCl ₂
12.69	H	CCF ₃ =CBBr ₂
12.70	H	CCF ₃ =CH ₂
12.71	H	CCF ₃ =CHBr
12.72	H	CCF ₃ =CHF
12.73	H	CCF ₃ =CFCI
12.74	H	CCF ₃ =CHCl
12.75	H	CH=CFCF ₂ Cl
12.76	H	CH=CClCF ₂ Cl
12.77	H	CH ₂ CF=CF ₂
12.78	H	CF=CFBr
12.79	H	CH ₂ CH=CF ₂
12.80	H	CH ₂ CH=CCl ₂
12.81	H	CH ₂ CH=CBBr ₂
12.82	H	CCl=CF ₂
12.83	H	C=CCH ₂ SiMe ₃

12.84	H	C=CSiMe ₂ CMe ₃
12.85	H	C=CCMe ₂ OH
12.86	H	C=CCH ₂ CH ₃
12.87	H	C=CCF=CF ₂
12.88	H	C=CCHFCI
12.89	H	CH=CF ₂ C ₂ F ₅
12.90	H	C=CCF ₂ CH ₂ CH ₃
12.91	H	C=CCHFC ₂ H ₅
12.92	H	C=CCF(CF ₃) ₂
12.93	H	CH=CClC ₂ F ₅
12.94	H	C=CC ₂ F ₅

В таблиці 13 наведена 1 сполука формули (III), у якій всі R², R³, R⁴ та R⁵ означають водень; n дорівнює 0; та Hal і R⁷ є такими, як визначено в таблиці 13.

Таблиця 13

Сполука №	R ⁷	Hal
13.01	C=CH	Br

У даному описі температура наведена в градусах Цельсія; "ЯМР" означає спектр ядерного магнітного резонансу; МС означає мас-спектр; М⁺-1 та М⁺+1 означають сигнали в мас-спектрі, що відповідають молекулярній масі мінус 1 або молекулярній масі плюс 1; i "%" означають мас.%, якщо відповідні концентрації не наведені в інших одиницях вимірювання.

У даному описі використовуються наступні аббревіатури:

т.пл.=	температура плавлення	т.кип.=	температура кипіння
s=	синглет	br=	широкий
d=	дублет	dd=	дублет дублетів
t=	триплет	q=	квартет
m=	мультиплет		

В таблиці 14 наведені деякі температури плавлення, деякі молекулярні іони та деякі дані ЯМР, всі одержані з використанням CDCl₃ як розчинник (якщо не зазначено інше; якщо використовується суміш розчинників, це зазначено, наприклад, у вигляді (CDCl₃/d₆-DMCO (диметилсульфоксид)), (не ставилося за мету привести всі дані, що характеризуються для всіх випадків) для сполук таблиць від 1 до 13. Якщо не зазначено інше, то дані відносяться до цис/транс-суміші кожної сполуки.

Таблиця 14

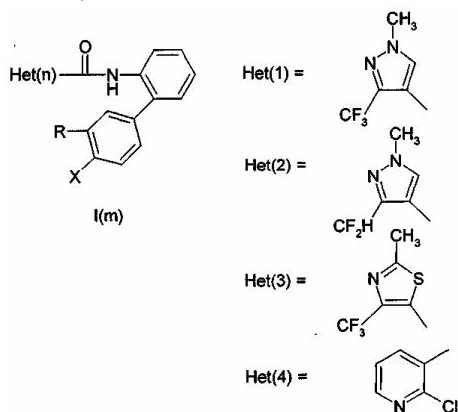
Сполука №	Дані ¹ H-ЯМР: (мас. част./млн/мультиплетність/кількість H) або дані МС	Температура плавлення/(°C)
1.01		169-170
1.03		132-135
1.08		147-150
1.10		>200
1.12		195-197
1.13		139-144
1.15		193-194
1.16		120-125
1.18		207-209
1.19		210-212
1.22		184-187
1.24		137-141
1.29		197-198
1.30		181-182
1.32		173-176
1.33		147-150
1.35		167-169
1.36		148-150
1.38		156-157
1.39		168-170
1.41		212-213
1.42		174-176
1.50		117-124
1.53		205-206
1.54		194-195
1.56		143-145
1.57		118-121
1.59		186-190
1.60		137-139
1.66		139-143
1.67	406 (M ⁺ -1)	193-196
1.69	382 (M ⁺ -1)	221-223
1.70	364 (M ⁺ -1)	205-208
1.77		208-210
1.78		202-205
1.80		165-166
1.81		165-169
1.85		198-198,5
1.86		184-184,5
1.88		206-207
1.89		200-201
1.93		160-162
1.94		205-206
1.95		198-199
1.97		197-198 (з розкладанням)
1.98		176-177
1.100		120-121
1.101		128-129
1.106		155-158
1.107		142-143
1.109		150-153
1.110		132-140
1.137		132-133
1.138		167-169
1.139		163-165
1.141		141-142,5
1.142		155-156
1.144	1,8(s,6); 2,1(s,3); 3,95(s,3) 7,2-7,6(m,7); 7,75(br.s,1); 8,25(d,1)	
1.145		132-141
1.147		149-150
1.150		143-145
1.151		189-194
1.152		168-170
1.154		197-200
1.155		174-178
1.158		195
1.166		172-155
1.167		145-150
1.182		127-129

1.185		111-114
1.194	2,25(s,3); 3,9(s,3); 6,7(t,1); 7,2-7,5(m,6); 7,7(s,1); 7,72(br,1); 8,3(d,1)	
1.212		176-179
1.226		152,5-153
1.227		146-147
1.250		159-162
1.251		156-161
1.252		163-165
1.254		139-140
1.255		187-187,5
1.257		177-178
2.01		145-148
2.08		148-154
2.66		160-165
3.01		145-147
3.08		103-105
3.12		122-126
3.18		160-165
3.29		146-147
3.32		125-130
3.35		120-126
3.38		122-127
3.41		169-170
3.56		132-137
3.66		129-133
3.69		159-163
3.97		133-134
3.100		127,7-129
3.109		117-119
3.136		140-142
3.141	1,55(s,6); 2,7(s,3); 3,4(s,3); 7,2-7,3(m,4); 7,4(m,1); 7,5(d,2); 7,55(br,1); 8,3(d,1)	
3.146		141-142
3.157		145-157
3.166		148-150
3.193		128-132
3.211		183-184
3.250		140-143
9.01		150-152
9.06		84-86
9.15		154-157
9.21		185-189
9.38		141-142
9.41		143-145
9.50		157-159
9.53		133-138
9.58		130-132
9.59		123-125
9.62		138-139
9.65		164-167
9.68	1,8(s,9); 4,9 + 5,25(m,1); 6,15-8,5(m,12)	
9.83		143-145
9.86		169-170
9.89		167-167,5
9.99		109-111
9.118	1,8(s,6); 2,1(s,3); 7,2-7,6(m,9); 8,1(m,1); 8,45(m,1)	
9.132		162-165
9.138		172-175
9.163		167-171
9.185		119-120,5
9.201	0,0(s,9); 1,55(s,2); 7,0-7,3(m,8); 7,9-8,0(m,2); 8,3(m,2)	
9.203		105-107
12.01		111-115
12.02	0,05(s,9); 6,5-6,7(d+t,2); 6,87,1(t+t,2); 7,2- 7,5(m,4)	
12.03	262(M+H ⁺); 303(M + MeCN + H ⁺);	
12.04		92-98
12.06	3,75(br,2); 5,35(dd,1); 6,75-6,9(m,2); 7,1- 7,2(m,2); 7,35-7,5(m,4)	
12.07	3,8(br,2); 6,8(d,1); 6,85(t,1); 6,9(s,1); 7,17,2(d+t,2); 7,45-7,65(m,4)	
12.08	3,8(br,2); 6,75-6,9(m,2); 7,1-7,2(m,2); 7,5- 7,7(m,5)	
12.09	3,8(br,2); 6,7-6,9(m,2); 7,1-7,2(m,2); 7,6(very narrow m,4) ¹⁹ F : -99,7; -114,6; -177,3	
12.10	230(M+H ⁺); 371(M + MeCN + H ⁺)	
12.12		84-86
12.13	298(M+H ⁺); 339(M + MeCN + H ⁺);	
12.14	208(M+H ⁺); 249(M + MeCN + H ⁺);	

12.15		66-69
12.16		91-96
12.17	0,8-0,9(m,4); 1,4-1,5(m,2); 3,7(br,2); 6,7-6,8(m,2); 7,1-7,2(m,2); 7,3-7,5(m,4)	
12.18	0,15(s,9); 2,0-2,6(дуже широкий,2); 6,6-6,7(m,2); 7,0-7,1(m,2); 7,3-7,5(m,4)	
12.19	3,8(br,2); 6,75-6,9(m,2); 7,1-7,2(m,2); 7,35-7,55(m,4)	
12.23		108-112
12.25	3,75(br,2); 6,8(m,2); 7,1-7,25(m,2); 7,5-7,7(m,4) ¹⁹ F : -35,9	
12.26	3,8(br,2); 6,4(t,1); 6,75-6,9(m,2); 7,1-7,25(m,2); 7,4-7,56(m,4); ¹⁹ F : -105,7	
12.28		69-71
12.29	1,7(d of d,3); 3,8(br,2); 5,5(d of quartets,1); 6,75-6,9(m,2); 7,05-7,2(m,2); 7,4-7,6(m,4) ¹⁹ F : -165,6	
12.30	1,75(d,6); 3,8(br,2); 6,8(m,2); 7,15(m,2); 7,4-7,6(m,4) ¹⁹ F : -126,0	
12.32	1,3(d,6); 3,7(br,2); 6,7-6,8(d+t,2); 7,15(m,2); 7,3-7,5(m,4)	
12.33	1,05(d,6); 1,9(m,1); 2,35(d,2); 3,75(br,2); 6,75-6,9(m,2); 7,1-7,2(m,2); 7,35-7,5(m,4)	
12.42	1,7-2,5(m,8); 3,7(br,2); 6,7-6,8(m,2); 7,05-7,15(m,2); 7,35,7,5(m,4); 7,1-7,2(m,2); 7,4-7,6(m,4)	
12.43	3,45(s,3); 3,8(br,2); 4,35(s,2); 6,7-6,8(d+t,2); 7,1-7,25(m,2); 7,4-7,6(m,4)	
12.45	1,75(s,6); 2,1(s,3); 3,75(br,2); 6,75-6,85(m,2); 7,1-7,2(m,2); 7,4-7,6(m,4)	
12.46	2,0(t,3); 3,75(br,2); 6,75-6,85(m,2); 7,1-7,2(m,2); 7,4-7,6(m,4)	
12.47	2,0(s,3); 3,75(br,2); 5,3(narrow m,1); 5,4(s,1); 6,75-6,85(m,2); 7,1-7,2(m,2); 7,4-7,55(m,4)	
12.48	3,8(br,2); 5,85 + 6,45 (2ds,1); 6,7-6,9(m,2); 7,1-7,2(m,2); 7,4-7,65(m,4); ¹⁹ F : -71,2; -73,9	
12.49	4,0-4,6(br,2); 6,0+ 6,7 (2ds,1); 6,75-6,9(m,2); 7,1-7,2(m,2); 7,4-7,65(m,4);	
12.50		86-92



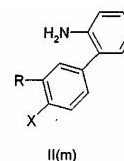
В таблиці 15 наведено 48 сполук формули 1(m), у якій R, X та Het є такими, як визначено в таблиці 15.



Таблиця 15

Сполука №	X	R	Het
15.1	H	C=CH	Het(1)
15.2	H	C=CH	Het(2)
15.3	H	C=CH	Het(3)
15.4	H	C=CH	Het(4)
15.5	Cl	C=CH	Het(1)
15.6	Cl	C=CH	Het(2)
15.7	Cl	C=CH	Het(3)
15.8	Cl	C=CH	Het(4)
15.9	F	C=CH	Het(1)
15.10	F	C=CH	Het(2)
15.11	F	C=CH	Het(3)
15.12	F	C=CH	Het(4)
15.13	H	C=CMe	Het(1)
15.14	H	C=CMe	Het(2)
15.15	H	C=CMe	Het(3)
15.16	H	C=CMe	Het(4)
15.17	F	C=CMe	Het(1)
15.18	F	C=CMe	Het(2)
15.19	F	C=CMe	Het(3)
15.20	F	C=CMe	Het(4)
15.21	Cl	C=CMe	Het(1)
15.22	Cl	C=CMe	Het(2)
15.23	Cl	C=CMe	Het(3)
15.24	Cl	C=CMe	Het(4)
15.25	H	C=CCMe ₃	Het(1)
15.26	H	C=CCMe ₃	Het(2)
15.27	H	C=CCMe ₃	Het(3)
15.28	H	C=CCMe ₃	Het(4)
15.29	Cl	C=CCMe ₃	Het(1)
15.30	Cl	C=CCMe ₃	Het(2)
15.31	Cl	C=CCMe ₃	Het(3)
15.32	Cl	C=CCMe ₃	Het(4)
15.33	F	C=CCMe ₃	Het(1)
15.34	F	C=CCMe ₃	Het(2)
15.35	F	C=CCMe ₃	Het(3)
15.36	F	C=CCMe ₃	Het(4)
15.37	H	CH=CClCF ₃	Het(1)
15.38	H	CH=CClCF ₃	Het(2)
15.39	H	CH=CClCF ₃	Het(3)
15.40	H	CH=CClCF ₃	Het(4)
15.41	Cl	CH=CClCF ₃	Het(1)
15.42	Cl	CH=CClCF ₃	Het(2)
15.43	Cl	CH=CClCF ₃	Het(3)
15.44	Cl	CH=CClCF ₃	Het(4)
15.45	F	CH=CClCF ₃	Het(1)
15.46	F	CH=CClCF ₃	Het(2)
15.47	F	CH=CClCF ₃	Het(3)
15.48	F	CH=CClCF ₃	Het(4)

В таблиці 16 наведено 12 сполук формули II(m), у якій R та X є такими, як визначено в таблиці 16:



Таблиця 16

Сполука №	X	R
16.1	H	C=CH
16.2	Cl	C=CH
16.3	F	C=CH
16.4	H	C=CMe
16.5	F	C=CMe
16.6	Cl	C=CMe
16.7	H	C=CCMe ₃
16.8	Cl	C=CCMe ₃
16.9	F	C=CCMe ₃
16.10	H	CH=CClCF ₃
16.11	Cl	CH=CClCF ₃
16.12	F	CH=CClCF ₃

Сполуки, пропонувані в даному винаході, можна одержати за наведеними нижче схемами реакцій, на яких, якщо не зазначено інше, визначення кожної змінної є таким, як визначено вище для сполуки формули (I).

Є ряд альтернативних методик одержання сполуки формули (I).

Методика А

Сполуку формули (I) можна одержати шляхом реакції сполуки формули (II) зі сполукою формули Het-C(=O)OR' [у якій R' означає $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкіл] у присутності сильної основи [наприклад, NaN або гексаметилдисилазану натрію], у сухому полярному розчиннику [краще - ТГФ (тетрагідрофуран)] та при температурі від -10°C і до температури кипіння розчинника [краще - при температурі навколишнього середовища]. Аналогічні методики докладно [описані в роботі J.Wang et al, Synlett 2001, 1485].

Методика В

Сполуку формули (I) можна одержати шляхом реакції сполуки формули (II) зі сполукою формули Het-C(=O)R'' [у якій R'' означає OH або групу, що відщеплюється, таку як Cl , Br , F або $\text{OC(=O)C}_1\text{-C}_4$ алкіл] в інертному органічному розчиннику [такому як етилацетат, дихлорметан, діоксан або ДМФ (диметилформамід)] та при температурі від -10°C і до температури кипіння розчинника [краще - при температурі навколишнього середовища]. Якщо R'' означає OH , то реакцію проводять у присутності активуючого реагенту [наприклад, хлорангідриду біс(2-оксо-3-оксазолідиніл)фосфонові кислоти] та 2 еквівалентів основи [такої як третинний амін, неорганічний карбонат або гідрокарбонат]. Альтернативно, якщо R'' означає групу, що відщеплюється, то реакцію проводять у присутності не менше ніж 1 еквівалента основи [такої як піридин, третинний амін, неорганічний карбонат або гідрокарбонат].

Методика С

Сполуку формули (I) [у якій R^1 є таким, як визначено вище, але не означає водень] можна одержати шляхом реакції сполуки формули (I) [у якій R^1 означає водень] зі сполукою формули R^1L^1 [у якій R^1 є таким, як визначено вище, але не означає водень; та L^1 означає групу, що відщеплюється, таку як Cl , Br , I , сульфат (наприклад, мезилат або тозилат) або $\text{OC(O)C}_1\text{-C}_4$ алкіл] у розчиннику [такому як галогенований розчинник (наприклад, дихлорметан), простий ефір, етилацетат, ДМФ або навіть вода (у вигляді двофазної суміші, необов'язково в присутності каталізатора міжфазового переносу, такого як тетрабутиламонійгідросульфат)] та у присутності основи [такої як третинний амін, карбонат лужного металу, гідрокарбонат лужного металу, гідроксид лужного металу або NaN ; хоча якщо L^1 означає $\text{O(CO)C}_1\text{-C}_4$ алкіл, то можливе просте нагрівання без використання основи].

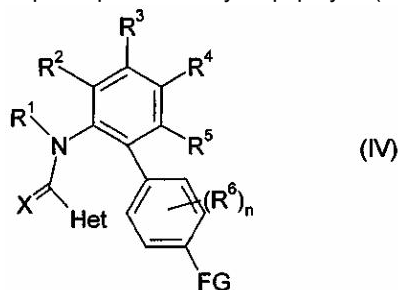
Методика D

Сполуку формули (I) можна одержати шляхом реакції сполуки формули (III) [у якій Hal краще означає бром або йод] зі сполукою формули Het-C(=O)NH_2 у присутності сполуки Cu(I) та апротонного розчинника [такого як циклічний простий ефір, наприклад, діоксан] при підвищеній температурі та краще - при кип'ятінні зі зворотним холодильником. Кращими умовами є застосування CuI при концентрації від 2 до 100мол./мол.% у перерахунку на сполуку формули (III), у присутності 1,2-діаміну, як лігандоутворюючої речовини (такої як 1,2-діаміноциклогексан або етилендіамін), та не мен-

ше ніж 1 еквівалента основи (такої як карбонат лужного металу або фосфат лужного металу). Аналогічні методики докладно [описані в роботі A.Klapars et al. J.Am.Chem.Soc. 123, 7727 (2001)].

Методика Е

Сполуку формули (I) можна одержати шляхом перетворення сполуки формули (IV)



[у якій FG означає функціональну групу, що може перетворюватися в R^7 за одну або більшу кількість стадій синтезу]. Перетворення функціональних груп є стандартними методиками для спеціаліста в даній галузі техніки. Є багато методик, описаних у літературі, які можна використовувати як такі або зі змінами відповідно до функціональних груп, що містяться; в таблиці А наведені посилання на літературу (у деяких з них наведені додаткові необхідні посилання), які стосуються саме одержання сполуки формули (I) шляхом перетворення FG в R^7 . Для спеціаліста в даній галузі техніки очевидно, що взяті з літератури приклади, наведені в таблиці А, необов'язково обмежуються одержанням конкретних зазначених R^7 , а також можуть застосовуватися за аналогією для одержання інших структурно подібних R^7 .

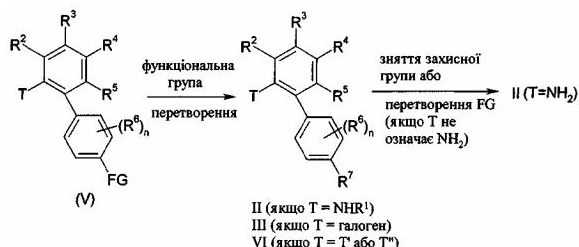
Таблиця А

Література	FG	R^7
Synthesis 2001, 2081 Tetrahedron 58, 1491 (2002)	CHO	$\text{CH}=\text{CBr}_2$ $\text{CH}=\text{CHBr}$ $\text{C}=\text{CBr}$
Russ.Chem. Bull. 50 (6), 1047 (2001) Tetrahedron 57, 7519 (2001)	CHO	$\text{CH}=\text{CCl}_2$ $\text{CH}=\text{CClCF}_3$ $\text{CH}=\text{CF}_2\text{CF}_2\text{Cl}$
Bull.Chem.Soc.Jpn. 73, 1691 (2000) Bull.Chem.Soc.Jpn. 71, 2903 (1998-)	CHO	$\text{CF}=\text{CBrF}$
J. Chem.Soc.Perkin 1 2002, 883	COCH_3	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CHBr}$ $\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CCl}_2$
J.Fluorine Chem. 1, 381 (1972) J.Fluorine Chem. 23, 339 (1983)	COCH_3 COCF_3	$\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CBr}_2$ $\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CFBr}$ $\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CFCl}$ $\text{C}(\text{CF}_3)=\text{CFBr}$ $\text{C}(\text{CF}_3)=\text{CFCl}$ $\text{C}(\text{CF}_3)=\text{CF}_2$
Tetrahedron Letters 41, 8045 (2000) J.Org.Chem. 62, 9217 (1997)	Hal	$\text{CF}=\text{CHF}$
Tetrahedron Letters 37,8799 (1996)	Hal	$\text{CH}=\text{CF}_2$
JP 09278688 J.Fluorine Chem. 31, 115 (1986)	Hal	$\text{CF}=\text{CF}_2$
Zh.Org.Khim. 25, 1451 (1989)	Hal	$\text{CF}=\text{CFCl}$
J.Org.Chem. 53, 2714 (1988)	Hal	$\text{CF}=\text{CFCF}_3$
J.Org.Chem. 56, 7336 (1991)	Hal	$\text{C}(\text{CF}_3)=\text{CH}_2$
Tetrahedron Letters 42, 4083 (2001)		
Ukr.Khim.Zh. 32, 996 (1966)	$\text{CHBrCH}_2\text{CF}_3$	$\text{CH}=\text{CHCF}_3$
Bull. Chem.Soc.Jap. 62,1352	$\text{CH}=\text{CClCF}_3$ $\text{CH}=\text{CFCF}_2\text{Cl}$	$\text{C}=\text{CCF}_3$ $\text{C}=\text{CCF}_2\text{Cl}$
J.Org.Chem. 54, 5856 (1989) J.Am.Chem.Soc. 109,2138 (1987)	Hal або трифлат	$\text{C}=\text{CH}$

Література	FG	R ⁷
Tetrahedron 45,6511 (1989) J.Orgmet.Chem.549,127 (1997) Tetrahedron 56, 10075 (2000) Tetrahedron Asymmetry 6, 245 (1995)		C=CSiMe ₃ C=CCH ₃ C=CCMe ₃ C=CCH ₂ OH C=CCHMeOH C=CCMe ₂ OH C=CCHO C=CC(O)Me
J.Org.Chem. 32, 1674 (1967)	C=CCH ₃	CH ₂ C=CH
Synth.Comm. 1989,561	CHO CH ₂ CHO	C=CH CH ₂ C=CH
WO 01 092563	CHO	CH=CH ₂
J.Am.Chem.Soc. 123,4155 (2001) Org.Lett. 2,3703 (2000) J.Org.Chem. 57,3558 (1992) Synthesis 2001,893	Hal або трифлат	CH=CH ₂
GB 2 183 639	C=CH	CH=CH ₂
Synthesis 1996, 1494 J.Org.Chem.49, 294 (1984)	CHO	C=CCl C=CH C=CBr
US 6 159956	CH ₂ Br	CH ₂ CF=CF ₂
Liebigs Ann.Chem. 1995, 2027	CH ₂ Br	CH=C(CF ₃) ₂
J.Am.Chem.Soc. 123,4155 (2001)	CH ₂ Br	CH ₂ C=CSiMe ₃
Inorg.Chim.Acta 296, 37 (1999)	Hal	CH ₂ C=CMe ₂
J.Fluorine.Chem.111, 185 (2001) J.Chem.Soc. Perkin I 1988, 921	CH=CHBr CH=CFBr CH=CBF ₂	CH=CHCF ₃ CH=CFCF ₃ CH=C(CF ₃) ₂
DE 4417441 US3976691 J. Org. Chem. 64, 7048 (1999)	C=CCH ₂ OH C=CCHMeOH C=CCMe ₂ OH C=CCHO C=CC(O)Me	C=CCH ₂ F C=CCHMeF C=CCMe ₂ F C=CCHF ₂ C=CCF ₂ Me
J.Chem.Soc. Perkin I 1994, 725	C=CCH ₂ OH	C=CCH ₂ CF ₃
Synthesis 1997, 1489 Angew.Chem.Int.Ed. 39, 2481 (2000) J.Org.Chem. 47, 2255 (1982) J.Fluorine.Chem.113, 55 (2002)	C=CH	C=CCF ₂ CF ₃ CH=CHCF ₂ CF ₃
J.Fluorine.Chem.64, 61 (1993) J.Am.Chem.Soc. 109, 3492 (1987) J.Am.Chem.Soc. 107, 5186 (1985)	C=CH CH=CHBr	C=CCHFCI C=CCF ₂ Br CH=CHCF ₂ CF ₃

Існує ряд альтернативних методик одержання сполуки формули (II), (III) або (IV).

Методика F - одержання сполуки формули (II) або (III).



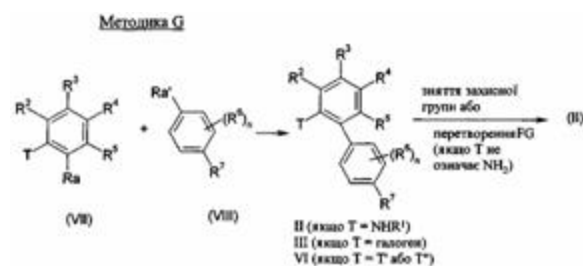
Сполуку формули (II), (III) або (VI) можна одержати шляхом перетворення функціональних груп з сполуки формули (V) [у якій FG є таким, як визначено вище для сполуки формули (IV) та T означає галоген, аміногрупу, NHR¹, захищену аміногрупу T' (наприклад, карбамат, амід, циклічний імід, N-алкіл-, N-алкеніл-, N-бензил-, N-дифенілметил- або N-третилпохідна, імінопохідна або N-силіл- або N-дисилілпохідна) або групу T'' (тобто групу, яку можна перетворити в NH₂ або NHR¹ за методиками синтезу, описаним у літературі; T'' краще означає азидну групу, нітрогрупу, галоген, трифлат, CONH₂, COOH, COCl або NCO)]. Виходячи з сполуки формули (V) функціональну групу FG можна перетворити в R⁷ за методикою, що аналогічна наведеній вище методиці E. Це перетворення приводить безпосередньо до сполуки формули (II) [якщо T означає NHR¹], до сполуки формули (III) [якщо T означає галоген (краще -

хлор, бром або йод)] або до сполуки формули (VI) [якщо T означає T' або T''].

На другій стадії сполуку формули (VI) або (II) [якщо R¹ не означає H] можна перетворити на сполуку формули (II) [у якій R¹ означає H] за будь-якими методиками [тобто видалення захисної групи або перетворення T'' в NH₂], у цілому описаними вище.

Приклади різних значень T' і методики видалення захисних груп наведені [в роботі T.W.Green and P.Wuts, Protective Groups in Organic Synthesis, 3rd edition (John Wiley & Sons 1999), Chapter 7].

Зведення корисних значень T'' та література з перетворення T'' в NH₂, T' або NHR¹ наведена в роботі M.B. Smith, Compendium of Organic Synthetic Methods, Vols. 1-10, Chapter 7 (Wiley, Vol.10: 2002).



Сполуку формули (II), (III) або (VI) можна одержати за реакцією сполучення сполуки формули (VI) зі сполукою формули (VII) [у якій Ra та Ra' незалежно означають галоген (краще - Cl, Br або I), трифлат або металовмісну функціональну групу, що включає як метал, наприклад, B, Sn, Mg, Zn або Cu; прикладами є B(OH)₂, складні ефіри боронової кислоти (краще - складні ефіри, одержані з 1,2 або 1,3-діолів), триалкілолово (краще - Sn(CH₃)₃ або Sn(nBu)₃), галогенідна сіль Mg, галогенідна сіль Zn або Cu. Якщо Ra або Ra' означає металовмісну функціональну групу, то іншими замісниками повинні бути галоген або трифлат].

Такі реакції сполучення широко описані в літературі. Особливо придатними є реакції сполучення, які каталізуються за допомогою Pd(O), Ni(O) або міді, які спеціалісту в даній галузі техніки відомі під назвами сполучення Стілле, сполучення Судзуки, сполучення Негіши або реакція Ульмана. Докладний огляд цих реакцій наведений [у роботі Metal-Catalysed Cross-Coupling Reactions; F.Diederich and P.Stang (eds.); Wiley-VCH; Weinheim 1998].

На другій стадії сполуку формули (VI) або (II) [якщо R¹ не означає H] можна перетворити на сполуку формули (II) [у якій R¹ означає H] за будь-якими методиками [тобто видалення захисної групи або перетворення T'' в NH₂], у цілому описаними вище.

Відповідно до винаходу несподівано було виявлено, що нові сполуки формули (I) із практичної точки зору мають дуже привабливий спектр активності для захисту рослин від хвороб, які викликаються грибами, а також бактеріями та вірусами.

Сполуки формули (I) можна використовувати в сільському господарстві й інших галузях застосування активних інгредієнтів для боротьби зі шкідниками рослин. Нові сполуки відрізняються чудо-

вою активністю при низьких нормах внесення, добре переносяться рослинами та є екологічно безпечними. Вони мають дуже корисні лікувальні, попереджувальні та системні характеристики і застосовуються для захисту численних культурних рослин. Сполуки формули I можна використовувати для пригнічення або знищення шкідників, що знаходяться на рослинах або частинах рослин (плодах, квітках, листах, стеблах, бульбах, коріннях) різних культур корисних рослин та одночасно для захисту також і тих частин рослин, які виростають пізніше, наприклад, від фітопатогенних мікроорганізмів.

Сполуки формули (I) також можна використовувати як агенти для протруювання посівного матеріалу, зокрема, для насіння (плодів, бульб, зерна) і саджанців рослин (наприклад, рису), для захисту від грибкових інфекцій, а також фітопатогенних грибів, що знаходяться в ґрунті.

Крім того, сполуки, пропоновані в даному винаході, можна використовувати для боротьби із грибами в суміжних галузях, наприклад, для захисту технічних матеріалів, включаючи деревину та виготовлені з використанням деревини технічні продукти, при зберіганні харчових продуктів, при гігієнічних заходах.

Сполуки формули (I), зокрема, ефективні проти фітопатогенних грибів наступних класів: *Fungi imperfecti* (наприклад, *Botrytis*, *Pyricularia*, *Helminthosporium*, *Fusarium*, *Septoria*, *Cercospora* та *Alternaria*) і *Basidiomycetes* (наприклад, *Rhizoctonia*, *Hemileia*, *Puccinia*). Крім того, вони ефективні проти класів *Ascomycetes* (наприклад, *Venturia* та *Erysiphe*, *Podosphaera*, *Monilinia*, *Uncinula*) і класів *Oomycetes* (наприклад, *Phytophthora*, *Pythium*, *Plasmopara*). Виявлено чудову активність відносно справжньої борошнистої роси (*Erysiphe* spp.) та іржі (*Puccinia* spp.). Крім того, нові сполуки формули I ефективні проти фітопатогенних бактерій та вірусів (наприклад, проти *Xanthomonas* spp, *Pseudomonas* spp, *Erwinia amylovora*, а також проти вірусу тютюнової мозаїки).

Відповідно до обсягу даного винаходу цільові культури, що підлягають захисту, звичайно включають наступні види рослин: злаки (пшениця, ячмінь, жито, овес, рис, кукурудза, сорго та споріднені види); буряк (цукровий буряк і кормовий буряк); яблука, кісточкові та ягоди (яблука, груші, сливи, персики, мигдаль, вишні, суниця, малина та чорна смородина); бобові рослини (боби, сочевиця, горох, соя); олійні рослини (рапс, гірчиця, мак, оливи, соняшник, кокос, рицина, какао-боби, земляний горіх); огіркові рослини (гарбуз, огірки, дині); волокнисті рослини (бавовна, льон, коноплі, джут); цитрусові фрукти (апельсини, лимони, грейпфрути, мандарини); овочі (шпинат, латук, спаржа, капуста, морква, цибуля, томати, картопля, червоний перець); лаврові (авокадо, кориця, камфора) і такі рослини, як тютюн, горіхи, кава, баклажани, цукровий очерет, чай, перець, виноград, хміль, банани та натуральні каучуконосні рослини, а також декоративні рослини.

Сполуки формули (I) застосовуються в незміненному вигляді або, краще, спільно з допоміжними

речовинами, що звичайно застосовуються при складанні рецептур. Для цього їх звичайно приготують відомим чином у вигляді емульгуювальних концентратів, паст для нанесення, розчинів, що розприскуються безпосередньо або розчинів, що розбавляють, розбавлених емульсій, змочувальних порошків, розчинних порошків, дуетів, гранулатів, а також форм, які капсульовані, наприклад, у полімерних речовинах. Як і тип композиції, способи внесення, такі як обприскування, атомізація, опилання, розкидання, нанесення шару або полив, вибираються відповідно до призначення та переважаних обставин. Композиції також можуть містити інші допоміжні речовини, такі як стабілізатори, протиспінювальні речовини, регулятори в'язкості, зв'язувальні речовини або речовини, що надають липкість, а також добрива, джерела живильних мікроелементів або інші рецептури, призначені для забезпечення спеціальних ефектів.

Придатні носії та допоміжні речовини можуть бути твердими або рідкими та є речовинами, що застосовуються в технології приготування рецептур, наприклад, натуральні або регенеровані мінеральні речовини, розчинники, диспергуючі речовини, змочувальні агенти, речовини, що надають липкість, загусники, зв'язувальні речовини або добрива. Такі носії описані, [наприклад, в WO 97/33890].

Сполуки формули (I) звичайно застосовуються у вигляді композицій і можуть вноситися на ділянку вирощування або рослину, яка підлягає обробці, одночасно або послідовно з додатковими сполуками. Цими додатковими сполуками можуть бути, наприклад, добрива або джерела живильних мікроелементів або інші препарати, які впливають на ріст рослин. Вони також можуть являти собою селективні гербіциди, а також інсектициди, фунгіциди, бактерициди, нематодици, молюскоциди або суміші декількох із цих препаратів, якщо необхідно, то разом з додатковими носіями, поверхнево-активними речовинами або допоміжні речовини, що сприяють внесенню, які звичайно застосовуються при складанні рецептур.

Сполуки формули (I) можна змішувати з іншими фунгіцидами, що в деяких випадках приводить до несподіваних синергетичних підвищень активності. Особливо кращими компонентами, що додають у суміші, є азоли, такі як азаконазол, BAY 14120, бітертанол, бромконазол, ципроконазол, дифеноконазол, диніконазол, епоксиконазол, фенбуконазол, флуквіконазол, флусилазол, флутриавол, гексаконазол, імазаліл, імібенконазол, іпконазол, метконазол, міклобутаніл, перфурозол, пенконазол, пірифенокс, прохлорах, пропіконазол, симеконазол, тебуконазол, тетраконазол, триадимефон, триадименол, трифлумізол, тритіконазол; піримідилкарбінол, такий як анцімідол, фенаримол, нуаримол; 2-амінопіримідини, такі як біпіримат, диметиримол, етиримол; морфоліни, такі як додеморф, ферпропідин, фенпропіморф, спіроксамін, тридеморф; анілінопіримідини, такі як ципродиніл, мепаніпірим, піриметаніл; піроли, такі як фенпіклоніл, флудіоксоніл; феніламід, такі як беналаксил, фуралаксил, металаксил, R-металаксил, офурац, оксидиксил; бензімідазоли,

такі як беноміл, карбендазим, дебакарб, фуберидазол, тіабендазол; дикарбоксиміди, такі як хлоролінат, дихлозолін, іпродіон, міклозолін, процімідон, вінклозолін; карбоксаміди, такі як карбоксин, фенфурам, флутоланил, мепроніл, оксикарбоксин, трифлузамід; гуанідини, такі як гуазатин, додин, іміноктадин; стробілурини, такі як азоксистробін, крезоксим-метил, метоміностробін, SSF-129, трифлуксистробін, пікоксистробін, BAS 500F (запропонована назва піраклостробін), BAS 520; дитіокарбамати, такі як фербам, манкозєб, манєб, метирам, пропінеб, тирам, зинеб, зирам; N-галогенметилтіотетрагідрофталіміди, такі як каптафол, каптан, дихлофлуанід, флуороміди, фоплет, толіфлуанід; сполуки Cu, такі як бордоська рідина, гідроксид міді(II), оксихлорид міді(II), сульфід міді(II), оксид міді(I), манкопер, оксин-коппер; похідні нітрофенолу, такі як динокап, нітроталізопропіл; фосфорорганічні похідні, такі як едифенфос, іпробенфос, ізопропіолан, фосдифен, піразофос, токлофос-метил; різноманітні інші сполуки, такі як ацибензолар-S-метил, анілазин, бентіавалікарб, бластицидин-S, хінометонат, хлоронеб, хлороталоніл, цифлуфенамід, цимоксаніл, дихлон, дикломезин, диклоран, діетофенкарб, диметоморф, SYP-LI90 (пропонована назва: флуморф), дитіанон, етабоксам, етридіазол, фамоксадон, фенамідон, феноксаніл, фентин, ферімзон, флуазинам, флусульфамід, фенгексамід, фозетилалюміній, гімексазол, іпровалікарб, IKF-916 (ціазофамід), касугаміцин, метасульфоккарб, метрафенон, нікобівен, пенцикурон, фталід, полікосини, пробеназол, пропамокарб, піроквілон, квінксіфен, квінтозен, сірка, тριαзоксид, трициклазол, трифорин, валідаміцин, зоксамід (RH7281).

Кращим способом внесення сполуки формули (I) або агрохімічної композицій, що містить не менше однієї із зазначених сполук, є позакореневе внесення. Частота внесення та доза, яка вноситься, будуть залежати від ризику зараження відповідним патогеном. Однак сполуки формули I також можуть проникати в рослину через корінь із ґрунту (системний вплив) при дощуванні місця вирощання рослин рідкою рецептурою або при внесенні сполук у ґрунт у твердому вигляді, наприклад, у гранульованому вигляді (внесення в ґрунт). Під культури затоплюваного рису такі грануляти можна вносити на залите рисове поле. Сполуки формули I також можна наносити на насіння (у вигляді покриття) шляхом просочування насіння або бульб рідкою рецептурою фунгіциду або нанесення на них твердої рецептури.

Рецептуру [тобто композицію, що містить сполуку формули (I)] і при необхідності тверду або рідку допоміжну речовину одержують відомим чином, звичайно безпосереднім змішуванням і/або розмелом сполуки з наповнювачами, наприклад, розчинниками, твердими носіями та, необов'язково, поверхнево-активними сполуками (поверхнево-активними речовинами).

Агрохімічні рецептури звичайно будуть містити від 0,1 до 99мас.%, краще - від 0,1 до 95мас.% сполуки формули I; від 99,9 до 1мас.%, краще - від 99,8 до 5мас.% твердої або рідкої допоміжної ре-

човини та від 0 до 25мас.%, краще - від 0,1 до 25мас.% поверхнево-активної речовини.

Кращі норми витрати звичайно становлять від 5 г до 2кг активного інгредієнту (AI) на гектар (га), краще - від 10г до 1кг AI/га, найбільш краще - від 20г до 600г AI/га. При використанні як агент для змочування насіння придатні дози становлять від 10мг до 1г активної речовини на 1кг насіння.

У той час як комерційні продукти краще готувати у вигляді концентратів, кінцевий користувач звичайно буде використовувати розведені рецептури.

Наведені нижче необмежуючі приклади більш докладно ілюструють даний винахід.

Приклад 1

У цьому прикладі описане одержання сполуки №1.01.

2-аміно-4'-етинілбіфеніл (0,30г) та 1-метил-3-трифторметил-4-хлоркарбонілпіразол (0,33г) поєднували в ТГФ при охолодженні льодом і потім додавали піридин (0,12мл). Після нагрівання до температури навколишнього середовища суспензію перемішували впродовж 3,5 год., виливали у воду та двічі екстрагували етилацетатом. Відділення органічної фази, сушіння над сульфатом натрію та випарювання розчинника й очищення за допомогою хроматографії на силікагелі (розчинник:гексан:етилацетат 2:1) приводило до 0,4г (70,2%) сполуки №1.01.

Приклад 2

У цьому прикладі описано одержання сполуки №2.01.

До 1-метил-3-трифторметил-4-піролкарбонової кислоти (0,22г), розчиненої в 10мл дихлорметану, додавали триетиламін (0,32мл) і 2-аміно-4'-триметилсилілетинілбіфеніл (0,3г) та наприкінці при охолодженні льодом - біс(2-оксо-3-оксазолідиніл)хлорфосфінову кислоту (0,29г). Після перемішування впродовж 18год. розчинники видаляли при зниженому тиску та залишок розчиняли в етилацетаті. Промивання водою та розсолон, сушіння над сульфатом натрію та випарювання розчинника приводило до 0,45г жовтого масла, що хроматографували на силікагелі (елюент:гексан:етилацетат 2:1) та одержували 0,13г (26%) сполуки №2.01.

Приклад 3

У цьому прикладі описане одержання сполуки №1.72.

До NaN (46мг) в 5мл сухого ТГФ при 0 - 5°C додавали 2-N-форміламіно-4'-(пропін-1-іл)-біфеніл (0,3г) в 10мл сухого ТГФ. Реакційну суміш витримували при цій температурі впродовж 1год. і потім додавали 1-метил-3-трифторметил-4-хлоркарбонілпіразол (0,372г). Одержану суспензію перемішували при кімнатній температурі впродовж ночі, виливали в розсіл та екстрагували етилацетатом. Розчинник випарювали та залишок розчиняли в метанолі та додавали метилат натрію (10мг). Через 30хв. суміш нейтралізували розведеною HCl, екстрагували етилацетатом і промивали до нейтральної реакції. Очищення за допомогою хроматографії на силікагелі (елюент:етилацетат:гексан 1:2) і перекристалізація

із суміші толуол:гексан (4:1) приводило до 0,169г сполуки №1.72.

Приклад 4

У цьому прикладі описано одержання 2-аміно-4'-(триметилсиліл)етинілбіфенілу (сполука №12.02) і 2-аміно-4'-етинілбіфенілу (сполука №12.01) за методикою, що відповідає наведеній вище методиці F.

До 2,5г 2-аміно-4'-бромбіфенілу [WO 0264562] в піперидині (25мл) в атмосфері азоту послідовно додавали CuI (0,1г), біс(трифенілфосфіно)паладійдихлорид (0,35г) та триметилсилілацетилен (2,8мл). Суміш перемішували впродовж 22год. при кімнатній температурі та впродовж ще 26год. при 60°C. Після охолодження реакційну суміш розбавляли водою та екстрагували етилацетатом. Потім органічну фазу промивали водою і сушили над сульфатом натрію. Після випарювання розчинників у вакуумі суміш хроматографували на силікагелі (гексан:етилацетат 9:1) і одержували 2-аміно-4'-(триметилсиліл)етинілбіфеніл (2г) (сполука №12.02).

1,4г Цієї сполуки розчиняли в метанолі (40мл) і при охолодженні додавали карбонат калію (0,9г). Одержану суспензію перемішували впродовж 2год., виливали у воду з льодом та осад, що утворився, відфільтровували, ретельно промивали водою та сушили й одержували 2-аміно-4'-етинілбіфеніл (0,9г) (сполука №12.01) у вигляді світло-жовтувато-коричневих кристалів.

Приклад 5

У цьому прикладі описано одержання 2-N-форміламіно-4'-(пропін-1-іл)-біфенілу (сполука №12.16)

N-форміламіно-4'-бромбіфеніл (3,5г) (J.Chem.Soc. 1957, 4), трибутилолово(пропін-1-іл) (5г) (виробництва фірми Aldrich), тетракіс(трифенілфосфін)паладій (0,37г) поєднували в толуолі (200мл) в атмосфері азоту та кип'ятили зі зворотним холодильником впродовж 16 год. Одержану темну суміш розбавляли водою та екстрагували етилацетатом. Органічну фазу промивали водою, сушили над сульфатом натрію і розчинники випарювали при зниженому тиску. Залишок розчиняли в ацетонітрилі та кілька разів промивали гексаном. Після видалення ацетонітрилу при зниженому тиску та хроматографуванні залишку на силікагелі (елюент: гексан:етилацетат 2:1) одержували 2-N-форміламіно-4'-(пропін-1-іл)-біфеніл (сполука №12.16) (1,57г) у вигляді світло-жовтого порошку.

Приклад 6

У цьому прикладі описано одержання 2-аміно-4'-(2,2-дихлор)етиленбіфенілу (сполука №12.07) та 2-аміно-4'-(хлоретиніл)-біфенілу (сполука №12.04).

а) Одержання 2-нітро-4'-(2,2-дихлор)етиленбіфенілу.

До 2-нітро-4'-формілбіфенілу (2г) [WO 95 03290] (одержаного за допомогою сполучення 2-бромнітробензолу з 4-формілфенілбороновою кислотою, що каталізується Pd) в етанолі (70мл) додавали гідразингідрат (95%) (1,32г) і потім одержану суміш кип'ятили зі зворотним холодильником впродовж 5год. Розчинник випарювали досуха

при зниженому тиску, залишок суспендували в ДМСО (30мл) і потім при охолодженні водою по краплях послідовно додавали аміак (25%) (3мл) та свіжоприготовлений CuCl (80мг), а наприкінці - тетрахлорметан (3,8г). Суміш перемішували при кімнатній температурі впродовж 24год. та одержану зелену суспензію виливали у воду, екстрагували дихлорметаном, промивали водою і сушили над сульфатом натрію. Випарювання розчинника та хроматографування залишку на силікагелі (елюент:гексан:етилацетат 4:1) приводило до 2-нітро-4'-(2,2-дихлор)етиленбіфенілу (0,8г), т. пл. 58 – 59°C.

б) Одержання 2-аміно-4'-(2,2-дихлор)етиленбіфенілу.

2-нітро-4'-(2,2-дихлор)етиленбіфеніл (0,76г), одержаний на стадії (а), розчиняли в 50% етанолі (30мл) та кип'ятили зі зворотним холодильником. Потім по краплях додавали 2н. HCl (0,3мл) в 50% етанолі (10мл). Реакційну суміш кип'ятили зі зворотним холодильником впродовж 4 год., охолоджували до кімнатної температури та фільтрували. Фільтрат нейтралізували бікарбонатом натрію, двічі екстрагували етилацетатом і органічну фазу сушили над сульфатом натрію. Випарювання розчинника при зниженому тиску давало 2-аміно-4'-(2,2-дихлор)етиленбіфеніл (0,62г) (сполука №12.07).

2-аміно-4'-(2,2-дихлор)етиленбіфеніл (3г) розчиняли в 150мл диметилсульфоксиду, у якому суспендовано 0,9г КОН (85%, порошкоподібний). Суміш перемішували впродовж ночі при кімнатній температурі, розбавляли надлишком води та двічі екстрагували етилацетатом і органічну фазу сушили над сульфатом натрію. Випарювання розчинника при зниженому тиску та хроматографування залишку на силікагелі (елюент: гексан:етилацетат 4:1) приводило до 2,5г 2-аміно-4'-(2,2-дихлор)етиленбіфенілу у вигляді жовтувато-коричневої твердої речовини.

Приклад 7

У цьому прикладі описано одержання сполуки №12.18.

Стадія А: 2-нітро-(4'-триметилсиліл)-біфеніл 2-Бромнітробензол (0,86г), 4-(триметилсиліл)фенілборонову кислоту (1г) і біс(трифенілфосфін)-паладійдихлорид (0,3г) розчиняли в диметоксетані (35мл) і потім по краплях додавали розчин бікарбонату натрію (1,3г) у воді (5мл). Суміш нагрівали впродовж 3 год. (температура бані 80°C), охолоджували до кімнатної температури, виливали в суміш етилацетат:вода: 1:1 (300мл) і фільтрували відсмоктуванням. Органічну фазу відокремлювали, сушили над сульфатом натрію та розчинник видаляли. Одержаний залишок (1,58г темного масла) хроматографували на силікагелі (елюент: гексан:етилацетат: 4:1) та одержували жовте масло (1,12г). Цю сполуку використовували на стадії В.

Стадія В: 2-аміно-(4'-триметилсиліл)-біфеніл [сполука 12.18]

Сполуку, одержану вище на стадії А (0,955г) та форміат амонію (1,86г) розчиняли в метанолі (30мл) і продували азотом. До цього розчину 2 порціями додавали Pd (100мг; 10% на вугіллі).

Після перемішування при кімнатній температурі впродовж 15 год. реакційну суміш фільтрували та розчинник випаровували.

Приклади рецептур сполук формули (I)

Робочі процедури приготування рецептур сполук формули I, таких як емульгувальні концентрати, розчини, гранули, дуети та змочувальні порошки [описані в WO 97/33890].

Біологічні приклади: фунгіцидні впливи

Приклад В-1: Вплив на *Russinia recondita*/пшениця (бура іржа на пшениці)

Рослини пшениці сорту Arina 1-тижневого віку обробляють рецептурою досліджуваної сполуки (0,02% активного інгредієнта) у камері для обприскування. Через день після внесення рослини пшениці заражають шляхом обприскування досліджуваних рослин суспензією спор (1×10^5 уредоспор/мл). Після інкубаційного періоду тривалістю в 2 дні при 20°C і відносній вологості 95% рослини тримають у теплиці впродовж 8 днів при 20°C і відносній вологості 60%. Захворюваність оцінюється через 10 днів після зараження.

Зараження попереджується практично повністю (зараження 0 - 5%) у випадку застосування кожної із сполук 1.01, 1.03, 1.08, 1.10, 1.12, 1.13, 1.15, 1.16, 1.18, 1.19, 1.22, 1.24, 1.33, 1.56, 1.57, 1.60, 1.66, 1.67, 1.69, 1.70, 1.77, 1.78, 1.81, 1.106, 1.107, 1.138, 1.139, 1.151, 1.152, 1.154, 1.155, 1.182, 1.185, 1.251, 1.252, 2.01, 2.08, 2.66, 3.01, 3.08, 3.12, 3.18, 3.32, 3.56, 3.66, 3.69, 3.250, 9.01, 9.06, 9.15, 9.21, 9.41, 9.50, 9.53, 9.59, 15.25, 15.26 та 15.28.

Приклад В-2: Вплив на *Podosphaera leucotricha*/яблуня (борошниста роса на яблуні)

Саджанці яблуні сорту McIntosh 5-тижневого віку обробляють рецептурою досліджуваної сполуки (0,02% активного інгредієнта) у камері для обприскування. Через день після внесення рослини яблуні заражають шляхом струшування рослин, заражених борошнистою росою яблуні, над досліджуваними рослинами. Після інкубаційного періоду тривалістю в 12 днів при 22°C і відносній вологості 60% при світловому режимі 14/10 год. (освітлення/затемнення) оцінюється захворюваність.

Зараження попереджується практично повністю (зараження 0-5%) у випадку застосування кожної із сполук 1.01, 1.03, 1.08, 1.10, 1.12, 1.13, 1.15, 1.16, 1.18, 1.19, 1.24, 1.33, 1.35, 1.36, 1.56, 1.57, 1.66, 1.67, 1.70, 1.77, 1.78, 1.81, 1.106, 1.107, 1.139, 1.151, 1.152, 1.154, 1.155, 1.182, 1.185, 1.251, 1.252, 2.01, 2.08, 2.66, 3.01, 3.08, 3.12, 3.18, 3.32, 3.35, 3.56, 3.66, 3.69, 3.250, 9.01, 9.06, 9.15, 9.21, 9.41, 9.50, 9.53, 9.59, 9.62, 15.25, 15.26 та 15.28.

Приклад В-3: Вплив на *Venturia inaequalis*/яблуня (парша на яблуні)

Саджанці яблуні сорту McIntosh 4-тижневого віку обробляють рецептурою досліджуваної сполуки (0,02% активного інгредієнта) у камері для обприскування. Через день після внесення рослини яблуні заражають шляхом обприскування досліджуваних рослин суспензією спор (4×10^5 конідій/мл). Після інкубаційного періоду тривалістю в 4 дні при 21°C і відносній вологості 95% рослини поміщають у теплицю на 4 дні при 21°C і відносній

вологості 60%. Ще через 4 дні інкубаційного періоду при 21°C і відносній вологості 95% оцінюється захворюваність.

Зараження попереджується практично повністю (зараження 0 - 5%) у випадку застосування кожної із сполук 1.01, 1.03, 1.08, 1.10, 1.12, 1.13, 1.18, 1.19, 1.24, 1.33, 1.56, 1.57, 1.66, 1.67, 1.69, 1.70, 1.77, 1.78, 1.81, 1.106, 1.107, 1.138, 1.152, 1.154, 1.155, 1.251, 1.252, 2.01, 2.08, 2.66, 3.01, 3.08, 3.12, 3.18, 3.32, 3.56, 3.66, 3.69, 9.01, 9.06, 9.15, 9.21, 9.50 та 9.59.

Приклад В-4: Вплив на *Erysiphe graminis*/ячмінь (борошниста роса на ячмені)

Рослини ячменя сорту Regina 1-тижневого віку обробляють рецептурою досліджуваної сполуки (0,02% активного інгредієнта) у камері для обприскування. Через день після внесення рослини ячменя заражають шляхом струшування рослин, заражених борошнистою росою, над досліджуваними рослинами. Після інкубаційного періоду в теплиці тривалістю в 6 днів при 20°C/18°C (день/ніч) і відносній вологості 60% оцінюється захворюваність.

Зараження попереджується практично повністю (зараження 0 - 5%) у випадку застосування кожної із сполук 1.01, 1.03, 1.08, 1.10, 1.12, 1.13, 1.15, 1.16, 1.18, 1.19, 1.24, 1.33, 1.35, 1.36, 1.56, 1.57, 1.66, 1.67, 1.70, 1.77, 1.78, 1.106, 1.107, 1.152, 1.155, 1.251, 1.252, 2.01, 2.08, 2.66, 3.01, 3.08, 3.12, 3.18, 3.32, 3.35, 3.56, 3.66, 3.69, 3.250, 9.01, 9.06, 9.15, 9.21, 9.41, 9.50 та 9.59.

Приклад В-5: Вплив на *Botrytis cinerea*/виноград (*Botrytis* на винограді)

Саджанці винограду сорту Gutedel 5-тижневого віку обробляють рецептурою досліджуваної сполуки (0,02% активного інгредієнта) у камері для обприскування. Через 2 дні після внесення рослини винограду заражають шляхом обприскування досліджуваних рослин суспензією спор (1×10^6 конідій/мл). Після інкубаційного періоду в теплиці тривалістю в 4 дні при 21°C та відносній вологості 95% оцінюється захворюваність.

Зараження попереджується практично повністю (зараження 0-5%) у випадку застосування кожної із сполук 1.01, 1.03, 1.08 та 1.10.

Приклад В-6: Вплив на *Botrytis cinerea*/томати (*Botrytis* на томатах)

Рослини томатів сорту Roter Gnom 4-тижневого віку обробляють рецептурою досліджуваної сполуки (0,02% активного інгредієнта) у камері для обприскування. Через 2 дні після внесення рослини томатів заражають шляхом обприскування досліджуваних рослин суспензією спор (1×10^5 конідій/мл). Після інкубаційного періоду в камері штучного клімату тривалістю в 4 дні при 20°C та відносній вологості 95% оцінюється захворюваність.

Зараження попереджується практично повністю (зараження 0 - 5%) у випадку застосування кожної із сполук 1.01, 1.03, 1.08, 1.10, 1.12, 1.13, 1.15, 1.16, 1.18, 1.19, 1.24, 1.33, 1.36, 1.56, 1.57, 1.66, 1.67, 1.69, 1.70, 1.77, 1.78, 1.106, 1.107, 1.138, 1.139, 1.152, 1.155, 1.251, 1.252, 2.01, 2.66, 3.01, 3.08, 3.12, 3.66, 3.69, 3.250, 9.06, 9.15, 9.21, 9.41, 9.50 та 9.59.

Приклад В-7: Вплив на *Septoria nodorum*/пшениця (септоріозна плямистість на пшениці)

Рослини пшениці сорту Arina 1-тижневого віку обробляють рецептурою досліджуваної сполуки (0,02% активного інгредієнта) у камері для обприскування. Через день після внесення рослини пшениці заражають шляхом обприскування досліджуваних рослин суспензією спор (5×10^5 конідій/мл). Після інкубаційного періоду тривалістю в 1 день при 20°C і відносній вологості 95% рослини тримають у теплиці впродовж 10 днів при 20°C і відносній вологості 60%. Захворюваність оцінюється через 11 днів після зараження.

Зараження попереджується практично повністю (зараження 0-5%) у випадку застосування кожної із сполук 1.01, 1.03, 1.08 та 1.10.

Приклад В-8: Вплив на *Helminthosporium teres*/ячмінь (сітчаста плямистість на ячмені)

Рослини ячменя сорту Regina 1-тижневого віку обробляють рецептурою досліджуваної сполуки (0,02% активного інгредієнта) у камері для обприскування. Через 2 дні після внесення рослини ячменя заражають шляхом обприскування досліджуваних рослин суспензією спор (3×10^4 конідій/мл). Після інкубаційного періоду в теплиці тривалістю в 4 дні при 20°C і відносній вологості 95% оцінюється захворюваність.

Зараження попереджується практично повністю (зараження 0 - 5%) у випадку застосування кожної із сполук 1.01, 1.03, 1.08, 1.10, 1.12, 1.13, 1.15, 1.16, 1.18, 1.19, 1.22, 1.24, 1.33, 1.36, 1.35, 1.56, 1.57, 1.60, 1.66, 1.67, 1.69, 1.70, 1.77, 1.78, 1.81, 1.106, 1.107, 1.138, 1.139, 1.151, 1.152, 1.154, 1.155, 1.182, 1.185, 1.251, 1.252, 2.01, 2.08, 2.66, 3.01, 3.08, 3.12, 3.18, 3.32, 3.35, 3.56, 3.66, 3.69, 9.01, 9.06, 9.15, 9.21, 9.41, 9.50, 9.53, 9.59, 9.62, 15.25, 15.26 та 15.28.

Приклад В-9: Вплив на *Alternaria solani*/томати (рання гниль на помідорах)

Рослини томатів сорту Roter Gnom 4-тижневого віку обробляють рецептурою досліджуваної сполуки (0,02% активного інгредієнта) у камері для обприскування. Через 2 дні після внесення рослини томатів заражають шляхом обприскування досліджуваних рослин суспензією спор (2×10^5 конідій/мл). Після інкубаційного періоду в камері штучного клімату тривалістю в 3 дні при 20°C та відносній вологості 95% оцінюється захворюваність.

Зараження попереджується практично повністю (зараження 0 - 5%) у випадку застосування кожної із сполук 1.01, 1.03, 1.08, 1.10, 1.13, 1.15, 1.16, 1.19, 1.22, 1.24, 1.33, 1.35, 1.36, 1.56, 1.57, 1.67, 1.69, 1.70, 1.77, 1.78, 1.81, 1.107, 1.151, 1.152, 1.154, 1.155, 1.182, 1.185, 1.251, 1.252, 2.01, 3.01, 3.08, 3.12, 3.32, 3.35, 3.56, 3.69, 9.01, 9.06, 9.15, 9.41, 9.50, 9.62 та 15.26.

Приклад В-10: Вплив на *Uncinula necator*/виноград (борошниста роса на винограді)

Саджанці винограду сорту Gutedel 5-тижневого віку обробляють рецептурою досліджуваної сполуки (0,02% активного інгредієнта) у камері для обприскування. Через день після внесення рослини винограду заражають шляхом струшування рослин, заражених борошнистою россою винограду, над досліджуваними рослинами. Після інкубаційного періоду тривалістю в 7 днів при 26°C і відносній вологості 60% при світловому режимі 14/10 год. (освітлення/затемнення) оцінюється захворюваність.

Зараження попереджується практично повністю (зараження 0-5%) у випадку застосування кожної із сполук 1.01, 1.03, 1.08, 1.10, 1.12, 1.13, 1.18, 1.19, 1.24, 1.33, 1.56, 1.57, 1.60, 1.66, 1.67, 1.70, 1.77, 1.78, 1.81, 1.106, 1.107, 1.138, 1.139, 1.151, 1.152, 1.154, 1.155, 1.182, 1.185, 1.251, 1.252, 2.01, 2.08, 2.66, 3.01, 3.08, 3.12, 3.32, 3.56, 3.66, 3.69, 3.250, 9.01, 9.06, 9.15, 9.41, 9.50, 9.53 та 9.59.

Приклад В-11: Вплив на *Septoria tritici*/пшениця (септоріозна плямистість на пшениці)

Рослини пшениці сорту Riband 2-тижневого віку обробляють рецептурою досліджуваної сполуки (0,2% активного інгредієнта) у камері для обприскування. Через день після внесення рослини пшениці заражають шляхом обприскування досліджуваних рослин суспензією спор (10×10^5 конідій/мл). Після інкубаційного періоду тривалістю в 1 день при 23°C 95% і відносній вологості 95% рослини тримають у теплиці впродовж 16 днів при 23°C та відносній вологості 60%. Захворюваність оцінюється через 18 днів після зараження.

Всі сполуки 1.10, 1.03, 1.09, 1.70, 1.69, 3.01, 1.67, 1.66, 3.66, 9.59, 3.69, 1.33, 2.66, 9.06, 3.08, 1.77, 1.78, 1.56, 1.57, 1.138, 1.139, 1.12, 1.18, 1.106, 1.107, 9.53, 3.32, 1.151, 1.152, 1.252, 1.155, 9.41, 3.56, 1.13, 3.12, 9.21, 1.250, 1.19 та 3.18 у цьому дослідженні виявляють гарну активність (захворюваність <20%).