



УКРАЇНА

(19) UA (11) 86251 (13) C2

(51) МПК (2009)

C07D 249/14 (2006.01)

A01N 43/653 (2006.01)

A01P 7/00

A01P 5/00

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

(54) ПОХІДНЕ 3-ТРИАЗОЛІЛСУЛЬФІДУ І ІНСЕКТИЦИД, АКАРИЦИД АБО НЕМАТОЦИД, ЩО МІСТЯТЬ ЙОГО ЯК АКТИВНИЙ ІНГРЕДІЄНТ

1

2

(21) а200702646

(22) 20.10.2005

(24) 10.04.2009

(86) PCT/JP2005/019315, 20.10.2005

(31) 2004-305251

(32) 20.10.2004

(33) JP

(46) 10.04.2009, Бюл.№ 7, 2009 р.

(72) ТОРІЯБЕ КЕЙДЖІ, ЯМАГУЧІ МІКІО, ІТОУ  
ЙОШІГІРО, КІНПАРА ШІОРИ, ЯНО ГІРОЮКІ, ТАКА-  
ГАШІ САТОРУ, ЙОНЕКУРА НОРИГІСА, ГАМАГУЧІ  
РЮДЖІ(73) КУМІАЙ КЕМІКАЛ ІНДАСТРІ КО., ЛТД., ІХАРА  
КЕМІКАЛ ІНДАСТРІ КО., ЛТД.

(56) EP 1 076 053, A, 14.02.2001

DE 19548415, A, 26.06.1997

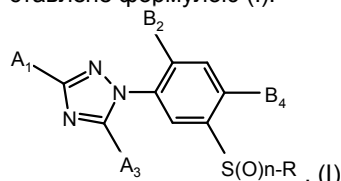
JP 2000239262, A, 05.09.2000 (abstract)

JP 7258227, A, 09.10.1995 (abstract)

JP 2091061, A, 30.03.1990 (abstract)

JP 2091062, A, 30.03.1990 (abstract)

EP 0 285 893, A, 12.10.1988

(57) 1. Похідне 3-триазолілфенілсульфіду, пред-  
ставлене формулою (I):де R являє собою циклопропілметильну групу або  
трифторетильну групу;

n являє собою ціле число від 0 до 1;

A<sub>1</sub> вибрано з групи, що складається з групи I, а A<sub>3</sub>  
вибрано з групи II;B<sub>2</sub> являє собою атом водню, атом галогену або  
метильну групу; аB<sub>4</sub> являє собою атом галогену, ціаногрупу або ме-  
тильну групу (яка може бути моно- або полізамі-  
щена атомами галогену);за умови, що, коли A<sub>3</sub> являє собою NH<sub>2</sub>, B<sub>2</sub> являє  
собою атом галогену або метильну групу;

група I:

алкільна група C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> (яка може бути моно- або  
полізаміщена атомами галогену, ціаногрупами,  
нітрогрупами), циклоалкільна група C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> (яка мо-  
же бути заміщена метальною групою), алкенільна  
група (яка може бути моно- або полізаміщена ато-  
мами галогену або ціаногрупами), алкінільна група  
C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> (яка може бути моно- або полізаміщена ато-  
мами галогену або ціаногрупами), алкоксильна  
група C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> (яка може бути моно- або полізаміще-  
на атомами галогену, ціаногрупами, алкоксикар-  
бонільними групами C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub> або алкоксильними гру-  
пами C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), алкілтіогрупа C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> (яка може бути  
моно- або полізаміщена атомами галогену, алкок-  
сильними групами C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, циклоалкільними групами  
C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, які можуть бути заміщені атомами галогену  
або ціаногрупами), алкілсульфінільна група C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>  
(яка може бути моно- або полізаміщена атомами  
галогену, алкоксильними групами C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, циклоал-  
кільними групами C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, які можуть бути заміщені  
атомами галогену або ціаногрупами), алкілсуль-  
фонільна група C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> (яка може бути моно- або  
полізаміщена атомами галогену, алкоксильними  
групами C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> або циклоалкільними групами C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>,  
які можуть бути заміщені атомами галогену), алкі-  
нілтіогрупа C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> (яка може бути моно- або полі-  
заміщена атомами галогену, алкоксильними гру-  
пами C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> або ціаногрупами), алкінілсульфінільна  
група C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> (яка може бути моно- або полізаміще-  
на атомами галогену, алкоксильними групами C<sub>1</sub>-  
C<sub>3</sub> або ціаногрупами), ацильна група C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub> і гало-  
геналкілкарбонільна група C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>;

група II:

нітрогрупа, ціаногрупа, група -N=CR<sub>1</sub>R<sub>2</sub>, група -  
N=C(NR<sub>2</sub>R<sub>3</sub>)NR<sub>2</sub>R<sub>3</sub>, група -N=(SO<sub>2</sub>R<sub>2</sub>)R<sub>3</sub>, група -  
N(OR<sub>3</sub>)R<sub>3</sub>', група -C(=O)OR<sub>2</sub>, група -C(=Q)NR<sub>2</sub>R<sub>3</sub>,  
група -SO<sub>2</sub>NR<sub>2</sub>R<sub>3</sub>, група-NR<sub>2</sub>R<sub>3</sub>, група-N(COR<sub>2</sub>)R<sub>3</sub> і  
група -N(COOR<sub>2</sub>)R<sub>3</sub>;

де R<sub>2</sub> являє собою атом водню, алкільну групу C<sub>1</sub>-  
C<sub>6</sub> (яка може бути моно- або полізаміщена атома-  
ми галогену, ціаногрупами), алкінільну групу C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>,  
аміногрупу, моноалкіламіногрупу C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, діалкіламі-  
ногрупу C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>;

R<sub>3</sub> являє собою атом водню, алкільну групу C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>;

(13) C2

(11) 86251

(19) UA

Q являє собою атом кисню.

2. Похідне 3-триазолілфенілсульфіду за п.1, відповідно до якого R являє собою трифторетильну групу;

n являє собою ціле число від 0 до 1;

A<sub>1</sub> являє собою алкільну групу C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену або ціаногрупами), алкілтіогрупу C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену) або алкілсульфінільну групу C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену);

A<sub>3</sub> являє собою групу -NR<sub>2</sub>R<sub>3</sub> або групу -N(COR<sub>2</sub>)R<sub>3</sub>;

кожний з R<sub>2</sub> і R<sub>3</sub>, які є незалежними один від одного, являє собою атом водню, алкіламіногрупу C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, алкільну групу C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену або ціаногрупами) або алкілсульфінільну групу C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, за умови, що R<sub>2</sub> і R<sub>3</sub> не є одночасно атомами водню;

B<sub>2</sub> являє собою атом водню, атом галогену або метильну групу, а

B<sub>4</sub> являє собою ціаногрупу або метильну групу (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену).

3. Похідне 3-триазолілфенілсульфіду за п.1, відповідно до якого R являє собою трифторетильну групу;

n являє собою ціле число від 0 до 1;

A<sub>1</sub> являє собою алкільну групу C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену або ціаногрупами), алкілтіогрупу C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену) або алкілсульфінільну групу C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену);

A<sub>3</sub> являє собою аміногрупу;

B<sub>2</sub> являє собою атом галогену або метильну групу; а

B<sub>4</sub> являє собою ціаногрупу або металеву групу (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену).

4. Похідне 3-триазолілфенілсульфіду за п.2, відповідно до якого A<sub>1</sub> являє собою ізопропільну групу, трет.-бутильну групу, трифторметильну групу, трифторметилтіогрупу, 2,2,2-трифторетилтіогрупу, пентафторетилтіогрупу, трифторметилсульфінільну групу або 2,2,2-трифторетилсульфінільну групу, а

A<sub>3</sub> являє собою метиламіногрупу, етиламіногрупу, ціанометиламіногрупу, пропаргіламіногрупу, ацетиламіногрупу, пропіонаміногрупу, трифторацетиламіногрупу або дифторацетиламіногрупу.

5. Похідне 3-триазолілфенілсульфіду за п.3, відповідно до якого A<sub>1</sub> являє собою ізопропільну групу, трет.-бутильну групу, трифторметильну групу, трифторметилтіогрупу, 2,2,2-трифторетилтіогрупу, пентафторетилтіогрупу, трифторметилсульфінільну групу або 2,2,2-трифторетилсульфінільну групу, а

A<sub>3</sub> являє собою аміногрупу.

6. Похідне 3-триазолілфенілсульфіду за п.2, відповідно до якого A<sub>1</sub> являє собою трифторметильну групу, трифторметилтіогрупу або 2,2,2-трифторетилсульфінільну групу, а

A<sub>3</sub> являє собою метиламіногрупу або трифторацетиламіногрупу.

7. Інсектицид, акарицид або нематодцид, призначений для застосування в сільськогосподарських і плодово-овочевих культурах, що містить похідне 3-триазолілфенілсульфіду, як це визначено в будь-якому із зазначених вище пп.1-6, як активний інгредієнт.

Даний винахід відноситься до нових похідних 3-триазолілфенілсульфіду і до інсектицидів, акарицидів і нематодцидів, які містять ці похідні як активний інгредієнт і які призначені для застосування в сільськогосподарських і плодово-овочевих культурах.

Похідні 3-триазолілфенілсульфіду, що використовуються як відомі інсектициди, акарициди і нематодциди, як це описано в патентному документі 1, вже відомі. Розкрито, що група сполук, як вона описана в цьому документі, демонструє високий акарицидний ефект при розприскуванні їх безпосередньо на рослини. Проте цей документ не розкриває застосування цих сполук для обробки ґрунту. Група сполук, як вона розкрита в цьому документі, має недостатній ступінь міграції в ґрунт і інфільтрації в рослини при обробці ґрунту. Відповідно, у деяких випадках не можна досягти достатньо високого акарицидного ефекту внаслідок нерівномірного обприскування хімічними продуктами, їх недостатньої транспірації, фотолізу, а також внаслідок вимивання хімічних продуктів дощем і тому подібне.

В даний час відома дуже невелика кількість акарицидів, які мають активність при практичній обробці ґрунту. Хімічні продукти, придатні для обробки ґрунту, є переважними для фермерських господарств, тому що вони мають перевагу над іншими внаслідок більшої безпеки, більшої економії трудових витрат і тому подібне. Відповідно, потребується розробка акарицидів, які мають активність при обробці ґрунту.

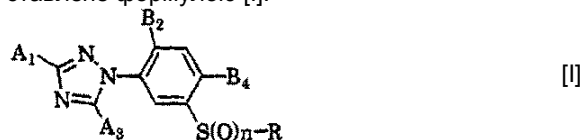
При даних обставинах метою даного винаходу є вирішення зазначених вище проблем, пов'язаних з застосуванням відомих інсектицидів, акарицидів і нематодцидів, і створення інсектицидів, акарицидів і нематодцидів, які демонструють чудові характеристики щодо безпеки використання, пестицидної дії, залишкової ефективності і тому подібне.

Авторами даного винаходу були синтезовані різноманітні похідні 3-триазолілфенілсульфіду і досліджена їхня фізіологічна активність з метою розробки інсектицидів, акарицидів і нематодцидів, які мають зазначені вище переважні характеристики. В результаті ними було встановлено, що похідні 3-триазолілфенілсульфіду у відповідності до даного винаходу (далі іменованих іноді сполуками у

відповідності до даного винаходу), які представлені нижче, проявляють визначний ефект при боротьбі з різноманітними комахами-шкідниками сільськогосподарських і плодово-овочевих культур, особливо з кліщами, зокрема з кліщами, представленими кліщиком павутинним двоплямистим, кліщиком павутинним Kanzawa і кліщиком павутинним цитрусовим, з комахами-шкідниками лускокрилими, представленими міллю капустяною, вогнівою стеблінною рисовою азіатською і совою малою, з комахами-шкідниками (справжніми) напівжорсткокрилими, представленими дельфацидом рисовим коричневим, цикадкою рисовою листяною і попелицею бавовняною, з комахами-шкідниками твердокрилими, представленими зернівою квасольовою адзукі, і з нематодами, представленими нематодою яванською галовою південною, і мають активність при обробці ґрунту, при якій стає можливим безпечно застосування і економія трудових витрат.

Таким чином, даний винахід забезпечує наступне.

(1) Похідне 3-тріазолілфенілсульфіду, представлене формулою [I]:



де R являє собою циклопропілметильну групу або трифторетильну групу;

n являє собою ціле число від 0 до 1;

A<sub>1</sub> і A<sub>3</sub> вибрані з груп, що складаються з групи I і групи II, за умови, що, щонайменше, одна з них вибрана з груп, що складають групу II;

B<sub>2</sub> являє собою атом водню, атом галогену або метильну групу; а

B<sub>4</sub> являє собою атом галогену, ціаногрупу, нітрогрупу або алкільну групу C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену);

за умови, що, коли A<sub>3</sub> являє собою NH<sub>2</sub>, B<sub>2</sub> являє собою атом галогену або метильну групу:

(група I)

атом водню, атом галогену, алкільна група C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену, гідроксильними групами, ціаногрупами, алкоксикарбонільними групами C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub> або алкоксильними групами C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), циклоалкільна група C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> (яка може бути моно- або полізаміщена алкільними групами, атомами галогену, ціаногрупами або алкоксильними групами C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), алкенільна група C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену або ціаногрупами), алкінільна група C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену або ціаногрупами), алкоксильна група C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену, ціаногрупами, алкоксикарбонільними групами C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub> або алкоксильними групами C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>), алкілтіогрупа C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену, алкоксильними групами C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, циклоалкільними групами C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, які можуть бути заміщені атомами галогену або ціаногрупами), алкілсульфонільна група C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену, алкокси-

льними групами C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, циклоалкільними групами C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, які можуть бути заміщені атомами галогену або ціаногрупами), алкілсульфонільна група C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену, алкоксильними групами C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> або циклоалкільними групами C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, які можуть бути заміщені атомами галогену), алкінілтіогрупа C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену, алкоксильними групами C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> або ціаногрупами), алкінілсульфонільна група C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену, алкоксильними групами C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> або ціаногрупами), ацильна група C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub> і галогеналкілкарбонільна група C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>;

(група II)

нітрогрупа, ціаногрупа, група -N=CR<sub>1</sub>R<sub>2</sub>, група -N=C(NR<sub>2</sub>'R<sub>3</sub>')NR<sub>2</sub>R<sub>3</sub>, група -N=(SO<sub>2</sub>R<sub>2</sub>)R<sub>3</sub>, група -N(OR<sub>3</sub>)R<sub>3</sub>', група -C(=O)OR<sub>2</sub>, група -C(=Q)NR<sub>2</sub>R<sub>3</sub>, група -SO<sub>2</sub>NR<sub>2</sub>R<sub>3</sub>, група -NR<sub>2</sub>R<sub>3</sub>, група -N(COR<sub>2</sub>)R<sub>3</sub> і група -N(COOR<sub>2</sub>)R<sub>3</sub>;

де R<sub>1</sub> являє собою атом водню, алкільну групу C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену, гідроксильними групами, ціаногрупами, алкоксикарбонільними групами C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub> або алкоксильними групами C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), алкенільну групу C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену або ціаногрупами), алкінільну групу C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену або ціаногрупами), циклоалкільну групу C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену, гідроксильними групами, ціаногрупами, алкоксикарбонільними групами C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub> або алкоксильними групами C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), арилалкільну групу (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену, ціаногрупами, алкільними групами C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, галогеналкільними групами C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, алкоксикарбонільними групами C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub> або алкоксильними групами C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), гетероарилалкільну групу (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену, ціаногрупами, алкільними групами C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, галогеналкільними групами C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, алкоксикарбонільними групами C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub> або алкоксильними групами C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), арильну групу (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену, ціаногрупами, алкільними групами C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, галогеналкільними групами C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, алкоксикарбонільними групами C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub> або алкоксильними групами C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), алкоксильну групу C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, алкілтіогрупу C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, аміногрупу, моноалкіламіногрупу C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> або діалкіламіногрупу C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>;

кожний з R<sub>2</sub> і R<sub>2</sub>' являє собою атом водню, алкільну групу C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену, гідроксильними групами, ціаногрупами, алкоксикарбонільними групами C<sub>2</sub>-C<sub>7</sub> або алкоксильними групами C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>), алкенільну групу C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену або ціаногрупами), алкінільну групу C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену або ціаногрупами), циклоалкільну групу C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> (яка може бути

моно- або полізаміщена атомами галогену, гідроксильними групами, ціаногрупами, алкоксикарбонільними групами  $C_2-C_7$  або алкоксильними групами  $C_1-C_6$ , аміногрупу, моноалкіламіногрупу  $C_1-C_6$ , діалкіламіногрупу  $C_2-C_{12}$ , арилалкільную групу (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену, ціаногрупами, алкільними групами  $C_1-C_6$ , галогеналкільними групами  $C_1-C_6$ , алкоксикарбонільними групами  $C_2-C_7$  або алкоксильними групами  $C_1-C_6$ ), гетероарилалкільную групу (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену, ціаногрупами, алкільними групами  $C_1-C_6$ , галогеналкільними групами  $C_1-C_6$ , алкоксикарбонільними групами  $C_2-C_7$  або алкоксильними групами  $C_1-C_6$ ), арильную групу (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену, ціаногрупами, алкільними групами  $C_1-C_6$ , галогеналкільними групами  $C_1-C_6$ , алкоксикарбонільними групами  $C_2-C_7$  або алкоксильними групами  $C_1-C_6$ ), алкенільну групу  $C_3-C_6$  (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену або ціаногрупами), алкінільну групу  $C_3-C_6$  (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену або ціаногрупами) або циклоалкільную групу  $C_3-C_6$  (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену, гідроксильними групами, ціаногрупами, алкоксикарбонільними групами  $C_2-C_7$  або алкоксильними групами  $C_1-C_6$ ); а

кожний з  $R_3$  і  $R_3'$  являє собою атом водню, алкільную групу  $C_1-C_6$  (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену, гідроксильними групами, ціаногрупами, алкоксикарбонільними групами  $C_2-C_7$  або алкоксильними групами  $C_1-C_6$ ), алкенільну групу  $C_3-C_6$  (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену або ціаногрупами), алкінільну групу  $C_3-C_6$  (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену або ціаногрупами) або циклоалкільную групу  $C_3-C_6$  (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену, гідроксильними групами, ціаногрупами, алкоксикарбонільними групами  $C_2-C_7$  або алкоксильними групами  $C_1-C_6$ ); а

Q являє собою атом кисню або атом сірки; за умови, що  $R_1$  і  $R_2$  в групі  $-N=CR_1R_2$  можуть утворювати 5- - 6-членне кільце разом з атомом вуглецю, до якого вони прив'язані,

$R_2$  і  $R_3$ , або  $R_2'$  і  $R_3'$  в групі  $-N=C(NR_2R_3')NR_2R_3$  можуть утворювати 5- - 6-членне кільце разом з атомом азоту, до якого вони прив'язані, а

$R_2$  і  $R_3$  в групі  $-NR_2R_3$  можуть утворювати 5- - 6-членне кільце разом з атомом азоту, до якого вони прив'язані.

(2) Похідне 3-тріазолілфенілсульфіду у відповідності до зазначеного вище пункту (1), де R являє собою трифторетильну групу;

n являє собою ціле число від 0 до 1;

$A_1$  являє собою алкільную групу  $C_1-C_6$  (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену або ціаногрупами), алкілтіогрупу  $C_1-C_6$  (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену) або алкілсульфінільну групу  $C_1-C_6$  (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену або алкоксильними групами  $C_1-C_3$ );

$A_3$  являє собою групу  $-NR_2R_3$  або групу  $-N(COR_2)R_3$ ;

кожний з  $R_2$  і  $R_3$ , які є незалежними один від одного, являє собою атом водню, алкіламіногрупу  $C_1-C_6$ , алкільную групу  $C_1-C_6$  (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену або ціаногру-

пами) або алкінільну групу  $C_3-C_6$  (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену або ціаногрупами), за умови, що  $R_2$  і  $R_3$  не є одночасно атомами водню;

$B_2$  являє собою атом водню, атом галогену або метильну групу, а

$B_4$  являє собою ціаногрупу або алкільную групу  $C_1-C_6$  (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену).

(3) Похідне 3-тріазолілфенілсульфіду у відповідності до зазначеного вище пункту (1), де R являє собою трифторетильну групу;

n являє собою ціле число від 0 до 1;

$A_1$  являє собою алкільную групу  $C_1-C_6$  (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену або ціаногрупами), алкілтіогрупу  $C_1-C_6$  (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену) або алкілсульфінільну групу  $C_1-C_6$  (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену або алкоксильними групами  $C_1-C_3$ );

$A_3$  являє собою аміногрупу;

$B_2$  являє собою атом галогену або метильну групу; а

$B_4$  являє собою ціаногрупу або алкільную групу  $C_1-C_6$  (яка може бути моно- або полізаміщена атомами галогену).

(4) Похідне 3-тріазолілфенілсульфіду у відповідності до зазначеного вище пункту (2), де  $A_1$  являє собою ізопропільную групу, t-бутильную групу, дифторметильну групу, трифторметильну групу, трифторметилтіогрупу, 2,2,2-трифторетилтіогрупу, 1,1,2,2-тетрафторетилтіогрупу, пентафторетилтіогрупу, трифторметилсульфінільну групу, 2,2,2-трифторетилсульфінільну групу або пентафторетилсульфінільну групу, а

$A_3$  являє собою метиламіногрупу, етиламіногрупу, пропіламіногрупу, ціанометиламіногрупу, пропаргіламіногрупу, ацетиламіногрупу, пропіоніламіногрупу, трифторацетиламіногрупу або дифторацетиламіногрупу.

(5) Похідне 3-тріазолілфенілсульфіду у відповідності до зазначеного вище пункту (3), де  $A_1$  являє собою ізопропільную групу, t-бутильную групу, дифторметильну групу, трифторметильну групу, трифторметилтіогрупу, 2,2,2-трифторетилтіогрупу, 1,1,2,2-тетрафторетилтіогрупу, пентафторетилтіогрупу, трифторметилсульфінільну групу, 2,2,2-трифторетилсульфінільну групу або пентафторетилсульфінільну групу, а

$A_3$  являє собою аміногрупу.

(6) Похідне 3-тріазолілфенілсульфіду у відповідності до зазначеного вище пункту (2), де  $A_1$  являє собою трифторметильну групу, трифторметилтіогрупу або 2,2,2-трифторетилсульфінільну групу, а

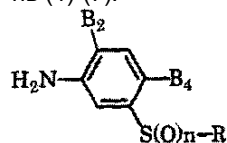
$A_3$  являє собою метиламіногрупу або трифторацетиламіногрупу.

(7) Похідне 3-тріазолілфенілсульфіду у відповідності до зазначеного вище пункту (2), де  $A_1$  являє собою трифторметильну групу, трифторметилтіогрупу або 2,2,2-трифторетилсульфінільну групу; а

$A_3$  являє собою аміногрупу.

(8) Похідне аніліну, представлене формулою [I-a], яке являє собою проміжну сполуку для одер-

жання похідного 3-тріазолілфенілсульфіду, як це визначено в будь-якому із зазначених вище пунктів (1)-(7):



[I-a]

де B<sub>2</sub> являє собою атом галогену або метильну групу, а B<sub>4</sub> являє собою алкільну групу C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>.

(9) Похідне аніліну у відповідності до зазначеного вище пункту (8), де B<sub>4</sub> являє собою метильну групу.

(10) Інсектицид, акарицид або нематоцид, які містять похідне 3-тріазолілфенілсульфіду як активний інгредієнт і які призначені для застосування в сільськогосподарських і плодово-овочевих культурах.

Сполуки у відповідності до даного винаходу демонструють чудову пестицидну активність проти комах-шкідників, наприклад, комах-шкідників ряду hemiptera ((справжніх) напівжорсткокрилих), комах-шкідників ряду lepidoptera (лускокрилих), комах-шкідників ряду coleoptera (твердокрилих), комах-шкідників ряду diptera (двокрилих), комах-шкідників ряду hymenoptera (перетинчастокрилих), комах-шкідників ряду orthoptera (прямокрилих), комах-шкідників ряду izoptera (рівнокрилих), комах-шкідників ряду thysanoptera (пухирчатоногих), кліщів і нематод-шкідників рослин, і вони також придатні для боротьби з комахами-шкідниками, які придбали опірність до загальновідомих пестицидів.

Більш конкретно, сполуки у відповідності до даного винаходу демонструють видатні результати по відношенню до різноманітних комах-шкідників, особливо по відношенню до комах-шкідників сільськогосподарських і плодово-овочевих культур, що включають кліщі, представлені кліщиком павутинним двоплемистим, кліщиком павутинним Kanzawa і кліщиком павутинним цитрусовим, комахи-шкідники лускокрилі, представлені міллю капустяною, вогнівкою стеблинною рисовою азійською і совкою малою, комахи-шкідники (справжні) напівжорсткокрилі, представлені дельфацидом рисовим коричневим, цикадкою рисовою листяною і попелицею бавовняною, комахи-шкідники твердокрилі, представлені зернівкою квасольовою адзукі, і нематоди, представлені нематодою яванською головою південною, і мають чудову системну дію. Відповідно, сполуки у відповідності до даного винаходу можуть бути використані для безпечного застосування і економії трудових витрат при обробці ґрунту.

Позначення і терміни, що використовуються в цьому описі, будуть визначені нижче.

Атом галогену являє атом фтору, атом хлору, атом броду або атом йоду.

Вираз C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> і тому подібне означає, що наступний замісник має в даному випадку від 1 до 6 атомів вуглецю.

Алкільна група C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> означає, якщо інше не визначено, алкільну групу з нерозгалуженим або розгалуженим ланцюгом, яка має від 1 до 6 атомів вуглецю, наприклад, метильну, етильну, n-

пропілну, i-пропілну, n-бутильну, s-бутильну, i-бутильну, t-бутильну, n-пентильну, 1-метилбутильну, 2-метилбутильну, 3-метилбутильну, 1-етилпропілну, 1,1-диметилпропілну, 1,2-диметилпропілну, неопентильну, n-гексильну, 1-метилпентильну, 2-метилпентильну, 3-метилпентильну, 4-метилпентильну, 1-етилбутильну, 2-етилбутильну, 1,1-диметилбутильну, 1,2-диметилбутильну, 1,3-диметилбутильну, 2,2-диметилбутильну, 2,3-диметилбутильну, 3,3-диметилбутильну, 1,1,2-триметилпропілну, 1,2,2-триметилпропілну, 1-етил-1-метилпропілну або 1-етил-2-метилпропілну групу.

Циклоалкільна група C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> означає, якщо інше не визначено, циклоалкільну групу, що має від 3 до 6 атомів вуглецю, наприклад, циклопропілну, циклобутильну, циклопентильну або циклогексильну групу.

Алкенільна група C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> означає, якщо інше не визначено, алкенільну групу з нерозгалуженим або розгалуженим ланцюгом, яка має від 2 до 6 атомів вуглецю, наприклад, вінілну, 1-пропенільну, i-пропенільну, 2-пропенільну, 1-бутенільну, 1-метил-1-пропенільну, 2-бутенільну, 1-метил-2-пропенільну, 3-бутенільну, 2-метил-1-пропенільну, 2-метил-2-пропенільну, 1,3-бутадієнілну, 1-пентенільну, 1-етил-2-пропенільну, 2-пентенільну, 1-метил-1-бутенільну, 3-пентенільну, 1-метил-2-бутенільну, 4-пентенільну, 1-метил-3-бутенільну, 3-метил-1-бутенільну, 1,2-диметил-2-пропенільну, 1,1-диметил-2-пропенільну, 2-метил-2-бутенільну, 3-метил-2-бутенільну, 1,2-диметил-1-пропенільну, 2-метил-3-бутенільну, 3-метил-3-бутенільну, 1,3-пентадієнілну, 1-вініл-2-пропенільну, 1-гексенільну, 1-пропіл-2-пропенільну, 2-гексенільну, 1-метил-1-пентенільну, 1-етил-2-бутенільну, 3-гексенільну, 4-гексенільну, 5-гексенільну, 1-метил-4-пентенільну, 1-етил-3-бутенільну, 1-(i-бутил)вінілну, 1-етил-1-метил-2-пропенільну, 1-етил-2-метил-2-пропенільну, 1-(i-пропіл)-2-пропенільну, 2-метил-2-пентенільну, 3-метил-3-пентенільну, 4-метил-3-пентенільну, 1,3-диметил-2-бутенільну, 1,1-диметил-3-бутенільну, 3-метил-4-пентенільну, 4-метил-4-пентенільну, 1,2-диметил-3-бутенільну, 1,3-диметил-3-бутенільну, 1,1,2-триметил-2-пропенільну, 1,5-гексадієнілну, 1-вініл-3-бутенільну або 2,4-гексадієнілну групу.

Алкінільна група C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> означає, якщо інше не визначено, алкінілну групу з нерозгалуженим або розгалуженим ланцюгом, яка має від 2 до 6 атомів вуглецю, наприклад, етинільну, 1-пропінілну, 2-пропінілну, 1-бутинілну, 1-метил-2-пропінілну, 2-бутинілну, 3-бутинілну, 1-пентинільну, 1-етил-2-пропінілну, 2-пентинільну, 3-пентинільну, 1-метил-2-бутинілну, 4-пентинільну, 1-метил-3-бутинілну, 2-метил-3-бутинілну, 1-гексинільну, 1-(n-пропіл)-2-пропінілну, 2-гексинільну, 1-етил-2-бутинілну, 3-гексинільну, 1-метил-2-пентинільну, 1-метил-3-пентинільну, 4-метил-1-пентинільну, 3-метил-1-пентинільну, 5-гексинільну, 1-етил-3-бутинілну, 1-етил-1-метил-2-пропінілну, 1-(i-пропіл)-2-пропінілну, 1,1-диметил-2-бутинілну або 2,2-диметил-3-бутинілну групу.

Галогеналкільна група  $C_1-C_6$  означає, якщо інше не визначено, алкілну групу  $C_1-C_4$  з нерозгалуженим або розгалуженим ланцюгом, заміщену 1-9 ідентичними або різними атомами галогену, наприклад, фторметильну, хлорметильну, бромметильну, дифторметильну, дихлорметильну, трифторметильну, трихлорметильну, хлордифторметильну, бромдифторметильну, 2-фторетильну, 1-хлоретильну, 2-хлоретильну, 1-бромметильну, 2-бромметильну, 2,2-дифторетильну, 1,2-дихлоретильну, 2,2-дихлоретильну, 2,2,2-трифторетильну, 2,2,2-трихлоретильну, 1,1,2,2-тетрафторетильну, пентафторетильну, 2-бром-2-хлоретильну, 2-хлор-1,1,2,2-тетрафторетильну, 1-хлор-1,2,2,2-тетрафторетильну, 1-хлорпропілну, 2-хлорпропілну, 3-хлорпропілну, 2-бромпропілну, 3-бромпропілну, 2-бром-1-метилетильну, 3-йодпропілну, 2,3-дихлорпропілну, 2,3-дибромпропілну, 3,3,3-трифторпропілну, 3,3,3-трихлорпропілну, 3-бром-3,3-дифторпропілну, 3,3-дихлор-3-фторпропілну, 2,2,3,3-тетрафторпропілну, 1-бром-3,3,3-трифторпропілну, 2,2,3,3,3-пентафторпропілну, 2,2,2-трифтор-1-трифторметилетильну, гептафторпропілну, 1,2,2,2-тетрафтор-1-трифторметилетильну, 2,3-дихлор-1,1,2,3,3-пентафторпропілну, 2-хлорбутильну, 3-хлорбутильну, 4-хлорбутильну, 2-хлор-1,1-диметилетильну, 4-бромбутильну, 3-бром-2-метилпропілну, 2-бром-1,1-диметилетильну, 2,2-дихлор-1,1-диметилетильну, 2-хлор-1-хлорметил-2-метилетильну, 4,4,4-трифторбутильну, 3,3,3-трифтор-1-метилпропілну, 3,3,3-трифтор-2-метилпропілну, 2,3,4-трихлорбутильну, 2,2,2-трихлор-1,1-диметилетильну, 4-хлор-4,4-дифторбутильну, 4,4-дихлор-4-фторбутильну, 4-бром-4,4-дифторбутильну, 2,4-дибром-4,4-дифторбутильну, 3,4-дихлор-3,4,4-трифторбутильну, 3,3-дихлор-4,4,4-трифторбутильну, 4-бром-3,3,4,4-тетрафторбутильну, 4-бром-3-хлор-3,4,4-трифторбутильну, 2,2,3,3,4,4-гексафторбутильну, 2,2,3,4,4,4-гексафторбутильну, 2,2,2-трифтор-1-метил-1-трифторметилетильну, 3,3,3-трифтор-2-трифторметилпропілну, 2,2,3,3,4,4,4-гептафторбутильну, 2,3,3,3-тетрафтор-2-трифторметилпропілну, 1,1,2,2,3,3,4,4-октафторбутильну, нонафторбутильну або 4-хлор-1,1,2,2,3,3,4,4-октафторбутильну групу.

Алкоксильна група  $C_1-C_6$  означає (алкіл)-О-групу, де алкільна складова - як це визначено вище, наприклад, метоксильну, етоксильну, n-пропоксильну, i-пропоксильну, n-бутоксильну, i-бутоксильну, t-бутоксильну, пентилоксильну, i-пентилоксильну або гексилоксильну групу.

Алкокси- $C_1-C_6$ -алкільна група  $C_1-C_6$  означає алкілну групу, яка має від 1 до 6 атомів вуглецю, заміщених алкоксильною групою, яка має від 1 до 6 атомів вуглецю, де алкільна складова і алкоксильна складова - як це визначено вище, наприклад, метоксиметильну, етоксиметильну, i-проксиметильну, n-бутоксиметильну, i-бутоксиметильну, пентилоксиметильну, метоксіе-

тильну, n-бутоксіетильну або i-бутоксіетильну групу.

Алкілтіогрупа  $C_1-C_6$  означає групу (алкіл)-8-, яка має від 1 до 6 атомів вуглецю, де алкільна складова - як це визначено вище, наприклад метилтіогрупу, етилтіогрупу, n-пропілтіогрупу або ізопропілтіогрупу.

Алкілсульфінільна група  $C_1-C_6$  означає групу (алкіл)-SO-, яка має від 1 до 6 атомів вуглецю, де алкільна складова - як це визначено вище, наприклад, метилсульфінільну, етилсульфінільну, n-пропілсульфінільну або i-пропілсульфінільну групу.

Алкілсульфонільна група  $C_1-C_6$  означає групу (алкіл)-SO<sub>2</sub>-, яка має від 1 до 6 атомів вуглецю, де алкільна складова - як це визначено вище, наприклад, метилсульфонільну, етилсульфонільну, n-пропілсульфонільну або ізопропілсульфонільну групу.

Ацильна група  $C_1-C_7$  означає формільну групу або групу (алкіл)-C(=O)-, яка має від 1 до 6 атомів вуглецю, де алкільна складова - як це визначено вище, наприклад, ацетильну або пропіонільну групу.

Алкоксікарбонільна група  $C_2-C_7$  означає або групу (алкіл)-C(=O)-, яка має від 1 до 6 атомів вуглецю, де алкільна складова - як це визначено вище, наприклад, метоксікарбонільну, етоксікарбонільну, n-пропоксикарбонільну або ізопропоксикарбонільну групу.

Галогеналкілкарбонільна група  $C_1-C_4$  означає групу (галогеналкіл)-C(=O)-, яка має від 1 до 6 атомів вуглецю, де галогеналкільна складова - як це визначено вище, наприклад хлорацетильну, трифторацетильну, пентафторпропіонільну або дифторметилтіогрупу.

Моноалкіламіногрупа  $C_1-C_6$  означає аміногрупу, яка монозаміщена алкільною групою, де алкільна складова - як це визначено вище, наприклад, метиламіно, етиламіно або n-пропіламіногрупу.

Діалкіламіногрупа  $C_2-C_{12}$  означає аміногрупу, яка дизаміщена алкільною групою, де алкільні складові - як це визначено вище, наприклад, диметиламіно, діетиламіно або N-етил-N-метиламіногрупу.

Арильна група означає групу вуглеводнів ароматичного ряду, наприклад, фенільну або нафтильну групу.

Арилалкільна група означає групу (арил)-(алкіл), де арильна і алкільна складові - як це визначено вище, наприклад бензильну, фенетильну або нафтилметильну групу.

Гетероарильна група означає гетероциклічну групу ароматичного ряду, наприклад, тієнільну, піридилну або бензотіазольну групу.

Гетероарилалкільна група означає групу (гетероарил)-(алкіл), де гетероарильна і алкільна складова - як це визначено вище, наприклад, тієнілметильну або піридилметильну групу.

Переважає сполуки зазначеної вище формули [I] являють собою сполуки, де R являє собою 2,2,2-трифторетильну групу, а n являє собою 0 або 1.

Більш переважні сполуки являють собою сполуки, де R являє собою 2,2,2-трифторетильну гру-

пу,  $B_2$  являє собою атом галогену,  $B_4$  являє собою алкільну групу або галогеналкільну групу, а  $n$  являє собою 0 або 1.

Нижче в таблицях 1-6 надані конкретні приклади сполук у відповідності до даного винаходу, які представлені формулою [I]. Проте, сполуки у відповідності до даного винаходу не обмежуються цими сполуками. Крім того, ці сполуки включають сполуки, що мають оптичний ізомер. Далі у даному описі посилання робляться на номери сполук.

Позначення в таблицях в даному описі означають відповідно наступні відповідні групи.

Me: метил	Et: етил
Pr: n-пропіл	Pr-i: ізопропіл
Pr-c: циклопропіл	Bu: n-бутил
Bu-i: ізобутил	Bu-s: втор-бутил
Bu-t: трет-бутил	Bu-c: циклобутил
Pen: n-пентил	Pen-i: ізопентил
Pen-c: циклопентил	Hex-c: циклогексил
Ph: феніл	Pu: піридил.

Наприклад, Ph-4-Cl означає 4-хлорфеніл, а 3-Pu-6-Cl означає 6-хлор-3-піридил.

Таблиця 1

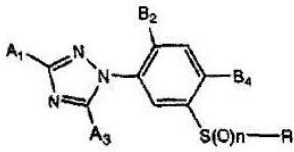
						
Сполука №	$A_1$	$A_3$	$B_2$	$B_4$	R	n
1	CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
2	CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
3	CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> Pr-c	0
4	CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> Pr-c	1
5	CF <sub>3</sub>	NHCOCF <sub>3</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
6	CF <sub>3</sub>	NHCOCF <sub>3</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
7	CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
8	CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
9	CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	Me	Cl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
10	CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	Me	Cl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
11	NO <sub>2</sub>	H	H	CHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
12	NO <sub>2</sub>	H	H	CHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
13	NO <sub>2</sub>	H	H	CN	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
14	NO <sub>2</sub>	H	H	CN	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
15	SMe	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
16	SMe	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
17	SOMe	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
18	SOMe	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
19	SO <sub>2</sub> Me	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
20	SO <sub>2</sub> Me	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
21	SEt	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
22	SEt	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
23	SOEt	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
24	SOEt	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
25	SO <sub>2</sub> Et	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
26	SO <sub>2</sub> Et	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
27	SCHF <sub>2</sub>	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
28	SCHF <sub>2</sub>	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
29	S(O)CHF <sub>2</sub>	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
30	S(O)CHF <sub>2</sub>	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
31	SCF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
32	SCF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
33	CN	H	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0

Таблица 2



Сполука №	A <sub>1</sub>	A <sub>3</sub>	B <sub>2</sub>	B <sub>4</sub>	R	n
34	CN	H	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
35	CN	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
36	CN	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
37	CF <sub>3</sub>	NHMe	H	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
38	CF <sub>3</sub>	NHMe	H	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
39	CF <sub>3</sub>	NHMe	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
40	CF <sub>3</sub>	NHMe	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
41	CF <sub>3</sub>	N(Me) <sub>2</sub>	H	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
42	CF <sub>3</sub>	N(Me) <sub>2</sub>	H	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
43	CF <sub>3</sub>	N(Me) <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
44	CF <sub>3</sub>	N(Me) <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
45	CF <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> Me	H	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
46	CF <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> Me	H	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
47	CF <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> Me	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
48	CF <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> Me	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
49	Et	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
50	Et	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
51	Cl	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
52	Cl	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
53	Br	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
54	Br	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
55	CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	Me	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
56	CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	Me	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
57	CF <sub>3</sub>		F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
58	CF <sub>3</sub>		F	Me	CH <sub>2</sub> CP <sub>3</sub>	1
59	CF <sub>3</sub>	NHEt	F	Me	CH <sub>2</sub> CP <sub>3</sub>	0
60	CF <sub>3</sub>	NHEt	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
61	CF <sub>3</sub>	NHPr	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
62	CF <sub>3</sub>	NHPr	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
63	CF <sub>3</sub>	NHCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
64	CF <sub>3</sub>	NHCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
65	CF <sub>3</sub>	NHCH <sub>2</sub> C≡CH	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
66	CF <sub>3</sub>	NHCH <sub>2</sub> C≡CH	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
67	CF <sub>3</sub>	NHCH <sub>2</sub> Ph-4-Cl	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
68	CF <sub>3</sub>	NHCH <sub>2</sub> Ph-4-Cl	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>1</sub>	1



Таблица 3

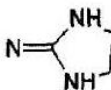
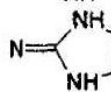


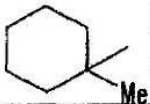
Сполука №	A <sub>1</sub>	A <sub>3</sub>	B <sub>2</sub>	B <sub>4</sub>	R	n
69	CF <sub>3</sub>	NHCH <sub>2</sub> -3-Py-6-Cl	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
70	CF <sub>3</sub>	NHCH <sub>2</sub> -3-Py-6-Cl	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
71	CF <sub>3</sub>	NH-Ph-2,6-Cl <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
72	CF <sub>3</sub>	NH-Ph-2,6-Cl <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
73	GF <sub>3</sub>	NH-2-Py-3-Cl-5-CF <sub>3</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
74	CF <sub>3</sub>	NH-2-Py-3-Cl-5-CF <sub>3</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
75	CF <sub>3</sub>	NHCOMe	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
76	CF <sub>3</sub>	NHCOMe	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
77	CF <sub>3</sub>	NHCOCH <sub>2</sub> OMe	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
78	CF <sub>3</sub>	NHCOCH <sub>2</sub> OMe	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
79	CF <sub>3</sub>	NHCOOMe	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
80	CF <sub>3</sub>	NHCOOMe	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
81	CF <sub>3</sub>	NHCONH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
82	CF <sub>3</sub>	NHCONH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
83	CF <sub>3</sub>	NHCONMe <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
84	CF <sub>3</sub>	NHCONMe <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
85	CF <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
86	CF <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
87	CF <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
88	CF <sub>3</sub>	NHSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
89	CF <sub>3</sub>	N=CH-Ph-4-OH-3-OMe	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
90	CF <sub>3</sub>	N=CH-Ph-4-OH-3-OMe	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
91	CF <sub>3</sub>	N=CMe <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
92	CF <sub>3</sub>	N=CMe <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
93	CF <sub>3</sub>	N=C(NH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> OF <sub>3</sub>	0
94	CF <sub>3</sub>	N=C(NH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
95	CF <sub>3</sub>		F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
96	CF <sub>3</sub>		F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
97	CF <sub>3</sub>	NHMe	Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
98	CF <sub>3</sub>	NHMe	Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
99	SCF <sub>3</sub>	NHCOCF <sub>3</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
100	SCF <sub>3</sub>	NHCOCF <sub>3</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
101	SC <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	NHMe	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
102	SC <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	NHMe	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
103	C(Me) <sub>2</sub> CN	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
104	C(Me) <sub>2</sub> CN	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1

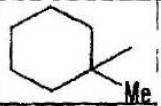
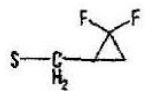
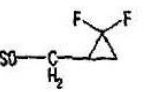
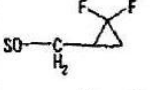

Таблица 4

Сполука №	A <sub>1</sub>	A <sub>3</sub>	B <sub>2</sub>	B <sub>4</sub>	R	n
105	Me	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
106	Me	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
106	CH <sub>2</sub> Bu-t	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
107	CH <sub>2</sub> Bu-t	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
108	CF <sub>3</sub>	NHCOMe	Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
109	CF <sub>3</sub>	NHCOMe	Cl	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
110	Pr-i	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
111	Pr-i	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
112	Bu-t	NHCOMe	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
113	Bu-t	NHCOMe	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
114	Bu-t	NHMe	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
115	Bu-t	NHMe	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
116	Et	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
117	Et	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
118	C(Me) <sub>2</sub> Et	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
119	C(Me) <sub>2</sub> Et	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
120	CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	H	CN	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
121	CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	H	CN	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
122	CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	H	CHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
123	CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	H	CHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
124	CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	H	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
125	CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	H	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
126	CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	H	Cl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
127	CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	H	Cl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
128	CF <sub>3</sub>	N(Et) <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
129	CF <sub>3</sub>	N(Et) <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
130	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
131	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
132	S(O)CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
133	S(O)CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
134	SPr	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
135	SPr	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
136	S(O)Pr	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
137	S(O)Pr	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
138	S(O) <sub>2</sub> Pr	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
139	S(O) <sub>2</sub> Pr	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
140	SCH <sub>2</sub> CN	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
141	SCH <sub>2</sub> CN	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
142	S(O)CH <sub>2</sub> CN	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
143	S(O)CH <sub>2</sub> CN	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
144	Bu-t	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0

Таблица 5

Сполука №	A <sub>1</sub>	A <sub>3</sub>	B <sub>2</sub>	B <sub>4</sub>	R	n
145	Bu-t	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
146	CF <sub>3</sub>	NHMe	Me	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
147	CF <sub>3</sub>	NHMe	Me	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
148	SCH <sub>2</sub> C = CH	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
149	SCH <sub>2</sub> C = CH	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
150	S(O)CH <sub>2</sub> C = CH	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
151	S(O)CH <sub>2</sub> C = CH	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
152	CF <sub>3</sub>	NHCOCF <sub>3</sub>	H	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
153	CF <sub>3</sub>	NHCOCF <sub>3</sub>	H	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
154	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	NHCOMe	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
155	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	NHCOMe	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
156	S(O)CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	NHCOMe	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
157	S(O)CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	NHCOMe	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
158	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	N(Me)COMe	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
159	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	N(Me)COMe	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
160	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	NHMe	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
161	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	NHMe	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
162	CF <sub>3</sub>	NHNH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
163	CF <sub>3</sub>	NHNH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
164	CF <sub>3</sub>	NHCH <sub>2</sub> CN	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
165	CF <sub>3</sub>	NHCH <sub>2</sub> CN	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
166	CF <sub>3</sub>	NHPh	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
167	CF <sub>3</sub>	NHPr-i	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
168	CF <sub>3</sub>	NHCONHMe	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
169	CF <sub>3</sub>	NHCONHMe	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
170	CF <sub>3</sub>	N(Me)NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
171	CF <sub>3</sub>	N(Me)NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
172	SC <sub>3</sub> F <sub>7</sub>	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
173	SC <sub>3</sub> F <sub>7</sub>	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
174	C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
175	C <sub>3</sub> F <sub>7</sub>	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
176	SC <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
177	SC <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
178		NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
179		NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
180		NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0

Таблиця 6

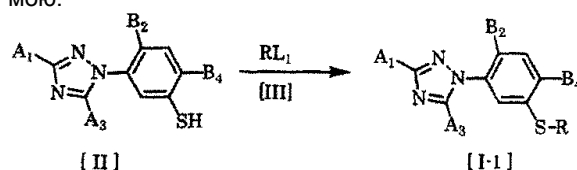
Сполука №	A <sub>1</sub>	A <sub>3</sub>	B <sub>2</sub>	B <sub>4</sub>	R	n
181		NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
182	CH(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
183	CH(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
184	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	NHCH <sub>2</sub> C = CH	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
185	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	NHCH <sub>2</sub> C = CH	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
186	CF <sub>3</sub>	NHCOEt	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
187	CF <sub>3</sub>	NHCOEt	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
189	CF <sub>3</sub>	NHCOCH <sub>2</sub> Cl	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
190	CF <sub>3</sub>	NHCOCH <sub>2</sub> Cl	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
191	CF <sub>3</sub>	NHCOCF <sub>2</sub> Cl	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
192	CF <sub>3</sub>	NHCOCF <sub>2</sub> Cl	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
193	SC <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	NHCH <sub>2</sub> C = CH	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
194	SC <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	NHCH <sub>2</sub> C = CH	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
195		NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
196		NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
197		NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
198		NH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
199	CF <sub>3</sub>	NHCOCHF <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
200	CF <sub>3</sub>	NHCOCHF <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
201	CF <sub>3</sub>	NHCONHPr-1	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
202	CF <sub>3</sub>	NHCONHPr-1	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
203	CF <sub>3</sub>	COOMe	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
204	CF <sub>3</sub>	COOMe	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
205	CF <sub>3</sub>	COOEt	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
206	CF <sub>3</sub>	COOEt	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
207	CF <sub>3</sub>	CONH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
208	CF <sub>3</sub>	CONH <sub>2</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
209	CF <sub>3</sub>	CN	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
210	CF <sub>3</sub>	CN	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1
211	CF <sub>3</sub>	N(Me)COCF <sub>3</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	0
212	CF <sub>3</sub>	N(Me)COCF <sub>3</sub>	F	Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1

Сполуки у відповідності до даного винаходу, представлені формулою [I], можуть бути одержані відповідно до наступних способів виробництва. Проте, їх одержання не обмежується цими способами.

<Спосіб виробництва 1>

Сполука формули [I-1] у відповідності до даного винаходу може бути одержана способом, приклад здійснення якого пояснюється наступною схемою:

лад здійснення якого пояснюється наступною схемою:



де Li являє собою атом галогену, алкілсульфонілоксильну групу, фенолсульфонілоксильну групу або SO<sub>2</sub>M, M являє собою лужний метал або лужноземельний метал, лужний метал являє собою переважно натрій або калій, а A<sub>1</sub>, A<sub>3</sub>, B<sub>2</sub>, B<sub>4</sub> і R - як це визначено вище.

Більш конкретно, похідне 3-тріазолілфенілсульфіду формули [I-1], яке являє собою сполуку у відповідності до даного винаходу, може бути одержано шляхом введення в реакцію сполуки формули [II] зі сполукою формули [III] в розчиннику в присутності основи або в присутності радикального ініціатора.

Кількість сполуки формули [III], яка має бути застосована, може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 1 до 5 моль на 1 моль сполуки формули [I] і складає переважно від 1,2 до 2,0 моль.

Розчинник, який має бути застосований в цій реакції, може, наприклад, являти собою простий ефір, наприклад діетиловий ефір, тетрагідрофуран або діоксан, вуглеводень ароматичного ряду, наприклад, бензол, толуол, ксилол або хлорбензол, галогенований вуглеводень, наприклад, дихлорметан, хлороформ або дихлоретан, апротонний полярний розчинник, наприклад, ацетонітрил, N,N-диметилформамід, N,N-диметилацетамід, N-метил-2-піролідон, диметилсульфоксид або сульфолан, спирт, наприклад, метанол, етанол або ізопропіловий спирт, нітрил, наприклад, ацетонітрил або пропіонітрил, складний ефір, наприклад, етилацетат або етилпропіонат, вуглеводень аліфатичного ряду, наприклад, пентан, гексан, циклогексан або гептан, піридин, наприклад, піридин або піколін, або воду або розчинювальну суміш цих компонентів.

Основа, яка має бути застосована в цій реакції, може, наприклад, являти собою неорганічну основу, наприклад, гідроксид лужного металу, наприклад, гідроксид натрію або гідроксид калію, гідроксид лужноземельного металу, наприклад, гідроксид кальцію або гідроксид магнію, карбонат лужного металу, наприклад, карбонат натрію або карбонат калію, або бікарбонат лужного металу, наприклад, бікарбонат натрію або бікарбонат калію, гідрид металу, наприклад, гідрид натрію або гідрид калію, металеву сіль спирту, наприклад, метоксид натрію, етоксид натрію або трет-бутоксид калію, або органічну основу, наприклад, тріетиламін, N,N-диметиламінін, піридин, 4-N,N-диметиламінопіридин або 1,8-дізабіцикло[5.4.0]-7-ундецен.

Кількість основи, яка має бути застосована, може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 0 до 5 моль на 1 моль сполуки формули [II] і складає переважно від 0 до 1,2 моль.

Радикальний ініціатор, який має бути застосований в цій реакції, може, наприклад, являти собою сірчисту кислоту, сульфитну сіль або сульфитний адукт, наприклад, ронгаліт (формальдегідсульфоксидат натрію). Основа і радикальний ініціатор можна застосовувати разом.

У випадку, коли використовується радикальний ініціатор, його кількість може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 0,01 до 5 моль на

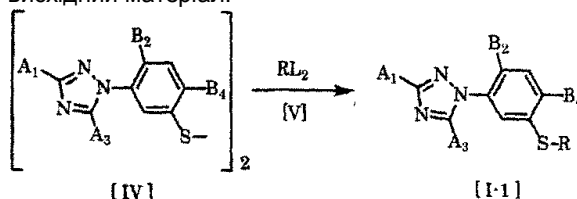
1 моль сполуки [II] і складає переважно від 0,05 до 1,2 моль.

Температура реакції може необов'язково бути вибрана з діапазону від -30°C до температури флегми реакційної системи і знаходиться переважно в діапазоні від 0°C до 150°C.

Час реакції варіює в залежності від температури реакції, реакційного субстрату, кількості реакційних компонентів і тому подібне і складає, як правило, від 10 хвилин до 20 годин.

<Спосіб виробництва 2>

Сполука формули [I-1] у відповідності до даного винаходу може бути одержана також шляхом використання сполуки формули [IV], яка являє собою окислювальний дим ер сполуки формули [II], яка застосовується у способі виробництва 1 як вихідний матеріал:



де L<sub>2</sub> являє собою атом галогену або сульфідну сіль, а A<sub>1</sub>, A<sub>3</sub>, B<sub>2</sub>, B<sub>4</sub> і R - як це визначено вище.

Більш конкретно, цільове похідне 3-тріазолілфенілсульфіду формули [I-1] може бути одержано шляхом введення в реакцію сполуки формули [IV] зі сполукою формули [V] в розчиннику в присутності радикального ініціатора.

Кількість сполуки формули [V], яка має бути застосована в цій реакції, може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 1 до 5 моль на 1 моль сполуки формули [IV] і складає переважно від 1,2 до 2,0 моль.

Розчинник, який має бути застосований в цій реакції, може, наприклад, являти собою простий ефір, наприклад діетиловий ефір, тетрагідрофуран або діоксан, вуглеводень ароматичного ряду, наприклад, бензол, толуол, ксилол або хлорбензол, апротонний полярний розчинник, наприклад, ацетонітрил, N,N-диметилформамід, N,N-диметилацетамід, N-метил-2-піролідон, диметилсульфоксид або сульфолан, нітрил, наприклад, ацетонітрил або пропіонітрил, складний ефір, наприклад, етилацетат або етилпропіонат, вуглеводень аліфатичного ряду, наприклад, пентан, гексан, циклогексан або гептан, піридин, наприклад, піридин або піколін, або воду або розчинювальну суміш цих компонентів.

Радикальний ініціатор може, наприклад, являти собою сірчисту кислоту, сульфитну сіль або сульфитний адукт, наприклад, ронгаліт (формальдегідсульфоксидат натрію).

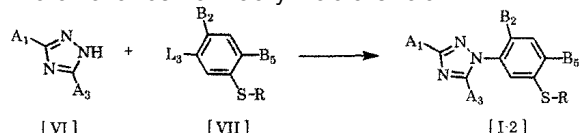
У випадку, коли використовується радикальний ініціатор, його кількість може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 0,01 до 5 моль на 1 моль сполуки [II] і складає переважно від 0,05 до 1,2 моль.

Температура реакції може необов'язково бути вибрана з діапазону від -30°C до температури флегми реакційної системи і знаходиться переважно в діапазоні від 0°C до 150°C.

Час реакції варіює в залежності від температури реакції, реакційного субстрату, кількості реакційних компонентів і тому подібне і складає, як правило, від 10 хвилин до 20 годин.

#### <Спосіб виробництва 3>

Сполука формули [I-2], яка являє собою сполуку у відповідності до даного винаходу, може бути одержана також способом, приклад здійснення якого пояснюється наступною схемою:



де B<sub>5</sub> являє собою групу, яка вилучає електрони, A<sub>1</sub>, A<sub>2</sub>, B<sub>2</sub> і R - як це визначено вище, L<sub>3</sub> являє собою групу, що відщеплюється, наприклад, атом галогену, алкілсульфонілоксильну групу або фенілсульфонілоксильну групу, а група, що вилучає електрони, являє собою ціаногрупу, нітрогрупу або тому подібне.

Більш конкретно, сполука формули [I-2] у відповідності до даного винаходу може бути одержана шляхом введення в реакцію сполуки формули [VI] зі сполукою формули [VII] в розчиннику в присутності основи.

Кількість сполуки формули [VII] може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 1 до 5 моль на 1 моль сполуки формули [VI] і складає переважно від 1,0 до 1,2 моль.

Тип розчинника, який має бути застосований в цій реакції, не обмежується, за умови, що він не гальмує реакцію, і він може, наприклад, являти собою вуглеводень ароматичного ряду, наприклад, бензол, толуол або ксилол, простий ефір, наприклад діетиловий ефір, тетрагідрофуран, 1,2-диметоксетан або діоксан, кетон, наприклад, ацетон або метилетилкетон, нітрil, наприклад, ацетонітрil або пропіонітрil, апротонний полярний розчинник, наприклад, диметилсульфоксид, N,N-диметилформамід або N,N-диметилацетамід, вуглеводень аліфатичного ряду, наприклад, пентан, гексан, циклогексан або гептан, або піридин, наприклад, піридин або піколін, або розчинювальну суміш цих компонентів.

Основа, яка має бути застосована в цій реакції, може, наприклад, являти собою неорганічну основу, наприклад, гідроксид лужного металу, наприклад, гідроксид натрію або гідроксид калію, гідроксид лужноземельного металу, наприклад, гідроксид кальцію або гідроксид магнію, карбонат лужного металу, наприклад, карбонат натрію або карбонат калію, або бікарбонат лужного металу, наприклад,

бікарбонат натрію або бікарбонат калію, гідрид металу, наприклад, гідрид натрію або гідрид калію, металеву сіль спирту, наприклад, метоксид натрію, етоксид натрію або трет-бутоксид калію, або органічну основу, наприклад, тріетиламін, N,N-диметиламіліл, піридин, 4-N,N-диметиламінопіридин або 1,8-діазабіцикло[5.4.0]-7-ундецен.

Кількість основи, яка має бути застосована, може відповідним чином бути вибрана з діапазону

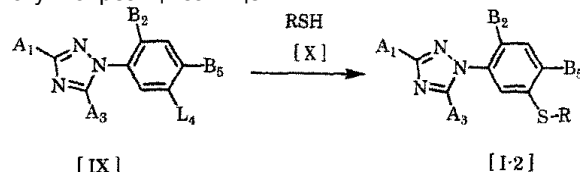
від 1 до 5 моль на 1 моль сполуки формули [II] і складає переважно від 1,1 до 1,2 моль.

Температура реакції може необов'язково бути вибрана з діапазону від -70°C до температури флегми реакційної системи і знаходиться переважно в діапазоні від -20°C до 150°C.

Час реакції варіює в залежності від температури реакції, реакційного субстрату, кількості реакційних компонентів і тому подібне і складає, як правило, від 10 хвилин до 20 годин.

#### <Спосіб виробництва 4>

Сполука формули [I-2], яка являє собою сполуку у відповідності до даного винаходу, може бути одержана також в результаті проведення наступної реакції заміщення:



де A<sub>1</sub>, A<sub>3</sub>, B<sub>2</sub>, B<sub>5</sub> і R - як це визначено вище, а L<sub>4</sub> являє собою атом галогену, алкілсульфонілоксильну групу, фенілсульфонілоксильну групу, алкілсульфонільну групу, фенілсульфонільну групу або нітрогрупу.

Більш конкретно, похідне 3-тріазолілфенілсульфіду формули [I-2], яке являє собою сполуку у відповідності до даного винаходу, може бути одержано шляхом введення в реакцію сполуки формули [IX] зі сполукою формули [X] в розчиннику в присутності основи або оксиду міді(І).

Розчинник, який має бути застосований в цій реакції, може, наприклад, являти собою простий ефір, наприклад діетиловий ефір, тетрагідрофуран або діоксан, вуглеводень ароматичного ряду, наприклад, бензол, толуол, ксилол або хлорбензол, апротонний полярний розчинник, наприклад, N,N-диметилформамід, N,N-диметилацетамід, N-метил-2-піролідон, диметилсульфоксид або сульфолан, спирт, наприклад, метанол, етанол або метилцелозольв, вуглеводень аліфатичного ряду, наприклад, пентан, гексан, циклогексан або гептан, піридин, наприклад, піридин або піколін, або воду або розчинювальну суміш цих компонентів.

Основа, яка має бути застосована в цій реакції, може, наприклад, являти собою неорганічну основу, наприклад, гідроксид лужного металу, наприклад, гідроксид натрію або гідроксид калію, гідроксид лужноземельного металу, наприклад, гідроксид кальцію або гідроксид магнію, карбонат лужного металу, наприклад, карбонат натрію або карбонат калію, або бікарбонат лужного металу, наприклад, бікарбонат натрію або бікарбонат калію, гідрид металу, наприклад, гідрид натрію або гідрид калію, металеву сіль спирту, наприклад, метоксид натрію, етоксид натрію або трет-бутоксид калію, або органічну основу, наприклад, тріетиламін, N,N-диметиламіліл, піридин, 4-N,N-диметиламінопіридин або 1,8-діазабіцикло[5.4.0]-7-ундецен.

Кількість основи або оксиду міді(І), які мають бути застосовані, може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 1 до 5 моль на 1 моль спо-

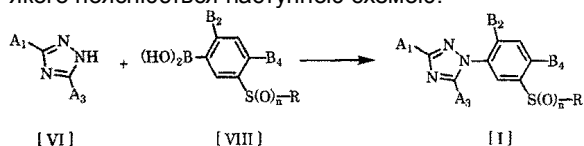
луки формули [IX] і складає переважно від 1,0 до 1,2 моль.

Температура реакції може необов'язково бути вибрана з діапазону від  $-70^{\circ}\text{C}$  до температури флегми реакційної системи і знаходиться переважно в діапазоні від  $0^{\circ}\text{C}$  до  $150^{\circ}\text{C}$ .

Час реакції варіює в залежності від температури реакції, реакційного субстрату, кількості реакційних компонентів і тому подібне і складає, як правило, від 10 хвилин до 20 годин.

<Спосіб виробництва 5>

Сполука формули [I], яка являє собою сполуку у відповідності до даного винаходу, може бути одержана також способом, приклад здійснення якого пояснюється наступною схемою:



де  $A_1$ ,  $A_3$ ,  $B_2$ ,  $B_4$ ,  $R$  і  $n$  - як це визначено вище.

Більш конкретно, сполука у відповідності до даного винаходу, представлена формулою [I], може бути одержана шляхом введення в реакцію сполуки формули [VI] і сполуки формули [VIII] з безводною сіллю міді в розчиннику в присутності органічної основи.

Кількість сполуки формули [VIII] може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 1 до 5 моль на 1 моль сполуки формули [VI] і складає переважно від 1,0 до 2,0 моль.

Тип розчинника, який має бути застосований в цій реакції, не обмежується, за умови, що він не гальмує реакцію, і він може, наприклад, являти собою галогенований алкан, наприклад, хлороформ або дихлорметан, вуглеводень ароматичного ряду, наприклад, бензол, толуол або ксилол, простий ефір, наприклад діетиловий ефір, тетрагідрофуран, 1,2-диметоксигетан або діоксан, кетон, наприклад, ацетон або метилетилкетон, нітрил, наприклад, ацетонітрил або пропіонітрил, апротонний полярний розчинник, наприклад,  $N,N$ -диметилформамід або  $N,N$ -диметилацетамід, вуглеводень аліфатичного ряду, наприклад, пентан, гексан, циклогексан або гептан, або піридин, наприклад, піридин або піколін, або розчинувальну суміш цих компонентів.

Безводна сіль міді, яка має бути застосована в цій реакції, може, наприклад, являти собою безводний ацетат міді.

Кількість безводної солі міді, яка має бути застосована, може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 1 до 5 моль на 1 моль сполуки формули [VI] і складає переважно від 1,2 до 2,2 моль.

Органічна основа, яка має бути застосована в цій реакції, може, наприклад, являти собою тріетиламін,  $N,N$ -диметиланілін, піридин, 4- $N,N$ -диметилампіридин або 1,8-дізабіцикло[5.4.0]-7-ундецен.

Кількість органічної основи, яка має бути застосована, може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 1 до 5 моль на 1 моль сполуки формули [VI] і складає переважно від 1,2 до 4,4 моль.

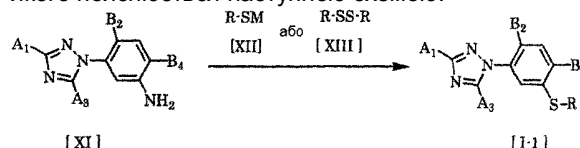
Температура реакції може необов'язково бути вибрана з діапазону від  $0^{\circ}\text{C}$  до температури фле-

гми реакційної системи і знаходиться переважно в діапазоні від  $10^{\circ}\text{C}$  до  $30^{\circ}\text{C}$ .

Час реакції варіює в залежності від температури реакції, реакційного субстрату, кількості реакційних компонентів і тому подібне і складає, як правило, від 8 до 48 годин.

<Спосіб виробництва 6>

Сполука формули [I-1], яка являє собою сполуку у відповідності до даного винаходу, може бути одержана також способом, приклад здійснення якого пояснюється наступною схемою:



де  $A_1$ ,  $A_3$ ,  $B_2$ ,  $B_4$ ,  $R$  і  $M$  - як це визначено вище.

Більш конкретно, цільове похідне 3-тріазолілфенілсульфіду формули [I-1] може бути одержане шляхом перетворення сполуки формули [XI] в сіль діазонію в розчиннику загальновідомим способом (спосіб, де використовують мінеральну кислоту (наприклад, хлористоводневу або сірчану кислоту) і нітритну сіль або алкілнітрил) і введення в реакцію солі діазонію з сіллю меркаптану формули [XII] або дисульфідом формули [XIII].

Кількість сполуки формули [XII] або сполуки формули [XIII] може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 1 до 5 моль на 1 моль сполуки формули [XI] і складає переважно від 1,0 до 2,0 моль.

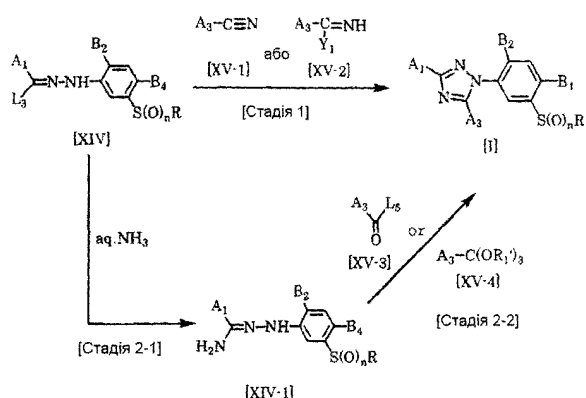
Розчинник, який має бути застосований в цій реакції, може, наприклад, являти собою простий ефір, наприклад, діетиловий ефір, тетрагідрофуран або діоксан, вуглеводень ароматичного ряду, наприклад, бензол, толуол, ксилол або хлорбензол, галогенований вуглеводень, наприклад, дихлорметан, хлороформ або дихлоретан, апротонний полярний розчинник, наприклад, ацетонітрил,  $N,N$ -диметилформамід,  $N,N$ -диметилацетамід,  $N$ -метил-2-піролідон, диметилсульфоксид або сульфолан, спирт, наприклад, метанол, етанол або ізопропіловий спирт, нітрил, наприклад, ацетонітрил або пропіонітрил, складний ефір, наприклад, етилацетат або етилпропіонат, вуглеводень аліфатичного ряду, наприклад, пентан, гексан, циклогексан або гептан, піридин, наприклад, піридин або піколін, або воду або розчинувальну суміш цих компонентів.

Температура реакції може необов'язково бути вибрана з діапазону від  $-30^{\circ}\text{C}$  до температури флегми реакційної системи і знаходиться переважно в діапазоні від  $-10^{\circ}\text{C}$  до  $100^{\circ}\text{C}$ .

Час реакції варіює в залежності від температури реакції, реакційного субстрату, кількості реакційних компонентів і тому подібне і складає, як правило, від 10 хвилин до 20 годин.

<Спосіб виробництва 7>

Сполука формули [I], яка являє собою сполуку у відповідності до даного винаходу, може бути одержана також способом, приклад здійснення якого пояснюється наступною схемою:



де  $L_3$ ,  $A_1$ ,  $A_3$ ,  $B_r$ ,  $B_4$ ,  $R$  і  $n$  - як це визначено вище,  $Y_1$  являє собою алкоксильну групу або алкілтіогрупу,  $L_5$  являє собою групу, що відщеплюється, наприклад, атом галогену, ацилоксильну групу, алкілсульфонілоксильну групу або фенілсульфонілоксильну групу, а  $R_1'$  являє собою алкілну групу.

#### [Стадія 1]

Більш конкретно, сполука формули [I] у відповідності до даного винаходу може бути одержана шляхом введення в реакцію сполуки формули [XIV] зі сполукою формули [XV-1] або [XV-2] в розчиннику в присутності основи.

Кількість сполуки формули [XV-1] або [XV-2], яка має бути застосована в цій реакції, знаходиться в межах від 1 моль до великого надлишку на 1 моль сполуки формули [XIV] і складає переважно від 1,2 до 2,0 моль.

Розчинник, який має бути застосований в цій реакції, може, наприклад, являти собою простий ефір, наприклад діетиловий ефір, тетрагідрофуран або діоксан, вуглеводень ароматичного ряду, наприклад, бензол, толуол, ксилол або хлорбензол, галогенований вуглеводень, наприклад, дихлорметан, хлороформ або дихлоретан, апротонний полярний розчинник, наприклад, ацетонітрил,  $N,N$ -диметилформамід,  $N,N$ -диметилацетамід,  $N$ -метил-2-піролідон, диметилсульфоксид або сульфолан, спирт наприклад, метанол, етанол або ізопропіловий спирт, нітрил, наприклад, ацетонітрил або пропіонітрил, складний ефір, наприклад, етилацетат або етилпропіонат, вуглеводень аліфатичного ряду, наприклад, пентан, гексан, циклогексан або гептан, піридин, наприклад, піридин або піколін, або воду або розчинювальну суміш цих компонентів.

Основа, яка має бути застосована в цій реакції, може, наприклад, являти собою неорганічну основу, наприклад, гідроксид лужного металу, наприклад, гідроксид натрію або гідроксид калію, гідроксид лужноземельного металу, наприклад, гідроксид кальцію або гідроксид магнію, карбонат лужного металу, наприклад, карбонат натрію або карбонат калію, або бікарбонат лужного металу, наприклад, бікарбонат натрію або бікарбонат калію, гідрид металу, наприклад, гідрид натрію або гідрид калію, металеву сіль спирту, наприклад, метоксид натрію, етоксид натрію або трет-бутоксид калію, або органічну основу, наприклад, тріетиламін,  $N,N$ -диметиланілін, піридин, 4- $N,N$ -

диметиламінопіридин або 1,8-діазабіцикло[5.4.0]-7-ундецен.

Кількість основи, яка має бути застосована, може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 2 до 5 моль на 1 моль сполуки формули [XIV] і складає переважно від 2,2 до 3,0 моль.

Температура реакції може необов'язково бути вибрана з діапазону від  $0^\circ\text{C}$  до температури флегми реакційної системи і знаходиться переважно в діапазоні від  $10^\circ\text{C}$  до  $150^\circ\text{C}$ .

Час реакції варіює в залежності від температури реакції, реакційного субстрату, кількості реакційних компонентів і тому подібне і складає, як правило, від 3 до 12 годин.

Як інший спосіб, цільове похідне 3-тріазолілфенілсульфіду формули [I] може бути одержане шляхом введення в реакцію сполуки формули [XIV] з водним аміаком з метою одержання сполуки формули [XIV-1] (стадія 2-1) і введення в реакцію цієї сполуки зі сполукою формули [XV-3] або [XV-4] в розчиннику в присутності основи або в присутності кислотного каталізатора (стадія 2-2).

#### (Стадія 2-1)

Кількість водного аміаку, який має бути застосований на цій стадії, може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 1 до 10 моль на 1 моль сполуки формули [XIV] і складає переважно від 2,0 до 5,0 моль.

Розчинник, який має бути застосований на цій стадії, може, наприклад, являти собою простий ефір, наприклад діетиловий ефір, тетрагідрофуран або діоксан, вуглеводень ароматичного ряду, наприклад, бензол, толуол, ксилол або хлорбензол, галогенований вуглеводень, наприклад, дихлорметан, хлороформ або дихлоретан, апротонний полярний розчинник, наприклад, ацетонітрил,  $N,N$ -диметилформамід,  $N,N$ -диметилацетамід,  $N$ -метил-2-піролідон, диметилсульфоксид або сульфолан, спирт, наприклад, метанол, етанол або ізопропіловий спирт, нітрил, наприклад, ацетонітрил або пропіонітрил, складний ефір, наприклад, етилацетат або етилпропіонат, вуглеводень аліфатичного ряду, наприклад, пентан, гексан, циклогексан або гептан, піридин, наприклад, піридин або піколін, або воду або розчинювальну суміш цих компонентів.

Температура реакції може необов'язково бути вибрана з діапазону від  $-30^\circ\text{C}$  до температури флегми реакційної системи і знаходиться переважно в діапазоні від  $-10^\circ\text{C}$  до  $100^\circ\text{C}$ .

Час реакції варіює в залежності від температури реакції, реакційного субстрату, кількості реакційних компонентів і тому подібне і складає, як правило, від 10 хвилин до 20 годин.

#### (Стадія 2-2)

Крім того, кількість сполуки формули [XV-3] або сполуки формули [XV-4], яка має бути застосована на цій стадії, знаходиться в межах від 1 моль до великого надлишку на 1 моль сполуки формули [XIV-1] і складає переважно від 1,0 до 2,0 моль.

Кислотний каталізатор, який має бути застосований на цій стадії, може, наприклад, являти собою сульфонову кислоту, наприклад, метансуль-



фонову кислоту або р-толуолсульфонову кислоту, неорганічну кислоту, наприклад, хлористоводневу кислоту або сірчану кислоту, або карбонову кислоту, наприклад, оцтову кислоту або трифтороцтову кислоту.

Кількість кислотного каталізатора, який має бути застосований, може відповідним чином бути вибраний з діапазону від 0,01моль до великого надлишку на 1моль сполуки формули [XIV-1] і складає переважно від 0,05 до 1,0моль.

Розчинник, який має бути застосований на цій стадії, може являти собою той же розчинник, як це визначено для зазначеної вище стадії 1.

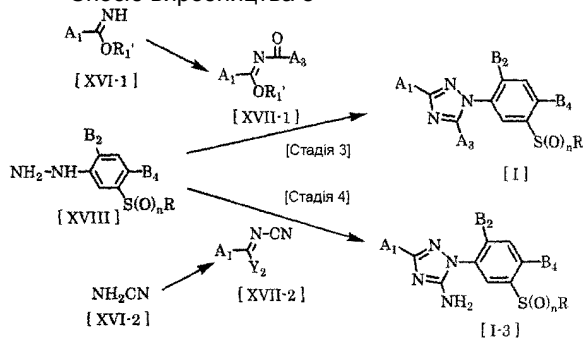
Основа, яка має бути застосована в цій реакції, може, наприклад, являти собою неорганічну основу, наприклад, гідроксид лужного металу, наприклад, гідроксид натрію або гідроксид калію, гідроксид лужноземельного металу, наприклад, гідроксид кальцію або гідроксид магнію, карбонат лужного металу, наприклад, карбонат натрію або карбонат калію, або бікарбонат лужного металу, наприклад, бікарбонат натрію або бікарбонат калію, гідрид металу, наприклад, гідрид натрію або гідрид калію, металеву сіль спирту, наприклад, метоксид натрію, етоксид натрію або трет-бутоксид калію, або органічну основу, наприклад, тріетиламін, N,N-диметиланілін, піридин, 4-N,N-диметиламінопіридин або 1,8-дізабіцикло[5.4.0]-7-ундецен.

Кількість основи, яка має бути застосована, може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 1моль до великого надлишку на 1моль сполуки формули [XIV-1] і складає переважно від 1,0 до 1,5моль.

Температура реакції може необов'язково бути вибрана з діапазону від -30°C до температури флегми реакційної системи і знаходиться переважно в діапазоні від -10°C до 100°C.

Час реакції варіює в залежності від температури реакції, реакційного субстрату, кількості реакційних компонентів і тому подібне і складає, як правило, від 10 хвилин до 20 годин.

#### <Спосіб виробництва 8>



де  $Y_2$  являє собою атом галогену, алкоксильну групу або алкілїтїгруппу, яка може бути заміщена галогеном, а  $R_1'$ ,  $A_1$ ,  $A_3$ ,  $B_2$ ,  $B_4$ ,  $R$  і  $n$  - як це визначено вище.

#### (Стадія 3)

Сполука формули [I] у відповідності до даного винаходу може бути одержана шляхом введення в реакцію сполуки формули [XVII-1], отриманої із сполуки формули [XVI-1], і галогенангідриду, ангі-

дриду кислоти або тому подібне зі сполукою формули [XVIII].

Кількість сполуки формули [XVII-1] може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 1,0 до 5,0моль на 1моль сполуки формули [XVIII] і складає переважно від 1,0 до 1,5моль.

Розчинник, який має бути застосований на цій стадії, може, наприклад, являти собою простий ефір, наприклад діетиловий ефір, тетрагідрофуран або діоксан, вуглеводень ароматичного ряду, наприклад, бензол, толуол, ксилол або хлорбензол, апротонний полярний розчинник, наприклад, ацетонітрил, N,N-диметилформамід, N,N-диметилацетамід, N-метил-2-піролідон, диметилсульфоксид або сульфолан, спирт, наприклад, метанол, етанол або ізопропіловий спирт, галогенований вуглеводень, наприклад, метиленхлорид, хлороформ або дихлоретан, вуглеводень аліфатичного ряду, наприклад, пентан, гексан, циклогексан або гептан, кетон, наприклад, ацетон, метилетилкетон або циклогексанон, або воду.

Температура реакції може необов'язково бути вибрана з діапазону від -30°C до температури флегми реакційної системи і знаходиться переважно в діапазоні від -10°C до 100°C.

Час реакції варіює в залежності від температури реакції, реакційного субстрату, кількості реакційних компонентів і тому подібне і складає, як правило, від 10 хвилин до 20 годин.

#### (Стадія 4)

Крім того, цільове похідне 3-тріазолілфенілсульфіду формули [I-3] може бути одержано шляхом введення в реакцію сполуки формули [XVII-2], отриманої із сполуки формули [XVI-2], і дисульфиду вуглецю, галогеналкілу або тому подібне зі сполукою формули [XVIII].

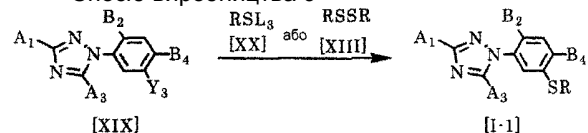
Кількість сполуки формули [XVII-2] може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 1,0 до 10моль на 1моль сполуки формули [XVIII] і складає переважно від 1,0 до 1,5моль.

Розчинник, який має бути застосований на цій стадії, може являти собою той же розчинник, як це визначено для зазначеної вище стадії 3.

Температура реакції може необов'язково бути вибрана з діапазону від -30°C до температури флегми реакційної системи і знаходиться переважно в діапазоні від -10°C до 100°C.

Час реакції варіює в залежності від температури реакції, реакційного субстрату, кількості реакційних компонентів і тому подібне і складає, як правило, від 10 хвилин до 20 годин.

#### <Спосіб виробництва 9>



де  $Y_3$  являє собою атом водню або атом галогену, а  $L_3$ ,  $A_1$ ,  $A_3$ ,  $B_2$ ,  $B_4$  і  $R$  - як це визначено вище.

Сполука формули [I-1] у відповідності до даного винаходу може бути одержана шляхом введення в реакцію сполуки формули [XIX] з металом або металоорганічною сполукою і подальшим введенням в реакцію зі сполукою формули [XX] або [XIII].

Кількість сполуки формули [XX] або [XIII], що має бути застосована, може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 1 до 5 моль на 1 моль сполуки формули [XIX] і складає переважно від 1,0 до 2,0 моль.

Розчинник, який має бути застосований в цій реакції, може, наприклад, являти собою простий ефір, наприклад, діетиловий ефір, тетрагідрофуран або діоксан, вуглеводень ароматичного ряду, наприклад, бензол, толуол, ксилол або хлорбензол, вуглеводень аліфатичного ряду, наприклад, пентан, гексан, циклогексан або гептан, або піридин, наприклад, піридин або піколін, або розчинювальну суміш цих компонентів.

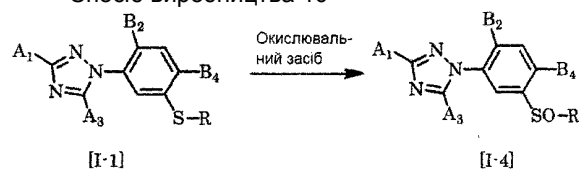
Метал, який має бути застосований в цій реакції, може, наприклад, являти собою лужний метал, наприклад, літій, або лужноземельний метал, наприклад, магній, а його кількість, яка має бути застосована, може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 1 до 3 моль на 1 моль сполуки формули [XIX] і складає переважно від 1,0 до 1,1 моль.

Металоорганічна сполука, яка має бути застосована в цій реакції, може, наприклад, являти собою алкіллітій, наприклад, n-бутиллітій, а її кількість, яка має бути застосована, може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 1 до 3 моль на 1 моль сполуки формули [XIX] і складає переважно від 1,0 до 1,1 моль.

Температура реакції може необов'язково бути вибрана з діапазону від -90°C до температури флегми реакційної системи і знаходиться переважно в діапазоні від -78°C до 70°C.

Час реакції варіює в залежності від температури реакції, реакційного субстрату, кількості реакційних компонентів і тому подібне і складає, як правило, від 10 хвилин до 20 годин.

#### <Спосіб виробництва 10>



де  $A_1$ ,  $A_3$ ,  $B_2$ ,  $B_4$  і  $R$  - як це визначено вище.

Сполука формули [I-4] у відповідності до даного винаходу може бути одержана шляхом введення в реакцію сполуки формули [I-1] з окислювальним засобом в присутності або при відсутності каталізатора.

Окислювальний засіб може, наприклад, являти собою пероксид водню, т-хлорпербензойну кислоту, періодат натрію, OXONE (торгове найменування, виробляється E.I. du Pont; містить гідрпероксосульфат калію), N-хлорсукцинімід, N-бромсукцинімід, трет-бутилгіпохлорит або гіпохлорит натрію.

Кількість окислювального засобу, який має бути застосований, може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 1 до 6 моль на 1 моль сполуки формули [I-1] і складає переважно від 1,0 до 1,2 моль.

Каталізатор, який має бути застосований в цій реакції, може, наприклад, являти собою вольфрамат натрію.

Кількість каталізатора, який має бути застосований, може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 0 до 1 моль на 1 моль сполуки формули [I-1] і складає переважно від 0,01 до 0,1 моль.

Розчинник, який має бути застосований в цій реакції, може, наприклад, являти собою простий ефір, наприклад, діетиловий ефір, тетрагідрофуран або діоксан, вуглеводень ароматичного ряду, наприклад, бензол, толуол, ксилол або хлорбензол, апротонний полярний розчинник, наприклад, ацетонітрил, N,N-диметилформамід, N,N-диметилацетамід, N-метил-2-піролідон, диметилсульфоксид або сульфолан, спирт, наприклад, метанол, етанол або ізопропіловий спирт, галогенований вуглеводень, наприклад, метиленхлорид, хлороформ або дихлоретан, вуглеводень

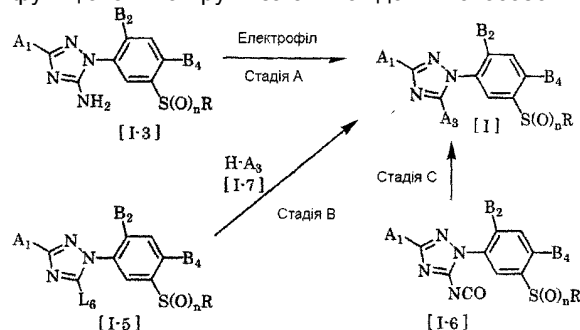
аліфатичного ряду, наприклад, пентан, гексан, циклогексан або гептан, кетон, наприклад, ацетон, метилетилкетон або циклогексанон, або воду або розчинювальну суміш цих компонентів.

Температура реакції може необов'язково бути вибрана з діапазону від -30°C до температури флегми реакційної системи і знаходиться переважно в діапазоні від -10°C до 100°C.

Час реакції варіює в залежності від температури реакції, реакційного субстрату, кількості реакційних компонентів і тому подібне і складає, як правило, від 10 хвилин до 20 годин.

#### <Спосіб виробництва 11>

Сполука формули [I] у відповідності до даного винаходу може бути одержана із похідного 3-тріазолілфенілсульфіду шляхом перетворення функціональної групи загальновідомим способом:



де  $A_1$ ,  $A_3$ ,  $B_2$ ,  $B_4$ ,  $n$  і  $R$  - як це визначено вище, а  $L_6$  являє собою атом водню, атом галогену, метилтиогрупу, метилсульфінільну групу, метилсульфонільну групу, p-толуолсульфонільну групу або тому подібне.

#### (Стадія А)

Сполука формули [I] у відповідності до даного винаходу може бути одержана шляхом введення в реакцію сполуки формули [I-3] у відповідності до даного винаходу з електрофільним реагентом в присутності або при відсутності розчинника, в присутності або при відсутності основи, в присутності або при відсутності кислоти і в присутності або при відсутності засобу для збезводнювального конденсування.

Електрофільний засіб, який має бути застосований на цій стадії, може, наприклад, являти собою галогенований алкан, галогенований алкен, галогенований алкін, фенолалкілгалогенід, гетероциклічний алкілгалогенід, ацилгалогенід, ангідрид

кислоти, бензойну кислоту, бензоїлгалогенід, гетероциклічну карбонову кислоту, галогенід карбонової кислоти гетероциклічного ряду, галогенід карбонової кислоти аліфатичного ряду, ізоціанат, спирт, галогенід ароматичного ряду, гетероциклічний галогенід, сульфонілгалогенід, або ангідрид сульфонової кислоти, або кетон або тіокетон.

Галогенований алкан, який має бути застосований на цій стадії, може, наприклад, являти собою метилйодид, етильйодид або пропілйодид.

Галогенований алкен, який має бути застосований на цій стадії, може, наприклад, являти собою алілбромід або 1,1,3-трихлорпропен.

Галогенований алкін, який має бути застосований на цій стадії, може, наприклад, являти собою пропаргілбромід або 4-хлор-2-бутин.

Фенілалкілгалогенід, який має бути застосований на цій стадії, може, наприклад, являти собою бензилбромід, 4-метоксибензилхлорид або 4-хлорбензилбромід.

Гетероциклічний алкілгалогенід, який має бути застосований на цій стадії, може, наприклад, являти собою 2-хлор-5-хлорметилпіридин.

Ацилгалогенід, який має бути застосований на цій стадії, може, наприклад, являти собою ацетилхлорид, пропіонілхлорид, дифторацетилхлорид, трифторацетилхлорид, метилхлорформіат, етилхлорформіат або N,N-диметилскарбамоїлхлорид.

Ангідрид кислоти, який має бути застосований на цій стадії, може, наприклад, являти собою оцтовий ангідрид, трифтороцтовий ангідрид або хлордифтороцтовий ангідрид.

Ізоціанат, який має бути застосований на цій стадії, може, наприклад, являти собою метилізоціанат, етилізоціанат або хлорсульфонілізоціанат.

Галогенід ароматичного ряду, який має бути застосований на цій стадії, може, наприклад, являти собою 3,5-дихлор-4-фторбензотрифторид.

Гетероциклічний галогенід, який має бути застосований на цій стадії, може, наприклад, являти собою 2,3-дихлор-5-трифторметилпіридин.

Сульфонілгалогенід, який має бути застосований на цій стадії, може, наприклад, являти собою трифторметансульфонілфторид, трифторметансульфонілхлорид або дифторметансульфонілхлорид.

Ангідрид сульфонової кислоти, який має бути застосований на цій стадії, може, наприклад, являти собою ангідрид трифторметансульфонової кислоти.

Кетон, що має бути застосований на цій стадії, може, наприклад, являти собою ацетон або 4-гідрокси-3-метоксибензальдегід.

Бензоїлгалогенід, який має бути застосований на цій стадії, може, наприклад, являти собою бензоїлхлорид.

Гетероциклічна карбонова кислота, яка має бути застосована на цій стадії, може, наприклад, являти собою 3-піридинкарбонову кислоту або тіофенкарбонову кислоту.

Галогенід карбонової кислоти гетероциклічного ряду, який має бути застосований на цій стадії, може, наприклад, являти собою хлорид 3-піридинкарбонової кислоти або хлорид тіофенкарбонової кислоти.

Галогенід карбонової кислоти аліфатичного ряду, який має бути застосований на цій стадії, може, наприклад, являти собою ацетилхлорид або пропіонілхлорид.

Спирт, який має бути застосований на цій стадії, може, наприклад, являти собою метанол, етанол або бензиловий спирт.

Кількість електрофільного засобу, який має бути застосований, може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 1 до 100 моль на 1 моль сполуки формули [I-3] і складає переважно від 1 до 10 моль, більш переважно від 1 до 3 моль.

У випадку, коли на цій стадії використовують основу, основа, яка має бути застосована, може, наприклад, являти собою неорганічну основу, наприклад, гідроксид лужного металу, наприклад, гідроксид натрію або гідроксид калію, гідроксид лужноземельного металу, наприклад, гідроксид кальцію або гідроксид магнію, карбонат лужного металу, наприклад, карбонат натрію або карбонат калію, або бікарбонат лужного металу, наприклад, гідрокарбонат натрію або гідрокарбонат калію, гідрид металу, наприклад, гідрид натрію або гідрид калію, металеву сіль спирту, наприклад, метоксид натрію, етоксид натрію або трет-бутоксид калію, або органічну основу, наприклад, тріетиламін, N,N-диметиланілін, піридин, 4-N,N-диметиламінопіридин або 1,8-діазабіцикло[5.4.0]-7-ундецен.

У випадку, коли використовують основу, кількість основи, яка має бути застосована, може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 0,01 до 3 моль на 1 моль сполуки формули [I-3] і складає переважно від 0,1 до 2 моль, більш переважно від 0,1 до 1,2 моль.

У випадку, коли на цій стадії використовують кислоту, кислота, яка має бути застосована, може, наприклад, являти собою кислоту Льюїса, наприклад, сульфоновою кислоту, наприклад, метансульфоновою кислоту або p-толуолсульфоновою кислоту, неорганічну кислоту, наприклад, хлористоводневу кислоту, бромистоводневу кислоту або сірчану кислоту, або карбонову кислоту, наприклад, оцтову кислоту або трифтороцтову кислоту.

У випадку, коли використовують кислоту, кількість кислоти, яка має бути застосована, може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 0,001 до 5 моль на 1 моль сполуки формули [I-3] і складає переважно від 0,01 до 2 моль, більш переважно від 0,03 до 1,0 моль.

Розчинник, який має бути застосований на цій стадії, може, наприклад, являти собою простий ефір, наприклад діетиловий ефір, тетрагідрофуран або діоксан, вуглеводень ароматичного ряду, наприклад, бензол, толуол, ксилол або хлорбензол, апротонний полярний розчинник, наприклад, ацетонітрил, N,N-диметилформамід, N,N-диметилацетамід, N-метил-2-піролідон, диметилсульфоксид або сульфолан, спирт, наприклад, метанол, етанол або ізопропіловий спирт, галогенований вуглеводень, наприклад, метиленхлорид, хлороформ або дихлоретан, вуглеводень аліфатичного ряду, наприклад, пентан, гексан, циклогексан або гептан, або кетон, наприклад, ацетон, ме-

тилкетон або циклогексанон, або розчинювальну суміш цих компонентів.

У випадку, коли на цій стадії використовують засіб збезводнювального конденсування, засіб збезводнювального конденсування, що має бути застосований, може являти собою карбодіїмід, наприклад, дициклогексилкарбодіїмід.

У випадку, коли використовують засіб збезводнювального конденсування, кількість засобу збезводнювального конденсування, який має бути застосований, може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 1 до 3 моль на 1 моль сполуки формули [I-3] і складає переважно від 1,0 до 1,2 моль.

Температура реакції може необов'язково бути вибрана з діапазону від -20°C до температури флегми реакційної системи і знаходиться переважно в діапазоні від 0°C до 80°C.

Час реакції варіює в залежності від температури реакції, реакційного субстрату, кількості реакційних компонентів і тому подібне і складає, як правило, від 15 хвилин до 24 годин.

(Стадія В)

Сполука формули [I] у відповідності до даного винаходу може бути одержана шляхом введення в реакцію сполуки формули [I-5] зі сполукою формули [I-7] в присутності або при відсутності основи в присутності розчинника.

У випадку, коли при здійсненні цього способу використовують основу, основа, яка має бути застосована в цій реакції, може, наприклад, являти собою неорганічну основу, наприклад, гідроксид лужного металу, наприклад, гідроксид натрію або гідроксид калію, гідроксид лужноземельного металу, наприклад, гідроксид кальцію або гідроксид магнію, карбонат лужного металу, наприклад, карбонат натрію або карбонат калію, або бікарбонат лужного металу, наприклад, гідрокарбонат натрію або гідрокарбонат калію, гідрид металу, наприклад, гідрид натрію або гідрид калію, металеву сіль спирту, наприклад, метоксид натрію, етоксид натрію або трет-бутоксид калію, або органічну основу, наприклад, тріетиламін, N,N-диметиламілін, піридин, 4-N,N-диметиламінопіридин або 1,8-дізабіцикло[5.4.0]-7-ундецен.

У випадку, коли використовують основу, кількість основи, яка має бути застосована, може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 1 до 10 моль на 1 моль сполуки формули [I-5] і складає переважно від 1 до 3 моль, більш переважно від 1,0 до 1,2 моль.

Розчинник, що має бути застосований на цій стадії, може, наприклад, являти собою простий ефір, наприклад діетиловий ефір, тетрагідрофуран або діоксан, вуглеводень ароматичного ряду, наприклад, бензол, толуол, ксилол або хлорбензол, апротонний полярний розчинник, наприклад, ацетонітрил, N,N-диметилформамід, N,N-диметилацетамід, N-метил-2-піролідон, диметилсульфоксид або сульфолан, спирт, наприклад, метанол, етанол або ізопропіловий спирт, галогенований вуглеводень, наприклад, метилхлорид, хлороформ або дихлоретан, вуглеводень аліфатичного ряду, наприклад, пентан, гексан, циклогексан або гептан, кетон, наприклад, ацетон, метиле-

тилкетон або циклогексанон, або вода або розчинювальна суміш цих компонентів також може бути використана.

Температура реакції може необов'язково бути вибрана з діапазону від -20°C до температури флегми реакційної системи і знаходиться переважно в діапазоні від -10°C до 150°C.

Час реакції варіює в залежності від температури реакції, реакційного субстрату, кількості реакційних компонентів і тому подібне і складає, як правило, від 15 хвилин до 12 годин.

(Стадія С)

Сполука у відповідності до даного винаходу, представлена формулою [I], може бути одержана шляхом введення в реакцію сполуки формули [I-6] з аміном, карбоною кислотою або спиртом в присутності або при відсутності розчинника.

Амін, який має бути застосований на цій стадії, може, наприклад, являти собою метиламін, етиламін, диметиламін, пропіламін, ізопропіламін, гідразин або метилгідразин.

Карбонова кислота, яка має бути застосована на цій стадії, може, наприклад, являти собою оцтову кислоту, пропіонову кислоту, метоксіоцтову кислоту або бензойну кислоту.

Спирт, який має бути застосований на цій стадії, може, наприклад, являти собою метанол, етанол, пропанол, аліловий спирт, пропаргіловий спирт або циклопропанол.

Щодо кількості аміну, карбонової кислоти або спирту, які мають бути застосовані, використовують від 1 моль до 100 моль, переважно від 1 моль до 30 моль, більш переважно від 1 моль до 3 моль аміну, карбонової кислоти або спирту на 1 моль сполуки, представленої формулою [I-6].

Розчинник, який має бути застосований в цій реакції, може, наприклад, являти собою простий ефір, наприклад діетиловий ефір, тетрагідрофуран або діоксан, вуглеводень ароматичного ряду, наприклад, бензол, толуол, ксилол або хлорбензол, апротонний полярний розчинник, наприклад, ацетонітрил, N,N-диметилформамід, N,N-диметилацетамід, N-метил-2-піролідон, диметилсульфоксид або сульфолан, спирт, наприклад, метанол, етанол або ізопропіловий спирт, галогенований вуглеводень, наприклад, метилхлорид, хлороформ або дихлоретан, вуглеводень аліфатичного ряду, наприклад, пентан, гексан, циклогексан або гептан, кетон, наприклад, ацетон, метилетилкетон або циклогексанон, або розчинювальну суміш цих компонентів.

Температура реакції може необов'язково бути вибрана з діапазону від -20°C до температури флегми реакційної системи і знаходиться переважно в діапазоні від -10°C до 150°C.

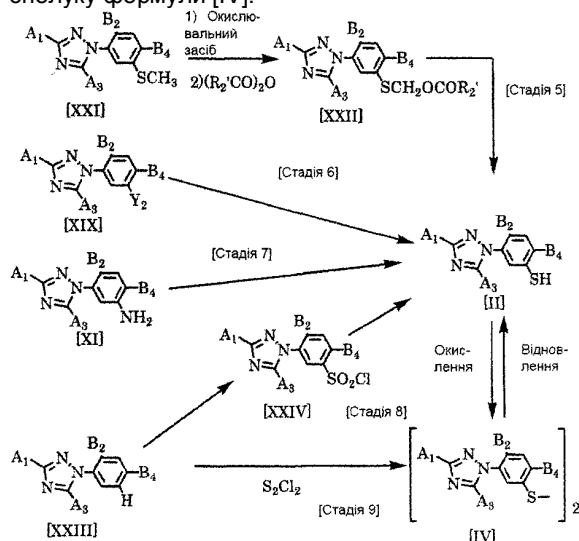
Час реакції варіює в залежності від температури реакції, реакційного субстрату, кількості реакційних компонентів і тому подібне і складає, як правило, від 30 хвилин до 24 годин.

Нижче наданий більш детальний опис синтезу проміжних сполук для виробництва сполук у відповідності до даного винаходу.

<Спосіб виробництва проміжних сполук 1 >

Синтез проміжних сполук [II] і [IV]

Сполуки формул [II] і [IV] можуть бути синтезовані наступним чином. Нема потреби говорити, що вони можуть взаємно перетворюватися через реакцію окислення-відновлення. Особливо сполука формули [II] може в деяких випадках бути легко окислена атмосферним киснем з перетворенням в сполуку формули [IV]:



де  $R_2'$  являє собою метильну групу або триформетильну групу, а  $Y_2$ ,  $A_1$ ,  $A_3$ ,  $B_2$  і  $B_4$  - як це визначено вище.

(Стадія 5)

Більш конкретно, цільова сполука, представлена формулою [II] або [IV], може бути одержана наступним чином. Сполуку формули [XXI] окислюють окислювальним засобом в метилсульфоксид з подальшим перетворенням в ацилоксиметилсульфід, представлений формулою [XXII], шляхом проведення реакції перегрупування Пумерера з використанням оцтового ангідриду або трифтороцтового ангідриду, після чого отриману сполуку гідролізують.

Окислювальний засіб може, наприклад, являти собою пероксид водню, m-хлорпербензойну кислоту, періодат натрію, OXONE (торгове найменування, виробляється E.I. du Pont; містить гідропероксосульфат калію), N-хлорсукцинімід, N-бромсукцинімід, трет-бутилгіпохлорит або гіпохлорит натрію.

Кількість окислювального засобу, який має бути застосований, може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 1 до 3 моль на 1 моль сполуки формули [XXI] і складає переважно від 1,0 до 1,2 моль.

Щодо кількості оцтового ангідриду або трифтороцтового ангідриду, які мають бути застосовані, вони можуть бути застосовані як реакційний розчинник в кількості 1 моль або більше на 1 моль сполуки формули [XXI], і ця кількість складає переважно від 1,0 до 3,0 моль.

Температура кожної реакції може необов'язково бути вибрана з діапазону від  $-10^\circ\text{C}$  до температури флегми реакційної системи і знаходиться переважно в діапазоні від  $0^\circ\text{C}$  до  $50^\circ\text{C}$ .

Час реакції варіює в залежності від температури реакції, реакційного субстрату, кількості реак-

ційних компонентів і тому подібне і складає, як правило, від 5 хвилин до 12 годин.

(Стадія 6)

Сполука, представлена формулою [II], може бути одержана шляхом обробки сполуки формули [XIX] металом або металоорганічною сполукою в розчиннику з подальшим введенням в реакцію з сіркою.

Розчинник, який має бути застосований на цій стадії, може, наприклад, являти собою простий ефір, наприклад, діетиловий ефір, тетрагідрофуран або діоксан, вуглеводень ароматичного ряду, наприклад, бензол, толуол, ксилол або хлорбензол, вуглеводень аліфатичного ряду, наприклад, пентан, гексан, циклогексан або гептан, або піридин, наприклад, піридин або піколін, або розчинувальну суміш цих компонентів.

Метал, який має бути застосований на цій стадії, може, наприклад, являти собою літій або магній.

Кількість металу, який має бути застосований, може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 1 до 3 моль на 1 моль сполуки формули [XIX] і складає переважно від 1,0 до 1,2 моль.

Металоорганічна сполука, яка має бути застосована на цій стадії, може, наприклад, являти собою n-бутиллітій.

Кількість металоорганічної сполуки, яка має бути застосована, може необов'язково бути вибрана з діапазону від 1 до 3 моль на 1 моль сполуки формули [XIX] і складає переважно від 1,0 до 1,2 моль.

Кількість сірки, яка має бути застосована, може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 1 до 5 моль на 1 моль сполуки формули [XIX] і складає переважно від 1,0 до 2,0 моль.

Температура кожної реакції може необов'язково бути вибрана з діапазону від  $-60^\circ\text{C}$  до температури флегми реакційної системи і знаходиться переважно в діапазоні від  $-60^\circ\text{C}$  до кімнатної температури.

Час реакції варіює в залежності від температури реакції, реакційного субстрату, кількості реакційних компонентів і тому подібне і складає, як правило, від 30 хвилин до 12 годин.

(Стадія 7)

Сполука, представлена формулою [II], може бути одержана наступним чином. Сполуку, представлену формулою [XI], перетворюють на сіль діазонію таким же чином, як і в зазначеному вище способі виробництва 6. Потім сіль діазонію вводять в реакцію з ксантатом або тіоціанатом з подальшим проведенням лужного гідролізу.

Кількість ксантату або тіоціанату, які мають бути застосовані, може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 1 до 3 моль на 1 моль сполуки формули [XI] і складає переважно від 1,0 до 1,5 моль.

Температура кожної реакції може необов'язково бути вибрана з діапазону від  $-70^\circ\text{C}$  до температури флегми реакційної системи і знаходиться переважно в діапазоні від  $-20^\circ\text{C}$  до  $100^\circ\text{C}$ .

Час реакції варіює в залежності від температури реакції, реакційного субстрату, кількості реак-

ційних компонентів і тому подібне і складає, як правило, від 10 хвилин до 20 годин.

(Стадія 8)

Синтетична проміжна сполука, представлена формулою [II], може бути одержана шляхом обробки сполуки формули [XXIII] хлорсульфоновою кислотою з перетворенням в сульфонілхлорид формули [XXIV] і його відновленням алюмогідридом літію, цинком і кислотою, оловом і кислотою або червоним фосфором і йодом.

Кількість хлорсульфонової кислоти, яка має бути застосована на цій стадії, може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 2 до 5 моль на 1 моль сполуки формули [XXIII] і складає переважно від 2,2 до 3,0 моль.

Кислота може, наприклад, являти собою хлористоводневу кислоту або сірчану кислоту.

Кількість хлорсульфонової кислоти, яка має бути застосована, може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 2 до 10 моль на 1 моль сполуки формули [XXIII] і складає переважно від 2,2 до 3,5 моль.

Кількість алюмогідриду літію, цинку і кислоти, олова і кислота або червоного фосфору і йоду може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 1 до 5 моль на 1 моль сполуки формули [XXIII] і складає переважно від 1,5 до 2,0 моль.

(Стадія 9)

Сполука, представлена формулою [IV], може бути одержана шляхом введення в реакцію сполуки формули [XXIII] з дихлоридом в присутності або при відсутності каталізатора. Крім того, сполука, представлена формулою [II], може бути одержана шляхом відновлення сполуки, представленої формулою [IV], загальновідомим способом.

Кількість дихлориду піросірчаної кислоти, який має бути застосований, може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 1 до 5 моль на 1 моль сполуки формули [XXIII] і складає переважно від 1,1 до 1,5 моль.

Каталізатор, який має бути застосований на цій стадії, може, наприклад, являти собою каталізатор на основі кислот Льюїса, наприклад, хлорид алюмінію, хлорид олова(II) або хлорид олова(IV).

Кількість каталізатора, який має бути застосований, може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 1 до 5 моль на 1 моль сполуки формули [XXIII] і складає переважно від 1,1 до 2,0 моль.

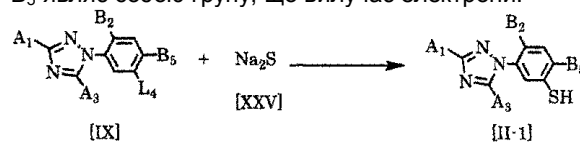
Розчинник, який має бути застосований на цій стадії, може, наприклад, являти собою галогенований вуглеводень, наприклад, метиленхлорид, хлороформ або дихлоретан, або вуглеводень ароматичного ряду, наприклад, хлорбензол або дихлорбензол.

Температура реакції може необов'язково бути вибрана з діапазону від -30°C до температури флегми реакційної системи і знаходиться переважно в діапазоні від -10°C до 100°C.

Час реакції варіює в залежності від температури реакції, реакційного субстрату, кількості реакційних компонентів і тому подібне і складає, як правило, від 1 до 20 годин.

<Спосіб виробництва проміжних сполук 2>

Крім того, синтетична проміжна сполука формули [II-1] може бути одержана шляхом проведення реакції заміщення із сполуки формули [IX], де B<sub>5</sub> являє собою групу, що випускає електрони:



де L<sub>4</sub>, A<sub>1</sub>, A<sub>3</sub>, B<sub>2</sub> і B<sub>5</sub> - як це визначено вище.

Більш конкретно, цільове похідне 3-тріазолілфенілтіолу, представлене формулою [II-1], може бути одержане шляхом введення в реакцію сполуки формули [IX] зі сполукою формули [XXV] в розчиннику в присутності основи з подальшим здійсненням нейтралізації мінеральною кислотою або тому подібне.

Кількість сполуки формули [XXV], яка має бути застосована, може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 1 до 3 моль на 1 моль сполуки формули [IX] і складає переважно від 1,0 до 1,5 моль.

Розчинник, який має бути застосований на цій стадії, може, наприклад, являти собою простий ефір, наприклад діетиловий ефір, тетрагідрофуран або діоксан, вуглеводень ароматичного ряду, наприклад, бензол, толуол, ксилол або хлорбензол, апротонний полярний розчинник, наприклад, ацетонітрил, N,N-диметилформамід, N,N-диметилацетамід, N-метил-2-піролідон, диметилсульфоксид або сульфолан, спирт, наприклад, метанол, етанол або ізопропіловий спирт, галогенований вуглеводень, наприклад, метиленхлорид, хлороформ або дихлоретан, вуглеводень аліфатичного ряду, наприклад, пентан, гексан, циклогексан або гептан, кетон, наприклад, ацетон, метилетилкетон або циклогексанон, або воду.

Основа, яка має бути застосована на цій стадії, може, наприклад, являти собою неорганічну основу, наприклад, гідроксид лужного металу, наприклад, гідроксид натрію або гідроксид калію, гідроксид лужноземельного металу, наприклад, гідроксид кальцію або гідроксид магнію, карбонат лужного металу, наприклад, карбонат натрію або карбонат калію, або бікарбонат лужного металу, наприклад, бікарбонат натрію або бікарбонат калію, гідрид металу, наприклад, гідрид натрію або гідрид калію, металеву сіль спирту, наприклад, метоксид натрію, етоксид натрію або трет-бутоксид калію, або органічну основу, наприклад, тріетиламін, N,N-диметиланілін, піридин, 4-N,N-диметиламінопіридин або 1,8-діазабіцикло[5.4.0]-7-ундецен.

Кількість основи, яка має бути застосована, може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 1 до 5 моль на 1 моль сполуки формули [IX] і складає переважно від 1,0 до 1,2 моль.

Мінеральна кислота може, наприклад, являти собою хлористоводневу кислоту або сірчану кислоту.

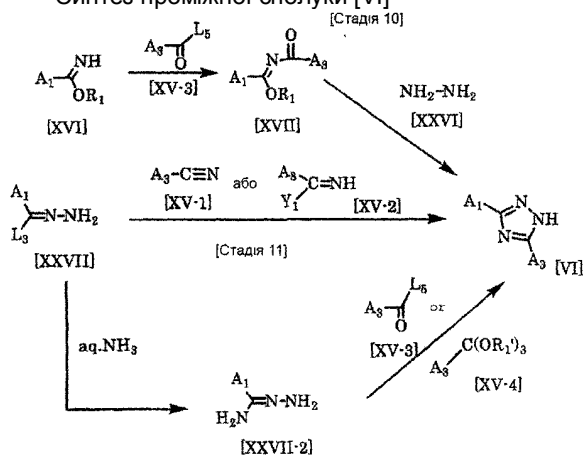
Кількість мінеральної кислоти, яка має бути застосована, може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 1 до 5 моль на 1 моль сполуки формули [IX] і складає переважно від 1,0 до 2,0 моль.

Температура реакції може необов'язково бути вибрана з діапазону від  $-30^{\circ}\text{C}$  до температури флегми реакційної системи і знаходиться переважно в діапазоні від  $-20^{\circ}\text{C}$  до  $100^{\circ}\text{C}$ .

Час реакції варіює в залежності від температури реакції, реакційного субстрату, кількості реакційних компонентів і тому подібне і складає, як правило, від 10 хвилин до 20 годин.

<Спосіб виробництва проміжних сполук 3>

Синтез проміжної сполуки [VI]



де  $A_1$ ,  $A_3$ ,  $R'$ ,  $Y_1$ ,  $L_3$  і  $L_5$  - як це визначено вище. (Стадія 10)

Синтетична проміжна сполука, представлена формулою [VI], може бути одержана таким же чином, як і в способі виробництва 8, шляхом перетворення сполуки формули [XVI] в сполуку формули [XVII] і введення її в реакцію з гідразингідратом формули [XXVI].

Кількість гідразингідрату формули [XXVI], який має бути застосований, може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 1 до 5 моль на 1 моль сполуки формули [XVII] і складає переважно від 1,0 до 2,0 моль.

(Стадія 11)

Крім того, синтетична проміжна сполука, представлена формулою [VI], може бути одержана таким же чином, як і в способі виробництва 7, шляхом введення в реакцію сполуки формули [XXVII] зі сполукою формули [XV-1] або [XV-2].

Кількість сполуки, представлена формулою [XV-1] або [XV-2], які мають бути застосовані, знаходиться в межах від 1 моль до великого надлишку на 1 моль сполуки формули [XXVII] і складає переважно від 1,0 до 2,0 моль.

Температура реакції може необов'язково бути вибрана з діапазону від  $-70^{\circ}\text{C}$  до температури флегми реакційної системи і знаходиться переважно в діапазоні від  $-20^{\circ}\text{C}$  до  $100^{\circ}\text{C}$ .

Час реакції варіює в залежності від температури реакції, реакційного субстрату, кількості реакційних компонентів і тому подібне і складає, як правило, від 10 хвилин до 20 годин.

(Стадія 12)

Синтетична проміжна сполука, представлена формулою [VI], може бути одержана шляхом введення в реакцію сполуки, представлені формулою [XXVII], з водним аміаком з метою одержання амідразону, представленого формулою [XXVII-2], і

введення цього продукту реакції в реакцію зі сполукою, представленою формулою [XV-3] або [XV-4].

Кількість водного аміаку, який має бути застосований, може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 1 до 10 моль на 1 моль сполуки, представлені формулою [XXVII], і складає переважно від 2,0 до 5,0 моль.

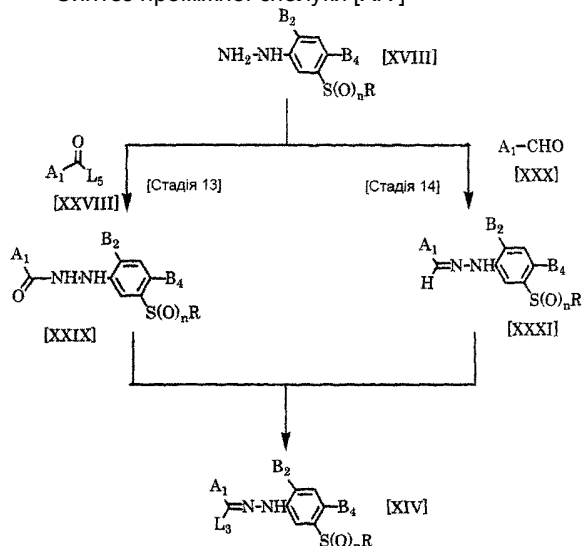
Кількість сполуки, представлені формулою [XV-3] або [XV-4], знаходиться в межах від 1 моль до великого надлишку на 1 моль сполуки, представлені формулою [XXVII-2], і складає переважно від 1,0 до 2,0 моль.

Температура реакції може необов'язково бути вибрана з діапазону від  $-70^{\circ}\text{C}$  до температури флегми реакційної системи і знаходиться переважно в діапазоні від  $-20^{\circ}\text{C}$  до  $100^{\circ}\text{C}$ .

Час реакції варіює в залежності від температури реакції, реакційного субстрату, кількості реакційних компонентів і тому подібне і складає, як правило, від 10 хвилин до 20 годин.

<Спосіб виробництва проміжних сполук 4>

Синтез проміжної сполуки [XIV]



де  $L_3$ ,  $L_5$ ,  $A_1$ ,  $B_2$ ,  $B_4$ ,  $R$  і  $n$  - як це визначено вище.

(Стадія 13)

Цільова сполука, представлена формулою [XIV], може бути одержана шляхом введення в реакцію похідного фенілгідрозину, представленого формулою [XVIII], зі сполукою, представленою формулою [XXVII], в розчиннику в присутності основи для ацилювання з метою одержання сполуки, представлені формулою [XXIX], з подальшою обробкою сполуки, представлені формулою [XXIX], засобом для галогенування.

Кількість сполуки формули [XXVII], яка має бути застосована, може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 1 до 5 моль на 1 моль сполуки формули [XVIII] і складає переважно від 1,0 до 1,1 моль.

Розчинник, який має бути застосований на цій стадії, може, наприклад, являти собою простий ефір, наприклад діетиловий ефір, тетрагідрофуран або діоксан, вуглеводень ароматичного ряду, наприклад, бензол, толуол, ксилол або хлорбензол,

галогенований вуглеводень, наприклад, дихлорметан, хлороформ або дихлоретан, апротонний полярний розчинник, наприклад, ацетонітрил, N,N-диметилформамід, N,N-диметилацетамід, N-метил-2-піролідон, диметилсульфоксид або сульфолан, спирт, наприклад, метанол, етанол або ізопропіловий спирт, нітрил, наприклад, ацетонітрил або пропіонітрил, складний ефір, наприклад, етилацетат або етилпропіонат, вуглеводень аліфатичного ряду, наприклад, пентан, гексан, циклогексан або гептан, піридин, наприклад, піридин або піколін, або воду або розчинювальну суміш цих компонентів.

Основа, яка має бути застосована на цій стадії, може, наприклад, являти собою неорганічну основу, наприклад, гідроксид лужного металу, наприклад, гідроксид натрію або гідроксид калію, гідроксид лужноземельного металу, наприклад, гідроксид кальцію або гідроксид магнію, карбонат лужного металу, наприклад, карбонат натрію або карбонат калію, або бікарбонат лужного металу, наприклад, гідрокарбонат натрію або гідрокарбонат калію, гідрид металу, наприклад, гідрид натрію або гідрид калію, металеву сіль спирту, наприклад, метоксид натрію, етоксид натрію або трет-бутоксид калію, або органічну основу, наприклад, тріетиламін, N,N-диметиланілін, піридин, 4-N,N-диметиламінопіридин або 1,8-дізабіцикло[5.4.0]-7-ундецен.

Кількість основи, яка має бути застосована, знаходиться в межах від 1 моль до великого надлишку на 1 моль сполуки формули [XVIII] і складає переважно від 1,0 до 1,2 моль.

Засіб для галогенування може, наприклад, являти собою трихлорид фосфору, трибромід фосфору, тіонілхлорид, оксихлорид фосфору, пентахлорид фосфору, тетрахлорид трифенілфосфіну/вуглецю або тетрабромід трифенілфосфіну/вуглецю.

Кількість засобу для галогенування, який має бути застосований, знаходиться в межах від 1 моль до великого надлишку на 1 моль сполуки формули [XXIX] і складає переважно від 1,0 до 1,5 моль.

Температура реакції може необов'язково бути вибрана з діапазону від -70°C до температури флегми реакційної системи і знаходиться переважно в діапазоні від -20°C до 150°C.

Час реакції варіює в залежності від температури реакції, реакційного субстрату, кількості реакційних компонентів і тому подібне і складає, як правило, від 10 хвилин до 20 годин.

(Стадія 14)

В іншому варіанті здійснення винаходу цільова сполука, представлена формулою [XIV], може бути одержана шляхом введення в реакцію похідного фенілгідрозину, представленого формулою [XVIII], з альдегідною сполукою, представленною формулою [XXX], в розчиннику в присутності або при

відсутності кислотного каталізатора з метою одержання похідного фенілгідрозону, представленого формулою [XXXI], з подальшою його обробкою засобом для галогенування.

Кількість сполуки формули [XXX], яка має бути застосована, може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 1 до 5 моль на 1 моль сполуки формули [XVIII] і складає переважно від 1,0 до 1,2 моль.

Тип розчинника, який має бути застосований на цій стадії, не обмежується, за умови, що він не гальмує реакцію, і він може, наприклад, являти собою вуглеводень ароматичного ряду, наприклад, бензол, толуол, або ксилол, простий ефір, наприклад, діетиловий ефір, тетрагідрофуран, 1,2-диметоксіетан або діоксан, кетон, наприклад, ацетон, метилетилкетон або циклогексанон, нітрил, наприклад, ацетонітрил або пропіонітрил, апротонний полярний розчинник, наприклад, диметилсульфоксид, N,N-диметилформамід або N,N-диметилацетамід, вуглеводень аліфатичного ряду, наприклад, пентан, гексан, циклогексан або гептан, або піридин, наприклад, піридин або піколін, або розчинювальну суміш цих компонентів.

Кислотний каталізатор, який має бути застосований на цій стадії, може, наприклад, являти собою кислоту Льюїса, наприклад, сульфонову кислоту, наприклад, р-толуолсульфонову кислоту, або тетрахлорид титану.

У випадку, коли використовують кислотний каталізатор, його кількість, яка має бути застосована, може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 1 до 5 моль на 1 моль сполуки формули [XVIII] і складає переважно від 1,0 до 1,2 моль.

Засіб для галогенування, який має бути застосований на цій стадії, може, наприклад, являти собою хлор, N-хлорсукцинімід, N-бромсукцинімід або трет-бутилгіпохлорит.

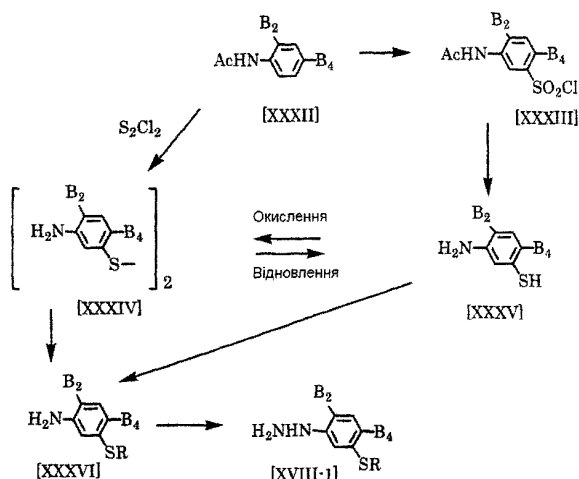
Кількість засобу для галогенування, який має бути застосований, може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 1 до 5 моль на 1 моль сполуки формули [XXXI] і складає переважно від 1,0 до 1,1 моль.

Температура реакції може необов'язково бути вибрана з діапазону від -70°C до температури флегми реакційної системи і знаходиться переважно в діапазоні від -20°C до 150°C.

Час реакції варіює в залежності від температури реакції, реакційного субстрату, кількості реакційних компонентів і тому подібне і складає, як правило, від 10 хвилин до 20 годин.

Фенілгідрозин формули [XVIII] може бути синтезований з відповідного аніліну у відповідності до будь-якого загальновідомого способу, наприклад, способом, який розкритий в [Comprehensive Organic Functional Group Transformations (Комплексні перетворення органічних функціональних груп), vol.2, p.769].





де  $B_2$ ,  $B_4$  і  $R$  - як це визначено вище, а  $Ac$  являє собою ацетильну групу.

Похідне 3-тіоаніліну, представлене формулою [XXXVI], може бути одержано шляхом перетворення ацетаніліду, представленого формулою [XXXII], в дисульфід, представлений формулою [XXXIV], або тіол, представлений формулою [XXXV], таким же чином, як і в способі виробництва проміжних сполук 1, з подальшим здійсненням способу, як це розкрито в зазначеному вище способі виробництва 1 або 2.

Фенілгідазин, представлений формулою [XVIII-1], може бути одержаний шляхом введення в реакцію сполуки, представлені формулою [XXXVI], з нітритом в присутності мінеральної кислоти з метою отримання солі діазонію і її відновлення порошком цинку, сульфідом, хлоридом олова або тому подібне.

Мінеральна кислота може, наприклад, являти собою хлористоводневу кислоту або сірчану кислоту.

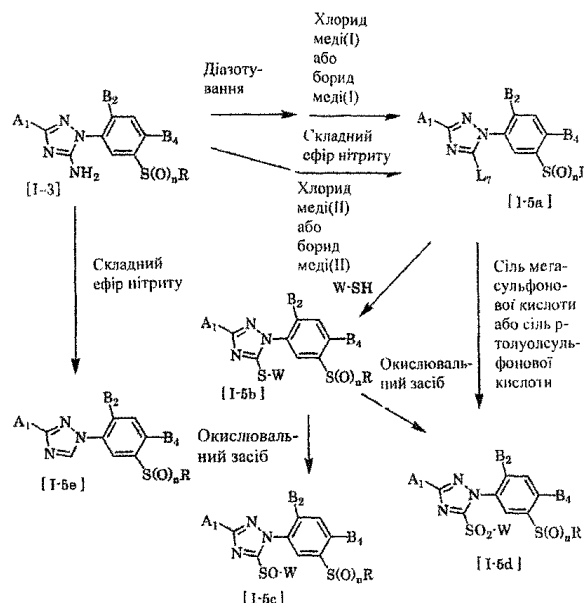
Кількість мінеральної кислоти, яка має бути застосована, може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 2 до 10 моль на 1 моль сполуки формули [XXXVI] і складає переважно від 3 до 5 моль.

Кількість нітриту, який має бути застосований, може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 1,0 до 5,0 моль на 1 моль сполуки [XXXVI] і складає переважно від 1,0 до 1,2 моль.

Температура реакції може необов'язково бути вибрана з діапазону від  $-20^{\circ}C$  до  $50^{\circ}C$  і знаходиться переважно в діапазоні від  $-5^{\circ}C$  до  $20^{\circ}C$ .

Час реакції варіює в залежності від температури реакції, реакційного субстрату, кількості реакційних компонентів і тому подібне і складає, як правило, від 30 хвилин до 5 годин.

Сполука формули [I-5] може бути одержана шляхом здійснення наступного способу:



Сполука формули [I-5a] може бути одержана шляхом діазотування сполуки формули [I-3] загальновідомим способом з подальшим проведенням реакції з хлоридом міді(I) або бромідом міді(I).

Кількість хлориду міді(I) або броміду міді(I), які мають бути застосовані, знаходиться в межах від 1 до 5 моль на 1 моль сполуки формули [I-3], переважно від 1 до 2 моль.

Розчинник, який має бути застосований, може, наприклад, являти собою карбонову кислоту, наприклад, оцтову кислоту, мінеральну кислоту, наприклад, хлористоводневу кислоту, бромистоводневу кислоту або сірчану кислоту, або воду або розчинювальну суміш цих компонентів.

Температура реакції може необов'язково бути вибрана з діапазону від  $-70^{\circ}C$  до температури флегми реакційної системи і знаходиться переважно в діапазоні від  $-20^{\circ}C$  до  $100^{\circ}C$ .

Час реакції варіює в залежності від температури реакції, реакційного субстрату, кількості реакційних компонентів і тому подібне і складає, як правило, від 10 хвилин до 20 годин.

Сполука формули [I-5a] може бути одержана також шляхом проведення реакції при взаємній присутності складного ефіру нітриту, наприклад, *t*-бутилнітриту або ізоамілнітриту і хлориду міді(II) або броміду міді(II) в розчиннику.

Кількість складного ефіру нітриту, який має бути застосований, знаходиться в межах від 1 до 5 моль на 1 моль сполуки формули [I-3], переважно від 1 до 2 моль.

Кількість хлориду міді(II) або броміду міді(II), які мають бути застосовані, знаходиться в межах від 1 до 5 моль на 1 моль сполуки формули [I-3], переважно від 1 до 2 моль.

Розчинник, який має бути застосований, може, наприклад, являти собою простий ефір, наприклад, діетиловий ефір, тетрагідрофуран або діоксан, нітрил, наприклад, ацетонітрил, або апротонний полярний розчинник, наприклад, *N,N*-диметилформамід, *N,N*-диметилацетамід, *N*-метил-2-піролідон, етансульфоксид або сульфолан, або розчинювальну суміш цих компонентів.

Температура реакції може необов'язково бути вибрана з діапазону від  $-70^{\circ}\text{C}$  до температури флегми реакційної системи і знаходиться переважно в діапазоні від  $-20^{\circ}\text{C}$  до  $100^{\circ}\text{C}$ .

Час реакції варіює в залежності від температури реакції, реакційного субстрату, кількості реакційних компонентів і тому подібне і складає, як правило, від 10 хвилин до 20 годин.

Сполука формули [I-5b] може бути одержана шляхом введення в реакцію сполуки формули [I-5a] з метилмеркаптаном або 4-метилбензолтіолом в розчиннику в присутності основи.

Основа, яка має бути застосована в цій реакції, може, наприклад, являти собою неорганічну основу, наприклад, гідроксид лужного металу, наприклад, гідроксид натрію або гідроксид калію, гідроксид лужноземельного металу, наприклад, гідроксид кальцію або гідроксид магнію, карбонат лужного металу, наприклад, карбонат натрію або карбонат калію, або бікарбонат лужного металу, наприклад, гідрокарбонат натрію або гідрокарбонат калію, гідрид металу, наприклад, гідрид натрію або гідрид калію, металеву сіль спирту, наприклад, метоксид натрію, етоксид натрію або трет-бутоксид калію, або органічну основу, наприклад, тріетиламін, N,N-диметиланілін, піридин, 4-N,N-диметиламінопіридин або 1,8-діазабіцикло[5.4.0]-7-ундецен.

Розчинник, який має бути застосований на цій стадії, може, наприклад, являти собою простий ефір, наприклад діетиловий ефір, тетрагідрофуран або діоксан, вуглеводень ароматичного ряду, наприклад, бензол, толуол, ксилол або хлорбензол, апротонний полярний розчинник, наприклад, N,N-диметилформамід, N,N-диметилацетамід, N-метил-2-піролідон, диметилсульфоксид або сульфолан, спирт, наприклад, метанол, етанол або ізопропіловий спирт, галогенований вуглеводень, наприклад, метиленхлорид, хлороформ або дихлоретан, вуглеводень аліфатичного ряду, наприклад, пентан, гексан, циклогексан або гептан, кетон, наприклад, ацетон, метилетилкетон або циклогексанон, або воду.

Сполука формули [I-5c] або [I-5d] може бути одержана шляхом введення в реакцію сполуки формули [I-5b] з окислювальним засобом, наприклад, пероксидом водню, m-хлорпербензойною кислотою, періодатом натрію, OXONE (торгове найменування, виробляється E.I. du Pont; містить гідропероксосульфат калію), N-хлорсукцинімідом, N-бромсукцинімідом, трет-бутилгіпохлоритом або гіпохлоритом натрію.

Кількість окислювального засобу, який має бути застосований, знаходиться, у разі одержання сполуки [I-5c], в межах від 0,5 до 1,5 моль, переважно від 0,8 до 1,2 моль, на 1 моль сполуки формули [I-5b]. Крім того, у разі одержання сполуки [I-5d], ця кількість знаходиться в межах від 2 до 10 моль, переважно від 2 моль до 4 моль, на 1 моль сполуки формули [I-5b].

Розчинник, який має бути застосований, температура реакції і час реакції - як це визначено для зазначеного вище способу виробництва 10.

Крім того, сполука формули [I-5d] може бути одержана також шляхом введення в реакцію спо-

луки, представленої формулою [I-5a], з сіллю метансульфонової кислоти або сіллю р-толуолсульфонової кислоти.

Кількість солі метансульфонової кислоти або солі р-толуолсульфонової кислоти, які мають бути застосовані, знаходиться в межах від 1 до 10 моль, переважно від 1 до 5 моль, більш переважно від 1 до 3 моль, на 1 моль сполуки формули [I-5a].

Розчинник, який має бути застосований, може, наприклад, являти собою нітрil, наприклад, ацетонітрil, або апротонний полярний розчинник, наприклад, диметилсульфоксид, N,N-диметилформамід або N,N-диметилацетамід.

Температура реакції може необов'язково бути вибрана з діапазону від  $0^{\circ}\text{C}$  до температури флегми реакційної системи і знаходиться переважно в діапазоні від  $10^{\circ}\text{C}$  до  $100^{\circ}\text{C}$ .

Час реакції варіює в залежності від температури реакції, реакційного субстрату, кількості реакційних компонентів і тому подібне і складає, як правило, від 1 до 24 годин.

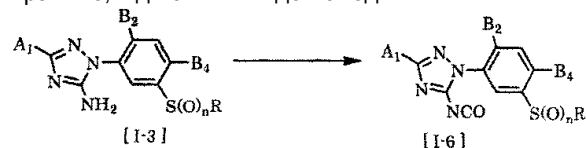
Сполука формули [I-5e] може бути одержана шляхом введення в реакцію сполуки формули [I-3] зі складним ефіром нітриту, наприклад, t-бутилнітритом або ізоаміlnітритом.

Кількість складного ефіру нітриту, який має бути застосований, знаходиться в межах від 1 до 5 моль на 1 моль сполуки формули [I-3] і складає переважно від 1 до 2 моль.

Розчинник, який має бути застосований, може, наприклад, являти собою простий ефір, наприклад діетиловий ефір, тетрагідрофуран або діоксан, нітрil, наприклад, ацетонітрil, або апротонний полярний розчинник, наприклад, N,N-диметилформамід, N,N-диметилацетамід, N-метил-2-піролідон, диметилсульфоксид або сульфолан, або розчинювальну суміш цих компонентів.

Температура реакції може необов'язково бути вибрана з діапазону від  $-70^{\circ}\text{C}$  до температури флегми реакційної системи і знаходиться переважно в діапазоні від  $-20^{\circ}\text{C}$  до  $100^{\circ}\text{C}$ .

Час реакції варіює в залежності від температури реакції, реакційного субстрату, кількості реакційних компонентів і тому подібне і складає, як правило, від 10 хвилин до 20 годин.



де  $A_1$ ,  $A_3$ ,  $B_2$ ,  $B_4$ ,  $n$  і  $R$  - як це визначено вище.

Сполука представлена формулою [I-6], може бути одержана загальновідомим способом шляхом введення в реакцію сполуки, представленої формулою [I-3], з оксалілхлоридом або фосгеном в присутності розчинника.

Кількість оксалілхлориду або фосгену, які мають бути застосовані, може відповідним чином бути вибрана з діапазону від 1 моль до тієї ж кількості, яка дорівнює кількості реакційного розчинника, на 1 моль сполуки, представленої формулою [I-3], і складає переважно від 1,1 до 3 моль.

Розчинник, який має бути застосований, може, наприклад, являти собою простий ефір, наприклад діетиловий ефір, тетрагідрофуран або діоксан,

вуглеводень ароматичного ряду, наприклад, бензол, толуол, ксилол або хлорбензол, галогенований вуглеводень, наприклад, дихлорметан, хлороформ або дихлоретан, вуглеводень аліфатичного ряду, наприклад, пентан, гексан, циклогексан або гептан, або розчинювальну суміш цих компонентів.

Коли сполука у відповідності до даного винаходу має бути застосована як активний інгредієнт пестициду, вона може бути застосована окремо як така. Проте, вона може бути сформульована у вигляді різноманітних складів для застосування, наприклад, концентрату, здатного до емульгування, суспензії, дусту, гранули, таблетки, змочувального порошку, водорозчинного концентрату, розчину, текучої суспензії, гранули, здатної до диспергування у воді, аерозолу, клею, масляного складу, концентрованої емульсії у воді і обкурювального засобу, в комбінації з різними носіями, поверхнево-активними речовинами і іншим добавками, які традиційно використовуються для формулювання складу як добавки сільськогосподарчого призначення. Їх змішують, як правило, в таких пропорціях, щоб масова частка активного інгредієнта знаходилась в межах від 0,1% до 90%, а масова частка добавки сільсько-господарчого призначення знаходилась в межах від 10% до 99,9%.

Носії, які мають бути застосовані для такого складу, можуть класифікуватися на тверді носії і на рідкі носії. Тверді носії включають, наприклад, порошки тваринного і рослинного походження, наприклад, крохмаль, активований вугіль, соєвий порошок, пшеничну муку, деревну муку, рибну муку і молочний порошок, і мінеральні порошки, наприклад, тальк, каолін, бентоніт, карбонат кальцію, цеоліт, діатомову землю, білу сажу, глину, глинозем, сульфат амонію і сечовину. Рідкі носії включають, наприклад, воду; спирти, наприклад, ізопропіловий спирт і етиленгліколь; кетони, наприклад, циклогексанон і мети лети лкетон; прості ефіри, наприклад, діоксан і тетрагідрофуран; вуглеводні аліфатичного ряду, наприклад, гас і світлий нафтопродукт; вуглеводні ароматичного ряду, наприклад, ксилол, триметилбензол, тетраметилбензол, метилнафталін і бензин-розчинник; галогеновані вуглеводні, наприклад, хлорбензол; амідні кислот, наприклад, диметилацетамід; складні ефіри, наприклад, гліцеринові ефіри жирних кислот; нітрили, наприклад, ацетонітрил; і сполуки, що містять сірку, наприклад, диметилсульфоксид.

Поверхнево-активні речовини включають, наприклад, металеві солі алкілбензолсульфонових кислот, металеві солі динафтилметандисульфонових кислот, солі оксисульфатів, алкіларилсульфонати, лігнінсульфонати, поліоксіетиленгліколеві ефіри, поліоксіетиленаалкіларилів ефіри і моноалкілати поліоксіетиленового сорбіту.

Інші добавки включають, наприклад, адгезійні засоби і згущувачі, наприклад, карбоксиметилцелюлозу, гуміарабік, аргінат натрію, гуарову смолу, трагакантову камедь і полівініловий спирт, противспінювальні засоби, наприклад, металеве мило, засоби для покращення фізичних характеристик,

наприклад, жирні кислоти, алкілфосфатні солі, силікон і парафін, і фарбувальні засоби.

При практичному застосуванні цих складів вони можуть використовуватись безпосередньо як такі або після розбавлення розріджувачем, наприклад, водою, до заздалегідь встановленої концентрації. Різнманітні склади, що містять сполуки у відповідності до даного винаходу, незалежно від того, чи розбавлені вони, чи ні, можуть бути застосовані з використанням загальновідомих способів, тобто, нанесенням (наприклад, обприскуванням, затуменням, розпиленням, обпудрюванням, нанесенням гранул, додаванням у воду зрошувальних рисових полів і внесенням у ящики для розсади), обробкою ґрунту (наприклад, підмішуванням або зрошуванням), нанесенням на поверхні (наприклад, фарбуванням, одяганням і покриттям), протравленням методом занурення, застосуванням отруйних приманок і обкурюванням. Крім того, зазначені вище активні інгредієнти можуть бути внесені в корм для худоби з метою запобігання інвазії або подальшого росту паразитів, особливо комах-паразитів, після того, як вони вийшли разом з екскрементами. В іншому варіанті здійснення винаходу вони можуть також застосовуватися в малому об'ємі у високій концентрації, де вміст активного інгредієнта може досягати аж 100%. Частка активного інгредієнта при необхідності вибирається відповідним чином і складає по суті від 0,1% до 20% (масова частка) у разі застосування у вигляді дусту або гранул, і від 1% до 80% (масова частка) у разі застосування у вигляді концентрату, що здатний до емульгування, або у вигляді змочувального порошку.

Пестициди у відповідності до даного винаходу застосовуються, коли вони розбавлені розріджувачем, як правило, при концентрації активного інгредієнта від 0,1 до 5,000 частин на мільйон. Коли вони використовуються окремо як такі, доза на одиницю площі складає від 0,1г до 5,000г на 1га в одиницях сполуки, яка застосовується як активний інгредієнт. Проте, доза не обмежена таким конкретним діапазоном.

Сполуки у відповідності до даного винаходу достатньо ефективні, коли вони застосовуються окремо як такі. Проте, вони можуть бути застосовані, якщо це необхідно, в комбінації або в домішці з добривами або іншими агрохімічними продуктами, наприклад, інсектицидами, акарицидами, нематоцидами, фунгіцидами, противірусними засобами, атрактантами, гербіцидами і регуляторами росту рослин, і таке комбіноване використання може іноді давати більш кращі результати.

Типові приклади інсектицидів, фунгіцидів, акарицидів і тому подібне, які можуть бути застосовані в комбінації зі сполуками у відповідності до даного винаходу, представлені нижче.

Інсектициди на основі фосфорорганічних сполук і карбаматів: фентіон, фенітротіон, діазинон, хлорпірифос, оксидепрофос, вамідотіон, фентоат (fentoat), диметоат, формотіон, малатіон, трихлорфон, тіометон, фосмет, дихлорвос, ацефат, ЕРВР, метил-паратіон, оксидиметон-метил, етіон, діоксабензофос, ціанофос (cyanofofos), ізоксатіон, піридафентіон, фосалон, метидатіон, сульпрофос

(sulprofos), хлорфенвінфос, тетрахлорвінфос, диметилвінфос, пропафос, ізофенфос, дисульфотон, профенофос, піраклофос, монокротофос, азинфос-метил, альдикарб, метоміл, тіодикарб, карбофуран, карбосульфат, бенфуракарб, фураціокарб, пропоксур, фенобкарб, метолкарб, ізопрокарб, карбарил (carbaril), піримікарб, етіофенкарб, дихлофентіон, піриміфос-метил, хіналфос, хлорпірифос-метил, протіофос, налед, EPN, ХМС, бендіокарб, оксаміл, аланікарб, хлоретоксифос і тому подібне.

Інсектициди на основі піретроїдів: перметрин, циперметрин, дельтаметрин, фенвалерат, фенпропатрин, піретрин, алетрин, тетраметрин, резметрин, диметрин, пропартрин, фенотрин, протрин, флувалінат, цифлутрин, цигалотрин, флуцитринат, етофенпрокс, циклопротрин, тралометрин, силфлуофен, тефлутрин, біфентрин, акринатрин і тому подібне.

Інсектициди на основі ацилсечовини і інші: дифлубензурон, хлорфлуазурон, гексафлумурон, трифлумурон, тефлубензурон, флуфеноксурон, флуциклоксурон, бупрофезин, пірипроксифен, луфенурон, циромазин, метопрен, ендосульфат, діафентіурон, імідаклоприд, ацетаміприд, нітенпірам, клотіанідин, дінотефуран, тіаметоксам, тіаклоприд, піметрозин, фіпроніл, піридаліл, нікотинсульфат, ротенон, металдегід, машинне масло, мікробні пестициди, наприклад, віруси ВТ і ентомопатогенні віруси, феноксикарб, картап, тіоциклам, бенсульфат, тебуфенозид, хлорфенапір, емаектин-бензоат, ацетаприд, нітенпірам, олеат натрію, масло насіння рапсу і тому подібне.

Нематоциди: фенаміфос, фостіазат, етопрофос, метилізотіоціанат, 1,3-дихлорпропен, DCIP і тому подібне.

Акарициди: хлорорбензилат, фенізобромолат, дикофол, амітраз, пропаргіт, бензомат, гексціязокс, фенбутаніоксид, полінактин, хінометонат, хлорфенсон, тетрадіфон, авермектин, мілбемектин, клофентезин, піридабен, фенпіроксимат, тебуфенпірад, піримідифен, фенотіокарб, діснохлор, етоксазол, біфеназат, ацехіноцил, галфенпрокс, спіродиклофен і тому подібне.

Фунгіциди: тіофанат-метил, беноміл, карбендазол, тіабендазол, фолпет, тіурам, дирам, зинеб, манеб, полікарбамат, іпробенфос, едифенфос, фталід, пробеназол, ізопротіолан, хлорталоніл, каптан, поліоксин, бластицидин-S, касугамуцин, стрептоміцин, валідаміцин, трициклазол, пірохілон, феназиноксид, мепроніл, флутоланіл, пенцикурон, іпродіон, гімексазол, металаксил, трифлумізол, трифорин, тріадимефон, бітретанол, фенаримол, пропіконазол, цимоксаніл, прохлораз, пефуразоат, гексаконазол, міклобутаніл, дикломезин, теклофталам, пропінеб, дитіанон, фосетил, вінклозолін, процимідон, оксациксил, гуазатин, пропамокарб-гідрохлорид, флуазинам, оксолінова кислота, гідроксізоксазол, мепаніпірим.

Сполуки у відповідності до даного винаходу демонструють чудову пестицидну активність проти комах-шкідників, наприклад, комах-шкідників ряду hemiptera (справжніх напівжорсткокрилих), комах-шкідників ряду lepidoptera (лускокрилих), комах-шкідників ряду coleoptera (твердокрилих), комах-

шкідників ряду diptera (двокрилих), комах-шкідників ряду hymenoptera (перетинчастокрилих), комах-шкідників ряду orthoptera (прямокрилих), комах-шкідників ряду izoptera (термітів), комах-шкідників ряду thysanoptera (пухирчастоногих), кліщів і нематод-шкідників рослин. До таких шкідників можна віднести наступні.

Комахи-шкідники ряду Hemiptera (справжні напівжорстко крилі): клопи різнокрилі (HETEROPTERA), наприклад, клоп бобовий (Riptortus clavatus), клоп-щитник південний зелений (Nezara viridula), клопи трав'яні виду (Lygus sp.), клоп-черепашка волосистий пшеничний північноамериканський (Blissus leucopterus) і клоп-мереживниця грушеподібний (Stephanitis nashi); цикадки сімейства (Deltocephalinae), наприклад, цикадка рисова листяна (Nephotettix cincticeps) і цикадки видів (Empoasca sp., Erythroneura sp., Circulifer sp.); дельфациди, наприклад, дельфацид рисовий коричневий (Nilaparvata lugens), дельфацид білозадий (Sogatella furcifera) і дельфацид малий коричневий (Laodelphax striatellus); попелиці, наприклад, мідянки виду (Psylla sp.); білокрилки, наприклад, білокрилка тютюнова (Bemisia tabaci) і білокрилка теплична (Trialeurodes vaporariorum); афіди, наприклад, філоксера виноградна (Viteus vitifolii), попелиця персикова зелена (Myzus persicae), попелиця яблунева зелена (Aphis pomi), попелиця бавовняна (Aphis gossypii), попелиця бурякова (Aphis fabae), попелиця псевдокапустяна (Rhopalosiphum psedobrassicae), попелиця теплична картопляна (Aulacorthum solani) і попелиця злакова звичайна (Schizaphis graminum); клопи або щитівки борошняні, наприклад, червець борошнистий Комстока (Pseudococcus comstocki), щитівка червона воскова (Ceroplastes rubens), щитівка каліфорнійська (Comstockaspis perniciosus) і щитівка східна цитрусова (Unaspis yanonensis) і клопи-хижнеці виду (Rhodnius sp.).

Комахи-шкідники ряду Lepidoptera (лускокрилі): наприклад, листовійка східна чайна (Homona magnanima), листовійка плодівих дерев літня (Adoxophyes orana), листовійки виду (Sparganothis pilleriana), листовійка східна персикова (Grapholitha molesta), свердлувальник соєвих бобів (Leguminivora glycinivorella), плодожерка яблунева (Laspeyresia pomonella), листовійки виду Eucosma sp. і листовійка Lobesia botrana; кохиліди сімейства Cochyliidae, наприклад, кохилід виноградної (Eupoecillia ambiguella); міщочниці, наприклад, виду Bambalina sp.; молі справжні, наприклад, міль європейська зернова (Nemapogon granellus) і міль меблева (Tinea translucens); молі вузкокрилі, наприклад, міль Lyonetia prunifoliella; молі-мінери вузкокрилі, наприклад, міль горностаєва яблунева (Phyllonorycter rigomella); сокоїдки сімейства Phyllocnistidae, наприклад, сокоїдка цитрусова (Phyllocnistis citrella); іпонометиди, наприклад, міль капустяна (Plutella xylostella) і міль Prays citri; скляниці, наприклад, склянниця виноградна (Paranthrene regalis) і склянниця виду Synanthedon sp.; гелехіди, наприклад, черв'як рожевий коробчастий бавовняний (Pectinophora gossypiella), личинка молі виїмчастокрилої (Phthorimaea operculella) і гелехіди виду Stomopteryx sp.; пло-

дожерки сімейства Carposinidae, наприклад, пло-  
дожерка персикова (*Carposina niponensis*); гусени  
слизовидільні, наприклад, слизневидки (*Monema  
flavescens*); вогнівки, наприклад, вогнівка стеблина  
на рисова азійська (*Chilo suppressalis*), листовійка  
рисова (*Snaphalocrocis medinalis*), вогнівка *Ostrinia  
nubilalis*, свердлувальник зерновий східний  
(*Ostrinia furnacalis*), гусінь вогнівки капустяної  
(*Hellula undalis*), міль велика воскова (*Galleria  
mellonella*), вогнівки *Elasmopalpus lignosellus* і  
*Loxostege sticticalis*; білянки, наприклад, білянка  
ріпна звичайна (*Pieris rapae*); п'ядениці, наприклад,  
п'ядениця лугова (*Ascotis selenaria*); коконопряди,  
наприклад, коконопряд, гусені якого будують спі-  
льні павутинні гнізда (*Malacosoma neustria*); мете-  
лики-бразники, наприклад, метелики *Manduca  
sexta*; волнянки, наприклад, волнянка чайна  
(*Euproctis pseudoconspersa*) і шовкопряд непар-  
ний (*Lymantria dispar*); ведмедки, наприклад, гусінь  
метелика білого американського (*Hyphantria  
cunea*); і совки, наприклад, совка тютюнова  
(*Heliothis virescens*), совка бавовняна (*Helicoverpa  
zea*), совка мала (*Spodoptera exigua*), черв'як коро-  
бчастий (*Helicoverpa ajmiger*), совка звичайна  
(*Spodoptera litura*), "похідний черв'як" капустяний  
(*Mamestra brassicae*), совка чорна (*Agrotis ipsiron*),  
"похідний черв'як" рисовий (*Pseudaletia separata*) і  
совка ні (*Trichoplusia ni*).

Комахи-шкідники ряду Coleoptera (твердокри-  
лі): хрущі, наприклад, хрущик мідянистий (*Anomala  
cuprea*), хрущик японський (*Popillia japonica*), хру-  
щик соевий (*Anomala rufocuprea*) і хрущик *Eutheola  
rugiceps*; жуки-лускуні, наприклад, дротяник видів  
(*Agriotes* sp.) і *Conodeus* sp.; сонечка, наприклад,  
сонечко двадцятивосьмиплямисте (*Epilachna  
vigintioctopunctata*) і сонечко бобове мексиканське  
(*Epilachna varivestis*); чорнотілки, наприклад, хру-  
щак каштановий (*Tribolium castaneum*); вусачи,  
наприклад, вусач білоплямистий (*Anoplophora  
malasiaca*) і вусач чорний сосновий (*Monochamus  
alternatus*); зернівки, наприклад, зернівка квасо-  
льова (*Acanthoscelides obtectus*) і зернівка квасо-  
льова адзукі (*Callosobruchus chinensis*); листоїди,  
наприклад, жук колорадський (*Leptinotarsa  
decemlineata*), блошиця длиновуса виду (*Diabrotica  
sp.*), листоїд рисовий (*Oulema oryzae*), листоїд бу-  
ряковий (*Chaetocnema concinna*), листоїди *Phaedon  
cochlearias*, *Oulema melanopus* і *Diadisa  
armigera*; апіоніди сімейства Arionidae, наприклад,  
апіонід *Arion godmani*; довгоносики, наприклад,  
довгоносик рисовий водяний (*Lissorhoptrus  
orysophilus*) і довгоносик бавовняний (*Anthonomus  
grandis*); слоники сімейства Rhynchophoridae, на-  
приклад, довгоносик кукурудзяний (*Sitophilus  
zeamais*); жуки-короїди; жуки-шкіроїди; і точильни-  
ки хлібні.

Комахи-шкідники ряду Diptera (двокрилі): дов-  
гоножка рисова (*Tipra ano*), дзвінець рисовий  
(*Tanytarsus oryzae*), галиця (*Orseolia oryzae*), муха  
плодова середньоземноморська (*Ceratitis capitata*),  
муха-мінер рисова (*Hydrellia griseola*), дроздофіла  
вишнева (*Drosophila suzukii*), мушка шведська  
(*Oscinella frit*), личинка плоджорки рисової  
(*Chlorops oryzae*), муха бобова французька  
(*Qphiomyia phaseoli*), муха бобова (*Liriomyza*

*trifolii*), муха бурякова (*Pegomya hvoscyami*), личин-  
ка мухи паросткової (*Hylemia platura*), муха соргова  
(*Atherigona soccata*), муха справжня (*Musca  
domestica*), оводи кінські виду (*Gastrophilus* sp.),  
жигалки звичайні виду (*Stomoxys* sp.), комар жов-  
тогарячковий (*Aedes aegypti*), комар звичайний  
(*Culex pipiens*), комар малярійний (*Anopheles  
slensis*) і комар *Culex tritaeniorhynchus*.

Комахи-шкідники ряду Hymenoptera (перетин-  
частокрилі): пильщики хлібні виду (*Sephus* sp.);  
товстоніжки виду (*Harmolita* sp.); пильщики капу-  
стяні виду (*Athalia* sp.), шершні виду (*Vespa* sp.) і  
мурашки Рихтера.

Комахи-шкідники ряду Orthoptera (прямокрилі):  
тарган рудий (*Blattella germanica*); тарган амери-  
канський (*Periplaneta americana*); кобилка афри-  
канська (*Grylotalpa africana*); сарана мігруюча азі-  
атська (*Locusta migratoria migratorioides*); кобилка і  
*Melanoplus sanguinipes*.

Комахи-шкідники ряду Isoptera (терміти): тер-  
міти (*Reticulitermes speratus*) і терміт (*Coptotermes  
formosanus*).

Комахи-шкідники ряду Thysanoptera (пухирча-  
стоногі): трипс жовтий чайний (*Scirtothrips dorsalis*);  
трипс динний (*Thrips palmi*); трипс тепличний  
(*Heliothrips haemorrhoidalis*); трипс пшеничний за-  
хідний (*Frankliniella occidentalis*) і трипс рисовий  
колючий (*Haplothrips aculeatus*).

Кліщі: кліщик павутинний двоплямистий  
(*Tetranychus urticae*); кліщик павутинний Kanzawa  
(*Tetranychus kanzawai*); кліщик павутинний цитру-  
совий (*Panonychus citri*); кліщик павутинний черво-  
ний європейський (*Panonychus ulmi*), кліщик паву-  
тинний жовтий (*Eotetranychus carpini*); кліщик  
червоний техаський (*Eotetranychus banksi*); кліщик  
рудастий цитрусовий (*Phyllocoptruta oleiyora*); кліщ  
широкий (*Poliphagotarsonemus latus*); кліщик паву-  
тинний несправжній виду (*Brevipalpus* sp.); кліщик  
кореневий (*Rhizoglyphus robini*) і кліщ плісенний  
(*Tyrophagus putrescentiae*).

Нематоди-шкідники рослин: нематода явансь-  
ка галова південна виду (*Meloidogyne* sp.); нема-  
тода-шкідник коріння виду (*Pratylenchus* sp.); нема-  
тода соєва (*Heterodera glycines*); нематода  
картопляна (*Globodera rostochiensis*); нематода  
бананова (*Radopholus similis*); нематода сунічна  
*fAphelenchoides fragariae*); нематода рисова  
(*Aphelenchoides besseyi*) і нематода соснякова  
(*Bursaphelenchus xylophilus*).

Інші шкідники, тварини-шкідники, антисанітарні  
комахи і паразити: черевоні молюски  
(Gastropoda), наприклад, ампулярії (*Pomacea  
canaliculata*), слизовики виду (*Indiana* sp.) і ахатина  
(*Achatina fulica*); рівноногі молюски (Isopoda), на-  
приклад, мокриця (*Armadillidium* sp.), мокриця зви-  
чайна і стоніжка; воші, наприклад, воші виду  
*Liposcelis* sp.; лускунниці, наприклад, лускунниці  
виду *Ctenolepisma* sp.; блохи, наприклад, блохи  
видів *Pulex* sp. і *Ctenocephalides* sp.; пухіди, що  
паразитують на птахів, наприклад, пухіди виду  
*Trichodectes* sp.; блошиці, наприклад, блошиці  
виду *Cimex* sp.; кліщі, що паразитують на твари-  
нах, наприклад, кліщі *Boophilus microplus* і  
*Haemaphysalis longicornis*, і кліщі сімейства  
Epidermoptidae.

Крім того, сполуки у відповідності до даного винаходу ефективні також при боротьбі з комахами-шкідниками, які проявляють опірність до фосфорорганічних сполук, сполук на основі карбаматів, синтетичних сполук на основі піретроїдів, сполук на основі ацилсечовини або до загальнодоміх інсектицидів.

#### Приклади

Нижче представлений більш детальний опис способів приготування, складів і способів використання сполук у відповідності до даного винаходу з посиланням на приклади. Описані також способи приготування синтетичних проміжних сполук у відповідності до даного винаходу.

#### Приклад 1

Приготування [5-(5-аміно-3-трифторметил-1,2,4-тріазоліл)-4-хлор-2-метилфеніл]-2,2,2-трифторетилсульфід (Сполука №7 у відповідності до даного винаходу)

(1) Синтез 5-ацетилтіо-2-хлор-4-метилацетаніліду

До 100мл хлорсульфонової кислоти додали 55г 2-хлор-4-метилацетаніліду при температурі від 5°C до 10°C. До змішаної рідини додали 65г 60%-ної димлячої сірчаної кислоти при температурі від 5°C до 15°C, після чого отриману суміш піддали перемішуванню при кімнатній температурі протягом 1 години і додатковому перемішуванню протягом 18 годин при 90°C. Після того, як отриману реакційну суміш охолодили до кімнатної температури, її влили у льодяну воду, додали толуол, відфільтрували нерозчинені домішки, а отриманий органічний шар промили водою і просушили над безводним сульфатом магнію. Розчинник відігнали в умовах зниженого тиску, суміш отриманого залишку, 31г червоного фосфору, 1г йоду і 200мл оцтової кислоти піддали нагріванню зі зворотним холодильником протягом 1 години, а отриману реакційну рідину охолодили до кімнатної температури. Після того, як нерозчинені домішки відфільтрували, рідину піддали концентруванню в умовах зниженого тиску, додали воду і здійснили екстрагування етилацетатом. Органічний шар промили водою і просушили над безводним сульфатом магнію, розчинник відігнали в умовах зниженого тиску, а залишок очистили методом колонкової хроматографії на силікагелі, в результаті чого було отримано 14г 5-ацетилтіо-2-хлор-4-метилацетаніліду.

(2) Синтез 2-хлор-4-метил-5-меркаптоаніліну

В 150мл етанолу розчинили 14г 5-ацетилтіо-2-хлор-4-метилацетаніліду і додали 22г 50%-ного водного розчину гідроксиду натрію з подальшим нагріванням зі зворотним холодильником протягом 4 годин. Отриману реакційну суміш піддали концентруванню в умовах зниженого тиску, додали воду, після чого суміш нейтралізували розбавленою хлористоводневою кислотою, а потім екстрагували етилацетатом. Органічний шар промили водою і просушили над безводним сульфатом магнію, а розчинник відігнали в умовах зниженого тиску, в результаті чого було отримано 9,4г 2-хлор-4-метил-5-меркаптоаніліну.

(3) Синтез 2-хлор-4-метил-5-(2,2,2-трифторетилтіо)аніліну

Суміш 9,4г 2-хлор-4-метил-5-меркаптоаніліну, 20г 2,2,2-трифторетилїодиду, 13г карбонату калію і 200мл N,N-диметилформаміду піддали перемішуванню при кімнатній температурі протягом 16 годин. Реакційну суміш піддали концентруванню в умовах зниженого тиску, додали воду, після чого суміш екстрагували толуолом. Органічний шар промили водою і просушили над безводним сульфатом магнію, а розчинник відігнали в умовах зниженого тиску, в результаті чого було отримано 13,5г 2-хлор-4-метил-5-(2,2,2-трифторетилтіо)аніліну.

Дані <sup>1</sup>H-ЯМР (значення CDCI<sub>3</sub>/TMS δ (частин на мільйон)): 2,32 (3H, c), 3,33 (2H, кв), 3,96 (2H, c), 6,94 (1H, c), 7,11 (1H, c)

(4) Синтез 2-хлор-4-метил-5-(2,2,2-трифторетилтіо)фенілгідазину

До 30мл концентрованої хлористоводневої кислоти по краплях додали 13,5г 2-хлор-4-метил-5-(2,2,2-трифторетилтіо)аніліну при кімнатній температурі, потім до цієї суміші по краплях додали водний розчин, що містив 3,8г нітриту натрію, при температурі від 0°C до 5°C, після чого суміш у такому стані піддали перемішуванню протягом 1 години, в результаті чого була отримана сіль діазонію. В 250мл 6N. розчину хлористоводневої кислоти розчинили 36г дигідрату хлориду олова і до цього розчину по краплях додали водний розчин зазначеної вище солі діазонію при температурі від 0°C до 5°C, після чого розчин додатково піддали перемішуванню при кімнатній температурі протягом 2 годин. Потім додали толуол, отриманий розчин нейтралізували водним розчином гідроксиду натрію, нерозчинені домішки відфільтрували, а органічний шар промили водою і просушили над безводним сульфатом магнію. Розчинник відігнали в умовах зниженого тиску, в результаті чого було отримано 12,1г 2-хлор-4-метил-5-(2,2,2-трифторетилтіо)фенілгідазину.

(5) Синтез {2-хлор-4-метил-5-(2,2,2-трифторетилтіо)феніл}гідазону трифторацетальдегіду

Суміш, яка містила 4,1г 2-хлор-4-метил-5-(2,2,2-трифторетилтіо)фенілгідазину, 2,3г етилогеміацеталу трифторацетальдегіду, 0,1г моногідрату p-толуолсульфонової кислоти і 50мл етанолу, піддали нагріванню зі зворотним холодильником протягом 6 годин. Отриману реакційну суміш піддали концентруванню в умовах зниженого тиску, додали воду, після чого суміш екстрагували толуолом. Органічний шар промили водою і просушили над безводним сульфатом магнію, а розчинник відігнали в умовах зниженого тиску, в результаті чого було отримано 3,6г {2-хлор-4-метил-5-(2,2,2-трифторетилтіо)феніл}гідазону трифторацетальдегіду.

(6) Синтез N-{2-хлор-4-метил-5-(2,2,2-трифторетилтіо)феніл}трифторацетогідазоноілброміду

В 30мл N,N-диметилформаміду розчинили 3,6г (10,3ммоль) {2-хлор-4-метил-5-(2,2,2-трифторетилтіо)феніл}гідазону трифторацетальдегіду, потім при кімнатній температурі додали 2,0г N-бромсукциніміду, після чого суміш піддали перемішуванню при кімнатній температурі протя-

гом 2 годин. Отриману реакційну суміш влили у воду і екстрагували толуолом, а органічний шар промили водою і просушили над безводним сульфатом магнію. Розчинник відігнали в умовах зниженого тиску, в результаті чого було отримано 4,1г N-{2-хлор-4-метил-5-(2,2,2-трифторетилтіо)феніл}трифторацетогідразоноілброміду.

(7) Синтез [5-(5-аміно-3-трифторметил-1,2,4-тріазоліл)-4-хлор-2-метилфеніл]-2,2,2-трифторетилсульфіду

До суміші, яка містила 4,1г N-{2-хлор-4-метил-5-(2,2,2-трифторетилтіо)феніл}трифторацетогідразоноілброміду, 4,4г гідрододату S-метилізотіосечовини і 100мл тетрагідрофурану, додали при кімнатній температурі 3,5г тріетиламіну, після чого суміш піддали перемішуванню при 50°C протягом 3 годин. Реакційну суміш піддали концентруванню в умовах зниженого тиску, а до отриманого залишку додали ксиол з подальшим нагріванням зі зворотним холодильником протягом 2 годин. Реакційну суміш охолодили до кімнатної температури, а потім промили водою, після чого органічний шар просушили над безводним сульфатом магнію. Розчинник відігнали в умовах зниженого тиску, а отримані неочищені кристали піддали перекристалізації з етанолу, в результаті чого було отримано 2,0г [5-(5-аміно-3-трифторметил-1,2,4-тріазоліл)-4-хлор-2-метилфеніл]-2,2,2-трифторетилсульфіду у вигляді кристалів світло-сірого кольору (температура плавлення: 193°C-194°C).

#### Приклад 2

Приготування [5-(5-аміно-3-трифторметил-1,2,4-тріазоліл)-4-хлор-2-метилфеніл]-2,2,2-трифторетилсульфоксиду (Сполука №8 у відповідності до даного винаходу)

В 80мл етилацетату розчинили 1,3г [5-(5-аміно-3-трифторметил-1,2,4-тріазоліл)-4-хлор-2-метилфеніл]-2,2,2-трифторетилсульфіду, після чого додали 0,9г (чистота 75%) m-хлорпербензойної кислоти в умовах охолодження льодом. Суміш піддали перемішуванню в умовах охолодження льодом протягом 2 годин, промили водним розчином тіосульфату натрію, а потім промили водним розчином гідрокарбонату натрію, після чого просушили над безводним сульфатом магнію. Розчинник відігнали в умовах зниженого тиску, а отримані кристали промили тетрагліцером вуглецю, в результаті чого було отримано 1,2г [5-(5-аміно-3-трифторметил-1,2,4-тріазоліл)-4-хлор-2-метилфеніл]-2,2,2-трифторетилсульфоксиду у вигляді кристалів білого кольору (температура плавлення: 235°C-237°C).

#### Приклад 3

Приготування [5-(3-нітро-1,2,4-тріазоліл)-2-дифторметилфеніл]-2,2,2-трифторетилсульфіду (Сполука №11 у відповідності до даного винаходу)

(1) Синтез 4-(3-нітро-1,2,4-тріазоліл)-2-фторбензальдегіду

До суспензії 1,2г (60%) гідриду натрію і 50мл N,N-диметилформаміду по краплях додали 10мл розчину N,N-диметилформаміду з 3,4г 3-нітро-1,2,4-тріазолу в умовах охолодження льодом.

Після припинення виділення водню додали 4,3г 2,4-дифторбензальдегіду з подальшим перемішуванням при 70°C протягом 3 годин. Суміш піддали концентруванню в умовах зниженого тиску, додали 200мл води, після чого суміш екстрагували етилацетатом. Шар етилацетату промили водою, після чого просушили над безводним сульфатом магнію. Розчинник відігнали в умовах зниженого тиску, а отримані неочищені кристали промили діізопропіловим ефіром, в результаті чого було отримано 1,6г 4-(3-нітро-1,2,4-тріазоліл)-2-фторбензальдегіду.

(2) Синтез 4-(3-нітро-1,2,4-тріазоліл)-2-(2,2,2-трифторетилтіо)бензальдегіду До суміші 1,6г 4-(3-нітро-1,2,4-тріазоліл)-2-фторбензальдегіду, 1,3г карбонату калію і 50мл N,N-диметилформаміду по краплях в умовах охолодження льодом додали 0,8г 2,2,2-трифторетилмеркаптану з подальшим перемішуванням при температурі від 0°C до 10°C протягом 4 годин. Суміш піддали концентруванню в умовах зниженого тиску, додали 200мл води, після чого суміш екстрагували етилацетатом. Органічний шар промили водою, після чого просушили над безводним сульфатом магнію. Розчинник відігнали в умовах зниженого тиску, в результаті чого було отримано 1,8г 4-(3-нітро-1,2,4-тріазоліл)-2-(2,2,2-трифторетилтіо)бензальдегіду.

(3) Синтез [5-(3-нітро-1,2,4-тріазоліл)-2-дифторметилфеніл]-2,2,2-трифторетилсульфіду

До суміші 1,8г 4-(3-нітро-1,2,4-тріазоліл)-2-(2,2,2-трифторетилтіо)бензальдегіду з 20мл метилхлориду додали в умовах охолодження льодом 2,6г діетиламіносірчаного трифториду з подальшим нагріванням зі зворотним холодильником протягом 6 годин. Після того, як суміш охолодили до кімнатної температури, її влили в льодяну воду, а органічний шар промили водним розчином гідрокарбонату натрію і водою, після чого просушили над безводним сульфатом магнію. Розчинник відігнали в умовах зниженого тиску, а залишок очистили методом колонкової хроматографії на силікагелі, в результаті чого був отриманий [5-(3-нітро-1,2,4-тріазоліл)-2-дифторметилфеніл]-2,2,2-трифторетилсульфід у вигляді кристалів палевого кольору (температура плавлення: 74°C-76°C).

#### Приклад 4

Приготування [5-(5-аміно-3-трифторметил-1,2,4-тріазоліл)-4-фтор-2-метилфеніл]-2,2,2-трифторетилсульфіду (Сполука №1 у відповідності до даного винаходу)

(1) Синтез 5-ацетилтіо-2-фтор-4-метилацетаніліду

До 500г хлорсульфонової кислоти додали 150г 2-фтор-4-метилацетаніліду при 50°C або нижче з подальшим перемішуванням протягом 1 години. Реакційну суміш влили в суміш льодяної води з етилацетатом, органічний шар промили водою і просушили над безводним сульфатом магнію, а розчинник відігнали в умовах зниженого тиску, в результаті чого був отриманий твердий залишок. Отриманий твердий залишок розчинили в 350мл оцтової кислоти, а отриманий розчин по краплях додали до суміші 84г червоного фосфору, 1г йоду і 300мл оцтової кислоти з нагріванням зі зворотним холодильником протягом 1 години і подальшим

додатковим нагріванням зі зворотним холодильником протягом 2 годин. Отриману реакційну суміш охолодили до кімнатної температури, нерозчинені домішки відфільтрували, а рідину піддали концентруванню в умовах зниженого тиску, після чого влили воду, а суміш екстрагували етилацетатом. Органічний шар промили водою і просушили над безводним сульфатом магнію, а розчинник відігнали в умовах зниженого тиску, в результаті чого було отримано 211г 5-ацетилтіо-2-фтор-4-метилацетаніліду.

(2) Синтез 2-фтор-4-метил-5-меркаптоаніліну

В 500мл етанолу розчинили 211г 5-ацетилтіо-2-фтор-4-метилацетаніліду і до цього розчину протягом 30 хвилин по краплях додали розчин, що містив 200г гідроксиду калію і 500мл води, з подальшим нагріванням зі зворотним холодильником протягом 5 годин. Після того, як реакційну суміш охолодили до кімнатної температури, її нейтралізували розбавленою хлористоводневою кислотою, піддали концентруванню в умовах зниженого тиску і екстрагували етилацетатом. Органічний шар просушили над безводним сульфатом магнію, а розчинник відігнали в умовах зниженого тиску, в результаті чого було отримано 129г 2-фтор-4-метил-5-меркаптоаніліну

(3) Синтез 2-фтор-4-метил-5-(2,2,2-трифторетилтіо)аніліну

До 1000мл розчину N,N-диметилформаміду і 129г 2-фтор-4-метил-5-меркаптоаніліну додали 250г 2,2,2-трифторетиліодиду і 125г карбонату калію, після чого додатково додали 10г ронгаліту з подальшим перемішуванням при кімнатній температурі протягом 8 годин. Реакційну рідину влили у воду, суміш екстрагували етилацетатом, органічний шар просушили над безводним сульфатом магнію, а розчинник відігнали в умовах зниженого тиску, в результаті чого було отримано 182г 2-фтор-4-метил-5-(2,2,2-трифторетилтіо)аніліну.

Дані  $^1\text{H}$ -ЯМР (Значення  $\text{CDCl}_3/\text{TMS}$   $\delta$  (частин на мільйон)): 2,36 (3H, с), 3,30 (2H, кв), 3,64 (2H, с), 6,86 (1H, д), 6,98 (1H, д).

(4) Синтез 2-фтор-4-метил-5-(2,2,2-трифторетилтіо)фенілгідазину

До 300мл концентрованої сірчаної кислоти при 50°C або нижче додали 53г нітриту натрію, після чого при 50°C або нижче по краплях додали 300мл оцтової кислоти. До цього змішаного розчину по краплях протягом 2 годин при 20°C або нижче додали 100мл розчину оцтової кислоти і 182г 2-фтор-4-метил-5-(2,2,2-трифторетилтіо)аніліну з подальшим перемішуванням при 20°C протягом 3 годин. Реакційну суміш по краплях при 5°C або нижче додали до змішаного розчину 390г дигідрату хлориду олова(II) і 1000мл 6н. хлористоводневої кислоти з подальшим перемішуванням протягом 30 хвилин. До цієї реакційної суміші додали толуол, а реакційну суміш нейтралізували 10%-ним водним розчином гідроксиду натрію. Нерозчинені домішки відфільтрували, а органічний шар просушили над безводним сульфатом магнію і піддали концентруванню в умовах зниженого тиску, в результаті чого було отримано 177г 2-фтор-4-метил-5-(2,2,2-трифторетилтіо)фенілгідазину.

(5) Синтез {2-фтор-4-метил-5-(2,2,2-трифторетилтіо)-феніл}гідазонтрифторацетальдегіду

Суміш 3,1г 2-фтор-4-метил-5-(2,2,2-трифторетилтіо)фенілгідазину, 1,9г етилового геміацеталю трифторацетальдегіду, 0,5г метансульфонової кислоти і 100мл етанолу піддали нагріванню зі зворотним холодильником протягом 5 годин. Після того, як реакційну суміш охолодили до кімнатної температури, її піддали концентруванню в умовах зниженого тиску і екстрагували етилацетатом, а органічний шар просушили над безводним сульфатом магнію. Розчинник відігнали в умовах зниженого тиску, в результаті чого було отримано 3,7г {2-фтор-4-метил-5-(2,2,2-трифторетилтіо)-феніл}гідазонтрифторацетальдегіду.

(6) Синтез N-{2-фтор-4-метил-5-(2,2,2-трифторетилтіо)феніл}трифторацетогідазоноілброміду

В 50мл N,N-диметилформаміду розчинили 3,7г {2-фтор-4-метил-5-(2,2,2-трифторетилтіо)-феніл}гідазонтрифторацетальдегіду і додали при кімнатній температурі 2,0г N-бромсукцинімиду з подальшим перемішуванням при кімнатній температурі протягом 30 хвилин. Отриману реакційну суміш влили у воду і екстрагували етилацетатом, а органічний шар просушили над безводним сульфатом магнію. Розчинник відігнали в умовах зниженого тиску, в результаті чого було отримано 4,4г N-{2-фтор-4-метил-5-(2,2,2-трифторетилтіо)феніл}-трифторацетогідазоноілброміду.

(7) [5-(5-аміно-3-трифторметил-1,2,4-тріазоліл)-4-фтор-2-метилфеніл]-2,2,2-трифторетилсульфід

До 100мл тетрагідрофурану додали 4,5г гідродиду S-метилізотіосечовини, 3,5г тріетиламіну і 4,4г N-{2-фтор-4-метил-5-(2,2,2-

трифторетилтіо)феніл}трифторацетогідазоноілброміду з подальшим нагріванням зі зворотним холодильником протягом 8 годин. Після того, як реакційну суміш охолодили до кімнатної температури, її піддали концентруванню в умовах зниженого тиску і екстрагували етилацетатом, а органічний шар промили водою і просушили над безводним сульфатом магнію. Розчинник відігнали в умовах зниженого тиску, а отриману тверду речовину очистили методом колонкової хроматографії на силікагелі (елюент: етилацетат:гексан =4:1), в результаті чого було отримано 2,9г [5-(5-аміно-3-трифторметил-1,2,4-тріазоліл)-4-фтор-2-метилфеніл]-2,2,2-трифторетилсульфіду у вигляді кристалів палевого кольору (температура плавлення: 171°C-173°C).

Приклад 5

Приготування [5-(5-аміно-3-трифторметил-1,2,4-тріазоліл)-4-фтор-2-метилфеніл]-2,2,2-трифторетилсульфоксиду (Сполука №2 у відповідності до даного винаходу)

В 100мл хлороформу розчинили 1,9г [5-(5-аміно-3-трифторметил-1,2,4-тріазоліл)-4-фтор-2-метилфеніл]-2,2,2-трифторетилсульфіду і додали 1,0г m-хлорпербензойної кислоти при 0°C з пода-



льшим перемішуванням при кімнатній температурі протягом 1 години. Розчинник відігнали в умовах зниженого тиску, а отриманий залишок очистили методом колонкової хроматографії на силікагелі (елюент: етилацетат:гексан:тріетиламін =50:50:1), в результаті чого було отримано 1,8г [5-(5-аміно-3-трифторметил-1,2,4-тріазоліл)-4-фтор-2-метилфеніл]-2,2,2-трифторетилсульфоксиду у вигляді кристалів палевого кольору (температура плавлення: 236°C-238°C).

#### Приклад 6

Приготування [5-(5-трифторацетиламіно-3-трифторметил-1,2,4-тріазоліл)-4-фтор-2-метилфеніл]-2,2,2-трифторетилсульфіду (Сполука №5 у відповідності до даного винаходу)

До 50мл трифтороцтового ангідриду додали 1,1г [5-(5-аміно-3-трифторметил-1,2,4-тріазоліл)-4-фтор-2-метилфеніл]-2,2,2-трифторетилсульфіду з подальшим перемішуванням при кімнатній температурі протягом 12 годин. Розчинник відігнали в умовах зниженого тиску, а отриману тверду речовину очистили методом колонкової хроматографії на силікагелі (елюент: етилацетат:гексан =2:1), в результаті чого було отримано 1,1г [5-(5-трифторацетиламіно-3-трифторметил-1,2,4-тріазоліл)-4-фтор-2-метилфеніл]-2,2,2-трифторетилсульфіду у вигляді кристалів палевого кольору (температура плавлення: 122°C-125°C).

#### Приклад 7

Приготування [5-(5-аміно-3-трифторметил-1,2,4-тріазоліл)-4-фтор-2-метилфеніл]-2,2,2-трифторетилсульфоксиду (Сполука №6 у відповідності до даного винаходу)

В 50мл хлороформу розчинили 0,8г [5-(5-трифторацетиламіно-3-трифторметил-1,2,4-тріазоліл)-4-фтор-2-метилфеніл]-2,2,2-трифторетилсульфіду і при 0°C додали 0,3г m-хлорпербензойної кислоти з подальшим перемішуванням при кімнатній температурі протягом 1 години. Розчинник відігнали в умовах зниженого тиску, а отриману тверду речовину очистили методом колонкової хроматографії на силікагелі (елюент: етилацетат:гексан =1:1), в результаті чого було отримано 0,6г [5-(5-трифторацетиламіно-3-трифторметил-1,2,4-тріазоліл)-4-фтор-2-метилфеніл]-2,2,2-трифторетилсульфоксиду у вигляді порошку палевого кольору (температура плавлення 233°C-237°C).

Структурні формули і фізичні властивості сумішей [I] у відповідності до даного винаходу, синтезованих згідно зазначених вище прикладів, включаючи зазначені вище приклади, показані в Таблицях 7-10. Позначення в таблицях відповідають визначеним вище.

В приведеному нижче описі посилання робляться на номери сполук.

Таблиця 7

Сполука №	Температура плавлення, °C або індекс рефракції, $n_D^{20}$	
1	температура плавлення	171-173
2	температура плавлення	236-238
3	температура плавлення	179-181
4	температура плавлення	207-209
5	температура плавлення	122-125
6	температура плавлення	233-237
7	температура плавлення	193-194
8	температура плавлення	235-237
9	температура плавлення	183-185
10	температура плавлення	249-251
11	температура плавлення	74-76
12	температура плавлення	155-156
15	температура плавлення	130-131
17	температура плавлення	158-160
18	температура плавлення	181-183
20	температура плавлення	218-219
21	температура плавлення	87-89
23	температура плавлення	156-157
24	температура плавлення	201-203
26	температура плавлення	204-205
27	температура плавлення	107-109
28	температура плавлення	189-191
30	температура плавлення	199-202

## Продовження таблиці 7

31	температура плавлення	111-113
32	температура плавлення	205-207
35	температура плавлення	130-131
36	температура плавлення	184-186
37	температура плавлення	120-122
38	температура плавлення	196-198
39	температура плавлення	150-151
40	температура плавлення	147-148
43	температура плавлення	111-114
49	температура плавлення	не піддалася вимірюванню
50	температура плавлення	195-197
55	температура плавлення	176-178
56	температура плавлення	256-257
59	індекс рефракції	1,4988
60	температура плавлення	149-152
65	температура плавлення	76-78
66	температура плавлення	152-154

Таблиця 8

Сполука №	Температура плавлення, °C або індекс рефракції, $n_D^{20}$	
75	температура плавлення	133-135
76	температура плавлення	159-161
79	температура плавлення	131-133
80	температура плавлення	167-169
83	температура плавлення	142-144
84	температура плавлення	100-103
97	температура плавлення	116-118
98	температура плавлення	181-182
99	температура плавлення	180-181
101	індекс рефракції	1,5028
102	температура плавлення	141-143
103	температура плавлення	156-157
104	температура плавлення	194-195
105	температура плавлення	171-172
106	температура плавлення	180-182
106	температура плавлення	138-139
107	температура плавлення	185-186
108	температура плавлення	157-159
110	температура плавлення	149-151
111	температура плавлення	146-148
112	температура плавлення	170-172
113	температура плавлення	156-157
114	температура плавлення	125-128
115	температура плавлення	147-150
116	температура плавлення	169-172
117	температура плавлення	199-200

## Продовження таблиці 8

118	температура плавлення	140-142
119	температура плавлення	154-156
120	температура плавлення	163-165
121	температура плавлення	204-206
123	температура плавлення	205-206
124	температура плавлення	135-137
125	температура плавлення	207-208
126	температура плавлення	147-149
127	температура плавлення	164-167
128	індекс рефракції	1,4811
130	температура плавлення	109-110
131	температура плавлення	152-154
133	температура плавлення	195-197
134	температура плавлення	81-84
136	температура плавлення	140-141
137	температура плавлення	196-197
139	температура плавлення	198-199
140	температура плавлення	110-111
141	температура плавлення	138-140

## Таблиця 9

Сполука №	Температура плавлення, °C або індекс рефракції, $n_D^{20}$	
143	температура плавлення	193-195
144	температура плавлення	49-51
145	температура плавлення	102-104
146	температура плавлення	91-93
147	температура плавлення	203-205
148	температура плавлення	69-71
150	температура плавлення	127-128
151	температура плавлення	92-95
153	температура плавлення	147-149
154	температура плавлення	147-149
155	температура плавлення	163-166
157	температура плавлення	89-92
158	індекс рефракції	1,5175
160	температура плавлення	91-93
161	температура плавлення	50-53
162	температура плавлення	113-115
163	температура плавлення	195-197
164	температура плавлення	112-114
165	температура плавлення	130-132
167	температура плавлення	93-95
168	температура плавлення	132-133
169	температура плавлення	107-109
170	температура плавлення	53-55
171	температура плавлення	138-139
172	температура плавлення	102-104

Продовження таблиці 9

173	температура плавлення	208-211
174	температура плавлення	97-98
175	температура плавлення	193-195
176	температура плавлення	113-115
177	температура плавлення	209-211
178	температура плавлення	178-179
179	температура плавлення	206-208
180	температура плавлення	159-160
181	температура плавлення	89-92
182	температура плавлення	159-161
183	температура плавлення	107-110
184	індекс рефракції	1,5253
185	індекс рефракції	1,5335
186	температура плавлення	115-116
187	температура плавлення	139-141
189	температура плавлення	72-74

Таблиця 10

Сполука №	Температура плавлення, °С або індекс рефракції, $n_D^{20}$	
190	температура плавлення	180-181
192	температура плавлення	182-184
193	індекс рефракції	1,5065
194	температура плавлення	42-45
195	індекс рефракції	1,5445
196	температура плавлення	150-151
197	температура плавлення	155-157
198	температура плавлення	174-175
200	температура плавлення	151-154
201	температура плавлення	168-171
202	температура плавлення	168-171
203	температура плавлення	92-94
204	температура плавлення	143-145
206	температура плавлення	90-92
207	температура плавлення	128-129
208	температура плавлення	202-203
209	індекс рефракції	1,4939
210	температура плавлення	95-97
212	температура плавлення	92-94

Дані  $^1\text{H}$ -ЯМР (Значення  $\text{CDCl}_3/\text{TMS}$   $\delta$  (частин на мільйон)) відносно сполук №№49, 59, 101, 128, 158, 184, 185, 193, 195 і 209 надані нижче.

Сполука №49: 2,56 (3H, с), 3,40 (2H, кв), 5,29 (2H, с), 7,21 (1H, д), 7,67 (1H, д)

Сполука №59: 1,22 - 1,28 (3H, м), 2,55 (3H, с), 3,40 (2H, кв), 3,46 - 3,55 (2H, м), 4,12 (1H, т), 7,20 (1H, д), 7,63 (1H, д)

Сполука №101: 2,54 (3H, с), 3,07 (3H, д), 3,39 (2H, кв), 4,25 (1H, с), 7,17 (1H, д), 7,61 (1H, д)

Сполука №128: 1,32 (6H, т), 2,50 (3H, с), 3,25 (4H, кв), 3,44 (2H, кв), 7,19 (1H, с), 7,75 (1H, с)

Сполука №158: 1,98 (3H, с), 2,56 (3H, с), 3,05 (3H, с), 3,36 (2H, кв), 3,85 (2H, кв), 7,16 (1H, д), 7,61 (1H, д)

Сполука №184: 2,29 (1H, д), 2,53 (3H, с), 3,39 (2H, кв), 3,82 (2H, кв), 4,20 (2H, дд), 4,34 (1H, с), 7,16 (1H, д), 7,61 (1H, д)

Сполука №185: 2,29 (1H, т), 2,47 (3H, с), 3,42-3,57 (2H, м), 3,83 (2H, кв), 4,22 (2H, д), 4,40 (1H, с), 7,22 (1H, с), 8,12 (1H, с)

Сполука №193: 2,30 (1H, т), 2,55 (3H, с), 3,40 (2H, кв), 4,24 (2H, кв), 4,40 (1H, с), 7,20 (1H, д), 7,63 (1H, д)

Сполука №195: 1,22-1,39 (1H, м), 1,48-1,57 (1H, м), 2,06-2,14 (1H, м), 2,52 (3H, с), 3,07 (1H, дд), 3,29 (1H, дд), 3,42 (2H, т), 4,75 (2H, с), 7,16 (1H, д), 7,65 (1H, д)

Сполука №209: 2,61 (3H, с), 3,42 (2H, кв), 7,31 (1H, д), 7,74 (1H, д)

Нижче приведені приклади приготування проміжних сполук.

<Приклад приготування проміжних сполук 1>

(1) Синтез 5-ацетилтіо-2,4-диметилацетаніліду

До 168г хлорсульфонової кислоти додали 78г 2-фтор-4-метилацетаніліду при 40°C або нижче з подальшим перемішуванням при 70°C протягом 2 годин. Реакційну суміш влили в суміш льодяної води і етилацетату, органічний шар промили водою і просушили над безводним сульфатом магнію, а розчинник відігнали в умовах зниженого тиску, в результаті чого був отриманий твердий залишок. Отриманий твердий залишок розчинили в 200мл оцтової кислоти, а отриманий розчин по краплях додали до змішаного розчину 72г червоного фосфору, 1г йоду і 300мл оцтової кислоти в умовах нагрівання зі зворотним холодильником протягом 1 години з подальшим додатковим нагріванням зі зворотним холодильником протягом 4 годин. Нерозчинені домішки відфільтрували, оцтову кислоту відігнали в умовах зниженого тиску, додали воду, а залишок екстрагували етилацетатом. Органічний шар промили водою і просушили над безводним сульфатом магнію. Розчинник відігнали в умовах зниженого тиску, в результаті чого було отримано 42г 5-ацетилтіо-2,4-диметилацетаніліду.

(2) Синтез 2-фтор-4-метил-5-меркаптоаніліну

До 5%-ного водного розчину гідроксиду калію додали 42г 5-ацетилтіо-2-фтор-4-метилацетаніліду з подальшим нагріванням зі зворотним холодильником протягом 18 годин. Після того, як реакційну суміш охолодили до кімнатної температури, її скоректували розбавленою хлористоводневою кислотою до pH=7 і екстрагували етилацетатом. Органічний шар просушили над безводним сульфатом магнію, а розчинник відігнали в умовах зниженого тиску, в результаті чого було отримано 25г 2,4-диметил-5-меркаптоаніліну.

(3) Синтез 2,4-диметил-5-(2,2,2-трифторетилтіо)аніліну

До змішаного розчину 20г 2,4-диметил-5-меркаптоаніліну і 150мл N,N-диметилформаміду додали 41г 2,2,2-трифторетилйодиду і 24г карбонату калію, а потім додатково додали 4г ронгаліту з подальшим перемішуванням при кімнатній температурі протягом 24 годин. Реакційну суміш влили у воду і екстрагували етилацетатом. Органічний шар просушили над безводним сульфатом магнію, розчинник відігнали в умовах зниженого тиску, а

отриманий залишок очистили методом колонкової хроматографії на силікагелі (елюент: гексан:етилацетат =5:1), в результаті чого було отримано 29г 2,4-диметил-5-(2,2,2-трифторетилтіо)аніліну.

Дані <sup>1</sup>H-ЯМР (Значення CDCl<sub>3</sub>/TMS δ (частин на мільйон)): 2,13 (3H, с), 3,34 (3H, с), 3,32 (2H, кв), 3,52 (2H, с), 6,84 (1H, с), 6,91 (1H, с)

Нижче наданий більш детальний опис способів формулювання складів, який супроводжується посиланнями на типові приклади формулювання складів. Проте, слід розуміти, що типи і частки сполук і добавок не обмежуються цими конкретними прикладами і можуть змінюватися в широкому діапазоні. В наданому нижче описі "частка(и)" означає "масову(и) частку(и)".

Приклад формулювання складу 1: Концентрат, що здатний до емульгування

Сполуку №6 (30 частин), циклогексанон (20 частин), поліоксіетиленакїларіловий ефір (11 частин), алкілбензолсульфонат кальцію (4 частини) і метилнафталін (35 частин) рівномірно розчинили, в результаті чого був отриманий концентрат, що здатний до емульгування.

Приклад формулювання складу 2: Змочувальний порошок

Сполуку №2 (10 частин), натрієву сіль нафталінсульфонової кислоти/конденсат формаліну (0,5 частини), поліоксіетиленакїларіловий ефір (0,5 частини), діатомову землю (24 частини) і глину (65 частин) рівномірно перемішали і подрібнили, в результаті чого був отриманий змочувальний порошок.

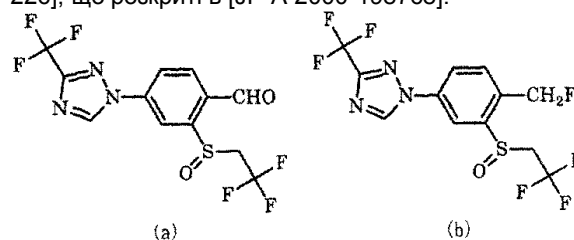
Приклад формулювання складу 3: Дуст

Сполуку №6 (2 частини), діатомову землю (5 частин) і глину (93 частини) рівномірно перемішали і подрібнили, в результаті чого був отриманий дуст.

Приклад формулювання складу 4: Гранули

Сполуку №2 (5 частин), спиртний натрієвий сульфат лаурилового спирту (2 частини), лігнісульфонат натрію (5 частин), карбоксиметилцелюлозу (2 частини) і глину (86 частин) рівномірно перемішали і подрібнили. До цієї суміші (100 частин) додали воду (20 частин) і перемішали до одержання однорідної маси, сформували в гранули розміром від 14 до 32 меш (≈1,20-0,49мм) у грануляторі екструдійного типу і просушили, в результаті чого був отриманий гранульований склад.

Нижче наданий опис дії пестицидів, що містять сполуки у відповідності до даного винаходу як активні інгредієнти, який супроводжується посиланнями на приклади випробувань. Сполуки для порівняння а і б являють собою сполуки [VI-208] і [VI-226], що розкриті в [JP-A-2000-198768]:



Приклад випробувань 1 Випробування на акарицидну дію на кліщах двоплямистих павутинних (шляхом занурення)

Змочувальні порошки приготували відповідно до прикладу формулювання складу 2, після чого їх розбавили водою до досягнення активним інгредієнтом концентрації 500 частин на мільйон. Саджанці сої, які були заражені імаго кліщів двоплямистих павутинних, спочатку занурили в отримані

розчини, а потім просушили на повітрі. Оброблені саджанці розмістили в термостатичній камері при 25°C на період 13 днів, а уцілілі кліщі підраховали з метою обчислення значення акарицидної дії з використанням рівняння 2. Випробування здійснювали з використанням одноступінчатої системи. Результати цих випробувань надані в таблицях 11 і 12.

Таблиця 11

Сполука №	Значення акарицидної дії
1	100
2	100
4	100
5	100
6	100
8	100
28	100
30	100
32	100
35	100
36	100
37	100
38	100
43	100
50	100
56	100
60	100
66	100
76	100
80	100
84	100
98	100
99	100
102	100
104	100
106	100
106	100
107	100
111	100
113	100

Таблиця 12

Сполука №	Значення акарицидної дії
114	100
115	100
117	100
119	100
121	100
123	100
125	100
127	100
131	100
133	100
144	100
145	100
147	100
153	100
155	100
157	100
161	100
162	100
167	100
169	100
171	100
177	100
179	100
183	100
185	100
187	100
190	100
192	100
194	100
202	100
212	100
Сполука для порівняння а	100
Сполука для порівняння b	99

Приклад випробувань 2 Випробування на акарицидну дію на кліщах двоплямистих павутинних (шляхом зрошування ґрунту)

Змочувальні порошки приготували відповідно до прикладу формулювання складу 2, після чого їх розбавили водою до досягнення активним інгредієнтом концентрації 100 частин на мільйон. 100 Г ґрунту в комірках з саджанцями сої, які були зара-

жені імаго кліщів двоплямистих павутинних, окропили 5мл отриманого розчину. Оброблені саджанці розмістили в термостатичній камері при 25°C на період 13 днів, а уцілілі кліщі підраховали з метою обчислення значення акарицидної дії з використанням рівняння 2. Результати цього випробування надані в таблицях 13 і 14.

Таблиця 13

Сполука №	Значення акарицидної дії
1	99
2	100
4	100
5	100
6	100
8	100
28	100
30	100
32	100
35	93
36	100
37	100
38	100
43	100
50	100
56	100
60	100
66	100
76	100
80	100
84	100
98	100
99	100
102	100
104	100
106	100
106	100
107	100
111	100
113	100
114	100
115	100
117	100
119	100
121	100
123	100

Таблиця 14

Сполука №	Значення акарицидної дії
125	99
127	100
131	100
133	100
144	100
145	100
147	100
153	100
155	100
157	100
161	100

Продовження таблиці 14

162	95
167	100
169	100
171	100
177	100
179	100
183	100
185	100
187	99
190	100
192	100
194	100
202	100
212	100
Сполука для порівняння а	0
Сполука для порівняння б	0

Приклад випробувань 3 Випробування на інсектицидну дію на дельфацидах коричневих

Змочувальні порошки приготували відповідно до прикладу формулювання складу 2, після чого їх розбавили водою до досягнення активним інгредієнтом концентрації 500 частин на мільйон. В отриманий розчин спочатку занурили пророслий рис, а потім помістили його в пластмасову комірку місткістю 60мл. В комірку випустили десять личи-

нок дельфацид коричневих четвертої вікової стадії, після чого комірку накрили і розмістили в термостатичній камері при 25°C на період 6 днів, а уцілілі особини підраховали з метою обчислення ступеня інсектицидної дії з використанням рівняння 1. Випробування здійснювали з використанням одноступінчатої системи. Результати цього випробування надані в таблиця 15 і 16.

Таблиця 15

Сполука №	Ступень інсектицидної дії, %
1	90
2	100
4	90
5	100
6	100
11	90
17	100
20	100
23	90
24	90
26	90
27	100
28	100
31	100
32	100
37	100
38	100
39	100
43	100
49	100
50	99
59	100
60	100
65	100
66	100



Продовження таблиці 15

75	100
76	100
79	100
80	100
83	10
84	100
99	100
101	100
102	100
105	90
106	90
111	100
112	90
113	100
114	100
115	100
117	100
119	90
124	100

Таблиця 16

Сполука №	Ступень інсектицидної дії, %
125	100
127	100
128	100
131	90
133	100
137	100
141	100
144	90
148	100
150	100
153	100
155	90
157	100
158	90
160	100
161	100
162	100
163	100
164	100
165	100
167	100
168	100
169	100
170	100
171	100
174	90
176	90
179	100

Продовження таблиці 16

184	100
185	100
186	100
187	100
189	100
190	100
192	100
193	100
194	100
195	100
200	100
201	100
202	100
212	100

## Приклад випробувань

Випробування немастатичної дії на південних яванських галових нематодах Сполуки у відповідності до даного винаходу (5 частин) і Tween 20 (торговельна назва для поліоксіетиленсорбітан-монолаурату) (1 частина) як речовину, що підвищує змочувальну здатність, розчинили в N,N-диметилформаміді (94 частини), в результаті чого були приготовані 5%-ні концентрати сполук у відповідності до даного винаходу, що здатні до емульгування. До концентратів, що здатні до емульгування, додали дистильовану воду, в результаті

чого були приготовані розбавлені розчини, що мали концентрацію сполук у відповідності до даного винаходу 20 частин на мільйон. 0,5мл розбавлених розчинів і 0,5мл водних суспензій, що містили 100 личинок південних яванських галових нематод другої вікової стадії, змішали, отриману суміш розмістили в термостатичній камері при 25°C на період 5 днів, а уцілілі особини підраховували з метою обчислення ступеня немастатичної дії з використанням рівняння 3. Випробування здійснювали з використанням двоступінчатої системи. Результати цього випробування наведені в таблицях 17 і 18.

Таблиця 17

Сполука №	Ступень немастатичної дії, %
1	100
2	100
3	100
6	100
15	100
17	99
20	92
21	100
23	100
27	100
30	95
31	100
35	100
36	100
38	100
39	100
43	93
50	98
59	100
65	100
66	94
75	94
79	94

Продовження таблиці 17

85

86251

86

97	97
101	98
102	98
103	94
110	97
114	100
115	92
116	97

Таблиця 18

Сполука №	Ступень неастиатичної дії, %
123	98
124	100
125	91
126	94
127	94
130	100
131	93
133	98
140	99
141	97
144	97
146	98
148	99
160	100
161	98
162	100
164	100
168	100
170	100
171	100
174	100
175	97
176	97
182	91
193	100
203	92
207	100
208	100
209	100
212	100

## Рівняння 2

Значення акарицидної дії, % =

$$\begin{aligned}
 & \text{число дорослих кліщів на} & \text{число дорослих кліщів на} \\
 & \text{контрольній площі до її} & \text{обробленій площі на дату} \\
 & \text{обробки} & \text{виживання} \\
 (1 - \frac{\text{число дорослих кліщів на}}{\text{обробленій площі до її}} & \times & \frac{\text{число дорослих кліщів на}}{\text{контрольній площі на дату}} \times 100 \\
 & \text{обробки} & \text{виживання}
 \end{aligned}$$

## Рівняння 3

Ступінь немастатичної дії, % =

$$\begin{aligned}
 & \text{число уцілілих особин на} & \text{число уцілілих особин на} \\
 & \text{контрольній площі} & - \text{обробленій площі} \\
 & \frac{\text{число уцілілих особин на контрольній площі}}{\text{число уцілілих особин на контрольній площі}} & \times 100
 \end{aligned}$$