



УКРАЇНА

(19) UA

(11) 106199

(13) C2

(51) МПК

C07D 213/60 (2006.01)

C07C 237/42 (2006.01)

A01N 37/22 (2006.01)

A01N 43/40 (2006.01)

ДЕРЖАВНА СЛУЖБА
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
УКРАЇНИ

(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД

(21) Номер заявки: а 2010 09135

(22) Дата подання заявки: 09.12.2008

(24) Дата, з якої є чинними
права на винахід: 11.08.2014

(31) Номер попередньої
заявки відповідно до
Паризької конвенції: 07150343.7

(32) Дата подання
попередньої заявки
відповідно до
Паризької конвенції: 21.12.2007

(33) Код держави-учасниці
Паризької конвенції,
до якої подано
попередню заявку: EP

(41) Публікація відомостей
про заявку: 25.08.2010, Бюл.№ 16

(46) Публікація відомостей
про видачу патенту: 11.08.2014, Бюл.№ 15

(86) Номер та дата
подання міжнародної
заявки, поданої
відповідно до
Договору РСТ RST/EP2008/010418,
09.12.2008

(72) Винахідник(и):

Гьоргенс Ульріх (DE),

Янагі Акіхіко (JP),

Вада Катсуакі (JP),

Мурата Тецуя (JP),

Ватанабе Юкійоші (JP),

Міхара Джун (JP),

Аракі Коічі (JP)

(73) Власник(и):

БАЕР КРОПСАЄНС АГ,

Alfred-Nobel-Strasse 50, D-40789 Monheim,
Germany (DE)

(74) Представник:

Шамріна Олена Олексіївна, реєстр. №141

(56) Перелік документів, взятих до уваги
експертизою:

CA 2 616 749 A1; 01.02.2007

WO 2007/017075 A; 15.02.2007

WO 2007/013332 A; 01.02.2007

EP 1 938 685 A; 02.07.2008

EP 1 661 886 A; 31.05.2006

US 3 309 367; 14.03.1967

US 6 794 392 B1; 21.09.2004

(54) ПОХІДНІ АМІОБЕНЗАМІДУ ЯК АГЕНТИ, ЩО ПРИДАТНІ ДЛЯ ВИКОРИСТАННЯ ДЛЯ БОРОТЬБИ З ПАРАЗИТАМИ ТВАРИН

(57) Реферат:

Винахід стосується композиції, що містить щонайменше одну сполуку амінобензаміду або її сіль для боротьби з паразитами тварин, ветеринарних фармацевтичних композицій, що містять щонайменше одну похідну амінобензаміду формули (I), для запобігання інфікуванню хворобами, що передаються паразитами, їх застосування для одержання ветеринарного фармацевтичного препарату для боротьби з паразитами тварин і способу для запобігання інфікуванню хворобами, що передаються паразитами.

UA 106199 C2

Винахід стосується композиції, що містить щонайменше одну з похідних амінобензаміду або її сіль для боротьби з паразитами тварин, ветеринарних фармацевтичних композицій, що містять щонайменше одну з похідних амінобензаміду або її сіль для запобігання інфікуванню хворобами, що передаються паразитами, їх застосування для виготовлення ветеринарних фармацевтичних препаратів для боротьби з паразитами тварин і способу для запобігання інфікуванню хворобами, що передаються паразитами.

Зараження паразитами тварин, домашніх тварин, хатніх тварин, а також і сільськогосподарських тварин являє собою проблему. Найчастіше, заражені тварини інфікуються хворобами, що передаються паразитами, такими як, наприклад, кліщовим бореліозом, різноманітними вірусними захворюваннями, які іноді стають смертельними або послаблюють імунну систему тварин внаслідок зараження, таким чином, що тварини стають схильними до інших хвороб таких як, наприклад, бактеріальні інфекції. В результаті чого, доводиться призначати дорогі лікарські препарати і, коли тварини, яких лікують, є сільськогосподарськими тваринами, тоді повстає загроза безпеки продукції тваринництва. Крім того, зараження сільськогосподарських тварин паразитами дуже часто супроводжується захворюванням, що відображується на показниках якості і кількості виробленого м'яса, молока, яєць, вовни або хутра.

Зокрема, кровосисні ектопаразити і ектопаразити, що викликають міаз, являють собою потенційні переносники широкого спектру патогенних мікроорганізмів, крім того, виникають інші вторинні ефекти ектопаразитарного зараження такі як втрата крові, подразнення, запалення, вторинна бактеріальна інфекція, вторинна паразитарна інфекція (наприклад, міаз) і безпосередній токсикоз (кліщовий параліч).

Хоча, відомо, що існують окремі сполуки для боротьби з паразитами тварин, до сих пір існує потреба у нових сполуках. Особливо у галузі тваринництва ектопаразити, яких піддають обробці, часто присутні у великих кількостях. Поряд з повторюваними обробками, які є необхідними для мінімізування ушкодження тварин-хазяїв, існує постійно зростаючий ризик, що у ектопаразитів розвивається резистентність до існуючих ветеринарних фармацевтичних препаратів. Існує також потреба у ветеринарних фармацевтичних препаратах, які запобігають зараженню тварин паразитами. Більш того, існує потреба у сполуках, які можуть запобігати насмоктуванню паразитом порції крові або ушкодженням, викликаним ектопаразитами і, таким чином, додатково можуть знижувати ризик передачі трансмісивних захворювань тваринам і людям.

З міжнародних публікацій WO 2005/021488 A, WO 2005/073165 A, WO 2006/137376 A, WO 2006/137395 A, JP 2006/306771, WO 2007/017075 A, WO2007/013150 A і WO 2007/013332 A відомо, що окремі похідні амінобензаміду можуть використовуватися як інсектициди у сільськогосподарській і плодоовочевій галузі.

Винахідниками було знайдено, що окремі похідні амінобензаміду або композиції, що містять щонайменше одну оптично-активну похідну амінобензаміду проявляють відмінну активність проти паразитів тварин і таким чином можуть використовуватися як ветеринарні фармацевтичні препарати, особливо для запобігання інфікуванню хворобами, які передаються через паразитів тварин.

Перше втілення

Таким чином, у першому втіленні, винахід стосується фармацевтичної композиції, що містить щонайменше одну похідну амінобензаміду формули (I) або її сіль



в якій

A¹, A², A³ і A⁴ кожний незалежно один від одного означають C-X, N або N=O;

X незалежно один від одного означає атом водню, атом галогену, гідроксигрупу, C₁-C₆ алкільну групу або трифторметильну групу;

B¹ і B² кожний незалежно один від одного означають атом кисню або атом сірки;

- R^1 і R^2 відповідно незалежно один від одного означають атом водню, C_1-C_6 алкільну групу, C_1-C_6 галоалкільну групу, C_1-C_6 алкоксигрупу, C_1-C_6 галоалкоксигрупу, C_1-C_6 алкілтіогрупу, C_1-C_6 галоалкілтіогрупу, C_1-C_6 алкілкарбонільну групу, C_1-C_6 галоалкілкарбонільну групу; або означає фенільну групу, або бензильну групу необов'язково заміщену щонайменше однією групою,
- 5 вибраною з групи, що включає C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 алкокси, C_1-C_6 алкілтіо, C_1-C_6 алкілсульфініл, C_1-C_6 алкілсульфоніл, C_1-C_6 галоалкіл, C_1-C_6 галоалкокси, C_1-C_6 галоалкілтіо, C_1-C_6 галоалкілсульфініл, C_1-C_6 галоалкілсульфоніл, нітро, гідрокси і галоген; або піридил, піразоліл, тієніл, фурил, ізоксазоліл, тіадіазоліл, або піридилметил, піразолілметил, тієнілметил, фурилметил, ізоксазолілметил або тіадіазолілметил, необов'язково заміщений щонайменше
- 10 однією групою, вибраною з групи, що включає C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 алкокси, C_1-C_6 алкілтіо, C_1-C_6 алкілсульфініл, C_1-C_6 алкілсульфоніл, C_1-C_6 галоалкіл, C_1-C_6 галоалкокси, C_1-C_6 галоалкілтіо, C_1-C_6 галоалкілсульфініл, C_1-C_6 галоалкілсульфоніл, нітро, гідрокси і галоген;
- Q означає L або $Y-R^6$,
- де
- 15 Y означає кисень, сірку, аміно, C_1-C_4 аміноалкіл; і
- R^6 означає C_1-C_6 алкільну групу, C_1-C_6 галоалкільну групу, C_2-C_6 алкенільну групу, C_2-C_6 галоалкенільну групу, C_2-C_6 алкінільну групу, C_2-C_6 галоалкінільну групу, C_3-C_8 циклоалкільну групу або C_3-C_8 галоциклоалкільну групу; або
- 20 $-E_1-Z_1-R^7$ (де E_1 означає C_1-C_4 алкіленову групу, C_2-C_4 алкеніленову групу, C_3-C_4 алкініленову групу, C_1-C_4 галоалкіленову групу, C_2-C_4 галоалкеніленову групу або C_3-C_4 галоалкініленову групу, R^7 означає атом водню, C_1-C_6 алкільну групу, C_2-C_6 алкенільну групу, C_2-C_6 алкінільну групу, C_1-C_6 галоалкільну групу, C_2-C_6 галоалкенільну групу або C_2-C_6 галоалкінільну групу і Z_1 означає $-O-$, $-S-$, $-SO-$, $-SO_2-$, $-C(=O)-$, $-C(=O)O-$, $-OC(=O)-$, $-N(R_8)-$, $-C(=O)N(R_8)-$ або $-N(R_8)C(=O)-$); або
- 25 $-E_2-R_9$ (де E_2 означає C_1-C_4 алкіленову групу, C_2-C_4 алкеніленову групу, C_3-C_4 алкініленову групу, C_1-C_4 галоалкіленову групу, C_2-C_4 галоалкеніленову групу або C_3-C_4 галоалкініленову групу; і R_9 означає C_3-C_8 циклоалкільну групу, C_3-C_8 галоциклоалкільну групу, ціаногрупу, нітрогрупу, гідроксигрупу, фенільну групу або заміщену фенільну групу, що має один або більше замісників, які можуть бути однаковими або відмінними і, які вибирають з атому галогену, C_1-C_6 алкільної
- 30 групи, C_1-C_6 галоалкільної групи, C_1-C_6 алкоксигрупи, C_1-C_6 галоалкоксигрупи, C_1-C_6 алкілтіогрупи, C_1-C_6 галоалкілтіогрупи, C_1-C_6 алкілсульфінільної групи, C_1-C_6 галоалкілсульфінільної групи, C_1-C_6 алкілсульфонільної групи, C_1-C_6 галоалкілсульфонільної групи, ціаногрупи, нітрогрупи, гідроксигрупи, C_1-C_4 алкілкарбонільної групи, C_1-C_4 галоалкілкарбонільної групи, C_1-C_4 алкілкарбонілоксигрупи і C_1-C_4 алкоксикарбонільної групи
- 35 або піридилної групи, або заміщену піридилну групу, що має один або більше замісників, які вибирають з атому галогену, C_1-C_6 галоалкільної групи і C_1-C_6 галоалкоксигрупи, тієнільної групи або тетрагідрофуранової групи);
- L означає фенільну групу; або
- гетероциклільну групу; або
- 40 атом водню, C_1-C_6 алкільну групу, C_2-C_6 алкенільну групу, C_2-C_6 алкінільну групу, C_3-C_8 циклоалкільну групу, C_3-C_8 циклоалкенільну групу, C_1-C_6 альдегідну групу, C_1-C_6 іміноальдегідну групу, C_1-C_6 алкоксиіміноальдегідну групу, C_1-C_6 алкоксиіміно- C_1-C_6 -алкільну групу, C_1-C_6 алкоксигрупу, C_1-C_6 алкілтіогрупу, C_1-C_6 галоалкілтіогрупу, C_1-C_6 алкілсульфінільну групу і C_1-C_6 алкілсульфонільну групу;
- 45 де кожний з вище зазначених залишків необов'язково заміщений атомом галогену, C_1-C_4 алкільною групою, C_1-C_4 галоалкільною групою, C_2-C_4 алкенільною групою, C_2-C_4 галоалкенільною групою, C_2-C_4 алкінільною групою, C_2-C_4 галоалкінільною групою, C_3-C_6 циклоалкільною групою, C_3-C_6 галоциклоалкільною групою, C_1-C_3 алкоксигрупою, C_1-C_3 галоалкоксигрупою, C_1-C_3 алкілтіогрупою, C_1-C_3 галоалкілтіогрупою, C_1-C_3 алкілсульфінільною групою, C_1-C_3 галоалкілсульфінільною групою, C_1-C_3 алкілсульфонільною групою, C_1-C_3 галоалкілсульфонільною групою, C_1-C_4 алкіламіногрупою, ді- C_1-C_4 алкіламіногрупою, ціаногрупою, нітрогрупою, гідроксигрупою, C_1-C_4 алкілкарбонільною групою, C_1-C_4 алкілкарбонілоксигрупою, C_1-C_4 алкоксикарбонільною групою, ацетиламіногрупою, фенільною групою і піридилною групою;
- 55 W означає фенільну групу або заміщену фенільну групу, що має один або більше замісників, які можуть бути однаковими або відмінними і, які вибирають з атому галогену, C_1-C_4 алкільної групи, C_1-C_4 галоалкільної групи, C_1-C_4 галоалкільної C_1-C_4 алкоксигрупи, C_1-C_4 галоалкіл C_1-C_4 галоалкоксигрупи, C_1-C_4 алкоксигрупи, C_1-C_4 галоалкоксигрупи, C_1-C_3 алкілтіогрупи, C_1-C_3 галоалкілтіогрупи, C_1-C_3 алкілсульфінільної групи, C_1-C_3 галоалкілсульфінільної групи, C_1-C_3 алкілсульфонільної групи, C_1-C_3 галоалкілсульфонільної групи, C_1-C_3 алкілсульфонільної групи, C_1-C_3 галоалкілсульфонільної групи, ціаногрупи, карбоніл- C_1-C_4 -
- 60

алкільної групи, карбоніл-С₁-С₄-галоалкільної групи; або SF₅ групи;

для запобігання інфікування хворобами, що передаються паразитами.

Амінобензаміди формули (I) переважно і найбільш переважно визначаються наступними замісниками:

5 А¹ переважно незалежно один від одного вибраний з групи, що складається з С-Х і N; більш переважно з С-Х; і найбільш переважно вибраний з групи, що включає СН, С-галоген, зокрема, С-F, С-CH₃ і С-ОН.

10 А², А³ і А⁴ переважно незалежно один від одного вибрані з групи, що включає С-Х і N; переважно С-Х; і найбільш переважно СН.

Х переважно вибраний з групи, що включає атом водню, атом галогену, гідроксигрупу і С₁-С₆ алкільну групу;

15 найбільш переважно вибраний з групи, що включає атом водню, атом галогену, гідроксигрупу і С₁-С₃ алкільну групу.

В¹ і В² кожний є атомом кисню.

20 R¹ і R² переважно незалежно один від одного вибрані з групи, що включає атом водню, С₁-С₄ алкільну групу, С₁-С₄ галоалкільну групу; фенільну групу або бензильну групу, необов'язково заміщених щонайменше однією групою, вибраною з групи, що включає С₁-С₆ алкіл, С₁-С₆ алкокси, С₁-С₆ алкілтіо, С₁-С₆ алкілсульфініл, С₁-С₆ алкілсульфоніл, С₁-С₆ галоалкіл, С₁-С₆ галоалкокси, С₁-С₆ галоалкілтіо, С₁-С₆ галоалкілсульфініл, С₁-С₆ галоалкілсульфоніл, нітро, гідрокси і галоген; і піридиліну групу, що необов'язково заміщена щонайменше однією групою, вибраною з групи, що включає С₁-С₆ алкіл, С₁-С₆ алкокси, С₁-С₆ алкілтіо, С₁-С₆ алкілсульфініл, С₁-С₆ алкілсульфоніл, С₁-С₆ галоалкіл, С₁-С₆ галоалкокси, С₁-С₆ галоалкілтіо, С₁-С₆ галоалкілсульфініл, С₁-С₆ галоалкілсульфоніл, нітро, гідрокси і галоген;

30 більш переважно незалежно один від одного вибрані з групи, що включає атом водню, С₁-С₄ алкільну групу; бензильну групу, необов'язково заміщену щонайменше однією групою, вибраною з групи, що включає С₁-С₆ алкіл, С₁-С₆ алкокси, С₁-С₆ алкілтіо, С₁-С₆ алкілсульфініл, С₁-С₆ алкілсульфоніл, С₁-С₆ галоалкіл, С₁-С₆ галоалкокси, С₁-С₆ галоалкілтіо, С₁-С₆ галоалкілсульфініл, С₁-С₆ галоалкілсульфоніл, нітро, гідрокси і галоген; і піридиліну групу, що необов'язково заміщена щонайменше однією групою, вибраною з групи, що включає С₁-С₆ алкіл, С₁-С₆ алкокси, С₁-С₆ алкілтіо, С₁-С₆ алкілсульфініл, С₁-С₆ алкілсульфоніл, С₁-С₆ галоалкіл, С₁-С₆ галоалкокси, С₁-С₆ галоалкілтіо, С₁-С₆ галоалкілсульфініл, С₁-С₆ галоалкілсульфоніл, нітро, гідрокси і галоген;

35 найбільш переважно незалежно один від одного вибрані з групи, що включає атом водню, піридин-3-іл-метил, 2-фторбензил, 2-хлорпіридин-3-іл-метил, піридин-2-іл-метил і метил.

Q переважно означає L або Y-R⁶,

40 де Y означає атом кисню; і

R⁶ означає С₁-С₆ алкільну групу, С₁-С₆ галоалкільну групу, С₂-С₆ алкенільну групу, С₂-С₆ галоалкенільну групу, С₂-С₆ алкінільну групу, С₂-С₆ галоалкінільну групу, С₃-С₈ циклоалкільну групу або С₃-С₈ галоциклоалкільну групу; або

45 більш переважно означає L або Y-R⁶, де

Y означає атом кисню; і

R⁶ означає С₁-С₆ алкільну групу або С₁-С₆ галоалкільну групу, найбільш переважно означає L або Y-R⁶,

50 де Y означає атом кисню; і

R⁶ означає CH₃, C₂H₅, i-C₃H₇, CH₂CCl₃, CH(CH₂F)₂, (CH₂)₂Cl і CH₂CF₃.

L переважно означає фенільну групу; або

55 гетероциклільну групу, вибрану з групи, що включає піридиліну групу, тіофенільну групу, фуранільну групу, піразолільну групу, тіадіазолільну групу; або

атом водню, С₁-С₆ алкільну групу, С₂-С₆ алкенільну групу, С₂-С₆ алкінільну групу, С₃-С₈ циклоалкільну групу, С₃-С₈ циклоалкенільну групу, С₁-С₆ альдегідну групу, С₁-С₆ іміноальдегідну групу, С₁-С₆ алкоксиіміноальдегідну групу, С₁-С₆ алкоксиіміно-С₁-С₆-алкільну групу, С₁-С₆ алкоксигрупу, С₁-С₆ алкілтіогрупу, С₁-С₆ алкілсульфінільну групу і С₁-С₆ алкілсульфонільну групу;

де кожний з вище зазначених залишків необов'язково заміщений атомом галогену, C_1-C_4 алкільною групою, C_1-C_4 галоалкільною групою, C_2-C_4 алкенільною групою, C_2-C_4 галоалкенільною групою, C_2-C_4 алкінільною групою, C_2-C_4 галоалкінільною групою, C_3-C_6 циклоалкільною групою, C_3-C_6 галоциклоалкільною групою, C_1-C_3 алкоксигрупою, C_1-C_3 галоалкоксигрупою, C_1-C_3 алкілтіогрупою, C_1-C_3 галоалкілтіогрупою, C_1-C_3 алкілсульфінільною групою, C_1-C_3 галоалкілсульфінільною групою, C_1-C_3 алкілсульфонільною групою, C_1-C_3 галоалкілсульфонільною групою, C_1-C_4 алкіламіногрупою, ді- C_1-C_4 алкіламіногрупою, ціаногрупою, нітрогрупою, гідроксигрупою, C_1-C_4 алкілкарбонільною групою, C_1-C_4 алкілкарбонілоксигрупою, C_1-C_4 алкоксикарбонільною групою, ацетиламіногрупою, фенільною групою і піридилною групою;

більш переважно означає фенільну групу; або

гетероциклільну групу, вибрану з групи, що включає піридилну групу, тіофенільну групу, фуранільну групу, піразолільну групу, тіадіазолільну групу; або

C_1-C_6 алкільну групу, C_2-C_6 алкенільну групу, C_2-C_6 алкінільну групу, C_3-C_8 циклоалкільну групу, C_3-C_8 циклоалкенільну групу, C_1-C_6 альдегідну групу і C_1-C_6 іміноальдегідну групу, C_1-C_6 алкоксиміноальдегідну групу, C_1-C_6 алкоксиміно- C_1-C_6 алкільну групу;

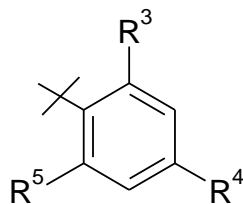
де кожний з вище зазначених залишків необов'язково заміщений атомом галогену, C_1-C_4 алкільною групою, C_1-C_4 галоалкільною групою, C_2-C_4 алкенільною групою, C_1-C_3 алкоксигрупою, C_1-C_3 алкілтіогрупою, C_1-C_4 алкіламіногрупою, ді- C_1-C_4 алкіламіногрупою, ціаногрупою, нітрогрупою і гідроксигрупою;

найбільш переважно означає піридин-2-іл, піридин-3-іл, піридин-4-іл, 2-фторпіридин-3-іл, 6-фторпіридин-3-іл, 4,6-дифторпіридин-3-іл, 2-хлорпіридин-3-іл, 2-хлорпіридин-4-іл, 2-хлорпіридин-5-іл, 3-хлорпіридин-2-іл, 5-хлорпіридин-3-іл, 6-хлорпіридин-3-іл, 3,5-дихлорпіридин-2-іл, 2-бромпіридин-3-іл, 2-фторпіридин-3-іл, 2-фторпіридин-5-іл, 2-метилпіридин-3-іл, 4-(трифторметил)піридин-2-іл, 4-(трифторметил)піридин-3-іл, 3-хлор-5-(трифторметил)піридин-2-іл, 3-(трифторметил)піридин-2-іл, 2,6-дихлорпіридин-3-іл, 2,6-дихлорпіридин-4-іл, 3-гідроксипіридин-2-іл, 6-хлор-4-(трифторметил)піридин-3-іл, тіофен-2-іл, тіофен-3-іл, 2-хлортіофен-3-іл, 2-хлортіофен-5-іл, 3-хлортіофен-2-іл, 3-хлортіофен-2-іл, 5-хлортіофен-2-іл, 2,5-дихлортіофен-3-іл, 3-метокси-5-(трифторметил)тіофен-2-іл, 3-метилтіофен-2-іл, фуран-2-іл, фуран-3-іл, 2-бромфуран-5-іл, 2,3-дибромфуран-5-іл, 3-(трет-бутил)-1-метилпіразол-5-іл, 5-хлор-1-метил-3-(трифторметил)піразол, 4-бром-1-етил-3-метилпіразол-5-іл, 4-метил-1,2,3-тіадіазол-5-іл, феніл, 2-фторфеніл, 3-фторфеніл, 4-фторфеніл, 2-хлорфеніл, 3-хлорфеніл, 4-хлорфеніл, 2-бромфеніл, 3-бромфеніл, 4-бромфеніл, 2-йодфеніл, 2,3-дихлорфеніл, 2,4-дихлорфеніл, 2,5-дихлорфеніл, 2,6-дихлорфеніл, 3,4-дихлорфеніл, 3,5-дихлорфеніл, 2-хлор-6-фторфеніл, 2,3-дифторфеніл, 2,4-дифторфеніл, 2,5-дифторфеніл, 2,6-дифторфеніл, 2,4,6-трифторфеніл, 2-метилфеніл, 3-метилфеніл, 4-метилфеніл, 2-етилфеніл, 4-метилтіофеніл, 4-метоксифеніл, 4-етоксифеніл, 4-(трифторметокси)феніл, 2-(трифторметил)феніл, 3-(трифторметил)феніл, 4-(трифторметил)феніл, 4-(трифторметилтіо)феніл, 2,4,6-трифторфеніл, 2-нітрофеніл, 2,3-дифторфеніл, 2,4-дифторфеніл, 2,6-дифторфеніл, 4-метилсульфінілфеніл, 4-метилсульфонілфеніл, 4-(трифторметилсульфоніл)феніл, 4-(трифторметилсульфініл)феніл, 2-нітрофеніл, ізоксазол-5-іл, 5-метилізоксазол-4-іл, 4-ціанофеніл, 4-нітрофеніл, 2-хлор-4-нітрофеніл, 2-хлор-3-амінофеніл, (Е)-пропеніл, 2-хлорциклогекс-1-ен-1-іл, метиліденциклогексан-2-іл, (Z)-2-фторстирол-2-іл, (Е)-бут-2-ен-2-іл, (Е)-пент-2-ен-2-іл, (Z)-бут-2-ен-2-іл, (Е)-1-хлоретен-1-іл циклопропіл, (Е)-2-метилстирол-2-іл, циклогексен-1-іл, циклопентен-1-іл, 1-метоксиминоетанал-1-іл, форміл, етил, пропіл, ізопропіл, втор-бутил, 4-фторбензил, ізобутил і $Si(CH_2)_3$.

W означає переважно заміщену фенільну групу, що має один або більше замісників, які можуть бути однаковими або відмінними і, які вибрані з групи, що включає атом галогену, C_1-C_4 алкільну групу, C_1-C_4 галоалкільну групу, C_1-C_4 галоалкіл C_1-C_4 алкоксигрупу, C_1-C_4 галоалкіл C_1-C_4 галоалкоксигрупу, C_1-C_4 алкоксигрупу, C_1-C_4 галоалкоксигрупу, C_1-C_3 алкілтіогрупу, C_1-C_3 галоалкілтіогрупу, C_1-C_3 алкілсульфінільну групу, C_1-C_3 галоалкілсульфінільну групу, C_1-C_3 алкілсульфонільну групу, C_1-C_3 галоалкілсульфонільну групу, ціаногрупу або SF_5 групу;

більш переважно означає заміщену фенільну групу, що має один або більше замісників, які можуть бути однаковими або відмінними і, які вибрані з групи, що включає атом галогену, C_1-C_4 алкільну групу, C_1-C_4 галоалкільну групу, C_1-C_3 алкілтіогрупу, C_1-C_3 галоалкілтіогрупу, C_1-C_3 алкілсульфінільну групу, C_1-C_3 галоалкілсульфінільну групу, C_1-C_3 алкілсульфонільну групу, C_1-C_3 галоалкілсульфонільну групу, карбоніл- C_1-C_4 -алкільну групу, карбоніл- C_1-C_4 -галоалкільну групу і SF_5 групу;

найбільш переважно



де
 R^3 переважно вибраний з групи, що включає атом галогену, C_1 - C_4 алкільну групу;
 більш переважно вибраний з групи, що включає атом галогену, метильну групу та етил^{ьну} групу;

R^4 переважно вибраний з групи, що включає C_1 - C_4 галоалкільну групу, C_1 - C_3 алкілтіогрупу, C_1 - C_3 галоалкілтіогрупу, C_1 - C_3 алкілсульфінільну групу, C_1 - C_3 галоалкілсульфінільну групу, C_1 - C_3 алкілсульфонільну групу, C_1 - C_3 галоалкілсульфонільну групу, карбоніл- C_1 - C_4 -алкільну групу, карбоніл- C_1 - C_4 -галоалкільну групу, і SF_5 групу;

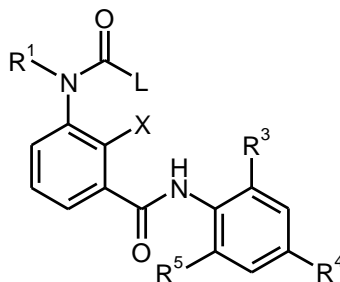
R^4 більш переважно вибраний з групи, що включає CF_3 , $CF(CF_3)_2$, $CH(CF_3)_2$, C_2F_5 , SCF_3 , SC_2F_5 , $n-SC_3F_7$, $S(O)CF_3$, $S(O)C_2F_5$, $S(O)-n-C_3F_7$, SO_2CF_3 , $SO_2C_2F_5$, $SO_2-n-C_3F_7$, $S(O)CH_2CF_3$, Br , SF_5 , $C(OC_2H_5)(CF_3)_2$ і $C(OCH_3)(CF_3)_2$;

R^5 переважно вибраний з групи, що включає атом галогену, C_1 - C_4 алкільну групу і C_1 - C_4 галоалкільну групу;

R^5 найбільш переважно вибраний з групи, що включає атом галогену, CH_3 , C_2H_5 , C_2F_5 , $CH(CH_3)_2$, $i-C_3H_7$, $n-C_3H_7$ і SCF_3 .

Друге втілення

У другому втіленні, композиція яка описана у першому або другому втіленні, містить сполуку формули (I-1), в якій



I-1

X означає атом водню, атом галогену, гідроксигрупу, C_1 - C_6 алкільну групу або трифторметильну групу;

R^1 означає атом водню, C_1 - C_6 алкільну групу, C_1 - C_6 галоалкільну групу, C_1 - C_6 алкоксигрупу, C_1 - C_6 галоалкоксигрупу, C_1 - C_6 алкілтіогрупу, C_1 - C_6 галоалкілтіогрупу, C_1 - C_6 алкілкарбонільну групу, C_1 - C_6 галоалкілкарбонільну групу або означає феніл, або бензил необов'язково заміщений щонайменше однією групою, вибраною з групи, що включає C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 алкілтіо, C_1 - C_6 алкілсульфініл, C_1 - C_6 алкілсульфоніл, C_1 - C_6 галоалкіл, C_1 - C_6 галоалкокси, C_1 - C_6 галоалкілтіо, C_1 - C_6 галоалкілсульфініл, C_1 - C_6 галоалкілсульфоніл, нітро, гідрокси і галоген; або піридил, піразоліл, тієніл, фурил, ізоксазоліл, тіадіазоліл, або піридилметил, піразолілметил, тієнілметил, фурилметил, ізоксазолілметил, або тіадіазолілметил необов'язково заміщений щонайменше однією групою, вибраною з групи, що включає C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 алкілтіо, C_1 - C_6 алкілсульфініл, C_1 - C_6 алкілсульфоніл, C_1 - C_6 галоалкіл, C_1 - C_6 галоалкокси, C_1 - C_6 галоалкілтіо, C_1 - C_6 галоалкілсульфініл, C_1 - C_6 галоалкілсульфоніл, нітро, гідрокси і галоген

R^3 і R^5 незалежно один від одного означає атом галогену, C_1 - C_4 алкільну групу, C_1 - C_4 галоалкільну групу, C_1 - C_4 алкоксигрупу, C_1 - C_4 галоалкоксигрупу, C_1 - C_3 алкілтіогрупу, C_1 - C_3 галоалкілтіогрупу, C_1 - C_3 алкілсульфінільну групу, C_1 - C_3 галоалкілсульфінільну групу, C_1 - C_3 алкілсульфонільну групу, C_1 - C_3 галоалкілсульфонільну групу або ціаногрупу;

R^4 означає C_1 - C_4 алкільну групу, C_1 - C_4 галоалкільну групу, C_1 - C_4 галоалкіл C_1 - C_4 алкоксигрупу, C_1 - C_4 галоалкіл C_1 - C_4 галоалкоксигрупу, C_1 - C_4 алкоксигрупу, C_1 - C_4 галоалкоксигрупу, C_1 - C_3 алкілтіогрупу, C_1 - C_3 галоалкілтіогрупу, C_1 - C_3 алкілсульфінільну групу, C_1 - C_3 галоалкілсульфінільну групу, C_1 - C_3 алкілсульфонільну групу, C_1 - C_3 галоалкілсульфонільну групу або SF_5 групу;

- L означає фенільну групу або заміщену фенільну групу, що має один або більше замісників, які можуть бути однаковими або відмінними і, які вибирають з атому галогену, C₁-C₄ алкільної групи, C₁-C₄ галоалкільної групи, C₂-C₄ алкенільної групи, C₂-C₄ галоалкенільної групи, C₂-C₄ алкінільної групи, C₂-C₄ галоалкінільної групи, C₃-C₆ циклоалкільної групи, C₃-C₆ галоциклоалкільної групи, C₁-C₃ алкоксигрупи, C₁-C₃ галоалкоксигрупи, C₁-C₃ алкілтіогрупи, C₁-C₃ галоалкілтіогрупи, C₁-C₃ алкілсульфінільної групи, C₁-C₃ галоалкілсульфінільної групи, C₁-C₃ алкілсульфонільної групи, C₁-C₃ галоалкілсульфонільної групи, C₁-C₄ алкіламіногрупи, ді- C₁-C₄ алкіламіногрупи, ціаногрупи, нітрогрупи, гідроксигрупи, C₁-C₄ алкілкарбонільної групи, C₁-C₄ алкілкарбонілоксигрупи, C₁-C₄ алкоксикарбонільної групи, ацетиламіногрупи і фенільної групи; або піридилну групу; або піридилну групу, що має один або більше замісників, які можуть бути однаковими або відмінними і, які вибрані з атому галогену, C₁-C₄ алкільної групи, C₁-C₄ галоалкільної групи, C₂-C₄ алкенільної групи, C₂-C₄ галоалкенільної групи, C₂-C₄ алкінільної групи, C₂-C₄ галоалкінільної групи, C₃-C₆ циклоалкільної групи, C₃-C₆ галоциклоалкільної групи, C₁-C₃ алкоксигрупи, C₁-C₃ галоалкоксигрупи, C₁-C₃ алкілтіогрупи, C₁-C₃ галоалкілтіогрупи, C₁-C₃ алкілсульфінільної групи, C₁-C₃ галоалкілсульфінільної групи, C₁-C₃ алкілсульфонільної групи, C₁-C₄ алкіламіногрупи, ді- C₁-C₄ алкіламіногрупи, ціаногрупи, нітрогрупи, гідроксигрупи, C₁-C₄ алкілкарбонільної групи, C₁-C₄ алкілкарбонілоксигрупи, C₁-C₄ алкоксикарбонільної групи, ацетиламіногрупи і фенільної групи; або
- атом водню, C₂-C₄ галоалкенільну групу, C₂-C₄ алкінільну групу, C₂-C₄ галоалкінільну групу, C₃-C₆ циклоалкільну групу, C₃-C₆ галоциклоалкільну групу, C₁-C₃ алкоксигрупу, C₁-C₃ галоалкоксигрупу, C₁-C₃ алкілтіогрупу, C₁-C₃ галоалкілтіогрупу, C₁-C₃ алкілсульфінільну групу, C₁-C₃ галоалкілсульфінільну групу, C₁-C₃ алкілсульфонільну групу і C₁-C₃ галоалкілсульфонільну групу; або
- C₁-C₄ алкільну групу, C₁-C₄ галоалкільну групу, C₂-C₄ алкенільну групу, C₂-C₄ галоалкенільну групу, C₂-C₄ алкінільну групу, C₂-C₄ галоалкінільну групу, C₃-C₆ циклоалкільну групу, C₃-C₆ галоциклоалкільну групу, C₁-C₃ алкоксигрупу, C₁-C₃ галоалкоксигрупу, C₁-C₃ алкілтіогрупу, C₁-C₃ галоалкілтіогрупу, C₁-C₃ алкілсульфінільну групу, C₁-C₃ галоалкілсульфінільну групу, C₁-C₃ алкілсульфонільну групу і C₁-C₃ галоалкілсульфонільну групу, кожна з яких заміщена фенільною групою, що має один або більше замісників, які можуть бути однаковими або відмінними, і які вибрані з атому галогену, C₁-C₄ алкільної групи, C₁-C₄ галоалкільної групи, C₂-C₄ алкенільної групи, C₂-C₄ алкінільної групи, C₂-C₄ галоалкінільної групи, C₃-C₆ циклоалкільної групи, C₃-C₆ галоциклоалкільної групи, C₁-C₃ алкоксигрупи, C₁-C₃ галоалкоксигрупи, C₁-C₃ алкілтіогрупи, C₁-C₃ галоалкілтіогрупи, C₁-C₃ алкілсульфінільної групи, C₁-C₃ галоалкілсульфінільної групи, C₁-C₃ алкілсульфонільної групи, C₁-C₄ алкіламіногрупи, ді- C₁-C₄ алкіламіногрупи, ціаногрупи, нітрогрупи, гідроксигрупи, C₁-C₄ алкілкарбонільної групи, C₁-C₄ алкілкарбонілоксигрупи, C₁-C₄ алкоксикарбонільної групи, ацетиламіногрупи і фенільної групи; або піридилну групу;
- для запобігання інфікуванню хворобами, що передаються паразитами.
- Амінобензаміди формули (I-1) переважно і найбільш переважно визначаються наступними замісниками:
- X переважно вибраний з групи, що включає атом водню, атом галогену, гідроксигрупу і C₁-C₆ алкільну групу;
- найбільш переважно вибраний з групи, що включає атом водню, атом галогену, гідроксигрупу і C₁-C₃ алкільну групу.
- R¹ переважно незалежно один від одного вибраний з групи, що включає атом водню, C₁-C₄ алкільну групу, C₁-C₄ галоалкільну групу; фенільну групу або бензолну групу, необов'язково заміщені щонайменше однією групою, вибраною з групи, що включає C₁-C₆ алкіл, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ алкілтіо, C₁-C₆ алкілсульфініл, C₁-C₆ алкілсульфоніл, C₁-C₆ галоалкіл, C₁-C₆ галоалкокси, C₁-C₆ галоалкілтіо, C₁-C₆ галоалкілсульфініл, C₁-C₆ галоалкілсульфоніл, нітро, гідрокси і галоген; і піридилну групу, яка необов'язково заміщена щонайменше однією групою, вибраною з групи, що включає C₁-C₆ алкіл, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ алкілтіо, C₁-C₆ алкілсульфініл, C₁-C₆ алкілсульфоніл, C₁-C₆ галоалкіл, C₁-C₆ галоалкокси, C₁-C₆ галоалкілтіо, C₁-C₆ галоалкілсульфініл, C₁-C₆ галоалкілсульфоніл, нітро, гідрокси і галоген;
- більш переважно незалежно один від одного вибраний з групи, що включає атом водню, C₁-C₄ алкільну групу; бензилну групу, необов'язково заміщену щонайменше однією групою, вибраною з групи, що включає C₁-C₆ алкіл, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ алкілтіо, C₁-C₆ алкілсульфініл, C₁-C₆ алкілсульфоніл, C₁-C₆ галоалкіл, C₁-C₆ галоалкокси, C₁-C₆ галоалкілтіо, C₁-C₆ галоалкілсульфініл, C₁-C₆ галоалкілсульфоніл, нітро, гідрокси і галоген; і піридилну групу, яка необов'язково заміщена щонайменше однією групою, вибраною з групи, що включає C₁-C₆

алкіл, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ алкілтіо, C₁-C₆ алкілсульфініл, C₁-C₆ алкілсульфоніл, C₁-C₆ галоалкіл, C₁-C₆ галоалкокси, C₁-C₆ галоалкілтіо, C₁-C₆ галоалкілсульфініл, C₁-C₆ галоалкілсульфоніл, нітро, гідрокси і галоген;

5 найбільш переважно незалежно один від одного вибраний з групи, що включає атом водню, піридин-3-іл-метил, 2-фторбензил, 2-хлорпіридин-3-іл-метил, піридин-2-іл-метил і метил.

R³ переважно вибраний з групи, що включає атом галогену, C₁-C₄ алкільну групу;

більш переважно вибраний з групи, що включає атом галогену, метильну групу та етил^{ЬНУ} групу,

10 R⁴ переважно вибраний з групи, що включає C₁-C₄ галоалкільну групу, C₁-C₃ алкілтіогрупу, C₁-C₃ галоалкілтіогрупу, C₁-C₃ алкілсульфінільну групу, C₁-C₃ галоалкілсульфінільну групу, C₁-C₃ алкілсульфонільну групу, C₁-C₃ галоалкілсульфонільну групу, карбоніл-C₁-C₄-алкільну групу, карбоніл-C₁-C₄-галоалкільну групу і SF₅ групу;

більш переважно вибраний з групи, що включає CF₃, CF(CF₃)₂, CH(CF₃)₂, C₂F₅, SCF₃, SC₂F₅, n-SC₃F₇, S(O)CF₃, S(O)C₂F₅, S(O)-n-C₃F₇, SO₂CF₃, SO₂C₂F₅, SO₂-n-C₃F₇, S(O)CH₂CF₃, Br, SF₅, C(OC₂H₅)(CF₃)₂ і C(OCH₃)(CF₃)₂;

15 R⁵ переважно вибраний з групи, що включає атом галогену, C₁-C₄ алкільну групу і C₁-C₄ галоалкільну групу;

найбільш переважно вибраний з групи, що включає атом галогену, CH₃, C₂H₅, C₂F₅, CH(CH₃)₂, i-C₃H₇, n-C₃H₇ і SCF₃.

20 L переважно означає фенільну групу; або

гетероциклільну групу вибрану з групи, що включає піридинільну групу, тіофенільну групу, фуранільну групу, піразолільну групу, тіадіазолільну групу; або

25 атом водню, C₁-C₆ алкільну групу, C₂-C₆ алкенільну групу, C₂-C₆ алкінільну групу, C₃-C₈ циклоалкільну групу, C₃-C₈ циклоалкенільну групу, C₁-C₆ альдегідну групу, C₁-C₆ іміноальдегідну групу, C₁-C₆ алкоксигрупу, C₁-C₆ алкілтіогрупу, C₁-C₆ алкілсульфінільну групу і C₁-C₆ алкілсульфонільну групу;

30 де кожний з вище зазначених залишків необов'язково заміщений атомом галогену, C₁-C₄ алкільною групою, C₁-C₄ галоалкільною групою, C₂-C₄ алкенільною групою, C₂-C₄ галоалкенільною групою, C₂-C₄ алкінільною групою, C₂-C₄ галоалкінільною групою, C₃-C₆ циклоалкільною групою, C₃-C₆ галоциклоалкільною групою, C₁-C₃ алкоксигрупою, C₁-C₃ галоалкоксигрупою, C₁-C₃ алкілтіогрупою, C₁-C₃ галоалкілтіогрупою, C₁-C₃ алкілсульфінільною групою, C₁-C₃ галоалкілсульфінільною групою, C₁-C₃ алкілсульфонільною групою, C₁-C₃ галоалкілсульфонільною групою, C₁-C₄ алкіламіногрупою, ді-C₁-C₄ алкіламіногрупою, ціаногрупою, нітрогрупою, гідроксигрупою, C₁-C₄ алкілкарбонільною групою, C₁-C₄ алкілкарбонілоксигрупою, C₁-C₄ алкоксикарбонільною групою, ацетиламіногрупою, фенільною групою і піридинільною групою;

більш переважно означає фенільну групу; або

гетероциклільну групу вибрану з групи, що включає піридинільну групу, тіофенільну групу, фуранільну групу, піразолільну групу, тіадіазолільну групу; або

40 C₁-C₆ алкільну групу, C₂-C₆ алкенільну групу, C₂-C₆ алкінільну групу, C₃-C₈ циклоалкільну групу, C₃-C₈ циклоалкенільну групу, C₁-C₆ альдегідну групу і C₁-C₆ іміноальдегідну групу;

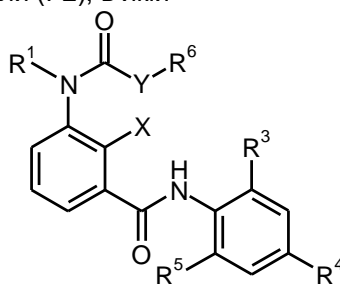
45 де кожний з вище зазначених залишків необов'язково заміщений атомом галогену, C₁-C₄ алкільною групою, C₁-C₄ галоалкільною групою, C₂-C₄ алкенільною групою, C₁-C₃ алкоксигрупою, C₁-C₃ алкілтіогрупою, C₁-C₄ алкіламіногрупою, ді-C₁-C₄ алкіламіногрупою, ціаногрупою, нітрогрупою і гідроксигрупою;

50 найбільш переважно означає піридин-2-іл, піридин-3-іл, піридин-4-іл, 2-фторпіридин-3-іл, 6-фторпіридин-3-іл, 4,6-дифторпіридин-3-іл, 2-хлорпіридин-3-іл, 2-хлорпіридин-4-іл, 2-хлорпіридин-5-іл, 3-хлорпіридин-2-іл, 5-хлорпіридин-3-іл, 6-хлорпіридин-3-іл, 3,5-дихлорпіридин-2-іл, 2-бромпіридин-3-іл, 2-фторпіридин-3-іл, 2-фторпіридин-5-іл, 2-метилпіридин-3-іл, 4-(трифторметил)піридин-2-іл, 4-(трифторметил)піридин-3-іл, 3-хлор-5-(трифторметил)піридин-2-іл, 3-(трифторметил)піридин-2-іл, 2,6-дихлорпіридин-3-іл, 2,6-дихлорпіридин-4-іл, 3-гідроксипіридин-2-іл, 6-хлор-4-(трифторметил)піридин-3-іл, тіофен-2-іл, тіофен-3-іл, 2-хлортіофен-3-іл, 2-хлортіофен-5-іл, 3-хлортіофен-2-іл, 3-хлортіофен-2-іл, 5-хлортіофен-2-іл, 2,5-дихлортіофен-3-іл, 3-метокси-5-(трифторметил)тіофен-2-іл, 3-метилтіофен-2-іл, фуран-2-іл, фуран-3-іл, 2-бромфуран-5-іл, 2,3-дибромфуран-5-іл, 3-(трет-бутил)-1-метилпіразол-5-іл, 5-хлор-1-метил-3-(трифторметил)піразол, 4-бром-1-етил-3-метилпіразол-5-іл, 4-метил-1,2,3-тіадіазол-5-іл, феніл, 2-фторфеніл, 3-фторфеніл, 4-фторфеніл, 2-хлорфеніл, 3-хлорфеніл, 4-хлорфеніл, 2-бромфеніл, 3-бромфеніл, 4-бромфеніл, 2-йодфеніл, 2,3-дихлорфеніл, 2,4-дихлорфеніл, 2,5-дихлорфеніл, 2,6-дихлорфеніл, 3,4-дихлорфеніл, 3,5-дихлорфеніл, 2-хлор-6-фторфеніл, 2,3-дифторфеніл, 2,4-дифторфеніл, 2,5-дифторфеніл, 2,6-дифторфеніл, 2,4,6-

трифторфеніл, 2-метилфеніл, 3-метилфеніл, 4-метилфеніл, 2-етилфеніл, 4-метилтіофеніл, 4-метоксифеніл, 4-етоксифеніл, 4-(трифторметокси)феніл, 2-(трифторметил)феніл, 3-(трифторметил)феніл, 4-(трифторметил)феніл, 4-(трифторметилтіо)феніл, 2,4,6-трифторфеніл, 2-нітрофеніл, 2,3-дифторфеніл, 2,4-дифторфеніл, 2,6-дифторфеніл, 4-метилсульфінілфеніл, 4-метилсульфонілфеніл, 4-(трифторметилсульфоніл)феніл, 4-(трифторметилсульфініл)феніл, 2-нітрофеніл, ізоксазол-5-іл, 5-метилізоксазол-4-іл, 4-ціанофеніл, 4-нітрофеніл, 2-хлор-4-нітрофеніл, 2-хлор-3-амінофеніл, (Е)-пропеніл, 2-хлорциклогекс-1-ен-1-іл, метиліденциклогексан-2-іл, (Z)-2-фторстирол-2-іл, (Е)-бут-2-ен-2-іл, (Е)-пент-2-ен-2-іл, (Z)-бут-2-ен-2-іл, (Е)-1-хлоретен-1-іл циклопропіл, (Е)-2-метилстирол-2-іл, циклогексен-1-іл, циклопентен-1-іл, 1-метоксиіміноетанал-1-іл, форміл, етил, пропіл, ізопропіл, втор-бутил 4-фторбензил, ізобутил і $\text{Cl}(\text{CH}_2)_3$.

Третє втілення

У третьому втіленні композиція, що описана у першому або другому втіленні, містить щонайменше одну сполуку формули (I-2), в якій



I-2

X означає атом водню, атом галогену, гідроксигрупу, $\text{C}_1\text{-C}_3$ алкільну групу або трифторметильну групу;

Y означає кисень, сірку, аміно, $\text{C}_1\text{-C}_4$ аміноалкіл;

R^1 означає атом водню, $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкільну групу, $\text{C}_1\text{-C}_6$ галоалкільну групу, $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкоксигрупу, $\text{C}_1\text{-C}_6$ галоалкоксигрупу, $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкілтіогрупу, $\text{C}_1\text{-C}_6$ галоалкілтіогрупу, $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкілкарбонільну групу, $\text{C}_1\text{-C}_6$ галоалкілкарбонільну групу; або означає фенільну групу, або бензильну групу, необов'язково заміщену щонайменше однією групою, вибраною з групи, що включає $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкіл, $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкокси, $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкілтіо, $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкілсульфініл, $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкілсульфоніл, $\text{C}_1\text{-C}_6$ галоалкіл, $\text{C}_1\text{-C}_6$ галоалкокси, $\text{C}_1\text{-C}_6$ галоалкілтіо, $\text{C}_1\text{-C}_6$ галоалкілсульфініл, $\text{C}_1\text{-C}_6$ галоалкілсульфоніл, нітро, гідрокси і галоген; або піридил, піразоліл, тіеніл, фурил, ізоксазоліл, тіадіазоліл, або піридилметил, піразолілметил, тіенілметил, фурилметил, ізоксазолілметил, або тіадіазолілметил необов'язково заміщений щонайменше однією групою, вибраною з групи, що включає $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкіл, $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкокси, $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкілтіо, $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкілсульфініл, $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкілсульфоніл, $\text{C}_1\text{-C}_6$ галоалкіл, $\text{C}_1\text{-C}_6$ галоалкокси, $\text{C}_1\text{-C}_6$ галоалкілтіо, $\text{C}_1\text{-C}_6$ галоалкілсульфініл, $\text{C}_1\text{-C}_6$ галоалкілсульфоніл, нітро, гідрокси і галоген;

R^3 і R^5 незалежно один від одного означає атом галогену, $\text{C}_1\text{-C}_4$ алкільну групу, $\text{C}_1\text{-C}_4$ галоалкільну групу, $\text{C}_1\text{-C}_4$ алкоксигрупу, $\text{C}_1\text{-C}_4$ галоалкоксигрупу, $\text{C}_1\text{-C}_3$ алкілтіогрупу, $\text{C}_1\text{-C}_3$ галоалкілтіогрупу, $\text{C}_1\text{-C}_3$ алкілсульфінільну групу, $\text{C}_1\text{-C}_3$ галоалкілсульфінільну групу, $\text{C}_1\text{-C}_3$ алкілсульфонільну групу, $\text{C}_1\text{-C}_3$ галоалкілсульфонільну групу або ціаногрупу;

R^4 означає $\text{C}_1\text{-C}_4$ алкільну групу, $\text{C}_1\text{-C}_4$ галоалкільну групу, $\text{C}_1\text{-C}_4$ галоалкіл $\text{C}_1\text{-C}_4$ алкоксигрупу, $\text{C}_1\text{-C}_4$ галоалкіл $\text{C}_1\text{-C}_4$ галоалкоксигрупу, $\text{C}_1\text{-C}_4$ алкоксигрупу, $\text{C}_1\text{-C}_4$ галоалкоксигрупу, $\text{C}_1\text{-C}_3$ алкілтіогрупу, $\text{C}_1\text{-C}_3$ галоалкілтіогрупу, $\text{C}_1\text{-C}_3$ алкілсульфінільну групу, $\text{C}_1\text{-C}_3$ галоалкілсульфінільну групу, $\text{C}_1\text{-C}_3$ алкілсульфонільну групу, $\text{C}_1\text{-C}_3$ галоалкілсульфонільну групу або SF_5 групу;

R^6 означає $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкільну групу, $\text{C}_1\text{-C}_6$ галоалкільну групу, $\text{C}_2\text{-C}_6$ алкенільну групу, $\text{C}_2\text{-C}_6$ галоалкенільну групу, $\text{C}_2\text{-C}_6$ алкінільну групу, $\text{C}_2\text{-C}_6$ галоалкінільну групу, $\text{C}_3\text{-C}_8$ циклоалкільну групу або $\text{C}_3\text{-C}_8$ галоциклоалкільну групу; або

$-\text{E}_1\text{-Z}_1\text{-R}^7$ (де E_1 означає $\text{C}_1\text{-C}_4$ алкіленову групу, $\text{C}_2\text{-C}_4$ алкеніленову групу, $\text{C}_3\text{-C}_4$ алкініленову групу, $\text{C}_1\text{-C}_4$ галоалкіленову групу, $\text{C}_2\text{-C}_4$ галоалкеніленову групу або $\text{C}_3\text{-C}_4$ галоалкініленову групу, R^7 означає атом водню, $\text{C}_1\text{-C}_6$ алкільну групу, $\text{C}_2\text{-C}_6$ алкенільну групу, $\text{C}_2\text{-C}_6$ алкінільну групу, $\text{C}_1\text{-C}_6$ галоалкільну групу, $\text{C}_2\text{-C}_6$ галоалкенільну групу або $\text{C}_2\text{-C}_6$ галоалкінільну групу і Z_1 означає $-\text{O}-$, $-\text{S}-$, $-\text{SO}-$, $-\text{SO}_2-$, $-\text{C}(=\text{O})-$, $-\text{C}(=\text{O})\text{O}-$, $-\text{OC}(=\text{O})-$, $-\text{N}(\text{R}_8)-$, $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R}_8)-$ або $-\text{N}(\text{R}_8)\text{C}(=\text{O})-$); або

$-\text{E}_2\text{-R}_9$ (де E_2 означає $\text{C}_1\text{-C}_4$ алкіленову групу, $\text{C}_2\text{-C}_4$ алкеніленову групу, $\text{C}_3\text{-C}_4$ алкініленову групу,

С₁-С₄ галоалкіленову групу, С₂-С₄ галоалкеніленову групу або С₃-С₄ галоалкініленову групу; і R₉ означає С₃-С₈ циклоалкільну групу, С₃-С₈ галоциклоалкільну групу, ціаногрупу, нітрогрупу, гідроксигрупу, фенільну групу або заміщену фенільну групу, що має один або більше замісників, які можуть бути однаковими або відмінними і, які вибирають з атому галогену, С₁-С₆ алкільної групи, С₁-С₆ галоалкільної групи, С₁-С₆ алкоксигрупи, С₁-С₆ галоалкоксигрупи, С₁-С₆ алкілтіогрупи, С₁-С₆ галоалкілтіогрупи, С₁-С₆ алкілсульфінільної групи, С₁-С₆ галоалкілсульфінільної групи, С₁-С₆ алкілсульфонільної групи, С₁-С₆ галоалкілсульфонільної групи, ціаногрупи, нітрогрупи, гідроксигрупи, С₁-С₄ алкілкарбонільної групи, С₁-С₄ галоалкілкарбонільної групи, С₁-С₄ алкілкарбонілоксигрупи і С₁-С₄ алкоксикарбонільної групи або піридинільної групи, або заміщеної піридинільної групи, що має один або більше замісників, які вибирають з атому галогену, С₁-С₆ галоалкільної групи і С₁-С₆ галоалкоксигрупи, тієнільної групи або тетрагідрофуранової групи);

для запобігання інфікуванню хворобами, що передаються паразитами.

Амінобензаміди формули (I) означають переважно і найбільш переважно наступними замісниками:

X переважно вибраний з групи, що включає атом водню, атом галогену, гідроксигрупу і С₁-С₆ алкільну групу;

найбільш переважно вибраний з групи, що включає атом водню, атом галогену, гідроксигрупу і С₁-С₃ алкільну групу.

R¹ переважно незалежно один від одного вибраний з групи, що включає атом водню, С₁-С₄ алкільну групу, С₁-С₄ галоалкільну групу; фенільну групу або бензолну групу, необов'язково заміщені щонайменше однією групою, вибраною з групи, що включає С₁-С₆ алкіл, С₁-С₆ алкокси, С₁-С₆ алкілтіо, С₁-С₆ алкілсульфініл, С₁-С₆ алкілсульфоніл, С₁-С₆ галоалкіл, С₁-С₆ галоалкокси, С₁-С₆ галоалкілтіо, С₁-С₆ галоалкілсульфініл, С₁-С₆ галоалкілсульфоніл, нітро, гідрокси і галоген; і піридинільну групу, яка необов'язково заміщена щонайменше однією групою, вибраною з групи, що включає С₁-С₆ алкіл, С₁-С₆ алкокси, С₁-С₆ алкілтіо, С₁-С₆ алкілсульфініл, С₁-С₆ алкілсульфоніл, С₁-С₆ галоалкіл, С₁-С₆ галоалкокси, С₁-С₆ галоалкілтіо, С₁-С₆ галоалкілсульфініл, С₁-С₆ галоалкілсульфоніл, нітро, гідрокси і галоген;

більш переважно незалежно один від одного вибраний з групи, що включає атом водню, С₁-С₄ алкільну групу; бензилну групу необов'язково заміщену щонайменше однією групою, вибраною з групи, що включає С₁-С₆ алкіл, С₁-С₆ алкокси, С₁-С₆ алкілтіо, С₁-С₆ алкілсульфініл, С₁-С₆ алкілсульфоніл, С₁-С₆ галоалкіл, С₁-С₆ галоалкокси, С₁-С₆ галоалкілтіо, С₁-С₆ галоалкілсульфініл, С₁-С₆ галоалкілсульфоніл, нітро, гідрокси і галоген; і піридинільну групу, яка необов'язково заміщена щонайменше однією групою, вибраною з групи, що включає С₁-С₆ алкіл, С₁-С₆ алкокси, С₁-С₆ алкілтіо, С₁-С₆ алкілсульфініл, С₁-С₆ алкілсульфоніл, С₁-С₆ галоалкіл, С₁-С₆ галоалкокси, С₁-С₆ галоалкілтіо, С₁-С₆ галоалкілсульфініл, С₁-С₆ галоалкілсульфоніл, нітро, гідрокси і галоген;

найбільш переважно незалежно один від одного вибраний з групи, що включає атом водню, піридин-3-іл-метил, 2-фторбензил, 2-хлорпіридин-3-іл-метил, піридин-2-іл-метил і метил.

Y означає переважно кисень;

R⁶ означає переважно С₁-С₆ алкільну групу, С₁-С₆ галоалкільну групу, С₂-С₆ алкенільну групу, С₂-С₆ галоалкенільну групу, С₂-С₆ алкінільну групу, С₂-С₆ галоалкінільну групу, С₃-С₈ циклоалкільну групу або С₃-С₈ галоциклоалкільну групу; або

більш переважно С₁-С₆ алкільну групу, або С₁-С₆ галоалкільну групу, означає найбільш переважно CH₃, C₂H₅, i-C₃H₇, CH₂CCl₃, CH(CH₂F)₂, (CH₂)₂Cl або CH₂CF₃.

R³ переважно вибраний з групи, що включає атом галогену, С₁-С₄ алкільну групу;

більш переважно вибирають з групи, що включає атом галогену, метильну групу і етильну групу;

R⁴ переважно вибраний з групи, що включає С₁-С₄ галоалкільну групу, С₁-С₃ алкілтіогрупу, С₁-С₃ галоалкілтіогрупу, С₁-С₃ алкілсульфінільну групу, С₁-С₃ галоалкілсульфінільну групу, С₁-С₃ алкілсульфонільну групу, С₁-С₃ галоалкілсульфонільну групу, карбоніл-С₁-С₄-алкільну групу, карбоніл-С₁-С₄-галоалкільну групу і SF₅ групу;

більш переважно вибраний з групи, що включає CF₃, CF(CF₃)₂, CH(CF₃)₂, C₂F₅, SCF₃, SC₂F₅, n-SC₃F₇, S(O)CF₃, S(O)C₂F₅, S(O)-n-C₃F₇, SO₂CF₃, SO₂C₂F₅, SO₂-n-C₃F₇, S(O)CH₂CF₃, Br, SF₅, C(OC₂H₅)(CF₃)₂ і C(OCH₃)(CF₃)₂;

R⁵ переважно вибраний з групи, що включає атом галогену, С₁-С₄ алкільну групу і С₁-С₄ галоалкільну групу;

найбільш переважно вибраний з групи, що включає атом галогену, CH₃, C₂H₅, C₂F₅, CH(CH₃)₂, i-C₃H₇, n-C₃H₇ і SCF₃.

Вищезазначені сполуки відповідно до формул (I), (I-1) і (I-2) відомі з міжнародних публікацій

WO 2005/021488 A, WO 2005/073165 A, WO 2006/137376 A, WO 2006/137395 A, JP 2006/306771, WO 2007/017075 A, WO2007/013150 A і WO 2007/013332 A і можуть бути синтезовані згідно з способами, описані в цьому документі.

5 Фармацевтична композиція, що містить вищезазначені сполуки формул (I), (I-1) і (I-2) є переважно ветеринарною фармацевтичною композицією.

Крім того, представлений винахід стосується використання похідної амінобензаміду як описано у будь-якому з першого по третє втілення для боротьби з паразитами, переважно паразитами тварин, найбільш переважно з ектопаразитами. Ектопаразитами є, зокрема, членистоногі. Найбільш переважними групами членистоногих є акариди і комахи. Несподівано
10 було знайдено, що сполуки мають особливо високу активність проти акаридів, зокрема, тіксів і кліщів.

Крім того, представлений винахід стосується використання композиції, що містить щонайменше одну похідну амінобензаміду як описано у будь-якому з першого по третє для боротьби з паразитами, переважно паразитами тварин, такими як членистоногі. Членистоногі включають акариди, зокрема, тікси, що включають іксодові тікси і аргасові тікси, кліщі, що
15 включають кінські кліщі, вушні кліщі, пташині кліщі, кліщі-червонотілки; членистоногі також включають комах таких як двокрилі комахи, воші і блохи, зокрема блохи різноманітних хазяїв (наприклад, котячі блохи, собачі блохи і т. і.), жаліячі двокрилі комахи, двокрилі комахи, які лижуть, паразитичні личинки мух, пуході і сисні воші.

20 Крім того, представлений винахід стосується способу запобігання інфікуванню хворобами, що передаються паразитами, який відрізняється тим, що композицію, що містить щонайменше одну похідну амінобензаміду, як описано у будь-якому від першого до третього втілення, призначають тварині ентеральним шляхом введення таким як оральний, місцевим або парентеральним шляхом введення таким як за допомогою ін'єкції. Переважним шляхом
25 введення є зовнішнє застосування.

Більш того, було знайдено, що сполуки представленого винаходу забезпечують відмінну активність проти паразитів тварин, особливо проти членистоногих, що уражають і/або заражають хатніх тварин або сільськогосподарських тварин. Таким чином, сполуки і композиції згідно з винаходом можуть використовуватися для боротьби з членистоногими що уражають
30 і/або заражають хатніх тварин і сільськогосподарських тварин.

Композиція згідно з винаходом необов'язково містить додаткові активні інгредієнти і/або допоміжні агенти такі як, наприклад, агенти, що допомагають розповсюдженню, поверхнево-активні речовини, емульгатори, розчинники, піноутворювачі або протиспінювальні агенти і наповнювачі.

35 Прикладами додаткових активних інгредієнтів, які можуть використовуватися у представленому винаході є інсектициди, бактерициди, акарициди, нематодциди, фунгіциди. Приклади таких активних інгредієнтів включають органофосфорні агенти, карбонати, карбоксилати, хлоровані гідрокарбонати і матеріали, що вироблені мікроорганізмами.

Інші приклади таких активних інгредієнтів включають, але не обмежуються ними, інгібітори
40 Ацетилхолінерастери (АХЕ), подібні карбаматам такі як, наприклад, аланікарб, альдікарб, альдоксикарб, алліксикарб, амінокарб, бендіокарб, бенфуракарб, буфенкарб, бутаккарб, бутоксикарб, бутоксикарб, карбарил, карбофуран, карбосульфат, клоетокарб, диметилан, етіофенкарб, фенобукарб, фенотіокарб, форметанат, фураціокарб, ізопрокарб, метам-натрій, метіокарб, метоміл, метолкарб, оксаміл, піримікарб, промеккарб, пропоксур, тіодикарб, тіофанокс, триметаккарб, ХМС, ксилілкарб і триазамат; органофосфати такі як,
45 наприклад, ацефат, азаметифос, азинфос (-метил, -етил), аромофос-етил, аромфенвінфос (-метил), аутатіофос, кадузафос, карбофенотіон, хлоретоксифос, хлорфенвінфос, хлормефос, хлорпірифос (-метил/-етил), коумафос, ціанофенфос, ціанофос, деметон-S-метил, деметон-S-метилсульфон, діаліфос, діазинон, дихлорфентіон, дихлорвоз/DDVP, дикротофос, диметоат,
50 диметилвінфос, діоксабензофос, дисульфотон, EPN, етіон, етопрофос, етримфос, фамфур, фенаміфос, фенітротіон, фенсульфотіон, фентіон, флупіразофос, фонофос, формотіон, фосметилан, фостіазат, гептенофос, йодофенфос, іпробенфос, ізазофос, ізофенфос, ізопропіл О-саліцилат, ізоксатіон, малатіон, мекарбам, метакрифос, метамідофос, метидатіон, мевінфос, монокротофос, налед, ометоат, оксидеметон-метил, паратіон (-метил/-етил), фентоат, форат,
55 фозалон, фосмет, фосфамідон, фосфокарб, фоксим, піримифос (-метил/-етил), профенофос, пропафос, пропетамфос, протіофос, протоат, піркофос, піридафентіон, піридатіон, квіналфос, себуфос, сульфотеп, сульпрофос, тебупіримфос, темефос, тербуфос, тетраклорвінфос, тіометон, триазофос, трихлорфон, вамідотіон.

Модулятори натрієвих каналів / блокатори натрієвих каналів, що залежать від напруги такі
60 як піретроїди як, наприклад, акринатрин, аллетрин (d-цис-транс, d-транс), бета-цифлутрин,

біфентрин, біоаллетрин, біоаллетрин-S-циклопентил-ізомер, біоетанометрин, біоперметрин, біоресметрин, кловапортрин, цис-циперметрин, цис-ресметрин, цис-перметрин, клоцитрин, циклопротрин, цифлутрин, цигалотрин, циперметрин (альфа-, бета-, тета-, дзета-), цифенотрин, дельтаметрин, емпентрин (1R-ізомер), есфенвалерат, етофенпрокс, фенфлутрин, фенпропатрин, фенпіритрин, фенвалерат, флуброцитринат, флуцитринат, флуфенпркс, флуметрин, флувалінат, фубфенпрокс, гамма-цихалотрин, іміпротрин, кадетрин, лямбда-цихалотрин, метофлутрин, перметрин (цис-, транс-), фенотрин (1R-транс ізомер), праллетрин, профлутрин, протрифенбут, пірезметрин, резметрин, RU 15525, силафлуофен, тау-флувалінат, тефлутрин, тераллетрин, тетраметрин (-1R- ізомер), тралометрин, трансфлутрин, ZXI 8901, піретрини (піретрум);

ДДТ; оксadiaзини такі як, наприклад, індоксакарб.

Агоністи/антагоністи рецептора ацетилхоліну, як хлоронікотиніди такі як, наприклад, ацетаміпрід, клотіанідин, динотефуран, імідаклопрід, нітенпірам, нітріазин, тіаклопрід, тіаметоксам, нікотин, бенсултап, картап.

Модулятори рецептора ацетилхоліну, як спінозини такі як, наприклад, спінозад.

Антагоністи хлоридного каналу, що регулюється гамма-аміномасляною кислотою (GABA), як оргонохлорини такі як, наприклад, камфехлор, хлордан, ендосульфат, гамма-HCH, HCH, гептахлор, ліндан, метоксихлор; фіпроли такі як, наприклад, ацетопрол, етіпрол, фіпроніл, пірафлупрол, пірипрол і ваніліпрол.

Активатори хлоридного каналу, як мектини такі як, наприклад, авермектин, емаектин, емаектин бензоат, івермектин, мільбецідин, латидектин, лепімектин, селамектин, дорамектин, еприномектин і моксидектин.

Міметичний ювенільний гормон, як наприклад, діофенолан, епофенонан, феноксикарб, гідропрен, кінопрен, метопрен, пірипроксифен і трипрен.

Агоністи рецептора латрофіліну, як депсипептиди, переважно, циклічні депсипептиди, зокрема, 24-членні циклічні депсипептиди, наприклад, емодепсид.

Агоністи/дезінтегратори екдизону, як діацилгідразини такі як, наприклад, хромафенозид, галофенозид, метоксифенозид, тебуфенозид.

Інгібітори біосинтезу хітину, як бензоїлкарбаміди такі як, наприклад, бістрифлурон, хлофлауазурон, дифлубензулон, флауазурон, флуциклоксурон, флуфеноксурон, гексафлумурон, луфенурон, новалурон, новіфлумурон, пенфлурон, тефлбензулон, трифлумурон; бупрофезин; циромазин.

Інгібітори оксидувального фосфорилування, дезінтегратори аденозинтрифосфату (АТФ) такі як діафентіурон; олово органічні сполуки такі як, наприклад, азоциклотин, цигексатин, фенбутатин-оксид.

Переривачі оксидувального фосфорилування шляхом переривання Н-градієнта протонів як піроли такі як, наприклад, хлорфенапір; динітрофеноли такі як, наприклад, бінапацірл, динобутон, динокап, DNOC.

Інгібітори переносу електронів комплексу I, як METI's такі як, наприклад, фенаквін, фенпіроксимат, піримідифен, піридабен, тебуфенпірад, толфенпірад; гідраметилнон; дикофол.

Інгібітори переносу електронів комплексу II, як ротенони.

Інгібітори переносу електронів комплексу III, як ацеквіноцил, флауакріпірим.

Мікробні дезінтегратори кишкової мембрани комах такі як штами *Bacillus thuringiensis*.

Інгібітори синтезу жирів, як тетранові кислоти такі як, наприклад, спіродиклофен, спіромезифен; тетрамові кислоти такі як, наприклад, спіротетрамат (номер в системі кодування реферативного журналу Chemical Abstracts System CAS-Reg.-№: 203313-25-1) і 3-(2,5-диметилфеніл)-8-метокси-2-оксо-1-азаспіро[4,5]дец-3-ен-4-іл етил карбонат (інше найменування: етиловий естер 3-(2,5-диметилфеніл)-8-метокси-2-оксо-1-азаспіро[4,5]дец-3-ен-4-іл карбонової кислоти, CAS-Reg.-№: 382608-10-8); карбоксаміди такі як, наприклад, флонікамід.

Агоністи октопаміну такі як, наприклад, амітраз.

Інгібітор магній-стимулюючої аденозинтрифосфатази (АТФаз), як пропаргіт дикарбоксаміди бензойної кислоти такі як, наприклад, флубендіамід; аналоги нереістоксину такі як, наприклад, тіоциклам гідрооксалат, тіосултап-натрій.

Біопрепарати, гормони або феромони такі як азадирахтин, види *Bacillus*, види *Beauveria*, кодлемон, види *Metarrhizium*, види *Paecilomyces*, *thuringiensis*, види *Verticillium*.

Діючі речовини з невідомим або неспецифічним механізмом дії, як фуміганти такі як, наприклад, фосфід алюмінію, метилбромід, сульфурилфторид; інгібітори поїдання такі як, наприклад, криоліт, флонікамід, піметрозин; інгібітори росту кліщів такі як, наприклад, клофентизин, етоксазол, гекситіазокс; амідифлумет, бенклотіаз, бензоксимат, біфеназат,

броморопілат, бупрофезин, хінометіонат, хлордимеформ, хлорбензилат, хлоропикрин, хлортіазобен, циклопрен, цифлуметофен, дицикланіл, феноксакрим, фентрифаніл, флубензімін, флуфенерим, флутензин, госсіплур, гідраметилнон, японілур, метоксadiaзон, керосин, піперонілбутоксид, олеат калію, піридаліл, сульфурамід, тетрадифон, тетрасул, триаратен і вербутин.

Приклади паразитів, проти яких можуть використовуватися сполуки або композиції згідно з винаходом включають, але не обмежуються ними, вищезазначених паразитів і ендопаразитів, як наприклад, гельмінти класу нематода, трематоди, цестоди, наприклад, такі як акантоцефали (*Acanthocephala*), аскариди (*Ascariasis*), цестода (*Cestoda*), двоустка китайська (*Clonorchis sinensis*), підшкірний глист (*Dracunculiasis*), остриці (*Enterobius vermicularis*), філярії (*Filariasis*), анкілостоми (*Hookworm*), *Loa loa*, *Onchocerciasis*, *Schistosomiasis*, угриця кишкова (*Strongyloides stercoralis*), *Toxocara canis*, трихінела (*Trichinella*), трихоцефал (*Whipworm*); або найпростіші такі як кокцидія.

Інші приклади паразитів включають, але не обмежуються ними паразитів з загону *Anoplurida* такі як види *Haematopinus*, види *Linognathus*, види *Pediculus*, види *Phtirus*, види *Solenopotes*, *Linognathus setosus*, *Linognathus vituli*, *Linognathus ovillus*, *Linognathus oviformis*, *Linognathus pedalis*, *Linognathus stenopsis*, *Haematopinus asini macrocephalus*, *Haematopinus eurysternus*, *Haematopinus suis*, *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Phylloera vastatrix*, *Phthirus pubis*, *Solenopotes capillatus*;

із загону *Mallophagida* і підзагонів *Amblycerina* і *Ischnocerina* такі як види *Trimenopon*, види *Menopon*, види *Trinoton*, види *Bovicola*, види *Werneckiella*, види *Lepikentron*, види *Damalina*, види *Trichodectes*, види *Felicola*, *Bovicola bovis*, *Bovicola ovis*, *Bovicola limbata*, *Damalina bovis*, *Trichodectes canis*, *Felicola subrostratus*, *Bovicola caprae*, *Lepikentron ovis*, *Werneckiella equi*;

із загону *Diptera* і підзагонів *Nematocera* і *Brachycera* такі як види *Aedes*, види *Anopheles*, види *Culex*, види *Simulium*, види *Eusimulium*, види *Phlebotomus*, види *Lutzomyia*, види *Culicoides*, види *Chrysops*, види *Odagmia*, види *Wilhelmia*, види *Hybomitra*, види *Atylotus*, види *Tabanus*, види *Haematopota*, види *Philipomyia*, види *Braula*, види *Musca*, види *Hydrotaea*, види *Stomoxys*, види *Haematobia*, види *Morellia*, види *Fannia*, види *Glossina*, види *Calliphora*, види *Lucilia*, види *Chrysomya*, види *Wohlfahrtia*, види *Sarcophaga*, види *Oestrus*, види *Hypoderma*, види *Gasterophilus*, види *Hippobosca*, види *Lipoptena*, види *Melophagus*, види *Rhinoestrus*, види *Tipula*, *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes taeniorhynchus*, *Anopheles gambiae*, *Anopheles maculipennis*, *Calliphora erythrocephala*, *Chrysosona pluvialis*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex pipiens*, *Culex tarsalis*, *Fannia canicularis*, *Sarcophaga carnaria*, *Stomoxys calcitrans*, *Tipula paludosa*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*, *Simulium reptans*, *Phlebotomus papatasi*, *Phlebotomus longipalpis*, *Odagmia ornata*, *Wilhelmia equina*, *Boophthora erythrocephala*, *Tabanus bromius*, *Tabanus spodopterus*, *Tabanus atratus*, *Tabanus sudeticus*, *Hybomitra ciurea*, *Chrysops caecutiens*, *Chrysops relictus*, *Haematopota pluvialis*, *Haematopota italica*, *Musca autumnalis*, *Musca domestica*, *Haematobia irritans*, *Haematobia irritans exigua*, *Haematobia stimulans*, *Hydrotaea irritans*, *Hydrotaea albipuncta*, *Chrysomya chloropyga*, *Chrysomya bezziana*, *Oestrus ovis*, *Hypoderma bovis*, *Hypoderma lineatum*, *Przhevalskiana silenus*, *Dermatobia hominis*, *Melophagus ovinus*, *Lipoptena capreoli*, *Lipoptena cervi*, *Hippobosca variegata*, *Hippobosca equina*, *Gasterophilus intestinalis*, *Gasterophilus haemorroidalis*, *Gasterophilus inermis*, *Gasterophilus nasalis*, *Gasterophilus nigricornis*, *Gasterophilus pecorum*, *Braula coeca*;

із загону *Siphonaptera* такі як види *Pulex*, види *Ctenocephalides*, види *Tunga*, види *Xenopsylla*, види *Ceratophyllus*, *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, *Xenopsylla cheopis*;

із загону *Heteropterida* такі як види *Cimex*, види *Triatoma*, види *Rhodnius*, види *Panstrongylus*;

із загону *Blattaria* такі як *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blattella germanica*, види *Supella*, *Suppella longipalpa*;

Сполуки третього втілення є особливо придатними для використання для боротьби з паразитами з підкласу *Acar* (*Acarina*) і загонів *Meta-* і *Mesostigmata* такі як види *Argas*, види *Ornithodoros*, види *Otobius*, види *Ixodes*, види *Amblyomma*, види *Rhipicephalus* (*Boophilus*) види *Dermacentor*, види *Haemaphysalis*, види *Hyalomma*, види *Dermanyssus*, початковий рід багатоклазєвих тіксів, а саме види *Rhipicephalus*, види *Ornithonyssus*, види *Pneumonyssus*, види *Raillietia*, види *Pneumonyssus*, види *Sternostoma*, види *Varroa*, види *Acarapis*, *Argas persicus*, *Argas reflexus*, *Ornithodoros moubata*, *Otobius megnini*, *Rhipicephalus* (*Boophilus*) *microplus*, *Rhipicephalus* (*Boophilus*) *decoloratus*, *Rhipicephalus* (*Boophilus*) *annulatus*, *Rhipicephalus* (*Boophilus*) *calceratus*, *Hyalomma anatolicum*, *Hyalomma aegypticum*, *Hyalomma marginatum*, *Hyalomma transiens*, *Rhipicephalus evertsi*, *Ixodes ricinus*, *Ixodes hexagonus*, *Ixodes canisuga*, *Ixodes pilosus*, *Ixodes rubicundus*, *Ixodes scapularis*, *Ixodes holocyclus*, *Haemaphysalis concinna*,

Haemaphysalis punctata, Haemaphysalis cinnabarina, Haemaphysalis otophila, Haemaphysalis leachi, Haemaphysalis longicorni, Dermacentor marginatus, Dermacentor reticulatus, Dermacentor pictus, Dermacentor albipictus, Dermacentor andersoni, Dermacentor variabilis, Hyalomma mauritanicum, Rhipicephalus sanguineus, Rhipicephalus bursa, Rhipicephalus appendiculatus, Rhipicephalus capensis, Rhipicephalus turanicus, Rhipicephalus zambeziensis, Amblyomma americanum, Amblyomma variegatum, Amblyomma maculatum, Amblyomma hebraeum, Amblyomma cajennense, Dermanyssus gallinae, Ornithonyssus bursa, Ornithonyssus sylviarum, Varroa jacobsoni;

із заgonу Actiniedida (Prostigmata) і Acaridida (Astigmata) такі як, наприклад, види Acarapis, види Cheyletiella, види Ornithocheyletia, види Myobia, види Psorergates, види Demodex, види Trombicula, види Listrophorus, види Acarus, види Tyrophagus, види Caloglyphus, види Hypodectes, види Pterolichus, види Psoroptes, види Chorioptes, види Otodectes, види Sarcoptes, види Notoedres, види Knemidocoptes, види Cytodites, види Laminosioptes, Cheyletiella yasguri, Cheyletiella blakei, Demodex canis, Demodex bovis, Demodex ovis, Demodex caprae, Demodex equi, Demodex caballi, Demodex suis, Neotrombicula autumnalis, Neotrombicula desaleri, Neoschöngastia xerothermobia, Trombicula akamushi, Otodectes cynotis, Notoedres cati, Sarcoptes canis, Sarcoptes bovis, Sarcoptes ovis, Sarcoptes rupicaprae або Sarcoptes caprae, Sarcoptes equi, Sarcoptes suis, Psoroptes ovis, Psoroptes cuniculi, Psoroptes equi, Chorioptes bovis, Psoergates ovis, Pneumonyssoidic Mange, Pneumonyssoides caninum, Acarapis woodi.

Сполуки другого втілення є особливо придатними для використання для боротьби з паразитами з підкласу акаридів (Acarina) і заgonів Meta- і Mesostigmata, за винятком видів Ornithodoros, видів Ixodes і видів Boophilus. Зокрема, зазначають наступні: види Amblyomma, види Dermacentor, види Haemaphysalis, види Hyalomma, види Dermanyssus, види Rhipicephalus, види Ornithonyssus, види Pneumonyssus, види Varroa, Hyalomma anatolicum, Hyalomma marginatum, Rhipicephalus evertsi, Haemaphysalis leachi, Haemaphysalis longicorni, Dermacentor marginatus, Dermacentor reticulatus, Dermacentor andersoni, Dermacentor variabilis, Hyalomma mauritanicum, Rhipicephalus sanguineus, Rhipicephalus bursa, Rhipicephalus appendiculatus, Rhipicephalus capensis, Rhipicephalus turanicus, Amblyomma americanum, Amblyomma variegatum, Amblyomma maculatum, Amblyomma hebraeum, Amblyomma cajennense, Dermanyssus gallinae, Ornithonyssus bursa, Ornithonyssus sylviarum, Varroa jacobsoni;

із заgonу Actiniedida (Prostigmata) і Acaridida (Astigmata) такі як, наприклад, види Acarapis, види Cheyletiella, види Ornithocheyletia, види Myobia, види Psorergates, види Demodex, види Trombicula, види Listrophorus, види Acarus, види Tyrophagus, види Caloglyphus, види Hypodectes, види Pterolichus, види Psoroptes, види Chorioptes, види Otodectes, види Sarcoptes, види Notoedres, види Knemidocoptes, види Cytodites, види Laminosioptes, Cheyletiella yasguri, Cheyletiella blakei, Demodex canis, Demodex bovis, Demodex ovis, Demodex caprae, Demodex equi, Demodex caballi, Demodex suis, Neotrombicula autumnalis, Neotrombicula desaleri, Neoschöngastia xerothermobia, Trombicula akamushi, Otodectes cynotis, Notoedres cati, Sarcoptes canis, Sarcoptes bovis, Sarcoptes ovis, Sarcoptes rupicaprae або Sarcoptes caprae, Sarcoptes equi, Sarcoptes suis, Psoroptes ovis, Psoroptes cuniculi, Psoroptes equi, Chorioptes bovis, Psoergates ovis, Pneumonyssoidic Mange, Pneumonyssoides caninum, Acarapis woodi.

Згідно з особливо переважним втіленням, сполуки втілення 1, втілення 2 або втілення 3 є придатними для боротьби з Amblyomma americanum.

Крім того, згідно з особливо переважним втіленням, сполуки втілення 1, втілення 2 або втілення 3 є придатними для боротьби з Dermacentor variabilis.

Крім того, згідно з особливо переважним втіленням, сполуки втілення 1, втілення 2 або втілення 3 є придатними для боротьби з Dermacentor reticulatus.

Крім того, згідно з особливо переважним втіленням, сполуки втілення 1, втілення 2 або втілення 3 є придатними для боротьби з Rhipicephalus sanguineus.

Крім того, згідно з особливо переважним втіленням, сполуки втілення 1, втілення 2 або втілення 3 є придатними для боротьби з Rhipicephalus decoloratus.

Хвороби, що передаються паразитами, особливо ектопаразитами є, наприклад, бактеріальними, вірусними, рикетсіозними і протозойними трансмісійними хворобами.

Прикладами вірусних хвороб, що передаються арбовірусами, тобто, артропонозними вірусами, є Конго-Кримська геморагічна лихоманка (CCHF), лихоманка, лихоманка паппатачі, енцефаліт, менінгіт, які викликаються сімейством буньявірусів (Bunyaviridae) такими як буньявірус (Bunyavirus), Nairovirus або Phlebovirus; катаральна лихоманка овець (Bluetongue), менінгоенцефаліт, лихоманка, геморагічна лихоманка, які викликаються родиною Reoviridae такими як орбівірус (Orbivirus), (Colitivirus); лихоманка, висип, енцефаліт, поліартрит, лімфаденіт, які викликаються родиною Togaviridae такими як Sindbisvirus, вірусний збудник хвороби чікунгунья (Chikungunya Virus); менінгоенцефаліт, що передається кліщами,

геморагічна форма лихоманки денге (Dengue hemorrhagic fever), енцефаліт, лихоманка, жовта лихоманка, які викликається флавівірусами (Flaviviridae) такими як флавівірус (Flavivirus) (включаючи різноманітні підгрупи).

Прикладами бактеріальних хвороб, що передаються паразитами, є рикетсіоз такий як плямиста лихоманка скелястих гір (Rocky Mountain spotted fever), кліщовий рикетсіоз, викликаний інфектуванням видами рикетсії (Rickettsia); туляремія (Tularemia), викликана інфектуванням збудником *Francisella tularensis*; борреліоз або спірохетоз такий як хвороба Лайма, або епідемічний поворотний тиф, викликаний інфектуванням видами боррелій (*Borrelia*); ерліхіоз (*Ehrlichiosis*), викликаний інфектуванням видами *Ehrlichia*; чума (Plague), викликана інфектуванням видами ієрсинії (*Yersinia*).

Прикладами хвороб, що викликаються найпростішими або рикетсіями є піроплазмоз (*Babesiosis*) такий як техаська лихоманка, гемоглобінурія, ку-лихоманка (Q-fever), викликана інфектуванням видами *Babesia*; тейлеріоз, такий як східно-берегова лихоманка, середньоземноморська лихоманка, викликана інфектуванням видами *Theileria*; нагана хвороба, сонна хвороба, викликані інфектуванням видами *Trypanosoma*, анаплазмоз, викликаний інфектуванням видами *Anaplasma*; малярія, викликана інфектуванням видами *Plasmodium*; лейшманіоз, викликаний інфектуванням видами *Leishmania*.

Хвороби, що передаються паразитами, є многочисельними і не обмежуються тільки вищезазначеними. Крім того, хвороби, викликані паразитами тварин, зокрема, ектопаразитами, міаз, викликаний паразитами такими як, наприклад, види *Lucilia*; короста, викликана паразитами такими як, наприклад, види *Sarcoptes* (*Sarcoptes*), види *Psoroptes*, види *Demodex*; педикульоз, викликаний паразитами такими як, наприклад *Mallophaga* (кусаючі воші) види *Bovicola* і *Anoplura* (сисні воші) види *Haematopinus*; алергічний блошиний дерматит, викликаний паразитами видів *Stenoccephalides*, видів *Pulex*; гіподерматоз, викликаний паразитами такими як, наприклад, види *Hypoderma*, види *Dermatobia*; іксодидіоз, викликаний паразитами такими як, наприклад, види *Ixodes*, види *Rhipicephalus*, види *Hyalomma*, види *Amblyomma*.

Відповідно до винаходу, термін "тварини" означає всі види тварин, поміж них також людей, домашніх тварин, традиційних хатніх тварин таких як, наприклад, собаки, коти, птахи для утримання у клітках, акваріумні рибки, не традиційних хатніх тварин таких як тхори, рептилії і екзотичні птахи, всі види піддослідних тварин таких як гризунів як, наприклад, щури і миші, хом'якові і морські свинки і сільськогосподарських тварин.

Прикладами сільськогосподарських тварин є велика рогата худоба, вівці, кози, коні, свині, віслюки, верблюди, буйволи, кролики, хутрові звірки такі як норка; домашня птиця, як курки, індик, качки, гуси; і інші сільськогосподарські тварини як медоносні бджоли.

Термін боротьба з паразитами тварин слід розуміти як знищення паразитів або запобігання зараженню паразитами. Термін знищення паразитів тварин слід розуміти як зменшення абсолютної кількості паразитів на або у тварині-хазяїні.

Сполуки або композиції відповідно до винаходу можуть вводитися за допомогою відомого шляху введення і у відповідній препаративній формі. Перевага надається ентеральному, парентеральному або зовнішньому шляху введення.

Зазвичай, при використанні для обробки тварин, активні сполуки формули (I) можуть застосовуватися безпосередньо. Переважно вони застосовуються як фармацевтичні композиції, які можуть містити фармацевтично прийнятні ексципієнти і/або допоміжні речовини, які є відомими в цій галузі.

У ветеринарній галузі і при утриманні тварин, активні сполуки застосовують (= вводять) відомим шляхом введення, ентеральним шляхом введення у формі, наприклад, таблеток, капсул, напоїв, примочок, гранул, паст, пілюль, способом наскрізного живлення, супозиторіїв; шляхом парентерального введення, таким як, наприклад, ін'єкції (внутрішньом'язові, підшкірні, внутрішньовенні, внутрішньочеревинні і т. і.), імплантанти, назальні введення, нанесення на шкіру у формі, наприклад, купання або занурення, розпилювання, наливання та нанесення, промивання, запилення та за допомогою формованих виробів, що містять активну сполуку, таких як нашийники, вушні бірки, хвостові бірки, пов'язки для кінцівок, повіді, прилади для маркування тощо. Активні сполуки можуть бути виготовлені як шампуні або як додатні композиції, які застосовують у вигляді аерозолів, спреїв, що знаходяться не під тиском, наприклад, пульверизаторів спреїв та розприскувачів спреїв.

Загалом, винахід може бути здійснений за допомогою способу, пристосованого до форми застосування або введення. Прийнятні форми включають аерозолі, спреї, що знаходяться не під тиском, наприклад, пульверизаторні спреї та спреї у розприскувачах, автоматичні прилади туманоутворення, аерозольні генератори, піни, гелі, автоматичні дрібно крапельні розбризкувачі, автоматичні вуалюючі системи, зволожувачі, піни, гелі, випарники з таблетками

випарника, виготовленими із целюлози або полімеру, рідкі випарники, гелеві і мембранні випарники, пропелерні випарники, що не потребують енергії (пасивні випарні системи).

Крім того, сполуки і композиції відповідно до винаходу можуть застосовуватися за допомогою внутрішньом'язових, підшкірних, внутрішньовенних, внутрішньочеревинних ін'єкцій, імплантантів або назального введення, нанесення на шкіру у формі, наприклад, купання або занурення, розпилювання, наливання та нанесення, промивання, запилення та за допомогою засобів, що містять активну сполуку, таких як нашійники, вушні бірки, хвостові бірки, пов'язки для кінцівок, повіді, прилади для маркування і тощо. Препаративними формами для введення сполук і композицій відповідно до винаходу ентеральним шляхом можуть бути таблетки, капсули, напої, примочки, гранули, пасти, пілюлі, спосіб наскрізного живлення, супозиторії.

Зокрема, сполуки і композиції відповідно до винаходу можуть бути виготовлені у вигляді звичайних препаративних форм. Для різноманітних шляхів введення, приклади препаративних форм включають розчини, емульсії, порошки, здатні до диспергування в воді, гранули, здатні до диспергування в воді, суспензії, дисти, піни, пасти, таблетки, гранули, аерозолі, природні та синтетичні речовини, збагачені активною сполукою, мікрокапсули, рецептури, що використовуються в камері згоряння (наприклад, обкурювальні та димлячі картриджі, банки та спіралі) та ультранизькі об'єми UVL (холодні аерозолі та гарячі аерозолі). Перевага надається порошкам, емульсіям, порошкам, здатним до диспергування в воді, гомогенним розчинам, концентратам емульсій, порошкам, здатним до диспергування в воді (WP) і суспензіям або концентратам суспензій. Особлива перевага надається способам застосування зазначених в цьому документі рецептур таким як наливання, нанесення, розпилення, вушним біркам і зануренням.

Кожна з цих рецептур може бути одержана за допомогою по суті відомих способів. Зазвичай, сполуку або композицію відповідно до винаходу змішують з агентами, що допомагають розповсюдженню, такими як рідкі розбавники або носії, розбавники або носії зрідженого газу, тверді розбавники або носії і, при необхідності, з поверхнево-активними речовинами такими як аніонні, катіонні і неіонні поверхнево-активні речовини такі як діоктил натрій сульфосукцинат і/або диспергувальні агенти. Крім агентів, що допомагають розповсюдженню, і присутніх, при необхідності, поверхнево-активних речовин і/або диспергувальних агентів, у рецептурі можуть бути представлені допоміжні компоненти, такі як емульгатори, піноутворювачі або агенти проти спінення такі як симетикон, консерванти, зв'язувальні речовини і/або барвники. Рецепттура активної речовини або композиції переважно містить а агент, що допомагає розповсюдженню, емульгатори і/або диспергувальні агенти, і/або піноутворювачі.

Приклади рідких розбавників або носіїв включають, але не обмежуються ними, ароматичні вуглеводні такі як ксилен, толуол, алкілнафтаден, хлоровані ароматичні або аліфатичні вуглеводні такі як хлорбензоли, етиленхлориди і метиленхлориди, аліфатичні вуглеводні такі як циклогексани, парафіни такі як фракції мінеральної олії, спирти такі як, наприклад, бензиловий спирт, ізопропанол, етанол, бутанол, гліколь і їх етери і естери, кетони такі як ацетон, метилетилкетон, метилізобутилкетон і циклогексанон, сильно полярні розчинники такі як диметилсульфоксид і диметилсульфоксид, циклічні карбонати такі як етиленкарбонат, пропіленкарбонат, піролідони такі як N-октилпіролідон, N-метилпіролідон, етери такі як монометилловий етер діетиленгліколю і монопропіловий етер діетиленгліколю, лактони такі як бутиролактон і вода.

Приклади розчинників або носіїв зрідженого газу включають, але не обмежуються ними, такі, що існують в газоподібному стані при нормальному тиску і рідкому при підвищеному тиску, як наприклад, аерозольні пропеленти такі як фуран, пропан, газоподібний азот, діоксид вуглецю і галогеновані вуглеводні.

Приклади твердих розбавників або носіїв включають, але не обмежуються ними, подрібнені природні мінерали такі як каолін, глина, тальк, крейда, кварц, аттапульгіт, монтморрілоніт або діатомову землю і подрібнені синтетичні матеріали такі як вискодисперсна кремнієва кислота, глинозем, силікат.

Приклади твердих носіїв для гранул включають, але не обмежуються ними, подрібнене та фракціоноване каміння таке як, наприклад, кальцит, мармур, пемза, сепіоліт, доломіт, синтетичні гранули неорганічних або органічних порошоків, органічні матеріали як, наприклад, ошурки, шкаралупи кокосового горіха, серцевина кукурудзяного початку, квітконіжка тютюну.

Приклади емульгаторів і/або піноутворювачів включають, але не обмежуються ними, неіонні або аніонні емульгатори як, наприклад, естери жирних кислот поліоксиетилену, етери жирних спиртів поліоксиетилену як, наприклад, алкіларилполігліколевий етер, алкілсульфонати, алкілсульфати, арилсульфонати і продукти гідролізу альбуміну.

Приклади сполук, із яких виготовляються формовані вироби, такі як, наприклад, нашійники і, які містять активні сполуки, включають, але не обмежуються ними, полівінілхлорид, поліамід, поліамід₆, поліамід_{6,6}, поліолефіни такі як високої густини поліетилен (HDPE), поліетилен, поліпропілен і етилен-пропілен-дієн-мономер (EPDM).

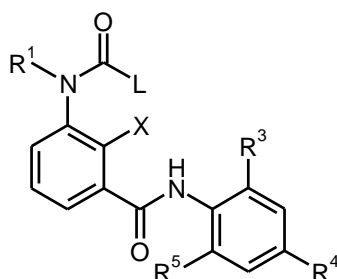
5 Приклади диспергантів включають, але не обмежуються ними, лігнінсульфітний луг, метилцелюлозу.

У композиціях використовуються зв'язувальні речовини, як наприклад, порошки, гранули і концентрати емульсій. Приклади зв'язувальних речовин включають, але не обмежуються ними, крохмалі, цукри, целюлозу або модифіковану целюлозу таку як карбоксиметилцелюлоза, гідроксипропілцелюлоза, лактоза або цукрові спирти як ксиліт, сорбіт або мальтіт, природні або синтетичні полімери такі як камедь, ксантан, полівініловий спирт і полівінілацетат.

10 Приклади барвників включають, але не обмежуються ними, неорганічні пігменти такі як оксид заліза, оксид титану і берлінська лазур, органічні барвники такі як алізарин, азобарвники або металевий фталоціаніновий барвник, і також, мічені живильні речовини такі як солі заліза, марганцю, бору, міді, кобальту, молібдену або цинку.

15 Рецептатура може містити сполуку відповідно до винаходу у кількості від 0,1 до 95 мас.% відносно загальної маси препарату, переважно від 0,5 до 90 мас.%, найбільш переважно від 0,8 до 70 мас.%.

Таблиця 1:



I-1

№	L	R ¹	R ³	R ⁴	R ⁵	X	Т.пл. (°C)
I-1-1	4-(трифторметил)піридин-3-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	176-179
I-1-2	4,6-дифторпіридин-3-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	181-182
I-1-3	6-хлорпіридин-3-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	237-238
I-1-4	6-хлорпіридин-3-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	H	
I-1-5	2-фторпіридин-3-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	102-105
I-1-6	2-хлорпіридин-3-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	121-124
I-1-7	2-бромпіридин-3-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	118-120
I-1-8	5-хлорпіридин-3-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	
I-1-9	2-метилпіридин-3-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	H	
I-1-10	2-метилпіридин-3-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	
I-1-11	піридин-3-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	H	
I-1-12	піридин-3-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	
I-1-13	3-хлор-5-(трифторметил)піридин-2-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	203-205
I-1-14	3,5-дихлорпіридин-2-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	
I-1-15	3-хлорпіридин-2-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	>250
I-1-16	3-(трифторметил)піридин-2-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	H	
I-1-17	3-(трифторметил)піридин-2-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	
I-1-18	піридин-2-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	H	
I-1-19	піридин-2-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	
I-1-20	2,6-дихлорпіридин-4-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	140-144
I-1-21	2-хлорпіридин-4-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	115-118
I-1-22	піридин-4-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	H	

Продовження таблиці 1

I-1-23	піридин-4-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	
I-1-24	2,5-дихлортіофен-3-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	90-94
I-1-25	2-хлортіофен-3-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	
I-1-26	тіофен-3-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	
I-1-27	5-хлортіофен-2-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	
I-1-28	3-хлортіофен-2-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	H	
I-1-29	3-хлортіофен-2-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	90-95
I-1-30	тіофен-2-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	182
I-1-31	тіофен-2-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	H	
I-1-32	фуран-2-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	97-99
I-1-33	фуран-2-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	H	
I-1-34	3-(трет-бутил)-1-метилпіразол-5-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	102-106
I-1-35	4-метил-1,2,3-тіадіазол-5-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	223-224
I-1-36	2-йодофеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	134-141
I-1-37	2-хлорфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	I	H	101-105
I-1-38	2-хлорфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ F ₅	H	91-96
I-1-39	4-(трифторметокси)феніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	153-155
I-1-40	2-бромфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	105-109
I-1-41	3-бромфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	164-167
I-1-42	4-бромфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	205-206
I-1-43	3,4-дихлорфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	133-135
I-1-44	2,4-дихлорфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	129-134
I-1-45	3,5-дихлорфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	175-176
I-1-46	2,6-дихлорфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	137-140
I-1-47	2,3-дихлорфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	123-128
I-1-48	2,5-дихлорфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	115-120
I-1-49	4-(трифторметил)феніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	195-197
I-1-50	3-(трифторметил)феніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	
I-1-51	2-(трифторметил)феніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	134-139
I-1-52	2,4,6-трифторфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	223-224
I-1-53	2-нітрофеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	110-115
I-1-54	2,6-дифторфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	118-121
I-1-55	2,3-дифторфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	165-167
I-1-56	2,4-дифторфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	187-188
I-1-57	2-хлорфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	114-120
I-1-58	3-хлорфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	162-165
I-1-59	4-хлорфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	163-168
I-1-60	4-метоксифеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	192-194
I-1-61	4-фторфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	174-176
I-1-62	3-фторфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	175-177
I-1-63	2-фторфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	164-166
I-1-64	4-метилфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	213-214
I-1-65	3-метилфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	
I-1-66	2-метилфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	106-112
I-1-67	феніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	
I-1-68	4-(трифторметокси)феніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	H	
I-1-69	2,3-дихлорфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	H	
I-1-70	2,5-дихлорфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	H	
I-1-71	4-(трифторметил)феніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	H	
I-1-72	2,6-дифторфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	H	145-148
I-1-73	2,3-дифторфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	H	
I-1-74	2,4-дифторфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	H	
I-1-75	2-хлорфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	H	141-145

Продовження таблиці 1

I-1-76	3-хлорфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	H	
I-1-77	4-хлорфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	H	ЯМР
I-1-78	4-етоксифеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	H	
I-1-79	4-(трифторметилтіо)феніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	H	
I-1-80	3-фторфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	H	
I-1-81	2-фторфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	H	
I-1-82	4-метилсульфінілфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	H	
I-1-83	4-(трифторметилсульфініл)феніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	H	
I-1-84	4-метилсульфонілфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	H	
I-1-85	4-(трифторметилсульфоніл)феніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	H	
I-1-86	2-метилфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	H	
I-1-87	феніл	H	CH ₃	C ₂ F ₅	CH ₃	H	
I-1-88	феніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	H	201-204
I-1-89	4-хлорфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	H	
I-1-90	2-фторфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH(CH ₃) ₂	H	
I-1-91	4-хлорфеніл	H	C ₂ H ₅	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	
I-1-92	2,6-дифторфеніл	H	C ₂ H ₅	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	
I-1-93	4-фторфеніл	H	Cl	SCF ₃	Cl	H	
I-1-94	3-фторфеніл	H	Cl	SC ₂ F ₅	Cl	H	
I-1-95	2-фторфеніл	H	Cl	SC ₃ F _{7-n}	Cl	H	
I-1-96	2-хлорфеніл	H	Cl	S(O)CF ₃	Cl	H	
I-1-97	3-хлорфеніл	H	Cl	S(O)C ₂ F ₅	Cl	H	
I-1-98	4-хлорфеніл	H	Cl	S(O)C ₃ F _{7-n}	Cl	H	
I-1-99	2,6-дифторфеніл	H	Cl	SO ₂ CF ₃	Cl	H	
I-1-100	2,3-дифторфеніл	H	Cl	SO ₂ S ₂ F ₅	Cl	H	
I-1-101	2,4-дифторфеніл	H	Cl	SO ₂ C ₃ F _{7-n}	Cl	H	
I-1-102	4-хлорфеніл	H	CH ₃	SCF ₃	CH ₃	H	
I-1-103	4-фторфеніл	H	CH ₃	SC ₂ F ₅	CH ₃	H	
I-1-104	2-фторфеніл	H	CH ₃	SC ₃ F _{7-n}	CH ₃	H	
I-1-105	2,4-дифторфеніл	H	CH ₃	SO ₂ C ₃ F _{7-n}	CH ₃	H	
I-1-106	4-метилтіофеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	H	
I-1-107	4-(трифторметил)піридин-3-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	F	
I-1-108	4,6-дифторпіридин-3-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	F	
I-1-109	6-хлорпіридин-3-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	F	
I-1-110	3-хлор-5-(трифторметил)піридин-2-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	F	
I-1-111	2-бромофеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	F	
I-1-112	3,4-дихлорфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	F	
I-1-113	2,4-дихлорфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	F	
I-1-114	2,6-дихлорфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	F	
I-1-115	2,3-дихлорфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	F	
I-1-116	2,5-дихлорфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	F	
I-1-117	3-(трифторметил)феніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	F	
I-1-118	2-(трифторметил)феніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	F	
I-1-119	2,4,6-трифторфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	F	
I-1-120	2-нітрофеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	F	
I-1-121	2,6-дифторфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	F	
I-1-122	2,3-дифторфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	F	
I-1-123	2,4-дифторфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	F	
I-1-124	2-хлорфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	F	

Продовження таблиці 1

I-1-125	3-хлорфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	F	
I-1-126	4-хлорфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	F	
I-1-127	3-фторфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	F	
I-1-128	2-фторфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	F	
I-1-129	2,3-дихлорфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	F	
I-1-130	2,5-дихлорфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	F	
I-1-131	2,6-дифторфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	F	
I-1-132	2,3-дифторфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	F	
I-1-133	2,4-дифторфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	F	
I-1-134	2-хлорфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	F	193-194
I-1-135	3-хлорфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	F	
I-1-136	3-фторфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	F	
I-1-137	2-фторфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	F	
I-1-138	2-метилфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	F	
I-1-139	4-хлорфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	F	183-184
I-1-140	3,5-дихлорфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	Cl	
I-1-141	4-бромфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	Cl	
I-1-142	2-хлорфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	Cl	>250
I-1-143	2-хлорфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	CH ₃	>250
I-1-144	3-метокси-5-(трифторметил)тіофен-2-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	230-231
I-1-145	5-хлор-1-метил-3-(трифторметил)піразол	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	101-106
I-1-146	4-бром-1-етил-3-метилпіразол-5-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	91-97
I-1-147	5-метилізоксазол-4-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	216-217
I-1-148	ізоксазол-5-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	91-99
I-1-149	2-хлорпіридин-3-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	H	120-124
I-1-150	6-фторпіридин-3-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	211-213
I-1-151	6-фторпіридин-3-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	H	>250
I-1-152	3-гідроксипіридин-2-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	228-230
I-1-153	4-(трифторметил)піридин-2-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	H	>250
I-1-154	6-хлор-4-(трифторметил)піридин-3-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	223-227
I-1-155	(E)-пропеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	H	ЯМР
I-1-156	2-хлорциклогекс-1-ен-1-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	H	ЯМР
I-1-157	метиліденциклогексан-2-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	ЯМР
I-1-158	(Z)-2-фторстирол-2-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	ЯМР
I-1-159	(E)-бут-2-ен-2-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	ЯМР
I-1-160	(Z)-бут-2-ен-2-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	ЯМР
I-1-161	(E)-1-хлоретен-1-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	ЯМР
I-1-162	циклопропіл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	ЯМР
I-1-163	(E)-2-метилстирол-2-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	ЯМР
I-1-164	(E)-бут-2-ен-2-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	H	ЯМР
I-1-165	(E)-бут-2-ен-2-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	ЯМР
I-1-166	(E)-пент-2-ен-2-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	ЯМР
I-1-167	циклогексен-1-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	ЯМР
I-1-168	циклопентен-1-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	ЯМР
I-1-169	(E)-пент-2-ен-2-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	H	ЯМР
I-1-170	циклогексен-1-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	H	ЯМР
I-1-171	(E)-бут-2-ен-2-іл	H	I	CF(CF ₃) ₂	I	H	ЯМР
I-1-172	(E)-бут-2-ен-2-іл	H	I	CF ₃	I	H	ЯМР
I-1-173	2-фторфеніл	H	I	CF(CF ₃) ₂	I	H	ЯМР
I-1-174	2-фторфеніл	H	Br	CF(CF ₃) ₂	Br	H	ЯМР

Продовження таблиці 1

I-1-175	феніл	H	I	CF(CF ₃) ₂	I	H	ЯМР
I-1-176	2-хлорпіридин-5-іл	H	I	CF(CF ₃) ₂	I	H	ЯМР
I-1-177	циклопентен-1-іл	H	I	CF(CF ₃) ₂	I	H	ЯМР
I-1-178	2-фторфеніл	H	I	CF(CF ₃) ₂	Br	H	ЯМР
I-1-179	1-метоксиіміноетанал-1-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	74-77
I-1-180	2-хлорфеніл	H	CH ₃	SC ₃ F ₇	CH ₃	H	108-112
I-1-181	2-фторфеніл	H	CH ₃	SC ₃ F ₇	CH ₃	H	162-163
I-1-182	2,6-дифторфеніл	H	CH ₃	SC ₃ F ₇	CH ₃	H	105-110
I-1-183	2,5-дифторфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	170-175
I-1-184	2-фторфеніл	H	C ₂ H ₅	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	185-186
I-1-185	2,6-дифторфеніл	H	C ₂ H ₅	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	202-203
I-1-186	2-фторфеніл	H	CH ₃	SCF ₃	C ₂ H ₅	H	75-78
I-1-187	2-фторфеніл	H	CH ₃	SC ₂ F ₅	C ₂ H ₅	H	83-89
I-1-188	2-хлор-6-фторфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	ЯМР
I-1-189	2-фторфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	ЯМР
I-1-190	2-етилфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	119-122
I-1-191	феніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	F	194-195
I-1-192	2-хлорфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	F	201-202
I-1-193	3-хлорфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	F	86-89
I-1-194	4-хлорфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	F	100-103
I-1-195	2-фторфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	F	161-163
I-1-196	3-фторфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	F	125-129
I-1-197	4-фторфеніл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	F	169-173
I-1-198	3-фторфеніл	H	C ₂ H ₅	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	184-186
I-1-199	4-фторфеніл	H	C ₂ H ₅	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	180-183
I-1-200	4-фторфеніл	H	CH ₃	SC ₃ F ₇	C ₂ H ₅	H	181-182
I-1-201	2-фторфеніл	H	CH ₃	S(=O)CH ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	H	121-125
I-1-202	2-фторфеніл	H	CH ₃	S(=O) ₂ CH ₂ CF ₃	C ₂ H ₅	H	108-114
I-1-203	2-фторфеніл	H	I	CF ₃	CF ₃	H	234-236
I-1-204	феніл	H	I	CF ₃	CF ₃	H	234-235
I-1-205	феніл	H	Br	Br	Br	H	248-250
I-1-206	4-хлорфеніл	H	I	CF ₃	I	H	ЯМР
I-1-207	2-фторфеніл	H	I	CF ₃	I	H	243-245
I-1-208	2-фторпіридин-3-іл	H	I	CF ₃	I	H	ЯМР
I-1-209	піридин-3-іл	H	I	CF(CF ₃) ₂	I	H	ЯМР
I-1-210	піридин-2-іл	H	I	CF(CF ₃) ₂	I	H	213-217
I-1-211	4-хлорфеніл	H	I	CF ₃	CF ₃	H	ЯМР
I-1-212	4-хлорфеніл	H	Br	Br	CF ₃	H	242-244
I-1-213	2-фторфеніл	H	Br	SF ₅	Br	H	231-232
I-1-214	2-бромфуран-5-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	102-107
I-1-215	2-хлортіофен-5-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	183-185
I-1-216	3-хлортіофен-2-іл	H	C ₂ H ₅	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	92-98
I-1-217	2-хлортіофен-5-іл	H	C ₂ H ₅	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	195-198
I-1-218	3-метилтіофен-2-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	89-97
I-1-219	тіофен-2-іл	H	C ₂ H ₅	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	245-247
I-1-220	тіофен-2-іл	H	CH ₃	SC ₃ F ₇	C ₂ H ₅	H	92-97
I-1-221	тіофен-2-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	H	184-188
I-1-222	тіофен-3-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	167-170
I-1-223	фуран-3-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	153-156
I-1-224	фуран-2-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	H	80-84
I-1-225	2,3-дибромфуран-5-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	172-176
I-1-226	форміл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	H	86-90
I-1-227	4-метил-1,2,3-тіадіазол-5-іл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	H	230-232
I-1-228	форміл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	ОН	185-190

Продовження таблиці 1

I-1-229	форміл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	F	70-74
I-1-230	форміл	H	C ₂ H ₅	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	229-231
I-1-231	форміл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	221-220
I-1-232	форміл	H	CH ₃	SC ₃ F ₇	C ₂ H ₅	H	139-141
I-1-233	форміл	H	I	CF(CF ₃) ₂	I	H	238
I-1-234	форміл	H	I	CF(CF ₃) ₂	n-C ₃ H ₇	H	208-210
I-1-235	форміл	H	Br	CF(CF ₃) ₂	n-C ₃ H ₇	H	201-203
I-1-236	форміл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	H	H	160-161
I-1-237	форміл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	Br	H	209-211
I-1-238	2-фторфеніл	H	I	CF(CF ₃) ₂	n-C ₃ H ₇	H	87-90
I-1-239	форміл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	I	H	190-192
I-1-240	форміл	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	Cl	H	211-213
I-1-241	форміл	H	Cl	CF(CF ₃) ₂	Cl	H	213-214
I-1-242	форміл	H	Cl	CF(CF ₃) ₂	n-C ₃ H ₇	H	192-193
I-1-243	феніл	H	I	CF(CF ₃) ₂	n-C ₃ H ₇	H	131-137
I-1-244	4-ціанофеніл	H	I	CF(CF ₃) ₂	n-C ₃ H ₇	H	125-131
I-1-245	2-хлорпіридин-3-іл	H	I	CF(CF ₃) ₂	n-C ₃ H ₇	H	119-124
I-1-246	2-хлорпіридин-3-іл	H	CH ₃	CH(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	1,4991(nD)
I-1-247	2-фторпіридин-3-іл	H	CH ₃	CH(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	164-169
I-1-248	2-фторфеніл	H	CH ₃	CH(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	198-201
I-1-249	феніл	H	CH ₃	CH(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	182-186
I-1-250	4-нітрофеніл	H	CH ₃	CH(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	174-179
I-1-251	2,5-дифторфеніл	H	CH ₃	CH(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	177-181
I-1-252	піридин-3-іл	H	CH ₃	CH(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	1,4910(nD)
I-1-253	2-хлорпіридин-5-іл	H	CH ₃	CH(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	1,5005(nD)
I-1-254	4-трифторметил-піридин-3-іл	H	CH ₃	CH(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	1,4629(nD)
I-1-255	C ₂ H ₅	H	I	CF(CF ₃) ₂	I	H	>250
I-1-256	I-C ₃ H ₇	H	I	CF(CF ₃) ₂	I	H	>250
I-1-257	4-фторбензил	H	I	CF(CF ₃) ₂	I	H	>250
I-1-258	n-C ₃ H ₇	H	I	CF(CF ₃) ₂	I	H	>250
I-1-259	втор-C ₄ H ₉	H	I	CF(CF ₃) ₂	I	H	>250
I-1-260	i-C ₄ H ₉	H	I	CF(CF ₃) ₂	I	H	>250
I-1-261	Cl(CH ₂) ₃	H	I	CF(CF ₃) ₂	I	H	235-236
I-1-262	феніл	H	I	COC ₂ H ₅ (CF ₃) ₂	I	H	144-154
I-1-263	2-фторфеніл	H	I	COC ₂ H ₅ (CF ₃) ₂	I	H	1,5503(nD)
I-1-264	3-фторфеніл	H	I	COC ₂ H ₅ (CF ₃) ₂	I	H	138-145
I-1-265	2-фторпіридин-3-іл	H	I	COC ₂ H ₅ (CF ₃) ₂	I	H	1,5515(nD)
I-1-266	2-хлорпіридин-3-іл	H	I	COC ₂ H ₅ (CF ₃) ₂	I	H	1,5305(nD)
I-1-267	2-хлорпіридин-5-іл	H	I	C(OC ₂ H ₅)(CF ₃) ₂	I	H	140-145
I-1-268	2,6-дихлорпіридин-3-іл	H	I	C(OC ₂ H ₅)(CF ₃) ₂	I	H	1,5200(nD)
I-1-269	Cl(CH ₂) ₂	H	I	CF(CF ₃) ₂	n-C ₃ H ₇	H	216-217
I-1-270	2-хлорпіридин-5-іл	H	I	C(OCH ₃)(CF ₃) ₂	I	H	1,5032(nD)
I-1-271	Cl(CH ₂) ₂	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	I	H	>250
I-1-272	Cl(CH ₂) ₂	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	Cl	H	>250

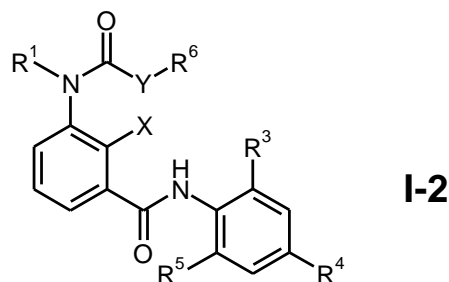
Продовження таблиці 1

I-1-273	$\text{Cl}(\text{CH}_2)_2$	H	Br	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	Br	H	>250
I-1-274	феніл	H	Br	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	SCF_3	H	81-87
I-1-275	2-хлорпіридин-3-іл	H	CH_3	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	CH_3	F	1,4907 (nD)
I-1-276	$\text{Cl}(\text{CH}_2)_2$	H	CH_3	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	CH_3	H	ЯМР
I-1-277	2-фторпіридин-3-іл	H	CH_3	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	CH_3	H	170-172
I-1-278	2-фторпіридин-5-іл	H	CH_3	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	C_2H_5	F	179-180
I-1-279	2-хлорпіридин-5-іл	H	CH_3	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	C_2H_5	F	214-215
I-1-280	2-фторпіридин-3-іл	H	I	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	C_2H_5	H	98-100
I-1-281	2-фторпіридин-3-іл	H	I	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	C_2H_5	H	99-105
I-1-282	2-фторпіридин-3-іл	H	Br	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	C_2H_5	H	101-103
I-1-283	2-фторпіридин-3-іл	H	I	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	I	H	121-124
I-1-284	2-хлор-4-нітрофеніл	H	I	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	CH_3	H	141-143
I-1-285	2-хлор-3-нітрофеніл	H	I	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	CH_3	H	139-143
I-1-286	2-хлор-4-амінофеніл	H	I	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	CH_3	H	137-139
I-1-287	2-хлор-3-амінофеніл	H	I	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	CH_3	H	159-162
I-1-288	2-фторфеніл	піридин-3-іл-метил	CH_3	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	C_2H_5	H	197-199
I-1-289	2-хлорпіридин-3-іл	піридин-3-іл-метил	CH_3	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	C_2H_5	H	184-186
I-1-290	2-фторфеніл	2-фторбензил	CH_3	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	C_2H_5	H	226
I-1-291	2-хлорпіридин-3-іл	2-фторбензил	CH_3	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	C_2H_5	H	197-198
I-1-292	2-фторфеніл	2-хлорпіридин-3-іл-метил	CH_3	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	C_2H_5	H	151-162
I-1-293	4-нітрофеніл	2-хлорпіридин-3-іл-метил	CH_3	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	C_2H_5	H	1,4963 (nD)
I-1-294	4-хлор-феніл	2-хлорпіридин-3-іл-метил	CH_3	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	C_2H_5	H	125-127
I-1-295	2-фторфеніл	піридин-2-іл-метил	CH_3	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	C_2H_5	H	220-222
I-1-296	4-нітрофеніл	піридин-3-іл-метил	CH_3	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	C_2H_5	H	93-96
I-1-297	4-хлор-феніл	піридин-3-іл-метил	CH_3	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	C_2H_5	H	158-160
I-1-298	4-фторфеніл	піридин-3-іл-метил	CH_3	$\text{CF}(\text{CF}_3)_2$	C_2H_5	H	185-187

Продовження таблиці 1

I-1-299	3-фторфеніл	піридин -3-іл- метил	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	195-196
I-1-300	2,6-дифторфеніл	піридин -3-іл- метил	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	202-203
I-1-301	2,5-дифторфеніл	піридин -3-іл- метил	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	190-192
I-1-302	2-фторпіридин-3-іл	піридин -3-іл- метил	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	81-83
I-1-303	феніл	піридин -3-іл- метил	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	209-210
I-1-304	(E)-бут-2-ен-2-іл	піридин -3-іл- метил	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	150-152
I-1-305	C ₂ H ₅	піридин -3-іл- метил	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	127-134
I-1-306	2-фторпіридин-3-іл	піридин -3-іл- метил	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	207-208
I-1-307	4-ціанофеніл	піридин -3-іл- метил	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	H	228-230
I-1-308	феніл	піридин -3-іл- метил	I	CF(CF ₃) ₂	I	H	178-181
I-1-309	3-фторфеніл	піридин -3-іл- метил	I	CF(CF ₃) ₂	I	H	1,5662 (nD)
I-1-310	4-фторфеніл	піридин -3-іл- метил	I	CF(CF ₃) ₂	I	H	1,5135 (nD)
I-1-311	4-нітрофеніл	піридин -3-іл- метил	I	CF(CF ₃) ₂	I	H	128-130
I-1-312	3-фторфеніл	піридин -3-іл- метил	Br	CF(CF ₃) ₂	Br	H	187-190
I-1-313	феніл	піридин -3-іл- метил	Br	CF(CF ₃) ₂	Br	H	204-205
I-1-314	2-хлорпіридин-3-іл	піридин -3-іл- метил	Br	CF(CF ₃) ₂	Br	H	1,4947 (nD)
I-1-315	2-фторпіридин-3-іл	CH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	F	
I-1-316	4-ціанофеніл	CH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	F	

Таблиця 2



№	R ¹	R ³	R ⁴	R ⁵	Y	R ⁶	X	Т.пл. (°C)
I-2-1	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	O	CH ₂ CCl ₃	F	96-98
I-2-2	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	O	CH ₂ CCl ₃	H	165-170
I-2-3	піридин-3-іл-метил	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	O	CH ₂ CCl ₃	H	194-196
I-2-4	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	O	C ₂ H ₅	H	1,4712 (nD)
I-2-5	H	CH ₃	CH(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	O	i-C ₃ H ₇	H	186-190
I-2-6	H	I	CF(CF ₃) ₂	I	O	C ₂ H ₅	H	170-176
I-2-7	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	O	CH ₂ CCl ₃	H	ЯМР
I-2-8	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	O	C ₂ H ₅	H	ЯМР
I-2-9	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	O	i-C ₃ H ₇	H	ЯМР
I-2-10	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	O	CH ₂ CF ₃	H	ЯМР
I-2-11	H	I	CF(CF ₃) ₂	I	O	CH ₂ CCl ₃	H	ЯМР
I-2-12	2-фторбензил	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	O	CH ₂ CCl ₃	H	182-185
I-2-13	(2-хлорпіридин-3-іл)метил	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	O	CH ₂ CCl ₃	H	1,4907 (nD)
I-2-14	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	O	CH ₃	H	195-197
I-2-15	піридин-3-іл-метил	I	CF(CF ₃) ₂	I	O	C ₂ H ₅	H	1,5360 (nD)
I-2-16	H	I	COC ₂ F ₅ (CF ₃) ₂	I	O	C ₂ H ₅	H	157-161
I-2-17	CH ₃	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	NCH ₃	CH ₃	H	137-140
I-2-18	піридин-3-іл-метил	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	C ₂ H ₅	NCH ₃	CH ₃	H	102-105
I-2-19	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	O	CH(CH ₂ F) ₂	F	
I-2-20	H	CH ₃	CF(CF ₃) ₂	CH ₃	O	(CH ₂) ₂ Cl	F	

№	ЯМР дані
I-1-77	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ: 2,36 (6H, c), 7,36 (2H, шс), 7,46-7,95 (8H, м), 7,96 (1H, шс), 8,27 (1H, шс)
I-1-155	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ: 1,93-1,94 (3H, м), 2,34 (6H, c), 5,93-5,99 (1H, м), 7,00-7,03 (1H, м), 7,35 (2H, c), 7,44-7,47 (2H, м), 7,69-7,72 (3H, м), 8,26 (1H, c).
I-1-156	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ: 1,68-1,73 (4H, м), 2,28 (6H, c), 2,41-2,43 (4H, м), 7,32 (2H, c), 7,40 (1H, т), 7,67-7,71 (2H, м), 7,97-8,00 (2H, м), 8,22 (1H, c).
I-1-157	¹ H-ЯМР (ацетон-d ₆) δ: 1,16-1,21 (3H, м), 1,64-1,74 (4H, м), 2,36-2,46 (5H, м), 2,75-2,81 (6H, м), 6,04-6,05 (1H, м), 7,41-7,44 (3H, м), 7,68-7,70 (1H, м), 7,94-7,97 (1H, м), 8,30-8,30 (1H, м), 9,19-9,22 (1H, м).
I-1-158	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ: 1,21-1,25 (3H, м), 2,32 (3H, c), 2,66-2,68 (2H, м), 7,06 (1H, д), 7,36-7,51 (6H, м), 7,68-7,80 (5H, м), 8,28 (2H, c).
I-1-159	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ: 1,22 (4H, т), 1,83-1,87 (3H, м), 2,17 (3H, c), 2,35 (3H, c), 2,69-2,71 (2H, м), 6,57-6,60 (1H, м), 7,37 (2H, c), 7,49-7,51 (1H, м), 7,59 (1H, c), 7,69-7,71 (3H, м), 8,23 (1H, c).
I-1-160	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ: 1,20-1,24 (3H, м), 1,82-1,96 (6H, м), 2,30 (3H, c), 2,67 (2H, кв), 5,73-5,75 (1H, м), 7,38-7,41 (3H, м), 7,69-7,72 (3H, м), 8,03 (1H, c), 8,26 (1H, c).
I-1-161	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ: 1,24-1,27 (3H, м), 2,31 (3H, шс), 2,65-2,68 (2H, м), 6,31 (1H, д), 7,34-

№	ЯМР дані
	7,38 (3H, м), 7,63-7,67 (1H, м), 7,74-7,78 (1H, м), 8,00-8,03 (1H, м), 8,16-8,19 (1H, м), 8,40-8,43 (1H, м).
I-1-162	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ: 0,89-0,91 (2H, м), 1,11-1,12 (2H, м), 1,22 (3H, т), 2,34 (3H, с), 2,68-2,70 (2H, м), 7,36 (2H, с), 7,47-7,49 (1H, м), 7,62-7,68 (4H, м), 8,20 (1H, с).
I-1-163	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ: 1,17 (3H, т), 2,16 (3H, с), 2,27 (3H, с), 2,65 (2H, кв), 7,30-7,43 (9H, м), 7,64-7,66 (1H, м), 7,76-7,79 (1H, м), 7,98 (1H, с), 8,06 (1H, с), 8,24 (1H, с).
I-1-164	¹ H-ЯМР (ацетон-d ₆) δ: 1,41-1,44 (3H, м), 1,55-1,55 (3H, м), 2,01 (8H, с), 6,19-6,22 (1H, м), 7,07-7,10 (3H, м), 7,36-7,38 (1H, м), 7,61-7,64 (1H, м), 7,96-7,97 (1H, м), 8,77 (1H, с), 8,87 (1H, с).
I-1-165	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ: 1,86-1,88 (3H, м), 1,99-1,99 (3H, м), 2,36 (5H, с), 2,72 (3H, кв), 6,63-6,65 (1H, м), 7,31-7,33 (1H, м), 7,38 (2H, с), 7,72-7,82 (3H, м), 8,52-8,52 (1H, м).
I-1-166	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ: 1,09-1,11 (3H, м), 1,21-1,24 (3H, м), 1,97 (3H, д), 2,24-2,26 (2H, м), 2,35 (3H, с), 2,69-2,71 (2H, м), 6,45-6,49 (1H, м), 7,49-7,62 (7H, м), 8,23 (1H, с).
I-1-167	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ: 1,20-1,25 (3H, м), 1,64-1,74 (4H, м), 2,24-2,26 (2H, м), 2,35-2,37 (2H, м), 2,70 (2H, кв), 6,80 (1H, с), 7,36 (2H, с), 7,47-7,49 (1H, м), 7,57 (1H, с), 7,71 (3H, дд), 8,23 (1H, с).
I-1-168	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ: 1,22 (3H, т), 2,06-2,08 (2H, м), 2,34 (3H, с), 2,56-2,58 (2H, м), 2,67-2,71 (4H, м), 6,72 (1H, с), 7,36 (2H, с), 7,49-7,52 (2H, м), 7,67-7,76 (3H, м), 8,24 (1H, с).
I-1-169	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ: 1,09 (3H, т), 1,96 (3H, с), 2,17-2,27 (2H, м), 2,34 (6H, с), 6,46-6,47 (1H, м), 7,35 (2H, с), 7,47 (1H, т), 7,67-7,70 (3H, м), 7,78 (1H, с), 8,24 (1H, с).
I-1-170	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ: 1,66-1,74 (4H, м), 2,25-2,37 (4H, м), 6,78-6,82 (1H, м), 7,35 (2H, с), 7,47-7,50 (1H, м), 7,57 (1H, с), 7,68-7,70 (2H, м), 7,79 (1H, с), 8,25 (1H, с).
I-1-171	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ: 1,81-1,83 (3H, м), 1,94 (3H, с), 6,56-6,58 (1H, м), 7,44 (1H, т), 7,70-7,80 (2H, м), 8,09 (2H, с), 8,22-8,22 (1H, м), 8,29 (1H, с).
I-1-172	¹ H-ЯМР (ацетон-d ₆) δ: 1,88-1,91 (3H, м), 2,03-2,04 (3H, м), 6,56-6,58 (1H, м), 7,45-7,50 (1H, м), 7,78-7,80 (1H, м), 8,01-8,02 (1H, м), 8,27-8,28 (2H, м), 8,36 (1H, д), 9,15 (1H, с), 9,73 (1H, с).
I-1-173	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ: 7,20-7,30 (3H, м), 7,49-7,54 (2H, м), 7,79-7,92 (2H, м), 8,11-8,14 (3H, м), 8,31-8,34 (2H, м), 8,65-8,70 (1H, м).
I-1-174	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ: 7,20-7,28 (3H, м), 7,45-7,55 (2H, м), 7,76-7,92 (3H, м), 8,10-8,13 (1H, м), 8,32-8,32 (2H, м), 8,65-8,71 (1H, м).
I-1-175	¹ H-ЯМР (ацетон-d ₆) δ: 6,89-6,92 (2H, м), 7,20-7,57 (7H, м), 8,21-8,39 (3H, м), 9,45-9,48 (1H, м).
I-1-176	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ: 7,47-7,59 (2H, м), 7,78-7,80 (1H, м), 7,96-7,99 (2H, м), 8,08-8,12 (2H, м), 8,18-8,27 (3H, м), 8,88-8,92 (1H, м).
I-1-177	¹ H-ЯМР (ацетон-d ₆) δ: 1,87-2,66 (6H, м), 6,69-6,70 (1H, м), 7,42-8,32 (6H, м), 9,12 (1H, с), 9,69 (1H, с).
I-1-178	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ: 7,19-7,37 (2H, м), 7,52-7,60 (2H, м), 7,80-7,91 (4H, м), 8,12-8,17 (2H, м), 8,33-8,36 (1H, м), 8,61-8,66 (1H, м).
I-1-188	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ: 1,23 (3H, т), 2,36 (3H, с), 2,71 (2H, кв), 7,12 (1H, т), 7,27-7,44 (4H, м), 7,51-7,61 (2H, м), 7,69-7,77 (2H, м), 7,84 (1H, д), 8,30 (1H, с).
I-1-189	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ: 1,23 (3H, т), 2,32 (3H, с), 2,68 (2H, кв), 7,18-7,26 (1H, м), 7,34 (1H, т), 7,45 (2H, с), 7,50-7,62 (3H, м), 7,73 (1H, д), 7,87 (1H, д), 8,15-8,21 (1H, м), 8,33 (1H, с), 8,63 (1H, д).
I-1-206	¹ H-ЯМР (DMCO-d ₆) δ: 7,53-7,63 (3H, м), 7,82 (1H, д), 8,01-8,07 (3H, м), 8,29 (2H, с), 8,35 (1H, с), 10,53 (1H, с), 10,59 (1H, с).
I-1-208	¹ H-ЯМР (DMCO-d ₆) δ: 7,50-7,60 (2H, м), 7,82 (1H, д), 7,97 (1H, д), 8,32-8,24 (4H, м), 8,41 (1H, д), 10,62 (1H, с), 10,80 (1H, с).
I-1-209	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ: 7,45 (1H, дд), 7,55 (1H, т), 7,78 (1H, д), 7,96 (1H, д), 8,02 (1H, с), 8,09 (2H, с), 8,22 (1H, д), 8,32 (2H, д), 8,78 (1H, д), 9,14 (1H, с).
I-1-276	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ: 2,35 (6H, с), 2,59 (2H, т, J=6,6 Гц), 3,67 (2H, т, J=6,6 Гц), 7,28-7,54 (5H, м), 7,65-7,77 (2H, м), 8,17 (1H, шс).
I-1-211	¹ H-ЯМР (DMCO-d ₆) δ: 7,55-7,64 (3H, м), 7,83 (1H, д), 8,09-8,02 (3H, м), 8,30 (2H, с), 8,37 (1H, с), 10,54 (1H, с), 10,60 (1H, с).
I-2-7	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ: 2,35 (6H, с), 4,85 (2H, с), 7,16 (1H, шс), 7,35 (2H, шс), 7,46-7,69 (4H, м), 8,05 (1H, шс).
I-2-8	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ: 1,33 (3H, т), 2,35 (6H, с), 4,25 (2H, кв), 6,75 (1H, шс), 7,35 (2H, шс), 7,41-7,64 (4H, м), 8,02 (1H, шс).

№	ЯМР дані
I-2-9	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ: 1,32 (6H, т), 2,35 (6H, с), 5,04 (1H, сеп), 6,68 (1H, шс), 7,27-7,65 (6H, м), 8,03 (1H, шс)
I-2-10	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ: 2,32 (6H, с), 4,57 (2H, кв), 7,10 (1H, шс), 7,35 (2H, шс), 7,42-7,69 (4H, м), 8,00 (1H, шс)
I-2-11	¹ H-ЯМР (CDCl ₃) δ: 4,84 (2H, с), 7,38-7,41 (1H, м), 7,48-7,50 (1H, м), 7,71-7,73 (2H, м), 8,04-8,08 (4H, м).

Представлений винахід надалі буде описаний у наступних прикладах. Однак, ці приклади не призначені для обмеження рамок представленої заявки.

Приклад № 1

5 Voophilus microplus - тест (ін'єкція)

Розчинник: диметилсульфоксид

Для одержання прийнятного препарату активної сполуки, 10 мг активної сполуки розчиняли у 0,5 мл розчинника і концентрат розбавляли водою до досягнення бажаної концентрації.

10 П'ять насмоктаних крові дорослих форм особин жіночої статі тіксів (Voophilus microplus) ін'єктували у черевце розчином сполуки. Тіксів переносили до чашок Петрі і інкубували у камері для кліматичних досліджень протягом проміжку часу. Після відкладання яєць спостерігали за яйцями, здатними уворювати личинки.

Після певного періоду часу, визначали у % смертність. 100 % означає, що всі яйця нежиттєздатні; 0 % означає, що всі яйця здатні уворювати личинки.

15 У цьому тесті, наприклад, наступні сполуки із прикладів одержання, демонстрували високу активність у розмірі ≥ 80 % при дозуванні 20 мкг/тварина:

20 Номер Прикладу I-1-5, I-1-6, I-1-7, I-1-15, I-1-20, I-1-24, I-1-29, I-1-30, I-1-32, I-1-35, I-1-36, I-1-39, I-1-40, I-1-41, I-1-42, I-1-43, I-1-44, I-1-45, I-1-46, I-1-49, I-1-51, I-1-52, I-1-54, I-1-55, I-1-56, I-1-57, I-1-58, I-1-59, I-1-60, I-1-61, I-1-62, I-1-63, I-1-64, I-1-66, I-1-72, I-1-75, I-1-77, I-1-88, I-1-134, I-1-139, I-1-149, I-1-150, I-1-151, I-1-154, I-1-155, I-1-156, I-1-157, I-1-158, I-1-159, I-1-160, I-1-161, I-1-162, I-1-163, I-1-164, I-1-165, I-1-166, I-1-167, I-1-168, I-1-169, I-1-170, I-1-171, I-1-173, I-1-174, I-1-175, I-1-176, I-1-177, I-1-178, I-1-179, I-1-180, I-1-181, I-1-182, I-1-183, I-1-184, I-1-185, I-1-186, I-1-187, I-1-188, I-1-189, I-1-190, I-1-191, I-1-192, I-1-193, I-1-194, I-1-195, I-1-196, I-1-197, I-1-198, I-1-199, I-1-200, I-1-201, I-1-202, I-1-203, I-1-204, I-1-205, I-1-206, I-1-207, I-1-208, I-1-209, I-1-210, I-1-211, I-1-212, I-1-213, I-1-214, I-1-215, I-1-216, I-1-217, I-1-218, I-1-219, I-1-221, I-1-222, I-1-223, I-1-224, I-1-225, I-1-226, I-1-227, I-1-228, I-1-229, I-1-230, I-1-231, I-1-233, I-1-234, I-1-235, I-1-236, I-1-237, I-1-238, I-1-239, I-1-240, I-1-241, I-1-242, I-1-243, I-1-244, I-1-245, I-1-246, I-1-247, I-1-248, I-1-249, I-1-250, I-1-251, I-1-252, I-1-253, I-1-254, I-1-255, I-1-256, I-1-257, I-1-258, I-1-259, I-1-260, I-1-261, I-1-262, I-1-263, I-1-264, I-1-265, I-1-266, I-1-267, I-1-268, I-1-269, I-1-270, I-1-271, I-1-272, I-1-273, I-1-274, I-1-275, I-1-276, I-1-277, I-1-278, I-1-279, I-1-280, I-1-281, I-1-282, I-1-283, I-1-284, I-1-285, I-1-286, I-1-287, I-1-288, I-1-289, I-1-290, I-1-291, I-1-292, I-1-293, I-1-294, I-1-295, I-1-296, I-1-297, I-1-298, I-1-299, I-1-300, I-1-301, I-1-302, I-1-303, I-1-304, I-1-305, I-1-306, I-1-307, I-1-308, I-1-309, I-1-310, I-1-311, I-1-312, I-1-313, I-1-314, I-2-1, I-2-2, I-2-3, I-2-4, I-2-5, I-2-6, I-2-7, I-2-8, I-2-17, I-2-18

35 Приклад № 2

Stenoccephalides felis - тест (СТЕСФЕ)

Розчинник: диметилсульфоксид

40 Для одержання прийнятного препарату активної сполуки, 10 мг активної сполуки розчиняли у 0,5 мл розчинника і концентрат розбавляли кров'яною кров'ю до досягнення бажаної концентрації.

45 Приблизно від 10 до 15 негодованих дорослих форм (Stenoccephalides felis) поміщали до камер для блох. Камеру для крові, з дном, запечатаним парафіном, заповнювали кров'яною кров'ю, доповненою розчином сполуки і поміщали у верхню частину камери для блох, таким чином, щоб блохи змогли ссати кров. Камеру для крові нагрівали до 37 °C, при цьому камеру для блох тримали при кімнатній температурі.

Після певного проміжку часу, визначали в % смертність. 100 % означає, що всі блохи були знищені; 0 % означає, що ні однієї блохи не було знищено.

У цьому тесті, наприклад, наступні сполуки із прикладів одержання продемонстрували високу активність у розмірі ≥ 80 % при застосуванні дозування 100 м.ч.:

50 Номер прикладу I-1-5, I-1-6, I-1-7, I-1-30, I-1-32, I-1-35, I-1-36, I-1-40, I-1-42, I-1-46, I-1-49, I-1-51, I-1-52, I-1-54, I-1-55, I-1-56, I-1-57, I-1-59, I-1-61, I-1-62, I-1-63, I-1-66, I-1-72, I-1-75, I-1-88, I-1-134, I-1-139, I-1-149, I-1-150, I-1-151, I-1-155, I-1-156, I-1-159, I-1-162, I-1-164, I-1-165, I-1-166, I-1-167, I-1-168, I-1-169, I-1-170, I-1-171, I-1-173, I-1-174, I-1-175, I-1-176, I-1-177, I-1-178, I-1-180, I-1-

181, I-1-182, I-1-183, I-1-184, I-1-185, I-1-186, I-1-187, I-1-188, I-1-189, I-1-191, I-1-192, I-1-193, I-1-194, I-1-195, I-1-196, I-1-197, I-1-198, I-1-199, I-1-200, I-1-201, I-1-203, I-1-204, I-1-206, I-1-207, I-1-208, I-1-209, I-1-210, I-1-211, I-1-212, I-1-213, I-1-214, I-1-217, I-1-218, I-1-219, I-1-220, I-1-221, I-1-222, I-1-223, I-1-224, I-1-226, I-1-227, I-1-229, I-1-230, I-1-231, I-1-233, I-1-234, I-1-235, I-1-238, I-1-241, I-1-242, I-1-243, I-1-244, I-1-245, I-1-246, I-1-247, I-1-248, I-1-249, I-1-250, I-1-251, I-1-252, I-1-253, I-1-254, I-1-255, I-1-256, I-1-257, I-1-258 I-1-259, I-1-260, I-1-261, I-1-262, I-1-263, I-1-264, I-1-265, I-1-266, I-1-267, I-1-269, I-1-271, I-1-274, I-1-275, I-1-276, I-1-277, I-1-278, I-1-279, I-1-280, I-1-281, I-1-282, I-1-283, I-1-284, I-1-287, I-1-288, I-1-289, I-1-292, I-1-293, I-1-295, I-1-296, I-1-297, I-1-298, I-1-299, I-1-300, I-1-301, I-1-302, I-1-304, I-1-306, I-1-307, I-1-308, I-1-309, I-1-310, I-1-311, I-1-312, I-1-313, I-1-314, I-2-1, I-2-2, I-2-4, I-2-5, I-2-6, I-2-7, I-2-8

Приклад № 3

Lucilia cuprina - тест

Розчинник: диметилсульфоксид

Для одержання прийнятного препарату активної сполуки, 10 мг активної сполуки розчиняли у 0,5 мл розчинника і концентрат розбавляли водою до досягнення бажаної концентрації.

Приблизно 20-30 (личинок *Lucilia cuprina*) переносили до пробірки, що містить 1 см³ конячого фаршу і 0,5 мл водного розчину сполуки, що тестують.

Після певного проміжку часу, визначали в % смертність. 100 % означає, що всі личинки були знищені; 0 % що ні однієї личинки не було знищено.

У цьому тесті, наприклад, наступні сполуки із прикладів одержання продемонстрували високу активність у розмірі ≥ 80 % при застосуванні дозування 100 м.ч.:

Номер прикладу I-1-5, I-1-6, I-1-7, I-1-15, I-1-24, I-1-29, I-1-30, I-1-32, I-1-35, I-1-36, I-1-39, I-1-40, I-1-41, I-1-42, I-1-43, I-1-44, I-1-45, I-1-46, I-1-49, I-1-51, I-1-52, I-1-54, I-1-55, I-1-56, I-1-57, I-1-58, I-1-59, I-1-60, I-1-61, I-1-62, I-1-63, I-1-64, I-1-66, I-1-72, I-1-75, I-1-77, I-1-88, I-1-134, I-1-139, I-1-149, I-1-150, I-1-151, I-1-154, I-1-155, I-1-156, I-1-159, I-1-160, I-1-164, I-1-165, I-1-166, I-1-167, I-1-168, I-1-170, I-1-171, I-1-173, I-1-174, I-1-175, I-1-176, I-1-177, I-1-178, I-1-179, I-1-180, I-1-181, I-1-182, I-1-183, I-1-184, I-1-185, I-1-186, I-1-187, I-1-188, I-1-189, I-1-190, I-1-191, I-1-192, I-1-193, I-1-194, I-1-195, I-1-196, I-1-197, I-1-198, I-1-199, I-1-200, I-1-204, I-1-206, I-1-207, I-1-208, I-1-209, I-1-210, I-1-211, I-1-213, I-1-214, I-1-215, I-1-216, I-1-218, I-1-219, I-1-220, I-1-221, I-1-222, I-1-223, I-1-224, I-1-225, I-1-226, I-1-227, I-1-229, I-1-230, I-1-231, I-1-232, I-1-233, I-1-234, I-1-235, I-1-237, I-1-238, I-1-239, I-1-240, I-1-241, I-1-242, I-1-243, I-1-244, I-1-245, I-1-246, I-1-247, I-1-248, I-1-249, I-1-250, I-1-251, I-1-252, I-1-255, I-1-256, I-1-257, I-1-258 I-1-259, I-1-260, I-1-261, I-1-262, I-1-263, I-1-264, I-1-265, I-1-266, I-1-267, I-1-268, I-1-269, I-1-270, I-1-271, I-1-272, I-1-273, I-1-274, I-1-275, I-1-276, I-1-277, I-1-278, I-1-279, I-1-280, I-1-281, I-1-282, I-1-283, I-1-284, I-1-285, I-1-286, I-1-287, I-1-288, I-1-289, I-1-291, I-1-292, I-1-293, I-1-294, I-1-295, I-1-296, I-1-297, I-1-298, I-1-299, I-1-300, I-1-301, I-1-302, I-1-303, I-1-304, I-1-306, I-1-308, I-1-309, I-1-310, I-1-311, I-1-312, I-1-313, I-1-314, I-2-1, I-2-2, I-2-3, I-2-4, I-2-5, I-2-6, I-2-7, I-2-8

Приклад № 4

Муха домашня (*Musca domestica*) - тест

Розчинник: диметилсульфоксид

Для одержання прийнятного препарату активної сполуки, 10 мг активної сполуки розчиняли у 0,5 мл розчинника і концентрат розбавляли водою до досягнення бажаної концентрації.

Перед дослідженням, шматок або кухонну губку просочували сумішшю цукру і розчину сполуки і поміщали до контейнера. 10 дорослих форм (*Musca domestica*) поміщали всередину контейнера і закривали перфорованою кришкою.

Після певного проміжку часу, визначали в % смертність. 100 % означає, що всі личинки були знищені; 0 % що ні однієї личинки не було знищено.

У цьому тесті, наприклад, наступні сполуки із прикладів одержання продемонстрували високу активність у розмірі ≥ 80 % при застосуванні дозування 100 м.ч.:

Номер прикладу I-1-5, I-1-6, I-1-7, I-1-32, I-1-44, I-1-52, I-1-54, I-1-62, I-1-63, I-1-72, I-1-75, I-1-139, I-1-173, I-1-174, I-1-175, I-1-176, I-1-177, I-1-178, I-1-185, I-1-191, I-1-193, I-1-194, I-1-195, I-1-196, I-1-197, I-1-199, I-1-208, I-1-209, I-1-210, I-1-222, I-1-229, I-1-238, I-1-243, I-1-244, I-1-245, I-1-246, I-1-247, I-1-255, I-1-258, I-1-260, I-1-261, I-1-262, I-1-263, I-1-264, I-1-265, I-1-266, I-1-267, I-1-269, I-1-271, I-1-274, I-1-275, I-1-277, I-1-278, I-1-279, I-1-280, I-1-281, I-1-282, I-1-283, I-1-284, I-1-285, I-1-288, I-1-289, I-1-292, I-1-300, I-1-302, I-1-306, I-1-308, I-1-309, I-1-310, I-1-311, I-1-312, I-1-313, I-1-314, I-2-1, I-2-2, I-2-3, I-2-4, I-2-6, I-2-7

Приклад № 5

Voorphilus microplus (занурення)

Розчинник: диметилсульфоксид

Для одержання прийнятного препарату активної сполуки, 10 мг активної сполуки розчиняли

у 0,5 мл розчинника і концентрат розбавляли водою до досягнення бажаної концентрації.

Від восьми до десяти насмоктаних крові дорослих форм особин жіночої статі тіксів *Boophilus microplus* поміщали до перфорованих пластикових посудин і занурювали у водний розчин сполуки протягом однієї хвилини. Тіксів переносили на фільтрувальний папір до пластмасового

планшету і інкубували у камері для кліматичних досліджень протягом проміжку часу. Після відкладання яєць спостерігали за яйцями, здатними уворювати личинки.

Після певного періоду часу, визначали у % смертність. 100 % означає, що всі яйця нежиттєздатні; 0 % означає, що всі яйця здатні уворювати личинки.

У цьому тесті, наприклад, наступні сполуки із прикладів одержання продемонстрували високу активність у розмірі ≥ 80 % при застосуванні дозування 100 м.ч.:

Приклад № I-1-5, I-1-6, I-a-54, I-1-192, I-1-194, I-1-195, I-1-238, I-1-245, I-1-246, I-1-260, I-1-274, I-1-275, I-1-278, I-1-280, I-1-281, I-1-282, I-1-283

Приклад № 6

Amblyomma hebraeum - тест (AMBYHE)

Розчинник: диметилсульфоксид

Для одержання прийнятого препарату активної сполуки, 1 масову частину активної сполуки змішували з встановленою кількістю розчинника і концентрат розбавляли розчинником до досягнення бажаної концентрації.

Німфів тіксів *Amblyomma hebraeum* поміщали до перфорованих пластикових посудин і занурювали у водний розчин сполуки протягом однієї хвилини. Тіксів переносили на фільтрувальний папір до чашки Петрі і інкубували у камері для кліматичних досліджень протягом 42 днів.

Після певного проміжку часу, визначали в % смертність. 100 % означає, що всі тікси були знищені; 0 % що ні одного з тіксів не було знищено.

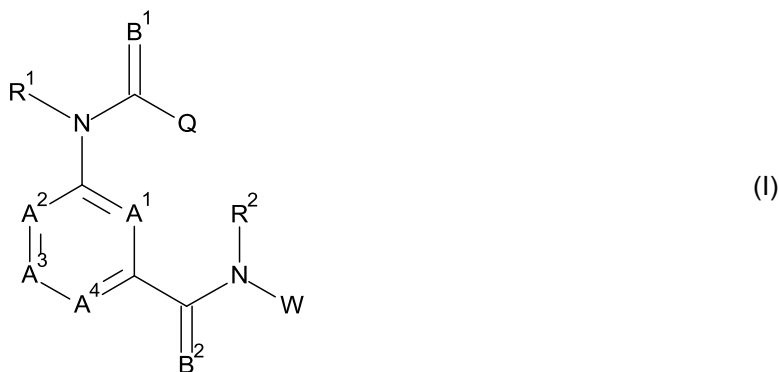
У цьому тесті, наприклад, наступні сполуки із прикладів одержання продемонстрували високу активність у розмірі ≥ 80 % при застосуванні дозування 100 м.ч.:

Приклад № I-1-5, I-1-280, I-1-281, I-1-282

Якщо не вказано інакше тестовані сполуки або композиції вводили у прийнятній рецептурі.

ФОРМУЛА ВИНАХОДУ

1. Застосування похідної амінобензаміду формули (I) або її солі



де
A¹ означає C-X, де X означає атом водню або атом галогену;

A², A³ і A⁴ означають CH;

B¹ і B² означають атом кисню;

R¹ означає атом водню, C₁-C₆алкільну групу, бензильну групу, необов'язково заміщену атомом галогену; або піридилметил, необов'язково заміщений атомом галогену;

R² означає атом водню;

Q означає L або Y-R⁶,

де

Y означає кисень або C₁-C₄аміноалкіл; і

R⁶ означає C₁-C₆алкільну групу або C₁-C₆галогеналкільну групу;

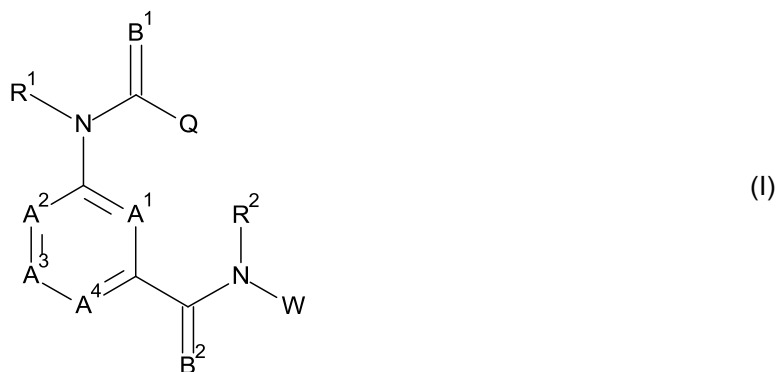
L означає феноільну групу, необов'язково заміщену атомом галогену, C₁-C₄алкільною групою, C₁-C₄галогеналкільною групою, C₁-C₃алкоксигрупою, C₁-C₃галогеналкоксигрупою, C₁-

С₃алкілтіогрупою, ціаногрупою або нітрогрупою, 6-членну ароматичну гетероциклічну групу з гетероатомами, що вибрані з групи, яка включає N, S та O, необов'язково заміщену атомом галогену, С₁-С₄алкільною групою, С₁-С₄галогеналкільною групою або С₁-С₃алкоксигрупою, С₁-С₆алкільною групою або С₂-С₆алкенільною групою, необов'язково заміщену атомом галогену або фенольною групою, С₃-С₈циклоалкільною групою, С₃-С₈циклоалкенільною групою, С₁-С₆альдегідну групу або С₁-С₆алкоксііміноальдегідну групу;

W означає фенільну групу або заміщену фенільну групу, що має один або більше замісників, які можуть бути однаковими або відмінними і які вибирають з атома галогену, С₁-С₄алкільної групи, С₁-С₄галогеналкільної групи, С₁-С₄галогеналкілС₁-С₄алкоксигрупи, С₁-С₃галогеналкілтіогрупи, С₁-С₃галогеналкілсульфінільної групи, С₁-С₃галогеналкілсульфонільної, або SF₅-групу;

для боротьби з акаридами, що вибрані з групи, яка включає *Amblyomma americanum*, *Dermacentor variabilis*, *Dermacentor reticulatus* та *Rhipicephalus sanguineus*.

2. Застосування фармацевтичної композиції, що містить щонайменше одну похідну амінобензаміду формули (I) або її сіль



де значення замісників є такими, як вказано в п. 1,

для запобігання інфікуванню хворобами, що передаються акаридами, що вибрані з групи, яка включає *Amblyomma americanum*, *Dermacentor variabilis*, *Dermacentor reticulatus* та *Rhipicephalus sanguineus*.