



УКРАЇНА

(19) UA (11) 93525 (13) C2

(51) МПК

C07D 261/04 (2006.01)

C07D 413/12 (2006.01)

A01N 43/80 (2006.01)

A01P 7/04 (2006.01)

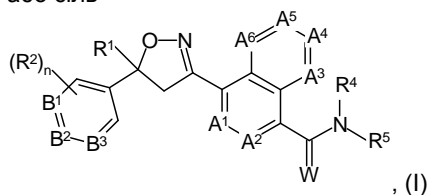
A01C 1/08 (2006.01)

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

(54) ПОХІДНІ ІЗОКСАЗОЛІНУ, КОМПОЗИЦІЇ НА ЇХ ОСНОВІ, СПОСОБИ БОРОТЬБИ З БЕЗХРЕБЕТНИМИ ШКІДНИКАМИ ТА ОБРОБЛЕНЕ НАСІННЯ

1

- (21) а200806928
(22) 28.12.2006
(24) 25.02.2011
(86) PCT/US2006/049459, 28.12.2006
(31) 60/755,247
(32) 30.12.2005
(33) US
(31) 60/839,988
(32) 23.08.2006
(33) US
(31) 60/857,307
(32) 07.11.2006
(33) US
(46) 25.02.2011, Бюл.№ 4, 2011 р.
(72) ЛАМ ДЖОРДЖ ФІЛІП, US, ШУП УЕСЛІ ЛОУ-РЕНС, US, СУ МІНГ, CN/US
(73) Е. І. ДЮ ПОН ДЕ НЕМУР ЕНД КОМПАНІ, US
(56) WO 20050852166, А, 15.09.2005
EP 1 538 138, А, 08.06.2005
(57) 1. Похідні ізоксазоліну формули I, їх N-оксиди або сіль



де
A¹, A², A³, A⁴, A⁵ та A⁶ незалежно вибрані з групи, що включає CR³ та N, за умови, що не більше, ніж 3 з A¹, A², A³, A⁴, A⁵ та A являють собою N;
B¹, B² та B³ незалежно вибрані з групи, що включає CR² та N;
W являє собою O або S;
R¹ являє собою C₁-C₆алкіл, C₂-C₆алкеніл, C₂-C₆алкініл, C₃-C₆циклоалкіл, C₄-C₇алкілциклоалкіл або C₄-C₇циклоалкілалкіл, кожний необов'язково заміщений одним або більше замісниками, незалежно вибраними з R⁶; кожний R² незалежно являє собою H, галоген, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл, C₁-C₆алкокси, C₁-C₆алкілсульфініл, C₁-C₆алкілсульфоніл, C₁-C₆алкіламіно, C₂-C₆діалкіламіно, C₂-C₆алкоксикарбоніл, -CN або -NO₂;

2

C₆галогеналкокси, C₁-C₆алкілтіо, C₁-C₆галогеналкілтіо, C₁-C₆алкілсульфініл, C₁-C₆галогеналкілсульфініл, C₁-C₆алкілсульфоніл, C₁-C₆алкіламіно, C₂-C₆діалкіламіно, C₂-C₆алкоксикарбоніл, -CN або -NO₂;
кожний R³ незалежно являє собою H, галоген, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл, C₃-C₆циклоалкіл, C₃-C₆галогенциклоалкіл, C₁-C₆алкокси, C₁-C₆галогеналкокси, C₁-C₆алкілтіо, C₁-C₆алкілсульфініл, C₁-C₆галогеналкілсульфініл, C₁-C₆алкілсульфоніл, C₁-C₆галогеналкілсульфоніл, C₁-C₆алкіламіно, C₂-C₆діалкіламіно, -CN або -NO₂;
R⁴ являє собою H, C₁-C₆алкіл, C₂-C₆алкеніл, C₂-C₆алкініл, C₃-C₆циклоалкіл, C₄-C₇алкілциклоалкіл, C₄-C₇циклоалкілалкіл, C₂-C₇алкілкарбоніл або C₂-C₇алкоксикарбоніл;
R⁵ являє собою H, OR¹⁰, NR¹¹R¹² або Q¹; або C₁-C₆алкіл, C₂-C₆алкеніл, C₂-C₆алкініл, C₃-C₆циклоалкіл, C₄-C₇алкілциклоалкіл або C₄-C₇циклоалкілалкіл, кожний необов'язково заміщений одним або більше замісниками, незалежно вибраними з R; або
R⁴ та R⁵, взяті разом з азотом, до якого приєднані, утворюють кільце, що містить 2-6 атомів вуглецю та необов'язково один додатковий атом, вибраний з групи, що включає N, S та O, зазначене кільце необов'язково заміщене 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає C₁-C₂алкіл, галоген, -CN, -NO₂ та C₁-C₂алкокси;
кожний R⁶ незалежно являє собою галоген, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆алкокси, C₁-C₆алкілтіо, C₁-C₆алкілсульфініл, C₁-C₆алкілсульфоніл, -CN або -NO₂;
кожний R⁷ незалежно являє собою галоген, C₁-C₆алкіл, C₃-C₆циклоалкіл, C₁-C₆алкокси, C₁-C₆алкілтіо, C₁-C₆алкілсульфініл, C₁-C₆алкіламіно, C₂-C₆діалкіламіно, C₃-C₆циклоалкіламіно, C₂-C₇алкілкарбоніл, C₂-C₇алкоксикарбоніл, C₂-C₇алкіламінокарбоніл, C₃-C₉діалкіламінокарбоніл,

(13) C2

(11) 93525

(19) UA

C₂-C₇галогеналкілкарбоніл,
C₇галогеналкоксикарбоніл,
C₇галогеналкіламінокарбоніл,
C₉галогендіалкіламінокарбоніл, гідрокси, -NH₂, -CN
або -NO₂; або Q²;

кожний R⁸ незалежно являє собою галоген, C₁-
C₆алкокси, C₁-C₆галогеналкокси, C₁-C₆алкілтіо, C₁-
C₆галогеналкілтіо, C₁-C₆алкілсульфініл, C₁-
C₆галогеналкілсульфініл, C₁-C₆алкілсульфоніл, C₁-
C₆галогеналкілсульфоніл, C₁-C₆алкіламіно, C₂-
C₆діалкіламіно, C₂-C₄алкоксикарбоніл, -CN або -
NO₂;

кожний R⁹ незалежно являє собою галоген, C₁-
C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл, C₃-C₆циклоалкіл, C₃-
C₆галогенциклоалкіл, C₁-C₆алкокси, C₁-
C₆галогеналкокси, C₁-C₆алкілтіо, C₁-
C₆галогеналкілтіо, C₁-C₆алкілсульфініл, C₁-
C₆галогеналкілсульфініл, C₁-C₆алкілсульфоніл, C₁-
C₆галогеналкілсульфоніл, C₁-C₆алкіламіно, C₂-
C₆діалкіламіно, -CN, -NO₂, феніл або піридиніл;
R¹⁰ являє собою H; або C₁-C₆алкіл, C₂-C₆алкеніл,
C₂-C₆алкініл, C₃-C₆циклоалкіл, C₄-
C₇алкілциклоалкіл або C₄-C₇циклоалкілалкіл, кож-
ний необов'язково заміщений одним або більше
галогенами;

R¹¹ являє собою H, C₁-C₆алкіл, C₂-C₆алкеніл, C₂-
C₆алкініл, C₃-C₆циклоалкіл, C₄-C₇алкілциклоалкіл,
C₄-C₇циклоалкілалкіл, C₂-C₇алкілкарбоніл або C₂-
C₇алкоксикарбоніл;

R¹² являє собою H; Q³; або C₁-C₆алкіл, C₂-
C₆алкеніл, C₂-C₆алкініл, C₃-C₆циклоалкіл, C₄-
C₇алкілциклоалкіл або C₄-C₇циклоалкілалкіл, кож-
ний необов'язково заміщений одним або більше
замісниками, незалежно вибраними з R⁷; або
R¹¹ та R¹², взяті разом з азотом, до якого приєдна-
ні, утворюють кільце, що містить 2-6 атомів вугле-
цю та необов'язково один додатковий атом, виб-
раний з групи, що включає N, S та O, зазначене
кільце необов'язково заміщене 1-4 замісниками,
незалежно вибраними з групи, що включає C₁-
C₂алкіл, галоген, -CN, -NO₂ та C₁-C₂алкокси;

Q¹ являє собою фенільне кільце, 5- або 6-членне
гетероциклічне кільце чи 8-, 9- або 10-членну кон-
денсовану біциклічну кільцеву систему, що необо-
в'язково містить від одного до трьох гетероатомів,
вибраних з 0-1 O, 0-1 S та 0-3 N, кожне кільце або
кільцева система необов'язково заміщені одним
або більше замісниками, незалежно вибраними з
R⁸;

кожний Q² незалежно являє собою фенільне кіль-
це чи 5- або 6-членне гетероциклічне кільце, кожне
кільце необов'язково заміщене одним або більше
замісниками, незалежно вибраними з R⁹;

Q³ являє собою фенільне кільце чи 5- або 6-
членне гетероциклічне кільце, кожне кільце необо-
в'язково заміщене одним або більше замісниками,
незалежно вибраними з R⁹; та
п означає 0, 1 або 2.

2. Похідні ізоксазоліну за п.1, де

R¹ являє собою C₁-C₃алкіл, необов'язково заміще-
ний одним або більше замісниками, незалежно
вибраними з R⁶; кожний R² незалежно являє со-
бою H, галоген, C₁-C₆галогеналкіл, C₁-
C₆галогеналкокси або -CN; та

кожний R³ незалежно являє собою H, галоген, C₁-
C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл, C₃-C₆циклоалкіл, C₃-
C₆галогенциклоалкіл, C₁-C₆алкокси, C₁-
C₆галогеналкокси, -CN або -NO₂.

3. Похідні ізоксазоліну за п.2, де

V¹, V² та V³ незалежно являють собою CR²;

W являє собою O;

R⁴ являє собою H, C₁-C₆алкіл, C₂-C₇алкілкарбоніл
або C₂-C₇алкоксикарбоніл; та

R⁵ являє собою H, NR¹¹R¹² або Q¹; або C₁-C₄алкіл,
C₂-C₄алкеніл, C₂-C₄алкініл, C₃-C₄циклоалкіл, C₄-
C₇алкілциклоалкіл або C₄-C₇циклоалкілалкіл, кож-
ний необов'язково заміщений одним або більше
замісниками, незалежно вибраними з R⁷.

4. Похідні ізоксазоліну за п.3, де

R¹ являє собою C₁-C₂алкіл, необов'язково заміще-
ний галогеном;

кожний R² незалежно являє собою H, CF₃, OCF₃,
галоген або -CN;

кожний R³ незалежно являє собою H, C₁-C₄алкіл,
C₁-C₄галогеналкіл, C₃-C₆циклопропіл, C₁-C₄алкокси
або -CN; та

кожний R⁷ незалежно являє собою галоген, C₁-
C₄алкіл, C₁-C₄алкокси, C₁-C₄алкілтіо, C₁-
C₄алкілсульфініл, C₁-C₄алкілсульфоніл, C₂-
C₄алкілкарбоніл, C₂-C₄алкоксикарбоніл, C₂-
C₅алкіламінокарбоніл, C₂-C₅галогеналкілкарбоніл,
C₂-C₅галогеналкоксикарбоніл, C₂-
C₅галогеналкіламінокарбоніл, -NH₂, -CN або -NO₂;
або Q.

5. Похідні ізоксазоліну за п.4, де

R⁴ являє собою H;

R⁵ являє собою C₁-C₄алкіл, необов'язково заміще-
ний одним або більше замісниками, незалежно
вибраними з R⁷;

кожний R⁷ незалежно являє собою галоген або Q²;
та

кожний Q² незалежно являє собою феніл, піриди-
ніл або тіазоліл.

6. Похідні ізоксазоліну за п.5, де

R¹ являє собою CF₃;

A¹, A², A³, A⁴, A⁵ та A⁶ кожний являє собою CR³;

V² являє собою CR²; та

кожний R³ незалежно являє собою H, C₁-C₄алкіл
або -CN.

7. Похідні ізоксазоліну за п.6, де

V² являє собою CH;

кожний R² незалежно являє собою галоген або C₁-
C₃галогеналкіл;

R³ являє собою H;

R⁵ являє собою CH₂CF₃ або CH₂-2-піридиніл; та
п означає 0.

8. Похідні ізоксазоліну за п.1, які вибрани з групи:

4-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-
(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-N-(2,2,2-
трифторетил)-1-нафталінкарбоксамід,
4-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-
(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-N-піридинілметил)-
1-нафталінкарбоксамід,
4-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-
(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-N-(2-
піридинілметил)-1-нафталінкарбоксамід,
4-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-
(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-N-етил-1-
нафталінкарбоксамід,

4-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-N-(2-метоксietил)-1-нафталінкарбоксамід,

4-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-N-[2-(2,2,2-трифторметил)-2-оксоетил]-1-нафталінкарбоксамід,

5-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-N-(2-піридинілметил)-8-ізохінолінкарбоксамід,

5-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-N-(2-піридинілметил)-8-ізохінолінкарбоксамід та

1-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-N-(2-піридинілметил)-4-ізохінолінкарбоксамід.

9. Похідні ізоксазоліну за п.1, які вибрані з групи:

4-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-N-(2,2,2-трифторетил)-1-нафталінкарбоксамід,

4-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-N-(2-піридинілметил)-1-нафталінкарбоксамід,

4-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-N-етил-1-нафталінкарбоксамід,

4-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-N-(2-метоксietил)-1-нафталінкарбоксамід та

4-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-N-[2-оксо-2-[(2,2,2-трифторетил)аміно]етил]-1-нафталінкарбоксамід.

10. Композиція для боротьби з безхребетними шкідниками, яка містить сполуку за п.1 та принаймні один додатковий компонент, вибраний з групи, що включає поверхнево-активну речовину, твердий розріджувач та рідкий розріджувач.

11. Композиція за п.10, яка додатково містить принаймні одну додаткову біологічно активну сполуку або агент.

12. Композиція для боротьби з безхребетними шкідниками, що містить біологічно ефективну кількість сполуки за п.1 та принаймні один додатковий компонент, вибраний з групи, що включає поверхнево-активну речовину, твердий розріджувач та рідкий розріджувач.

13. Композиція за п.12, яка додатково містить біологічно ефективну кількість принаймні однієї додаткової біологічно активної сполуки або агента.

14. Композиція за п.13, де принаймні одна додаткова біологічно активна сполука або агент вибрані з інсектицидів з групи: модулятори натрієвих каналів, антихолінестеразні засоби, неонікотиніди, інсектицидні макроциклічні лактони, GABA - регульовані блокатори хлоридних каналів, інгібітори синтезу хітину, ювенільні гормональні міметики, ліганди рецептора октопаміну, агоністи екдизону, ліганди рецептору ріанодину, аналоги нерізотоксину, інгібітори мітохондріального переносу електронів, інгібітори біосинтезу ліпідів, циклодієнові інсектициди, інгібітори линяння, нуклеополігедровірус, член *Bacillus thuringiensis*, інкапсульований дельта-ендотоксин *Bacillus thuringiensis*; та природний або генномодифікований вірусний інсектицид.

15. Композиція за п.13, де принаймні одна додаткова біологічно активна сполука або агент вибрані з групи: абаментин, ацефат, ацетаміприд, ацетопрол, алдикарб, амідифлумет, амітраз, аверментин, азадирахтин, азинфос-метил, біфентрин, біфеназат, бістрифлурон, бупрофезин, карбофуран, картап, хінометіонат, хлорфенапір, хлорфлуазурон, хлорантраніліпрол, хлорпірифос, хлорпірифос-метил, хлоробензилат, хромафенозид, клотіанідин, цифлуметофен, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, гама-цигалотрин, лямбда-цигалотрин, цигексатин, циперметрин, циромазин, дельтаметрин, діафентіурон, діазинон, дикофол, діельдрин, дієнохлор, дифлубензурон, димефлутрин, диметоат, динотефуран, діофенолан, емаментин, ендосульфат, есфенвалерат, етіпрол, етоксазол, фенаміфос, феназахін, оксид фенбутатину, фенотіокарб, феноксикарб, фенпропратрин, фенпіроксимат, фенвалерат, фіпроніл, флонікамід, флубендіамід, флуцитринат, тау-флувалінат, флуфенерим, флуфеноксурон, фонофос, галофенозид, гексафлумурон, гекситіазокс, гідраметилнон, іміціафос, імідаклоприд, індоксакарб, ізофенфос, луфенурон, малатіон, метафлумізон, метальдегід, метамідофос, метідаіон, метоміл, метопрен, метоксихлор, метоксифенозид, метофлутрин, монокротофос, нітенпірам, нітіазин, новалурон, новіфлумурон, оксаміл, паратіон, паратіон-метил, перметрин, форат, фосалон, фосмет, фосфамідон, піримікарб, профенофос, профлутрин, пропаргіт, протрифенбут, піметрозин, пірафлупрол, піретрин, піридабен, піридаліл, пірифлухіназон, пірипрол, пірипроксифен, ротенон, ріанодин, спінеторам, спіносад, спіродиклофен, спіромезифен, спіротетрамат, сульпрофос, тебуфенозид, тебуфенпірад, тефлубензурон, тефлутрин, тербуфос, тетрахлорвінфос, тіаклоприд, тіаметоксам, тіодикарб, тіосультап-натрій, толфенпірад, тралометрин, триазамат, трихлорфен, трифлумурон, *Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*, нуклеополігедровірус, інкапсульований дельта-ендотоксин *Bacillus thuringiensis*, бакуловірус, ентомопатогенні бактерії, ентомопатогенний вірус та ентомопатогенні гриби.

16. Композиція за п.15, де принаймні одна додаткова біологічно активна сполука або агент вибрані з групи: абаментин, ацетаміприд, амітраз, аверментин, азадирахтин, біфентрин, бупрофезин, картап, хлорантраніліпрол, хлорфенапір, хлорпірифос, клотіанідин, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, лямбда-цигалотрин, циперметрин, циромазин, дельтаметрин, діельдрин, динотефуран, діофенолан, емаментин, ендосульфат, есфенвалерат, етіпрол, фенотіокарб, феноксикарб, фенвалерат, фіпроніл, флонікамід, флубендіамід, флуфеноксурон, гексафлумурон, гідраметилнон, імідаклоприд, індоксакарб, луфенурон, метафлумізон, метоміл, метопрен, метоксифенозид, нітенпірам, нітіазин, новалурон, оксаміл, піметрозин, піретрин, піридабен, піридаліл, пірипроксифен, ріанодин, спінеторам, спіносад, спіродиклофен, спіромезифен, тебуфенозид, тіаклоприд, тіаметоксам, тіодикарб, тіосультап-натрій, тралометрин, триазамат, трифлумурон, *Bacillus thuringiensis*

subsp. aizawai, *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*, нуклеополігедровірус та інкапсульований дельта-ендотоксин *Bacillus thuringiensis*.

17. Композиція за п.12 або 13, яка є у формі рідкої препаративної форми для змочування ґрунту.

18. Композиція у формі спрею для боротьби з безхребетними шкідниками, яка містить:

(а) біологічно ефективну кількість сполуки за п.1 або композиції за п.12 або 13; та

(b) пропелент.

19. Композиція у формі приманки для боротьби з безхребетними шкідниками, яка містить:

(а) біологічно ефективну кількість сполуки за п.1 або композиції за п.12 або 13;

(b) одну або більше харчову речовину.

20. Композиція за п.19, яка додатково містить аттрактант.

21. Композиція за п.19 або 20, яка додатково містить зволожувач.

22. Пастка для боротьби з безхребетними шкідниками, яка містить:

(а) композицію у формі приманки за пп.19-21; та

(b) корпус, пристосований для розміщення композиції у формі приманки, де корпус має принаймні один отвір, розмір якого дозволяє безхребетному шкіднику пройти через отвір, так що безхребетний шкідник може скористатися доступом до зазначеної композиції у формі приманки із місця знаходження поза корпусом, та де корпус додатково пристосований для розміщення в або поблизу місця знаходження можливої або відомої активності безхребетних шкідників.

23. Спосіб боротьби з безхребетними шкідниками, що включає контактування безхребетного шкідника або його оточення з біологічно ефективною кількістю сполуки за будь-яким з пп.1-8, за умови, що вказаний спосіб не є терапевтичним способом лікування людини або тварини.

24. Спосіб боротьби з безхребетними шкідниками, що включає контактування безхребетного шкідника або його оточення з композицією за будь-яким з пп.10-21, за умови, що вказаний спосіб не є тера-

певтичним способом лікування людини або тварини.

25. Спосіб за п.24, де оточення являє собою ґрунт та композицію застосовують до ґрунту у вигляді препаративної форми для змочування ґрунту.

26. Спосіб боротьби з тарганами, мурахами або термітами, який включає контактування таргана, мурахи або терміта з композицією у формі приманки в пастці за п.22, за умови, що вказаний спосіб не є терапевтичним способом лікування людини або тварини.

27. Спосіб боротьби з москітами, мошками, жигалками осінніми, оленячими гедзями, гедзями, осами справжніми, осами, шершнями, кліщами, павуками, мурахами або комарами, який включає контактування москітів, мошок, жигалок осінніх, оленячих гедзів, гедзів, ос справжніх, ос, шершнів, кліщів, павуків, мурах або комарів з композицією у формі спрею за п.18, дозованою з контейнера для розприскування, за умови, що вказаний спосіб не є терапевтичним способом лікування людини або тварини.

28. Спосіб захисту насіння від безхребетного шкідника, який включає контактування насіння з біологічно ефективною кількістю сполуки за п.1.

29. Спосіб за п.28, в якому насіння покривають сполукою за п.1, виготовленою у вигляді композиції, що містить плівкоутворювач або адгезійний засіб.

30. Оброблене насіння, що містить сполуку за п.1 в кількості від приблизно 0,0001 до 1 % на масу насіння перед обробкою.

31. Композиція для захисту тварини від безхребетного паразитичного шкідника, що містить паразитично ефективну кількість сполуки за п.1 або 9 та принаймні один носій.

32. Композиція за п.31, виготовлена у формі для перорального введення.

33. Застосування сполуки за п.1 або 9 для захисту тварини від безхребетного паразитичного шкідника.

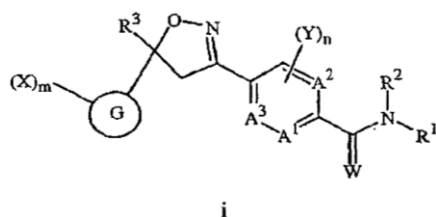
Даний винахід відноситься до певних ізоксазолінів, їх N-оксидів, солей та композицій, придатних для сільськогосподарського та несільськогосподарського застосування, включаючи застосування наведені нижче, і до способів їх застосування для боротьби з безхребетними шкідниками, такими як членистоногі, як в сільськогосподарських, так і несільськогосподарських середовищах.

Передумови створення винаходу

Боротьба з безхребетними шкідниками надзвичайно важлива для досягнення високої ефективності урожаю. Пошкодження сільськогосподарських культур, які ростуть та які зберігають, викликані безхребетними шкідниками, можуть викликати істотне зниження продуктивності та, таким чином, призвести до збільшених витрат спожива-

ча. Також важливою є боротьба з безхребетними шкідниками, які вражають лісове господарство, тепличні культури, декоративні рослини, культури у розсадниках, харчові продукти та волокнисту продукцію, що зберігаються, худобу, домашнє господарство, дерен, лісоматеріали та наносять шкоду здоров'ю людей та тварин. Для цих цілей комерційно доступно багато продуктів, але продовжує залишатися потреба в нових сполуках, які є більш ефективними, менш дорогими, менш токсичними, екологічно безпечнішими або мають відмінні способи дії.

Публікація патентної заявки PCT WO 05/085216 розкриває похідні ізоксазоліну Формули і як інсектициди

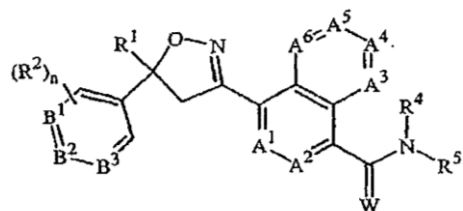


i

де, зокрема, кожний з A^1 , A^2 та A^3 незалежно являє собою С або N; G являє собою бензольне кільце; W являє собою О або S; та X являє собою галоген або C_1 - C_6 галогеналкіл.

Короткий опис суті винаходу

Даний винахід відноситься до сполук Формули 1, включаючи всі їх геометричні та стереоізмери, N-оксиди та солі, та композицій, що їх містять, та до їх застосування для боротьби з безхребетними шкідниками:



1

де

A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 та A^6 незалежно вибрані з групи, що включає CR^3 та N, за умови, що не більше, ніж 3 з A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 та A^6 являють собою N;

B^1 , B^2 та B^3 незалежно вибрані з групи, що включає CR та N;

W являє собою О або S;

R^1 являє собою C_1 - C_6 алкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 алкініл, C_3 - C_6 циклоалкіл, C_4 - C_7 алкілциклоалкіл або C_4 - C_7 циклоалкілалкіл, кожний необов'язково заміщений одним або більше замісниками, незалежно вибраними з R^6 ;

кожний R^2 незалежно являє собою Н, галоген, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 галогеналкокси, C_1 - C_6 алкілтіо, C_1 - C_6 галогеналкілтіо, C_1 - C_6 алкілсульфініл, C_1 - C_6 галогеналкілсульфініл, C_1 - C_6 алкілсульфоніл, C_1 - C_6 галогеналкілсульфоніл, C_1 - C_6 алкіламіно, C_2 - C_6 діалкіламіно, C_2 - C_4 алкоксикарбоніл, -CN або -NO₂;

кожний R^3 незалежно являє собою Н, галоген, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл, C_3 - C_6 галогенциклоалкіл, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 галогеналкокси, C_1 - C_6 алкілтіо, C_1 - C_6 галогеналкілтіо, C_1 - C_6 алкілсульфініл, C_1 - C_6 галогеналкілсульфініл, C_1 - C_6 алкілсульфоніл, C_1 - C_6 галогеналкілсульфоніл, C_1 - C_6 алкіламіно, C_2 - C_6 діалкіламіно, -CN або -NO₂;

R^4 являє собою Н, C_1 - C_6 алкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 алкініл, C_3 - C_6 циклоалкіл, C_4 - C_7 алкілциклоалкіл, C_4 - C_7 циклоалкілалкіл, C_2 - C_7 алкілкарбоніл або C_2 - C_7 алкоксикарбоніл;

R^5 являє собою Н, OR¹⁰, NR¹¹R¹² або Q¹; або C_1 - C_6 алкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 алкініл, C_3 - C_6 циклоалкіл, C_4 - C_7 алкілциклоалкіл або C_4 - C_7 циклоа-

лілалкіл, кожний необов'язково заміщений одним або більше замісниками, незалежно вибраними з R^7 ; або

R^4 та R^5 , взяті разом з азотом, до якого приєднані, утворюють кільце, що містить 2-6 атомів вуглецю та необов'язково один додатковий атом, вибраний з групи, що включає N, S та O, зазначене кільце необов'язково заміщене 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає C_1 - C_2 алкіл, галоген, -CN, -NO₂ та C_1 - C_2 алкокси;

кожний R^6 незалежно являє собою галоген, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 алкілтіо, C_1 - C_6 алкілсульфініл, C_1 - C_6 алкілсульфоніл, -CN або -NO₂;

кожний R^7 незалежно являє собою галоген, C_1 - C_6 алкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 алкілтіо, C_1 - C_6 алкілсульфініл, C_1 - C_6 алкілсульфоніл, C_1 - C_6 алкіламіно, C_2 - C_8 діалкіламіно, C_3 - C_6 циклоалкіламіно, C_2 - C_7 алкілкарбоніл, C_2 - C_7 алкоксикарбоніл, C_2 - C_7 алкіламінокарбоніл, C_3 - C_9 діалкіламінокарбоніл, C_2 - C_7 галогеналкілкарбоніл, C_2 - C_7 галогеналкоксикарбоніл, C_2 - C_7 галогеналкіламінокарбоніл, C_3 - C_9 галогендіалкіламінокарбоніл, гідрокси, -NH₂, -CN або -NO₂; або Q²;

кожний R^8 незалежно являє собою галоген, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 галогеналкокси, C_1 - C_6 алкілтіо, C_1 - C_6 галогеналкілтіо, C_1 - C_6 алкілсульфініл, C_1 - C_6 галогеналкілсульфініл, C_1 - C_6 алкілсульфоніл, C_1 - C_6 галогеналкілсульфоніл, C_1 - C_6 алкіламіно, C_2 - C_6 діалкіламіно, C_2 - C_4 алкоксикарбоніл, -CN або -NO₂;

кожний R^9 незалежно являє собою галоген, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл, C_3 - C_6 галогенциклоалкіл, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 галогеналкокси, C_1 - C_6 алкілтіо, C_1 - C_6 галогеналкілтіо, C_1 - C_6 алкілсульфініл, C_1 - C_6 галогеналкілсульфініл, C_1 - C_6 алкілсульфоніл, C_1 - C_6 галогеналкілсульфоніл, C_1 - C_6 алкіламіно, C_2 - C_6 діалкіламіно, -CN, -NO₂, феніл або піридиніл;

R^{10} являє собою Н; або C_1 - C_6 алкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 алкініл, C_3 - C_6 циклоалкіл, C_4 - C_7 алкілциклоалкіл або C_4 - C_7 циклоалкілалкіл, кожний необов'язково заміщений одним або більше галогенами;

R^{11} являє собою Н, C_1 - C_6 алкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 алкініл, C_3 - C_6 циклоалкіл, C_4 - C_7 алкілциклоалкіл, C_4 - C_7 циклоалкілалкіл, C_2 - C_7 алкілкарбоніл або C_2 - C_7 алкоксикарбоніл;

R^{12} являє собою Н; Q³; або C_1 - C_6 алкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 алкініл, C_3 - C_6 циклоалкіл, C_4 - C_7 алкілциклоалкіл або C_4 - C_7 циклоалкілалкіл, кожний необов'язково заміщений одним або більше замісниками, незалежно вибраними з R^7 ; або

R^{11} та R^{12} , взяті разом з азотом, до якого приєднані, утворюють кільце, що містить 2-6 атомів вуглецю та необов'язково один додатковий атом, вибраний з групи, що включає N, S та O, зазначене кільце необов'язково заміщене 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає C_1 - C_2 алкіл, галоген, -CN, -NO₂ та C_1 - C_2 алкокси;

Q¹ являє собою фенільне кільце, 5- або 6-членне гетероциклічне кільце чи 8-, 9- або 10-членну конденсовану біциклічну кільцеву систему, що необов'язково містить від одного до трьох гетероатомів, вибраних з 0-1 О, 0-1 S та 0-3 N, кожне кільце або кільцева система необов'язково замі-

шені одним або більше замісниками, незалежно вибраними з R^8 ;

кожний Q^2 незалежно являє собою фенільне кільце чи 5- або 6-членне гетероциклічне кільце, кожне кільце необов'язково заміщене одним або більше замісниками, незалежно вибраними з R^9 ;

Q^3 являє собою фенільне кільце чи 5- або 6-членне гетероциклічне кільце, кожне кільце необов'язково заміщене одним або більше замісниками, незалежно вибраними з R^9 ; та

n означає 0, 1 або 2.

Даний винахід також забезпечує композицію, яка містить сполуку Формули 1, її N-оксид або сіль, та, принаймні, один додатковий компонент, вибраний з групи, що включає поверхнево-активну речовину, твердий розріджувач та рідкий розріджувач. В одному втіленні, даний винахід також забезпечує композицію для боротьби з безхребетними шкідниками, яка містить біологічно ефективну кількість сполуки Формули 1, її N-оксиду або солі, та, принаймні, один додатковий компонент, вибраний з групи, що включає поверхнево-активну речовину, твердий розріджувач та рідкий розріджувач, зазначена композиція необов'язково додатково містить біологічно ефективну кількість, принаймні, однієї додаткової біологічно активної сполуки або агенту.

Даний винахід, крім того, забезпечує композицію у формі спрею для боротьби з безхребетними шкідниками, яка містить біологічно ефективну кількість сполуки Формули 1, її N-оксиду або солі, або композиції, описаної вище, та пропелент. Даний винахід також забезпечує композицію у формі приманки для боротьби з безхребетними шкідниками, яка містить біологічно ефективну кількість сполуки Формули 1, її N-оксиду або солі, або композиції, описаної вище, одну або більше харчову речовину, необов'язково атрактант, та необов'язково зволожувач.

Даний винахід, крім того, забезпечує пастку для боротьби з безхребетними шкідниками, яка включає зазначену композицію у формі приманки та корпус, пристосований для розміщення зазначеної композиції у формі приманки, де корпус має, принаймні, один отвір, розмір якого дозволяє безхребетному шкіднику пройти через отвір, так що безхребетний шкідник може скористатися доступом до зазначеної композиції у формі приманки із місця знаходження поза корпусом, та де корпус додатково пристосований для розміщення в або поблизу місцезнаходження можливої або відомої активності безхребетних шкідників.

Даний винахід також забезпечує спосіб боротьби з безхребетними шкідниками, який включає контактування безхребетного шкідника або його оточення з біологічно ефективною кількістю сполуки Формули 1, її N-оксиду або солі (наприклад, у вигляді композиції, описаної в даній заявці). Даний винахід також відноситься до такого способу, де безхребетний шкідник або його оточення контактують з композицією, що містить біологічно ефективну кількість сполуки Формули 1, її N-оксиду або солі, та, принаймні, один додатковий компонент, вибраний з групи, що включає поверхнево-активну речовину, твердий розріджувач та рідкий розріджувач,

джував, зазначена композиція необов'язково додатково містить біологічно ефективну кількість, принаймні однієї додаткової біологічно активної сполуки або агенту.

Детальний опис винаходу

Як використовується в даній заявці, мається на увазі, що терміни "містить", "що містить", "включає", "включаючи", "має", "маючи", "складається", "складаючись" або будь-яка їх інша варіація відносяться до невиняткового включення. Наприклад, композиція, суміш, процес, спосіб, продукт або апарат, який включає перелік елементів, не обмежується обов'язково лише цими елементами, а він може включати інші елементи не зазначені чітко в переліку або властиві такій композиції, суміші, процесу, способу, продукту або апарату. Надалі, якщо тільки не зазначено інше, "або" відноситься до включаючого "або" та до не виключаючого "або". Наприклад, умова A або B задовольняє будь-якому з наступного: A вірне (або присутнє) та B невірне (або відсутнє), A невірне (або відсутнє) та B вірне (або присутнє), та як A, так і B вірні (або присутні).

Також, мається на увазі, що невизначені артикли "a" та "an", що передують елементу або компоненту винаходу, необмежені щодо кількості прикладів (тобто випадків) елемента або компонента. Таким чином, потрібно читати, що "a" або "an" включають один або, принаймні, один, та однина елемента або компонента також включає множину, за винятком, коли число явно означає одиницю.

Як посилаються в даній заявці, термін "безхребетний шкідник" включає членистоногі, червононогі молюски та нематоди, що мають економічне значення як шкідники. Термін "членистоногий" включає комахи, кліщі, павуки, скорпіони, багатоніжки, двопарноногі, мокриці та симфіли. Термін "червононогі молюски" включає равлики, слизняки та інші Stylommatophora. Термін "гельмінти" включає черв'яки в типах Nematelminthes, Platyhelminthes та Acanthocephala, такі як: круглі черв'яки, серцеві глисти та рослиноїдні нематоди (Nematoda), трематоди (Trematoda), стрічкові черв'яки (Cestoda) та колючоголові черв'яки.

В контексті даної заявки "боротьба з безхребетними шкідниками" означає інгібування розвитку безхребетних шкідників (включаючи смертність, зниження живлення та/або порушення спарювання) та залежні експресії визначені аналогічно.

Термін "сільськогосподарський" відноситься до вирощування польових культур, таких як культури призначені для харчування та виробництва волокна, та включає вирощування кукурудзи, сої та інших бобів, рису, злакових культур (наприклад, пшениці, вівса, ячменю, жита, рису, маїсу), листяних овочевих культур (наприклад, салату, капусти та інших капустяних культур), плодоносних овочевих культур (наприклад, помідорів, перцю, баклажану, хрестоцвітних та огірків), картоплі, солодкої картоплі, винограду, бавовни, деревних фруктів (наприклад, насіннячкових, кісточкових та цитрусових), ягід (ягід, вишні) та інших спеціальних культур (наприклад, каноли, соняшнику, маслин). Термін "несільськогосподарський" відноситься до садових культур (наприклад, рослин в теплицях,

розсадниках або декоративних рослин, що не вирощуються в полі), до використань в житлових та комерційних структурах в міських та промислових приміщеннях, дерну (наприклад, дерен на фермі, пасовищі, полі для гри в гольф, житлових газонах, розважальних спортивних площадках, тощо), лісоматеріалів, продуктів, що зберігаються, агролісового господарства та контролювання вирощування, охорони здоров'я (людей) та охорони здоров'я тварин (наприклад, свійських тварин, таких як кімнатні тварини, худоба та домашня птиця, несвійських тварин, таких як дикі тварини).

В зазначених вище визначеннях, термін "алкіл", що використовується або сам по собі, або в складених словах, таких як "алкілтіо" або "галогеналкіл", включає алкіл з прямим або розгалуженим ланцюгом, як наприклад, метил, етил, н-пропіл, і-пропіл або різні ізомери бутилу, пентилу або гексилу. "Алкеніл" включає алкени з прямим або розгалуженим ланцюгом, як наприклад етеніл, 1-пропеніл, 2-пропеніл та різні ізомери бутенілу, пентенілу та гексенілу. "Алкеніл" також включає полієни, як наприклад 1,2-пропадієніл та 2,4-гексадієніл. "Алкініл" включає алкіни з прямим або розгалуженим ланцюгом, як наприклад етиніл, 1-пропініл, 2-пропініл та різні ізомери бутинілу, пентинілу та гексинілу. "Алкініл" також може включати компоненти, що містять множинні потрійні зв'язки, як наприклад 2,5-гексадініл.

"Алкокси" включає, наприклад, метокси, етокси, н-пропілокси, ізопропілокси та різні ізомери бутокси, пентокси та гексилокси. "Алкілтіо" включає алкілтіо компоненти з прямим або розгалуженим ланцюгом, як наприклад метилтіо, етилтіо та різні ізомери пропілтіо, бутилтіо, пентилтіо та гексилтіо. "Алкілсульфініл" включає обидва енантіомери алкілсульфінільної групи. Приклади "алкілсульфінілу" включають $\text{CH}_3\text{S(O)-}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S(O)-}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S(O)-}$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHS(O)-}$ та різні ізомери бутилсульфінілу, пентилсульфінілу та гексилсульфінілу. Приклади "алкілсульфонілу" включають $\text{CH}_3\text{S(O)}_2-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S(O)}_2-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S(O)}_2-$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHS(O)}_2-$ та різні ізомери бутилсульфонілу, пентилсульфонілу та гексилсульфонілу. "Алкіламіно", "діалкіламіно" та подібні визначені аналогічно до наведених вище прикладів. "Циклоалкіл" включає, наприклад, циклопропіл, циклобутил, циклопентил та циклогексил. Термін "алкілциклоалкіл" означає заміщення циклоалкільного компоненту алкілом та включає, наприклад, етилциклопропіл, і-пропілциклобутил, 3-метилциклопентил та 4-метилциклогексил. Термін "циклоалкілалкіл" означає заміщення алкільного компоненту циклоалкілом. Приклади "циклоалкілалкілу" включають циклопропілметил, циклопентилетил та інші циклоалкільні компоненти, приєднані до алкільної групи з прямим або розгалуженим ланцюгом.

Термін "галоген", або сам по собі, або в складених словах, таких як "галогеналкіл", або при використанні в описі, як наприклад "алкіл, заміщений галогеном", включає фтор, хлор, бром або йод. Крім того, коли він використовується в складених словах, таких як "галогеналкіл", або при використанні в описі, як наприклад "алкіл, заміщений галогеном", зазначений алкіл може бути част-

ково або повністю заміщений атомами галогену, які можуть бути однаковими або різними. Приклади "галогеналкілу" або "алкілу, заміщеного галогеном" включають $\text{F}_3\text{C-}$, ClCH_2- , CF_3CH_2- та CF_3CCl_2- . Терміни "галогенциклоалкіл", "галогеналкокси", "галогеналкілтіо" та подібні визначені аналогічно до терміну "галогеналкіл". Приклади "галогеналкокси" включають $\text{CF}_3\text{O-}$, $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O-}$, $\text{HCF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O-}$ та $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O-}$. Приклади "галогеналкілтіо" включають $\text{CCl}_3\text{S-}$, $\text{CF}_3\text{S-}$, $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{S-}$ та $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S-}$. Приклади "галогеналкілсульфінілу" включають $\text{CF}_3\text{S(O)-}$, $\text{CCl}_3\text{S(O)-}$, $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S(O)-}$ та $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S(O)-}$. Приклади "галогеналкілсульфонілу" включають $\text{CF}_3\text{S(O)}_2-$, $\text{CCl}_3\text{S(O)}_2-$, $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S(O)}_2-$ та $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S(O)}_2-$.

"Алкілкарбоніл" означає алкільні компоненти з прямим або розгалуженим ланцюгом, які зв'язані з компонентом C(=O) . Приклади "алкілкарбонілу" включають $\text{CH}_3\text{C(=O)-}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C(=O)-}$ та $(\text{CH}_3)_2\text{CHC(=O)-}$. Приклади "алкоксикарбонілу" включають $\text{CH}_3\text{OC(=O)-}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC(=O)-}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC(=O)-}$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC(=O)-}$ та різні ізомери бутокси- або пентоксикарбонілу.

Загальна кількість атомів вуглецю в заміщуючій групі вказана за допомогою префіксу "C_i-C_j", де і та j означають числа від 1 до 8. Наприклад, C₁-C₄ алкілсульфоніл означає радикал від метилсульфонілу до бутилсульфонілу; C₂ алкоксіалкіл означає CH_3OCH_2 ; C₃ алкоксіалкіл означає, наприклад, $\text{CH}_3\text{CH}(\text{OCH}_3)$, $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ або $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$; та C₄ алкоксіалкіл означає різні ізомери алкільної групи, заміщеної алкокси групою, що містить загально чотири атоми вуглецю, приклади включають $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ та $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$.

Коли сполука заміщена замісником, що має нижній індекс, який вказує, що кількість зазначених замісників може перевищити 1, зазначені замісники (коли їх більше 1) незалежно вибрані з групи визначених замісників, наприклад, $(\text{R}^2)_n$, n означає 1, 2, 3, 4 або 5. Коли група містить замісник, який може бути воднем, наприклад R^2 , тоді, коли цей замісник взятий як водень, визнають, що ця група еквівалентна зазначеній групі, що є незаміщеною.

Термін "гетероциклічне кільце", "гетероцикл" або "гетероциклічна кільцева система" означає кільця або кільцеві системи, в яких, принаймні, один кільцевий атом не є вуглецем, наприклад, азот, кисень або сірка. Звичайно гетероциклічне кільце містить не більше, ніж 4 атоми азоту, не більше, ніж 2 атоми кисню та не більше, ніж 2 атоми сірки. Гетероциклічне кільце може бути приєднане через будь-який доступний атом вуглецю або азоту шляхом заміни атому водню на зазначений атом вуглецю або азоту. Гетероциклічне кільце може бути насиченим, частково ненасиченим або повністю ненасиченим кільцем. Коли повністю ненасичене гетероциклічне кільце задовольняє правило Хюкеля, тоді зазначене кільце також називають "гетероароматичним кільцем", "ароматичним гетероциклічним кільцем".

Термін "ароматичне кільце" або "ароматична кільцева система" означає повністю ненасичені карбоцикли та гетероцикли, в яких, принаймні, одне кільце поліциклічної кільцевої системи є ароматичним (де ароматичний означає, що кіль-

цева система задовольняє правило Хюкеля). Термін "конденсована біциклічна кільцева система" включає кільцеву систему, що складається з двох конденсованих кілець, в яких будь-яке кільце може бути насиченим, частково ненасиченим або повністю ненасиченим. Термін "конденсована гетеробіциклічна кільцева система" включає кільцеву систему, що складається з двох конденсованих кілець, в яких, принаймні, один кільцевий атом не є вуглецем та які можуть бути ароматичними або неароматичними, як визначено вище.

Термін "необов'язково заміщений" щодо гетероциклічних кілець відноситься до груп, які є незаміщеними, або мають, принаймні, один неводневий замісник, який не гасить біологічну активність, яку має незаміщений аналог. Як використовується в даній заявці, повинні застосовуватися наступні визначення, якщо не вказано інше. Термін "необов'язково заміщений" використовується рівнозначно з фразою "заміщений або незаміщений" або з терміном "(не)заміщений." Якщо не вказано інше, необов'язково заміщена група може мати замісник в кожному положенні групи, здатної до заміщення, та кожне заміщення є незалежним від іншого.

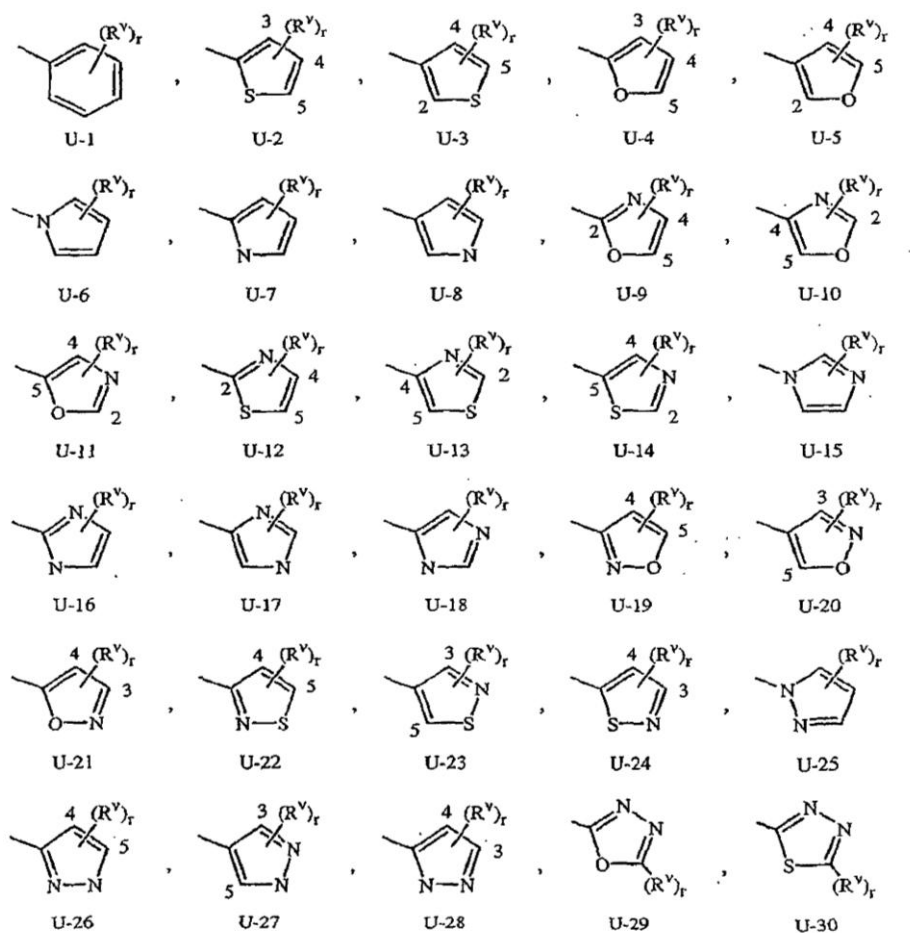
Коли Q^1 являє собою 5- або 6-членне гетероциклічне кільце, що містить азот, воно може бути приєднане до залишку Формули 1 через будь-який доступний кільцевий атом вуглецю або азоту, якщо не описано інше. Так само, коли Q^2 або Q^3 яв-

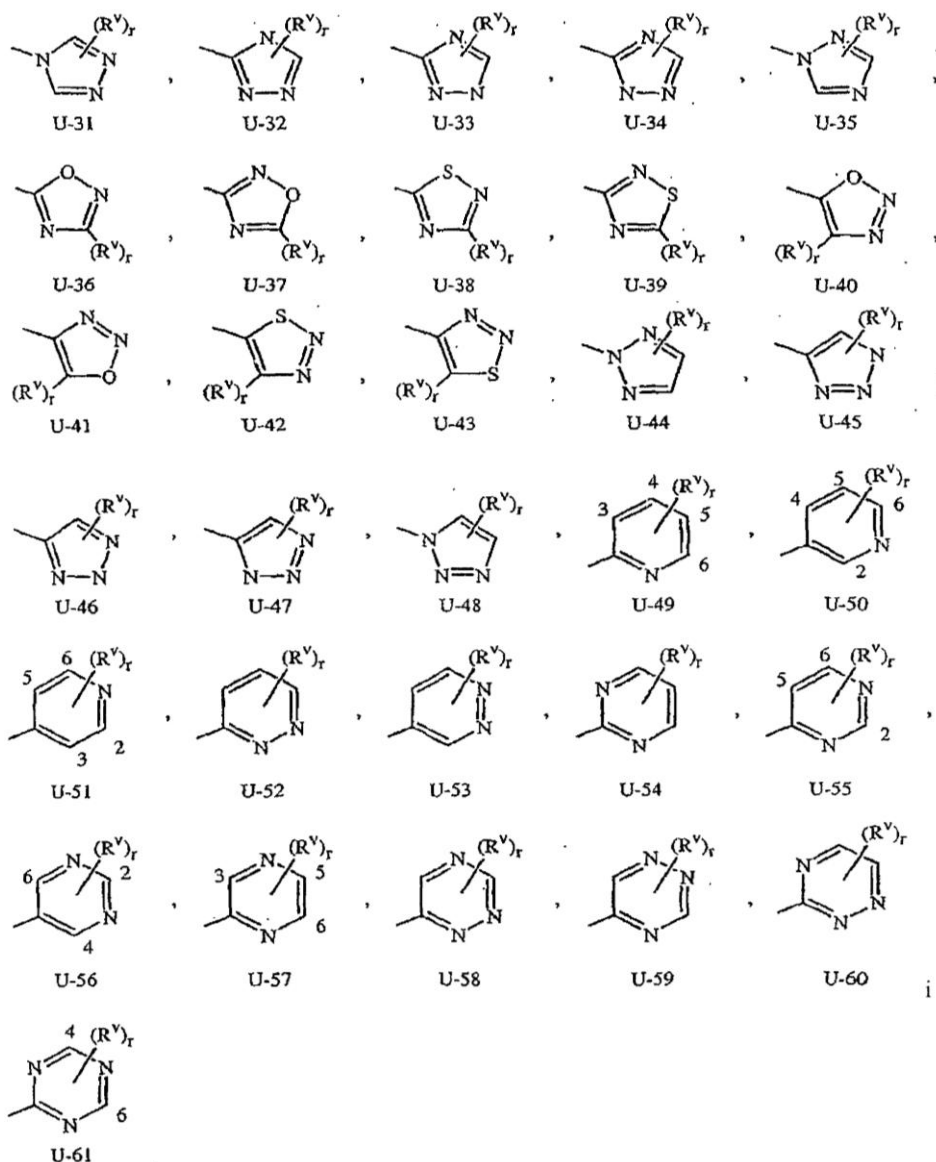
ляє собою 5- або 6-членний гетероцикл, що містить азот, він може бути приєднаний через будь-який доступний кільцевий атом вуглецю або азоту, якщо не описано інше.

Як зазначено вище, Q^1 , Q^2 або Q^3 можуть бути (серед іншого) фенілом, необов'язково заміщеним одним або більше замісниками, вибраними з групи замісників, які визначені в частині „Короткий опис суті винаходу”. Прикладом фенілу, необов'язково заміщеного від одного до п'яти замісниками, є кільце, проілюстроване як U-1 в Ілюстрації 1, де R^y являє собою R^8 або R^9 , які визначені в частині „Короткий опис суті винаходу” для Q^1 , Q^2 або Q^3 та r означає ціле число від 0 до 5.

Як зазначено вище, Q^1 , Q^2 або Q^3 можуть бути (серед іншого) 5- або 6-членним гетероциклічним кільцем, яке може бути насиченим або ненасиченим, необов'язково заміщеним одним або більше замісниками, вибраними з групи замісників, які визначені в частині „Короткий опис суті винаходу”. Приклади 5- або 6-членних ненасичених ароматичних гетероциклічних кілець, необов'язково заміщених одним або більше замісниками, включають кільця U-2 - U-61, проілюстровані в Ілюстрації 1, де R^y являє собою будь-який замісник, який визначений в частині „Короткий опис суті винаходу” для Q^1 , Q^2 або Q^3 (тобто, R^8 або R^9) та r означає ціле число від 0 до 4.

Ілюстрація 1





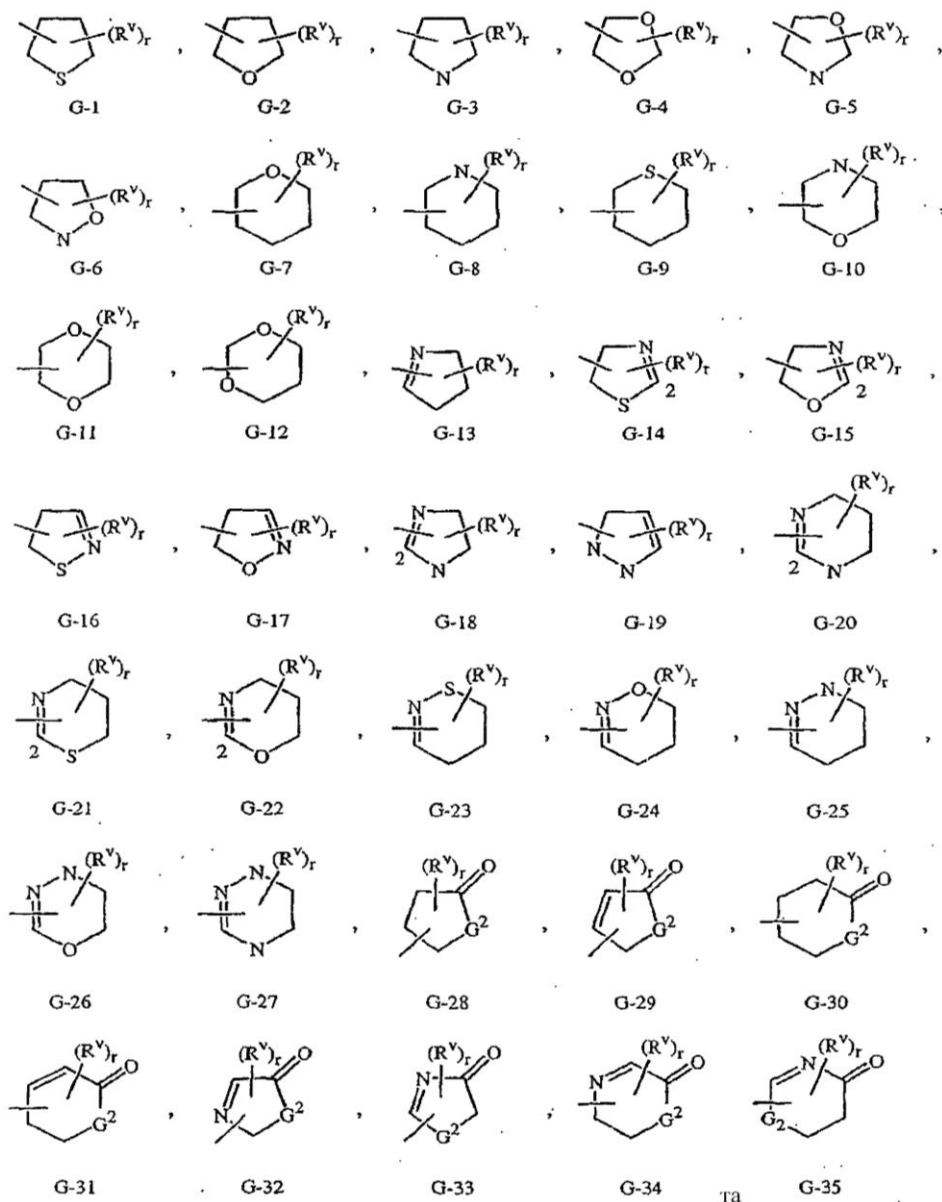
Відзначено, що коли Q^1 , Q^2 або Q^3 являють собою 5- або 6-членне насичене або ненасичене неароматичне гетероциклічне кільце, необов'язково заміщене одним або більше замісниками, вибраними з групи замісників, які визначені в частині „Короткий опис суті винаходу” для Q^1 , Q^2 або Q^3 , один або два вуглецеві кільцеві члени гетероциклу необов'язково можуть знаходитися в окисненій формі карбонільного компонента.

Приклади 5- або 6-членних насичених або неароматичних ненасичених гетероциклічних кілець включають кільця G-1 - G-35, які проілюстровані в Ілюстрації 2. Відзначено, що коли точка приєднання на групі G проілюстрована як змінна, група G

може бути приєднана до залишку Формули 1 через будь-який доступний атом вуглецю або азоту групи G шляхом заміни атома водню. Необов'язкові замісники можуть бути приєднані до будь-якого доступного атома вуглецю або азоту шляхом заміни атома водню.

Відзначено, що коли Q^1 , Q^2 або Q^3 включають кільце, вибране з G-28 - G-35, G^2 вибраний з O, S або N. Відзначено, що коли G^2 являє собою N, валентність атома азоту може бути завершена заміщенням або H, або замісниками, які визначені в частині „Короткий опис суті винаходу” для Q^1 , Q^2 або Q^3 (тобто, R^8 або R^9).

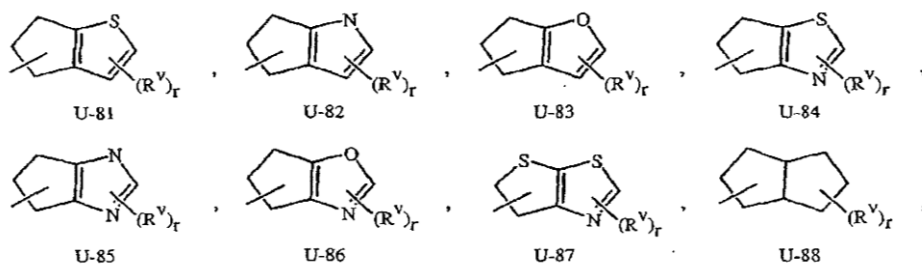
Ілюстрація 2

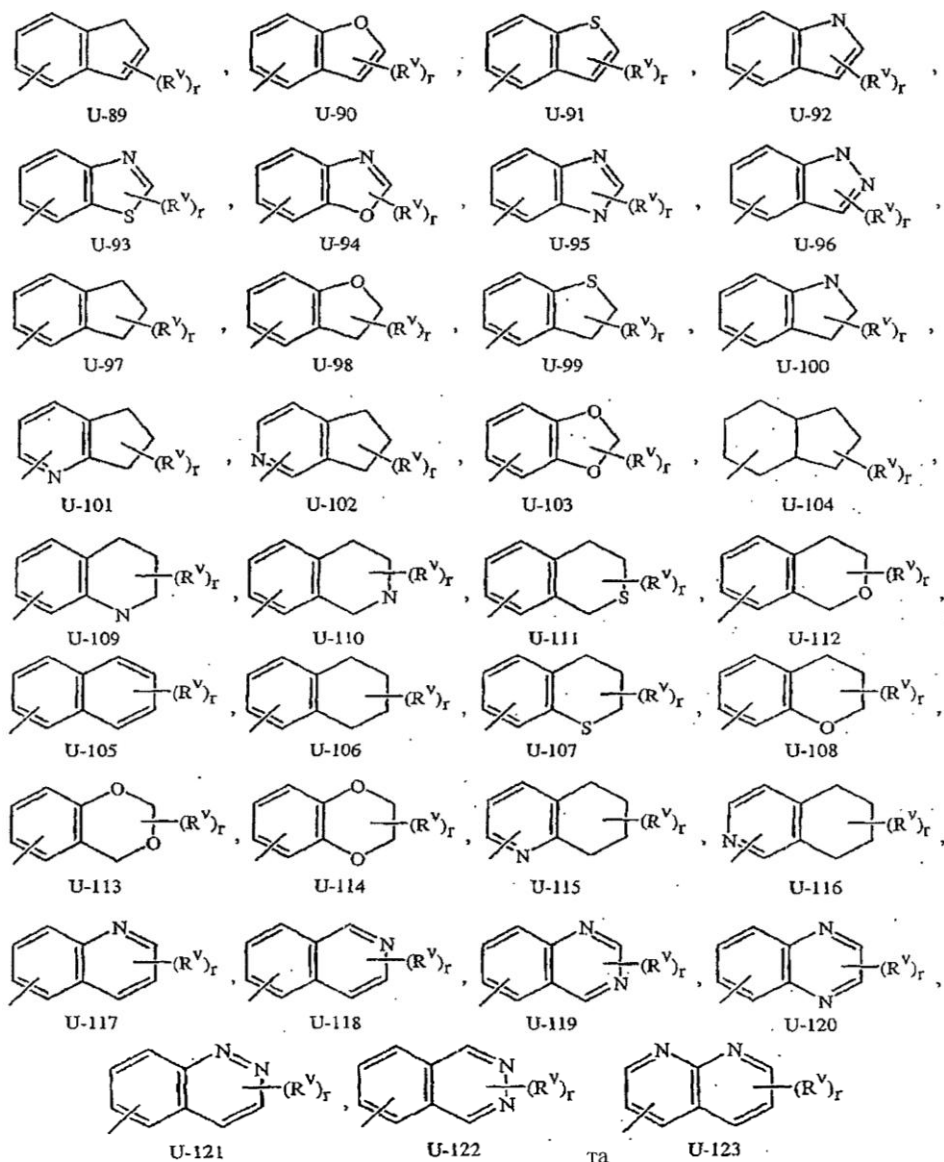


Як зазначено вище, Q^1 може бути (серед іншого) 8-, 9- або 10-членною конденсованою біциклічною кільцевою системою, необов'язково заміщеною одним або більше замісниками, вибраними з групи замісників, які визначені в частині „Короткий опис суті винаходу” (тобто, R^8). Приклади 8-, 9- або 10-членної конденсованої біциклічної кільце-

вої системи, необов'язково заміщеної одним або більше замісниками, включають кільця U-81 - U-123, проілюстровані в Ілюстрації 3, де R^v являє собою будь-який замісник, який визначений в частині „Короткий опис суті винаходу” для Q^1 (тобто, R^8) та r означає ціле число від 0 до 4.

Ілюстрація 3





Хоча групи R^V наведені в структурах U-1 - U-123, зазначено, що вони можуть бути не присутні, оскільки вони є необов'язковими замісниками. Відзначено, що, коли R^V являє собою H та приєднаний до атома, це означає те ж саме, що зазначений атом є незаміщеним. Атоми азоту, які потребують заміщення для досягнення валентності, заміщені H або R^V . Відзначено, що коли точка приєднання між $(R^V)_r$ та групою U проілюстрована як змінна, $(R^V)_r$ може бути приєднаний до будь-якого доступного атома вуглецю або атома азоту групи U. Відзначено, що коли точка приєднання на групі U проілюстрована як змінна, група U може бути приєднана до залишку Формули 1 через будь-який доступний атом вуглецю або азоту групи U шляхом заміни атома водню. Відзначено, що деякі групи U можуть бути заміщені лише менше, ніж 4 групами R^V (наприклад, U-2 - U-5, U-7 - U-48 та U-52 - U-61).

Сполуки за даним винаходом можуть існувати у вигляді одного або більше стереоізомерів. Різні

стереоізомери включають енантіомери, діастереомери, атропізомери та геометричні ізомери. Фахівець в даній галузі техніки прийме до уваги, що один стереоізомер може бути більш активним та/або може проявляти сприятливі ефекти, коли він збагачений відносно іншого стереоізомеру(ів), або коли він відокремлений від іншого стереоізомеру(ів). Додатково, кваліфікований фахівець знає, як відділити, збагатити та/або селективно одержати зазначені стереоізомери. Сполуки за винаходом можуть бути присутні у вигляді сумішей стереоізомерів, індивідуальних стереоізомерів, або у вигляді оптично активної форми.

Фахівець в даній галузі техніки прийме до уваги, що не всі гетероциклічні кільця, які містять азот, можуть утворювати N-оксиди, оскільки азоту для окиснення до оксиду необхідна вільна окрема пара; фахівець в даній галузі техніки визначить ті гетероциклічні кільця, які містять азот, що можуть утворювати N-оксиди. Фахівець в даній галузі техніки також визнає, що третинні аміни можуть утво-

рювати N-оксиди. Синтетичні способи одержання N-оксидів гетероциклів та третинних амінів добре відомі фахівцю в даній галузі техніки, включаючи окиснення гетероциклів та третинних амінів пероксикислотами, такими як пероксиоцтова та м-хлорпероксибензойна кислота (MCPBA), пероксидом водню, алкіл гідропероксидами, такими як трет-бутил гідропероксид, перборатом натрію та діоксиранами, такими як диметилдіоксиран. Ці способи одержання N-оксидів були докладно описані та переглянуті в літературі, див. наприклад: T. L. Gilchrist в *Comprehensive Organic Synthesis*, vol. 7, pp. 748-750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler та B. Stanovnik в *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, vol. 3, pp. 18-20, A. J. Boulton та A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M. R. Grimmett та B. R. T. Keene в *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 43, pp. 149-161, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler та B. Stanovnik в *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 9, pp. 285-291, A. R. Katritzky та A. J. Boulton, Eds., Academic Press; та G. W. H. Cheeseman та E. S. G. Werstiuk в *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 22, pp. 390-392, A. R. Katritzky та A. J. Boulton, Eds., Academic Press.

Солі сполук за даним винаходом включають кислотну-адитивні солі з неорганічними або органічними кислотами, такими як бромистоводнева кислота, соляна кислота, азотна кислота, фосфорна кислота, сірчана кислота, оцтова кислота, бутанова кислота, фумарова кислота, молочна кислота, малеїнова кислота, маленова кислота, щавлева кислота, пропіонова кислота, саліцилова кислота, винна кислота, 4-толуолсульфонова кислота або валеріанова кислота. Солі сполук за даним винаходом також включають солі, утворені з органічними основами (наприклад, з піридином, аміаком або триетиламіном) або неорганічними основами (наприклад, гідридами, гідроксидами або карбонатами натрію, калію, літію, кальцію, магнію або барію), коли сполука містить кислотну групу, як наприклад коли R^4 являє собою алкілкарбоніл та R^5 являє собою Н.

Відповідно, даний винахід включає сполуки, вибрані з Формули 1, їх N-оксиди та сільськогосподарськo прийнятні солі.

Втілення даного винаходу, який описаний в частині „Короткий опис суті винаходу“, включають:

Втілення 1. Сполука Формули 1, де R^1 являє собою C_1 - C_3 алкіл, необов'язково заміщений одним або більше замісниками, незалежно вибраними з R^6 .

Втілення 2. Сполука за Втіленням 1, де R^1 являє собою C_1 - C_3 алкіл, необов'язково заміщений галогеном.

Втілення 3. Сполука за Втіленням 2, де R^1 являє собою C_1 - C_3 алкіл, заміщений галогеном.

Втілення 4. Сполука за Втіленням 3, де R^1 являє собою C_1 - C_3 алкіл, заміщений F.

Втілення 5. Сполука за Втіленням 4, де R^1 являє собою C_1 - C_3 алкіл, повністю заміщений F.

Втілення 6. Сполука за Втіленням 5, де R^1 являє собою CF_3 .

Втілення 7. Сполука Формули 1, де кожний R^2 незалежно являє собою Н, галоген, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_1 - C_6 галогеналкокси або -CN.

Втілення 8. Сполука за Втіленням 7, де кожний R^2 незалежно являє собою Н, CF_3 , OCF_3 , галоген або -CN.

Втілення 9. Сполука за Втіленням 7, де кожний R^2 незалежно являє собою галоген або C_1 - C_3 галогеналкіл.

Втілення 10. Сполука Формули 1, де кожний R^3 незалежно являє собою Н, галоген, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл, C_3 - C_6 галогенциклоалкіл, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 галогеналкокси, -CN або $-NO_2$.

Втілення 11. Сполука за Втіленням 10, де кожний R^3 незалежно являє собою Н, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл, C_1 - C_4 алкокси або -CN.

Втілення 12. Сполука за Втіленням 11, де кожний R^3 незалежно являє собою Н, C_1 - C_4 алкіл або -CN.

Втілення 13. Сполука за Втіленням 12, де кожний R^3 являє собою Н.

Втілення 14. Сполука Формули 1, де R^4 являє собою Н, C_1 - C_6 алкіл, C_2 - C_7 алкілкарбоніл або C_2 - C_7 алкоксикарбоніл.

Втілення 15. Сполука за Втіленням 14, де R^4 являє собою Н.

Втілення 16. Сполука Формули 1, де R^5 являє собою Н, OR^{10} , $NR^{11}R^{12}$ або Q^1 ; або C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, C_3 - C_4 циклоалкіл, C_4 - C_7 алкілциклоалкіл або C_4 - C_7 циклоалкілалкіл, кожний необов'язково заміщений одним або більше замісниками, незалежно вибраними з R^7 .

Втілення 17. Сполука за Втіленням 16, де R^5 являє собою Н; або C_1 - C_4 алкіл, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, C_3 - C_4 циклоалкіл, C_4 - C_7 алкілциклоалкіл або C_4 - C_7 циклоалкілалкіл, кожний необов'язково заміщений одним або більше замісниками, незалежно вибраними з R^7 .

Втілення 18. Сполука за Втіленням 17, де R^5 являє собою Н; або C_1 - C_4 алкіл, необов'язково заміщений одним або більше замісниками, незалежно вибраними з R^7 .

Втілення 19. Сполука за Втіленням 18, де R^5 являє собою C_1 - C_4 алкіл, необов'язково заміщений одним або більше замісниками, незалежно вибраними з R^7 .

Втілення 20. Сполука за Втіленням 19, де R^5 являє собою CH_2CF_3 .

Втілення 21. Сполука за Втіленням 19, де R^5 являє собою CH_2 -2-піридиніл.

Втілення 22. Сполука за Втіленням 16, де R^5 являє собою OR^{10} , $NR^{11}R^{12}$ або Q^1 .

Втілення 23. Сполука за Втіленням 22, де R^5 являє собою $NR^{11}R^{12}$.

Втілення 24. Сполука за Втіленням 22, де R^5 являє собою Q^1 .

Втілення 25. Сполука Формули 1, де R^6 являє собою галоген.

Втілення 26. Сполука Формули 1, де кожний R^7 незалежно являє собою галоген, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 алкілтію, C_1 - C_4 алкілсульфініл, C_1 - C_4 алкілсульфоніл, C_2 - C_4 алкілкарбоніл, C_2 - C_4 алкоксикарбоніл, C_2 - C_5 алкіламінокарбоніл, C_2 - C_5 гало-

геналкїлкарбонїл, C₂-C₅ галогеналкоксикарбонїл, C₂-C₅ галогеналкіламінокарбонїл, -NH₂, -CN або -NO₂; або Q².

Втілення 27. Сполука за Втіленням 26, де кожний R⁷ незалежно являє собою галоген, C₂-C₄ алкоксикарбонїл, C₂-C₅ алкіламінокарбонїл, C₂-C₅ галогеналкоксикарбонїл, C₂-C₅ галогеналкіламінокарбонїл, -NH₂, -CN або -NO₂; або Q².

Втілення 28. Сполука за Втіленням 27, де кожний R⁷ незалежно являє собою галоген, C₂-C₅ алкіламінокарбонїл, C₂-C₅ галогеналкіламінокарбонїл або Q².

Втілення 29. Сполука за Втіленням 28, де кожний R⁷ незалежно являє собою галоген або Q².

Втілення 30. Сполука за Втіленням 29, де кожний R⁷ незалежно являє собою F, Cl або Br.

Втілення 31. Сполука за Втіленням 30, де кожний R⁷ являє собою F.

Втілення 32. Сполука за Втіленням 29, де кожний R⁷ являє собою Q².

Втілення 33. Сполука Формули 1, де кожний R⁸ незалежно являє собою галоген, C₁-C₄ алкіл, C₁-C₄ галогеналкіл або -CN.

Втілення 34. Сполука Формули 1, де кожний R⁹ являє собою галоген, C₁-C₄ алкіл, C₁-C₄ галогеналкіл, -CN, фенїл або піридинїл.

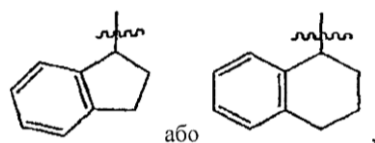
Втілення 35. Сполука Формули 1, де R¹⁰ являє собою H; або C₁-C₆ алкіл, необов'язково заміщений одним або більше галогенами.

Втілення 36. Сполука Формули 1, де R¹¹ являє собою H, C₁-C₆ алкіл, C₂-C₇ алкілкарбонїл або C₂-C₇ алкоксикарбонїл.

Втілення 37. Сполука за Втіленням 34, де R¹¹ являє собою H.

Втілення 38. Сполука Формули 1, де R¹² являє собою H або Q³; або C₁-C₄ алкіл, необов'язково заміщений одним або більше замісниками, незалежно вибраними з R⁷.

Втілення 39. Сполука Формули 1, де Q¹ являє собою фенїл, піридинїл, тіазолїл,



кожний необов'язково заміщений одним або більше замісниками, незалежно вибраними з R⁸.

Втілення 40. Сполука Формули 1, де кожний Q² незалежно являє собою фенїл, піридинїл або тіазолїл, кожний необов'язково заміщений одним або більше замісниками, незалежно вибраними з R⁹.

Втілення 41. Сполука за Втіленням 34, де кожний Q² незалежно являє собою фенїл, піридинїл або тіазолїл.

Втілення 42. Сполука Формули 1, де Q³ являє собою фенїл, піридинїл або тіазолїл, кожний необов'язково заміщений одним або більше замісниками, незалежно вибраними з R⁹.

Втілення 43. Сполука Формули 1, де A¹, A², A³, A⁴, A⁵ та A⁶ кожний являє собою CR³.

Втілення 44. Сполука Формули 1, де A¹ являє собою N; та A², A³, A⁴, A⁵ та A⁶ кожний являє собою CR³.

Втілення 45. Сполука Формули 1, де A² являє собою N; та A¹, A³, A⁴, A⁵ та A⁶ кожний являє собою CR³.

Втілення 46. Сполука Формули 1, де A⁴ являє собою N; та A¹, A², A³, A⁵ та A⁶ кожний являє собою CR³.

Втілення 47. Сполука Формули 1, де A⁶ являє собою N; та A¹, A², A³, A⁴ та A⁵ кожний являє собою CR³.

Втілення 48. Сполука Формули 1, де B¹, B² та B³ незалежно являють собою CR².

Втілення 49. Сполука за Втіленням 48, де B² являє собою CH.

Втілення 50. Сполука Формули 1, де B¹ являє собою N; та B² і B³ незалежно являють собою CR².

Втілення 51. Сполука Формули 1, де B² являє собою N; та B¹ та B³ незалежно являють собою CR².

Втілення 52. Сполука Формули 1, де B² являє собою CR²; та B¹ і B³ являють собою N.

Втілення 53. Сполука Формули 1, де W являє собою O.

Втілення 54. Сполука Формули 1, де p означає 0.

Втілення даного винаходу, включаючи Втілення 1-54, наведені вище, а також будь-які інші втілення, описані в даній заявці, можуть бути скомбіновані будь-яким чином, та визначення перемінних у втіленнях відносяться не тільки до сполук Формули 1, а також до вихідних сполук та проміжних сполук. Крім того, втілення даного винаходу, включаючи Втілення 1-54, описані вище, а також будь-які інші втілення, описані в даній заявці, та будь-яка їх комбінація, відносяться до композицій та способів за даним винаходом.

Комбінації Втілень 1-54 можуть бути проілюстровані за допомогою:

Втілення А. Сполука Формули 1, де

R¹ являє собою C₁-C₃ алкіл, необов'язково заміщений одним або більше замісниками, незалежно вибраними з R⁶;

кожний R² незалежно являє собою H, галоген, C₁-C₆ галогеналкіл, C₁-C₆ галогеналкокси або -CN; та

кожний R³ незалежно являє собою H, галоген, C₁-C₆ алкіл, C₁-C₆ галогеналкіл, C₃-C₆ циклоалкіл, C₃-C₆ галогенциклоалкіл, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ галогеналкокси, -CN або -NO₂.

Втілення В. Сполука за Втіленням А, де

B¹, B² та B³ незалежно являють собою CR²;

W являє собою O;

R⁴ являє собою H, C₁-C₆ алкіл, C₂-C₇ алкілкарбонїл або C₂-C₇ алкоксикарбонїл; та

R⁵ являє собою H, NR¹¹R¹² або Q¹; або C₁-C₄ алкіл, C₂-C₄ алкенїл, C₂-C₄ алкінїл, C₃-C₄ циклоалкіл, C₄-C₇ алкілциклоалкіл або C₄-C₇ циклоалкілалкіл, кожний необов'язково заміщений одним або більше замісниками, незалежно вибраними з R⁷.

Втілення С. Сполука за Втіленням В, де

R¹ являє собою C₁-C₃ алкіл, необов'язково заміщений галогеном;

кожний R² незалежно являє собою H, CF₃, OCF₃, галоген або -CN;

кожний R^3 незалежно являє собою H, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 галогеналкіл, C_3 - C_6 циклопропіл, C_1 - C_4 алкокси або -CN; та

кожний R^7 незалежно являє собою галоген, C_1 - C_4 алкіл, C_1 - C_4 алкокси, C_1 - C_4 алкілтіо, C_1 - C_4 алкілсульфініл, C_1 - C_4 алкілсульфоніл, C_2 - C_4 алкілкарбоніл, C_2 - C_4 алкоксикарбоніл, C_2 - C_5 алкіламінокарбоніл, C_2 - C_5 галогеналкілкарбоніл, C_2 - C_5 галогеналкоксикарбоніл, C_2 - C_5 галогеналкіламінокарбоніл, -NH₂, -CN або -NO₂; або Q².

Втілення D. Сполука за Втіленням C, де

R^4 являє собою H;

R^5 являє собою C_1 - C_4 алкіл, необов'язково заміщений одним або більше замісниками, незалежно вибраними з R^7 ;

кожний R^7 незалежно являє собою галоген або Q²; та

кожний Q² незалежно являє собою феніл, піридиніл або тіазоліл.

Втілення E. Сполука за Втіленням D, де

R^1 являє собою CF₃;

A¹, A², A³, A⁴, A⁵ та A⁶ кожний являє собою CR³;

B² являє собою CR²; та

кожний R^3 незалежно являє собою H, C_2 - C_4 алкіл або -CN.

Втілення F. Сполука за Втіленням E, де

B² являє собою CH;

кожний R^2 незалежно являє собою галоген або C_1 - C_3 галогеналкіл;

R^3 являє собою H;

R^5 являє собою CH₂CF₃ або CH₂-2-піридиніл; та

n означає 0.

Конкретні втілення включають сполуки Формули 1, вибрані з групи, що включає:

4-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-N-(2,2,2-трифторетил)-1-нафталінкарбоксамід,

4-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-N-піридинілметил)-1-нафталінкарбоксамід,

4-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-N-(2-піридинілметил)-1-нафталінкарботіоамід,

4-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-N-етил-1-нафталінкарбоксамід,

4-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-N-(2-метоксietил)-1-нафталінкарбоксамід,

4-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-N-[2-(2,2,2-трифторетил)-2-оксоетил]-1-нафталінкарбоксамід,

5-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-N-(2-піридинілметил)-8-хінолінкарбоксамід,

5-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-N-(2-піридинілметил)-8-ізохінолінкарбоксамід, та

1-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-N-(2-піридинілметил)-4-ізохінолінкарбоксамід.

Прикладами є конкретні втілення, що включають сполуки Формули 1, вибрані з групи, що включає:

4-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-N-(2,2,2-трифторетил)-1-нафталінкарбоксамід,

4-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-N-(2-піридинілметил)-1-нафталінкарбоксамід,

4-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-N-(2-піридинілметил)-1-нафталінкарботіоамід,

5-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-N-(2-піридинілметил)-8-хінолінкарбоксамід,

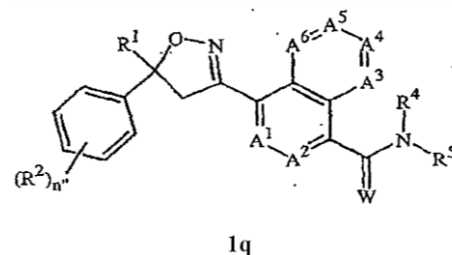
5-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-N-(2-піридинілметил)-8-ізохінолінкарбоксамід, та

1-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-N-(2-піридинілметил)-4-ізохінолінкарбоксамід.

Додаткові конкретні втілення включають будь-яку комбінацію сполук Формули 1, вибраних з групи, наведеної вище.

Втілення даного винаходу додатково включають:

Втілення AA. Сполука Формули 1q, її N-оксид або сіль



де

A¹, A², A³, A⁴, A⁵ та A⁶ незалежно вибрані з групи, що включає CR³ та N, за умови, що не більше, ніж 3 з A¹, A², A³, A⁴, A⁵ та A⁶ являють собою N;

W являє собою O або S;

R¹ являє собою C_1 - C_6 алкіл, C_2 - C_6 алкеніл, C_2 - C_6 алкініл, C_3 - C_6 циклоалкіл, C_4 - C_7 алкілциклоалкіл або C_4 - C_7 циклоалкілалкіл, кожний необов'язково заміщений одним або більше замісниками, незалежно вибраними з R⁶;

кожний R² незалежно являє собою H, галоген, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 галогеналкокси, C_1 - C_6 алкілтіо, C_1 - C_6 галогеналкілсульфініл, C_1 - C_6 алкілсульфоніл, C_1 - C_6 галогеналкілсульфоніл, C_1 - C_6 алкіламіно, C_2 - C_6 діалкіламіно, C_2 - C_4 алкоксикарбоніл, -CN або -NO₂;

кожний R³ незалежно являє собою H, галоген, C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 галогеналкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл, C_3 - C_6 галогенциклоалкіл, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 галогеналкокси, C_1 - C_6 алкілтіо, C_1 - C_6 галогеналкілсульфініл, C_1 - C_6 алкілсульфоніл, C_1 - C_6 галогеналкілсульфоніл, C_1 - C_6 алкіламіно, C_2 - C_6 діалкіламіно, -CN або -NO₂;

R^4 являє собою H , C_1-C_6 алкіл, C_2-C_6 алкеніл, C_2-C_6 алкініл, C_3-C_6 циклоалкіл, C_4-C_7 алкілциклоалкіл, C_4-C_7 циклоалкілалкіл, C_2-C_7 алкілкарбоніл або C_2-C_7 алкоксикарбоніл;

R^5 являє собою H , OR^{10} , $NR^{11}R^{12}$ або Q^1 ; або C_1-C_6 алкіл, C_2-C_6 алкеніл, C_2-C_6 алкініл, C_3-C_6 циклоалкіл, C_4-C_7 алкілциклоалкіл або C_4-C_7 циклоалкілалкіл, кожний необов'язково заміщений одним або більше замісниками, незалежно вибраними з R^7 ; або

R^4 та R^5 , взяті разом з азотом, до якого приєднані, утворюють кільце, що містить 2-6 атомів вуглецю та необов'язково один додатковий атом, вибраний з групи, що включає N , S та O , зазначене кільце необов'язково заміщене 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає C_1-C_2 алкіл, галоген, $-CN$, $-NO_2$ та C_1-C_2 алкокси;

кожний R^6 незалежно являє собою галоген, C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 алкокси, C_1-C_6 алкілтіо, C_1-C_6 алкілсульфініл, C_1-C_6 алкілсульфоніл, $-CN$ або $-NO_2$;

кожний R^7 незалежно являє собою галоген, C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 алкокси, C_1-C_6 алкілтіо, C_1-C_6 алкілсульфініл, C_1-C_6 алкілсульфоніл, C_1-C_6 алкіламіно, C_2-C_8 діалкіламіно, C_3-C_6 циклоалкіламіно, C_2-C_7 алкілкарбоніл, C_2-C_7 алкоксикарбоніл, C_2-C_7 алкіламінокарбоніл, C_3-C_9 діалкіламінокарбоніл, C_2-C_7 галогеналкілкарбоніл, C_2-C_7 галогеналкоксикарбоніл, C_2-C_7 галогеналкіламінокарбоніл, C_3-C_9 галогендіалкіламінокарбоніл, гідрокси, $-NH_2$, $-CN$ або $-NO_2$; або Q^2 ;

кожний R^8 незалежно являє собою галоген, C_1-C_6 алкокси, C_1-C_6 галогеналкокси, C_1-C_6 алкілтіо, C_1-C_6 галогеналкілтіо, C_1-C_6 алкілсульфініл, C_1-C_6 галогеналкілсульфініл, C_1-C_6 алкілсульфоніл, C_1-C_6 галогеналкілсульфоніл, C_1-C_6 алкіламіно, C_2-C_6 діалкіламіно, C_2-C_4 алкоксикарбоніл, $-CN$ або $-NO_2$;

кожний R^9 незалежно являє собою галоген, C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 галогеналкіл, C_3-C_6 циклоалкіл, C_3-C_6 галогенциклоалкіл, C_1-C_6 алкокси, C_1-C_6 галогеналкокси, C_1-C_6 алкілтіо, C_1-C_6 галогеналкілтіо, C_1-C_6 алкілсульфініл, C_1-C_6 галогеналкілсульфініл, C_1-C_6 алкілсульфоніл, C_1-C_6 галогеналкілсульфоніл, C_1-C_6 алкіламіно, C_2-C_6 діалкіламіно, $-CN$, $-NO_2$, феніл або піридиніл;

R^{10} являє собою H ; або C_1-C_6 алкіл, C_2-C_6 алкеніл, C_2-C_6 алкініл, C_1-C_6 циклоалкіл, C_4-C_7 алкілциклоалкіл або C_4-C_7 циклоалкілалкіл, кожний необов'язково заміщений одним або більше замісниками;

R^{11} являє собою H , C_1-C_6 алкіл, C_2-C_6 алкеніл, C_2-C_6 алкініл, C_3-C_6 циклоалкіл, C_4-C_7 алкілциклоалкіл, C_4-C_7 циклоалкілалкіл, C_2-C_7 алкілкарбоніл або C_2-C_7 алкоксикарбоніл;

R^{12} являє собою H ; Q^3 ; або C_1-C_6 алкіл, C_2-C_6 алкеніл, C_2-C_6 алкініл, C_3-C_6 циклоалкіл, C_4-C_7 алкілциклоалкіл або C_4-C_7 циклоалкілалкіл, кожний необов'язково заміщений одним або більше замісниками, незалежно вибраними з R^7 ; або

R^{11} та R^{12} , взяті разом з азотом, до якого приєднані, утворюють кільце, що містить 2-6 атомів вуглецю та необов'язково один додатковий атом, вибраний з групи, що включає N , S та O , зазначене кільце необов'язково заміщене 1-4 замісниками, незалежно вибраними з групи, що включає C_1-C_2 алкіл, галоген, $-CN$, $-NO_2$ та C_1-C_2 алкокси;

Q^1 являє собою фенільне кільце, 5- або 6-членне гетероциклічне кільце чи 8-, 9- або 10-членну конденсовану біциклічну кільцеву систему, що необов'язково містить від одного до трьох гетероатомів, вибраних з 0-1 O , 0-1 S та 0-3 N , кожне кільце або кільцева система необов'язково заміщені одним або більше замісниками, незалежно вибраними з R^8 ;

кожний Q^2 незалежно являє собою фенільне кільце чи 5- або 6-членне гетероциклічне кільце, кожне кільце необов'язково заміщене одним або більше замісниками, незалежно вибраними з R^9 ;

Q^3 являє собою фенільне кільце чи 5- або 6-членне гетероциклічне кільце, кожне кільце необов'язково заміщене одним або більше замісниками, незалежно вибраними з R^9 ; та

n означає 1, 2, 3, 4 або 5.

На увагу заслуговує те, що сполуки за даним винаходом характеризуються сприятливими метаболічними властивостями та/або ґрунтовими залишковими властивостями та проявляють активність щодо контролю спектру сільськогосподарських та несільськогосподарських безхребетних шкідників.

Зокрема, зважаючи на спектр контролю безхребетних шкідників та економічну значимість, захист сільськогосподарських культур від ушкодження або пошкодження, викликаних безхребетними шкідниками, шляхом боротьби з безхребетними шкідниками, є втіленнями винаходу. Сполуки за даним винаходом завдяки своїм сприятливим властивостям пересування речовини або систематичному застосуванню в рослинах захищають листя та інші частини рослини, що непрямо контактують зі сполукою Формули 1 або композиціями, які містять сполуку.

Також на увагу, як втілення даного винаходу, заслуговують композиції, що містять сполуку за будь-яким з попередніх Втілень, а також будь-якими іншими втіленнями, описаними в даній заявці, та будь-якими їх комбінаціями, та, принаймні, один додатковий компонент, вибраний з групи, що включає поверхнево-активну речовину, твердий розріджувач та рідкий розріджувач, зазначені композиції необов'язково додатково містять, принаймні, одну додаткову біологічно активну сполуку або агент.

Додатково на увагу, як втілення даного винаходу, заслуговують композиції для боротьби з безхребетними шкідниками, які містять біологічно ефективну кількість сполуки за будь-яким з попередніх Втілень, а також будь-якими іншими втіленнями, описаними в даній заявці, та будь-якими їх комбінаціями, та, принаймні, один додатковий компонент, вибраний з групи, що включає поверхнево-активну речовину, твердий розріджувач та рідкий розріджувач, зазначені композиції необов'язково додатково містять біологічно ефективну кількість, принаймні, однієї додаткової біологічно активної сполуки або агенту. Втілення винаходу, крім того, включають способи боротьби з безхребетними шкідниками, які включають контактування безхребетного шкідника або його оточення з біологічно ефективною кількістю сполуки за будь-

яким з попередніх Втілень (наприклад, у вигляді композиції, описаної в даній заявці).

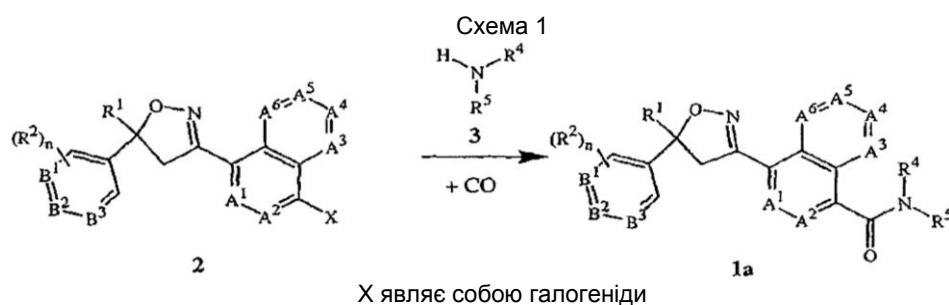
Втілення винаходу також включають композицію, що містить сполуку за будь-яким з попередніх Втілень, у формі рідкої препаративної форми для змочування ґрунту. Втілення винаходу, крім того, включають способи боротьби з безхребетними шкідниками, які включають контактування ґрунту з рідкою композицією, як наприклад рідкою композицією для змочування ґрунту, яка містить біологічно ефективну кількість сполуки за будь-яким з попередніх Втілень.

Втілення винаходу також включають композицію у формі спрею для боротьби з безхребетними шкідниками, що містить біологічно ефективну кількість сполуки за будь-яким з попередніх Втілень, та пропелент. Втілення винаходу, крім того, включають композицію у формі приманки для боротьби з безхребетними шкідниками, яка містить біологічно ефективну кількість сполуки за будь-яким з попередніх Втілень, одну або більше харчову речовину, необов'язково атрактант, та необов'язково зволожувач. Втілення винаходу також включають пристрій для боротьби з безхребетними шкідниками, який включає зазначену композицію у формі приманки та корпус, пристосований для розміщен-

ня зазначеної композиції у формі приманки, де корпус має, принаймні, один отвір, розмір якого дозволяє безхребетному шкіднику пройти через отвір, так що безхребетний шкідник може скористатися доступом до зазначеної композиції у формі приманки із місця знаходження поза корпусом, та де корпус додатково пристосований для розміщення в або поблизу місцезнаходження можливої або відомої активності безхребетних шкідників.

Для одержання сполук Формули 1 можуть бути використані один або більше наступних способів та варіацій, які описані на Схемах 1-12. Визначення R^1 , R^2 , R^4 , R^5 , A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 , A^6 , B^1 , B^2 , B^3 , n та W в сполуках Формул 1-15 нижче є такими, як визначено вище в частині „Короткий опис суті винаходу”, якщо не вказано вище. Сполуки Формул 1a та 1b є підгрупою сполук Формули 1, сполуки Формул 12a-12c є підгрупою сполук Формули 12 та сполука Формули 15a є сполукою Формули 15.

Сполуки Формули 1a (Формула 1, де W являє собою O) можуть бути одержані за допомогою амінокарбонілування арил бромідів або йодидів Формули 2, де X являє собою Br або I , з відповідно заміщеними аміно сполуками Формули 3, як наведено на Схемі 1.

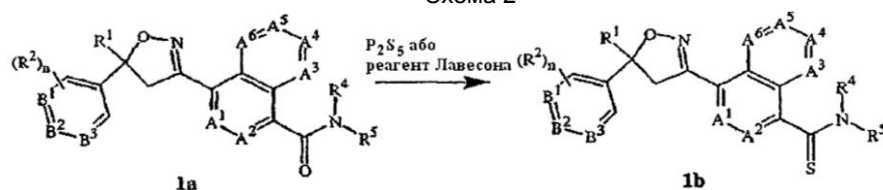


Цю реакцію звичайно здійснюють з арил бромідом Формули 2, де X являє собою Br , в присутності каталізатора на основі паладію в атмосфері CO . Каталізатори на основі паладію, які використовуються в даному способі, звичайно містяться в формальному стані окиснення або 0 (тобто $Pd(0)$), або 2 (тобто $Pd(II)$). Як каталізатори для даного способу корисна широка різноманітність таких сполук та комплексів. Приклади сполук та комплексів, що містять паладій, корисних як каталізатори в способі, наведеному на Схемі 1, включають $PdCl_2(PPh_3)_2$ (дихлорид біс(трифенілфосфін)паладію (II)), $Pd(PPh_3)_4$ (тетракіс(трифенілфосфін)паладію (0)), $Pd(C_5H_7O_2)_2$ (паладію (II) ацетил-ацетонат), $Pd_2(dba)_3$ (трис(добензиліденацетон) дипаладію (0)) та [1,1'-біс(дифеніл-фосфіно)фероцен]дихлорпаладію (II). Спосіб Схеми 1 загалом проводять в рідкій фазі, та, таким чином, найбільш ефективним буде каталізатор на основі паладію, що має добру розчинність в рідкій фазі. Корисні розчинники включають, наприклад, ефіри, такі як 1,2-диметоксигетан, аміді, як наприклад N,N -диметилацетамід, та негалогеновані ароматичні вуглеводні, як наприклад толуол.

Спосіб Схеми 1 може бути проведений в широкому діапазоні температур від приблизно 25 до приблизно $150^\circ C$. Прикладом є температури від приблизно 60 до приблизно $110^\circ C$, при яких звичайно забезпечуються високі швидкості реакцій та високі виходи продукту. Загальні способи та методики для амінокарбонілування з арил бромідом та аміном добре відомі в літературі; див., наприклад, H. Honno et al., *Synthesis* 1989, 715; та J. J. Li, G. W. Gribble, editors, *Palladium in Heterocyclic Chemistry: A Guide for the Synthetic Chemist*, 2000. Спосіб Схеми 1 проілюстрований на Стадії С Прикладу 2 та Стадії Е Прикладу 4.

Як наведено на Схемі 2, сполуки Формули 1b (Формула 1, де W являє собою S) можуть бути одержані за допомогою обробки відповідних амідних сполук Формули 1a реагентом, що переносить тіо, таким як P_2S_5 (див. наприклад, E. Klingsberg et al., *J. Am. Chem. Soc.* 1951, 72, 4988; E. C Taylor Jr. et al., *J. Am. Chem. Soc.* 1953, 75, 1904; R. Crossley et al., *J. Chem. Soc. Perkin Trans.* 1 1976, 977) або реагент Лавесона (2,5-біс(4-метоксифеніл)-1,3-дитіа-2,4-дифосфетан-2,4-дисульфід; див., наприклад, S. Prabhakar et al. *Synthesis*, 1984, 829).

Схема 2

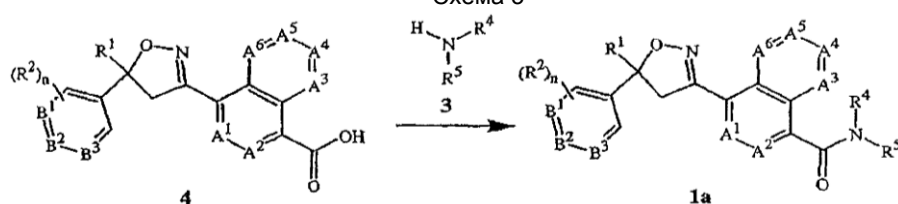


Спосіб Схеми 2 може бути проведений в широкому діапазоні температур, включаючи від приблизно 50 до приблизно 150°C. Прикладом є температури від приблизно 70 до приблизно 120°C, при яких звичайно забезпечуються високі швидко-

сті реакції та високі виходи продукту. Спосіб Схеми 2 проілюстрований в Прикладі 3.

Сполуки Формули 1a також можуть бути одержані за допомогою сполучення карбонових кислот Формули 4 з відповідно заміщеними аміно сполуками Формули 3, як наведено на Схемі 3.

Схема 3

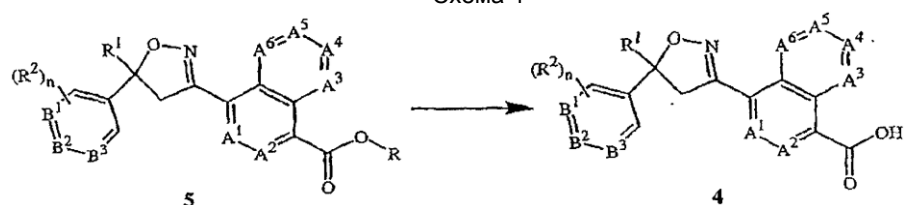


Дану реакцію загалом здійснюють в присутності дегідратуючого реагенту сполучення, такого як дициклогексил карбодіімід, 1-(3-диметиламінопропіл)-3-етилкарбодіімід, циклічний ангідрид 1-пропанфосфонові кислоти або карбоніл діімідазол, в присутності основи, такої як триетиламін, піридин, 4-(диметиламіно)піридин або

N,N-діізопропілетиламін, в безводному апротонному розчиннику, такому як дихлорметан або тетрагідрофуран, при температурі звичайно від кімнатної температури до 70°C. Спосіб Схеми 3 проілюстрований на Стадії Е Прикладу 1.

Сполуки Формули 4 можуть бути одержані за допомогою гідролізу ефіру Формули 5, де R являє собою метил або етил, як наведено на Схемі 4.

Схема 4

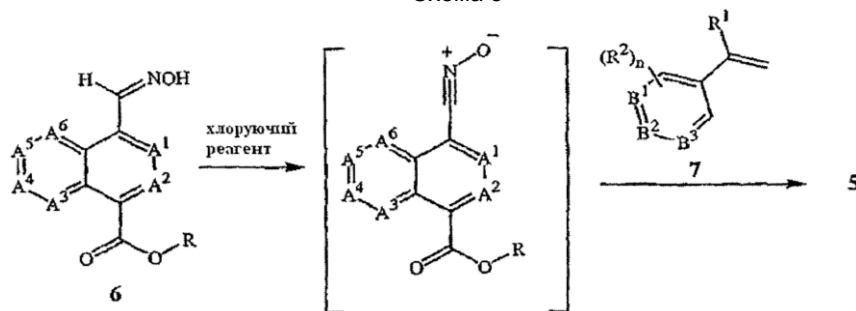


В цьому способі, ефірну сполуку Формули 5 перетворюють на відповідну карбонову кислоту Формули 4 за допомогою загальних методик, добре відомих з рівня техніки. Наприклад, обробкою метилового або етилового ефіру Формули 5 водним гідроксидом літію в тетрагідрофурані, з наступним підкисленням одержують відповідну карбо-

нову кислоту Формули 4. Спосіб Схеми 4 проілюстрований на Стадії D Прикладу 1.

Сполуки Формули 5 можуть бути одержані за допомогою 1,3-дипольного циклоприєднання стиrolів Формули 7 з вітрильними оксидами, отриманими з оксимів Формули 6, як наведено на Схемі 5.

Схема 5

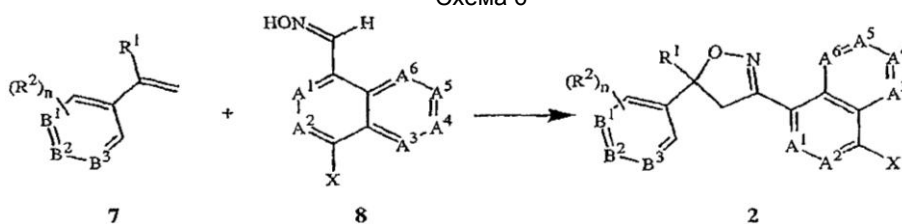


Дана реакція звичайно відбувається через проміжне утворення гідроксаміл хлориду, отриманого *in situ*, який дегідрохлорують до нітрильного оксиду, який потім піддають 1,3-диполярному циклоприєднанню з стирилом 7 з одержанням сполук Формули 5. В типовій методиці хлоруючий реагент, такий як гіпохлорит натрію, N-хлорсукцинімід або хлорамін-Т, об'єднують з оксимом в присутності стирилу. Залежно від умов, для полегшення проходження реакції дегідрохлорування може бути необхідним додавання аміної основи, такої як піридин або триетиламін. Реакція може бути проведена в різноманітних розчинниках, включаючи тетрагідрофур, діетиловий ефір, метилен хлорид, діоксан та толуол, при температурах в діапа-

зоні від кімнатної температури до температури кипіння розчинника зі зворотним холодильником. Загальні методики циклоприєднання нітрильних оксидів з олефінами добре описані в хімічній літературі; наприклад, див. Lee, *Synthesis*, 1982, 6, 508-509; Kanemasa et al., *Tetrahedron*, 2000, 56, 1057-1064, EP 1,538,138-A1, а також посилання, наведені в цих статтях. Спосіб Схеми 4 проілюстрований на Стадії С Прикладу 1.

Сполуки Формули 2 також можуть бути одержані за допомогою 1,3-диполярного циклоприєднання стирилів Формули 7 з нітрильними оксидами, отриманими з оксимів Формули 8, як наведено на Схемі 6.

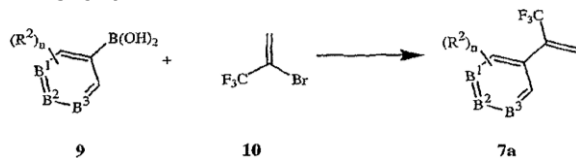
Схема 6



В способі Схеми 6, сполуки Формули 2, де X являє собою атом галогену, одержують за допомогою реакції сполуки Формули 8 з хлоруючим реагентом, з наступним додаванням сполуки Формули 7. Спосіб Схеми 6 проводять аналогічно способу, вже описаному на Схемі 5. Спосіб Схеми 6 проілюстрований на Стадії В Прикладу 2, Стадії D Прикладу 4 та Стадії С Прикладу 5.

Особливо корисна група стирилів для синтезу сполук Формули 1 представлена Формулою 7а, як наведено на Схемі 7. Ці проміжні сполуки можуть бути одержані за допомогою сполучення, каталізованого паладієм, арил боронових кислот Формули 9 з комерційно доступним 2-бром-3,3,3-трифторпропеном (Формула 10). Загальні методики для цієї реакції описані в хімічній літературі; див. Pan et al., *J. Fluorine Chemistry*, 1999, 95, 167-170. Спосіб Схеми 7 проілюстрований на Стадії В Прикладу 1.

Схема 7

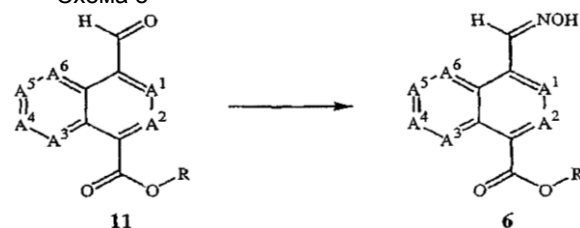


Оксими Формули 6 можуть бути одержані за допомогою реакції альдегідів 11 з гідроксиламіном, як наведено на Схемі 8. Наприклад, див., Н. К. Jung et al. *Bioorg. Med. Chem.* 2004, 12, 3965.

Альдегіди Формули 11 можуть бути одержані за допомогою різноманітних способів, відомих з рівня техніки; деякі з альдегідів є відомими сполуками або є комерційно доступними. Наприклад, одержання сполук Формули 11, де A¹, A², A³, A⁴, A⁵ та A⁶ являють собою CH та R⁹ являє собою Me, описане в P. Madenson et al. *J. Med. Chem.* 2002,

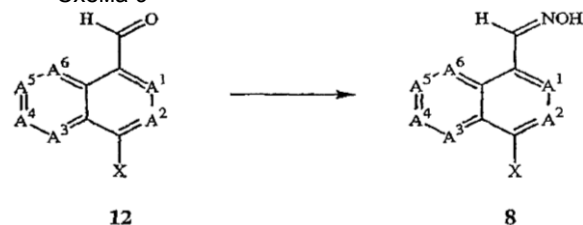
45, 5755. Спосіб Схеми 8 проілюстрований на Стадії А Прикладу 1.

Схема 8



Як наведено на Схемі 9, оксими Формули 8, де X являє собою атом галогену, можуть бути одержані з відповідних альдегідів Формули 12, аналогічно способу Схеми 8. Спосіб Схеми 9 проілюстрований на Стадії А Прикладу 2, Стадії С Прикладу 4 та Стадії В Прикладу 5.

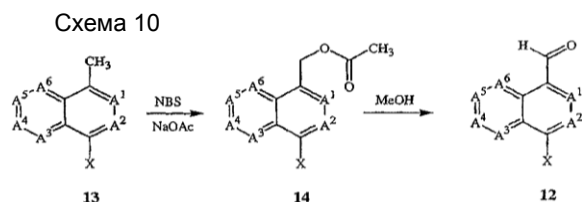
Схема 9



Сполуки Формули 12 є комерційно доступними або є відомими сполуками, або вони можуть бути одержані за допомогою різноманітних способів, відомих з рівня техніки. Наприклад, сполука Формули 12 може бути одержана за допомогою безпосереднього формулювання відповідних арил галогенідів, див. G. E. Boswell et al. *J. Org. Chem.* 1995, 65, 6592; або за допомогою відновлення відповід-

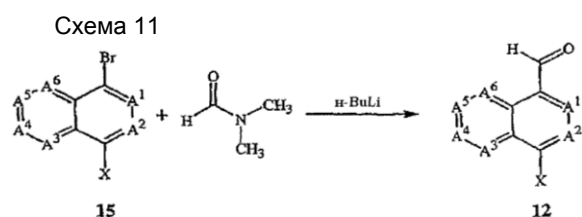
них арильних ефірів, див. P. R. Bernstein et al. *Bioorg. Med. Chem. Lett.* 2001, 2769 та L. W. Deady et al. *Aust. J. Chem.* 1989, 42, 1029.

Для конкретного прикладу, який наведений на Схемі 10, альдегіди Формули 12 можуть бути одержані з відповідних метил-заміщених сполук Формули 13 (де X являє собою галоген) за допомогою реакції з N-бромсукцинімідом (NBS) в присутності 2,2'-азобіс(2-метилпропіонітрилу) (AIBN) та ацетату натрію з одержанням ацетатів Формули 14, які потім перетворюють на альдегіди Формули 12 за допомогою естерифікації та окиснення. Спосіб Схеми 10 проілюстрований в Прикладі 4, Стадії А та В.

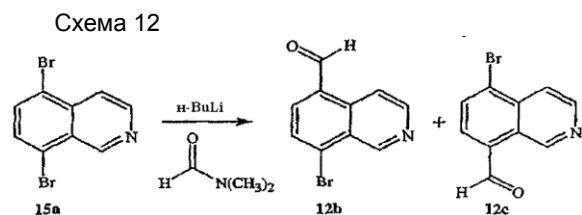


Сполуки Формули 13 є комерційно доступними або відомими сполуками, або вони можуть бути одержані за допомогою різноманітних способів, відомих з рівня техніки. Наприклад, сполука Формули 13, де A^3 являє собою N, A^1 , A^2 , A^4 , A^5 та A^6 являють собою CH, може бути одержана, як описано в *Molecules*, 2004, 9, 178.

Альтернативний спосіб одержання альдегідів Формули 12 (де X являє собою атом галогену) наведений на Схемі 11. Формільна група Формули 12 може бути введена в 10-членну ароматичну кільцеву систему за допомогою заміщення бром-замісника на сполуці Формули 15. Для посилання щодо цього загального способу, див. *Synthesis*, 2006, 293 та *Bioorg. Med. Chem.* 2004, 12, 715. Спосіб Схеми 11 проілюстрований на Стадії А Прикладу 5.



Як наведено на Схемі 12, альдегіди Формули 12b та 12c можуть бути одержані з 5,8-дибромізохіноліну (Формула 15a) за допомогою обробки сполуки Формули 15a n-BuLi при -78°C та гасіння N,N-диметилформамідом.



Сполука Формули 15a може бути одержана за допомогою способу, описаного в *Synthesis*, 2002, 83; див., наприклад, або за допомогою способу, описаному в G. E. Boswell et al. *J. Org. Chem.* 1995, 65, 6592. Альтернативно, арил альдегіди Формули 12 можуть бути одержані за допомогою інших різноманітних способів, відомих з рівня техніки, наприклад, за допомогою відновлення відповідних арилових ефірів, див. посилання P. R. Bernstein et al. *Bioorg. Med. Chem. Lett.* 2001, 2769 та L. W. Deady et al. *Aust. J. Chem.* 1989, 42, 1029.

Визнають, що деякі реагенти та реакційні умови, описали вище для одержання сполук Формули 1, не можуть бути сумісні з певними функціональностями, присутніми в проміжних сполуках. В цих випадках, введення циклів захист/зняття захисту або взаємоперетворень функціональних груп в синтез допоможе в отриманні бажаних продуктів. Використання та вибір захисних груп буде очевидним фахівцю в хімічному синтезі (див., наприклад, Greene, T. W.; Wuts, P. G. M., *Protective Groups in Organic Synthesis*, 2nd ed.; Wiley: New York, 1991). Фахівець в даній галузі техніки визнає, що, в деяких випадках, після введення наданого реагенту, як це зображено на будь-якій конкретній схемі, може бути необхідним проведення додаткових стандартних стадій синтезу, що не описані детально, для завершення синтезу сполук Формули 1. Фахівець в даній галузі техніки також визнає, що може бути необхідним проведення комбінації стадій, проілюстрованих на зазначених вище схемах, в іншому порядку, ніж наведений, за допомогою конкретної послідовності, представленої для одержання сполук Формули 1.

Фахівець в даній галузі техніки також визнає, що сполуки Формули 1 та проміжні сполуки, описані в даній заявці, можуть бути піддані різним електрофільним, нуклеофільним, радикальним, органометалічним, окисним та відновним реакціям для введення замісників або модифікації існуючих замісників.

Без додаткового уточнення, вважають, що фахівець в даній галузі техніки, використовуючи попередній опис, може застосовувати даний винахід до його найширших меж. Таким чином, наступні Приклади наведено лише для ілюстрації та вони ні в якому випадку не обмежують розкриття. Спектри ^1H ЯМР наведені в м.ч. нижче області тетраметилсилану; "s" означає синглет, "d" означає дублет, "t" означає триплет, "m" означає мультиплет, "dd" означає дублет дублетів та "br s" означає уширений синглет.

Приклад 1

Одержання 4-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-N-(2,2,2-трифторетил)-1-нафталінкарбоксаміду

Стадія А: Одержання метил 4-[(гідроксііміно)метил]-1-нафталінкарбоксилату

До перемішаного розчину метил 4-форміл-1-нафталінкарбоксилату (2,2 г, 10,3 ммоль) в метанолі (50 мл) додавали розчин гідроксиламіну (1,33 мл, 50% у воді). Після перемішування при кімнатній температурі протягом 2 год, реакційну суміш концентрували під зниженим тиском, одержуючи

зазначену у заголовку сполуку у вигляді блідо-жовтої твердої речовини (2,55 г).

^1H ЯМР (CDCl_3): 8,93 (d, 1H), 8,86 (s, 1H), 8,41 (d, 1H), 8,14 (d, 1H), 7,82 (d, 1H), 7,63 (m, 2H), 4,02 (s, 3H).

Стадія В: Одержання 1,3-дихлор-5-[1-(триметилфторметил)-етеніл]бензолу

До суміші тетрагідрофурану (33 мл), 1,2-диметоксіетану (33 мл) та 4 N водного гідроксиду калію (33 мл) в 200-мл герметичній колбі Фішера-Портера додавали 3,5-дихлорфенілборонову кислоту (8,72 г, 45,7 ммоль) та 2-бром-3,3,3-трифторпропен (10,0 г, 57,2 ммоль), потім додавали тетракіс(трифенілфосфін)паладій (0) (264 мг, 0,229 ммоль). Потім суміш нагрівали до 75°C протягом 3 год. Реакційну суміш розділяли між діетиловим ефіром та водою. Водний екстракт промивали діетиловим ефіром (2x20 мл). Органічні екстракти об'єднували, сушили (MgSO_4) та концентрували під зниженим тиском. Залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі, використовуючи гексани/етил ацетат як елюент, одержуючи зазначену у заголовку сполуку у вигляді прозорого масла (4,421 г).

^1H ЯМР (CDCl_3): δ 7,41 (s, 2H), 7,33 (s, 1H), 6,04 (d, 1H), 5,82 (d, 1H).

Стадія С: Одержання метил 4-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-1-нафталінкарбоксаміду

До перемішаного розчину метил 4-[(гідроксііміно)метил]-1-нафталінкарбоксилату (тобто, продукту зі Стадії А) (1,0 г, 4,36 ммоль) в N,N-диметилформаміді (5,0 мл) додавали N-хлорсукцинімід (1,16 г, 8,72 ммоль). Цю суміш перемішували протягом 1,5 год при кімнатній температурі, та потім додавали розчин 1,3-дихлор-5-[1-(трифторметил)етеніл]бензолу (тобто, продукту зі Стадії В) (3,20 г, 13,1 ммоль) та триетиламіну (6,1 мл, 43,6 ммоль) в N,N-диметилформаміді (4,0 мл). Після перемішування протягом додаткових 2 год при кімнатній температурі, реакційну суміш розбавляли водою та екстрагували етил ацетатом. Органічний шар промивали сольовим розчином, сушили (Na_2SO_4) та концентрували під зниженим тиском. Залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі, використовуючи гексани/етил ацетат як елюент, одержуючи зазначену у заголовку сполуку у вигляді блідо-жовтого масла (700 мг, вихід 34%).

^1H ЯМР (CDCl_3): 8,88 (d, 1H), 8,80 (d, 1H), 8,10 (d, 1H), 7,68 (m, 2H), 7,55 (m, 3H), 7,46 (dd, 1H), 4,27 (d, 1H), 4,03 (s, 3H), 3,91 (d, 1H).

Стадія D: Одержання 4-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-1-нафталінкарбонової кислоти

До перемішаного розчину метил 4-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-1-нафталінкарбоксилату (тобто, продукту зі Стадії С) (650 мг, 1,39 ммоль) в тетрагідрофурані (10 мл) додавали розчин моногідрату гідроксиду літію (350 мг, 8,34 ммоль) у воді (10 мл), потім додавали метанол (10 мл). Одержану суміш перемішували протягом ночі при кімнатній температурі. Реакційну суміш розділяли між водою та діетиловим ефіром. Потім водний шар підкис-

ляли 6 N водною соляною кислотою до pH 2 та екстрагували етил ацетатом. Об'єднані органічні шари промивали сольовим розчином, сушили та концентрували, одержуючи зазначену у заголовку сполуку у вигляді білої твердої речовини (450 мг).

^1H ЯМР (CDCl_3): 9,08 (d, 1H), 8,80 (d, 1H), 8,31 (d, 1H), 7,71 (m, 2H), 7,57 (m, 3H), 7,46 (dd, 1H), 4,28 (d, 1H), 3,91 (d, 1H).

Стадія E: Одержання 4-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-N-(2,2,2-трифторетил)-1-нафталінкарбоксаміду

Суміш 4-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-1-нафталінкарбонової кислоти (тобто, продукту зі Стадії С) (190 мг, 0,42 ммоль), 4-(диметиламіно)піридину (77 мг, 0,63 ммоль), пропілфосфонового ангідриду (0,38 мл, 0,63 ммоль, 50% в етил ацетаті) та 2,2,2-трифторетиламіну (0,033 мл, 0,42 мл) в дихлорметані (5 мл) перемішували при кімнатній температурі протягом ночі. Реакційну суміш концентрували та залишок очищали за допомогою колоночної хроматографії на силікагелі, використовуючи гексани/етил ацетат як елюент, одержуючи зазначений у заголовку продукт, сполуку за даним винаходом, у вигляді білої твердої речовини (71 мг).

^1H ЯМР (CDCl_3): 8,78 (d, 1H), 8,18 (d, 1H), 7,63 (m, 2H), 7,56 (m, 2H), 7,52 (d, 1H), 7,46 (m, 1H), 7,44 (d, 1H), 6,41 (t, 1H), 4,23 (d, 1H), 4,20 (m, 2H), 3,87 (d, 1H).

Приклад 2

Одержання 4-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-N-(2-піридинілметил)-1-нафталінкарбоксаміду

Стадія А: Одержання 4-бром-1-нафталінкарбоксилат оксиму

До перемішаного розчину 4-бром-1-нафталінкарбоксальдегіду (3,7 г, 15,7 ммоль) в етанолі (30 мл) додавали водний розчин гідроксіламіну (1,25 мл, 50% у воді). Після перемішування при кімнатній температурі протягом 3 год, реакційну суміш концентрували під зниженим тиском, одержуючи зазначену у заголовку сполуку у вигляді блідо-жовтої твердої речовини (3,8 г).

^1H ЯМР ($\text{DMSO}-d_6$): 11,60 (s, 1H), 8,81 (s, 1H), 8,71 (d, 1H), 8,24 (d, 1H), 7,95 (d, 1H), 7,74 (m, 3H).

Стадія B: Одержання 3-(4-бром-1-нафталеніл)-5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)ізоксазолу

До перемішаного розчину 4-бром-1-нафталінкарбоксилат оксиму (тобто, продукту зі Стадії А) (2,33 г, 9,3 ммоль) в N,N-диметилформаміді (6,0 мл) додавали N-хлорсукцинімід (1,70 г, 12,7 ммоль). Реакційну суміш перемішували протягом 1 год при кімнатній температурі та потім додавали розчин 1,3-дихлор-5-[1-(трифторметил)етеніл]бензолу (тобто, продукту зі Стадії B Прикладу 1) (2,70 г, 11,2 ммоль) та триетиламіну (4,5 мл, 32,0 ммоль) в N,N-диметилформаміді (9,0 мл). Після перемішування протягом додаткових 2 год при кімнатній температурі, реакційну суміш розбавляли водою та екстрагували етил ацетатом. Органічний шар промивали сольовим розчином, сушили (Na_2SO_4) та концентрували під зниженим тиском. Залишок очищали за

допомогою колоночної хроматографії на силікагелі, використовуючи гексани/етил ацетат як елюент, одержуючи зазначену у заголовку сполуку у вигляді білої твердої речовини (2,9 г, вихід 64%).

¹H ЯМР (CDCl₃): 8,87 (m, 1H), 8,32 (m, 1H), 7,77 (d, 1H), 7,66 (m, 2H), 7,55 (s, 2H), 7,46 (dd, 1H), 7,32 (d, 1H), 4,24 (d, 1H), 3,88 (d, 3H).

Стадія С: Одержання 4-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-N-(2-піридинілметил)-1-нафталінкарбоксаміду

Суміш 3-(4-бром-1-нафталеніл)-5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)ізоксазолу (тобто, продукту зі Стадії В) (1,0 г, 2,04 ммоль), [1,1'-біс(дифенілфосфіно)фероцен]дихлорпаладію (II) (PdCl₂(dppf)) (0,22 г, 0,30 ммоль), 2-(амінометил)піридину (0,86 г, 7,96 ммоль) та триетиламіну (5,6 мл, 40 ммоль) в толуолі (15 мл) продували монооксидом вуглецю протягом 15 хвилин. Потім в реакційній посудині підтримували рівень монооксиду вуглецю, використовуючи балон. Реакційну суміш перемішували при 70°C в атмосфері монооксиду вуглецю протягом ночі. Суміш охолоджували до кімнатної температури, фільтрували через невелику прокладку з допоміжного діатомового фільтрувального матеріалу целіт® та промивали невеликою кількістю етил ацетату. Фільтрат концентрували та залишок очищали за допомогою колоночної хроматографії на силікагелі, використовуючи гексани/етил ацетат як елюент, одержуючи зазначений у заголовку продукт, сполуку за даним винаходом, у вигляді білої твердої речовини (0,72 г, вихід 65%).

¹H ЯМР (CDCl₃): 8,81 (d, 1H), 8,55 (d, 1H), 8,38 (d, 1H), 7,80-7,27 (m, 10H), 4,89 (d, 2H), 4,22 (d, 1H), 3,86 (d, 1H).

Приклад 3

Одержання 4-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-N-(2-піридинілметил)-1-нафталінкарбоксаміду

Суміш 4-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-N-(2-піридинілметил)-1-нафталінкарбоксаміду (тобто, продукту з Прикладу 2) (40 мг, 0,073 ммоль) та 2,5-біс(4-метоксифеніл)-1,3-дитіа-2,4-дифосфетан-2,4-дисульфід (реагент Лавесона) (18 мг, 0,044 ммоль) в толуолі (2 мл) нагрівали при кипінні зі зворотним холодильником протягом 2 год. Реакційну суміш охолоджували до кімнатної температури та безпосередньо очищали за допомогою колоночної хроматографії на силікагелі, використовуючи гексани/етил ацетат як елюент, одержуючи зазначений у заголовку продукт, сполуку за даним винаходом, у вигляді жовтої твердої речовини (29 мг, вихід 71%).

¹H ЯМР (CDCl₃): 9,41 (br s 1H), 8,91 (dd, 1H), 8,70 (dd, 1H), 8,46 (d, 1H), 8,21 (d, 1H), 7,75 (dt, 1H), 7,64 (d, 1H), 7,57 (s, 2H), 7,47 (dd, 1H), 7,43 (t, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,24 (dd, 1H), 5,14 (d, 2H), 4,68 (d, 1H), 4,39 (d, 1H).

Приклад 4

Одержання 5-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-N-(2-піридинілметил)-8-хінолінкарбоксаміду

Стадія А: Одержання (8-бром-5-хінолініл)метил ацетату

Суміш 8-бром-5-метилхіноліну (5,4 г, 24,3 ммоль), N-бромсукциніміду (5,2 г, 29,2 ммоль) та 2,2'-азобіс(2-метилпропіонітрилу) (AIBN) (0,40 г, 24,3 ммоль) в тетрагліцериді вуглецю (80 мл) нагрівали при кипінні зі зворотним холодильником протягом 3 год в атмосфері азоту. Реакційну суміш охолоджували до кімнатної температури та фільтрували, використовуючи гексан для промивання. Фільтрат концентрували під зниженим тиском. Залишок розчиняли в N,N-диметилформаміді (50 мл), та потім додавали ацетат натрію (4,0 г, 48,8 ммоль). Одержану суміш перемішували при 100°C протягом 2 год в атмосфері азоту. Реакційну суміш охолоджували до кімнатної температури, розбавляли водою та екстрагували сумішшю етил ацетату та гексану (3:7). Органічний шар промивали сольовим розчином, сушили (Na₂SO₄) та концентрували під зниженим тиском. Неочищений продукт очищали за допомогою колоночної хроматографії на силікагелі, використовуючи гексани/етил ацетат як елюент, одержуючи зазначений у заголовку продукт у вигляді блідо-жовтої твердої речовини (4,8 г).

Стадія В: Одержання 8-бром-5-хінолінкарбоксальдегіду

Суміш (8-бром-5-хінолініл)метил ацетату (тобто, продукту зі Стадії А) та метанолу (50 мл) нагрівали при кипінні зі зворотним холодильником протягом 1 год в присутності дуже малої кількості карбонату калію (10 мг). Потім реакційну суміш охолоджували до кімнатної температури та концентрували під зниженим тиском, одержуючи відповідний спирт з кількісним виходом у вигляді блідо-жовтої твердої речовини.

До перемішаного розчину неочищеного спирту (2,0 г, 8,3 ммоль) в дихлорметані (60 мл) повільно додавали 1,1,1-трис(ацетокси)-1,1-дигідро-1,2-бензодоксол-3(1H)-он (періодинан Дес-Мартіна) (4,0 г, 9,4 ммоль) при кімнатній температурі. Після перемішування протягом 0,5 год, реакційну суміш розбавляли дихлорметаном, промивали насиченим водним бікарбонатом натрію та сольовим розчином, сушили (Na₂SO₄) та концентрували під зниженим тиском. Неочищений продукт очищали за допомогою колоночної хроматографії на силікагелі, використовуючи гексани/етил ацетат як елюент, одержуючи зазначений у заголовку продукт у вигляді білої твердої речовини (1,8 г).

¹H ЯМР (CDCl₃): 10,31 (s, 1H), 9,65 (dd, 1H), 9,12 (dd, 1H), 8,26 (d, 1H), 7,88 (d, 1H), 7,66 (dd, 1H).

Стадія С: Одержання 8-бром-5-хінолінкарбоксальдегід оксиму

До перемішаного розчину 8-бром-5-хінолінкарбоксальдегіду (тобто, продукту зі Стадії В) (1,7 г, 7,1 ммоль) в етанолі (30 мл) додавали водний розчин гідроксиламіну (0,7 мл, 50% у воді). Після перемішування при кімнатній температурі протягом 2 год, реакційну суміш концентрували під зниженим тиском, одержуючи зазначену у заголовку сполуку у вигляді блідо-жовтої твердої речовини (1,8 г).

^1H ЯМР (DMSO-d_6): 11,61 (s, 1H), 9,16 (dd, 1H), 9,07 (dd, 1H), 8,79 (s, 1H), 8,20 (d, 1H), 7,79 (d, 1H), 7,72 (dd, 1H).

Стадія D: Одержання 8-бром-5-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]хіноліну

До перемішаного розчину 8-бром-5-хінолінкарбоксальдегід оксиму (тобто, продукту зі Стадії C) (1,7 г, 6,8 ммоль) в N,N-диметилформаміді (13,0 мл) додавали N-хлорсукцинімід (1,24 г, 9,3 ммоль). Реакційну суміш перемішували протягом 1 год при кімнатній температурі та потім додавали розчин 1,3-дихлор-5-[1-(трифторметил)етеніл]бензолу (тобто, продукту з Прикладу 1, Стадія B) (1,96 г, 8,1 ммоль) та триетиламіну (2,86 мл, 20,4 ммоль) в N,N-диметилформаміді (7,0 мл). Після перемішування протягом додаткових 12 год при кімнатній температурі, реакційну суміш розбавляли водою та екстрагували етил ацетатом. Органічний шар промивали сольовим розчином, сушили (Na_2SO_4) та концентрували під зниженим тиском. Залишок очищали за допомогою колоночної хроматографії на силікагелі, використовуючи гексани/етил ацетат як елюент, одержуючи зазначену у заголовку сполуку у вигляді білої твердої речовини (2,0 г, вихід 61%).

^1H ЯМР (CDCl_3): 9,39 (dd, 1H), 9,08 (dd, 1H), 8,05 (d, 1H), 7,59 (dd, 1H), 7,55 (s, 2H), 7,44 (t, 1H), 7,40 (d, 1H), 4,27 (d, 1H), 3,92 (d, 1H).

Стадія E: Одержання 5-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-N-(2-піридинілметил)-8-хінолінкарбоксаміду

Суміш 8-бром-5-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]хіноліну (тобто, продукту зі Стадії D) (500 мг, 1,0 ммоль), [1,1'-біс(дифенілфосфіно)фероцен]дихлорпаладію (II) ($\text{PdCl}_2(\text{dppf})$) (75 мг, 0,10 ммоль), 2-(амінометил)піридину (0,43 мл, 4,0 ммоль) та триетиламіну (2,8 мл, 20 ммоль) в толуолі (10 мл) продували монооксидом вуглецю протягом 15 хвилин. Потім в реакційній посудині підтримували рівень монооксиду вуглецю, використовуючи балон. Реакційну суміш перемішували при 70°C в атмосфері монооксиду вуглецю протягом ночі. Суміш охолоджували до кімнатної температури, фільтрували через невелику прокладку з допоміжного діатомового фільтрувального матеріалу целіт® та промивали невеликою кількістю етил ацетату. Фільтрат концентрували та залишок очищали за допомогою колоночної хроматографії на силікагелі, використовуючи гексани/етил ацетат як елюент, одержуючи зазначений у заголовку продукт, сполуку за даним винаходом, у вигляді коричневої пінистої твердої речовини (60 мг, вихід 11%).

^1H ЯМР (CDCl_3): 12,02 (br s 1H), 9,52 (d, 1H), 9,01 (s, 1H), 8,88 (d, 1H), 8,62 (d, 1H), 7,60-7,74 (m, 3H), 7,56 (s, 2H), 7,45 (br s 2H), 7,20 (dd, 1H), 4,96 (d, 2H), 4,32 (d, 1H), 3,98 (d, 1H).

Приклад 5

Одержання 5-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-N-(2-піридинілметил)-8-ізохінолінкарбоксаміду

Стадія A: Одержання 8-бром-5-ізохінолінкарбоальдегіду та 5-бром-8-ізохінолінкарбоальдегіду

До перемішаної суміші 5,8-дибромізохіноліну (4,0 г, 13,9 ммоль) в тетрагідрофурані (120 мл) при -78°C в атмосфері азоту по краплям додавали розчин н-бутиллітію (2,3 M в гексані, 7,3 мл, 16,8 ммоль). Реакційна суміш ставала темною. Після перемішування протягом 15 хвилин, реакційну суміш гасили додаванням N,N-диметилформаміду (4,0 мл). Після перемішування при -78°C протягом додаткової 1 год, реакційну суміш гасили водою, екстрагували сумішшю етил ацетату/гексану (2:8), промивали водою та сольовим розчином, сушили (Na_2SO_4) та концентрували під зниженим тиском. Залишок очищали за допомогою колоночної хроматографії на силікагелі, використовуючи гексани/етил ацетат як елюент, одержуючи 8-бром-5-ізохінолінкарбоксальдегід (0,10 г), а потім 5-бром-8-ізохінолінкарбоксальдегід (1,0 г) у вигляді білих твердих речовин.

^1H ЯМР (CDCl_3) 8-бром-5-ізохінолінкарбоксальдегіду: 10,36 (s, 1H), 9,72 (s, 1H), 9,00 (d, 1H), 8,79 (d, 1H), 8,04 (d, 1H), 8,01 (dd, 1H); та

^1H ЯМР (CDCl_3) 5-бром-8-ізохінолінкарбоксальдегіду: 10,57 (s, 1H), 10,41 (s, 1H), 8,81 (d, 1H), 8,18 (d, 1H), 8,11 (d, 1H), 7,94 (d, 1H).

Стадія B: Одержання 8-бром-5-ізохінолінкарбоальдегід оксиму

До перемішаного розчину 8-бром-5-ізохінолінкарбоксальдегіду (тобто, продукту зі Стадії A) (75 мг, 0,3 ммоль) в етанолі (7 мл) додавали водний розчин гідроксиламіну (0,5 мл, 50% у воді). Після перемішування при кімнатній температурі протягом ночі, реакційну суміш концентрували під зниженим тиском, одержуючи зазначену у заголовку сполуку у вигляді жовтої твердої речовини (70 мг).

^1H ЯМР (DMSO-d_6): 11,75 (s, 1H), 9,55 (s, 1H), 8,78 (s, 1H), 8,71 (d, 1H), 8,59 (d, 1H), 8,07 (d, 1H), 7,96 (d, 1H).

Стадія C: Одержання 8-бром-5-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]ізохіноліну

До перемішаного розчину 8-бром-5-ізохінолінкарбоксальдегід оксиму (тобто, продукту зі Стадії B) (70 мг, 0,28 ммоль) в N,N-диметилформаміді (2,0 мл) додавали N-хлорсукцинімід (64 г, 0,48 ммоль). Реакційну суміш перемішували протягом 0,5 год при кімнатній температурі та потім додавали розчин 1,3-дихлор-5-[1-(трифторметил)етеніл]бензолу (135 мг, 0,56 ммоль) (тобто, продукту з Прикладу 1, Стадія B) та триетиламіну (0,12 мл, 0,86 ммоль) в N,N-диметилформаміді (1,5 мл). Після перемішування протягом додаткових 12 год при кімнатній температурі, реакційну суміш розбавляли водою та екстрагували етил ацетатом. Органічний шар промивали сольовим розчином, сушили (Na_2SO_4) та концентрували під зниженим тиском. Залишок очищали за допомогою колоночної хроматографії на силікагелі, використовуючи гексани/етил ацетат

як елюент, одержуючи зазначену у заголовку сполуку (20 мг), забруднену деякими домішками.

Стадія D: Одержання 5-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]-N-(2-піридинілметил)-8-ізохінолінкарбоксаміду

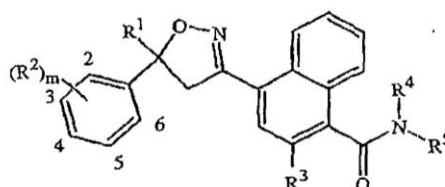
Суміш 8-бром-5-[5-(3,5-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-(трифторметил)-3-ізоксазоліл]ізохіноліну (тобто, продукту зі Стадії C) (20 мг, 0,04 ммоль), [1,1'-біс(дифенілфосфіно)фероцен]дихлорпаладію (II) ($\text{PdCl}_2(\text{dppf})$) (6 мг, 0,008 ммоль), 2-(амінометил)піридину (17 мг, 0,16 ммоль) та триетиламіну (0,1 мл, 0,7 ммоль) в толуолі (2 мл) продували монооксидом вуглецю протягом 15 хвилин. Потім в реакційній посудині підтримували рівень монооксиду вуглецю, використовуючи балон. Реакційну суміш перемішували при 70°C в атмосфері монооксиду вуглецю протягом ночі. Суміш охолоджували до кімнатної температури, фільтрували через невелику прокладку з допоміжного діатомо-

вого фільтрувального матеріалу целіт® та промивали невеликою кількістю етил ацетату. Фільтрат концентрували та залишок очищали за допомогою колоночної хроматографії на силікагелі, використовуючи гексани/етил ацетат як елюент, одержуючи зазначений у заголовку продукт, сполуку за даним винаходом, у вигляді блідо-білої твердої речовини (15 мг).

^1H ЯМР (CDCl_3): 9,77 (s, 1H), 8,80 (d, 1H), 8,70 (d, 1H), 8,52 (s, 1H), 7,81-7,23 (m, 9H), 4,88 (d, 2H), 4,28 (d, 1H), 3,92 (d, 1H).

За допомогою методик, описаних в даній заявці, разом зі способами, відомими з рівня техніки, можуть бути одержані наступні сполуки, наведені в Таблицях 1-9. В Таблицях використовуються наступні скорочення: -CN означає ціано, Ph означає феніл, Ru означає піридиніл, Me означає метил, Et означає етил та i-Pr означає ізопропіл.

Таблиця 1



де m означає 1, 2, 3, 4 або 5.

R^1	$(\text{R}^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(\text{R}^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF_3	H	H	H	CH_2CF_3	CF_3	H	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	2-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	3-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	4-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-Cl	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CF_3
R^1	$(\text{R}^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(\text{R}^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF_3	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	2-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-F	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	3-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	4-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-F	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	2-F, 4-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-F, 4-F	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	3-F, 4-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F, 4-F	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	3-F, 5-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F, 5-F	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	3- CF_3	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3- CF_3	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	4- CF_3	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4- CF_3	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	3- CF_3 , 5- CF_3	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3- CF_3 , 5- CF_3	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	3-Cl, 5- CF_3	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5- CF_3	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	3-Cl, 4- CF_3	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4- CF_3	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	3-Cl, 4-Br	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	3-Br, 5-Br	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	3-Br, 4-Br	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2CF_3

CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	H	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	2-Cl	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-Cl	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	2-Cl, 4-Cl	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl	H	CH ₂ CF ₃

<u>R</u> ¹	<u>(R</u> ² <u>)</u> _m	<u>R</u> ³	<u>R</u> ⁴	<u>R</u> ⁵
CF ₃	2-F	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-F	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-F	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	2-F, 4-F	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-F, 4-F	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-F, 5-F	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-CF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-CF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-Br	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Br, 5-Br	a	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Br, 4-Br	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Br	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-Br	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-I	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-I	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-CN	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-CN	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Me	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-Me	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-OMe	Cl	H	CH ₂ CF ₃

CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	H	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py

<u>R</u> ¹	<u>(R</u> ² <u>)</u> _m	<u>R</u> ³	<u>R</u> ⁴	<u>R</u> ⁵
CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py

CF ₃	4-OMe	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-OCF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-OCF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	H	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py

<u>R</u> ¹	<u>(R</u> ² <u>)</u> _m	<u>R</u> ³	<u>R</u> ⁴	<u>R</u> ⁵
CF ₃	4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	H	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₂ CF ₃	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₂ CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₂ CF ₃	4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₂ CF ₃	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃

CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	H	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Cl	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl, 4-Cl	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F	Cl	H	CH ₂ -2-Py

<u>R</u> ¹	<u>(R</u> ² <u>)</u> _m	<u>R</u> ³	<u>R</u> ⁴	<u>R</u> ⁵
CF ₃	4-F	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F, 4-F	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 4-F	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	Cl	H	CH ₂ -2-Py*
CF ₃	4-I	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	H	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py

CF ₂ CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₂ CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₂ CF ₃	4-F	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₂ CF ₃	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃

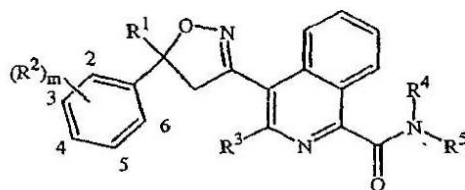
<u>R¹</u>	<u>(R²)_m</u>	<u>R³</u>	<u>R⁴</u>	<u>R⁵</u>
CF ₂ CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₂ CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₂ CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₂ CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₂ CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₂ CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₂ CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₂ CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₂ CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₂ CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₂ CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₂ CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₂ CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₂ CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₂ CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₂ CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₂ CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₂ CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₂ CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₂ CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₂ CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	H	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-F	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃

CF ₂ CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py

<u>R¹</u>	<u>(R²)_m</u>	<u>R³</u>	<u>R⁴</u>	<u>R⁵</u>
CF ₂ CF ₃	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	H	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
$CF(CF_3)_2$	3- CF_3	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4- CF_3	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3- CF_3 , 5- CF_3	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3- CF_3 , 5- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5- CF_3	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4- CF_3	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-I	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-I	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-I	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-I	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-CN	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-CN	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Me	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Me	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OMe	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OMe	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py

Таблиця 2



де m означає 1, 2, 3, 4 або 5.

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF_3	H	H	H	CH_2CF_3	CF_3	H	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF_3	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-F	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-F	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-F, 4-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-F, 4-F	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-F, 4-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F, 4-F	H	H	CH_2 -2-Py

CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	H	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	H	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F	H	H	CH ₂ -2-Py
<u>R¹</u>	<u>(R²)_m</u>	<u>R³</u>	<u>R⁴</u>	<u>R⁵</u>	<u>R¹</u>	<u>(R²)_m</u>	<u>R³</u>	<u>R⁴</u>	<u>R⁵</u>
CF(CF ₃) ₂	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py

CF(CF ₃) ₂	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-CN	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	H	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
<u>R</u> ¹	<u>(R</u> ² <u>)</u> _m	<u>R</u> ³	<u>R</u> ⁴	<u>R</u> ⁵
CF ₃	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃

CF(CF ₃) ₂	3-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	H	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
<u>R</u> ¹	<u>(R</u> ² <u>)</u> _m	<u>R</u> ³	<u>R</u> ⁴	<u>R</u> ⁵
CF ₃	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py

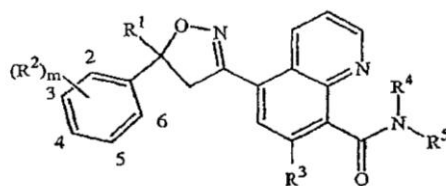
CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	H	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	2-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃

<u>R</u> ¹	<u>(R)</u> _m ²	<u>R</u> ³	<u>R</u> ⁴	<u>R</u> ⁵
CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-I	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-I	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃

CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	H	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py

<u>R</u> ¹	<u>(R)</u> _m ²	<u>R</u> ³	<u>R</u> ⁴	<u>R</u> ⁵
CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py

Таблиця 3



де m означає 1, 2, 3, 4 або 5.

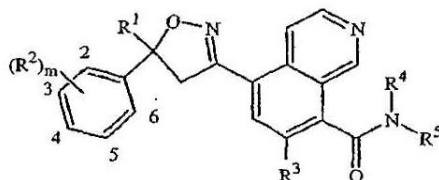
R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF ₃	H	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	H	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	H	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py

CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
<u>R</u> ¹	<u>(R</u> ² <u>)</u> _m	<u>R</u> ³	<u>R</u> ⁴	<u>R</u> ⁵	<u>R</u> ¹	<u>(R</u> ² <u>)</u> _m	<u>R</u> ³	<u>R</u> ⁴	<u>R</u> ⁵
CF(CF ₃) ₂	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CN ¹	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF ₃	4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	H	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
$CF(CF_3)_2$	3-F, 4-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3- CF_3 , 5- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3- CF_3 , 5- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-I	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-I	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-I	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-I	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-CN	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-CN	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Me	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Me	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OMe	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OMe	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py

Таблиця 4



де m означає 1, 2, 3, 4 або 5.

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF_3	H	H	H	CH_2CF_3	CF_3	H	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF_3	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-F	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-F	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-F, 4-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-F, 4-F	H	H	CH_2 -2-Py

CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃ ¹	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	H	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-F	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃

CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	H	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br	H	H	CH ₂ -2-Py

CF(CF ₃) ₂	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-CN	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	H	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
<u>R</u> ¹	<u>(R</u> ² <u>)</u> _m	<u>R</u> ³	<u>R</u> ⁴	<u>R</u> ⁵
CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃

CF(CF ₃) ₂	4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	H	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
<u>R</u> ¹	<u>(R</u> ² <u>)</u> _m	<u>R</u> ³	<u>R</u> ⁴	<u>R</u> ⁵
CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py

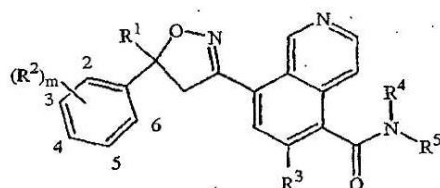
CF(CF ₃) ₂	H	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	2-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃

<u>R¹</u>	<u>(R²)_m</u>	<u>R³</u>	<u>R⁴</u>	<u>R⁵</u>
CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-I	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-I	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃

CF(CF ₃) ₂	H	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py

<u>R¹</u>	<u>(R²)_m</u>	<u>R³</u>	<u>R⁴</u>	<u>R⁵</u>
CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py

Таблиця 5



де m означає 1, 2, 3, 4 або 5.

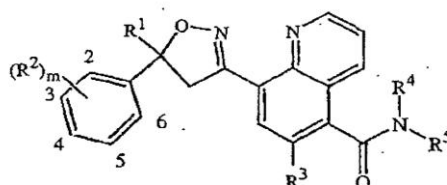
R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF ₃	H	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF ₃	4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	H	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	H	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py

CF(CF ₃) ₂	4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
<u>R</u> ¹	(<u>R</u> ²) _m	<u>R</u> ³	<u>R</u> ⁴	<u>R</u> ⁵	<u>R</u> ¹	(<u>R</u> ²) _m	<u>R</u> ³	<u>R</u> ⁴	<u>R</u> ⁵
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	H	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
$CF(CF_3)_2$	4-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-F, 4-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-F, 4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F, 4-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3- CF_3 , 5- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3- CF_3 , 5- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-I	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-I	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-I	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-I	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-CN	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-CN	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Me	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Me	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OMe	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OMe	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py

Таблица 6



де m означає 1, 2, 3, 4 або 5.

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF_3	H	H	H	CH_2CF_3	CF_3	H	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-F	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-F	H	H	CH_2 -2-Py

CF ₃	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	H	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
<u>R¹</u>	<u>(R²)_m</u>	<u>R³</u>	<u>R⁴</u>	<u>R⁵</u>
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-F	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃

CF ₃	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	H	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
<u>R¹</u>	<u>(R²)_m</u>	<u>R³</u>	<u>R⁴</u>	<u>R⁵</u>
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	H	H'	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py

CF(CF ₃) ₂	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-CN	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-Me	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	H	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
<u>R</u> ¹	<u>(R</u> ² <u>)</u> _m	<u>R</u> ³	<u>R</u> ⁴	<u>R</u> ⁵
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃

CF(CF ₃) ₂	3-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	H	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
<u>R</u> ¹	<u>(R</u> ² <u>)</u> _m	<u>R</u> ³	<u>R</u> ⁴	<u>R</u> ⁵
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py

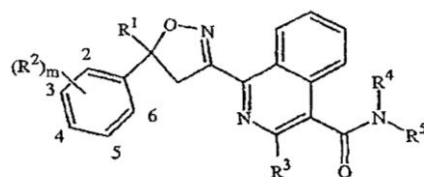
CF(CF ₃) ₂	H	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	2-F	Me	H	CH ₂ CF ₃

<u>R¹</u>	<u>(R²)_m</u>	<u>R³</u>	<u>R⁴</u>	<u>R⁵</u>
CF(CF ₃) ₂	3-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-I	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-I	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃

CF(CF ₃) ₂	H	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py

<u>R¹</u>	<u>(R²)_m</u>	<u>R³</u>	<u>R⁴</u>	<u>R⁵</u>
CF(CF ₃) ₂	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py

Таблиця 7



де m означає 1, 2, 3, 4 або 5.

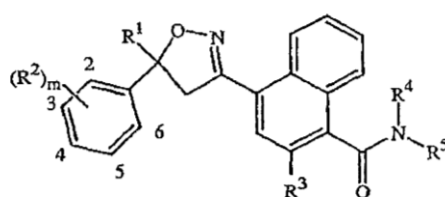
R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF ₃	H	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	H	CH ₂ -2-Py
R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF ₃	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	H	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	H	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
$CF(CF_3)_2$	4-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-F, 4-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-F, 4-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F, 4-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 4-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3- CF_3	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3- CF_3	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4- CF_3	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4- CF_3	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3- CF_3 , 5- CF_3	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3- CF_3 , 5- CF_3	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5- CF_3	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5- CF_3	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4- CF_3	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4- CF_3	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Br	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Br	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-I	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-I	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-I	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-I	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-CN	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-CN	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-CN	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-CN	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Me	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Me	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Me	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Me	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OMe	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OMe	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OMe	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OMe	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	H	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	H	H	CH_2 -2-Py
CF_3	H	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	H	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	3-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py
CF_3	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2 -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	H	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
$CF(CF_3)_2$	2-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-F'	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	2-F, 4-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	2-F, 4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F, 4-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 4-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-F, 5-F	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3- CF_3 , 5- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3- CF_3 , 5- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4- CF_3	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4- CF_3	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br, 4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Br	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Br	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-I	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-I	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-I	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-I	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-CN	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-CN	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-CN	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Me	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-Me	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-Me	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OMe	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OMe	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OMe	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	3-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py
$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	Me	H	CH_2CF_3	$CF(CF_3)_2$	4-OCF ₃	Me	H	CH_2 -2-Py

Таблиця 8



де m означає 1, 2, 3, 4 або 5.

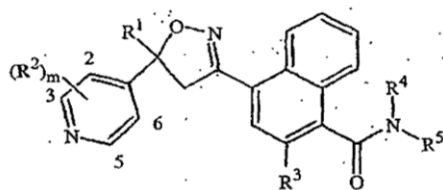
R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF_3	3-Cl, 4-Cl	H	H	H	CF_3	3-Cl, 5-Cl	H	H	H
CF_3	3-Cl, 4-Cl	H	H	Me	CF_3	3-Cl, 5-Cl	H	H	Me
CF_3	3-Cl, 4-Cl	H	H	Et	CF_3	3-Cl, 5-Cl	H	H	Et
CF_3	3-Cl, 4-Cl	H	H	i-Pr	CF_3	3-Cl, 5-Cl	H	H	i-Pr
CF_3	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2Ph	CF_3	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2Ph
CF_3	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CO_2Me	CF_3	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2CO_2Me
CF_3	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CN	CF_3	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2CN
CF_3	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2 -2-тіазоліл	CF_3	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2 -2-тіазоліл
CF_3	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2 -4-	CF_3	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2 -4-

				тіазоліл
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -5-тіазоліл
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -3-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -4-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	Me	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	H
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	Me
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	Et
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	i-Pr
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ Ph
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CO ₂ Me
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CN
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-тіазоліл
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -4-тіазоліл
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -5-тіазоліл
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -3-Py
R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -4-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	Me	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	H
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	Me
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	Et
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	i-Pr
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ Ph
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CO ₂ Me
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CN
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-тіазоліл
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -4-тіазоліл
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -5-тіазоліл
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -3-Py

				тіазоліл
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -5-тіазоліл
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -3-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -4-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	Me	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	H
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	Me
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	Et
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	i-Pr
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ Ph
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CO ₂ Me
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CN
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-тіазоліл
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -4-тіазоліл
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -5-тіазоліл
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -3-Py
R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -4-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	Me	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	H
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	Me
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	Et
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	i-Pr
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ Ph
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CO ₂ Me
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CN
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-тіазоліл
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -4-тіазоліл
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -5-тіазоліл
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -3-Py

CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -4-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -4-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	C(O)Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	C(O)Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	Me	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	Me	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	C(O)Me	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	C(O)Me	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	H	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	H
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	Me
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	Et	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	Et
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	i-Pr	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	i-Pr
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ Ph	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ Ph
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CO ₂ Me	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CO ₂ Me
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CN	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CN
<u>R</u> ¹	<u>(R</u> ² <u>)</u> _m	<u>R</u> ³	<u>R</u> ⁴	<u>R</u> ⁵	<u>R</u> ¹	<u>(R</u> ² <u>)</u> _m	<u>R</u> ³	<u>R</u> ⁴	<u>R</u> ⁵
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-тіазоліл	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-тіазоліл
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -4-тіазоліл	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -4-тіазоліл
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -5-тіазоліл	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -5-тіазоліл
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -3-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -3-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -4-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -4-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	Me	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	Me	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	C(O)Me	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	C(O)Me	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	Me	CH ₂ -2-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	Me	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	C(O)Me	CH ₂ -2-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	C(O)Me	CH ₂ -2-Py

Таблиця 9



де m означає 1, 2, 3 або 4.

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF ₃	3-Cl	H	H	H	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	H
CF ₃	3-Cl	H	H	Me	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	Me
CF ₃	3-Cl	H	H	Et	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	Et
CF ₃	3-Cl	H	H	i-Pr	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	i-Pr
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ Ph	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ Ph
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ CO ₂ Me	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CO ₂ Me
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ CN	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CN
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-тіазоліл	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-тіазоліл
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ -4-тіазоліл	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -4-тіазоліл
R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ -5-тіазоліл	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -5-тіазоліл
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ -3-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -3-Py
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ -4-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -4-Py
CF ₃	3-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl	H	Me	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	Me	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	H	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	H
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	Me	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	Me
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	Et	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	Et
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	i-Pr	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	i-Pr
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ Ph	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ Ph
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ CO ₂ Me	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CO ₂ Me
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ CN	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CN
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-тіазоліл	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-тіазоліл
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ -4-тіазоліл	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -4-тіазоліл
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ -5-тіазоліл	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -5-тіазоліл
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ -3-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -3-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ -4-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -4-Py

CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	Me	CH ₂ -2-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	Me	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ -2-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cr	H	C(O)Me	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	Me	H	H	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	H
CF ₃	3-Cl	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	Me
CF ₃	3-Cl	Me	H	Et	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	Et
CF ₃	3-Cl	Me	H	i-Pr	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	i-Pr
<u>R</u> ¹	<u>(R</u> ²) _m	<u>R</u> ³	<u>R</u> ⁴	<u>R</u> ⁵	<u>R</u> ¹	<u>(R</u> ²) _m	<u>R</u> ³	<u>R</u> ⁴	<u>R</u> ⁵
CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ Ph	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ Ph
CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ CO ₂ Me	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CO ₂ Me
CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ CN	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CN
CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-тіазоліл	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-тіазоліл
CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ -4-тіазоліл	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -4-тіазоліл
CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ -5-тіазоліл	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -5-тіазоліл
CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ -3-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -3-Py
CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ -4-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -4-Py
CF ₃	3-Cl	Me	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl	Me	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl	Me	C(O)Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	C(O)Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl	Me	Me	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	Me	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	Me	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	Me	C(O)Me	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	C(O)Me	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	H	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	H
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	Me
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	Et	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	Et
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	i-Pr	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	i-Pr
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ Ph	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ Ph
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ CO ₂ Me	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CO ₂ Me
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ CN	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CN
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-тіазоліл	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-тіазоліл
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ -4-тіазоліл	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -4-тіазоліл
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ -5-тіазоліл	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -5-тіазоліл
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ -3-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -3-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ -4-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -4-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	Me	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	Me	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	C(O)Me	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	C(O)Me	CH ₂ CF ₃

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
$CF(CF_3)_2$	3-Cl	Me	Me	CH_2-2-Py	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	Me	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl	Me	CO_2Me	CH_2-2-Py	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	CO_2Me	CH_2-2-Py
$CF(CF_3)_2$	3-Cl	Me	$C(O)Me$	CH_2-2-Py	$CF(CF_3)_2$	3-Cl, 5-Cl	Me	$C(O)Me$	CH_2-2-Py
CF_3	H	H	H	CH_2CF_3	CF_3	H	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	2-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	3-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	2-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-F	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	3-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	3-F, 5-F	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F, 5-F	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	3- CF_3	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3- CF_3	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	3- CF_3 , 5- CF_3	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3- CF_3 , 5- CF_3	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	3-Cl, 5- CF_3	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5- CF_3	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	3-Br, 5-Br	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Br, 5-Br	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	3-Br	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Br	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	3-I	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-I	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	3-CN	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-CN	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	3-Me	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Me	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	3-OMe	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-OMe	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	3-OCF ₃	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-OCF ₃	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	H	Cl	H	CH_2CF_3	CF_3	H	H	H	CH_2-2-Py
CF_3	2-Cl	a	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl	H	H	CH_2-2-Py
CF_3	3-Cl	Cl	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl	H	H	CH_2-2-Py
CF_3	3-Cl, 5-Cl	Cl	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH_2-2-Py
CF_3	2-F	Cl	H	CH_2CF_3	CF_3	2-F	H	H	CH_2-2-Py
CF_3	3-F	Cl	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F	H	H	CH_2-2-Py
CF_3	3-F, 5-F	Cl	H	CH_2CF_3	CF_3	3-F, 5-F	H	H	CH_2-2-Py
CF_3	3- CF_3	Cl	H	CH_2CF_3	CF_3	3- CF_3	H	H	CH_2-2-Py
CF_3	3- CF_3 , 5- CF_3	Cl	H	CH_2CF_3	CF_3	3- CF_3 , 5- CF_3	H	H	CH_2-2-Py
CF_3	3-Cl, 5- CF_3	Cl	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 5- CF_3	H	H	CH_2-2-Py
CF_3	3-Br, 5-Br	Cl	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Br, 5-Br	H	H	CH_2-2-Py

R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(R^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF ₃	3-Br	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	H	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	H	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	2-Cl	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	2-F	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-F	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-F, 5-F	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-CF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Br, 5-Br	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Br	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-I	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-CN	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Me	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-OMe	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-OCF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	H	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	H	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF ₂ CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	H	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	H	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py

Препаративні форми/Корисність

Сполуки за даним винаходом загалом будуть використовувати у вигляді препаративної форми або композиції з прийнятним носієм, що містить, принаймні, один компонент, вибраний з рідкого розріджувача, твердого розріджувача або поверхнево-активної речовини. Інгредієнти препаративної форми або композиції вибрано таким чином, щоб вони були сумісні з фізичними властивостями активного інгредієнта, способом використання та факторами навколишнього середовища, такими як тип землі, вологість та температура. Корисні препаративні форми включають рідкі форми, такі як розчини (включаючи емульгуючі концентрати), суспензії, емульсії (включаючи мікроемульсії та/або суспензії) та подібні, які необов'язково можуть бути згущені до гелів. Корисні препаративні форми, крім того, включають тверді форми, такі як пилоподібні препарати, порошки, гранули, пілюлі, таблетки, плівки (включаючи обробку насіння) та подібні, які можуть бути диспергованими у воді

("змочувані") або водорозчинними. Активний інгредієнт може бути (мікро)інкапсульований та потім включений в суспензію або тверду препаративну форму; альтернативно, вся препаративна форма активного інгредієнта може бути інкапсульована (або "покрита"). Інкапсуляція може контролювати або затримувати вивільнення активного інгредієнта. Препаративні форми, прийнятні для розприскування, можуть знаходитися в прийнятному середовищі та використовуватися з об'ємами розприскування від приблизно одного до декількох сотень літрів на гектар. Висококонцентровані композиції, перш за все, використовуються як проміжні продукти для подальшого виготовлення препаративних форм.

Препаративні форми звичайно будуть містити ефективні кількості активного інгредієнта, розріджувача та поверхнево-активної речовини в межах наступних приблизних діапазонів, які складають до 100 відсотків на масу.

	Масовий відсоток		
	Активний інгредієнт	Розріджувач	Поверхнево-активна речовина
Дисперговані у воді та водорозчинні гранули, таблетки та порошки	0,001-90	0-99,999	0-15
Суспензії, емульсії, розчини (включаючи емульгуємі концентрати)	1-50	40-99	0-50
Пилоподібні препарати	1-25	70-99	0-5
Гранули та пілюлі	0,001-99	5-99,999	0-15
Висококонцентровані композиції	90-99	0-10	0-2

Типові тверді розріджувачі описані в Watkins, et al., Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers, 2nd edition, Dorland Books, Caldwell, New Jersey. Типові рідкі розріджувачі описані в Marsden, Solvents Guide, 2nd edition, Interscience, New York, 1950. В McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual, Allured Publ. Corp., Ridgewood, New York, Jersey, а також в Sisely and Wood, Енциклопедія of Surface Active Agents, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964, перераховані поверхнево-активні речовини та рекомендоване використання. Всі препаративні форми можуть містити незначні кількості добавок для зниження спінення, затвердіння, окиснення, мікробіологічного росту, тощо, або загусників для збільшення в'язкості.

Поверхнево-активні речовини включають, наприклад, поліетоксильовані спирти, поліетоксильовані алкілфеноли, поліетоксильовані ефіри сорбіта та жирних кислот, діалкіл сульфосукцинати, алкіл сульфати, алкілбензол сульфонати, органіксілікони, N,N-діалкілтаурати, лігнін сульфонати, конденсати сульфонату нафталіну та формальдегіду, полікарбоксілати, ефіри гліцерину, блок кополімери гюліоксіетиле-ну/поліоксіпропілену та алкілполіглікозиди, де число одиниць глюкози, на які посилаються як на ступінь полімеризації (С.П.), може заходитися в діапазоні від 1 до 3 та одиниці алкілу можуть знаходитися в діапазоні від C₆-C₁₄ (див. Pure and Applied Chemistry 72, 1255-1264). Тверді розріджувачі включають, наприклад, глини, такі як бентоніт, монтморилоніт, атапульгіт та каолін, крохмаль, цукор, кремнезем, тальк, діатомову землю, сечовину, карбонат кальцію, карбонат і бікарбонат натрію та сульфат натрію. Рідкі розріджувачі включають, наприклад, воду, N,N-диметилформамід, диметил сульфоксид, N-алкілпіролідон, етилен гліколь, поліпропілен гліколь, пропілен карбонат, двоосновні ефіри, парафіни, алкілбензоли, алкілнафталіни, гліцерин, триацетин, оливкову олію, касторову олію, льняну олію, тунгову олію, сезамову олію, кукурудзяну олію, арахісову олію, бавовняну олію, соєву олію, рапсову олію та кокосову олію, ефіри жирних кислот, кетони, такі як циклогексанон, 2-гептанон, ізофорон та 4-гідрокси-4-метил-2-пентанон, ацетати, такі як гексил ацетат, гептил ацетат та октил ацетат, та спирти, такі як метанол, циклогексанол, деканол, бензиловий спирт та тетрагідрофурфуріловий спирт.

Корисні препаративні форми за даним винаходом також можуть містити речовини, добре відомі фахівцю в даній галузі техніки, такі як допоміжні речовини для препаративних форм, включаючи антиспінювачі, плівкоутворювачі і бар-

вники. Антиспінювачі можуть включати дисперговані у воді рідини, що містять поліорганосилоксани, такі як Rhodorsil® 416. Плівкоутворювачі можуть включати полівініл ацетати, кополімери полівінілацетату, кополімер полівінілпіролідону-вініл ацетату, полівінілові спирти, кополімери полівінілового спирту та віск. Барвники можуть включати дисперговані у воді рідкі забарвлюючі композиції, такі як Pro-Ized® Colorant Red. Фахівець в даній галузі техніки прийме до уваги, що наведено невичерпний перелік допоміжних речовин для препаративних форм. Прийнятні приклади допоміжних речовин для препаративних форм включають речовини, наведені в даній заявці, та речовини, наведені в McCutcheon's 2001, Volume 2: Functional Materials, опублікованому MC Publishing Company та публікації PCT WO 03/024222.

Розчини, включаючи емульгуємі концентрати, можуть бути легко одержані за допомогою змішування інгредієнтів. Пилоподібні препарати та порошки можуть бути одержані за допомогою змішування та, звичайно, розмелювання, як наприклад в молотковому млині або в струминному млині. Суспензії звичайно одержують за допомогою розмелювання в рідкому середовищі; див., наприклад, патент US 3,060,084. Гранули та пілюлі можуть бути одержані за допомогою розпилення активної речовини на попередньо одержані гранульовані носії або за допомогою способів агломерації. Див. Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, December 4, 1967, pp. 147-48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4th edition, McGraw-Hill, New York, 1963, pages 8-57 і наступні та WO 91/13546. Пілюлі можуть бути одержані, як описано в US 4,172,714. Дисперговані у воді та водорозчинні гранули можуть бути одержані, як розкрито в US 4,144,050, US 3,920,442 та DE 3,246,493. Таблетки можуть бути одержані, як описано в US 5,180,587, US 5,232,701 та US 5,208,030. Плівки можуть бути одержані, як наведено в GB 2,095,558 та US 3,299,566.

Для подальшої інформації щодо рівня техніки по препаративним формам див. T. S. Woods, "The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture" в Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge, T. Brooks та T. R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, pp. 120-133. Див. також US 3,235,361, Колонка 6, лінія 16 - Колонка 7, лінія 19 та Приклади 10-41; US 3,309,192, Колонка 5, лінія 43 - Колонка 7, лінія 62 та Приклади 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138-140, 162-164, 166, 167 та 169-182; US 2,891,855, Колонка 3, лінія

66 - Колонка 5, лінія 17 та Приклади 1-4; Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pp. 81-96; Hance et al., Weed Control Handbook, 8th edition., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989; та Developments in formulation technology, PJB Publications, Richmond, UK, 2000.

В наступних Прикладах всі відсотки є відсотками на масу та всі препаративні форми одержані традиційними шляхами. Номери сполук посилаються на сполуки в Індексних Таблицях А-С. Вважають, що фахівець в даній галузі техніки, без подальшої розробки, використовуючи попередній опис, може використовувати даний винахід до його найширших меж. Таким чином, наступні Приклади слід розглядати лише як ілюстрацію, та їх не потрібно аналізувати з метою обмеження будь-яким чином винаходу. Відсотки є відсотками на масу, якщо не вказано інше.

Приклад А

Змочуваний порошок

Сполука 1	65,0%
ефір додецилфенолу та поліетиленгліколю	2,0%
лігнінсульфонат натрію	4,0%
силікоалюмінат натрію	6,0%
монтморілоніт (кальцинований)	23,0%

Приклад В

Гранули

Сполука 2	10,0%
гранули атапульгіту (низько-летка речовина, 0,71/0,30 мм; U.S.S. сито № 25-50)	90,0%

Приклад С

Пресована пілюля

Сполука 8	25,0%
безводний сульфат натрію	10,0%
неочищений лігнінсульфонат кальцію	5,0%
алкілнафталенсульфонат натрію	1,0%
бентоніт кальцію/магнію	59,0%

Приклад D

Емульгуємий концентрат

Сполука 20	20,0%
суміш розчинних у маслі сульфонатів та поліоксіетиленових ефірів	10,0%
ізофорон	70,0%

Приклад Е

Мікроемульсія

Сполука 21	5,0%
кополімер полівінілпіролідону-вініл ацетату	30,0%
алкілполіглікозид	30,0%
гліцерил моноолеат	15,0%
вода	20,0%

Приклад F

Обробка насіння

Сполука 101	20,00%
кополімер полівінілпіролідону-вініл ацетату	5,00%
кислотне похідне монтанного воску	5,00%
лігнінсульфонат кальцію	1,00%
блок кополімери поліоксіетилену/поліоксипропілену	1,00%
стеариловий спирт (POE 20)	2,00%
поліорганосилан	0,20%

барвник „colorant red”	0,05%
вода	65,75%
Приклад G	
Брусок добрива	
Сполука 201	2,50%
кополімер піролідону-стиролу	4,80%
тристирилфеніл 16-етоксилат	2,30%
тальк	0,80%
кукурудзяний крохмаль	5,00%
добриво повільного вивільнення Nitrophoska®	36,00%
Permanent 15-9-15 (BASF)	
каолін	38,00%
вода	10,60%

Сполуки за даним винаходом проявляють активність проти широкого спектру безхребетних шкідників. Ці шкідники включають безхребетних, що існують в різноманітних оточуючих середовищах, таких як, наприклад, листя рослин, корені, ґрунт, зібрані врожаї або інші харчові продукти, будівлі або зовнішні покрови тіла тварин. Ці шкідники включають, наприклад, безхребетних, що харчуються листям (включаючи листя, стовбури, квітки та плоди), насінням, деревиною, текстильними волокнами або кров'ю чи тканинами тварин, та, таким чином, викликають травми або пошкодження, наприклад, сільськогосподарських культур, що ростуть або зберігаються, лісів, тепличних культур, декоративних рослин, культур у розсадниках, харчових продуктів та волокнистої продукції, що зберігаються, або будинків чи інших будівель або їх вмісту, або наносять шкоду здоров'ю тварин або людей. Фахівець в даній галузі техніки визнає, що не всі сполуки є однаково ефективними проти всіх стадій росту всіх шкідників.

Дані сполуки та композиції, таким чином, сільськогосподарсько корисні для захисту польових культур від рослинної безхребетних шкідників, а також несільськогосподарсько корисні для захисту інших садових культур та рослин від рослинної безхребетних шкідників. Така корисність включає захист культур та інших рослин (тобто як сільськогосподарських, так і несільськогосподарських), які включають генну речовину, введену генною інженерією (тобто трансгенні), або модифіковані, щоб забезпечити вигідні особливості. Приклади таких особливостей включають толерантність до гербіцидів, резистентність до рослинних шкідників (наприклад, комах, кліщів, тлі, павуків, нематодів, равликів, рослинних патогенних грибків, бактерій та вірусів), поліпшений ріст рослин, збільшену толерантність до несприятливих умов вирощування, таких як високі та низькі температури, низька або висока вологість землі, та висока солоність, збільшене цвітіння або плодоносність, більші виходи врожаю, більш швидке дозрівання, вища якість та/або живильне значення зібраного продукту, або поліпшені властивості зберігання або процесу зібраних продуктів. Трансгенні рослини можуть бути модифіковані, щоб експресувати різні особливості. Приклади рослин, що мають особливості, забезпечені генною інженерією або мутагенезом, включають різновиди зернових, бавовни, сої та картоплі, що експресують інсектицидний токсин *Bacillus thuringiensis*, такий як

YIELD GARD®, KNOCKOUT®, STARLINK®, BOLLGARD®, NuCOTN® та NEWLEAF®, та толерантні до гербіциду різновиди зернових, бавовни, сої та рапсу, такі як ROUNDUP READY®, LIBERTY LINK®, IMI®, STS® та CLEARFIELD®, а також культури, що експресують N-ацетилтрансферазу (GAT), щоб забезпечити резистентність до гліфосатного гербіциду, або культури, що містять ген HRA, що забезпечує резистентність до гербіцидів, які інгібують ацетолактат синтазу (ALS). Дані сполуки та композиції можуть синергетично взаємодіяти з особливостями, введеними генною інженерією або модифікованими мутагенезом, таким чином, підвищуючи фенотипову експресію або ефективність особливостей або збільшуючи ефективність даних сполук та композицій щодо боротьби з безхребетними шкідниками. Зокрема, дані сполуки та композиції можуть синергетично взаємодіяти з фенотиповою експресією протеїнів або інших природних продуктів, токсичних для безхребетних шкідників, щоб забезпечити більший-ніж-адитивний контроль цих шкідників.

Несільськогосподарські застосування відносяться до боротьби з безхребетними шкідниками в областях, відмінних від хлібних злаків. Несільськогосподарські застосування даних сполук та композицій включають боротьбу з безхребетними шкідниками в зерні, бобах та інших харчових продуктах, що зберігаються, та в тканинах, таких як одяг та килими. Несільськогосподарські застосування даних сполук та композицій також включають боротьбу з безхребетними шкідниками в декоративних рослинах, лісах, рослинах на подвір'ї, уздовж узбіччя та в залізничній зоні відчуження, та на дерні, як наприклад газонах, полях для гри в гольф та пасовищах. Несільськогосподарські застосування даних сполук та композицій також включають боротьбу з безхребетними шкідниками в будинках та інших будівлях, в яких можуть жити люди, та/або супутніх будівлях, на фермі, ранчо, у тварин в зоопарку або інших тварин. Несільськогосподарські застосування даних сполук та композицій також включають боротьбу зі шкідниками, такими як терміти, які можуть наносити шкоду лісу або іншим структурним матеріалам, що використовуються в будівлях.

Несільськогосподарські застосування даних сполук та композицій також включають захист здоров'я людей та тварин шляхом боротьби з безхребетними шкідниками, які є паразитичними, або переносять інфекційні хвороби. Боротьба з тваринними шкідниками включає боротьбу із зовнішніми шкідниками, які є паразитичними до поверхні тіла свійської тварини (наприклад, плечей, пахв, живота, внутрішньої частини стегон), та внутрішніми шкідниками, які є паразитичними до внутрішньої частини тіла свійської тварини (наприклад, шлунку, кишечника, легені, вен, під шкірою, лімфатичної тканини). Зовнішні паразитичні шкідники або шкідники, що переносять хворобу, включають, наприклад, кліщі-тромбікуліди, іксодові кліщі, воші, москіти, мухи, кліщі та блохи. Внутрішні шкідники включають серцеві черв'яки, анкілостомати та гельмінти. Сполуки та композиції за даним винаходом є прийнятними для систематичного та/або

несистематичного контролю інвазії або зараження паразитами на тваринах. Сполуки та композиції за даним винаходом є особливо прийнятними для боротьби із зовнішніми паразитичними шкідниками або шкідниками, що переносять хвороби. Сполуки та композиції за даним винаходом є прийнятними для боротьби з паразитами, які заражають сільськогосподарських працюючих тварин, таких як велика рогата худоба, вівця, кози, коні, свині, осли, верблюди, буйволи, кролики, курки, індюки, качки, гуски та бджоли; кімнатні тварини та домашні тварини, такі як собаки, коти, кімнатні птахи та акваріумні рибки; а також і так названі експериментальні тварини, такі як хом'яки, морські свинки, щури та миші. За допомогою боротьби з цими паразитами, смертність та зниження продуктування (в показниках м'ясо, молоко, шерсть, шкіра, яйця, мед, тощо) зменшуються, таким чином, що застосування композицій, що містять сполуку за даним винаходом, дозволяє більш економічне та просте вирощування тварин.

Приклади сільськогосподарських або несільськогосподарських безхребетних шкідників включають яйця, личинки та дорослі особини ряду *Lepidoptera*, такі як "похідні черв'яки", озимі черв'яки, п'ядениці та совки в сімействі *Noctuidae* (наприклад, рожевий стовбурний свердильник (*Sesamia inferens* Walker), свердильник стебла кукурудзи (*Sesamia nonagrioides* Lefebvre), південна совка (*Spodoptera eridania* Cramer), совка трав'яна (*Spodoptera fugiperda* J. E. Smith), совка мала (*Spodoptera exigua* Hubner), совка (*Spodoptera littoralis* Boisduval), жовто-смуриста совка (*Spodoptera ornithogalli* Guenee), совка іпсилон (*Agrotis ipsilon* Hufnagel), бархатна бобова гусінь (*Anticarsia gemmatilis* Hubner), зелена гусінь-шкідник плодів (*Lithophane antennata* Walker), капустяна совка (*Barathra brassicae* Linnaeus), соєва п'ядиця (*Pseudoplusia includens* Walker), совка ні (*Trichoplusia ni* Hubner), тютюнова листовійка-почкоїд (*Heliothis virescens* Fabricius)); свердильники, чохлоноси, гусениці, що випускають павутину, конусоподібні черв'яки, мермитиди та шкідники, що скелетують листя, з сімейства *Pyrilidae* (наприклад, метелик кукурудзяний (*Ostrinia nubilalis* Hubner), „пупкова“ цитрусова гусінь (*Amyelois transitella* Walker), зерновий кореневий метелик (*Crambus caliginosellus* Clemens), лугові метелики (*Pyrilidae*: *Crambinae*), такі як луговий метелик (*Herpetogramma licarsisalis* Walker), точильник стебла цукрового очерету (*Chilo infuscatellus* Snellen), свердильник малий томатний (*Neoleucinodes elegantalis* Guenee), трубокрут зелений (*Cnaphalocerus medinalis*), вогнівка виноградна (*Desmia funeralis* Hubner), черв'як диневий (*Diaphania nitidalis* Stoll), капустяний серединний черв'як (*Heliolua hydralis* Guenee), жовтий стебловий свердильник (*Scirpophaga incertulas* Walker), ранній свердильник (*Scirpophaga infuscatellus* Snellen), білий стебловий свердильник (*Scirpophaga innotata* Walker), верхній свердильник (*Scirpophaga nivella* Fabricius), темно-головий рисовий свердильник (*Chilo polychrysus* Meyrick), кластерна гусениця капустянки (*Crociodolomia binotalis* English)); листовійки, листовійки-почкоїди,

плодожерки та гусениця-шкідник плодів в сімействі Tortricidae (наприклад, плодожерка яблунева (*Cydia pomonella* Linnaeus), листовійка виноградна (*Endopiza viteana* Clemens), плодожерка східна персикова (*Grapholita molesta* Busck), цитрусова псевдо-яблунева плодожерка (*Cryptophlebia leucotreta* Meyrick), свердильник цитрусовий (*Ecdyolopha aurantiana* Lima), червонострічкова листовійка (*Argyrotaenia velutinana* Walker), косострічкова листовійка (*Choristoneura rosaceana* Harris), світло-коричнева яблунева плодожерка (*Epiphyas postvittana* Walker), міль європейська виноградна (*Eupoecilia ambiguella* Hubner), вертуха почкова (*Pandemis pyrusana* Kearfott), листовійка всеїдна (*Platynota stultana* Walsingham), поперечно смугаста фруктова листовійка (*Pandemis cerasana* Hubner), листовійка яблунева коричнева (*Pandemis heparana* Denis & Schiffermüller)); та багато інших економічно важливих метеликів (наприклад, міль капустяна (*Plutella xylostella* Linnaeus), рожевий коробковий черв'як бавовнику (*Pectinophora gossypiella* Saunders), шовкопряд непарний (*Lymantria dispar* Linnaeus), свердильник персиковий (*Carposina niponensis* Walsingham), міль фруктова смугаста (*Anarsia lineatella* Zeller), личинка виїмчатокрилої молі (*Phthorimaea operculella* Zeller), міль-строканка плодова нижньоостороння (*Lithocolletis blancardella* Fabricius), міль-мінер азіатська яблунева (*Lithocolletis ringoniella* Matsumura), рисова листовійка (*Lerodea eufala* Edwards), міль-мінер яблунева (*Leucoptera scitella* Zeller)); яйця, німфи та дорослі особини ряду Blattodea, включаючи тарганів з сімейств Blattellidae та Blattidae (наприклад, тарган чорний (*Blatta orientalis* Linnaeus), азіатський тарган (*Blattella asahinai* Mizukubo), тарган рижий (*Blattella germanica* Linnaeus), коричневосмугастий тарган (*Supella longipalpa* Fabricius), американський тарган (*Periplaneta americana* Linnaeus), коричневий тарган (*Periplaneta brunnea* Burmeister), мадейський тарган (*Leucophaea maderae* Fabricius)), димчастий коричневий тарган (*Periplaneta fidiginosa* Service), австралійський тарган (*Periplaneta australasiae* Fabr.), тарган сірий (*Nauphoeta cinerea* Olivier) та гладкий тарган (*Symptloce pollens* Stephens)); яйця, личинки та дорослі особини, що поїдають листя, плоди, коріння, насіння та везикулярні тканини, ряду Coleoptera, включаючи довгоносики з сімейств Anthribidae, Bruchidae та Curculionidae (наприклад, довгоносик бавовняний (*Anthonomus grandis* Boheman), довгоносик рисовий водяний (*Lissorhoptus oryzophilus* Kuschel), довгоносик амбарний (*Sitophilus granarius* Linnaeus), рисовий довгоносик (*Sitophilus oryzae* Linnaeus)), довгоносик тонконога однолітнього (*Listronotus maculicollis* Dietz), довгоносик тонконога (*Sphenophorus parvulus* Gyllenhal), мисливський довгоносик (*Sphenophorus venatus vestitus*), денверський довгоносик (*Sphenophorus cicatristriatus* Fahraeus)); земляні білшки, листоїди *Diabrotica*, личинки, що пошкоджують коріння, листоїди, колорадські жуки та молі-мінери вузьокрили в сімействі Chrysomelidae (наприклад, колорадський жук (*Leptinotarsa decemlineata* Say), західний кукурудзяний жук (*Diabrotica virgifera* LeConte)); хрущі та

інші жуки з сімейства Scarabaeidae (наприклад, хрущик японський (*Popillia japonica* Newman), хрущик східний (*Anomala orientalis* Waterhouse), *Exomala orientalis* (Waterhouse) Baraud), північний замаскований хрущ (*Cyclosperka borealis* Arrow), південний замаскований хрущ (*Cyclocephata immaculata* Olivier або *C. lurida* Bland), навозний жук та личинка хруща (*Aphodius* spp.), чорний газонний хрущ (*Ataenius spretulus* Haldeman), хрущ блискучий зелений (*Cotinis nitida* Linnaeus), хрущик азіатський садовий (*Maladera castanea* Arrow), майський/червневий хрущ (*Phyllophaga* spp.) та європейський хрущ (*Rhizotrogus majalis* Razoumowsky)); шкіроїди з сімейства Dermestidae; дротяники з сімейства Elateridae; короїди з сімейства Scolytidae та хрущаки великі мучні з сімейства Tenebrionidae. Крім того, агрономічні та неагрономічні шкідники включають: яйця, дорослі особини та личинки ряду Dermaptera, включаючи щипавки з сімейства Forficulidae (наприклад, щипавка звичайна (*Forficula auricularia* Linnaeus), чорна щипавка (*Chel* являє собою *Oches morio* Fabricius)); яйця, недорозвинуті, дорослі особини та німфи ряду Hemiptera та Homoptera, такі як слипняки з сімейства Miridae, цикади з сімейства Cicadidae, цикадки (наприклад, *Empoasca* spp.) з сімейства Cicadellidae, клопи постільні (наприклад, *Cimex lectularius* Linnaeus) з сімейства Cimicidae, дельфациди з сімейств Fulgoroidae та Delphacidae, горбатки з сімейства Membracidae, псилиди з сімейства Psyllidae, алейродиди з сімейства Aleyrodidae, попелиця з сімейства Aphididae, філоксера з сімейства Phylloxeridae, червеці з сімейства Pseudococcidae, кокциди з сімейств Coccidae, Diaspididae та Margarodidae, мереживниці з сімейства Tingidae, щитники з сімейства Pentatomidae, земляні клопи (наприклад, волосистий земляний клоп (*Blissus leucoptenis hirtus* Montandon) та південний земляний клоп (*Blissus insularis* Barber)) та інші наземники з сімейства Lygaeidae, пінніці з сімейства Cercopidae, клоп-ромбовник сумний з сімейства Coreidae і червоноклопи та червоноклопи бавовняні з сімейства Pyrrhocoridae. Також включені яйця, личинки, німфи та дорослі особини ряду Acari (кліщі), такі як кліщики павутинні та червоні кліщі в сімействі Tetranychidae (наприклад, кліщ червоний плодовий (*Panonychus ulmi* Koch); кліщик павутинний двоплямистий (*Tetranychus urticae* Koch), кліщ МакДенієла (*Tetranychus mcdanieli* McGregor)); плоскі кліщі в сімействі Tenuipalpidae (наприклад, цитрусовий плоский кліщ (*Brevipalpus lewisi* McGregor)); галові та брунькові кліщі в сімействі Eriophyidae та інші кліщі, що поїдають листя, та кліщі, важливі при охороні здоров'я людей та тварин, тобто пилові кліщі в сімействі Epidermoptidae, залізничні в сімействі Demodicidae, зернові кліщі в сімействі Glycyphagidae, іксодові кліщі в ряду Ixodidae (наприклад, червоно-коричневий кліщ (*Ixodes scapularis* Say), австралійський паразитуєчий кліщ (*Ixodes holocyclus* Neumann), іксодовий кліщ мінливий (*Dermacentor variabilis* Say), іксодовий кліщ *Amblyomma* (*Amblyomma americanum* Linnaeus)) та кінський і коростяний кліщі в сімействах Psoroptidae, Pyemotidae та Sarcoptidae; яйця, до-

рослі та недорозвинуті особини ряду Orthoptera, включаючи коники, сарану та цвіркуни (наприклад, мігруючі коники (наприклад, *Melanoplus sanguinipes* Fabricius, *M. differentialis* Thomas), сарана американська (наприклад, *Schistocerca americana* Drury), сарана пустельна (*Schistocerca gregaria* Forskal), сарана перелітна (*Locusta migratoria* Linnaeus), чагарникова сарана (*Zonocerus* spp.), цвіркун домашній (*Acheta domestica* Linnaeus), капустянки (наприклад, коричнево-жовта капустянка (*Scapteriscus vicinus* Scudder) та капустянка південна (*Scapteriscus borellii* Giglio-Tos)); яйця, дорослі та недорозвинуті особини ряду Diptera, включаючи моли-мінери вузькокрилі (наприклад, *Liriomyza* spp., такі як змієподібні рослинні моли-мінери (*Liriomyza sativae* Blanchard)), галіци, осетниці (Tephritidae), мушки шведські (наприклад, *Oscinella frit* Linnaeus), ґрунтові черв'яки, ґедзі (наприклад, *Musca domestica* Linnaeus), мухи кімнатні малі (наприклад, *Fannia canicularis* Linnaeus, *F. femoralis* Stein), жигалки осінні (наприклад, *Stomoxys calcitrans* Linnaeus), мухи польові, жигалки коров'ячі малі, мухи м'ясні сині (наприклад, *Chrysomya* spp., *Phormia* spp.) та інші мухоподібні двокрилі шкідники, ґедзі (наприклад, *Tabanus* spp.), носоглоткові ґедзі (наприклад, *Gastrophilus* spp., *Oestrus* spp.), бичачі ґедзі (наприклад, *Hypoderma* spp.), оленячі ґедзі (наприклад, *Chrysops* spp.), кровососкі овечі (наприклад, *Melophagus ovinus* Linnaeus) та інші Brachycera, москити (наприклад, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp.), мошки (наприклад, *Prosimulium* spp., *Sirnllhim* spp.), мокреці, мошки, комарикси та інші Nematocera; яйця, недорозвинуті та дорослі особини ряду Thysanoptera, включаючи трипси тютюнові (*Thrips tabaci* Lindeman), трипси звичайні (*Frankliniella* spp.), та інші трипси, що поїдають листя; комахи-шкідники ряду Hymenoptera, включаючи мурахи з сімейства Formicidae, включаючи флоридську мурашу-червицю (*Camponotus floridanus* Buckley), лісову рижу мурашу-червицю (*Camponotus ferrugineus* Fabricius), чорну мурашу-червицю (*Camponotus pennsylvanicus* De Geer), білоногу мурашу (*Technomyrmex albipes* fr. Smith), великоголові мурахи (*Pheidole* sp.), мурашу-привид (*Tapinoma melanoccephalum* Fabricius); фараонову мурашу (*Monomorium pharaonis* Linnaeus), вогняну мурашу малу (*Wasmannia auropunctata* Roger), вогняну мурашу (*Solenopsis geminata* Fabricius), лісову рижу вогняну мурашу (*Solenopsis invicta* Buren), аргентинську мурашу (*Iridomyrmex humilis* Mayr), великооку мурашу (*Paratrechina longicornis* Latreille), мурашу дернову [*Tetramorium caespitum* Linnaeus), мурашу садову білоногу (*Lasius alienus* Forster), пахучу мурашу-злодій домову (*Tapinoma sessile* Say). Інші Hymenoptera включаючи бджоли (включаючи бджоли-теслі), шершні, оси, оси справжні та пильщики (*Neodiprion* spp.; *Cephas* spp.); комахи-шкідники сімейства являє собою Optera, включаючи терміти в сімействах Termitidae (наприклад, *Macrotermes* sp., *Odontotermes obesus* Rambur), *Kalotermitidae* (наприклад, *Cryptotermes* sp.) та *Rhinotermitidae* (наприклад, *Reticulitermes* sp., *Coptotermes* sp., *Heierotermes tenuis* Hagen), терміт жовтоногий (*Reticulitermes flavipes* Kollar),

західний носатий терміт (*Reticulitermes hesperus* Banks), тайванський носатий терміт (*Coptotermes formosanus* Shiraki), тропічний сухостійний терміт (*Incisitermes immigrans* Snyder), терміт-деревогриз (*Cryptotermes brevis* Walker), сухостійний терміт (*Incisitermes snyderi* Light), південно-східний носатий терміт (*Reticulitermes virginicus* Banks), західний сухостійний терміт (*Incisitermes minor* Hagen), деревні терміти, такі як *Nasutitermes* sp. та інші терміти, що є економічно важливими; комахи-шкідники ряду Thysanura, такі як лусковиця (*Lepisma saccharina* Linnaeus) та лусковиця домашня (*Therniobia domestica* Packard); комахи-шкідники ряду Mallophaga та включаючи головну вошу (*Pediculus humanus capitis* De Geer), вошу платтяну (*Pediculus humanus* Linnaeus), курячу вошу (*Menacanthus stramineus* Nitsch), власоїд собачий (*Trichodectes canis* De Geer), пухоїд курячий строкаточеревний (*Goniocotes gallinae* De Geer), овечу вошу (*Bovicola ovis* Schrank), вошу коров'ячу коротконогу (*Haematopinus eurysternus* Nitzsch), вошу великої рогаї худоби довгоносу (*Linognathus vituli* Linnaeus) та інші сисні та жувальні паразитні воші, що атакують людину та тварин; комахи-шкідники ряду Siphonoptera, включаючи блоху щурячу південну (*Xenopsylla cheopis* Rothschild), блоху котячу (*Ctenocephalides felis* Bouche), блоху собачу (*Ctenocephalides canis* Curtis), блоху курячу (*Ceratophyllus gallinae* Schrank), блоху, що присмоктується (*Echidnophaga gallinacea* Westwood), блоху людську (*Pulex irritans* Linnaeus) та інші блохи, від яких страждають ссавці та птахи. Додаткові членистоногі шкідники включають: павуки в ряду Araneae, такі як коричневий павук пустельник (*Loxosceles reclusa* Gertsch & Mulaik) і павук чорна вдова (*Latrodectus mactans* Fabricius), та багатоніжки в ряду Scutigermorpha, такі як мухоловка звичайна (*Scutigera coleoptrata* Linnaeus). Сполуки за даним винаходом також мають активність на членів класів Nematoda, Cestoda, Trematoda та Acanthocephala, включаючи економічно важливі члени рядів Strongylida, Ascaridida, Oxyurida, Rhabditida, Spirurida та Enoplida, такі як, без обмеження, економічно важливі сільськогосподарські шкідники (тобто, яванські галові нематоди у виді *Meloidogone*, вражаючи нематоди у виді *Pratylenchus*, кремезні корінні нематоди у виді *Trichodorus*, тощо) та шкідники, що шкодять здоров'ю людей та тварин (тобто всі економічно важливі трематоди, стрічкові черв'яки та круглі черв'яки, такі *Strongylus vulgaris* у коней, *Toxocara canis* у собак, *Haemonchus contortus* у вівці, *Dirofilaria immitis* Leidy у собак, *Anoplocephala perfoliata* у коней, *Fasciola hepatica* Linnaeus у жуйних тварин, тощо).

Сполуки за винаходом виявляють особливу високу активність проти шкідників в ряду Lepidoptera (наприклад, *Alabama argillacea* Hubner (бавовняна совка), *Archips argyrospila* Walker (листовійка плодівих дерев), *A. rosana* Linnaeus (листовійка різана золотиста) та інші види *Archips*, *Chilo suppressalis* Walker (свердлильник рисовий стовбурний), *Snaphalocrosis medinalis* Guenee (листовійка рисова), *Crambus caliginosellus* Clemens (зерновий кореневий метелик), *Crambus teterrellus*

Zincken (метелик тонконогий), *Cydia pomonella* Linnaeus (плодожерка яблунева), *Earias insulana* Boisduval (шипуватий черв'як), *Earias vittella* Fabricius (совка плямиста), *Helicoverpa armigera* Hubner (совка бавовняна), *Helicoverpa zea* Boddie (гусениця совки бавовняної американської), *Heliothis virescens* Fabricius (листовійка тютюнова), *Herpetogramma licarsalis* Walker (лугові метелики), *Lobesia botrana* Denis & Schiffmuller (листовійка виноградна), *Pectinophora gossypiella* Saunders (рожевий коробковий черв'як бавовнику), *Phyllocnistis citrella* Stainton (міль-мінер вузькокрила цитрусова), *Pieris brassicae* Linnaeus (білан капустяний), *Pieris rapae* Linnaeus (білан ріпний), *Phitella xylostella* Linnaeus (міль капустяна), *Spodoptera exigua* Hubner (совка мала), *Spodoptera litura* Fabricius (совка тютюнова, кластерна гусениця), *Spodoptera frugiperda* J. E. Smith (совка трав'яна), *Trichoplusia ni* Hubner (совка ні) та *Tuta absoluta* Meyrick (міль-мінер вузькокрила томатна)).

Сполуки за винаходом також виявляють значну активність на членів з ряду Homoptera, включаючи: *Acyrtosiphon pisum* Harris (попелиця горохова), *Aphis craccivora* Koch (попелиця люцернова чорна), *Aphis fabae* Scopoli (попелиця бурячна), *Aphis gossypii* Glover (попелиця бавовняна, попелиця баштанна), *Aphis pomi* De Geer (попелиця яблунно-подорожникова), *Aphis spiraeicola* Patch (попелиця спірея), *Aulacorthum solani* Kaltenbach (попелиця картопляна звичайна), *Chaetosiphon fragaefolii* Cockerell (попелиця сунична американська), *Diuraphis noxia* Kurdjumov/Mordvilko (російська пшенична попелиця), *Dysaphis plantaginea* Raaserini (попелиця яблунева рожева), *Eriosoma lanigerum* Hausmann (попелиця яблунева кров'яна), *Hyalopterus pruni* Geoffroy (попелиця борошніста очеретяна), *Lipaphis erysimi* Kaltenbach (попелиця горчична листяна), *Metopolophium dirhodum* Walker (попелиця велика злакова), *Macrosiphum euphorbiae* Thomas (попелиця картопляна велика), *Myzus persicae* Sulzer (попелиця персиково-картопляна велика, попелиця персикова зелена), *Nasonovia ribisnigri* Mosley (попелиця цикорієво-смородинна), *Pemphigus* spp. (коренеплідна попелиця та галоутворююча попелиця), *Rhopalosiphum maidis* Fitch (попелиця кукурудзяна листяна), *Rhopalosiphum padi* Linnaeus (попелиця черемхова звичайна), *Schizaphis graminum* Rondani (попелиця злакова звичайна), *Sitobion avenae* Fabricius (попелиця злакова), *Therioaphis maculata* Buckton (попелиця конюшинна), *Toxoptera aurantii* Boyer de Fonscolombe (попелиця чайна) та *Toxoptera citricida* Kirkaldy (попелиця цитрусова); *Adelges* spp. (хермеси); *Phylloxera devastatrix* Pergande (філоксера гікори); *Bemisia tabaci* Gennadius (білан тютюновий, білан бататовий), *Bemisia argentifolii* Bellows & Perring (білан сріблястий), *Dialeurodes citri* Ashmead (білан цитрусовий) та *Trialeurodes vaporariorum* Westwood (білан тепличний); *Empoasca fabae* Harris (цикадка картопляна), *Laodelphax striatellus* Fallen (цикадка темна), *Macrolestes quadrilineatus* Forbes (цикадка астрова), *Nephotettix cincticeps* Uhler (цикадка зелена), *Nephotettix nigropictus* Stal (цикадка рисова),

Nilaparvata lugens Stal (цикадка темна), *Peregrinus maidis* Ashmead (цикадка кукурудзяна), *Sogatella furcifera* Horvath (цикадка білоспинна), *Sogatodes orizicola* Muir (рисовий дельфацид), *Typhlocyba pomaria* McAtee (цикадка яблунева), *Erythroneoura* spp. (виноградна цикадка); *Magacidada septendecim* Linnaeus (періодична цикадка); *Icerya purchasi* Maskell (червець австралійський жолобчастий), *Quadraspidiotus perniciosus* Comstock (щитовка каліфорнійська); *Planococcus citri* Risso (борошністий червець виноградинний); *Pseudococcus* spp. (інший комплекс борошністих червців); *Sacopsylla pyricola* Foerster (листоблошка грушева жовта), *Trioza diospyri* Ashmead (листоблошка хурмова).

Сполуки за даним винаходом також мають активність на членів з ряду Hemiptera, включаючи: *Acroslemum hilare* Say (щитники), *Anasa tristis* De Geer (клоп-ромбовник сумний), *Blissus leucopterus leucopterus* Say (клоп-черепаха пшеничний північноамериканський), *Cimex lectularius* Linnaeus (клоп постільний), *Corythuca gossypii* Fabricius (клоп бавовняний), *Cyrtopeltis modesta* Distant (клоп томатний), *Dysdercus suturellus* Herrich-Schaffer (червоноклоп бавовняний), *Euchistus servus* Say (булавник темний), *Euchistus variolarius* Pal являє собою *Ot de Beauvois* (булавник однокрапковий), *Graptostethus* spp. (комплекс наземників), *Leptoglossus corculus* Say (краєвик сосновий), *Lygus lineolaris* Pal являє собою *Ot de Beauvois* (клоп трав'яний), *Nezara viridula* Linnaeus (булавник зелений південний), *Oebalus pugnax* Fabricius (рисовий булавник), *Oncopeltus fasciatus* Dallas (клоп-солдатик), *Pseudatomoscelis seriatus* Reuter (бавовняні блохи). Інші ряди комах, контрольовані за допомогою сполук за винаходом, включають *Thysanoptera* (наприклад, *Frankliniella occidentalis* Pergande (західний квітковий трипс), *Scirtothrips citri* Moulton (цитрусовий трипс), *Sericothrips variabilis* Вколений (соєвий трипс) та *Thrips tabaci* Lindeman (тютюновий трипс); та ряд *Coleoptera* (наприклад, *Leptinotarsa decemlineata* Say (коларадський жук), *Epilachna varivestis* Mulsant (мексиканський бобовий жук) та проволочники роду *Agriotes*, *Athous* або *Limonius*).

Слід зазначити, що в деяких сучасних системах класифікації Homoptera розміщено як підряд ряду Hemiptera.

Прикладом є застосування сполук за даним винаходом для боротьби з біланом сріблястим (*Bemisia argentifolii*). Прикладом є застосування сполук за даним винаходом для боротьби із західним квітковим трипсом (*Frankliniella occidentalis*). Прикладом є застосування сполук за даним винаходом для боротьби з цикадкою картопляною (*Empoasca fabae*). Прикладом є застосування сполук за даним винаходом для боротьби з цикадою кукурудзяною (*Peregrinus maidis*). Прикладом є застосування сполук за даним винаходом для боротьби з попелицею бавовняною (*Aphis gossypii*). Прикладом є застосування сполук за даним винаходом для боротьби з попелицею персиково-картопляною великою (*Myzus persicae*). Прикладом є застосування сполук за даним винаходом для боротьби з міллю капустяною (*Plutella*

xylostella). Прикладом є застосування сполук за даним винаходом для боротьби з совкою трав'яною (*Spodoptera frugiperda*).

Сполуки за даним винаходом також можуть бути змішані з однією або більше іншими біологічно активними сполуками або агентами, включаючи інсектициди, фунгіциди, нематодициди, бактерициди, акарициди, гербіциди, регулятори росту, такі як стимулятори укорінення, хімічні стерилізатори, напівхімікати, репеленти, аттрактанти, феромони, стимулятори споживання, інші біологічно активні сполуки або ентомопатогенні бактерії, вірус або грибки з одержанням багатокомпонентного пестициду, що надає навіть більш широкий спектр сільськогосподарського та несільськогосподарського використання. Таким чином, даний винахід також відноситься до композиції, що містить біологічно ефективну кількість сполуки Формули 1, її N-оксиду або солі та ефективну кількість, принаймні, однієї додаткової біологічно активної сполуки або агента, та може, крім того, містити, принаймні, один компонент, вибраний з поверхнево-активної речовини, твердого розріджувача або рідкого розріджувача. Інші біологічно активні сполуки або агенти можуть бути виготовлені в композиціях, що містять, принаймні, один компонент, вибраний з поверхнево-активної речовини, твердого або рідкого розріджувача. Для сумішей за даним винаходом, інші біологічно активні сполуки або агенти можуть бути виготовлені разом з даними сполуками, включаючи сполуки Формули 1, з одержанням попередньо змішаної суміші, або інші біологічно активні сполуки або агенти можуть бути виготовлені окремо від даних сполук, включаючи сполуки Формули 1, та дві препаративні форми об'єднують разом перед використанням (наприклад, в розпилювачі) або, альтернативно, застосовують по черзі.

Інші біологічно активні сполуки або агенти, що використовуються в композиціях за даним винаходом, можуть бути вибрані з агентів для боротьби з безхребетними шкідниками, що мають інший спосіб дії або належать до іншого хімічного класу, включаючи модулятори натрієвих каналів, антихолінергічні засоби, неонікотиніди, інсектицидні макроциклічні лактони, GABA (γ -амінобутанова кислота)-регульовані блокатори хлоридних каналів, інгібітори синтезу хітину, ювенільні гормональні міметики, ліганди рецептора октопаміну, агоністи екдизону, ліганди рецептору ріанодину, аналоги неріізотоксину, інгібітори мітохондріального переносу електронів, інгібітори біосинтезу ліпідів, циклодієнові інсектициди, інгібітори линяння та біологічні агенти, що включають нуклеополігедровірус (NPV), член *Bacillus thuringiensis*, інкапсульований дельта-ендотоксин *Bacillus thuringiensis*; та природний або генномодифікований вірусний інсектицид.

Прикладом є композиція за даним винаходом, в якій, принаймні, одна додаткова біологічно активна сполука або агент вибрані з інсектицидів з групи, що включає модулятори натрієвих каналів, антихолінергічні засоби, неонікотиніди, інсектицидні макроциклічні лактони, GABA-регульовані блокатори хлоридних каналів, інгібітори синтезу

хітину, ювенільні гормональні міметики, ліганди рецептора октопаміну, агоністи екдизону, ліганди рецептору ріанодину, аналоги неріізотоксину, інгібітори мітохондріального переносу електронів, інгібітори біосинтезу ліпідів, циклодієнові інсектициди, інгібітори линяння та біологічні агенти, включаючи нуклеополігедровірус, член *Bacillus thuringiensis*, інкапсульований дельта-ендотоксин *Bacillus thuringiensis*; та природний або генномодифікований вірусний інсектицид.

Прикладом є додаткова біологічно активна сполука або агент, вибрані з інсектицидів з групи, що включає модулятори натрієвих каналів, антихолінергічні засоби, неонікотиніди, інсектицидні макроциклічні лактони, GABA-регульовані блокатори хлоридних каналів, інгібітори синтезу хітину, ювенільні гормональні міметики, ліганди рецептора октопаміну, агоністи екдизону, ліганди рецептору ріанодину, аналоги неріізотоксину, інгібітори мітохондріального переносу електронів, інгібітори біосинтезу ліпідів, циклодієнові інсектициди, нуклеополігедровірус; член *Bacillus thuringiensis*, інкапсульований дельта-ендотоксин *Bacillus thuringiensis*; та природний або генномодифікований вірусний інсектицид.

Крім того, прикладами є додаткові біологічно активні сполуки або агенти, вибрані з інсектицидів з групи, що включає іретроїди, карбамати, неонікотиніди, блокатори пейронних натрієвих каналів, інсектицидні макроциклічні лактони, антагоністи γ -амінобутанової кислоти, інсектицидні сечовини та ювенільні гормональні міметики, член *Bacillus thuringiensis*, *Bacillus thuringiensis* дельта-ендотоксин та природний або генномодифікований вірусний інсектицид.

Приклади таких біологічно активних сполук або агентів, з якими можуть бути виготовлені сполуки за даним винаходом, включають: інсектициди, такі як абамектин, ацефат, ацетаміпрід, ацетопрол, амідифлумет (S-1955), авермектин, азадирахтин, азинфос-метил, біфентрин, біфеназат, бупрофезин, бістрифлурон, бупрофезин, карбофуран, картап, хлорфенапір, хлорфлуазурон, хлорантраніліпрол (DPX-E2Y45), хлорпірифос, хлорпірифос-метил, хромафенозид, клотіанідин, цифлуметофен, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, гама-цигалотрин, лямбда-цигалотрин, циперметрин, циромацин, дельтаметрин, діафентіурон, діазинон, діельдрин, дифлубензурон, димефлутрин, диметоат, динотефуран, діофенолан, емаектин, ендосульфат, есфенвалерат, етіпрол, фенотіокарб, феноксикарб, фенпропатрин, фенвалерат, фіпроніл, флонікамід, флубендіамід, флуцитринат, тау-флувалінат, флуфенерим (UR-50701), флуфеноксурон, фонофос, галофенозид, гексафлумурон, гідраметилнон, імідаклопрід, індоксакарб, ізофенфос, луфенурон, малатіон, метафлумізон, метальдегід, метамідофос, метідатіон, метоміл, метопрен, метоксихлор, метофлутрин, монокротофос, метоксифенозид, монокротофос, нітенпірам, нітіазин, новалурон, новіфлумурон (XDE-007), оксаміл, паратіон, паратіон-метил, перметрин, форат, фосалон, фосмет, фосфамідон, піримікарб, профенофос, профлутрин, протрифенбут, піметрозин, пірафлупрол, піретрин, пірида-

ліл, пірифлухіназон, пірипрол, пірипроксифен, ротенон, ріанодин, спінеторам, спіносад, спіродиклофен, спіромезифен (BSN 2060), спіротетрамат, сульпрофос, тебуфенозид, тefлубензулон, тefлутрин, тербуфос, тетрафлорвінфос, тіаклоприд, тіаметоксам, тіодикарб, тіосульфат-натрій, толфенпірад, тралометрин, триазамат, трихлорфон та трифлумурон; фунгіциди, такі як ацибензолар, альдиморф, амисульбром, азаконазол, азоксистробін, беналаксил, беноміл, бентіавалікарб, бентіавалікарб-ізопропіл, біноміал, біфеніл, бітертанол, бластицидин-S, бордоська рідина (триосновний сульфат міді), боскалід/нікобіфен, бромуконазол, бупіримат, бутіобат, карбоксин, карпропамід, каптафол, каптан, карбендазим, хлоронекс, хлороталоніл, хлоролінат, клотримазол, оксихлорид міді, солі міді, такі як сульфат міді та гідроксид міді, ціазофамід, цифлутрин, цимоксаніл, ципроконазол, ципродиніл, дихлофлуанід, диклоцимет, дикломезин, диклоран, діетофенкарб, дифенокназол, диметоморф, димоксистробін, диніконазол, диніконазол-М, динокап, дискостробін, дитіанон, додеморф, додин, еконазол, етаконазол, едифенфос, епоксиконазол, етакотам, етиримол, етридіазол, фамоксадон, фенамідон, фенаримол, фенбуконазол, фенкарсамід, фенфурам, фенгексамід, феноксаніл, фенпіклол, фенпропідин, фенпропіморф, ацетат фентину, гідроксид фентину, фербам, ферфурозат, феримзон, флуазинам, флудіоксоніл, флуметовер, флуопіклол, флуоксастробін, флухінокназол, флухінокназол, флусилазол, флусульфамід, флутоланіл, флутриафол, фолпет, фозетил-алюміній, фуберидазол, фуралаксил, фураметалпир, гексаконазол, гімексаконіл, гуазатин, імазаліл, імібенконазол, іміноктадин, іодикарб, іпконазол, іпробенфос, іпродіон, іпровалікарб, ізоконазол, ізопротіолан, касугаміцин, крезоксим-метил, манкоцеб, мандипропамід, манеб, мапаніпирин, мефеноксам, мепроніл, металаксил, метконазол, метасульфоксид, метирам, метоміностробін/феноміностробін, мепаніпирин, метрафенон, міконазол, міклобутаніл, нео-азоцин (метанарсонат заліза), нуаримол, октилінон, офурац, орисастробін, оксаксидил, оксолінова кислота, окспокназол, оксикарбоксин, паклобутразол, пенконазол, пенцифлурон, пентіопірад, перфурозат, фосфорна кислота, фталід, пікобенізамід, пікоксистробін, поліоксин, пробеназол, прохлораз, процімідон, пропамоксид, пропамоксид-гідрохлорид, пропіконазол, пропінеб, прохіназид, протіокназол, піраклостробін, піразофос, пірифенокс, піриметаніл, пірифенокс, піролінтрин, пірохілон, хінконазол, хіноксифен, хінтозен, силтіофам, симеконазол, спіроксамін, стрептоміцин, сірка, тебуконазол, теклофталам, текназен, тетраконазол, тіабендазол, тіфлузамід, тіофанат, тіофанат-метил, тірам, тіадиніл, толклофос-метил, толіфлуанід, триадимефон, триадименол, триаримол, триазоксид, тридеморф, триморфамід, трициклазол, трифлорсистробін, трифорин, тритіконазол, уніконазол, валідаміцин, вінклозолін, цинеб, цирам та зоксамід; нематоциди, такі як алдикарб, іміціафос, оксаміл та фенаміфос; бактеріциди, такі як стрептоміцин; акарициди, такі як амітраз, хінометіонат, хлорбензилат, цигексатин, дикофол, діенохлор,

етоксаконіл, феназахін, оксид фенбутатину, фенпропатрин, фенпроксимат, гекситіазокс, пропаргіт, піридабен та тебуфенпірад; та біологічні агенти, включаючи ентомопатогенні бактерії, такі як *Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*, та інкапсульовані дельта-ендотоксини *Bacillus thuringiensis* (наприклад, Cellcap, MPV, MPVII); ентомопатогенні грибки, такі як зелені мускардинні грибки; та ентомопатогенний вірус, включаючи бакуловірус, нуклеополігедровірус (NPV), такий як *Helicoverpa zea* нуклеополігедровірус (HzNPV), *Anagrapha falcifera* нуклеополігедровірус (AfNPV); та гранульоз-вірус (GV), такий як *Cydia pomonella* гранульоз-вірус (CpGV).

Сполуки за даним винаходом та їх композиції можуть застосовуватися до рослин, які генномодифіковані, щоб експресувати протеїни, токсичні для безхребетних шкідників (такі як *Bacillus thuringiensis* дельта-ендотоксини). Ефект екзогенного застосування сполук за даним винаходом для боротьби з безхребетними шкідниками може бути синергічним з експресованими тосичними протеїнами.

Загальні посилання для цих сільськогосподарських захисних агентів (тобто інсектицидів, фунгіцидів, нематоцидів, акарицидів, гербіцидів та біологічних агентів) включають *The Pesticide Manual*, 13th Edition, C. D. S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2003 та *The BioPesticide Manual*, 2nd Edition, L. G. Copping, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2001.

Прикладом є композиція за даним винаходом, в якій, принаймні, одна додаткова біологічно активна сполука або агент вибрані з групи, що включає абамектин, ацефат, ацетаміприд, ацетопрол, алдикарб, амідофлумет, амітраз, авермектин, азадирахтин, азінфос-метил, біфентрин, біфеназат, бістріфлурон, бупрофезин, карбофуран, картап, хінометіонат, хлорфенапір, хлорфлуазурон, хлорантраніліпрол, хлорпірифос, хлорпірифос-метил, хлоробензилат, хромафенозид, клотіанідин, цифлуметофен, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, гама-цигалотрин, лямбда-цигалотрин, цигексатин, циперметрин, циромазин, дельтаметрин, діафентіурон, діазинон, дикофол, діельдрин, діенохлор, дифлубензулон, димефлутрин, диметоат, динотетуран, діофенолан, емаектин, ендосульфат, есфенвалерат, етіпрол, етоксаконіл, фенаміфос, феназахін, оксид фенбутатину, фенотіокарб, феноксикарб, фенпропатрин, фенпроксимат, фенвалерат, фіпроніл, флонікамід, флубендіамід, флуцитринат, тау-флувалінат, флуфенерим, флуфеноксурон; фонофос, галофенозид, гексафлумурон, гекситіазокс, гідраметилнон, іміціафос, імідаклоприд, індоксакарб, ізофенфос, луфенурон, малатіон, метафлумізон, металдегід, метамідофос, метідаціон, метоміл, метопрен, метоксифлор, метоксифенозид, метофлутрин, монокротофос, нітенпірам, нітіазин, новалурон, новіфлумурон, оксаміл, паратіон, паратіон-метил, перметрин, форат, фосалон, фосмет, фосфамідон, піримікарб, профенофос, профлутрин, пропаргіт, протрифенбут, піметрозин, пірафлупрол, піретрин, піридабен,

піридаліл, пірифлухіазон, пірипрол, пірипрокси-
фен, ротенон, ріанодин, спінеторам, спіносад, спі-
ридиклофен, спіромезифен, спіротетрамат, сульп-
рофос, тебуфенозид, тебуфенпірад, тефлубензу-
рон, тефлутрин, тербуфос, тетрахлор-
вінфос, тіаклоприд, тіаметоксам, тіодикарб, тіосу-
льтап-натрій, толфенпірад, тралометрин, триаза-
мат, трихлорфон, трифлумурон, *Bacillus*
thuringiensis subsp. *aizawai*, *Bacillus thuringiensis*
subsp. *kurstaki*, нуклеополігедровірус, інкапсульо-
ваний дельта-ендотоксин *Bacillus thuringiensis*,
бакуловірус, ентомопатогенні бактерії, ентомопа-
тогенний вірус та ентомопатогенні грибки.

Також прикладом є композиція за даним вина-
ходом, в якій, принаймні, одна додаткова біологіч-
но активна сполука або агент вибрані з групи, що
включає абабектин, ацетаміприд, амітраз, авер-
мектин, азадирахтин, біфентрин, бупрофезин, кар-
тап, хлорантраніліпрол, хлорфенапір, хлорпіри-
фос, клотіанідин, цифлутрин, бета-цифлутрин,
цигалотрин, лямбда-цигалотрин, циперметрин,
циромазин, дельтаметрин, діельдрин, динотефу-
ран, діофенолан, емабектин, ендосульфат, есфе-
нвалерат, етіпрол, фенотіокарб, феноксикарб,
фенвалерат, фіпроніл, флонікамід, флубендіамід,
флуфеноксурон, гексафлумурон, гідраметилнон,
імідаклоприд, індоксакарб, луфенурон, метафлу-
мізон, метоміл, метопрен, метоксифенозид, нітен-
пірам, нітіазин, новалурон, оксаміл, піметрозин,
піретрин, піридабен, піридаліл, пірипрокси-
фен, ріанодин, спінеторам, спіносад, спіродиклофен,
спіромезифен, тебуфенозид, тіаклоприд, тіаметок-
сам, тіодикарб, тіосультап-натрій, тралометрин,
триазамат, трифлумурон, *Bacillus thuringiensis*
subsp. *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*,
нуклеополігедровірус та інкапсульований дельта-
ендотоксин *Bacillus thuringiensis*.

Для втілень, в яких використовуються один
або більше цих різних змішаних компонентів, ма-
сове співвідношення цих різних змішаних компо-
нентів (загалом) до сполуки Формули 1 звичайно
складає від приблизно 1:3000 до приблизно
3000:1. На увагу заслуговують масові співвідно-
шення від приблизно 1:300 до приблизно 300:1
(наприклад, співвідношення від приблизно 1:30 до
приблизно 30:1). Фахівець в даній галузі техніки
легко може визначити шляхом простого експери-
ментування біологічно ефективні кількості актив-
них інгредієнтів, необхідні для бажаного спектру
біологічної активності. Буде очевидно, що вклю-
чення цих додаткових компонентів може розшири-
ти спектр безхребетних шкідників, з якими борють-
ся, порівняно зі спектром безхребетних шкідників,
з якими борються за допомогою тільки сполуки
Формули 1.

В певних прикладах, комбінації сполуки за да-
ним винаходом з іншими біологічно активними
(зокрема, для боротьби з безхребетними шкідни-
ками) сполуками або агентами (тобто, активними
інгредієнтами) можуть привести до більшого, ніж
адитивний (тобто, синергічного), ефекту. Завжди

бажано знизити кількість хімічних агентів, що над-
ходять до навколишнього середовища, одночасно
забезпечуючи ефективну боротьбу зі шкідниками.
Коли при інтервалах застосування, що надають
агрономічно задовільні рівні боротьби зі шкідни-
ками, має місце синергізм активних інгредієнтів для
боротьби з безхребетними шкідниками, такі комбі-
нації можуть бути вигідні для зменшення собівар-
тості урожаю та зниження навантаження на навко-
лишнє середовище.

Прикладом є комбінація сполуки Формули 1 з,
принаймні, одним іншим активним інгредієнтом
для боротьби з безхребетними шкідниками. Конкрет-
ним прикладом є така комбінація, в якій інший
активний інгредієнт для боротьби з безхребетними
шкідниками має місце дії, відмінне від місця дії
сполуки Формули 1. В певних прикладах особливо
корисною для контролю резистентності буде ком-
бінація, принаймні, з одним іншим активним інгре-
дієнтом для боротьби з безхребетними шкідни-
ками, що має подібний спектр контролю, але інше
місце дії. Таким чином, композиція за даним вина-
ходом може, крім того, містити біологічно ефекти-
вну кількість, принаймні, одного додаткового акти-
вного інгредієнта для боротьби з безхребетними
шкідниками, що має подібний спектр контролю,
але інше місце дії. Контактуювання рослини, генно-
модифікованої, щоб експресувати сполуку для
боротьби з безхребетними шкідниками (напри-
клад, протеїн), або місцезнаходження рослини з
біологічно ефективною кількістю сполуки за даним
винаходом також можуть забезпечити більш ши-
рокий спектр захисту рослин та бути вигідними для
контролю резистентності.

В Таблиці А наведені конкретні комбінації спо-
луки Формули 1 з іншими агентами для боротьби з
безхребетними шкідниками, що ілюструють суміші,
комбінації та способи за даним винаходом. В пер-
шій колонці Таблиці А наведені конкретні агенти
для боротьби з безхребетними шкідниками (на-
приклад, "Абабектин" в першому рядку). В другій
колонці Таблиці А наведений спосіб дії (якщо ві-
домо) або хімічний клас агентів для боротьби з
безхребетними шкідниками. В третій колонці Таб-
лиці А наведені втілення діапазонів масових спів-
відношень для інтервалів, в яких може застосову-
ватися агент для боротьби з безхребетними
шкідниками, щодо сполуки Формули 1, її N-оксиду
або солі, (наприклад, "від 50:1 до 1:50" абабектину
щодо сполуки Формули 1 на масу). Таким чином,
наприклад, в першому рядку Таблиці А конкретно
розкрито комбінацію сполуки Формули 1 з абабек-
тином, яка може застосовуватися при масовому
співвідношенні від 50:1 до 1:50. Інші рядки Таблиці
А слід аналізувати так само. Крім того, в Таблиці А
наведені конкретні комбінації сполуки Формули 1 з
іншими агентами для боротьби з безхребетними
шкідниками, які ілюструють суміші, композиції та
способи за даним винаходом, та включені додат-
кові втілення діапазонів масового співвідношення
для інтервалів застосування.

Таблиця А

Агент для боротьби з безхребетними шкідниками	Спосіб дії або хімічний клас	Типове масове співвідношення
Абамектин	макроциклічні лактони	від 50:1 до 1:50
Ацетаміприд	неонікотиноїди	від 150:1 до 1:200
Амітраз	ліганди рецептора октопаміну	від 200:1 до 1:100
Авермектин	макроциклічні лактони	від 50:1 до 1:50
Азадирахтин	агоністи екдизону	від 100:1 до 1:120
Бета-цифлутрин	модулятори натрієвих каналів	від 150:1 до 1:200
Біфентрин	модулятори натрієвих каналів	від 100:1 до 1:10
Бупрофезин	інгібітори синтезу хітину	від 500:1 до 1:50
Картап	аналоги нерейтоксину	від 100:1 до 1:200
Хлорантраніліпрол	ліганди рецептору ріанодину	від 100:1 до 1:120
Хлорфенапір	інгібітори мітохондріального переносу електронів	від 300:1 до 1:200
Хлорпірифос	антихолінестеразні засоби	від 500:1 до 1:200
Клотіанидин	неонікотиноїди	від 100:1 до 1:400
Цифлутрин	модулятори натрієвих каналів	від 150:1 до 1:200
Цигалотрин	модулятори натрієвих каналів	від 150:1 до 1:200
Циперметрин	модулятори натрієвих каналів	від 150:1 до 1:200
Циромацин	інгібітори синтезу хітину	від 400:1 до 1:50
Дельтаметрин	модулятори натрієвих каналів	від 50:1 до 1:400
Діельдрин	циклодієнові інсектициди	від 200:1 до 1:100
Динотефуран	неонікотиноїди	від 150:1 до 1:200
Діофенолан	інгібітор линяння	від 150:1 до 1:200
Емаектин	макроциклічні лактони	від 50:1 до 1:10
Ендосульфат	циклодієнові інсектициди	від 200:1 до 1:100
Есфенвалерат	модулятори натрієвих каналів	від 100:1 до 1:400
Етіпрол	GABA-регульовані блокатори хлоридних каналів	від 200:1 до 1:100
Фенотіокарб		від 150:1 до 1:200
Феноксикарб	ювенільні гормональні міметики	від 500:1 до 1:100

Фенвалерат	модулятори натрієвих каналів	від 150:1 до 1:200
Фіпроніл	GABA-регульовані блокатори хлоридних каналів	від 150:1 до 1:100
Флонікамід		від 200:1 до 1:100
Флубендіамід	ліганди рецептора ріанодину	від 100:1 до 1:120
Флуфеноксурон	інгібітори синтезу хітину	від 200:1 до 1:100
Гексафлумурон	інгібітори синтезу хітину	від 300:1 до 1:50
Гідраметилнон	інгібітори мітохондріального переносу електронів	від 150:1 до 1:250
Імідаклоприд	неонікотинοїди	від 1000:1 до 1:1000
Індоксакарб	модулятори натрієвих каналів	від 200:1 до 1:50
Ламбда-цигалотрин	модулятори натрієвих каналів	від 50:1 до 1:250
Луфенурон	інгібітори синтезу хітину	від 500:1 до 1:250
Метафлумізон		від 200:1 до 1:200
Метоміл	антихолінестеразні засоби	від 500:1 до 1:100
Метопрен	ювенільні гормональні міметики	від 500:1 до 1:100
Метоксифенозид	агоністи екдизону	від 50:1 до 1:50
Нітенпірам	неонікотинοїди	від 150:1 до 1:200
Нітіазин	неонікотинοїди	від 150:1 до 1:200
Новалурон	інгібітори синтезу хітину	від 500:1 до 1:150
Оксаміл	антихолінестеразні засоби	від 200:1 до 1:200
Піметрозин		від 200:1 до 1:100
Піретрин	модулятори натрієвих каналів	від 100:1 до 1:10
Піридабен	інгібітори мітохондріального переносу електронів	від 200:1 до 1:100
Піридаліл		від 200:1 до 1:100
Пірипроксифен	ювенільні гормональні міметики	від 500:1 до 1:100
Ріанодин	ліганди рецептору ріанодину	від 100:1 до 1:120
Спінеторам	макроциклічні лактони	від 150:1 до 1:100
Спіносад	макроциклічні лактони	від 500:1 до 1:10
Спіродиклофен	інгібітори біосинтезу ліпідів	від 200:1 до 1:200
Спіромезифен	інгібітори біосинтезу ліпідів	від 200:1 до 1:200

Тебуфенозид	агоністи екдизону	від 500:1 до 1:250
Тіаклоприд	неонікотинοїди	від 100:1 до 1:200
Тіаметоксам	неонікотинοїди	від 1250:1 до 1:1000
Тіодикарб	антихолінергастазні засоби	від 500:1 до 1:400
Тіосультап-натрій		від 150:1 до 1:100
Тралометрин	модулятори натрієвих каналів	від 150:1 до 1:200
Триазамат	антихолінергастазні засоби	від 250:1 до 1:100
Трифлумурон	інгібітори синтезу хітину	від 200:1 до 1:100
<i>Bacillus thuringiensis</i>	біологічні агенти	від 50:1 до 1:10
<i>Bacillus thuringiensis</i> дельта токсин	біологічні агенти	від 50:1 до 1:10
NPV (тобто, Gemstar)	біологічні агенти	від 50:1 до 1:10

Одне втілення агентів для боротьби з безхребетними шкідниками (наприклад, інсектицидів та акарицидів) для змішування зі сполуками за даним винаходом включає модулятори натрієвих каналів, такі як біфентрин, циперметрин, цигалотрин, лямбда-цигалотрин, цифлутрин, бета-цифлутрин, дельтаметрин, димефлутрин, есфенвалерат, фенвалерат, індоксакарб, метофлутрин, профлутрин, піретрин та тралометрин; антихолінергастазні засоби, такі як хлорпірифос, метоміл, оксаміл, тіодикарб та триазамат; неонікотинοїди, такі як ацетаміприд, клотіанідин, динотефурон, імідаклоприд, нітенпірам, нітіазин, тіаклоприд та тіаметоксам; інсектицидні макроциклічні лактони, такі як спіне-торам, спіносад, абамектин, авермектин та емаме-ктин; GABA (γ -амінобутанова кислота)-регульовані блокатори хлоридних каналів, такі як ендосуль-фан, етіпрол та фіпроніл; інгібітори синтезу хітину, такі як бупрофезин, циромазин, флуфеноксурон, гексафлумурон, луфенурон, новалурон, новіфлу-мурон та трифлумурон; ювенільні гормональні міметики, такі як діофенолан, феноксикарб, мето-прен та пірипроксифен; ліганди рецептора окто-паміну, такі як амітраз; агоністи екдизону, такі як азадирахтин, метоксифенозид та тебуфенозид; ліганди рецептора ріанодину, такі як ріанодин, антранілові діаміди, такі як хлорантраніліпрол (див. патент US 6,747,047, публікації PCT WO 2003/015518 та WO 2004/067528) та флубендіамід (див. патент US 6,603,044); аналоги нереізотокси-ну, такі як картап; інгібітори мітохондріального пе-реносу електронів, такі як хлорфенапір, гідраме-тиллон та піридабен; інгібітори біосинтезу ліпідів, такі як спіродиклофен та спіромезифен; циклодіс-нові інсектициди, такі як діельдрин; цифлумето-фен; фенотіокарб; флонікамід; метафлумізон; пі-рафлупрол; піридаліл; пірипрол; піметрозин; спіротетрамат; та тіосультап-натрій. Одне втілен-

ня біологічних агентів для змішування зі сполуками за даним винаходом включає нуклеополігедрові-рус, такий як HzNPV та AfNPV; *Bacillus thuringiensis* та інкапсульовані дельта-ендотоксини *Bacillus thuringiensis*, такі як Cellcap, MPV та MPVII; а також, як природні, так і генномодифіковані віру-сні інсектициди, що включають члени сімейства *Baculoviridae*, а також ентомофільні грибки. Прик-ладом є композиція за даним винаходом, в якій, принаймні, одна додаткова біологічно активна сполука або агент вибрані з агентів для боротьби з безхребетними шкідниками, наведеними в Таблиці А вище. Також прикладом є композиція за даним винаходом, в якій, принаймні, одна додаткова біо-логічно активна сполука або агент, вибрані з групи, що включає циперметрин, цигалотрин, цифлутрин, бета-цифлутрин, есфенвалерат, фенвалерат, тралометрин, фенотіокарб, метоміл, оксаміл, тіо-дикарб, ацетаміприд, клотіанідин, імідаклоприд, тіаметоксам, тіаклоприд, індоксакарб, спіносад, абамектин, авермектин, емамектин, ендосульфан, етіпрол, фіпроніл, флуфеноксурон, трифлумурон, діофенолан, пірипроксифен, піметрозин, амітраз, *Bacillus thuringiensis aizawai*, *Bacillus thuringiensis kurstaki*, *Bacillus thuringiensis* дельта-ендотоксин та ентомопатогенні грибки.

Масові співвідношення сполуки, включаючи сполуку Формули 1, її N-оксид або сіль, до додат-кового агента для боротьби з безхребетними шкід-никами звичайно складає від 1000:1 до 1:1000, в одному втіленні - від 500:1 до 1:500, в іншому вті-ленні - від 250:1 до 1:200 та в іншому втіленні - від 100:1 до 1:50.

В Таблиці В нижче наведені втілення конкрет-них композицій, що містять сполуку Формули 1 (номери сполук посилаються на сполуки в Індекс-них Таблицях А-С) та додатковий агент для боро-тьби з безхребетними шкідниками.

Таблиця В

Суміш №	Спол. №	та	Агент для боротьби з безхребетними шкідниками	Суміш №	Спол. №	та	Агент для боротьби з безхребетними шкідниками
A-1	1	та	Абамектин	B-1	2	та	Абамектин
A-2	1	та	Ацетаміприд	B-2	2	та	Ацетаміприд
A-3	1	та	Аміграз	B-3	2	та	Аміграз
A-4	1	та	Авермектин	B-4	2	та	Авермектин
A-5	1	та	Азадирахтин	B-5	2	та	Азадирахтин
A-6	1	та	Бета-цифлутрин	B-6	2	та	Бета-цифлутрин
A-7	1	та	Біфентрин	B-7	2	та	Біфентрин
A-8	1	та	Бупрофезин	B-8	2	та	Бупрофезин
A-9	1	та	Картап	B-9	2	та	Картап
A-10	1	та	Хлорантраніліпрол	B-10	2	та	Хлорантраніліпрол
A-11	1	та	Хлорфенапір	B-11	2	та	Хлорфенапір
A-12	1	та	Хлорпірифос	B-12	2	та	Хлорпірифос
A-13	1	та	Клотіанідин	B-13	2	та	Клотіанідин
A-14	1	та	Цифлутрин	B-14	2	та	Цифлутрин
A-15	1	та	Цигалотрин	B-15	2	та	Цигалотрин
A-16	1	та	Циперметрин	B-16	2	та	Циперметрин
A-17	1	та	Циромазин	B-17	2	та	Циромазин
A-18	1	та	Дельтаметрин	B-18	2	та	Дельтаметрин
A-19	1	та	Діельдрин	B-19	2	та	Діельдрин
A-20	1	та	Динотефуран	B-20	2	та	Динотефуран
A-21	1	та	Діофенолан	B-21	2	та	Діофенолан
A-22	1	та	Емаектин	B-22	2	та	Емаектин
A-23	1	та	Ендосульфан	B-23	2	та	Ендосульфан
A-24	1	та	Есфенвалерат	B-24	2	та	Есфенвалерат
A-25	1	та	Етіпрол	B-25	2	та	Етіпрол
A-26	1	та	Фенотіокарб	B-26	2	та	Фенотіокарб
A-27	1	та	Феноксикарб	B-27	2	та	Феноксикарб
A-28	1	та	Фенвалерат	B-28	2	та	Фенвалерат
A-29	1	та	Фіпроніл	B-29	2	та	Фіпроніл
A-30	1	та	Флонікамід	B-30	2	та	Флонікамід

Суміш №	Спол. №	та	Агент для боротьби з безхребетними шкідниками	Суміш №	Спол. №	та	Агент для боротьби з безхребетними шкідниками
A-31	1	та	Флубендіамід	B-31	2	та	Флубендіамід
A-32	1	та	Флуфеноксурон	B-32	2	та	Флуфеноксурон
A-33	1	та	Гексафлумурон	B-33	2	та	Гексафлумурон
A-34	1	та	Гідраметилнон	B-34	2	та	Гідраметилнон
A-35	1	та	Імідаклоприд	B-35	2	та	Імідаклоприд
A-36	1	та	Індоксакарб	B-36	2	та	Індоксакарб
A-37	1	та	Лямбда-цигалотрин	B-37	2	та	Лямбда-цигалотрин
A-38	1	та	Луфенурон	B-38	2	та	Луфенурон
A-39	1	та	Метафлумізон	B-39	2	та	Метафлумізон
A-40	1	та	Метоміл	B-40	2	та	Метоміл
A-41	1	та	Метопрен	B-41	2	та	Метопрен
A-42	1	та	Метоксифенозид	B-42	2	та	Метоксифенозид
A-43	1	та	Нітенпірам	B-43	2	та	Нітенпірам
A-44	1	та	Нітіазин	B-44	2	та	Нітіазин
A-45	1	та	Новалурон	B-45	2	та	Новалурон
A-46	1	та	Оксаміл	B-46	2	та	Оксаміл
A-47	1	та	Піметрозин	B-47	2	та	Піметрозин
A-48	1	та	Піретрин	B-48	2	та	Піретрин
A-49	1	та	Піридабен	B-49	2	та	Піридабен
A-50	1	та	Піридаліл	B-50	2	та	Піридаліл
A-51	1	та	Пірипроксифен	B-51	2	та	Пірипроксифен
A-52	1	та	Ріанодин	B-52	2	та	Ріанодин
A-53	1	та	Спінеторам	B-53	2	та	Спінеторам
A-54	1	та	Спіносад	B-54	2	та	Спіносад
A-55	1	та	Спіродиклофен	B-55	2	та	Спіродиклофен
A-56	1	та	Спіромезифен	B-56	2	та	Спіромезифен
A-57	1	та	Тебуфенозид	B-57	2	та	Тебуфенозид
A-58	1	та	Тіаклоприд	B-58	2	та	Тіаклоприд
A-59	1	та	Тіаметоксам	B-59	2	та	Тіаметоксам
A-60	1	та	Тіодикарб	B-60	2	та	Тіодикарб
A-61	1	та	Тіосультап-натрій	B-61	2	та	Тіосультап-натрій
A-62	1	та	Тралометрин	B-62	2	та	Тралометрин
A-63	1	та	Тріазамат	B-63	2	та	Тріазамат
A-64	1	та	Трифлумурон	B-64	2	та	Трифлумурон

Суміш №	Спол. №	та	Агент для боротьби з безхребетними шкідниками	Суміш №	Спол. №	та	Агент для боротьби з безхребетними шкідниками
A-65	1	та	<i>Bacillus thuringiensis</i>	B-65	2	та	<i>Bacillus thuringiensis</i>
A-66	1	та	<i>Bacillus thuringiensis</i> дельта-ендотоксин	B-66	2	та	<i>Bacillus thuringiensis</i> дельта-ендотоксин
A-67	1	та	NPV (наприклад, Gemstar)	B-67	2	та	NPV (наприклад, Gemstar)
C-1	101	та	Абамектин	D-1	104	та	Абамектин
C-2	101	та	Ацетаміприд	D-2	104	та	Ацетаміприд
C-3	101	та	Аміграз	D-3	104	та	Аміграз
C-4	101	та	Авермектин	D-4	104	та	Авермектин
C-5	101	та	Азадирахтин	D-5	104	та	Азадирахтин
C-6	101	та	Бета-цифлутрин	D-6	104	та	Бета-цифлутрин
C-7	101	та	Біфентрин	D-7	104	та	Біфентрин
C-8	101	та	Бупрофезин	D-8	104	та	Бупрофезин
C-9	101	та	Картап	D-9	104	та	Картап
C-10	101	та	Хлорантраніліпрол	D-10	104	та	Хлорантраніліпрол
C-11	101	та	Хлорфенапір	D-11	104	та	Хлорфенапір
C-12	101	та	Хлорпірифос	D-12	104	та	Хлорпірифос
C-13	101	та	Клотіанідин	D-13	104	та	Клотіанідин
C-14	101	та	Цифлутрин	D-14	104	та	Цифлутрин
C-15	101	та	Цигалотрин	D-15	104	та	Цигалотрин
C-16	101	та	Циперметрин	D-16	104	та	Циперметрин
C-17	101	та	Циромазин	D-17	104	та	Циромазин
C-18	101	та	Дельтаметрин	D-18	104	та	Дельтаметрин
C-19	101	та	Діельдрин	D-19	104	та	Діельдрин
C-20	101	та	Динотефуран	D-20	104	та	Динотефуран
C-21	101	та	Діофенолан	D-21	104	та	Діофенолан
C-22	101	та	Емаектин	D-22	104	та	Емаектин
C-23	101	та	Ендосульфат	D-23	104	та	Ендосульфат
C-24	101	та	Есфенвалерат	D-24	104	та	Есфенвалерат
C-25	101	та	Етіпрол	D-25	104	та	Етіпрол
C-26	101	та	Фенотіокарб	D-26	104	та	Фенотіокарб
C-21	101	та	Феноксикарб	D-27	104	та	Феноксикарб
C-28	101	та	Фенвалерат	D-28	104	та	Фенвалерат
C-29	101	та	Фіпроніл	D-29	104	та	Фіпроніл

Суміш №	Спол. №	та	Агент для боротьби з безхребетними шкідниками	Суміш №	Спол. №	та	Агент для боротьби з безхребетними шкідниками
C-30	101	та	Флонікамід	D-30	104	та	Флонікамід
C-31	101	та	Флубендіамід	D-31	104	та	Флубендіамід
C-32	101	та	Флуфеноксурон	D-32	104	та	Флуфеноксурон
C-33	101	та	Гексафлумурон	D-33	104	та	Гексафлумурон
C-34	101	та	Гідраметилнон	D-34	104	та	Гідраметилнон
C-35	101	та	Імідаклоприд	D-35	104	та	Імідаклоприд
C-36	101	та	Індоксакарб	D-36	104	та	Індоксакарб
C-37	101	та	Лямбда-цигалотрин	D-37	104	та	Лямбда-цигалотрин
C-38	101	та	Луфенурон	D-38	104	та	Луфенурон
C-39	101	та	Метафлумізон	D-39	104	та	Метафлумізон
C-40	101	та	Метоміл	D-40	104	та	Метоміл
C-41	101	та	Метопрен	D-41	104	та	Метопрен
C-42	101	та	Метоксифенозид	D-42	104	та	Метоксифенозид
C-43	101	та	Нітенпірам	D-43	104	та	Нітенпірам
C-44	101	та	Нітіазин	D-44	104	та	Нітіазин
C-45	101	та	Новалурон	D-45	104	та	Новалурон
C-46	101	та	Оксаміл	D-46	104	та	Оксаміл
C-47	101	та	Піметрозин	D-47	104	та	Піметрозин
C-48	101	та	Піретрин	D-48	104	та	Піретрин
C-49	101	та	Піридабен	D-49	104	та	Піридабен
C-50	101	та	Піридаліл	D-50	104	та	Піридаліл
C-51	101	та	Пірипроксифен	D-51	104	та	Пірипроксифен
C-52	101	та	Ріанодин	D-52	104	та	Ріанодин
C-53	101	та	Спінеторам	D-53	104	та	Спінеторам
C-54	101	та	Спіносад	D-54	104	та	Спіносад
C-55	101	та	Спіродиклофен	D-55	104	та	Спіродиклофен
C-56	101	та	Спіромезифен	D-56	104	та	Спіромезифен
C-57	101	та	Тебуфенозид	D-57	104	та	Тебуфенозид
C-58	101	та	Тіаклоприд	D-58	104	та	Тіаклоприд
C-59	101	та	Тіаметоксам	D-59	104	та	Тіаметоксам
C-60	101	та	Тіодикарб	D-60	104	та	Тіодикарб
C-61	101	та	Тіосультап-натрій	D-61	104	та	Тіосультап-натрій
C-62	101	та	Тралометрин	D-62	104	та	Тралометрин
C-63	101	та	Тріазамат	D-63	104	та	Тріазамат

Суміш №	Спол. №	та	Агент для боротьби з безхребетними шкідниками	Суміш №	Спол. №	та	Агент для боротьби з безхребетними шкідниками
C-64	101	та	Трифлумурон	D-64	104	та	Трифлумурон
C-65	101	та	<i>Bacillus thuringiensis</i>	D-65	104	та	<i>Bacillus thuringiensis</i>
C-66	101	та	<i>Bacillus thuringiensis</i> дельта-ендотоксин	D-66	104	та	<i>Bacillus thuringiensis</i> дельта-ендотоксин
C-67	101	та	NPV (наприклад, Gemstar)	D-67	104	та	NPV (наприклад, Gemstar)
E-1	8	та	Абамектин	F-1	10	та	Абамектин
E-2	8	та	Ацетаміприд	F-2	10	та	Ацетаміприд
E-3	8	та	Амітраз	F-3	10	та	Амітраз
E-4	8	та	Авермектин	F-4	10	та	Авермектин
E-5	8	та	Азадирахтин	F-5	10	та	Азадирахтин
E-6	8	та	Бета-цифлутрин	F-6	10	та	Бета-цифлутрин
E-7	8	та	Біфентрин	F-7	10	та	Біфентрин
E-8	8	та	Бупрофезин	F-8	10	та	Бупрофезин
E-9	8	та	Картап	F-9	10	та	Картап
E-10	8	та	Хлорантраніліпрол	F-10	10	та	Хлорантраніліпрол
E-11	8	та	Хлорфенапір	F-11	10	та	Хлорфенапір
E-12	8	та	Хлорпірифос	F-12	10	та	Хлорпірифос
E-13	8	та	Клотіанідин	F-13	10	та	Клотіанідин
E-14	8	та	Цифлутрин	F-14	10	та	Цифлутрин
E-15	8	та	Цигалотрин	F-15	10	та	Цигалотрин
E-16	8	та	Циперметрин	F-16	10	та	Циперметрин
E-17	8	та	Циромазин	F-17	10	та	Циромазин
E-18	8	та	Дельтаметрин	F-18	10	та	Дельтаметрин
E-19	8	та	Діельдрин	F-19	10	та	Діельдрин
E-20	8	та	Динотефуран	F-20	10	та	Динотефуран
E-21	8	та	Діофенолан	F-21	10	та	Діофенолан
E-22	8	та	Емаектин	F-22	10	та	Емаектин
E-23	8	та	Ендосульфат	F-23	10	та	Ендосульфат
E-24	8	та	Есфенвалерат	F-24	10	та	Есфенвалерат
E-25	8	та	Етіпрол	F-25	10	та	Етіпрол
E-26	8	та	Фенотіокарб	F-26	10	та	Фенотіокарб
E-27	8	та	Феноксикарб	F-27	10	та	Феноксикарб
E-28	8	та	Фенвалерат	F-28	10	та	Фенвалерат

Суміш №	Спол. №	та	Агент для боротьби з безхребетними шкідниками	Суміш №	Спол. №	та	Агент для боротьби з безхребетними шкідниками
E-29	8	та	Фіпроніл	F-29	10	та	Фіпроніл
E-30	8	та	Флонікамід	F-30	10	та	Флонікамід
E-31	8	та	Флубендіамід	F-31	10	та	Флубендіамід
E-32	8	та	Флуфеноксурон	F-32	10	та	Флуфеноксурон
E-33	8	та	Гексафлумурон	F-33	10	та	Гексафлумурон
E-34	8	та	Гідраметилнон	F-34	10	та	Гідраметилнон
E-35	8	та	Імідаклоприд	F-35	10	та	Імідаклоприд
E-36	8	та	Індоксакарб	F-36	10	та	Індоксакарб
E-37	8	та	Лямбда-цигалотрин	F-37	10	та	Лямбда-цигалотрин
E-38	8	та	Луфенурон	F-38	10	та	Луфенурон
E-39	8	та	Метафлумізон	F-39	10	та	Метафлумізон
E-40	8	та	Метоміл	F-40	10	та	Метоміл
E-41	8	та	Метопрен	F-41	10	та	Метопрен
E-42	8	та	Метоксифенозид	F-42	10	та	Метоксифенозид
E-43	8	та	Нітенпірам	F-43	10	та	Нітенпірам
E-44	8	та	Нітіазин	F-44	10	та	Нітіазин
E-45	8	та	Новалурон	F-45	10	та	Новалурон
E-46	8	та	Оксаміл	F-46	10	та	Оксаміл
E-47	8	та	Піметрозин	F-47	10	та	Піметрозин
E-48	8	та	Піретрин	F-48	10	та	Піретрин
E-49	8	та	Піридабен	F-49	10	та	Піридабен
E-50	8	та	Піридаліл	F-50	10	та	Піридаліл
E-51	8	та	Пірипроксифен	F-51	10	та	Пірипроксифен
E-52	8	та	Ріанодин	F-52	10	та	Ріанодин
E-53	8	та	Спінеторам	F-53~	10	та	Спінеторам
E-54	8	та	Спіносад	F-54	10	та	Спіносад
E-55	8	та	Спіродиклофен	F-55	10	та	Спіродиклофен
E-56	8	та	Спіромезифен	F-56	10	та	Спіромезифен
E-57	8	та	Тебуфенозид	F-57	10	та	Тебуфенозид
E-58	8	та	Тіаклоприд	F-58	10	та	Тіаклоприд
E-59	8	та	Тіаметоксам	F-59	10	та	Тіаметоксам
E-60	8	та	Тіодикарб	F-60	10	та	Тіодикарб
E-61	8	та	Тіосультап-натрій	F-61	10	та	Тіосультап-натрій
E-62	8	та	Тралометрин	F-62	10	та	Тралометрин

Суміш №	Спол. №	та	Агент для боротьби з безхребетними шкідниками	Суміш №	Спол. №	та	Агент для боротьби з безхребетними шкідниками
E-63	8	та	Тріазамат	F-63	10	та	Тріазамат
E-64	8	та	Трифлумурон	F-64	10	та	Трифлумурон
E-65	8	та	<i>Bacillus thuringiensis</i>	F-65	10	та	<i>Bacillus thuringiensis</i>
E-66	8	та	<i>Bacillus thuringiensis</i> дельта-ендотоксин	F-66	10	та	<i>Bacillus thuringiensis</i> дельта-ендотоксин
E-67	8	та	NPV (наприклад, Gemstar)	F-67	10	та	NPV (наприклад, Gemstar)
G-1	41	та	Абамектин	H-1	51	та	Абамектин
G-2	41	та	Ацетаміприд	H-2	51	та	Ацетаміприд
G-3	41	та	Аміраз	H-3	51	та	Аміраз
G-4	41	та	Авермектин	H-4	51	та	Авермектин
G-5	41	та	Азадирахтин	H-5	51	та	Азадирахтин
G-6	41	та	Бета-цифлутрин	H-6	51	та	Бета-цифлутрин
G-7	41	та	Біфентрин	H-7	51	та	Біфентрин
C-8	41	та	Бупрофезин	H-8	51	та	Бупрофезин
G-9	41	та	Картап	H-9	51	та	Картап
G-10	41	та	Хлорантраніліпрол	H-10	51	та	Хлорантраніліпрол
G-11	41	та	Хлорфенапір	H-11	51	та	Хлорфенапір
G-12	41	та	Хлорпірифос	H-12	51	та	Хлорпірифос
G-13	41	та	Клотіанідин	H-13	51	та	Клотіанідин
G-14	41	та	Цифлутрин	H-14	51	та	Цифлутрин
G-15	41	та	Цигалотрин	H-15	51	та	Цигалотрин
G-16	41	та	Циперметрин	H-16	51	та	Циперметрин
G-17	41	та	Циромазин	H-17	51	та	Циромазин
G-18	41	та	Дельтаметрин	H-18	51	та	Дельтаметрин
G-19	41	та	Дієльдрин	H-19	51	та	Дієльдрин
G-20	41	та	Динотефуран	H-20	51	та	Динотефуран
G-21	41	та	Діофенолан	H-21	51	та	Діофенолан
G-22	41	та	Емаектин	H-22	51	та	Емаектин
G-23	41	та	Ендосульфан	H-23	51	та	Ендосульфан
C-24	41	та	Есфенвалерат	H-24	51	та	Есфенвалерат
G-25	41	та	Етіпрол	D-25	51	та	Етіпрол
G-26	41	та	Фенотіокарб	H-26	51	та	Фенотіокарб
C-27	41	та	Феноксикарб	D-27	51	та	Феноксикарб

Суміш №	Спол. №	та	Агент для боротьби з безхребетними шкідниками	Суміш №	Спол. №	та	Агент для боротьби з безхребетними шкідниками
G-28	41	та	Фенвалерат	H-28	51	та	Фенвалерат
G-29	41	та	Фіпроніл	H-29	51	та	Фіпроніл
G-30	41	та	Флонікамід	H-30	51	та	Флонікамід
G-31	41	та	Флубендіамід	H-31	51	та	Флубендіамід
G-32	41	та	Флуфеноксурон	H-32	51	та	Флуфеноксурон
G-33	41	та	Гексафлумурон	H-33	51	та	Гексафлумурон
G-34	41	та	Гідраметилнон	H-34	51	та	Гідраметилнон
G-35	41	та	Імідаклоприд	H-35	51	та	Імідаклоприд
G-36	41	та	Індоксакарб	H-36	51	та	Індоксакарб
G-37	41	та	Лямбда-цигалотрин	H-37	51	та	Лямбда-цигалотрин
G-38	41	та	Луфенурон	H-38	51	та	Луфенурон
G-39	41	та	Метафлумізон	H-39	51	та	Метафлумізон
G-40	41	та	Метоміл	H-40	51	та	Метоміл
G-41	41	та	Метопрен	H-41	51	та	Метопрен
G-42	41	та	Метоксифенозид	H-42	51	та	Метоксифенозид
G-43	41	та	Нітенпірам	H-43	51	та	Нітенпірам
G-44	41	та	Нітіазин	H-44	51	та	Нітіазин
G-45	41	та	Новалурон	H-45	51	та	Новалурон
G-46	41	та	Оксаміл	H-46	51	та	Оксаміл
G-47	41	та	Піметрозин	H-47	51	та	Піметрозин
G-48	41	та	Піретрин	H-48	51	та	Піретрин
G-49	41	та	Піридабен	H-49	51	та	Піридабен
G-50	41	та	Піридаліл	H-50	51	та	Піридаліл
G-51	41	та	Пірипроксифен	H-51	51	та	Пірипроксифен
G-52	41	та	Ріанодин	H-52	51	та	Ріанодин
G-53	41	та	Спінеторам	H-53	51	та	Спінеторам
G-54	41	та	Спіносад	H-54	51	та	Спіносад
G-55	41	та	Спіродиклофен	H-55	51	та	Спіродиклофен
G-56	41	та	Спіромезифен	H-56	51	та	Спіромезифен
G-57	41	та	Тебуфенозид	H-57	51	та	Тебуфенозид
G-58	41	та	Тіаклоприд	H-58	51	та	Тіаклоприд
G-59	41	та	Тіаметоксам	H-59	51	та	Тіаметоксам
G-60	41	та	Тіодикарб	H-60	51	та	Тіодикарб
G-61	41	та	Тіосультап-натрій	H-61	51	та	Тіосультап-натрій

Суміш №	Спол. №	та	Агент для боротьби з безхребетними шкідниками	Суміш №	Спол. №	та	Агент для боротьби з безхребетними шкідниками
G-62	41	та	Тралометрин	H-62	51	та	Тралометрин
G-63	41	та	Тріазамат	H-63	51	та	Тріазамат
G-64	41	та	Трифлумурон	H-64	51	та	Трифлумурон
G-65	41	та	<i>Bacillus thuringiensis</i>	H-65	51	та	<i>Bacillus thuringiensis</i>
G-66	41	та	<i>Bacillus thuringiensis</i>	H-66	51	та	<i>Bacillus thuringiensis</i>
			дельта-ендотоксин				дельта-ендотоксин
G-67	41	та	NPV (наприклад, Gemstar)	H-67	51	та	NPV (наприклад, Gemstar)

В конкретних сумішах, наведених в Таблиці В, звичайно сполука Формули 1 об'єднана з іншим агентом для боротьби з безхребетними шкідниками в співвідношеннях, вказаних в Таблиці А.

Безхребетних шкідників контролюють при сільськогосподарських та несільськогосподарських застосуваннях за допомогою використання однієї або більше сполук за даним винаходом, звичайно у формі композиції, в біологічно ефективній кількості, до середовища шкідників, включаючи сільськогосподарське та/або несільськогосподарське місцезнаходження зараження, до області, яку необхідно захистити, або безпосередньо на шкідниках, з якими борються.

Таким чином, даний винахід включає спосіб боротьби з безхребетними шкідниками в сільськогосподарському та/або несільськогосподарському застосуванні, який включає контактування безхребетного шкідника або його оточення з біологічно ефективною кількістю однієї чи більше сполук за винаходом або з композицією, що містить, принаймні, одну таку сполуку, або з композицією, що містить, принаймні, одну таку сполуку та біологічно ефективну кількість, принаймні, однієї додаткової біологічно активної сполуки або агента. Приклади прийнятних композицій, що містять сполуку за винаходом та біологічно ефективну кількість, принаймні, однієї додаткової біологічно активної сполуки або агента, включають гранульовані композиції, в яких додаткова активна сполука присутня на тій самій гранулі, що і сполука за винаходом, або на гранулах, які відділені від гранул сполуки за винаходом.

Для досягнення контакту зі сполукою або композицією за винаходом для захисту польових культур від безхребетних шкідників сполуку або композицію звичайно застосовують до насіння культури перед посадкою, до листя (наприклад, листя, стовбурів, квіток, плодів) сільськогосподарських культур, або до ґрунту або іншого середовища для вирощування перед або після того, як культура посаджена.

Одним втіленням способу контактування є контактування за допомогою розпилення. Альтернативно, гранульовану композицію, що містить сполуку за винаходом, можуть застосовувати до листя рослини або ґрунту. Сполуки за даним винаходом також ефективно можуть бути доставлені шляхом поглинання рослинами за допомогою контактування рослини з композицією, що містить сполуку за винаходом, яку застосовують у формі рідкої препаративної форми для змочування ґрунту, гранульованої препаративної форми для ґрунту, обробки розсадника або короткого занурення саджанців. Прикладом є композиція за даним винаходом у формі рідкої препаративної форми для змочування ґрунту. Також прикладом є спосіб боротьби з безхребетними шкідниками, який включає контактування безхребетного шкідника або його оточення з біологічно ефективною кількістю сполуки за даним винаходом або з композицією, що містить біологічно ефективну кількість сполуки за даним винаходом. Додатковим прикладом є даний спосіб, в якому оточенням є ґрунт та композицію застосовують до ґрунту у вигляді препаративної форми для змочування ґрунту. Додатковим прикладом є те, що сполуки за даним винаходом є також ефективними шляхом місцевого застосування до місцезнаходження зараження. Інші способи контактування включають застосування сполуки або композиції за винаходом за допомогою прямих та залишкових спреїв, повітряних спреїв, гелів, покриття насіння, мікроінкапсулювань, систематичного поглинання, приманок, сережок, шариків, зволожувачів, фумігантів, аерозолів, пилоподібних препаратів та багатьох інших. Одним втіленням способу контактування є стабільна за розмірами удобрювальна гранула, брусок або таблетка, що містять сполуку або композицію за винаходом. Сполуками за даним винаходом також можуть бути просочені матеріали для створення пристроїв для боротьби з безхребетними шкідниками (наприклад, сітка для комах).

Сполуки за даним винаходом також корисні при обробці насіння для захисту насіння від безх-

ребетних шкідників. В контексті даного опису та формули винаходу, обробка насіння означає контактування насіння з біологічно ефективною кількістю сполуки за даним винаходом, яку звичайно виготовляють у вигляді композиції за винаходом. Дана обробка насіння захищає насіння від ґрунтових безхребетних шкідників та загалом також може захищати корені та інші частини рослин при контакті із землею саджанця, що розвивається з пророщеного насіння. Обробка насіння також може забезпечити захист листя за допомогою перенесення сполуки за даним винаходом або другого активного інгредієнта в рослині, що розвивається. Обробка насіння може застосовуватися до всіх видів насіння, включаючи ті, з яких будуть рости рослини, які є генномодифікованими, щоб експресувати характерні властивості. Характерні приклади включають такі рослини, що експресують протеїни, токсичні для безхребетних шкідників, такі як *Bacillus thuringiensis* токсин, або ті, які експресують гербіцидну резистентність, як наприклад гліфозат ацетилтрансферази, яка забезпечує резистентність до гліфозату.

Один спосіб обробки насіння здійснюють шляхом розприскування або обпилення насіння сполукою за винаходом (тобто, у вигляді виготовленої композиції) перед засіванням насіння. Композиції, виготовлені перед обробкою насіння, загалом містять плівкоутворювач або адгезійний засіб. Таким чином, звичайно композиція для покриття насіння за даним винаходом містить біологічно ефективну кількість сполуки Формули 1, її N-оксиду або солі, та плівкоутворювач або адгезійний засіб. Насіння може бути покрито шляхом розприскування текучого суспензійного концентрату безпосередньо на площадку падіння насіння та потім висушування насіння. Альтернативно, на насіння можуть бути розприскані інші типи препаративних форм, такі як змочені порошки, розчини, суспензії, емульсії, концентрати та емульсії у воді. Даний процес особливо корисний при застосуванні плівкових покриттів на насіння. Фахівцю в даній галузі техніки доступні різні прилади та процеси для нанесення покриття. Прийнятні процеси включають наведені в P. Kusters et al., *Seed Treatment: Progress and Prospects*, 1994 BCPC Monograph No. 57, та посиланнях, приведених в даному документі.

Оброблене насіння звичайно містить сполуку за даним винаходом в кількості від приблизно 0,1 г до 1 кг на 100 кг насіння (тобто від приблизно 0,0001 до 1% на масу насіння перед обробкою). Текучі суспензії, виготовлені для обробки насіння, звичайно містять від приблизно 0,5 до приблизно 70% активного інгредієнта, від приблизно 0,5 до приблизно 30% плівкоутворюючого адгезійного засобу, від приблизно 0,5 до приблизно 20% диспергуючої речовини, від 0 до приблизно 5% загусника, від 0 до приблизно 5% пігменту та/або барвника, від 0 до приблизно 2% антисипінуючого засобу, від 0 до приблизно 1% консерванту та від 0 до приблизно 75% легкого рідкого розріджувача.

Сполуки за даним винаходом можуть бути введені в композицію у формі приманки, яку з'їдає безхребетний шкідник, або можуть бути використані в пристрої, такому як пастка, станція-

приманка та подібний. Така композиція у формі приманки може існувати у формі гранул, які містять (a) активні інгредієнти, а саме біологічно ефективну кількість сполуки Формули 1, її N-оксиду або солі; (b) одну або більше харчову речовину; необов'язково (c) атрактант, та необов'язково (d) один або більше зволожувач. Прикладом є гранули або композиції у формі приманки, які містять приблизно 0,001-5% активних інгредієнтів, приблизно 40-99% харчової речовини та/або атрактанту; та необов'язково приблизно 0,05-10% зволожувачів, які ефективні при боротьбі з ґрунтовими безхребетними шкідниками при дуже низьких діапазонах застосування, особливо при дозах активного інгредієнта, які є смертельними більш переважно при прийомі в середину, ніж при прямому контакті. Деякі харчові речовини можуть виступати як джерело харчування, так і як атрактант. Харчові речовини включають вуглеводи, протеїни та ліпіди. Прикладами харчових речовин є рослинне борошно, цукор, крохмалі, тваринний жир, рослинна олія, дріжджові екстракти та сухе молоко. Прикладами атрактантів є пахучі речовини та ароматизатори, такі як екстракти фруктів або рослин, духи або інші тваринний чи рослинний компонент, феромони або інші агенти, які, як відомо, приваблюють цільового безхребетного шкідника. Прикладами зволожувачів, тобто агентів, що утримують вологу, є гліколи та інші полііоли, гліцерин та сорбіт. Прикладом є композиція у формі приманки (та спосіб, в якому використовується така композиція у формі приманки), яку використовують для боротьби з, принаймні, одним безхребетним шкідником, вибраним з групи, що включає мурашки, терміти та таргани. Пристрій для боротьби з безхребетними шкідниками може містити композицію у формі приманки за даним винаходом та корпус, пристосований для розміщення зазначеної композиції у формі приманки, де корпус має, принаймні, один отвір, розмір якого дозволяє безхребетному шкіднику пройти через отвір, так що безхребетний шкідник може скористатися доступом до зазначеної композиції у формі приманки із місця знаходження поза корпусом, та де корпус додатково пристосований для розміщення в або поблизу місцезнаходження можливої або відомої активності безхребетних шкідників.

Сполуки за даним винаходом можуть застосовуватися без інших допоміжних речовини, але найчастіше їх будуть застосовувати у вигляді препаративної форми, що містить один або більше активний інгредієнт з прийнятними носіями, розріджувачами та поверхнево-активними речовинами, та можливо в комбінації з їжею залежно від передбаченого кінцевого використання. Один спосіб використання залучає розпилення водної дисперсії або очищеного масляного розчину сполуки за даним винаходом. Комбінації з розпиленими маслами, концентрованими розпиленими маслами, адгезивними агентами, ад'ювантами, іншими розчинниками та синергістами, такими як піпероніл бутоксид, часто збільшують ефективність сполук. Для несільськогосподарських застосувань такі розприскування можуть здійснювати з контейнерів для розприскування, таких як бідон, пляшка або

інший контейнер, або за допомогою насоса, або за допомогою вивільнення вмісту з аерозольної тари, наприклад, герметичного аерозольного бідону для розприскування. Такі композиції для розприскування можуть мати різні форми, наприклад, спрей, мла, піна, пара або туман. Таким чином, такі композиції для розприскування можуть, крім того, містити пропеленти, піноутворюючі агенти та т.п., в залежності від обставин. Прикладом є композиція у формі спрею, що містить біологічно ефективну кількість сполуки або композиції за даним винаходом та носій. В одному втіленні така композиція у формі спрею містить біологічно ефективну кількість сполуки або композиції за даним винаходом та пропелент. Приклади пропелентів включають, але не обмежуються, метан, етан, пропан, бутан, ізобутан, бутен, пентан, ізопентан, неопентан, пентен, фторовані вуглеводні, хлорфторвуглеці, диметилловий ефір та суміші наведеного вище. Прикладом є композиція у формі спрею (та спосіб, в якому використовується така композиція у формі спрею, дозована з контейнеру для розприскування), яку використовують для боротьби з, принаймні, одним безхребетним шкідником, вибраним з групи, що включає москіти, мошки, жигалки осінні, оленячі гедзі, гедзі, оси справжні, оси, шерсні, кліщі, павуки, мурашки, комари та подібні, включені індивідуально або в комбінаціях.

Несільськогосподарські застосування включають захист тварини, особливо хребетної, більш особливо теплокровної хребетної тварини (наприклад, ссавця або птаха) та найбільш особливо ссавця, від безхребетного паразитичного шкідника за допомогою введення паразитично ефективної (тобто, біологічно ефективної) кількості сполуки за винаходом, звичайно у формі композиції, виготовленої для ветеринарного застосування, тварині, яку необхідно захистити. Таким чином, прикладом є спосіб захисту тварини, який включає введення тварині паразитично ефективної кількості сполуки за винаходом. Як використовується в даному описі та формулі винаходу, терміни "паразитичний" та "паразитично" відносяться до помітних ефектів на безхребетному паразитичному шкіднику із забезпеченням захисту тварини від шкідника. Антипаразитичні ефекти звичайно відносяться до зниження наявності або активності цільового безхребетного паразитичного шкідника. Такі ефекти на шкіднику включають некроз, смерть, затримку розвитку, зниження рухливості або зменшення здатності залишитися на або в тварині-господарі, зменшення харчування та інгібування розмноження. Ці ефекти на безхребетних паразитичних шкідниках забезпечують контроль (включаючи попередження, зниження або усунення) паразитичної інвазії або інфекції тварини. Приклади безхребетних паразитичних шкідників, з якими борються за допомогою введення паразитично ефективної кількості сполуки за винаходом тварині, яку необхідно захистити, включають ектопаразити (членистоногі, акариди, тощо) та ендопаразити (гельмінти, наприклад, нематоди, трематоди, стрічкові черв'яки, скребні, тощо). Зокрема, сполуки за даним винаходом є ефективними проти ектопаразитів, включаючи: мухи, такі як *Haematobia (Lyperosia) irritans*

(жигалка коров'яча мала), *Stomoxys calcitrans* (жигалка осіння), *Simulium* spp. (мошки), *Glossina* spp. (мухи цеце), *Hydrotaea irritans* (муха справжня), *Musca autumnalis* (муха осіння), *Musca domestica* (муха кімнатна), *Morellia simplex* (муха потова), *Tabanus* spp. (гедзь), *Hypoderma bovis*, *Hypoderma lineatum*, *Lucilia sericata*, *Lucilia cuprina* (падальниця зелена), *Calliphora* spp. (м'ясна муха), *Protophormia* spp., *Oestrus ovis* (гедзь овечий), *Culicoides* spp. (комари), *Hippobosca equina*, *Gastrophilus instestinalis*, *Gastrophilus haemorrhoidalis* та *Gastrophilus nasalis*; воші, такі як *Bovicola (Damalinia) bovis*, *Boycicola equi*, *Hematomys asini*, *Felicola subrostratus*, *Heterodoxus spiniger*, *Lignonathus setosus* та *Trichodectes canis*; кровососки, такі як *Melophagus ovinus*; кліщі, такі як *Psoroptes* spp., *Sarcoptes scabiei*, *Chorioptes bovis*, *Demodex equi*, *Cheyletiella* spp., *Notoedres cati*, *Trombicula* spp. та *Otodectes cynotis* (вушні кліщі); кліщі, такі як *Ixodes* spp., *Boophilus* spp., *Rhipicephalus* spp., *Amblyomma* spp., *Dermacentor* spp., *Hyalomma* spp. та *Haemaphysalis* spp.; та блохи, такі як *Ctenocephalides felis* (блоха котяча) та *Ctenocephalides canis* (блоха собача).

Несільськогосподарське застосування у ветеринарному секторі здійснюють за допомогою стандартних засобів, таких як кишкове введення у форму, наприклад, таблеток, капсул, напоїв, препаратів для зрошування, гранул, пасти, пілюль, шляхом годування або супозиторієв; або парентеральне введення, як наприклад за допомогою ін'єкції (включаючи внутрішньом'язову, підшкірну, внутрішньовенну, інтраперитонеальну), імплантатів; назальне введення; місцеве введення, наприклад, у формі занурення або опускання, розприскування, промивання, покриття порошком, або застосування до малої області тварини, та через вироби, такі як шийні хомути, вушні бирки, хвостові стрічки, стрічки на кінцівках або недоуздки, які містять сполуки або композиції за даним винаходом.

Звичайно антипаразитичні композиції відповідно до даного винаходу містять суміш сполуки Формули 1, її N-оксиду або солі, з одним або більше фармацевтично або ветеринарно прийнятними носіями, що включають ексципієнти та допоміжні речовини, вибрані у відповідності з призначеним шляхом введення (наприклад, пероральне, місцеве або парентеральне введення, таке як ін'єкція), та відповідно до стандартної практики. Крім того, прийнятний носій вибирають на основі сумісності з одним або більше активними інгредієнтами в композиції, включаючи такі фактори, як стабільність щодо pH та вмісту вологи. Таким чином, прикладом є композиція для захисту тварини від безхребетного паразитичного шкідника, що містить паразитично ефективну кількість сполуки за винаходом та, принаймні, один носій.

Для парентерального введення, включаючи внутрішньовенну, внутрішньом'язову та підшкірну ін'єкцію, сполука за даним винаходом може бути виготовлена у суспензії, розчині або емульсії в масляному або водному наповнювачі, та може містити допоміжні речовини, такі як суспендувальні, стабілізуючі та/або диспергуючі агенти. Фарма-

цвітничні композиції для ін'єкції включають водні розчини розчинних у воді форм активних інгредієнтів (наприклад, сіль активної сполуки), переважно у фізіологічно сумісних буферах, що містять інші ексципієнти або допоміжні речовини, які відомі з рівня техніки щодо фармацевтичних препаратів.

Для перорального введення, включаючи розчини (форми, найбільш легко доступні для абсорбції), емульсії, суспензії, пасти, гелі, капсули, таблетки, пілюлі, порошки, гранули, блоки, що затримуються у рубці, та блоки їжа/вода/лизунець, сполука за даним винаходом може бути виготовлена зі зв'язуючими речовинами/заповнювачами, які, як відомо з рівня техніки, є прийнятними для композицій для перорального введення, такими як цукри (наприклад, лактоза, цукроза, маніт, сорбіт), крохмаль (наприклад, кукурудзяний крохмаль, пшеничний крохмаль, рисовий крохмаль, картопляний крохмаль), целюлоза та похідні (наприклад, метилцелюлоза, карбоксиметилцелюлоза, етилгідроксицелюлоза), протеїнові похідні (наприклад, зеїн, желатин) та синтетичні полімери (наприклад, полівініловий спирт, полівінілпіролідон). Якщо бажано, можуть бути додані змазуючі речовини (наприклад, стеарат магнію), агенти дезинтеграції (наприклад, поперечно зшитий полівінілпіролідон, агар, альгінова кислота) та барвники або пігменти. Пасти та гелі часто також містять адгезивні речовини (наприклад, гуміарабік, альгінову кислоту, бентоніт, целюлозу, ксантанову камедь, колоїдний алюміній/магній силікат) для того, щоб допомогти в утримуванні композиції при контакті з ротовою порожниною та щоб усунути легке вивільнення.

Якщо антипаразитичні композиції знаходяться у формі кормових концентратів, носії звичайно вибрані з високоякісного корму, харчових злаків або протеїнових концентратів. Такі композиції, що містять кормовий концентрат можуть, додатково до антипаразитичних активних інгредієнтів, містити добавки, що сприяють здоров'ю або росту тварин, покращують якість м'яса тварин при забої скота або іншим чином є корисними для тваринництва. Ці добавки можуть включати, наприклад, вітаміни, антибіотики, хіміотерапевтичні засоби, бактеріостати, фунгістати, кокцидіостати та гормони.

Було відкрито, що сполуки за даним винаходу мають сприятливі фармакокінетичні та фармакодинамічні властивості, що забезпечують систематичну наявність при пероральному введенні та ковтанні. Таким чином, після ковтання твариною, яку необхідно захистити, паразитично ефективні концентрації сполук за винаходом в кровообігу захищають тварину, якій їх ввели, від шкідників, що смокчуть кров, таких як блохи, кліщі та воші. Таким чином, прикладом є композиція для захисту тварини від безхребетного паразитичного шкідника у формі для перорального введення (тобто, яка містить додатково до паразитично ефективної кількості сполуки за винаходом, один або більше носіїв, вибраних зі зв'язуючих речовин та заповнювачів, прийнятих для перорального введення та носіїв для кормового концентрату).

Препаративні форми для місцевого введення звичайно знаходяться у формі порошку, крему,

суспензії, спрею, емульсії, піни, пасти, аерозолі, мазі, бальзаму або гелю. Більш звичайно препаративна форма для місцевого введення являє собою розчинний у воді розчин, який може знаходитися у формі концентрату, який розбавляють перед використанням. Антипаразитичні композиції, прийнятні для місцевого введення, звичайно містять сполуку за даним винаходом та один або більше носіїв, прийнятих для місцевого введення. Очікують, що в застосуваннях антипаразитичної композиції місцево до зовнішньої поверхні тварини у вигляді лінії або крапок (тобто, "крапкове" нанесення) активний інгредієнт активно мігрує по поверхні, щоб покрити більшу частину або всю зовнішню поверхню частину. В результаті, тварина, якій вводять препарат, особливо захищена від безхребетних шкідників, які харчуються епідермісом тварини, таких як кліщі, блохи та воші. Таким чином, препарати для місцевого локалізованого введення часто містять, принаймні, один органічний розчинник, щоб полегшити перенос активного інгредієнта по шкірі та/або проникнення в епідерміс тварини. Розчинники, що звичайно використовуються як носії в таких препаратах, включають пропілен гліколь, парафіни, ароматичні вуглеводні, ефіри, такі як ізопропіл міристат, гліколеві ефіри та спирти, такі як етанол та н-пропанол.

Діапазон застосування, який необхідний для ефективного контролю (тобто "біологічно ефективна кількість"), буде залежати від таких чинників, як види безхребетних, яких контролюють, життєвий цикл шкідника, життєва стадія, його розмір, місцезнаходження, пора року, домашня культура або тварина, харчова поведінка, поведінка при спарюванні, вологість навколишнього середовища, температура та подібні. При нормальних умовах, діапазони застосування від приблизно 0,01 до 2 кг активних інгредієнтів на гектар є достатніми для боротьби зі шкідниками в агрономічних екосистемах, але як найнижча доза можуть бути достатні 0,0001 кг/гектар, або як найвища доза можуть бути необхідні 8 кг/гектар. Для несільськогосподарських застосувань норми ефективного застосування будуть знаходитися в діапазоні від приблизно 1,0 до 50 мг/м², але як найнижча доза можуть бути достатні 0,1 мг/м², або як найвища доза можуть бути необхідні 150 мг/м². Фахівець в даній галузі техніки легко може визначити біологічно ефективну кількість, необхідну для бажаного рівня боротьби з безхребетними шкідниками.

Взагалі для ветеринарного застосування, сполуку Формули 1, її N-оксид або сіль вводять в паразитично ефективній кількості тварині, яку необхідно захистити від безхребетних паразитичних шкідників. Паразитично ефективна кількість являє собою кількість активного інгредієнта, необхідну для досягнення помітного ефекту, зменшуючи наявність або активність цільового безхребетного паразитичного шкідника. Фахівець в даній галузі техніки прийме до уваги, що паразитично ефективна доза може змінюватися залежно від різних сполук та композицій за даним винаходом, бажаного паразитичного ефекту та тривалості, цільових видів безхребетних шкідників, тварини, яку необхідно захистити, способу застосування, тощо, та

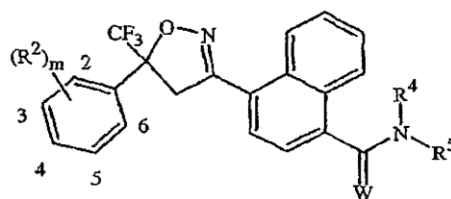
кількість, необхідна для досягнення конкретного ефекту може бути визначена за допомогою простого експериментування.

Для перорального введення теплокровним тваринам, щоденне дозування сполуки за даним винаходом звичайно знаходиться в діапазоні від приблизно 0,01 мг/кг до приблизно 100 мг/кг, більш звичайно від приблизно 0,5 мг/кг до приблизно 100 мг/кг, маси тіла тварини. Для місцевого (наприклад, дермального) введення, препаративні форми для занурення та розприскування звичайно містять від приблизно 0,5 м.ч. до приблизно 5000

м.ч., більш звичайно від приблизно 1 м.ч. до приблизно 3000 м.ч., сполуки за даним винаходом.

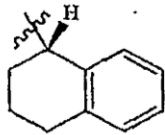
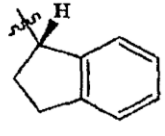
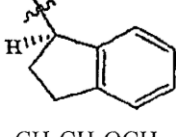
В Індексних таблицях А-С використовуються наступні скорочення: і означає ізо, t означає третинний, с означає цикло, Me означає метил, Et означає етил, c-Pr означає циклопропіл та t-Bu означає трет-бутил. Нафтил означає нафталеніл. (R) або (S) означають абсолютну хіральність асиметричного вуглецевого центру. Скорочення "Пр." позначає "Приклад" та за ним слідує номер, вказуючи, в якому прикладі одержують сполуку. В Індексній таблиці А $(R^2)_m$ відноситься до комбінації $(R^2)_n$ з прикладами CR^2 для B^1 , B^2 та B^3 .

ІНДЕКСНА ТАБЛИЦЯ А



де m означає 1, 2, 3, 4 або 5.

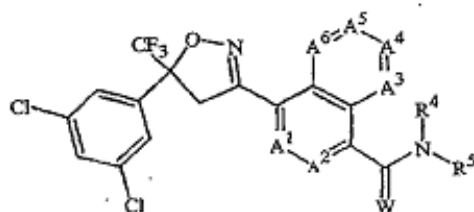
Сполука	W	$(R^2)_m$	R^4	R^5	т.п. (°C)
1 (Пр. 1)	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH_2CF_3	**
2 (Пр. 2)	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH_2 -2-піридиніл	**
3	O	H	H	CH_2CF_3	*
4	O	H	H	CH_2 -2-піридиніл	*
5	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH_2 -феніл	*
6	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH_2 -3-піридиніл	*
7	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH_2 -4-піридиніл	*
8 (Пр. 3)	S	3-Cl, 5-Cl	H	CH_2 -2-піридиніл	**
9	O	3-Cl, 5-Cl	Me	Et	*
10	O	3-Cl, 5-Cl	H	Et	*
11	O	3-Cl, 5-Cl	CO_2Me	CH_2 -2-піридиніл	*
12	O	3-Cl, 5-Cl	H	Me	*
13	O	3-Cl, 5-Cl	H	$CH_2CH_2N(CH_3)_2$	*
14	O	3-Cl, 5-Cl	H	$CH_2CH_2N(CH_3)_2.HCl$	*
15	O	3-Cl, 5-Cl	H	(R)- $CH(CH_3)$ -феніл	*
16	O	3-Cl, 5-Cl	H	$CH(CH_3)_2$	*
17	O	3-Cl, 5-Cl	H	(S)- $CH(CH_3)$ -феніл	*
18	O	3-Cl, 5-Cl	H	$CH_2CH=CH_2$	*
19.	O	3-Cl, 5-Cl	H	$CH_2C\equiv CH$	*
20	O	3-Cl, 5-Cl	H-	CH_2 -c-Pr	*
21	O	3-Cl, 5-Cl	H	$CH(CH_3)$ -2-піридиніл	*
22	O	3-Me, 5-Me	H	CH_2 -2-піридиніл	*
23	O	3-Cl, 4-Cl	H	CH_2 -2-піридиніл	*
24	O	3-F, 5-F	H	CH_2 -2-піридиніл	*

161				93525	162
25	O	3-Cl	H	CH ₂ -2-піридиніл	*
26	O	3-Br, 5-Br	H	CH ₂ -2-піридиніл	*
27	O	3-Cl, 5-Cl	H	(R)-CH(CH ₃)-2-нафтил	*
28	O	3-Cl, 5-Cl	H	(R)-CH(CH ₃)-(4-NO ₂ -феніл)	*
Сполука	W	(R ²) _m	R ⁴	R ⁵	Т.П. (°C)
29	O	3-Cl, 5-Cl	H	(S)-CH(CO ₂ CH ₃)-феніл	*
30	O	3-Cl, 5-Cl	H	(R)-CH(CH ₃)-(4-Cl-феніл)	*
31	O	3-Cl, 5-Cl	H	(R)-CH(CH ₃)-(4-F-феніл)	*
32	O	3-Cl, 5-Cl	H	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	*
33	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	*
34	O	3-Cl, 5-Cl	H	(R)-CH(CH ₃)-t-Bu	*
35	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CH ₂ OH	*
36	O	3-Cl, 5-Cl	H	H	*
37	O	3-Cl, 5-Cl		-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ -	*
38	O	3-Cl, 5-Cl	H		*
39	O	3-Cl, 5-Cl	H		*
40	O	3-Cl, 5-Cl	H		*
41	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	*
42	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CO ₂ Et	*
43	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CO ₂ H	*
44	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CO ₂ Na	*
45	O	3-Cl, 5-Cl	H	NHC(=O)Me	*
46	O	3-Cl, 5-Cl	H	NH-феніл	*
47	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CH ₂ NH ₂	*
48	O	3-Cl, 5-Cl	H	(S)-CH(Me)CO ₂ Me	*
49	O	3-Cl, 5-Cl	H	(S)-CH(i-Pr)CO ₂ Me	*
50	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ (CH ₂) ₅ NH ₂	*
51	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CONHCH ₂ CF ₃	*
52	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CN	*
53	O	3-Cl, 5-Cl	H	NH-2-піридиніл	*

* Див. Індексу таблицю D для даних ¹H ЯМР.

** Див. приклади для даних ¹H ЯМР.

ІНДЕКСНА ТАБЛИЦЯ В

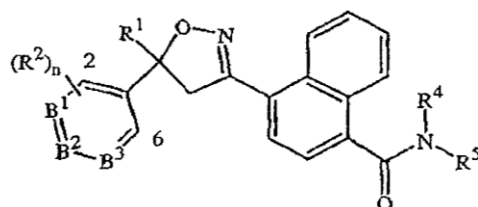


Сполука	W	A ¹	A ²	A ³	A ⁴	A ⁵	A ⁶	R ⁴	R ⁵	т.п. (°C)
101	O	N	CH	CH	CH	CH	CH	H	CH ₂ -2-піридиніл	*
102	O	CH	N	CH	CH	CH	CH	H	CH ₂ -2-піридиніл	*
103 (Пр. 4)	O	CH	CH	N	CH	CH	CH	H	CH ₂ -2-піридиніл	**
104 (Пр. 5)	O	CH	CH	CH	N	CH	CH	H	CH ₂ -2-піридиніл	**
105	O	CH	CH	CH	CH	N	CH	H	CH ₂ -2-піридиніл	*
106	O	CH	CH	CH	CH	CH	N	H	CH ₂ -2-піридиніл	*
107	O	CH	CH	CH	CH	CH	N	H	CH ₂ CF ₃	*
108	S	CH	CH	CH	CH	CH	N	H	CH ₂ -2-піридиніл	*
109	S	CH	CH	CH	CH	CH	N	H	CH ₂ CF ₃	*
110	O	CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	H	CH ₂ -2-піридиніл	*
111	O	CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	H	CH ₂ CF ₃	*

* Див. Індексу таблицю D для даних ¹H ЯМР.

** Див. приклади для даних ¹H ЯМР.

ІНДЕКСНА ТАБЛИЦЯ С



Сполука	B ¹	B ²	B ³	(R ²) _n	R ⁴	R ⁵	т.п. (°C)
201	C-Cl	N	CH	H	H	CH ₂ CF ₃	*
202	C-Cl	N	CH	H	H	CH ₂ -2-піридиніл	*

* Див. Індексу таблицю D для даних ¹ ЯМР

** Див. приклади для даних ¹H ЯМР.

ІНДЕКСНА ТАБЛИЦЯ D

Сполука № Дані ¹H ЯМР (розчин CDCl₃, якщо не вказано інше)^a

3	δ 8,67 (d, 1H), 8,06 (d, 1H), 7,66 - 7,45 (m, 7H), 7,39 (d, 1H), 7,29 (d, 1H), 6,78 (br s, 1H), 4,19 (d, 1H), 4,15 (m, 2H), 3,88 (d, 1H).
---	---

Сполука № Дані ^1H ЯМР (розчин CDCl_3 , якщо не вказано інше)^a

4	δ 8,82 (d, 1H), 8,50 (d, 1H), 8,35 (d, 1H), 7,71 - 7,44 (m, 11H), 7,35 (d, 1H), 7,20 (dd, 1H), 4,83 (d, 2H), 4,25 (d, 1H), 3,95 (d, 1H).
5	δ 8,78 (d, 1H), 8,27 (d, 1H), 7,64 - 7,30 (m, 12H), 6,40 (br t, 1H), 4,71 (d, 2H), 4,22 (d, 1H), 3,86 (d, 1H).
6	δ 8,72 (d, 1H), 8,53 (d, 1H), 8,49 (dd, 1H), 8,18 (d, 1H), 7,72 (d, 1H), 7,60 - 7,52 (m, 4H), 7,45 (m, 2H), 7,36 (d, 1H), 7,27 (m, 1H), 6,93 (br t, 1H), 4,66 (d, 2H), 4,21 (d, 1H), 3,86 (d, 1H).
7	δ 8,72 (d, 1H), 8,50 (d, 2H), 8,19 (d, 1H), 7,61 - 7,54 (m, 4H), 7,47 (m, 2H), 7,37 (d, 1H), 7,23 (d, 2H), 7,02 (br t, 1H), 4,66 (d, 2H), 4,22 (d, 1H), 3,86 (d, 1H).
9	δ 8,88 (m, 1H), 7,83 (m, 1H), 7,66 - 7,40 (m, 7H), 4,27 (d, 1H), 3,92 (d, 1H), 3,80 - 3,66 та 3,09 (m, 2H), 3,22 та 2,74 (s, 3H), 1,01 та 1,36 (t, 3H).
10	δ 8,78 (d, 1H), 8,25 (d, 1H), 7,64 - 7,42 (m, 7H), 6,08 (br s, 1H), 4,24 (d, 1H), 3,88 (d, 1H), 3,58 (m, 2H), 1,31 (t, 3H).
11	δ 8,92 (d, 1H), 8,63 (d, 1H), 8,17 (d, 1H), 7,74 - 7,53 (m, 7H), 7,45 (t, 1H), 7,35 (d, 1H), 7,23 (dd, 1H), 5,33 (s, 2H), 4,29 (d, 1H), 3,92 (d, 1H), 3,43 (s, 3H).
12	δ 8,77 (d, 1H), 8,21 (d, 1H), 7,63 - 7,55 (m, 5H), 7,44 (d, 1H), 7,38 (d, 1H), 6,18 (br s, 1H), 4,23 (d, 1H), 3,87 (d, 1H), 3,07 (d, 3H).
13	δ 8,78 (d, 1H), 8,27 (d, 1H), 7,39 - 7,62 (m, 1H), 6,77 (br s, 1H), 4,22 (d, 1H), 3,88 (d, 1H), 3,58 (q, 2H), 2,53 (t, 2H), 2,25 (s, 6H).
15	δ 8,63 (dd, 1H), 8,00 (dd, 1H), 7,56 (s, 2H), 7,47 - 7,16 (m, 9H), 6,78 (dd, 1H), 5,34 (m, 1H), 4,14 (dd, 1H), 3,80 (dd, 1H), 1,60 (d, 3H).
16	δ 8,80 (d, 1H), 8,25 (d, 1H), 7,66 - 7,45 (m, 7H), 5,87 (d, 1H), 4,41 (m, 1H), 4,24 (d, 1H), 3,88 (d, 1H), 1,33 (d, 6H).
17	δ 8,77 (d, 1H), 8,19 (dd, 1H), 7,63 - 7,30 (m, 12H), 6,30 (d, 1H), 5,44 (m, 1H), 4,22 (d, 1H), 3,86 (d, 1H), 1,67 (d, 1H).
18	δ 8,80 (d, 1H), 8,27 (d, 1H), 7,61 - 7,45 (m, 7H), 6,15 (br t, 1H), 5,99 (m, 1H), 5,31 (d, 1H), 5,24 (d, 1H), 4,25 (d, 1H), 4,17 (m, 2H), 3,88 (d, 1H).
19	δ 8,77 (d, 1H), 8,24 (d, 1H), 7,64 - 7,56 (m, 4H), 7,50 (d, 1H), 7,46 (dd, 1H), 7,40 (d, 1H), 6,38 (br t, 1H), 4,33 (dd, 2H), 4,23 (d, 1H), 3,87 (d, 1H), 2,32 (t, 1H).
20	δ 8,82 (d, 1H), 8,29 (d, 1H), 7,67 - 7,45 (m, 7H), 6,14 (br s, 1H), 4,26 (d, 1H), 3,90 (d, 1H), 3,42 (dd, 2H), 1,12 (m, 1H), 0,59 (m, 2H), 0,32 (m, 2H).
21	δ 8,82 (d, 1H), 8,50 (d, 1H), 8,34 (d, 1H), 7,72 (dt, 1H), 7,67 - 7,57 (m, 6H), 7,50 (d, 1H), 7,45 (dd, 1H), 7,34 (d, 1H), 7,21 (dd, 1H), 5,45 (m, 1H), 4,26 (d, 1H), 3,90 (d, 1H), 1,66 (d, 3H).
22	δ 8,85 (d, 1H), 8,51 (d, 1H), 8,36 (d, 1H), 7,72 - 7,57 (m, 4H), 7,51 (d, 1H), 7,45 (br t,

Сполука № Дані ^1H ЯМР (розчин CDCl_3 , якщо не вказано інше)^a

	1H), 7,36 (d, 1H), 7,25 (s, 2H), 7,21 (dd, 1H), 7,07 (s, 1H), 4,85 (d, 1H), 4,22 (d, 1H), 3,94 (d, 1H), 2,38 (s, 6H).
23	δ 8,81 (d, 1H), 8,51 (d, 1H), 8,37 (d, 1H), 7,78 - 7,46 (m, 9H), 7,36 (d, 1H), 7,22 (dd, 1H), 4,85 (d, 2H), 4,26 (d, 1H), 3,90 (d, 1H).
24	δ 8,83 (d, 1H), 8,52 (d, 1H), 8,39 (d, 1H), 7,74 - 7,22 (m, H), 6,91 (dt, 1H), 4,87 (d, 2H), 4,27 (d, 1H), 3,90 (d, 1H).
25	δ 8,83 (d, 1H), 8,51 (d, 1H), 8,37 (d, 1H), 7,73 - 7,41 (m, 10H), 7,37 (d, 1H), 7,22 (dd, 1H), 4,86 (d, 2H), 4,26 (d, 1H), 3,92 (d, 1H).
26	δ 8,82 (d, 1H), 8,52 (d, 1H), 8,38 (d, 1H), 7,76 (s, 2H), 7,74 - 7,59 (m, H), 7,52 (d, 1H), 7,44 (br t, 1H), 7,37 (d, 1H), 7,23 (dd, 1H), 4,87 (d, 2H), 4,26 (d, 1H), 3,90 (d, 1H).
27	δ 8,76 (d, 1H), 8,19 (dd, 1H), 7,87 - 7,36 (m, 14H), 6,46 (d, 1H), 5,59 (m, 1H), 4,20 (d, 1H), 3,84 (d, 1H), 1,73 (d, 3H).
28	δ 8,77 (d, 1H), 8,23 (d, 2H), 8,14 (dd, 1H), 7,66 - 7,44 (m, 9H), 6,45 (d, 1H), 5,47 (m, 1H), 4,24 (d, 1H), 3,88 (d, 1H), 1,66 (d, 3H).
29	δ 8,80 (d, 1H), 8,28 (d, 1H), 7,66 - 7,37 (m, H), 6,99 (d, 1H), 5,87 (d, 1H), 4,24 (d, 1H), 3,88 (d, 1H), 3,80 (s, 3H).
30	δ 8,76 (d, 1H), 8,14 (dd, 1H), 7,63 - 7,35 (m, 11H), 6,35 (d, 1H), 5,38 (m, 1H), 4,21 (d, 1H), 3,85 (d, 1H), 1,62 (d, 3H).
31	δ 8,76 (d, 1H), 8,16 (dd, 1H), 7,64 - 7,38 (m, 9H), 7,07(d, 1H), 7,05 (d, 1H), 6,30 (d, 1H), 5,41 (m, 1H), 4,22 (d, 1H), 3,86 (d, 1H), 1,64 (d, 3H).
32	δ 8,81 (d, 1H), 8,26 (d, 1H), 7,67 - 7,45 (m, 7H), 5,78 (d, 1H), 4,26 (d, 1H), 4,25 (m, 1H), 3,88 (d, 1H), 1,63 (m, 2H), 1,30 (d, 3H), 1,04 (t, 3H).
33	δ 8,81 (d, 1H), 8,26 (d, 1H), 7,67 - 7,45 (m, 7H), 5,78 (d, 1H), 4,26 (d, 1H), 4,25 (m, 1H), 3,88 (d, 1H), 1,63 (m, 2H), 1,30 (d, 3H), 1,04 (t, 3H).
34	δ 8,80 (d, 1H), 8,26 (d, 1H), 7,68 - 7,46 (m, 7H), 5,80 (d, 1H), 4,26 (d, 1H), 4,23 (m, 1H), 3,88 (d, 1H), 1,24 (d, 3H), 1,01 (s, 9H).
35	δ 8,65 (d, 1H), 8,08 (d, 1H), 7,55 (s, 2H), 7,52 - 7,44 (m, 7H), 7,27 (d, 1H), 7,19 (d, 1H), 6,93 (br t, 1H), 4,16 (d, 1H), 3,81 (d, 1H), 3,73 (s, br, 2H), 3,53 (m, 2H), 3,27 (br s, 1H).
36	δ 8,75 (d, 1H), 8,30 (d, 1H), 7,63 - 7,35 (m, 7H), 6,69 (br s, 1H), 6,32 (br s, 1H), 4,22 (d, 1H), 3,86 (d, 1H).
38	δ 8,79 (m, 1H), 8,34 (d, 1H), 7,64 - 7,12 (m, 11H), 6,29 (dd, 1H), 5,50 (m, 1H), 4,22 (d, 1H), 3,87 (d, 1H), 2,82 (m, 2H), 2,24 (m, 1H), 2,05 (m, 1H), 1,91 (m, 2H).
39	δ 8,80 (d, 1H), 8,34 (d, 1H), 7,65 - 7,25 (d, H), 6,28 (d, 1H), 5,79 (q, 1H), 4,24 (d, 1H),

Сполука № Дані ^1H ЯМР (розчин CDCl_3 , якщо не вказано інше)^a

	3,87 (d, 1H), 3,92 - 3,07 (m, 2H), 2,77 (m, 1H), 1,99 (m, 1H).
40	δ 8,81 (d, 1H), 8,37 (d, 1H), 7,67 - 7,26 (m, 1H), 6,26 (d, 1H), 5,80 (q, 1H), 4,24 (d, 1H), 3,88 (d, 1H), 3,09 - 2,93 (m, 2H), 2,79 (m, 1H), 1,99 (m, 1H).
41	δ 8,82 (d, 1H), 8,30 (d, 1H), 7,67 - 7,46 (m, 7H), 6,40 (br t, 1H), 4,25 (d, 1H), 3,89 (d, 1H), 3,75 (q, 2H), 3,63 (dd, 2H), 3,39 (s, 3H).
42	δ 8,84 (d, 1H), 8,37 (d, 1H), 7,67 - 7,46 (m, 7H), 6,53 (br t, 1H), 4,33 (d, 2H), 4,29 (q, 2H), 4,26 (d, 1H), 3,90 (d, 1H), 1,34 (t, 3H).
43	DMSO- d_6 : δ 9,02 (t, 1H), 8,81 (d, 1H), 8,37 (d, 1H), 7,92 (d, 1H), 7,83 (t, 1H), 7,74 - 7,65 (m, 5H), 4,58 (d, 1H), 4,54 (d, 1H), 4,02 (d, 2H).
44	DMSO- d_6 : δ 8,86 (d, 1H), 8 50 (d, 1H), 7,96 - 7,67 (m, 8H), 4,61 (видимий s, 2H), 3,64 (d, 2H).
45	DMSO- d_6 : δ 10,44 (s, 1H), 10,10 (s, 1H), 8,86 (d, 1H), 8,46 (d, 1H), 7,98 (d, 1H), 7,90 (t, 1H), 7,76 (m, 5H), 4,63 (d, 1H), 4,59 (d, 1H), 2,04 (s, 3H).
46	δ 10,45 (s, 1H), 8,80 (d, 1H), 8,24 (d, 1H), 7,95 (d, 1H), 7,85 - 7,63 (m, 7H), 7,22 (t, 2H), 6,90 (d, 2H), 6,78 (t, 1H), 4,57 (видимий s, 2H).
47	δ 8,83 (d, 1H), 8,33 (d, 1H), 7,69 - 7,46 (m, 9H), 6 54 (br s, 1H), 4,27 (d, 1H), 3,90 (d, 1H), 3,61 (q, 2H), 3,02 (t, 3H).
48	δ 8,83 (d, 1H), 8,35 (d, 1H), 7,68 - 7,46 (m, 7H), 6,54 (d, 1H), 4,91 (m, 1H), 4,26 (d, 1H), 3,90 (d, 1H), 3,83 (s, 3H), 1,60 (d, 3H).
49	δ 8,84 (d, 1H), 8,34 (d, 1H), 7,70 - 7,46 (m, 7H), 6,46 (d, 1H), 4,91 (dd, 1H), 4,26 (d, 1H), 3,90 (d, 1H), 3,83 (s, 3H), 2,36 (m, 1H), 1,10 (d, 3H), 0,99 (d, 3H).
50	DMSO- d_6 : δ 8,79 (d, 1H), 8,71 (t, 1H), 8,19 (d, 1H), 8,08 (br s, 2H), 7,90 (d, 1H), 7,84 (dd, 1H), 7,73 - 7,66 (m, 4H), 7,62 (d, 1H), 4,54 (видимий s, 2H), 3,35 (m, 2H), 2,76 (m, 2H), 1,60 (m, 4H), 1,39 (m, 4H).
51	δ 8,82 (d, 1H), 8,26 (d, 1H), 7,67 - 7,46 (m, 7H), 7,09(m, 2H), 4 28 (d, 2H), 4,25 (d, 1H), 3,96 (m, 2H), 3,88 (d, 1H).
52	δ 8,79 (d, 1H), 8,23 (d, 1H), 7,68 - 7,46 (m, 7H), 6,53 (br t, 1H), 4,46 (d, 2H), 4,26 (d, 1H), 3 89 (d, 1H).
53	δ 8,83 (d, 1H), 8,42 (d, 1H), 8,18 (d, 1H), 7,73 (d, 1H), 7,70 - 7,55 (m, 7H), 7,50 (d, 1H), 7,46 (dd, 1H), 6,84 (dd, 1H), 6,80 (d, 1H), 4,26 (d, 1H), 3,90 (d, 1H).
101	δ 9,24 (d, 1H), 8,75 (s, 1H), 8,52 (d, 1H), 8,45 (d, 1H), 7,82 - 7,70 (m, 3H), 7,64 (br s, 1H), 7,58 (s, 2H), 7,44 (t, 1H), 7,37 (d, 1H), 7,24 (dd, 1H), 4,87 (d, 2H).
102	δ 9,63 (d, 1H), 9,04 (br t, 1H), 8,93 (d, 1H), 8,60 (d, 1H), 8,52 (s, 1H), 7,86 (dd, 1H), 7,74 (dd, 1H), 7,69 (dd, 1H), 7,57 (s, 2H), 7,46 (dd, 1H), 7,40 (d, 1H), 7,23 (dd, 1H), 4,85 (d, 2H), 4,31 (d, 1H), 3,94 (d, 1H).

Сполука № Дані ^1H ЯМР (розчин CDCl_3 , якщо не вказано інше)^a

105	δ 10,17 (s, 1H), 8,64 (d, 1H), 8,53 (d, 1H), 8,22 (d, 1H), 7,90 (d, 1H), 7,73 (dt, 1H), 7,68 (br t, 1H), 7,59 (d, 1H), 7,56 (s, 2H), 7,46 (t, 1H), 7,37 (d, 1H), 7,24 (dd, 1H), 4,85 (d, 2H), 4,27 (d, 1H), 3,92 (d, 1H).
106	δ 8,95 (dd, 1H), 8,88 (dd, 1H), 8,55 (d, 1H), 8,26 (d, 1H), 7,83 (d, 1H), 7,72 (dt, 1H), 7,60 - 7,50 (m, 4H), 7,43 (t, 1H), 7,36 (d, 1H), 7,24 (dd, 1H), 4,85 (d, 2H), 4,72 (d, 1H), 4,42 (d, 1H).
107	δ 8,89 (dd, 1H), 8,61 (d, 1H), 7,99 (d, 1H), 7,59 (d, 1H), 7,55 (s, 2H), 7,45 (m, 2H), 6,89 (br t, 1H), 4,68 (d, 1H), 4,32 (d, 1H), 4,18 (m, 2H).
108	δ 9,41 (br s, 1H), 8,91 (dd, 1H), 8,70 (dd, 1H), 8,46 (d, 1H), 8,21 (d, 1H), 7,75 (dt, 1H), 7,64 (d, 1H), 7,57 (s, 2H), 7,47 (dd, 1H), 7,43 (t, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,24 (dd, 1H), 5,14 (d, 2H), 4,68 (d, 1H), 4,39 (d, 1H).
109	δ 8,88 (d, 1H), 8,47 (dd, 1H), 8,12 (br s, 1H), 7,97 (d, 1H), 7,53 (s, 2H), 7,47 (m, 3H), 4,74 (m, 2H), 4,59 (d, 1H), 4,25 (d, 1H).
110	δ 8,75 (d, 1H), 8,42 (d, 1H), 7,86 (d, 1H), 7,68 (dt, 1H), 7,57 (s, 2H), 7,55 - 7,35 (m, 5H), 7,31 (s, 1H), 7,18 (dd, 1H), 4,82 (d, 2H), 4,25 (d, 1H), 3,90 (d, 1H), 2,44 (s, 3H).
111	δ 8,59 (d, 1H), 7,58 (s, 2H), 7,54 (d, 1H), 7,47 (t, 1H), 7,36-7,44 (m, 2H), 7,10 (s, 1H), 6,80 (br t, 1H), 4,20 (d, 1H), 4,08 (m, 2H), 3,86 (d, 1H), 2,23 (s, 3H).
201	δ 8,71 (d, 1H), 8,48 (m, 1H), 8,13 (d, 1H), 7,55 - 7,64 (m, 3H), 7,49 (d, 1H), 7,44 (d, 1H), 7,35 (dd, 1H), 6,74 (t, 1H), 4,24 (d, 1H), 4,17 (m, 2H), 3,83 (d, 1H).
202	δ 8,79 (d, 1H), 8,50 (m, 2H), 8,35 (d, 1H), 7,50 - 7,72 (m, 7H), 7,47 (d, 1H), 7,36 (d, 1H), 7,22 (dd, 1H), 4,83 (d, 2H), 4,28 (d, 1H), 3,89 (d, 1H).

^a дані ^1H ЯМР наведені в м.ч. нижче області тетраметилсилану. Сполучення позначені як (s) – синглет, (d) – дублет, (t) – триплет, (q) – квартет, (m) – мультиплет, (dd) – дублет дублетів, (dt) – дублет триплетів, (br s) – уширений синглет, (br t) – уширений триплет.

Біологічні приклади винаходу

Наступні дослідження демонструють контрольну ефективність сполук за даним винаходом на конкретних шкідниках. "Контрольна ефективність" представляє інгібування розвитку (включаючи смерть) безхребетного шкідника, яке викликає істотне зниження споживання. Контрольний захист від шкідників, наданий сполуками, проте, не обмежений, цими видами. Для визначення сполук див. Індексні таблиці A-C.

Дослідження A

Для оцінки контролю молі капустяної (*Plutella xylostella*) тестова одиниця складалася з малого відкритого контейнера з 12-14-денними саджанцями редису всередині. Їх попередньо заражали приблизно 50 новонародженими личинками, які розподіляли в тестовій одиниці за допомогою посипання стержнями початку кукурудзи, використовуючи інокулятор „базука". Личинки переміщалися на тестову рослину після поміщення їх в тестову одиницю.

Тестові сполуки виготовляли, використовуючи розчин, що містить 10% ацетону, 90% води та 300 м.ч. неіонної поверхнево-активної речовини X-77™ Spreader Lo-Foam Formula, що містить алкіларил-

поліоксіетилен, вільні жирні кислоти, гліколи та ізопропанол (Loveland Industries, Inc. Greeley, Colorado, USA). Виготовлені сполуки використовували в 1 мл рідини через насадку пульверизатора SUJ2 з 1/8 JJ виготовленим на замовлення корпусом (Spraying Systems Co. Wheaton, Illinois, USA), розміщеним на 1,27 см (0,5 дюймів) вище верху кожної тестової одиниці. Всі експериментальні сполуки в цих дослідженнях розбризкували з концентрацією 250 та/або 50 м.ч та обробку повторювали тричі. Після обприскування виготовленою тестовою сполукою, кожну тестову одиницю залишали сохнути протягом 1 години та потім зверху поміщали чорний захисний ковпак. Тестові одиниці утримували протягом 6 днів в камері вирощування при 25°C та відносній вологості 70%. Потім візуально оцінювали пошкодження рослин в результаті над'їдання, базуючись на знищенні листя, та також підраховували і розраховували величину смертності шкідника для кожної тестової одиниці.

Досліджували сполуки Формули 1, наступні сполуки забезпечували рівні контрольної ефективності від дуже доброго до відмінного (пошкодження в результаті над'їдання 20% або менше чи смертність 80% або більше): 1, 2, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 26, 27, 28,

29, 30, 31, 32, 33, 34, 35, 36, 38, 39, 41, 42, 43, 45, 46, 47, 48, 49, 50, 51, 101, 102, 103, 104, 105, 106, 107*, 108*, 109*, 110, 111, 201 та 202.

* означає рівні контрольної ефективності від дуже доброго до відмінного, що спостерігалися тільки при концентрації 250 м.ч.

Дослідження В

Для оцінки контролю совки трав'яної (*Spodoptera frugiperda*) тестова одиниця складалася з малого відкритого контейнера з 4-5-денними зерновими (маїс) саджанцями всередині. Їх попередньо заражали (використовуючи щуп) 10-15 1-денними личинками на шматку їжі для комах. Тестові сполуки виготовляли та розприскували з концентрацією 250 та/або 50 м.ч., як описано для Дослідження А, та обробку повторювали тричі. Після обприскування тестові одиниці утримували в камері вирощування та потім контрольну ефективність оцінювали для кожної тестової одиниці, як описано для Дослідження А.

Досліджували сполуки Формули 1, наступні сполуки забезпечували рівні контрольної ефективності від дуже доброго до відмінного (пошкодження в результаті над'їдання 20% або менше чи смертність 80% або більше): 1, 2, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 25, 26, 28, 29, 30, 31, 32, 33, 34, 35, 36, 39, 41, 42, 46, 49, 51, 101, 102, 103, 104, 106*, 107*, 110*, 111*, 201 та 202.

* означає рівні контрольної ефективності від дуже доброго до відмінного, що спостерігалися тільки при концентрації 250 м.ч.

Дослідження С

Для оцінки контролю цикадки картопляної (*Empoasca fabae* Harris) через контактні та/або системні засоби, тестова одиниця складалася з малого відкритого контейнера з 5-6-денними *Soleil* бобовими саджанцями (з'явилося первинне листя) усередині. Поверх ґрунту додавали білий пісок та один з первинних листів зрізали перед обробкою. Тестові сполуки були виготовлені та розприскані з концентрацією 250 та/або 50 м.ч., та обробку повторювали тричі, як описано для Дослідження А. Після обприскування тестові одиниці залишали сохнути протягом 1 години перед тим, як їх попередньо заражали 5 цикадками картопляними (дорослі особи віком від 18 до 21 дня). Зверху барабану поміщали чорний захисний ковпак. Тестові одиниці утримували протягом 6 днів в камері вирощування при 19-21°C та відносній вологості 50-70%. Кожну тестову одиницю потім візуально оцінювали для визначення відсотку смертності комах.

Досліджували сполуки Формули 1, наступні сполуки забезпечували рівні контрольної ефективності від дуже доброго до відмінного (смертність 80% або більше): 1, 2, 8, 10, 11, 14*, 15, 16, 18*, 19, 20, 21, 26, 28, 31, 32*, 34, 36, 38, 46*, 101, 102* та 106*.

* означає рівні контрольної ефективності від дуже доброго до відмінного, що спостерігалися тільки при концентрації 250 м.ч.

Дослідження D

Для оцінки контролю західного квіткового трипсу (*Frankliniella occidentalis*) через контактні та/або системні засоби, тестова одиниця складалася з малого відкритого контейнера з 5-7-денними *Soleil* бобовими саджанцями всередині. Тестові сполуки були виготовлені та розприскані з концентрацією 250 та/або 50 м.ч., та обробку повторювали тричі, як описано для Дослідження А. Після обприскування тестові одиниці залишали сохнути протягом 1 години та потім до кожної одиниці додавали 22-27 дорослих особин трипсів та потім зверху поміщали чорний захисний ковпак. Тестові одиниці утримували протягом 6 днів при 25°C та відносній вологості 45-55%. Величину смертності та пошкодження рослини оцінювали для кожної тестової одиниці.

Досліджували сполуки Формули 1, наступні сполуки забезпечували рівні контрольної ефективності від дуже доброго до відмінного (пошкодження в результаті над'їдання 20% або менше чи смертність 80% або більше): 1, 2, 8, 10, 11, 13*, 14*, 15*, 16, 18, 19, 20*, 21, 26, 32, 33*, 34*, 35, 39*, 41, 42, 45*, 46*, 47*, 48*, 49, 51, 101 та 104.

* означає рівні контрольної ефективності від дуже доброго до відмінного, що спостерігалися тільки при концентрації 250 м.ч.

Дослідження Е

Для оцінки контролю блохи котячої (*Stenoccephalides felis* Bouche), миші CD-1® (маса приблизно 30 г, самець, отриманий Charles River Laboratories, Wilmington, MA) перорально вводили тестову сполуку в кількості 10 мг/кг, розчинену в пропілен гліколі/гліцерин'формалін (60-40). Через дві години після перорального введення тестової сполуки, на кожну мишу наносили приблизно 8-16 дорослих бліх. Потім через 48 годин після внесення бліх на мишу, їх кількість підраховували для оцінки смертності.

З досліджених сполук наступні сполуки викликали смертність 30% або більше: 1*, 2, 10*, 41* та 51*.

* означає, що сполука викликала смертність 50% або більше.