



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ

(21), (22) Заявка: 2004114242/04, 02.10.2002

(24) Дата начала отсчета срока действия патента:
02.10.2002(30) Конвенционный приоритет:
04.10.2001 СН 1829/01

(43) Дата публикации заявки: 27.10.2005

(45) Опубликовано: 10.04.2007 Бюл. № 10

(56) Список документов, цитированных в отчете о
поиске: EP 0630890 A2, 28.12.1994. EP 0953565
A2, 03.11.1999. SU 1200848 A, 23.12.1985.(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную фазу:
05.05.2004(86) Заявка РСТ:
EP 02/11087 (02.10.2002)(87) Публикация РСТ:
WO 03/031393 (17.04.2003)

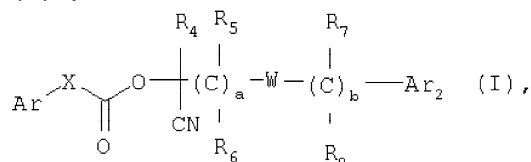
Адрес для переписки:
101000, Москва, М.Златоустинский пер., 10,
кв.15, "ЕВРОМАРКПАТ", пат.пов.
И.А.Веселицкой, рег. № 11

(72) Автор(ы):
ГЕБЕЛЬ Томас (DE),
ДЮКРЕЙ Пьер (FR)(73) Патентообладатель(и):
НОВАРТИС АГ (CH)

(54) КАРБОНИЛОКСИЦИАНОМЕТИЛЬНЫЕ СОЕДИНЕНИЯ, СПОСОБ ИХ ПОЛУЧЕНИЯ И ИХ ПРИМЕНЕНИЕ (ВАРИАНТЫ), КОМПОЗИЦИЯ И СПОСОБ БОРЬБЫ С ПАРАЗИТАМИ

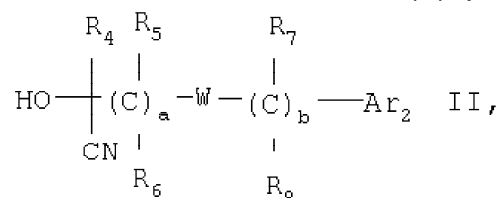
(57) Реферат:

Изобретение относится к соединениям формулы



в которой Ar₁ и Ar₂ независимо друг от друга обозначают незамещенный фенил либо одно- или многозамещенный фенил, заместители которого выбраны из группы, включающей галоген, C₁-C₆алкил, гало-C₁-C₆алкил или гало-C₁-C₆алкоксигруппу, R₄, R₅, R₆ независимо друг от друга обозначают водород или C₁-C₆алкил, W обозначает O, X обозначает N(R₁₀), где R₁₀ обозначает водород, а обозначает 1

и b обозначает 0. Изобретение также относится к способу получения соединений формулы I, который заключается в том, что соединение формулы



подвергают взаимодействию, необязательно в присутствии основного катализатора, с соединением формулы Ar₁-NCO. Кроме того, изобретение включает композицию для борьбы с паразитами, выбранными из группы, включающей гельминты, клещи, паразитиформные клещи и насекомые, которая содержит в качестве действующего вещества по меньшей мере одно

соединение формулы I, а также носители и/или диспергаторы; к применению соединений формулы I для борьбы с указанными паразитами; к способу борьбы с ними, заключающемуся в воздействии на паразитов эффективным количеством по меньшей мере одного соединения формулы I; к применению

соединения формулы I в способе борьбы с паразитами и для получения фармацевтической композиции с направленным против паразитов теплокровных животных, выбранных из группы, включающей гельминты, клещи, паразитиформные клещи и насекомые. 7 н.и 1 з.п. ф-лы, 1 табл.

RU 2 2 9 6 7 4 7 C 2

RU 2 2 9 6 7 4 7 C 2



FEDERAL SERVICE
FOR INTELLECTUAL PROPERTY,
PATENTS AND TRADEMARKS

(51) Int. Cl.
C07C 255/14 (2006.01)
A01N 37/34 (2006.01)

(12) **ABSTRACT OF INVENTION**(21), (22) Application: **2004114242/04, 02.10.2002**(24) Effective date for property rights: **02.10.2002**(30) Priority:
04.10.2001 CH 1829/01(43) Application published: **27.10.2005**(45) Date of publication: **10.04.2007 Bull. 10**(85) Commencement of national phase: **05.05.2004**(86) PCT application:
EP 02/11087 (02.10.2002)(87) PCT publication:
WO 03/031393 (17.04.2003)

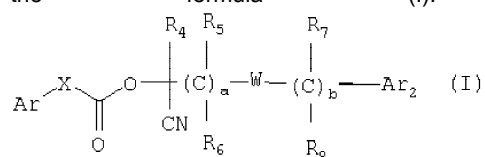
Mail address:
**101000, Moskva, M.Zlatoustinskij per., 10,
kv.15, "EVROMARKPAT", pat.pov.
I.A.Veselitskoj, reg. № 11**

(72) Inventor(s):
**GEBEL' Tomas (DE),
DJUKREJ P'er (FR)**(73) Proprietor(s):
NOVARTIS AG (CH)(54) **CARBONYLOXYCYANOMETHYL COMPOUNDS, METHOD FOR THEIR PREPARING AND THEIR USING (VARIANTS), COMPOSITION AND METHOD FOR CONTROL OF PARASITES**

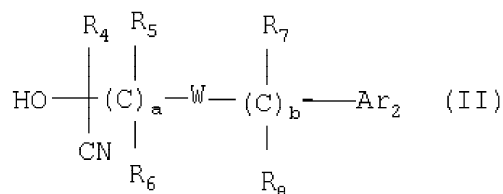
(57) Abstract:

FIELD: organic chemistry, insecticides.

SUBSTANCE: invention relates to compounds of the formula (I):



wherein Ar₁ and Ar₂ mean independently of one another unsubstituted phenyl of mono- or multi-substituted phenyl wherein its substitutes are chosen from group comprising halogen atom, (C₁-C₆)-alkyl, halide-(C₁-C₆)-alkyl or halide-(C₁-C₆)-alkoxy-group; R₄, R₅ and R₆ mean independently of one another hydrogen atom or (C₁-C₆)-alkyl; W mean oxygen atom (O); X means -N(R₁₀) wherein R₁₀ means hydrogen atom; a = 1; b = 0. Also, invention relates to a method for synthesis of compounds of the formula (I). Method involves interaction of compound of the formula (II):



with compound of the formula Ar₁-NCO optionally in the presence of a basic catalyst. Except for, invention comprises a composition designated for control of parasites chosen from group including helminthes, mites, parasite-like mites and insects wherein this composition contains at least one compound of the formula (I) as an active substance and carriers and/or dispersing agents also. Also, invention relates to using compounds of the formula (I) for control of indicated parasites and to a method for control of parasites that involves effect on parasites with the effective dose of at least one compound of the formula (I). Also, invention relates to using compound of the formula (I) for control of parasites and for preparing pharmaceutical composition with effect directed against

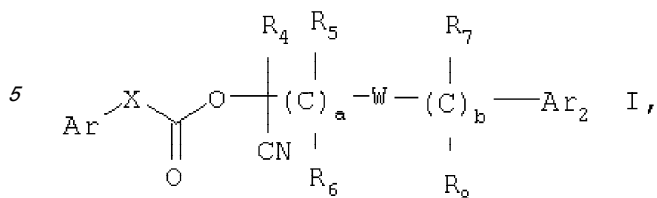
parasites chosen from group including helminthes, mites, parasite-like mites and insects in worm-blood animals.

EFFECT: improved method of synthesis, valuable insecticide properties of compounds and composition.
8 cl, 1 tbl, 3 ex

R U 2 2 9 6 7 4 7 C 2

R U 2 2 9 6 7 4 7 C 2

Настоящее изобретение относится к новым карбонилксианомерильным соединениям формулы



в которой

- 10 Ar_1 и Ar_2 независимо друг от друга обозначают незамещенный фенил либо одно- или многозамещенный фенил, заместители которого могут иметь независимые друг от друга значения и выбраны из группы, включающей галоген, нитрогруппу, цианогруппу, C_1 - C_6 алкил, гало- C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 алкоксигруппу, гало- C_1 - C_6 алкоксигруппу, C_2 - C_6 алкенил, гало- C_2 - C_6 алкенил, C_2 - C_6 алкинил, C_3 - C_6 циклоалкил, C_2 - C_6 алкенилоксигруппу, гало- C_2 - C_6 алкенилоксигруппу, C_1 - C_6 алкилтиогруппу, гало- C_1 - C_6 алкилтиогруппу, C_1 - C_6 алкилсульфонилоксигруппу, гало- C_1 - C_6 алкилсульфонилоксигруппу, C_1 - C_6 алкилсульфинил, гало- C_1 - C_6 алкилсульфинил, C_1 - C_6 алкилсульфонил, гало- C_1 - C_6 алкилсульфонил, C_2 - C_6 алкенилтиогруппу, гало- C_2 - C_6 алкенилтиогруппу, C_2 - C_6 алкенилсульфинил, гало- C_2 - C_6 алкенилсульфинил, C_2 - C_6 алкенилсульфонил, гало- C_2 - C_6 алкенилсульфонил, C_1 - C_6 алкиламиногруппу, ди- C_1 - C_6 алкиламиногруппу, C_1 - C_6 алкилсульфонаминогруппу, гало- C_1 - C_6 алкилсульфонаминогруппу, C_1 - C_6 алкилкарбонил, гало- C_1 - C_6 алкилкарбонил, C_1 - C_6 алкоксикарбонил, C_1 - C_6 алкиламинокарбонил, ди- C_1 - C_6 алкиламинокарбонил, незамещенную фениламиногруппу либо одно- или многозамещенную фениламиногруппу, незамещенный фенилкарбонил либо одно- или многозамещенный фенилкарбонил, незамещенный фенил либо одно- или многозамещенный фенил, при этом заместители могут иметь независимые друг от друга значения и в свою очередь выбраны из группы, включающей галоген, нитрогруппу, цианогруппу, C_1 - C_6 алкил, гало- C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 алкоксигруппу, гало- C_1 - C_6 алкоксигруппу, C_1 - C_6 алкилтиогруппу, гало- C_1 - C_6 алкилтиогруппу, C_1 - C_6 алкилсульфинил, гало- C_1 - C_6 алкилсульфинил, C_1 - C_6 алкилсульфонил и гало- C_1 - C_6 алкилсульфонил, незамещенную феноксигруппу либо одно- или многозамещенную феноксигруппу, заместители которой могут иметь независимые друг от друга значения и выбраны из группы, включающей галоген, нитрогруппу, цианогруппу, C_1 - C_6 алкил, гало- C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 алкоксигруппу, гало- C_1 - C_6 алкоксигруппу, C_1 - C_6 алкилтиогруппу, гало- C_1 - C_6 алкилтиогруппу, C_1 - C_6 алкилсульфинил, гало- C_1 - C_6 алкилсульфинил, C_1 - C_6 алкилсульфонил и гало- C_1 - C_6 алкилсульфонил, незамещенный фенилацетиленил либо одно- или многозамещенный фенилацетиленил, заместители которого могут иметь независимые друг от друга значения и выбраны из группы, включающей галоген, нитрогруппу, цианогруппу, C_1 - C_6 алкил, гало- C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 алкоксигруппу, гало- C_1 - C_6 алкоксигруппу, C_1 - C_6 алкилтиогруппу, гало- C_1 - C_6 алкилтиогруппу, C_1 - C_6 алкилсульфинил, гало- C_1 - C_6 алкилсульфинил, C_1 - C_6 алкилсульфонил и гало- C_1 - C_6 алкилсульфонил, и незамещенную пиридилоксигруппу либо одно- или многозамещенную пиридилоксигруппу, заместители которой могут иметь независимые друг от друга значения и выбраны из группы, включающей галоген, нитрогруппу, цианогруппу, C_1 - C_6 алкил, гало- C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 алкоксигруппу, гало- C_1 - C_6 алкоксигруппу, C_1 - C_6 алкилтиогруппу, гало- C_1 - C_6 алкилтиогруппу, C_1 - C_6 алкилсульфинил, гало- C_1 - C_6 алкилсульфинил, C_1 - C_6 алкилсульфонил и гало- C_1 - C_6 алкилсульфонил, или обозначают незамещенный гетероарил либо одно- или многозамещенный гетероарил,

- заместители которого могут иметь независимые друг от друга значения и выбраны из группы, включающей галоген, нитрогруппу, цианогруппу, C₁-C₆алкил, гало-C₁-C₆алкил, C₁-C₆алкоксигруппу, гало-C₁-C₆алкоксигруппу, C₂-C₆алкенилоксигруппу, гало-C₂-C₆алкенилоксигруппу, C₁-C₆алкилтиогруппу,
- 5 гало-C₁-C₆алкилтиогруппу, C₁-C₆алкилсульфинил, гало-C₁-C₆алкилсульфинил, C₂-C₆алкенилтиогруппу, гало-C₂-C₆алкенилтиогруппу, C₂-C₆алкенилсульфинил, гало-C₂-C₆алкенилсульфинил, C₁-C₆алкилсульфонил, гало-C₁-C₆алкилсульфонил, C₂-C₆алкенилсульфонил,
- 10 гало-C₂-C₆алкенилсульфонил, C₁-C₆алкиламиногруппу и ди-C₁-C₆алкиламиногруппу, или обозначают незамещенный нафтил или хинолил либо одно- или многозамещенный нафтил или хинолил, заместители каждого из которых могут иметь независимые друг от друга значения и выбраны из группы, включающей галоген, нитрогруппу, цианогруппу, C₁-C₆алкил, гало-C₁-C₆алкил, C₁-C₆алкоксигруппу,
- 15 гало-C₁-C₆алкоксигруппу, C₂-C₆алкенилоксигруппу, гало-C₂-C₆алкенилоксигруппу, C₁-C₆алкилтиогруппу, гало-C₁-C₆алкилтиогруппу, C₁-C₆алкилсульфинил, гало-C₁-C₆алкилсульфинил, C₂-C₆алкенилтиогруппу, гало-C₂-C₆алкенилтиогруппу, C₂-C₆алкенилсульфинил,
- 20 гало-C₂-C₆алкенилсульфинил, C₁-C₆алкилсульфонил, гало-C₁-C₆алкилсульфонил, C₂-C₆алкенилсульфонил, гало-C₂-C₆алкенилсульфонил, C₁-C₆алкиламиногруппу и ди-C₁-C₆алкиламиногруппу, R₄, R₅, R₆, R₇ и R₈ независимо друг от друга обозначают водород, галоген, незамещенный C₁-C₆алкил либо одно- или многозамещенный C₁-C₆алкил,
- 25 незамещенный C₂-C₆алкенил либо одно- или многозамещенный C₂-C₆алкенил, незамещенный C₂-C₆алкинил либо одно- или многозамещенный C₂-C₆алкинил, при этом заместители в каждом случае могут иметь независимые друг от друга значения и выбраны из группы, включающей галоген, C₁-C₆алкоксигруппу и гало-C₁-C₆алкоксигруппу, незамещенный C₃-C₆циклоалкил либо одно- или многозамещенный C₃-C₆циклоалкил,
- 30 заместители которого могут иметь независимые друг от друга значения и выбраны из группы, включающей галоген и C₁-C₆алкил, или незамещенный фенил либо одно- или многозамещенный фенил, заместители которого могут иметь независимые друг от друга значения и выбраны из группы, включающей галоген, нитрогруппу, цианогруппу, C₁-C₆алкил, гало-C₁-C₆алкил, C₁-C₆алкоксигруппу,
- 35 гало-C₁-C₆алкоксигруппу, C₁-C₆алкилтиогруппу, гало-C₁-C₆алкилтиогруппу, C₁-C₆алкилсульфинил, гало-C₁-C₆алкилсульфинил, C₁-C₆алкилсульфонил, гало-C₁-C₆алкилсульфонил, C₁-C₆алкиламиногруппу и ди-C₁-C₆алкиламиногруппу, или R₄ и R₅ совместно обозначают C₂-C₆алкилен,
- 40 W обозначает O, S, S(O₂) или N(R₉), R₉ обозначает водород или C₁-C₆алкил, X обозначает O, S или N(R₁₀), R₁₀ обозначает водород, C₁-C₆алкил, гало-C₁-C₆алкил, аллил или C₁-C₆алкоксиметил, а обозначает 1, 2, 3 или 4 и
- 45 b обозначает 0, 1, 2, 3 или 4.

Из литературы известны различные соединения, которые были предложены для применения в качестве обладающих гельминтоцидными свойствами действующих веществ в составе пестицидов, предназначенных для использования на домашних животных и продуктивном скоте. Однако такие известные в настоящее время соединения не в полной мере удовлетворяют по своим биологическим свойствам всем требованиям, предъявляемым к ним в области борьбы с вредителями и паразитами, в связи с чем сохраняется необходимость в получении других соединений с более совершенными пестицидными свойствами, прежде всего для борьбы с эндопаразитами. Согласно

изобретению, эту задачу в определенной степени удается решить с помощью предлагаемых в нем соединений формулы I.

В приведенных выше значениях заместителей алкил в качестве индивидуальной группы и в качестве структурного элемента других групп и соединений, таких как галоалкил, алкиламиногруппа, алкоксигруппа, алкилтиогруппа, алкилсульфинил и алкилсульфонил, является в каждом случае с учетом количества атомов углерода в конкретной группе или конкретном соединении либо прямоцепочечным, например представляет собой метил, этил, пропил, бутил, пентил, гексил, гептил или октил, либо разветвленным, например представляет собой изопропил, изобутил, втор-бутил, трет-бутил, изопентил, неопентил или изогексил.

Циклоалкил в качестве индивидуальной группы и в качестве структурного элемента других групп и соединений, таких как галоциклоалкил, циклоалкоксигруппа и циклоалкилтиогруппа, представляет собой в каждом случае с учетом количества атомов углерода в конкретной группе или конкретном соединении циклопропил, циклобутил, циклопентил, циклогексил, циклогептил или циклооктил.

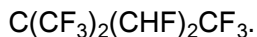
Алкенил в качестве индивидуальной группы и в качестве структурного элемента других групп и соединений является в каждом случае с учетом количества атомов углерода в конкретной группе или конкретном соединении и сопряженных или изолированных двойных связей либо прямоцепочечным, например представляет собой аллил, 2-бутенил, 3-пентенил, 1-гексенил, 1-гептенил, 1,3-гексадиенил или 1,3-октадиенил, либо разветвленным, например представляет собой изопропенил, изобутенил, изопренил, трет-пентенил, изогексенил, изогептенил или изооктенил.

Алкинил в качестве индивидуальной группы и в качестве структурного элемента других групп и соединений является в каждом случае с учетом количества атомов углерода в конкретной группе или конкретном соединении и сопряженных или изолированных двойных связей либо прямоцепочечным, например представляет собой пропаргил, 2-бутинил, 3-пентинил, 1-гексинил, 1-гептинил, 3-гексен-1-инил или 1,5-гептадиен-3-инил, либо разветвленным, например представляет собой 3-метилбут-1-инил, 4-этилпент-1-инил, 4-метилгекс-2-инил или 2-метилгепт-3-инил.

Гетероарил представляет собой пиридил, тиенил, фуранил, пиррил, бензотиенил, бензофуранил, индолил или индазол, предпочтительно пиридил или тиенил, прежде всего пиридил.

Галоген обычно представляет собой фтор, хлор, бром или иод. То же самое относится и к галогену ("гало-"), являющемуся элементом других групп и соединений, таких как галоалкил и галофенил.

Галогензамещенные углеродсодержащие группы и соединения могут быть частично галогенированными или пергалогенированными, при этом галогеновые заместители в случае полигалогенирования могут быть идентичными или различными. Примерами галоалкила в качестве индивидуальной группы и в качестве структурного элемента других групп и соединений, таких как галоалкоксигруппа или галоалкилтиогруппа, служат метил, который в качестве заместителей содержит от одного до трех атомов фтора, хлора и/или брома, например CHF_2 или CF_3 , этил, который в качестве заместителей содержит от одного до пяти атомов фтора, хлора и/или брома, например CH_2CF_3 , CF_2CF_3 , CF_2CCl_3 , CF_2CHCl_2 , CF_2CHF_2 , CF_2CFCl_2 , CF_2CHBr_2 , CF_2CHClF , CF_2CHBrF или CClFCHClF , пропил либо изопропил, каждый из которых в качестве заместителей содержит от одного до семи атомов фтора, хлора и/или брома, например $\text{CH}_2\text{CHBrCH}_2\text{Br}$, $\text{CF}_2\text{CHF}_2\text{CF}_3$, $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ или $\text{CH}(\text{CF}_3)_2$, бутил либо один из его изомеров, каждый из которых в качестве заместителей содержит от одного до девяти атомов фтора, хлора и/или брома, например $\text{CF}(\text{CF}_3)\text{CH}_2\text{CF}_3$ или $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_2\text{CF}_3$, пентил либо один из его изомеров, каждый из которых в качестве заместителей содержит от одного до одиннадцати атомов фтора, хлора и/или брома, например $\text{CF}(\text{CF}_3)(\text{CHF})_2\text{CF}_3$ или $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$, и гексил либо один из его изомеров, каждый из которых в качестве заместителей содержит от одного до тринадцати атомов фтора, хлора и/или брома, например $(\text{CH}_2)_4\text{CHBrCH}_2\text{Br}$, $\text{CF}_2(\text{CHF})_4\text{CF}_3$, $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_4\text{CF}_3$ или



Алкоксигруппы предпочтительно имеют цепь длиной от 1 до 6 атомов углерода. В качестве примеров алкоксигруппы можно назвать метокси-, этокси-, пропокси-, изопропокси-, н-бутокси-, изобутокси-, втор-бутокси- и трет-бутоксигруппу, а также

5 изомеры пентилоксигруппы и гексилоксигруппы, предпочтительны при этом метокси- и этоксигруппа. Галоалкоксигруппы предпочтительно имеют цепь длиной от 1 до 6 атомов углерода. В качестве примеров галоалкоксигруппы можно назвать фторметокси-, дифторметокси-, трифторметокси-, 2,2,2-трифторэтокси-, 1,1,2,2-тетрафторэтокси-, 2-фторэтокси-, 2-хлорэтокси-, 2,2-дифторэтокси- и 2,2,2-трихлорэтоксигруппу,

10 предпочтительны из которых дифторметокси-, 2-хлорэтокси- и трифторметоксигруппа.

Предпочтительными согласно изобретению соединениями являются следующие:

(1) соединение формулы I, в котором Ar_1 и Ar_2 независимо друг от друга обозначают незамещенный фенил либо одно- или многозамещенный фенил, заместители которого могут иметь независимые друг от друга значения и выбраны из группы, включающей

15 галоген, нитрогруппу, цианогруппу, C_1 - C_6 алкил, гало- C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 алкоксигруппу, гало- C_1 - C_6 алкоксигруппу, C_2 - C_6 алкенил, гало- C_2 - C_6 алкенил, C_2 - C_6 алкинил, C_3 - C_6 циклоалкил, C_2 - C_6 алкенилоксигруппу, гало- C_2 - C_6 алкенилоксигруппу, C_1 - C_6 алкилтиогруппу, гало- C_1 - C_6 алкилтиогруппу, C_1 - C_6 алкиламиногруппу,

20 ди- C_1 - C_6 алкиламиногруппу, C_1 - C_6 алкилкарбонил, гало- C_1 - C_6 алкилкарбонил, C_1 - C_6 алкоксикарбонил, C_1 - C_6 алкиламинокарбонил и ди- C_1 - C_6 алкиламинокарбонил, или обозначают незамещенный либо одно- или многозамещенный гетероарил, заместители которого, если он является замещенным, могут иметь независимые друг от друга значения и выбраны из группы, включающей галоген,

25 нитрогруппу, цианогруппу, C_1 - C_6 алкил, гало- C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 алкоксигруппу, гало- C_1 - C_6 алкоксигруппу, C_2 - C_6 алкенилоксигруппу, гало- C_2 - C_6 алкенилоксигруппу, C_1 - C_6 алкилтиогруппу, гало- C_1 - C_6 алкилтиогруппу, C_1 - C_6 алкиламиногруппу и ди- C_1 - C_6 алкиламиногруппу, или обозначают незамещенный либо одно- или многозамещенный нафтил, заместители

30 которого, если он является замещенным, могут иметь независимые друг от друга значения и выбраны из группы, включающей галоген, нитрогруппу, цианогруппу, C_1 - C_6 алкил, гало- C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 алкоксигруппу, гало- C_1 - C_6 алкоксигруппу, C_2 - C_6 алкенилоксигруппу, гало- C_2 - C_6 алкенилоксигруппу, C_1 - C_6 алкилтиогруппу, гало- C_1 - C_6 алкилтиогруппу, C_1 - C_6 алкиламиногруппу и ди- C_1 - C_6 алкиламиногруппу, прежде

35 всего независимо друг от друга обозначают незамещенный либо одно- или многозамещенный фенил, заместители которого могут иметь независимые друг от друга значения и выбраны из группы, включающей галоген, C_1 - C_6 алкил, гало- C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 алкоксигруппу, гало- C_1 - C_6 алкоксигруппу, C_3 - C_6 циклоалкил, C_1 - C_6 алкилтиогруппу,

40 гало- C_1 - C_6 алкилтиогруппу, C_1 - C_6 алкилкарбонил, гало- C_1 - C_6 алкилкарбонил, C_1 - C_6 алкоксикарбонил, C_1 - C_6 алкиламинокарбонил и ди- C_1 - C_6 алкиламинокарбонил, незамещенный либо одно- или многозамещенный гетероарил, заместители которого, если он является замещенным, могут иметь независимые друг от друга значения и выбраны из группы, включающей

45 галоген, C_1 - C_6 алкил, гало- C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 алкоксигруппу, гало- C_1 - C_6 алкоксигруппу, C_1 - C_6 алкиламиногруппу и ди- C_1 - C_6 алкиламиногруппу, или незамещенный либо одно- или многозамещенный нафтил, заместители которого, если он является замещенным, могут иметь независимые друг от друга значения и выбраны из группы, включающей галоген, C_1 - C_6 алкил, гало- C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 алкоксигруппу,

50 гало- C_1 - C_6 алкоксигруппу, C_1 - C_6 алкиламиногруппу и ди- C_1 - C_6 алкиламиногруппу, в частности независимо друг от друга обозначают незамещенный либо одно- или многозамещенный фенил, заместители которого могут иметь независимые друг от друга значения и выбраны из группы, включающей галоген, C_1 - C_6 алкил,

гало-С₁-С₆алкил, С₁-С₆алкоксигруппу и гало-С₁-С₆алкоксигруппу, или незамещенный либо одно- или многозамещенный гетероарил, заместители которого, если он является замещенным, могут иметь независимые друг от друга значения и выбраны из группы, включающей галоген, С₁-С₆алкил и гало-С₁-С₆алкил;

- 5 (2) соединение формулы I, в котором R₄, R₅, R₆, R₇ и R₈ независимо друг от друга обозначают водород, галоген, незамещенный С₁-С₆алкил либо одно- или многозамещенный С₁-С₆алкил, незамещенный С₂-С₆алкенил либо одно- или многозамещенный С₂-С₆алкенил, незамещенный С₂-С₆алкинил либо одно- или многозамещенный С₂-С₆алкинил, при этом заместители в каждом случае могут иметь
- 10 независимые друг от друга значения и выбраны из группы, включающей галоген, С₁-С₆алкоксигруппу и гало-С₁-С₆алкоксигруппу, незамещенный С₃-С₆циклоалкил либо одно- или многозамещенный С₃-С₆циклоалкил, заместители которого могут иметь независимые друг от друга значения и выбраны из группы, включающей галоген
- 15 и С₁-С₆алкил, или незамещенный фенил либо одно- или многозамещенный фенил, заместители которого могут иметь независимые друг от друга значения и выбраны из группы, включающей галоген, нитрогруппу, цианогруппу, С₁-С₆алкил, гало-С₁-С₆алкил, С₁-С₆алкоксигруппу, гало-С₁-С₆алкоксигруппу, С₁-С₆алкилсульфонил, гало-С₁-С₆алкилсульфонил, С₁-С₆алкиламиногруппу и ди-С₁-С₆алкиламиногруппу, прежде всего независимо друг от друга обозначают водород, галоген, незамещенный С₁-С₆алкил
- 20 либо одно- или многозамещенный С₁-С₆алкил, незамещенный С₂-С₆алкенил либо одно- или многозамещенный С₂-С₆алкенил, незамещенный С₂-С₆алкинил либо одно- или многозамещенный С₂-С₆алкинил, при этом заместители в каждом случае могут иметь независимые друг от друга значения и выбраны из группы, включающей галоген и С₁-С₆алкоксигруппу, незамещенный С₃-С₆циклоалкил либо одно- или
- 25 многозамещенный С₃-С₆циклоалкил, заместители которого могут иметь независимые друг от друга значения и выбраны из группы, включающей галоген и С₁-С₄алкил, или незамещенный фенил либо одно- или многозамещенный фенил, заместители которого могут иметь независимые друг от друга значения и выбраны из группы, включающей галоген, нитрогруппу, цианогруппу, С₁-С₆алкил, гало-С₁-С₆алкил, С₁-С₆алкоксигруппу или
- 30 гало-С₁-С₆алкоксигруппу, в частности независимо друг от друга обозначают водород, галоген, С₁-С₄алкил или гало-С₁-С₄алкил;

(3) соединение формулы I, в котором W обозначает O, S или N(R₉), прежде всего O или S, в частности O,

- (4) соединение формулы I, в котором R₉ обозначает водород или С₁-С₄алкил, прежде
- 35 всего водород или С₁-С₂алкил, в частности водород;

(5) соединение формулы I, в котором X обозначает O или N(R₁₀), прежде всего N(R₁₀),

(6) соединение формулы I, в котором R₁₀ обозначает водород, С₁-С₄алкил или гало-С₁-С₄алкил, прежде всего водород или С₁-С₄алкил, в частности водород;

- (7) соединение формулы I, в котором a обозначает 1, 2 или 3, прежде всего 1 или 2,
- 40 в частности 1;

(8) соединение формулы I, в котором b обозначает 0, 1, 2 или 3, прежде всего 0 или 1, в частности 0;

(9) соединение формулы I, в котором

- Ar₁ и Ar₂ независимо друг от друга обозначают незамещенный фенил либо одно- или
- 45 многозамещенный фенил, заместители которого могут иметь независимые друг от друга значения и выбраны из группы, включающей галоген, нитрогруппу, цианогруппу, С₁-С₆алкил, гало-С₁-С₆алкил, С₁-С₆алкоксигруппу, гало-С₁-С₆алкоксигруппу, С₂-С₆алкенил, гало-С₂-С₆алкенил, С₂-С₆алкинил, С₃-С₆циклоалкил, С₂-С₆алкенилоксигруппу,
- 50 гало-С₂-С₆алкенилоксигруппу, С₁-С₆алкилтиогруппу, гало-С₁-С₆алкилтиогруппу, С₁-С₆алкиламиногруппу, ди-С₁-С₆алкиламиногруппу, С₁-С₆алкилкарбонил, гало-С₁-С₆алкилкарбонил, С₁-С₆алкоксикарбонил, С₁-С₆алкиламинокарбонил и

- ди-С₁-С₆алкиламинокарбонил, незамещенный либо одно- или многозамещенный гетероарил, заместители которого, если он является замещенным, могут иметь независимые друг от друга значения и выбраны из группы, включающей галоген, нитрогруппу, цианогруппу, С₁-С₆алкил, гало-С₁-С₆алкил, С₁-С₆алкоксигруппу,
- 5 гало-С₁-С₆алкоксигруппу, С₂-С₆алкенилоксигруппу, гало-С₂-С₆алкенилоксигруппу, С₁-С₆алкилтиогруппу, гало-С₁-С₆алкилтиогруппу, С₁-С₆алкиламиногруппу и ди-С₁-С₆алкиламиногруппу, или незамещенный либо одно- или многозамещенный нафтил, заместители которого, если он является замещенным, могут иметь независимые друг от друга значения и выбраны из
- 10 группы, включающей галоген, нитрогруппу, цианогруппу, С₁-С₆алкил, гало-С₁-С₆алкил, С₁-С₆алкоксигруппу, гало-С₁-С₆алкоксигруппу, С₂-С₆алкенилоксигруппу, гало-С₂-С₆алкенилоксигруппу, С₁-С₆алкилтиогруппу, гало-С₁-С₆алкилтиогруппу, С₁-С₆алкиламиногруппу и ди-С₁-С₆алкиламиногруппу,
- 15 R₄, R₅, R₆, R₇ и R₈ независимо друг от друга обозначают водород, галоген, незамещенный С₁-С₆алкил либо одно- или многозамещенный С₁-С₆алкил, незамещенный С₂-С₆алкенил либо одно- или многозамещенный С₂-С₆алкенил, незамещенный С₂-С₆алкинил либо одно- или многозамещенный С₂-С₆алкинил, при этом заместители в каждом случае могут иметь независимые друг от друга значения и выбраны из группы, включающей галоген и С₁-С₆алкоксигруппу, незамещенный С₃-С₆циклоалкил
- 20 либо одно- или многозамещенный С₃-С₆циклоалкил, заместители которого могут иметь независимые друг от друга значения и выбраны из группы, включающей галоген и С₁-С₆алкил, или незамещенный фенил либо одно- или многозамещенный фенил, заместители которого могут иметь независимые друг от друга значения и выбраны из группы, включающей галоген, нитрогруппу, цианогруппу, С₁-С₆алкил,
- 25 гало-С₁-С₆алкил, С₁-С₆алкоксигруппу, гало-С₁-С₆алкоксигруппу, С₁-С₆алкилсульфонил, гало-С₁-С₆алкилсульфонил, С₁-С₆алкиламиногруппу и ди-С₁-С₆алкиламиногруппу, W обозначает O, S или N(R₉), R₉ обозначает водород или С₁-С₄алкил, X обозначает O или N(R₁₀),
- 30 R₁₀ обозначает водород, С₁-С₄алкил или гало-С₁-С₄алкил, a обозначает 1,2 или 3 и b обозначает 0, 1, 2 или 3;
- (10) соединение формулы I, в котором Ar₁ и Ar₂ независимо друг от друга обозначают незамещенный либо одно- или
- 35 многозамещенный фенил, заместители которого, если он является замещенным, могут иметь независимые друг от друга значения и выбраны из группы, включающей галоген, С₁-С₆алкил, гало-С₁-С₆алкил, С₁-С₆алкоксигруппу, гало-С₁-С₆алкоксигруппу, С₃-С₆циклоалкил, С₁-С₆алкилтиогруппу, гало-С₁-С₆алкилтиогруппу, С₁-С₆алкилкарбонил,
- 40 гало-С₁-С₆алкилкарбонил, С₁-С₆алкоксикарбонил, С₁-С₆алкиламинокарбонил и ди-С₁-С₆алкиламинокарбонил, незамещенный либо одно- или многозамещенный гетероарил, заместители которого, если он является замещенным, могут иметь независимые друг от друга значения и выбраны из группы, включающей галоген, С₁-С₆алкил, гало-С₁-С₆алкил, С₁-С₆алкоксигруппу,
- 45 гало-С₁-С₆алкоксигруппу, С₁-С₆алкиламиногруппу и ди-С₁-С₆алкиламиногруппу, или незамещенный либо одно- или многозамещенный нафтил, заместители которого, если он является замещенным, могут иметь независимые друг от друга значения и выбраны из группы, включающей галоген, С₁-С₆алкил, гало-С₁-С₆алкил, С₁-С₆алкоксигруппу, гало-С₁-С₆алкоксигруппу, С₁-С₆алкиламиногруппу и ди-С₁-С₆алкиламиногруппу, R₄, R₅, R₆,
- 50 R₇ и R₈ независимо друг от друга обозначают водород, галоген, незамещенный С₁-С₆алкил либо одно- или многозамещенный С₁-С₆алкил, незамещенный С₂-С₆алкенил либо одно- или многозамещенный С₂-С₆алкенил, незамещенный С₂-С₆алкинил либо одно- или многозамещенный С₂-С₆алкинил, при этом заместители в каждом случае могут иметь

независимые друг от друга значения и выбраны из группы, включающей галоген и C₁-C₆алкоксигруппу, незамещенный C₃-C₆циклоалкил либо одно- или многозамещенный C₃-C₆циклоалкил, заместители которого могут иметь независимые друг от друга значения и выбраны из группы, включающей галоген и C₁-C₄алкил, или незамещенный фенил либо одно- или многозамещенный фенил, заместители которого могут иметь независимые друг от друга значения и выбраны из группы, включающей галоген, нитрогруппу, цианогруппу, C₁-C₆алкил, гало-C₁-C₆алкил, C₁-C₆алкоксигруппу или гало-C₁-C₆алкоксигруппу,

W обозначает O или S,

R₉ обозначает водород или C₁-C₂алкил,

X обозначает N(R₁₀),

R₁₀ обозначает водород или C₁-C₄алкил,

a обозначает 1 или 2 и

b обозначает 0 или 1;

(11) соединение формулы I, в котором

Ar₁ и Ar₂ независимо друг от друга обозначают незамещенный либо одно- или многозамещенный фенил, заместители которого, если он является замещенным, могут иметь независимые друг от друга значения и выбраны из группы, включающей галоген, C₁-C₆алкил, гало-C₁-C₆алкил, C₁-C₆алкоксигруппу и гало-C₁-C₆алкоксигруппу, или незамещенный либо одно- или многозамещенный гетероарил, заместители которого, если он является замещенным, могут иметь независимые друг от друга значения и выбраны из группы, включающей галоген, C₁-C₆алкил и гало-C₁-C₆алкил,

R₄, R₅, R₆, R₇ и R₈ независимо друг от друга обозначают водород, галоген, C₁-C₄алкил или гало-C₁-C₄алкил,

W обозначает O,

R₉ обозначает водород,

X обозначает N(R₁₀),

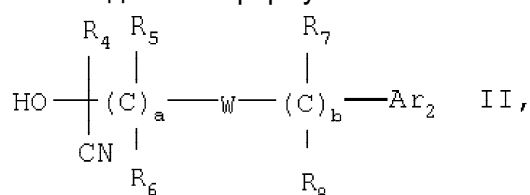
R₁₀ обозначает водород,

a обозначает 1 и

b обозначает 1.

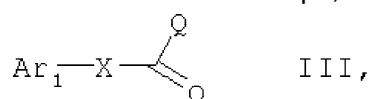
Согласно изобретению, особо предпочтительны соединения формулы I, перечисленные ниже в таблице 1, и прежде всего соединения, описанные ниже в примерах синтеза.

Изобретение относится также к способу получения соединений формулы I, соответственно в свободной форме или в виде соли, заключающемуся, например, в том, что соединение формулы



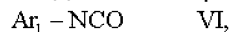
которое является известным соединением или которое можно получать аналогично соответствующим известным соединениям и в котором R₄, R₅, R₆, R₇, R₈, Ar₂, W, a и b имеют указанные для формулы I значения,

а) для получения соединения формулы I, в котором X имеет указанные для формулы I значения, за исключением NH, подвергают взаимодействию, необязательно в присутствии основного катализатора, с соединением формулы



которое является известным соединением или которое можно получать аналогично соответствующим известным соединениям и в котором Ar₁ и X имеют указанные для формулы I значения, а Q обозначает уходящую группу, либо

б) для получения соединения формулы I, в котором X обозначает NH, а n обозначает 1, подвергают взаимодействию, необязательно в присутствии основного катализатора, с соединением формулы



5 которое является известным соединением или которое можно получать аналогично соответствующим известным соединениям и в котором Ar_1 имеет указанные для формулы I значения, и затем при необходимости соединение формулы I, полученное описанным выше способом или иным путем, соответственно в свободной форме или в виде соли, превращают в другое соединение формулы I, разделяют полученную этим способом смесь
10 изомеров и выделяют целевой изомер и/или свободное соединение формулы I, полученное описанным выше способом, переводят в соль либо соль соединения формулы I, полученную описанным выше способом, переводят в свободное соединение формулы I или в другую соль.

15 Приведенные выше пояснения касательно солей соединений формулы I аналогичным образом относятся и к солям исходных соединений, указанных выше и в последующем описании.

При осуществлении рассмотренного выше способа реагенты можно подвергать взаимодействию между собой как таковые, т.е. без добавления растворителя или разбавителя, например в расплавленном состоянии. Однако в большинстве случаев может
20 оказаться целесообразным добавлять к реакционной смеси инертный растворитель или разбавитель либо их смесь. В качестве примеров таких растворителей и разбавителей можно назвать ароматические, алифатические и алициклические углеводороды и галогенированные углеводороды, такие как бензол, толуол, ксилол, мезителен, тетралин, хлорбензол, дихлорбензол, бромбензол, петролейный эфир, гексан, циклогексан,
25 дихлорметан, трихлорметан, тетрахлорметан, дихлорэтан, трихлорэтан или тетрахлорэтан, простые эфиры, такие как диэтиловый эфир, дипропиловый эфир, диизопропиловый эфир, дибутиловый эфир, трет-бутилметилловый эфир, монометилловый эфир этиленгликоля, моноэтиловый эфир этиленгликоля, диметилловый эфир этиленгликоля, диметоксидиэтиловый эфир, тетрагидрофуран или диоксан, кетоны, такие как ацетон,
30 метилэтилкетон или метилизобутилкетон, амиды, такие как N,N-диметилформамид, N,N-диэтилформамид, N,N-диметилацетамид, N-метилпирролидон или триамид гексаметилфосфорной кислоты, нитрилы, такие как ацетонитрил или пропионитрил, и сульфоксиды, такие как диметилсульфоксид.

Предпочтительными уходящими группами Q являются галогены, главным образом хлор.
35 В качестве примера оснований, пригодных для катализа проводимой в соответствии с предлагаемым в изобретении способом реакции, можно назвать гидроксиды, гидриды, амиды, алканолы, ацетаты, карбонаты, диалкиламиды или алкилсилиламиды щелочных или щелочноземельных металлов, алкиламины, алкилендиамины, необязательно N-алкилированные, необязательно ненасыщенные циклоалкиламины, гетероциклические
40 основания, гидроксиды аммония, а также карбоциклические амины. Конкретными примерами подобных оснований являются гидроксид, гидрид, амид, метанолы, ацетат и карбонат натрия, трет-бутанолят, гидроксид, карбонат и гидрид калия, диизопропиламид лития, бис(триметилсилил)амид калия, гидрид кальция, триэтиламин, диизопропилэтиламин, триэтилендиамин, циклогексиламин, N-циклогексил-N,N-
45 диметиламин, N,N-диэтиланилин, пиридин, 4-(N,N-диметиламино)пиридин, хинуклидин, N-метилморфолин, гидроксид бензилтриметиламмония, а также 1,5-диазабицикло[5.4.0]ундец-5-ен (ДБУ).

Реакцию целесообразно проводить при температуре от примерно 0 до примерно 150°C, предпочтительно от примерно 20 до примерно 100°C.

50 Соли соединений формулы I можно получать известным методом. Так, например, кислотнo-аддитивные соли соединений формулы I получают их обработкой приемлемой кислотой или приемлемым ионообменным реагентом, а соли с основаниями - их обработкой приемлемым основанием или приемлемым ионообменным реагентом.

Соли соединений формулы I можно обычным путем превращать в свободные соединения формулы I, для чего кислотнo-аддитивные соли можно, например, обрабатывать приемлемым основным агентом или приемлемым ионообменным реагентом, а соли с основаниями можно, например, обрабатывать приемлемой кислотой или приемлемым ионообменным реагентом.

Соли соединений формулы I можно известным образом превращать в другие соли соединений формулы I, при этом кислотнo-аддитивные соли можно, например, превращать в другие кислотнo-аддитивные соли, например обработкой соли неорганической кислоты, такой как гидрохлорид, приемлемой металлической солью, такой как натриевая, бариевая или серебряная соль, кислоты, например ацетатом серебра, в приемлемом растворителе, в котором образующаяся неорганическая соль, например хлорид серебра, не растворима и в результате выпадает в осадок из реакционной смеси.

В зависимости от конкретной методики и/или условий реакции соединения формулы I, обладающие солеобразующими свойствами, можно получать в свободной форме либо в виде солей.

Соединения формулы I можно также получать в виде их гидратов и/или они могут также содержать молекулы других растворителей, которые, например, могут при необходимости использоваться для кристаллизации соединений, представленных в твердом виде.

Соединения формулы I при определенных условиях могут быть представлены в виде их возможных оптических и/или геометрических изомеров либо в виде их смеси. В соответствии с этим настоящее изобретение относится и к чистым изомерам, и ко всем возможным смесям изомеров, что подразумевается выше и в последующем описании, даже если в каждом отдельном случае и не указаны конкретные подробности касательно стереохимического строения соединений.

Смеси диастереоизомеров соединений формулы I, получаемые предлагаемым в изобретении способом или иным путем, можно на основе различий физико-химических свойств компонентов таких смесей разделять известным методом, например фракционированной кристаллизацией, перегонкой и/или хроматографией, на чистые диастереоизомеры.

Смеси энантиомеров, которые образуются при соответствующих условиях, можно разделять на чистые изомеры известными методами, например перекристаллизацией из оптически активного растворителя, хроматографией на хиральных адсорбентах, например жидкостной хроматографией высокого давления (ЖХВД) на ацетилцеллюлозе, с помощью пригодных для этой цели микроорганизмов, расщеплением с помощью особых иммобилизованных ферментов или образованием соединений включения, например с использованием хиральных краун-эфиров, в каковом случае только один энантиомер образует комплекс.

Помимо разделения соответствующих смесей изомеров согласно изобретению существует также возможность сразу получать общеизвестными методами диастереоселективного или энантиоселективного синтеза чистые диастереоизомеры или энантиомеры, например за счет использования при проведении предлагаемого в изобретении способа исходных материалов с соответствующим стереохимическим строением.

В любом случае предпочтительно выделять или синтезировать биологически более активный изомер, например энантиомер, если индивидуальные компоненты обладают различной биологической активностью.

В предлагаемом в изобретении способе предпочтительно использовать те исходные материалы и промежуточные продукты, которые позволяют получать соединения формулы I, которые представлены в начале описания как наиболее предпочтительные.

Настоящее изобретение относится, в частности, к тому варианту осуществления способа получения соединений, который описан ниже в примере.

Настоящее изобретение относится также к новым исходным материалам и промежуточным продуктам, используемым согласно изобретению для получения

соединений формулы I, к применению этих исходных материалов и промежуточных продуктов и к способу их получения.

Предлагаемые в изобретении соединения формулы I отличаются широким спектром действия и являются ценными действующими веществами, позволяющими вести борьбу с вредителями и паразитами, включая, в частности, борьбу с эндопаразитами у животных, и вместе с тем обладают хорошей переносимостью теплокровными животными, рыбами и растениями.

В контексте настоящего изобретения под эктопаразитами подразумеваются, в частности, насекомые и клещи, в том числе паразитиформные клещи. К подобным эктопаразитам относятся насекомые отряда Lepidoptera, Coleoptera, Homoptera, Heteroptera, Diptera, Thysanoptera, Orthoptera, Anoplura, Siphonaptera, Mallophaga, Thysanura, Isoptera, Psocoptera и Hymenoptera. Однако особо следует отметить тех эктопаразитов, которые "досаждают" людям или животным и которые являются переносчиками болезнетворных организмов, например мухи, такие как *Musca domestica*, *Musca vetustissima*, *Musca autumnalis*, *Fannia canicularis*, *Sarcophaga carnaria*, *Lucilia cuprina*, *Hypoderma bovis*, *Hypoderma lineatum*, *Chrysomya chloropyga*, *Dermatobia hominis*, *Cochliomyia hominivorax*, *Gasterophilus intestinalis*, *Oestrus ovis*, *Stomoxys calcitrans*, *Haematobia irritans*, и мелкие двукрылые насекомые (Nematocera, длинноусые), такие как Culicidae, Simuliidae, Psychodidae, а также кровососущие паразиты, например блохи, такие как *Ctenocephalides felis* и *Ctenocephalides canis* (блохи кошачья и собачья соответственно), *Xenopsylla cheopis*, *Pulex irritans*, *Dermatophilus penetrans*, вши, такие как *Damalina ovis*, *Pediculus humanis*, жалящие мухи и слепни (Tabanidae), *Haematopota* spp., такие как *Haematopota pluvialis*, *Tabanidea* spp., такие как *Tabanus nigrovittatus*, *Chrysopsinae* spp., такие как *Chrysops caecutiens*, мухи це-це, такие как видов *Glossinia*, жалящие насекомые, в частности тараканы, такие как *Blattella germanica*, *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, и клещи, такие как *Dermanyssus gallinae*, *Sarcoptes scabiei*, *Psoroptes ovis*, *Psorergates* spp., в том числе, но не исключительно, паразитиформные клещи. Последние относятся к отряду Acarina. В качестве примера известных представителей паразитиформных клещей можно назвать *Boophilus*, *Amblyomma*, *Anocentor*, *Dermacentor*, *Haemaphysalis*, *Hyalomma*, *Ixodes*, *Rhipicentor*, *Margaropus*, *Rhipicephalus*, *Argas*, *Otobius*, *Ornithodoros* и т.п., которые преимущественно заражают теплокровных животных, включая сельскохозяйственных животных, в частности крупный рогатый скот, свиней, овец и коз, домашнюю птицу, в частности кур, индеек и гусей, специально разводимых пушных зверей, например норок, лисиц, шиншиллы, кроликов и т.п., а также комнатных и домашних животных, например кошек и собак, и человека.

Предлагаемые в изобретении соединения формулы I проявляют также эффективность на всех или отдельных стадиях развития не только обладающих нормальной чувствительностью вредителей и паразитов, но и устойчивых вредителей и паразитов, таких как насекомые и представители отряда Acarina. Инсектицидное, овицидное и/или акарицидное действие предлагаемых в изобретении действующих веществ может проявляться непосредственно, т.е. проявляться в гибели вредителей и паразитов, наступающей сразу же после обработки либо только по истечении некоторого периода времени, например в процессе линьки, или в разрушении их яиц, или же опосредованно, например проявляться в уменьшении количества откладываемых яиц и/или количества вылупляющихся из яиц особей, при этом хорошая активность соответствует гибели по меньшей мере 50-60% вредителей и паразитов.

Соединения формулы I могут также использоваться для борьбы с вредителями и паразитами в санитарно-гигиеническом секторе, прежде всего для борьбы с представителями из отряда Diptera семейств Sarcophagidae, Anophilidae и Culicidae, из отряда Orthoptera, Dictyoptera (например, семейства Blattidae) и из отряда Hymenoptera (например, семейства Formicidae).

Соединения формулы I позволяют также эффективно вести борьбу с паразитирующими

на растениях нематодами видов *Meloidogyne*, *Heterodera*, *Pratylenchus*, *Ditylenchus*, *Radopholus*, *Rizoglyphus* и т.д.

Предлагаемые в изобретении соединения позволяют, в частности, эффективно вести борьбу с гельминтами, среди которых эндопаразитические нематоды и трематоды могут
 5 являться причиной серьезных заболеваний у млекопитающих и домашней птицы, например у овец, свиней, коз, крупного рогатого скота, лошадей, ослов, собак, кошек, морских свинок и экзотических птиц. К типичным представителям таких нематод относятся *Haemonchus*, *Trichostrongylus*, *Ostertagia*, *Nematodirus*, *Cooperia*, *Ascaris*, *Bunostomum*, *Oesophagostomum*, *Charbertia*, *Trichuris*, *Strongylus*, *Trichonema*, *Dictyocaulus*,
 10 *Capillaria*, *Heterakis*, *Toxocara*, *Ascaridia*, *Oxyuris*, *Ancylostoma*, *Uncinaria*, *Toxascaris* и *Parascaris*. В качестве примера трематод можно назвать, в частности, представителей семейства *Fasciolidae*, прежде всего *Fasciola hepatica*. Особое преимущество соединений формулы I состоит в их эффективности при борьбе с теми паразитами, которые невосприимчивы к действующим веществам на основе
 15 бензимидазола.

Некоторые паразиты, относящиеся к видам *Nematodirus*, *Cooperia* и *Oesophagostomum*, заражают кишечник животного-хозяина, тогда как другие паразиты, относящиеся к видам *Haemonchus* и *Ostertagia*, паразитируют в желудке, а паразиты, относящиеся к виду *Dictyocaulus*, паразитируют в легочной ткани. Паразитов из семейств *Filariidae* и
 20 *Setariidae* можно обнаружить во внутриклеточной ткани, а также в различных органах, например в сердце, кровеносных сосудах, лимфатических сосудах и подкожной основе. При этом особо следует упомянуть такого паразита, как паразитирующий в сердце собак гельминт *Dirofilaria immitis*. Соединения формулы I высокоэффективны при борьбе с подобными паразитами.

К паразитам, с которыми также можно вести борьбу с помощью соединений формулы I, относятся и паразиты из класса *Cestoda* (ленточные черви), например представители семейства *Mesocestoidae*, прежде всего рода *Mesocestoides*, в частности *M. lineatus*, семейства *Dilepididae*, прежде всего *Dipylidium caninum*, *Joyeuxiella* spp., в частности *Joyeuxiella pasquali*, и *Diplopylidium* spp., и семейства *Taeniidae*, прежде всего
 30 *Taenia pisiformis*, *Taenia cervi*, *Taenia ovis*, *Taenia hydatigena*, *Taenia multiceps*, *Taenia taeniaeformis*, *Taenia serialis* и *Echinococcus* spp., наиболее предпочтительно *Taenia hydatigena*, *Taenia ovis*, *Taenia multiceps*, *Taenia serialis*, *Echinococcus granulosus* и *Echinococcus multilocularis*, а также *Multiceps multiceps*.

Особо следует отметить возможность борьбы с *Taenia hydatigena*, *T. pisiformis*, *T. ovis*, *T. taeniaeformis*, *Multiceps multiceps*, *Joyeuxiella pasquali*, *Dipylidium caninum*, *Mesocestoides* spp., *Echinococcus granulosus* и *E. multilocularis* у собак и кошек одновременно с борьбой с *Dirofilaria immitis*, *Ancylostoma* spp., *Toxocara* spp. и/или *Trichuris vulpis*.

Помимо этого соединения формулы I пригодны для борьбы с патогенными паразитами у
 40 человека. К типичным представителям подобных паразитов, которые обитают в пищеварительном тракте, относятся паразиты видов *Ancylostoma*, *Necator*, *Ascaris*, *Strongyloides*, *Trichinella*, *Capillaria*, *Trichuris* и *Enterobius*. Предлагаемые в изобретении соединения могут также эффективно использоваться для борьбы с паразитами видов *Wuchereria*, *Brugia*, *Onchocerca* и *Loa* из семейства *Filariidae*,
 45 которые обитают в крови, в различных тканях и различных органах, а также для борьбы с паразитами *Dracunculus* и паразитами видов *Strongyloides* и *Trichinella*, которые, в частности, заражают желудочно-кишечный тракт.

Соединения формулы I являются, кроме того, эффективными средствами борьбы с вредными и патогенными грибами на растениях, а также у человека и животных.

50 Высокая пестицидная активность предлагаемых в изобретении соединений формулы I проявляется в уничтожении по меньшей мере 50-60% вышеуказанных вредителей от всего их числа.

Соединения формулы I предпочтительно используют в немодифицированном виде или

что более предпочтительно совместно со вспомогательными веществами, обычно применяемыми в технологии получения препаративных форм, и, следовательно, такие соединения можно перерабатывать по известной технологии с получением, например, эмульгирующихся концентратов, непосредственно разбавляемых растворов, разбавленных эмульсий, растворимых порошков, гранул, а также микрокапсулированных в полимерные вещества препаратов. Тип препарата, равно как и методы обработки выбирают в соответствии с поставленными целями и преобладающими обстоятельствами.

Препаративные формы, т.е. композиции, составы или смеси, содержащие действующее вещество формулы I или подобные действующие вещества в сочетании с другими действующими веществами и при необходимости твердое или жидкое вспомогательное вещество, получают известным методом, например путем гомогенного смешения и/или измельчения действующих веществ с наполнителями, например растворителями, твердыми носителями и необязательно поверхностно-активными веществами (ПАВ).

В качестве указанных выше растворителей можно использовать, например, спирты, такие как этанол, пропанол или бутанол, гликоли и их простые и сложные эфиры, такие как пропиленгликоль, дипропиленгликолевый эфир, этиленгликоль, монометиловый либо -этиловый эфир этиленгликоля, кетоны, такие как циклогексанон, изофорон или диацетаноловый спирт, сильные полярные растворители, такие как N-метил-2-пирролидон, диметилсульфоксид или диметилформамид, или воду, растительные масла, такие как рапсовое, касторовое, кокосовое или соевое масло, а также, когда это уместно, силиконовые масла.

Предпочтительными препаративными формами для борьбы с гельминтами у теплокровных животных являются растворы, эмульсии, суспензии (препараты для вливания в ротовую полость животного), кормовые добавки, порошки, таблетки, включая шипучие таблетки, пилюли, капсулы, микрокапсулы и саморастекающиеся формы для обработки наливом, при этом при изготовлении того или иного препарата следует учитывать физиологическую совместимость включаемых в его состав эксципиентов.

В качестве связующих при изготовлении таблеток и пилюль можно использовать химически модифицированные природные полимерные вещества, растворимые в воде или в спирте, такие как крахмал, целлюлоза или производные протеинов (например, метилцеллюлоза, карбоксиметилцеллюлоза, этилгидроксиэтилцеллюлоза, такие протеины, как зеин, желатин и т.п.), а также синтетические полимеры, такие как поливиниловый спирт, поливинилпирролидон и т.д. В состав таблеток включают также наполнители (например, крахмал, микрокристаллическую целлюлозу, сахар, лактозу т.д.), смазывающие вещества и разрыхлители.

Если гельминтоциды представлены в виде кормовых концентратов, то в их состав в качестве носителей включают, например, нормированные (продуктивные) корма, кормовое зерно или протеиновые концентраты. Подобные кормовые концентраты или композиции помимо действующих веществ могут также содержать добавки, витамины, антибиотики, химиотерапевтические средства либо иные пестициды, главным образом бактериостатические средства, фунгистатические средства, кокцидиостатические средства, или даже гормональные препараты, вещества, обладающие анаболическим действием, или стимулирующие рост вещества, которые влияют на качество мяса убойных животных либо оказывают иное благоприятное действие на организм. При добавлении подобных композиций или содержащихся в них действующих веществ формулы I непосредственно к корму или в поилку предпочтительно, чтобы концентрация действующих веществ в получаемом кормовом или питьевом составе составляла примерно от 0,0005 до 0,02 мас.% (от 5 до 200 ч./млн).

Предлагаемые в изобретении соединения формулы I могут использоваться индивидуально или в сочетании с другими биоцидами. Так, например, для повышения эффективности эти соединения можно комбинировать с пестицидами, обладающими таким же действием, или, например, для расширения спектра действия эти соединения можно комбинировать с веществами, обладающими иным действием. В некоторых случаях может

оказаться целесообразным добавление так называемых репеллентов. Поскольку соединения формулы I являются "адультицидами", т.е. эффективны главным образом при борьбе с паразитами, полностью достигшими взрослой стадии развития (стадии имаго), может оказаться целесообразным добавление к ним пестицидов, которые более эффективны при борьбе с паразитами на более ранних стадиях их развития. Таким путем можно вести борьбу с большей частью популяции паразитов, наносящих значительный экономический ущерб. Помимо этого подобное комбинированное действие позволяет в значительной степени воспрепятствовать развитию у таких паразитов резистентности к действующим веществам. Большое число комбинированных препаратов могут также проявлять синергетический эффект, благодаря чему появляется возможность снизить общую норму расхода действующего вещества, что целесообразно с экологической точки зрения. Предпочтительные группы действующих веществ, а также особо предпочтительные действующие вещества, одно или несколько из которых могут использоваться в сочетании с соединением формулы I, указаны ниже.

Действующими веществами, пригодными для использования в смеси с предлагаемыми в изобретении соединениями, являются биоциды, например инсектициды и акарициды с различным механизмом действия, которые указаны ниже и которые уже достаточно давно известны специалистам в данной области, в частности ингибиторы синтеза хитина, регуляторы роста, действующие по типу ювенильных гормонов вещества, действующие по типу адультицидов вещества, инсектициды с широким спектром действия, акарициды с широким спектром действия и нематоциды, а также хорошо известные гельминтоциды и отпугивающие насекомых и/или клещей вещества, т.е. указанные выше репелленты или препараты, обеспечивающие самооткрепление паразитов от кожного покрова.

В качестве примера пригодных для использования в сочетании с предлагаемыми в изобретении соединениями инсектицидов и акарицидов можно назвать следующие (но не ограничиваясь только ими):

- | | | |
|-------------------------------------|--------------------|-------------------------|
| 1. абамектин | 18. бенфуракарб | 36. хлорфенапир |
| 2. АС 303630 | 19. бенсултап | 37. хлорфлуазурон |
| 3. ацефат | 20. β-цифлутрин | 38. хлормефос |
| 4. акринатрин | 21. бифентрин | 39. хлорпирифос |
| 5. аланикарб | 22. БФМК | 40. цис-ресметрин |
| 6. альдикарб | 23. брофенпрокс | 41. клоцитрин |
| 7. α-циперметрин | 24. бромофос А | 42. клофентизин |
| 8. альфаметрин | 25. буфенкарб | 43. цианофос |
| 9. амитраз | 26. бупрофезин | 44. циклопротрин |
| 10. авермектин В ₁ | 27. бутокарбоксим | 45. цифлутрин |
| 11. AZ 60541 | 28. бутилпиридабен | 46. цигексатин |
| 12. азинфос А | 29. кадусафос | 47. D-2341 |
| 13. азинфос М | 30. карбарил | 48. дельтаметрин |
| 14. азинфос-метил | 31. карбофуран | 49. деметон М |
| 15. азоциклотин | 32. карбофентион | 50. деметон S |
| 16. токсин <i>Bacillus subtilis</i> | 33. картап | 51. деметон-S-метил |
| 17. бендиокарб | 34. хлэктокарб | 52. дибутиламинотио |
| | 35. хлорэтоксифос | 53. дихлофентион |
| 54. диклифос | 88. флуфенпрокс | 119. милбемектин |
| 55. диэтион | 89. фонофос | 120. оксидектин |
| 56. дифлубензурон | 90. формотион | 121. налед |
| 57. диметоат | 91. фостиазат | 122. NC 184 |
| 58. диметилвинфос | 92. фубфенпрокс | 123. NI-25, ацетамиприд |
| 59. диоксатион | 93. HCH | 124. нитенпирам |
| 60. DPX-MP062 | 94. гелтенофос | 125. ометоат |
| 61. эдифенфос | 95. гексафлумурон | 126. оксамил |
| 62. эмабектин | 96. гекситиазокс | 127. оксидеметон М |
| 63. эндосульфат | 97. гидропрен | 128. оксидепрофос |
| 64. эсфенвалерат | 98. имидаклоприд | 129. паратион |
| 65. этиофенкарб | 99. инсектицидно | 130. паратион-метил |
| 66. этион | активные грибы | 131. перметрин |

	67.этофенпрокс	100. инсектицидно	132. фентоат
	68. этопрофос	активные нематоды	133. форат
	69. этримфос	101. инсектицидно	134. фосалон
	70. фенамифос	активные вирусы	135. фосмет
5	71. феназахин	102. ипробенфос	136. фоксим
	72. фенбутатиноксид	103. изофенфос	137. пиримикарб
	73. фенитротион	104. изопрокарб	138. пиримифос А
	74. фенобукарб	105. изоксатион	139. пиримифос М
	75. фенотиокарб	106. ивермектин	140. промеккарб
	76. феноксикарб	107. λ-цигалотрин	141. пропафос
10	77. фенпропатрин	108. луфенурон	142. пропоксур
	78. фенпирад	109. малатион	143. протиофос
	79. фенпироксимат	110. мекарбам	144. протоат
	80. фентион	111. месульфенфос	145. пираклофос
	81. фенвалерат	112. метальдегид	146. пирадафентион
	82. фипронил	113. метамидофос	147. пиресметрин
15	83. флуазинам	114. метиокарб	148. пиретрум
	84. флуазурон	115. метомил	149. пиридабен
	85. флуциклоксурон	116. метопрен	150. пиримидифен
	86. флуцитринат	117. метолкарб	151. пирипроксифен
	87. флуфеноксурон	118. мевинфос	152. RH-5992
20	153. RH-2485	165. темефос	177. триазофос
	154. салитион	166. тербам	178. триазурон
	155. себуфос	167. тербуфос	179. трихлорфон
	156. силафлуофен	168. тетрахлорвинфос	180. трифлумурон
	157. спиносад	169. тиафенокс	181. триметакарб
	158. сульфотеп	170. тиодикарб	182. ванидотион
25	159. сульпрофос	171. тиофанокс	183. КМК(3,5-
	160. тебуфенозид	172. тионазин	ксиллметилкарбамат)
	161. тебуфенпирад	173. турингенсин	184. ксиллкарб
	162. тебупиримфос	174. тралометрин	185. Y1 5301/5302
	163. тефлубензурон	175. триаратен	186. ζ-циперметрин
	164. тефлутрин	176. триазамат	187. зетаметрин

30

Ниже приведены не ограничивающие объем изобретения примеры пригодных для применения согласно изобретению гелминтоцидов, некоторые представители которых в дополнение к гелминтоцидному действию обладают также инсектицидным и акарицидным действием и поэтому частично уже упоминались в приведенном выше перечне:

35

(A1) празиквантел: 2-циклогексилкарбонил-4-оксо-1,2,3,6,7,11b-гексагидро-4Н-пиразино[2,1-α]изохинолин;

(A2) клосантел: 3,5-дииод-N-[5-хлор-2-метил-4-(α-циано-4-хлорбензил)фенил]салициламид;

(A3) триклабендазол: 5-хлор-6-(2,3-дихлорфенокси)-2-метилтио-1Н-бензимидазол;

40

(A4) левамисол: L-(-)-2,3,5,6-тетрагидро-6-фенилимидазо[2,1b]тиазол;

(A5) мебендазол: метиловый эфир (5-бензоил-1Н-бензимидазол-2-ил)карбаминовой кислоты;

(A6) омфалотин: макроциклический ферментативный продукт жизнедеятельности гриба *Omphalotus olearius*, описанный в WO 97/20857;

45

(A7) абамектин: авермектин В₁;

(A8) ивермектин, 22,23-дигидроавермектин В₁;

(A9) моксидектин, 5-О-деметил-28-дезоксиде(1,3-диметил-1-бутенил)-6,28-эпокси-23-(метоксиимино)милбемицин В;

(A10) дорамектин: 25-циклогексил-5-О-деметил-25-де(1-метилпропил)авермектин А_{1а};

50

(A11) милбемектин: смесь милбемицина А₃ и милбемицина А₄;

(A12) милбемициноксим: 5-оксим милбемектина.

Ниже приведены не ограничивающие объем изобретения примеры пригодных для применения согласно изобретению репеллентов и препаратов, обеспечивающих

самооткрепление паразитов от кожного покрова:

(R1) DEET: N,N-диэтил-м-толуамид;

(R2) KBR 3023: N-бутил-2-оксикарбонил(2-гидрокси)пиперидин;

(R3) цимиазол: N-2,3-дигидро-3-метил-1,3-тиазол-2-илиден-2,4-ксилиден.

5 Указанные выше действующие вещества, которые могут использоваться в смеси с предлагаемыми в изобретении соединениями, наиболее известны специалистам в данной области. Большинство из них описано в различных изданиях Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London, а другие описаны в различных изданиях The Merck Index, изд-во Merck & Co., Inc., Rahway, New Jersey, USA, или в патентной
10 литературе. С учетом этого приведенный ниже перечень ограничен некоторыми публикациями, в которых в качестве примера можно найти описание рассмотренных выше действующих веществ:

(I) O-метилкарбамоилоксим 2-метил-2-(метилтио)пропионового альдегида (альдикарб) известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London
15 1997, 11-е изд., с.26;

(II) 8-(3,4-дигидро-4-оксобензо[d]-[1,2,3]-триазин-3-илметил)-O,O-диметилфосфодитиоат (азинфос-метил) известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.67;

(III) этил-N-[2,3-дигидро-2,2-диметилбензофуран-7-илоксикарбонил(метил)аминотио]-N-изопропил-β-аланинат (бенфуракарб) известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.96;

(IV) 2-метилбифенил-3-илметил-(Z)-(1RS)-цис-3-(2-хлор-3,3,3-трифторпроп-1-енил)-2,2-диметилциклопропанкарбоксилат (бифентрин) известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.118;

25 (V) 2-трет-бутилимино-3-изопропил-5-фенил-1,3,5-тиадиазинан-4-он (бупрофезин) известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.157;

(VI) 2,3-дигидро-2,2-диметилбензофуран-7-илметилкарбамат (карбофуран) известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.186;

(VII) 2,3-дигидро-2,2-диметилбензофуран-7-ил(дибутиламинотио)метил-карбамат (карбосульфат) известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.188;

(VIII) S,S'-(2-диметиламинотриметил)-бис(тиокарбамат) (картап) известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.193;

(IX) 1-[3,5-дихлор-4-(3-хлор-5-трифторметил-2-пиридилокси)фенил]-3-(2,6-дифторбензоил)мочевина (хлорфлуазурон) известна из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.213;

(X) O,O-диэтил-O-3,5,6-трихлор-2-пиридилфосфотиоат (хлорпирифос) известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.235;

(XI) (RS)-α-циано-4-фтор-3-феноксibenзил-(1RS, 3RS; 1RS, 3RS)-3-(2,2-дихлорвинил)-2,2-диметилциклопропанкарбоксилат (цифлутрин) известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.293;

45 (XII) смесь (S)-α-циано-3-феноксibenзил-(2)-(1R, 3R)-3-(2-хлор-3,3,3-трифторпропенил)-2,2-диметилциклопропанкарбоксилата и (R)-α-циано-3-феноксibenзил-(Z)-(1R, 3R)-3-(2-хлор-3,3,3-трифторпропенил)-2,2-диметилциклопропанкарбоксилата (λ-цигалотрин) известна из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.300;

50 (XIII) рацемат, состоящий из (S)-α-циано-3-феноксibenзил-(Z)-(1R, 3R)-3-(2,2-дихлорвинил)-2,2-диметилциклопропанкарбоксилата и (R)-α-циано-3-феноксibenзил-(1S, 3S)-3-(2,2-дихлорвинил)-2,2-диметилциклопропанкарбоксилата (α-циперметрин), известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.308;

(XIV) смесь стереоизомеров (S)- α -циано-3-феноксibenзил-(1RS, 3RS, 1RS, 3RS)-3-(2,2-дихлорвинил)-2,2-диметилциклопропанкарбоксилата(ζ -циперметрин) известна из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.314;

(XV) (S)- α -циано-3-феноксibenзил-(1R, 3R)-3-(2,2-дибромвинил)-2,2-
5 диметилциклопропанкарбоксилат (дельтаметрин) известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.344;

(XVI) (4-хлорфенил)-3-(2,6-дифторбензоил)мочевина (дифлубензурон) известна из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.395;

(XVII) (1,4,5,6,7,7-гексахлор-8,9,10-тринорборн-5-ен-2,3-иленбисметилен)сульфит
10 (эндосульфат) известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.459;

(XVIII) α -этилтио-о-толилметилкарбамат (этиофенкарб) известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.479;

(XIX) O,O-диметил-O-4-нитро-м-толилфосфотиоат (фенитротиион) известен из The
15 Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.514;

(XX) 2-втор-бутилфенилметилкарбамат (фенобукарб) известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.516;

(XXI) (RS)- α -циано-3-феноксibenзил-(RS)-2-хлорфенил-3-метилбутират (фенвалерат)
20 известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.539;

(XXII) S-[формил(метил)карбамоилметил]-O,O-диметилфосфодитиоат (формотион) известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.625;

(XXIII) 4-метилтио-3,5-ксилилметилкарбамат (метиокарб) известен из The Pesticide
25 Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.813;

(XXIV) 7-хлорбицикло[3.2.0]гепта-2,6-диен-6-илдиметилфосфат (гептенофос) известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.670;

(XXV) 1-(6-хлор-3-пиридилметил)-N-нитроимидазолидин-2-имиденамин (имидаклоприд)
30 известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.706;

(XXVI) 2-изопропилфенилметилкарбамат (изопрокарб) известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.729;

(XXVII) O,S-диметилфосфоамидотиоат (метамидофос) известен из The Pesticide Manual,
35 изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.808;

(XXVIII) S-метил-N-(метилкарбамоилокси)тиоацетимидат (метомил) известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.815;

(XXIX) метил-3-(диметоксифосфиноилокси)бут-2-еноат (мевинфос) известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.844;

(XXX) O,O-диэтил-O-4-нитрофенилфосфотиоат (паратиион) известен из The Pesticide
40 Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.926;

(XXXI) O,O-диметил-O-4-нитрофенилфосфотиоат (паратиион-метил) известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.928;

(XXXII) S-6-хлор-2,3-дигидро-2-оксо-1,3-бензоксазол-3-илметил-0,0-
45 диэтилфосфодитиоат (фосалон) известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.963;

(XXXIII) 2-диметиламино-5,6-диметилпиримидин-4-илдиметилкарбамат (пиримикарб) известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.985;

(XXXIV) 2-изопропоксифенилметилкарбамат (пропоксур) известен из The Pesticide
50 Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.1036;

(XXXV) 1-(3,5-дихлор-2,4-дифторфенил)-3-(2,6-дифторбензоил)мочевина (тефлубензурон) известна из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection

Council, London 1997, 11-е изд., с.1158;

(XXXVI) S-трет-бутилтиометил-О,О-диметилфосфодитиоат (тербуфос) известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.1165;

(XXXVII) этил(3-трет-бутил-1-диметилкарбамоил-1Н-1,2,4-триазол-5-илтио)ацетат
5 (триазамат) известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.1224;

(XXXVIII) абамектин известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.3;

(XXXIX) 2-втор-бутилфенилметилкарбамат (фенобукарб) известен из The Pesticide
10 Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.516;

(XL) N-трет-бутил-N'-(4-этилбензоил)-3,5-диметилбензогидразид (тебуфенозид) известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.1147;

(XLI) (±)-5-амино-1-(2,6-дихлор-α,α,α-трифтор-п-толил)-4-
15 трифторметилсульфинилпиразол-3-карбонитрил (фипронил) известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.545;

(XLII)(RS)-α-циано-4-фтор-3-феноксibenзил-(1RS, 3RS; 1RS, 3RS)-3-(2,2-дихлорвинил)-
2,2-диметилциклопропанкарбоксилат (β-цифлутрин) известен из The Pesticide Manual,
изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.295;

(XLIII) (4-этоксифенил)-[3-(4-фтор-3-феноксифенил)пропил](диметил)силан
20 (силафлуофен) известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.1105;

(XLIV) трет-бутил-(E)-α-(1,3-диметил-5-феноксипиразол-4-илметиленаминоокси)-п-
толуат (фенпироксимат) известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop
25 Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.530;

(XLV) 2-трет-бутил-5-(4-трет-бутилбензилтио)-4-хлорпиридазин-3(2H)-он (пиридабен)
известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London
1997, 11-е изд., с.1161;

(XLVI) 4-[[4-(1,1-диметилфенил)фенил]этокси]хиназолин (феназахин) известен из The
30 Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.507;

(XLVII) 4-феноксифенил-(RS)-2-(пиридилокси)пропиловый эфир (пирипроксифен)
известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London
1997, 11-е изд., с.1073;

(XLVIII) 5-хлор-N-{2-[4-(2-этоксиэтил)-2,3-диметилфенокси]этил}-6-этилпиримидин-4-
35 амин (пиримидифен) известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.1070;

(XLIX) (E)-N-(6-хлор-3-пиридилметил)-N-этил-N'-метил-2-нитровинилидендиамин
(нитенпирам) известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection
Council, London 1997, 11-е изд., с.880;

(L) (E)-N¹-[(6-хлор-3-пиридил)метил]-N²-циано-N¹-метилацетамидин (NI-25,
40 ацетамиприд) известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.9;

(LI) авермектин В₁ известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop
Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.3;

(LII) инсектицидно активный растительный экстракт, прежде всего (2R, 6aS, 12aS)-
45 1,2,6,6a,12,12a-гексагидро-2-изопропенил-8,9-диметоксихромено[3,4-b]фууро[2,3-b]хромен-
6-он (ротенон), известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection
Council, London 1997, 11-е изд., с.1097, а экстракт из Azadirachta indica, прежде
50 всего азадирахтин, известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.59;

(LIII) препарат, содержащий инсектицидно активные нематоды, предпочтительно
препарат, содержащий Heterorhabditis bacteriophora и Heterorhabditis megidis,
известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London

1997, 11-е изд., с.671, препарат, содержащий *Steinernema feltiae*, известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.1115, и препарат, содержащий *Steinernema scapterisci*, известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.1116;

5 (LIV) препарат, получаемый из *Bacillus subtilis*, известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.72, или препарат, получаемый из штамма *Bacillus thuringiensis*, за исключением соединений, выделенных из штамма GC91 или штамма NCTC11821, известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.73;

10 (LV) препарат, содержащий инсектицидно активные грибы, предпочтительно препарат, содержащий *Verticillium lecanii*, известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.1266, препарат, содержащий *Beauveria brogniartii*, известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.85, и препарат, содержащий *Beauveria*
15 *bassiana*, известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.83;

(LVI) препарат, содержащий инсектицидно активные вирусы, предпочтительно препарат, содержащий вирус *Neodipridon Sertifer NPV*, известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.1342, препарат,
20 содержащий вирус *Mamestra brassicae NPV*, известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.759, и препарат, содержащий вирус *Cydia pomonella granulosus*, известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.291;

(CLXXXI) 7-хлор-2,3,4а,5-тетрагидро-2-[метоксикарбонил(4-
25 трифторметоксифенил)карбамоил]индол[1,2е]оксазолин-4а-карбоксилат (DPX-MP062, индоксикарб) известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.453;

(CLXXXII) N'-трет-бутил-N'-(3,5-диметилбензоил)-3-метокси-2-метилбензогидразид (RH-
2485, метоксифенозид) известен из The Pesticide Manual, изд-во The British Crop
30 Protection Council, London 1997, 11-е изд., с.1094;

(CLXXXIII) изопропиловый эфир (N'44-метоксибифенил-3-ил]гидразинкарбоновой кислоты (D 2341) известен из Brighton Crop Protection Conference, 1996, сс.487-493;

(R2) известен из Book of Abstracts, 212th ACS National Meeting Orlando, FL, 25-29 августа 1996 г., AGRO-020, издатель: American Chemical Society, Washington, D.C.

35 CONEN: 63BFAF.

В соответствии с этим еще одним важным объектом настоящего изобретения являются комбинированные препараты для борьбы с паразитами у теплокровных животных, отличающиеся тем, что они помимо соединения формулы I содержат по меньшей мере еще
40 одно действующее вещество, обладающее тем же или отличным действием, и по меньшей мере один физиологически приемлемый носитель. Следует отметить, что настоящее изобретение не ограничено двухкомпонентными комбинированными препаратами, т.е. препаратами, содержащими только два действующих вещества.

Обычно предлагаемые в изобретении гелминтоцидные композиции содержат от 0,1 до 99 мас.%, прежде всего от 0,1 до 95 мас.%, действующего вещества формулы I, от 99,9
45 до 1 мас.%, прежде всего от 99,8 до 5 мас.%, твердой или жидкой добавки, и от 0 до 25 мас.%, прежде всего от 0,1 до 25 мас.% ПАВ.

Предлагаемые в изобретении композиции для лечения животных можно применять локально, перорально, парентерально или подкожно, для чего такие композиции могут
50 быть представлены в виде растворов, эмульсий, суспензий (препаратов для вливания в ротовую полость животного), порошков, таблеток, пилкуль, капсул и саморастекающихся препаратов для обработки наливом.

Метод, состоящий в применении саморастекающихся препаратов для обработки наливом или точечной обработки, предусматривает нанесение соединения формулы I на

некоторый локальный участок кожи или шерстного покрова животного, преимущественно на его загривок или спину в области позвоночника. При этом саморастекающийся препарат для обработки наливом или точечной обработки наносят, например, с помощью тампона или распылением на относительно небольшой по площади участок шерстного покрова, откуда действующее вещество начинает, по существу, автоматически распространяться ("растекаться") по большой площади вдоль кожного или шерстного покрова благодаря наличию в препарате компонентов, способствующих подобному распространению действующего вещества, причем этот процесс "самораспространения" действующего вещества протекает более интенсивно за счет совершаемых животным движений.

Указанные саморастекающиеся препараты для обработки наливом и точечной обработки преимущественно содержат носители, которые обеспечивают быстрое распространение действующего вещества по кожному покрову или в шерстном покрове животного-хозяина и которые обычно называют распределяющими маслами. В качестве примера пригодных для применения в этих целях носителей можно назвать масляные растворы, спиртовые и изопропанольные растворы, в частности растворы 2-октилдодеканола или олеилового спирта, растворы эфиров монокарбоновых кислот, таких как изопропилмирилат, изопропилпальмитат, лаурилоксалат, олеиловый эфир олеиновой кислоты, дециловый эфир олеиновой кислоты, гексиллаурат, олеилолеат, децилолеат и эфиры капроновой кислоты и насыщенных жирных спиртов с длиной цепи C₁₂-C₁₈, растворы эфиров дикарбоновых кислот, таких как дибutilфталат, диизопропилизофталат, диизопропиловый эфир адипиновой кислоты и ди-н-бутиладипат, или же растворы эфиров алифатических кислот, например гликолей. В состав подобных препаратов может оказаться целесообразным включать также известный диспергатор, применяемый, например, в фармацевтической или косметической промышленности. В качестве примера при этом можно назвать 2-пирролидон, 2-(N-алкил)пирролидон, ацетон, полиэтиленгликоль и его простые и сложные эфиры, пропиленгликоль или синтетические триглицериды.

Масляные растворы содержат, например, растительные масла, такие как оливковое масло, арахисовое масло, кунжутное масло, сосновое масло, льняное масло или касторовое масло. Растительные масла могут присутствовать также в эпоксицированном виде. Помимо этого можно также использовать парафины и силиконовые масла.

Обычно саморастекающиеся препараты для обработки наливом и для точечной обработки содержат от 1 до 20 мас.% соединения формулы I, от 0,1 до 50 мас.% диспергатора и от 45 до 98,9 мас.% растворителя.

Метод, состоящий в применении саморастекающихся препаратов для обработки наливом или точечной обработки, предпочтительно использовать прежде всего на стадных животных, таких как крупный рогатый скот, лошади, овцы или свиньи, когда пероральное введение препарата или введение препарата путем инъекции каждому животному является трудоемкой процедурой, связанной с высокими затратами времени. Этот метод, который благодаря его простоте может, как очевидно, применяться и на всех остальных животных, включая отдельных домашних и комнатных животных, нашел широкое распространение среди владельцев животных, поскольку допускает частое его применение без квалифицированной помощи ветеринара.

В качестве поставляемых в продажу продуктов обычно предпочтительны составы или композиции в виде концентратов, тогда как конечный потребитель, как правило, использует разбавленные препараты.

Подобные препараты могут также содержать дополнительные вспомогательные вещества и добавки, такие как стабилизаторы, антивспениватели, регуляторы вязкости, связующие или прилипатели, а также другие действующие вещества, что обеспечивает достижение особых эффектов.

Гельминтоцидные композиции подобного типа, используемые конечным потребителем, также включены в объем настоящего изобретения.

Действующие вещества формулы I при их применении для борьбы с вредителями и паразитами любым из предлагаемых в изобретении методов или в составе любой

предназначенной для этих целей предлагаемой в изобретении композиции могут использоваться в виде всех их пространственных изомеров или их смесей.

В настоящем изобретении предлагается также способ профилактической защиты теплокровных животных, прежде всего продуктивного скота, домашних и комнатных животных, от паразитических гельминтов, отличающийся тем, что действующие вещества формулы I или полученные на их основе и содержащие их композиции перорально или путем инъекции либо парентерально вводят животным в виде добавки к корму либо к питью или же в твердой либо жидкой форме. Настоящее изобретение относится далее к предлагаемым в нем соединениям формулы I, предназначенным для применения в одном из таких методов.

Ниже изобретение проиллюстрировано на примерах, не ограничивающих его объем, при этом под действующим веществом имеется в виду одно из соединений, указанных в таблице 1. Так, в частности, ниже приведен состав предпочтительных композиций (препаративных форм) (данные в % соответствуют мас.%).

15 Примеры композиций (препаративных форм)

1. Гранулы	а) б)
действующее вещество	5% 10%
каолин	94% -
высокодисперсная кремниевая кислота	1% -
аттапульгит	- 90%

20 Действующее вещество растворяют в метиленхлориде и полученный раствор напыляют на носитель, после чего растворитель выпаривают в вакууме. Такие гранулы можно примешивать к корму для животных.

2. Гранулы

действующее вещество	3%
полиэтиленгликоль (ММ 200)	3%
каолин	94%

(ММ обозначает молекулярную массу)

30 Тонкоизмельченное действующее вещество равномерно подают в смесителе к каолину, увлажненному полиэтиленгликолем. Таким путем получают беспылевые гранулы с покрытием.

3. Таблетки или пилюли

I. действующее вещество	33,00%
Метилцеллюлоза	0,80%
высокодисперсная кремниевая кислота	0,80%
мучной крахмал	8,40%
II. кристаллическая лактоза	22,50%
мучной крахмал	17,00%
микrokристаллическая целлюлоза	16,50%
стеарат магния	1,00%

40 I. Метилцеллюлозу размешивают в воде. После набухания материала примешивают кремниевую кислоту и полученную смесь суспендируют до гомогенности. Действующее вещество смешивают с мучным крахмалом. Затем к этой смеси добавляют указанную выше водную суспензию и месят до тестообразного состояния. Полученную массу гранулируют продавливанием через сито 12 меш и сушат.

II. Тщательно смешивают между собой все 4 эксципиента.

III. Смеси, предварительно полученные на стадиях I и II, смешивают между собой и прессуют в таблетки или пилюли.

4. Препараты для инъекций

50 А. Масляный наполнитель (медленное высвобождение)

1. действующее вещество	0,1-1,0 г
арахисовое масло	до 100 мл
2. действующее вещество	0,1-1,0 г
кунжутное масло	до 100 мл

Получение: действующее вещество при перемешивании и при необходимости при умеренном нагревании растворяют в части от всего предусмотренного рецептурой количества масла и после охлаждения раствора его объем доводят до требуемого, а затем стерилизуют фильтрацией через соответствующий мембранный фильтр с размером пор 0,22 мм.

Б. Смешивающийся с водой растворитель (средняя скорость высвобождения)

1. действующее вещество	0,1-1,0 г
4-гидроксиметил-1,3-диоксолан (номинально глицерин)	40 г
1,2-пропандиол	до 100 мл
2. действующее вещество	0,1-1,0 г
глицериндиметилкеталь	40 г
1,2-пропандиол	до 100 мл

Получение: действующее вещество при перемешивании растворяют в части от всего предусмотренного рецептурой количества растворителя, после чего объем раствора доводят до требуемого и затем стерилизуют фильтрацией через соответствующий мембранный фильтр с размером пор 0,22 мм.

В. Водный солюбилизат (быстрое высвобождение)

1. действующее вещество	0,1-1,0 г
полиэтоксилированное касторовое масло (40 этиленоксидных звеньев)	10 г
1,2-пропандиол	20 г
бензиловый спирт	1 г
вода для инъекций	до 100 мл
2. действующее вещество	0,1-1,0 г
полиэтоксилированный сорбитанмоноолеат (20 этиленоксидных звеньев)	8 г
4-гидроксиметил-1,3-диоксолан (номинально глицерин)	20 г
бензиловый спирт	1 г
вода для инъекций	до 100 мл

Получение: действующее вещество растворяют в растворителях и ПАВ, после чего объем раствора доводят до требуемого добавлением воды. Далее раствор стерилизуют фильтрацией через соответствующий мембранный фильтр с размером пор 0,22 мм.

5. Саморастекающийся препарат для обработки наливом

А. действующее вещество	5 г
Изопропилмирикат	10 г
Изопропанол	до 100 мл
Б. действующее вещество	2 г
Гексиллаурат	5 г
триглицерид со средней длиной цепи	15 г
этанол	до 100 мл
В. действующее вещество	2 г
Олеилолеат	5 г
N-метилпирролидон	40 г
Изопропанол	до 100 мл

Такие водные системы предпочтительно использовать также для перорального введения и/или для введения в преджелудок (инtrarуминально).

Подобные композиции могут также содержать дополнительные вспомогательные вещества и добавки, такие как стабилизаторы, например необязательно эпоксицированные растительные масла (в частности эпоксицированное кокосовое, рапсовое или соевое масло), антивспениватели, например силиконовое масло, консерванты, регуляторы вязкости, связующие, прилипатели, а также удобрения или другие действующие вещества, что обеспечивает достижение особых эффектов.

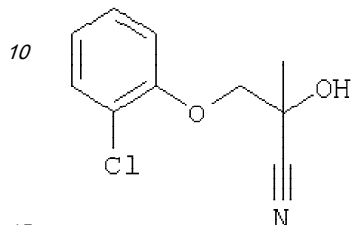
В состав описанных выше композиций можно также включать другие биологически активные вещества или добавки, обладающие нейтральными свойствами по отношению к

соединениям формулы I и не оказывающие нежелательного воздействия на подвергаемое лечению животное-хозяина, а также минеральные соли или витамины.

Ниже изобретение проиллюстрировано на примерах. Эти примеры не ограничивают объем изобретения. Сокращение "ч" обозначает время в часах. Используемые в этих примерах исходные вещества можно получать описанными в литературе методами либо они являются коммерчески доступными продуктами.

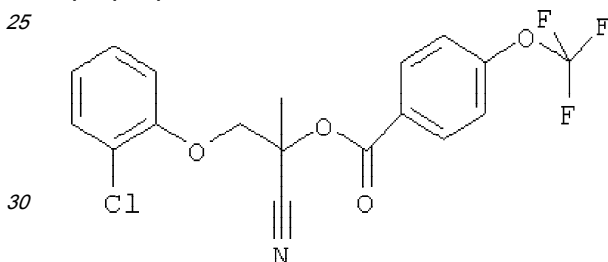
Примеры получения

Пример 1: 3-(2-хлорфенокси)-2-гидрокси-2-метилпропионитрил



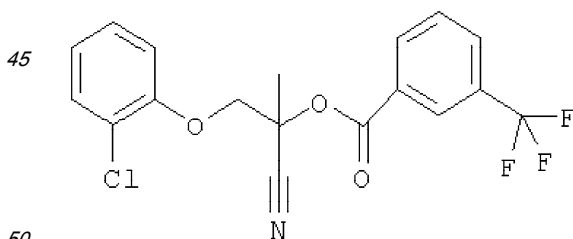
1,02 г 1-(2-хлорфенокси)пропан-2-она и 0,71 г цианида натрия растворяют в смеси 6 мл H_2O и 10 мл диэтилового эфира. Далее при внутренней температуре $0-5^{\circ}C$ по каплям добавляют 1,2 мл концентрированной соляной кислоты. После перемешивания реакционной смеси в течение 3 ч при $0-5^{\circ}C$ органическую фазу отделяют, а водную фазу дважды экстрагируют диэтиловым эфиром. Органические фазы объединяют, сушат над сульфатом натрия и удаляют растворитель. Таким путем получают 1,10 г указанного в заголовке соединения в виде бесцветного масла.

Пример 2: 2-(2-хлорфенокси)-1-циано-1-метилэтиловый эфир 4-трифторметоксибензойной кислоты



212 мг 3-(2-хлорфенокси)-2-гидрокси-2-метилпропионитрила и 270 мг хлорангидрида 4-трифторметоксибензойной кислоты растворяют в 15 мл CH_2Cl_2 и при внутренней температуре $0-5^{\circ}C$ по каплям добавляют 122 мг триэтиламина, растворенного в 5 мл CH_2Cl_2 . После добавления 25 мг диметиламинопиридина реакционную смесь перемешивают в течение 20 ч при $0-5^{\circ}C$, а затем промывают 1н. соляной кислотой, насыщенным раствором бикарбоната натрия и рассолом и органическую фазу отделяют. Эту органическую фазу сушат над сульфатом магния, удаляют растворитель и остаток хроматографируют на силикагеле (CH_2Cl_2 /Циклогексан в соотношении 1:3). Таким путем получают 220 мг указанного в заголовке соединения в виде бесцветного масла.

Пример 3: 2-(2-хлорфенокси)-1-циано-1-метилэтиловый эфир 4-трифторметилфенил)карбаминовой кислоты



254 мг 3-(2-хлорфенокси)-2-гидрокси-2-метилпропионитрила и 262 мг 4-трифторметилфенилизотиоцианата растворяют в 20 мл CH_2Cl_2 и при комнатной температуре по каплям добавляют 142 мг триэтиламина, растворенного в 5 мл CH_2Cl_2 . Реакционную

смесь перемешивают в течение 7 ч при комнатной температуре, а затем промывают 1н. соляной кислотой, насыщенным раствором бикарбоната натрия и рассолом. Органическую фазу сушат над сульфатом магния, удаляют растворитель и остаток хроматографируют на силикагеле (этилацетат/циклогексан в соотношении 1:1). В результате последующей кристаллизации из диэтилового эфира/гексана получают 150 мг указанного в заголовке соединения в виде бесцветных кристаллов с $t_{пл}$ 142-143°C.

Аналогично рассмотренному выше методу можно также получать соединения, перечисленные в приведенной ниже таблице.

Таблица 1

№	X	R ₁	R ₂	Физические характеристики
1.1	-	H	H	
1.2	-	H	2-CH ₃	
1.3	-	H	3-CH ₃	
1.4	-	H	4-CH ₃	
1.5	-	H	2-F	
1.6	-	H	3-F	
1.7	-	H	4-F	
1.8	-	H	2-Cl	
1.9	-	H	3-Cl	
1.10	-	H	4-Cl	
1.11	-	H	2-CF ₃	
1.12	-	H	3-CF ₃	
1.13	-	H	4-CF ₃	
1.14	-	H	2-OCF ₃	
1.15	-	H	3-OCF ₃	
1.16	-	H	4-OCF ₃	
1.17	-	H	2,3-Cl ₂	
1.18	-	H	2,4-Cl ₂	
1.19	-	H	2,5-Cl ₂	
1.20	-	H	2,6-Cl ₂	
1.21	-	H	3,4-Cl ₂	
1.22	-	H	3,5-Cl ₂	
1.23	-	2-CH ₃	H	
1.24	-	2-CH ₃	2-CH ₃	
1.25	-	2-CH ₃	3-CH ₃	
1.26	-	2-CH ₃	4-CH ₃	
1.27	-	2-CH ₃	2-F	
1.28	-	2-CH ₃	3-F	
1.29	-	2-CH ₃	4-F	
1.30	-	2-CH ₃	2-Cl	
1.31	-	2-CH ₃	3-Cl	
1.32	-	2-CH ₃	4-Cl	
1.33	-	2-CH ₃	2-CF ₃	

№	X	R ₁	R ₂	Физические характеристики
1.34	-	2-CH ₃	3-CF ₃	
1.35	-	2-CH ₃	4-CF ₃	
1.36	-	2-CH ₃	2-OCF ₃	
1.37	-	2-CH ₃	3-OCF ₃	

RU 2 296 747 C2

5

10

15

20

25

30

35

1.38	-	2-CH ₃	4-OCF ₃	
1.39	-	2-CH ₃	2,3-Cl ₂	
1.40	-	2-CH ₃	2,4-Cl ₂	
1.41	-	2-CH ₃	2,5-Cl ₂	
1.42	-	2-CH ₃	2,6-Cl ₂	
1.43	-	2-CH ₃	3,4-Cl ₂	
1.44	-	2-CH ₃	3,5-Cl ₂	
1.45	-	3-CH ₃	H	
1.46	-	3-CH ₃	2-CH ₃	
1.47	-	3-CH ₃	3-CH ₃	
1.48	-	3-CH ₃	4-CH ₃	
1.49	-	3-CH ₃	2-F	
1.50	-	3-CH ₃	3-F	
1.51	-	3-CH ₃	4-F	
1.52	-	3-CH ₃	2-Cl	
1.53	-	3-CH ₃	3-Cl	
1.54	-	3-CH ₃	4-Cl	
1.55	-	3-CH ₃	2-CF ₃	
1.56	-	3-CH ₃	3-CF ₃	
1.57	-	3-CH ₃	4-CF ₃	
1.58	-	3-CH ₃	2-OCF ₃	
1.59	-	3-CH ₃	3-OCF ₃	
1.60	-	3-CH ₃	4-OCF ₃	
1.61	-	3-CH ₃	2,3-Cl ₂	
1.62	-	3-CH ₃	2,4-Cl ₂	
1.63	-	3-CH ₃	2,5-Cl ₂	
1.64	-	3-CH ₃	2,6-Cl ₂	
1.65	-	3-CH ₃	3,4-Cl ₂	
1.66	-	3-CH ₃	3,5-Cl ₂	
1.67	-	4-CH ₃	H	
1.68	-	4-CH ₃	2-CH ₃	
1.69	-	4-CH ₃	3-CH ₃	
1.70	-	4-CH ₃	4-CH ₃	
1.71	-	4-CH ₃	2-F	
1.72	-	4-CH ₃	3-F	
1.73	-	4-CH ₃	4-F	
1.74	-	4-CH ₃	2-Cl	

40

45

50

№	X	R ₁	R ₂	Физические характеристики
1.75	-	4-CH ₃	3-Cl	
1.76	-	4-CH ₃	4-Cl	
1.77	-	4-CH ₃	2-CF ₃	
1.78	-	4-CH ₃	3-CF ₃	
1.79	-	4-CH ₃	4-CF ₃	
1.80	-	4-CH ₃	2-OCF ₃	
1.81	-	4-CH ₃	3-OCF ₃	
1.82	-	4-CH ₃	4-OCF ₃	
1.83	-	4-CH ₃	2,3-Cl ₂	
1.84	-	4-CH ₃	2,4-Cl ₂	
1.85	-	4-CH ₃	2,5-Cl ₂	
1.86	-	4-CH ₃	2,6-Cl ₂	
1.87	-	4-CH ₃	3,4-Cl ₂	
1.88	-	4-CH ₃	3,5-Cl ₂	
1.89	-	2-F	H	
1.90	-	2-F	2-CH ₃	
1.91	-	2-F	3-CH ₃	
1.92	-	2-F	4-CH ₃	

5

1.93	-	2-F	2-F	
1.94	-	2-F	3-F	
1.95	-	2-F	4-F	
1.96	-	2-F	2-Cl	
1.97	-	2-F	3-Cl	
1.98	-	2-F	4-Cl	
1.99	-	2-F	2-CF ₃	
1.100	-	2-F	3-CF ₃	
1.101	-	2-F	4-CF ₃	
1.102	-	2-F	2-OCF ₃	
1.103	-	2-F	3-OCF ₃	
1.104	-	2-F	4-OCF ₃	
1.105	-	2-F	2,3-Cl ₂	
1.106	-	2-F	2,4-Cl ₂	
1.107	-	2-F	2,5-Cl ₂	
1.108	-	2-F	2,6-Cl ₂	
1.109	-	2-F	3,4-Cl ₂	
1.110	-	2-F	3,5-Cl ₂	
1.111	-	3-F	H	
1.112	-	3-F	2-CH ₃	
1.113	-	3-F	3-CH ₃	
1.114	-	3-F	4-CH ₃	
1.115	-	3-F	2-F	
1.116	-	3-F	3-F	

10

15

20

25

№	X	R ₁	R ₂	Физические характеристики
1.117	-	3-F	4-F	
1.118	-	3-F	2-Cl	
1.119	-	3-F	3-Cl	
1.120	-	3-F	4-Cl	
1.121	-	3-F	2-CF ₃	
1.122	-	3-F	3-CF ₃	
1.123	-	3-F	4-CF ₃	
1.124	-	3-F	2-OCF ₃	
1.125	-	3-F	3-OCF ₃	
1.126	-	3-F	4-OCF ₃	
1.127	-	3-F	2,3-Cl ₂	
1.128	-	3-F	2,4-Cl ₂	
1.129	-	3-F	2,5-Cl ₂	
1.130	-	3-F	2,6-Cl ₂	
1.131	-	3-F	3,4-Cl ₂	
1.132	-	3-F	3,5-Cl ₂	
1.133	-	4-F	H	
1.134	-	4-F	2-CH ₃	
1.135	-	4-F	3-CH ₃	
1.136	-	4-F	4-CH ₃	
1.137	-	4-F	2-F	
1.138	-	4-F	3-F	
1.139	-	4-F	4-F	
1.140	-	4-F	2-Cl	
1.141	-	4-F	3-Cl	
1.142	-	4-F	4-Cl	
1.143	-	4-F	2-CF ₃	
1.144	-	4-F	3-CF ₃	
1.145	-	4-F	4-CF ₃	
1.146	-	4-F	2-OCF ₃	
1.147	-	4-F	3-OCF ₃	

30

35

40

45

50

RU 2 296 747 C2

5

1.148	- 4-F	4-OCF ₃	
1.149	- 4-F	2,3-Cl ₂	
1.150	- 4-F	2,4-Cl ₂	
1.151	- 4-F	2,5-Cl ₂	
1.152	- 4-F	2,6-Cl ₂	
1.153	- 4-F	3,4-Cl ₂	
1.154	- 4-F	3,5-Cl ₂	
1.155	- 2-Cl	H	
1.156	- 2-Cl	2-CH ₃	
1.157	- 2-Cl	3-CH ₃	
1.158	- 2-Cl	4-CH ₃	

10

15

20

25

30

35

40

45

50

№	X	R ₁	R ₂	Физические характеристики
1.159	- 2-Cl		2-F	
1.160	- 2-Cl		3-F	
1.161	- 2-Cl		4-F	
1.162	- 2-Cl		2-Cl	
1.163	- 2-Cl		3-Cl	
1.164	- 2-Cl		4-Cl	
1.165	- 2-Cl		2-CF ₃	
1.166	- 2-Cl		3-CF ₃	
1.167	- 2-Cl		4-CF ₃	масло
1.168	- 2-Cl		2-OCF ₃	
1.169	- 2-Cl		3-OCF ₃	
1.170	- 2-Cl		4-OCF ₃	масло
1.171	- 2-Cl		2,3-Cl ₂	
1.172	- 2-Cl		2,4-Cl ₂	
1.173	- 2-Cl		2,5-Cl ₂	
1.174	- 2-Cl		2,6-Cl ₂	
1.175	- 2-Cl		3,4-Cl ₂	
1.176	- 2-Cl		3,5-Cl ₂	
1.177	- 3-Cl		H	
1.178	- 3-Cl		2-CH ₃	
1.179	- 3-Cl		3-CH ₃	
1.180	- 3-Cl		4-CH ₃	
1.181	- 3-Cl		2-F	
1.182	- 3-Cl		3-F	
1.183	- 3-Cl		4-F	
1.184	- 3-Cl		2-Cl	
1.185	- 3-Cl		3-Cl	
1.186	- 3-Cl		4-Cl	
1.187	- 3-Cl		2-CF ₃	
1.188	- 3-Cl		3-CF ₃	
1.189	- 3-Cl		4-CF ₃	
1.190	- 3-Cl		2-OCF ₃	
1.191	- 3-Cl		3-OCF ₃	
1.192	- 3-Cl		4-OCF ₃	
1.193	- 3-Cl		2,3-Cl ₂	
1.194	- 3-Cl		2,4-Cl ₂	
1.195	- 3-Cl		2,5-Cl ₂	
1.196	- 3-Cl		2,6-Cl ₂	
1.197	- 3-Cl		3,4-Cl ₂	
1.198	- 3-Cl		3,5-Cl ₂	
1.199	- 4-Cl		H	
1.200	- 4-Cl		2-CH ₃	
1.201	- 4-Cl		3-CH ₃	

RU 2 296 747 C2

5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

№	X	R ₁	R ₂	Физические характеристики
1.202	-	4-Cl	4-CH ₃	
1.203	-	4-Cl	2-F	
1.204	-	4-Cl	3-F	
1.205	-	4-Cl	4-F	
1.206	-	4-Cl	2-Cl	
1.207	-	4-Cl	3-Cl	
1.208	-	4-Cl	4-Cl	
1.209	-	4-Cl	2-CF ₃	
1.210	-	4-Cl	3-CF ₃	
1.211	-	4-Cl	4-CF ₃	
1.212	-	4-Cl	2-OCF ₃	
1.213	-	4-Cl	3-OCF ₃	
1.214	-	4-Cl	4-OCF ₃	
1.215	-	4-Cl	2,3-Cl ₂	
1.216	-	4-Cl	2,4-Cl ₂	
1.217	-	4-Cl	2,5-Cl ₂	
1.218	-	4-Cl	2,6-Cl ₂	
1.219	-	4-Cl	3,4-Cl ₂	
1.220	-	4-Cl	3,5-Cl ₂	
1.221	-	2-CF ₃	H	
1.222	-	2-CF ₃	2-CH ₃	
1.223	-	2-CF ₃	3-CH ₃	
1.224	-	2-CF ₃	4-CH ₃	
1.225	-	2-CF ₃	2-F	
1.226	-	2-CF ₃	3-F	
1.227	-	2-CF ₃	4-F	
1.228	-	2-CF ₃	2-Cl	
1.229	-	2-CF ₃	3-Cl	
1.230	-	2-CF ₃	4-Cl	
1.231	-	2-CF ₃	2-CF ₃	
1.232	-	2-CF ₃	3-CF ₃	
1.233	-	2-CF ₃	4-CF ₃	масло
1.234	-	2-CF ₃	2-OCF ₃	
1.235	-	2-CF ₃	3-OCF ₃	
1.236	-	2-CF ₃	4-OCF ₃	T _{пл} 66-68°С
1.237	-	2-CF ₃	2,3-Cl ₂	
1.238	-	2-CF ₃	2,4-Cl ₂	
1.239	-	2-CF ₃	2,5-Cl ₂	
1.240	-	2-CF ₃	2,6-Cl ₂	
1.241	-	2-CF ₃	3,4-Cl ₂	
1.242	-	2-CF ₃	3,5-Cl ₂	

№	X	R ₁	R ₂	Физические характеристики
1.243	-	3-CF ₃	H	
1.244	-	3-CF ₃	2-CH ₃	
1.245	-	3-CF ₃	3-CH ₃	
1.246	-	3-CF ₃	4-CH ₃	
1.247	-	3-CF ₃	2-F	
1.248	-	3-CF ₃	3-F	
1.249	-	3-CF ₃	4-F	
1.250	-	3-CF ₃	2-Cl	
1.251	-	3-CF ₃	3-Cl	
1.252	-	3-CF ₃	4-Cl	
1.253	-	3-CF ₃	2-CF ₃	
1.254	-	3-CF ₃	3-CF ₃	
1.255	-	3-CF ₃	4-CF ₃	

5

1.256	-	3-CF ₃	2-OCF ₃	
1.257	-	3-CF ₃	3-OCF ₃	
1.258	-	3-CF ₃	4-OCF ₃	
1.259	-	3-CF ₃	2,3-Cl ₂	
1.260	-	3-CF ₃	2,4-Cl ₂	
1.261	-	3-CF ₃	2,5-Cl ₂	
1.262	-	3-CF ₃	2,6-Cl ₂	
1.263	-	3-CF ₃	3,4-Cl ₂	
1.264	-	3-CF ₃	3,5-Cl ₂	
1.265	-	4-CF ₃	H	
1.266	-	4-CF ₃	2-CH ₃	
1.267	-	4-CF ₃	3-CH ₃	
1.268	-	4-CF ₃	4-CH ₃	
1.269	-	4-CF ₃	2-F	
1.270	-	4-CF ₃	3-F	
1.271	-	4-CF ₃	4-F	
1.272	-	4-CF ₃	2-Cl	
1.273	-	4-CF ₃	3-Cl	
1.274	-	4-CF ₃	4-Cl	
1.275	-	4-CF ₃	2-CF ₃	
1.276	-	4-CF ₃	3-CF ₃	
1.277	-	4-CF ₃	4-CF ₃	
1.278	-	4-CF ₃	2-OCF ₃	
1.279	-	4-CF ₃	3-OCF ₃	
1.280	-	4-CF ₃	4-OCF ₃	
1.281	-	4-CF ₃	2,3-Cl ₂	
1.282	-	4-CF ₃	2,4-Cl ₂	
1.283	-	4-CF ₃	2,5-Cl ₂	

10

15

20

25

30

35

40

45

50

№	X	R ₁	R ₂	Физические характеристики
1.284	-	4-CF ₃	2,6-Cl ₂	
1.285	-	4-CF ₃	3,4-Cl ₂	
1.286	-	4-CF ₃	3,5-Cl ₂	
1.287	-	2-OCF ₃	H	
1.288	-	2-OCF ₃	2-CH ₃	
1.289	-	2-OCF ₃	3-CH ₃	
1.290	-	2-OCF ₃	4-CH ₃	
1.291	-	2-OCF ₃	2-F	
1.292	-	2-OCF ₃	3-F	
1.293	-	2-OCF ₃	4-F	
1.294	-	2-OCF ₃	2-Cl	
1.295	-	2-OCF ₃	3-Cl	
1.296	-	2-OCF ₃	4-Cl	
1.297	-	2-OCF ₃	2-CF ₃	
1.298	-	2-OCF ₃	3-CF ₃	
1.299	-	2-OCF ₃	4-CF ₃	
1.300	-	2-OCF ₃	2-OCF ₃	
1.301	-	2-OCF ₃	3-OCF ₃	
1.302	-	2-OCF ₃	4-OCF ₃	
1.303	-	2-OCF ₃	2,3-Cl ₂	
1.304	-	2-OCF ₃	2,4-Cl ₂	
1.305	-	2-OCF ₃	2,5-Cl ₂	
1.306	-	2-OCF ₃	2,6-Cl ₂	
1.307	-	2-OCF ₃	3,4-Cl ₂	
1.308	-	2-OCF ₃	3,5-Cl ₂	
1.309	-	3-OCF ₃	H	
1.310	-	3-OCF ₃	2-CH ₃	

5

1.311	-	3-OCF ₃	3-CH ₃	
1.312	-	3-OCF ₃	4-CH ₃	
1.313	-	3-OCF ₃	2-F	
1.314	-	3-OCF ₃	3-F	
1.315	-	3-OCF ₃	4-F	
1.316	-	3-OCF ₃	2-Cl	
1.317	-	3-OCF ₃	3-Cl	
1.318	-	3-OCF ₃	4-Cl	
1.319	-	3-OCF ₃	2-CF ₃	
1.320	-	3-OCF ₃	3-CF ₃	
1.321	-	3-OCF ₃	4-CF ₃	
1.322	-	3-OCF ₃	2-OCF ₃	
1.323	-	3-OCF ₃	3-OCF ₃	
1.324	-	3-OCF ₃	4-OCF ₃	

10

15

№	X	R ₁	R ₂	Физические характеристики
1.325	-	3-OCF ₃	2,3-Cl ₂	
1.326	-	3-OCF ₃	2,4-Cl ₂	
1.327	-	3-OCF ₃	2,5-Cl ₂	
1.328	-	3-OCF ₃	2,6-Cl ₂	
1.329	-	3-OCF ₃	3,4-Cl ₂	
1.330	-	3-OCF ₃	3,5-Cl ₂	
1.331	-	4-OCF ₃	H	
1.332	-	4-OCF ₃	2-CH ₃	
1.333	-	4-OCF ₃	3-CH ₃	
1.334	-	4-OCF ₃	4-CH ₃	
1.335	-	4-OCF ₃	2-F	
1.336	-	4-OCF ₃	3-F	
1.337	-	4-OCF ₃	4-F	
1.338	-	4-OCF ₃	2-Cl	
1.339	-	4-OCF ₃	3-Cl	
1.340	-	4-OCF ₃	4-Cl	
1.341	-	4-OCF ₃	2-CF ₃	
1.342	-	4-OCF ₃	3-CF ₃	
1.343	-	4-OCF ₃	4-CF ₃	
1.344	-	4-OCF ₃	2-OCF ₃	
1.345	-	4-OCF ₃	3-OCF ₃	
1.346	-	4-OCF ₃	4-OCF ₃	
1.347	-	4-OCF ₃	2,3-Cl ₂	
1.348	-	4-OCF ₃	2,4-Cl ₂	
1.349	-	4-OCF ₃	2,5-Cl ₂	
1.350	-	4-OCF ₃	2,6-Cl ₂	
1.351	-	4-OCF ₃	3,4-Cl ₂	
1.352	-	4-OCF ₃	3,5-Cl ₂	
1.353	-	2,3-Cl ₂	H	
1.354	-	2,3-Cl ₂	2-CH ₃	
1.355	-	2,3-Cl ₂	3-CH ₃	
1.356	-	2,3-Cl ₂	4-CH ₃	
1.357	-	2,3-Cl ₂	2-F	
1.358	-	2,3-Cl ₂	3-F	
1.359	-	2,3-Cl ₂	4-F	
1.360	-	2,3-Cl ₂	2-Cl	
1.361	-	2,3-Cl ₂	3-Cl	
1.362	-	2,3-Cl ₂	4-Cl	
1.363	-	2,3-Cl ₂	2-CF ₃	
1.364	-	2,3-Cl ₂	3-CF ₃	
1.365	-	2,3-Cl ₂	4-CF ₃	

20

25

30

35

40

45

50

RU 2 296 747 C2

5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

№	X	R ₁	R ₂	Физические характеристики
1.366	-	2,3-Cl ₂	2-OCF ₃	
1.367	-	2,3-Cl ₂	3-OCF ₃	
1.368	-	2,3-Cl ₂	4-OCF ₃	
1.369	-	2,3-Cl ₂	2,3-Cl ₂	
1.370	-	2,3-Cl ₂	2,4-Cl ₂	
1.371	-	2,3-Cl ₂	2,5-Cl ₂	
1.372	-	2,3-Cl ₂	2,6-Cl ₂	
1.373	-	2,3-Cl ₂	3,4-Cl ₂	
1.374	-	2,3-Cl ₂	3,5-Cl ₂	
1.375	-	2,4-Cl ₂	H	
1.376	-	2,4-Cl ₂	2-CH ₃	
1.377	-	2,4-Cl ₂	3-CH ₃	
1.378	-	2,4-Cl ₂	4-CH ₃	
1.379	-	2,4-Cl ₂	2-F	
1.380	-	2,4-Cl ₂	3-F	
1.381	-	2,4-Cl ₂	4-F	
1.382	-	2,4-Cl ₂	2-Cl	
1.383	-	2,4-Cl ₂	3-Cl	
1.384	-	2,4-Cl ₂	4-Cl	
1.385	-	2,4-Cl ₂	2-CF ₃	
1.386	-	2,4-Cl ₂	3-CF ₃	
1.387	-	2,4-Cl ₂	4-CF ₃	
1.388	-	2,4-Cl ₂	2-OCF ₃	
1.389	-	2,4-Cl ₂	3-OCF ₃	
1.390	-	2,4-Cl ₂	4-OCF ₃	
1.391	-	2,4-Cl ₂	2,3-Cl ₂	
1.392	-	2,4-Cl ₂	2,4-Cl ₂	
1.393	-	2,4-Cl ₂	2,5-Cl ₂	
1.394	-	2,4-Cl ₂	2,6-Cl ₂	
1.395	-	2,4-Cl ₂	3,4-Cl ₂	
1.396	-	2,4-Cl ₂	3,5-Cl ₂	
1.397	-	2,5-Cl ₂	H	
1.398	-	2,5-Cl ₂	2-CH ₃	
1.399	-	2,5-Cl ₂	3-CH ₃	
1.400	-	2,5-Cl ₂	4-CH ₃	
1.401	-	2,5-Cl ₂	2-F	
1.402	-	2,5-Cl ₂	3-F	
1.403	-	2,5-Cl ₂	4-F	
1.404	-	2,5-Cl ₂	2-Cl	
1.405	-	2,5-Cl ₂	3-Cl	
1.406	-	2,5-Cl ₂	4-Cl	

№	X	R ₁	R ₂	Физические характеристики
1.407	-	2,5-Cl ₂	2-CF ₃	
1.408	-	2,5-Cl ₂	3-CF ₃	
1.409	-	2,5-Cl ₂	4-CF ₃	
1.410	-	2,5-Cl ₂	2-OCF ₃	
1.411	-	2,5-Cl ₂	3-OCF ₃	
1.412	-	2,5-Cl ₂	4-OCF ₃	
1.413	-	2,5-Cl ₂	2,3-Cl ₂	
1.414	-	2,5-Cl ₂	2,4-Cl ₂	
1.415	-	2,5-Cl ₂	2,5-Cl ₂	
1.416	-	2,5-Cl ₂	2,6-Cl ₂	
1.417	-	2,5-Cl ₂	3,4-Cl ₂	
1.418	-	2,5-Cl ₂	3,5-Cl ₂	

RU 2 296 747 C2

5

1.419	-	2,6-Cl ₂	H	
1.420	-	2,6-Cl ₂	2-CH ₃	
1.421	-	2,6-Cl ₂	3-CH ₃	
1.422	-	2,6-Cl ₂	4-CH ₃	
1.423	-	2,6-Cl ₂	2-F	
1.424	-	2,6-Cl ₂	3-F	
1.425	-	2,6-Cl ₂	4-F	
1.426	-	2,6-Cl ₂	2-Cl	
1.427	-	2,6-Cl ₂	3-Cl	
1.428	-	2,6-Cl ₂	4-Cl	
1.429	-	2,6-Cl ₂	2-CF ₃	
1.430	-	2,6-Cl ₂	3-CF ₃	
1.431	-	2,6-Cl ₂	4-CF ₃	
1.432	-	2,6-Cl ₂	2-OCF ₃	
1.433	-	2,6-Cl ₂	3-OCF ₃	
1.434	-	2,6-Cl ₂	4-OCF ₃	
1.435	-	2,6-Cl ₂	2,3-Cl ₂	
1.436	-	2,6-Cl ₂	2,4-Cl ₂	
1.437	-	2,6-Cl ₂	2,5-Cl ₂	
1.438	-	2,6-Cl ₂	2,6-Cl ₂	
1.439	-	2,6-Cl ₂	3,4-Cl ₂	
1.440	-	2,6-Cl ₂	3,5-Cl ₂	
1.441	-	3,4-Cl ₂	H	
1.442	-	3,4-Cl ₂	2-CH ₃	
1.443	-	3,4-Cl ₂	3-CH ₃	
1.444	-	3,4-Cl ₂	4-CH ₃	
1.445	-	3,4-Cl ₂	2-F	
1.446	-	3,4-Cl ₂	3-F	
1.447	-	3,4-Cl ₂	4-F	

10

15

20

25

30

35

40

45

50

№	X	R ₁	R ₂	Физические характеристики
1.448	-	3,4-Cl ₂	2-Cl	
1.449	-	3,4-Cl ₂	3-Cl	
1.450	-	3,4-Cl ₂	4-Cl	
1.451	-	3,4-Cl ₂	2-CF ₃	
1.452	-	3,4-Cl ₂	3-CF ₃	
1.453	-	3,4-Cl ₂	4-CF ₃	
1.454	-	3,4-Cl ₂	2-OCF ₃	
1.455	-	3,4-Cl ₂	3-OCF ₃	
1.456	-	3,4-Cl ₂	4-OCF ₃	
1.457	-	3,4-Cl ₂	2,3-Cl ₂	
1.458	-	3,4-Cl ₂	2,4-Cl ₂	
1.459	-	3,4-Cl ₂	2,5-Cl ₂	
1.460	-	3,4-Cl ₂	2,6-Cl ₂	
1.461	-	3,4-Cl ₂	3,4-Cl ₂	
1.462	-	3,4-Cl ₂	3,5-Cl ₂	
1.463	-	3,5-Cl ₂	H	
1.464	-	3,5-Cl ₂	2-CH ₃	
1.465	-	3,5-Cl ₂	3-CH ₃	
1.466	-	3,5-Cl ₂	4-CH ₃	
1.467	-	3,5-Cl ₂	2-F	
1.468	-	3,5-Cl ₂	3-F	
1.469	-	3,5-Cl ₂	4-F	
1.470	-	3,5-Cl ₂	2-Cl	
1.471	-	3,5-Cl ₂	3-Cl	
1.472	-	3,5-Cl ₂	4-Cl	
1.473	-	3,5-Cl ₂	2-CF ₃	

RU 2 296 747 C2

5

1.474	-	3,5-Cl ₂	3-CF ₃	
1.475	-	3,5-Cl ₂	4-CF ₃	
1.476	-	3,5-Cl ₂	2-OCF ₃	
1.477	-	3,5-Cl ₂	3-OCF ₃	
1.478	-	3,5-Cl ₂	4-OCF ₃	
1.479	-	3,5-Cl ₂	2,3-Cl ₂	
1.480	-	3,5-Cl ₂	2,4-Cl ₂	
1.481	-	3,5-Cl ₂	2,5-Cl ₂	
1.482	-	3,5-Cl ₂	2,6-Cl ₂	
1.483	-	3,5-Cl ₂	3,4-Cl ₂	
1.484	-	3,5-Cl ₂	3,5-Cl ₂	
1.485	NH	H	H	
1.486	NH	H	2-CH ₃	
1.487	NH	H	3-CH ₃	
1.488	NH	H	4-CH ₃	

10

15

№	X	R ₁	R ₂	Физические характеристики
1.489	NH	H	2-F	
1.490	NH	H	3-F	
1.491	NH	H	4-F	
1.492	NH	H	2-Cl	
1.493	NH	H	3-Cl	
1.494	NH	H	4-Cl	
1.495	NH	H	2-CF ₃	
1.496	NH	H	3-CF ₃	
1.497	NH	H	4-CF ₃	
1.498	NH	H	2-OCF ₃	
1.499	NH	H	3-OCF ₃	
1.500	NH	H	4-OCF ₃	
1.501	NH	H	2,3-Cl ₂	
1.502	NH	H	2,4-Cl ₂	
1.503	NH	H	2,5-Cl ₂	
1.504	NH	H	2,6-Cl ₂	
1.505	NH	H	3,4-Cl ₂	
1.506	NH	H	3,5-Cl ₂	
1.507	NH	2-CH ₃	H	
1.508	NH	2-CH ₃	2-CH ₃	
1.509	NH	2-CH ₃	3-CH ₃	
1.510	NH	2-CH ₃	4-CH ₃	
1.511	NH	2-CH ₃	2-F	
1.512	NH	2-CH ₃	3-F	
1.513	NH	2-CH ₃	4-F	
1.514	NH	2-CH ₃	2-Cl	
1.515	NH	2-CH ₃	3-Cl	
1.516	NH	2-CH ₃	4-Cl	
1.517	NH	2-CH ₃	2-CF ₃	
1.518	NH	2-CH ₃	3-CF ₃	
1.519	NH	2-CH ₃	4-CF ₃	
1.520	NH	2-CH ₃	2-OCF ₃	
1.521	NH	2-CH ₃	3-OCF ₃	
1.522	NH	2-CH ₃	4-OCF ₃	
1.523	NH	2-CH ₃	2,3-Cl ₂	
1.524	NH	2-CH ₃	2,4-Cl ₂	
1.525	NH	2-CH ₃	2,5-Cl ₂	
1.526	NH	2-CH ₃	2,6-Cl ₂	
1.527	NH	2-CH ₃	3,4-Cl ₂	
1.528	NH	2-CH ₃	3,5-Cl ₂	

20

25

30

35

40

45

50

RU 2 296 747 C2

1.529	NH	3-CH ₃	H	
-------	----	-------------------	---	--

5

№	X	R ₁	R ₂	Физические характеристики
1.530	NH	3-CH ₃	2-CH ₃	
1.531	NH	3-CH ₃	3-CH ₃	
1.532	NH	3-CH ₃	4-CH ₃	
1.533	NH	3-CH ₃	2-F	
1.534	NH	3-CH ₃	3-F	
1.535	NH	3-CH ₃	4-F	
1.536	NH	3-CH ₃	2-Cl	
1.537	NH	3-CH ₃	3-Cl	
1.538	NH	3-CH ₃	4-Cl	
1.539	NH	3-CH ₃	2-CF ₃	
1.540	NH	3-CH ₃	3-CF ₃	
1.541	NH	3-CH ₃	4-CF ₃	
1.542	NH	3-CH ₃	2-OCF ₃	
1.543	NH	3-CH ₃	3-OCF ₃	
1.544	NH	3-CH ₃	4-OCF ₃	
1.545	NH	3-CH ₃	2,3-Cl ₂	
1.546	NH	3-CH ₃	2,4-Cl ₂	
1.547	NH	3-CH ₃	2,5-Cl ₂	
1.548	NH	3-CH ₃	2,6-Cl ₂	
1.549	NH	3-CH ₃	3,4-Cl ₂	
1.550	NH	3-CH ₃	3,5-Cl ₂	
1.551	NH	4-CH ₃	H	
1.552	NH	4-CH ₃	2-CH ₃	
1.553	NH	4-CH ₃	3-CH ₃	
1.554	NH	4-CH ₃	4-CH ₃	
1.555	NH	4-CH ₃	2-F	
1.556	NH	4-CH ₃	3-F	
1.557	NH	4-CH ₃	4-F	
1.558	NH	4-CH ₃	2-Cl	
1.559	NH	4-CH ₃	3-Cl	
1.560	NH	4-CH ₃	4-Cl	
1.561	NH	4-CH ₃	2-CF ₃	
1.562	NH	4-CH ₃	3-CF ₃	
1.563	NH	4-CH ₃	4-CF ₃	
1.564	NH	4-CH ₃	2-OCF ₃	
1.565	NH	4-CH ₃	3-OCF ₃	
1.566	NH	4-CH ₃	4-OCF ₃	
1.567	NH	4-CH ₃	2,3-Cl ₂	
1.568	NH	4-CH ₃	2,4-Cl ₂	
1.569	NH	4-CH ₃	2,5-Cl ₂	
1.570	NH	4-CH ₃	2,6-Cl ₂	

10

15

20

25

30

35

40

45

50

№	X	R ₁	R ₂	Физические характеристики
1.571	NH	4-CH ₃	3,4-Cl ₂	
1.572	NH	4-CH ₃	3,5-Cl ₂	
1.573	NH	2-F	H	
1.574	NH	2-F	2-CH ₃	
1.575	NH	2-F	3-CH ₃	
1.576	NH	2-F	4-CH ₃	
1.577	NH	2-F	2-F	
1.578	NH	2-F	3-F	
1.579	NH	2-F	4-F	
1.580	NH	2-F	2-Cl	
1.581	NH	2-F	3-Cl	

RU 2 296 747 C2

5

1.582	NH	2-F	4-Cl	
1.583	NH	2-F	2-CF ₃	
1.584	NH	2-F	3-CF ₃	
1.585	NH	2-F	4-CF ₃	
1.586	NH	2-F	2-OCF ₃	
1.587	NH	2-F	3-OCF ₃	
1.588	NH	2-F	4-OCF ₃	
1.589	NH	2-F	2,3-Cl ₂	
1.590	NH	2-F	2,4-Cl ₂	
1.591	NH	2-F	2,5-Cl ₂	
1.592	NH	2-F	2,6-Cl ₂	
1.593	NH	2-F	3,4-Cl ₂	
1.594	NH	2-F	3,5-Cl ₂	
1.595	NH	3-F	H	
1.596	NH	3-F	2-CH ₃	
1.597	NH	3-F	3-CH ₃	
1.598	NH	3-F	4-CH ₃	
1.599	NH	3-F	2-F	
1.600	NH	3-F	3-F	
1.601	NH	3-F	4-F	
1.602	NH	3-F	2-Cl	
1.603	NH	3-F	3-Cl	
1.604	NH	3-F	4-Cl	
1.605	NH	3-F	2-CF ₃	
1.606	NH	3-F	3-CF ₃	
1.607	NH	3-F	4-CF ₃	
1.608	NH	3-F	2-OCF ₃	
1.609	NH	3-F	3-OCF ₃	
1.610	NH	3-F	4-OCF ₃	
1.611	NH	3-F	2,3-Cl ₂	
1.612	NH	3-F	2,4-Cl ₂	
1.613	NH	3-F	2,5-Cl ₂	

10

15

20

25

30

35

40

45

50

№	X	R ₁	R ₂	Физические характеристики
1.614	NH	3-F	2,6-Cl ₂	
1.615	NH	3-F	3,4-Cl ₂	
1.616	NH	3-F	3,5-Cl ₂	
1.617	NH	4-F	H	
1.618	NH	4-F	2-CH ₃	
1.619	NH	4-F	3-CH ₃	
1.620	NH	4-F	4-CH ₃	
1.621	NH	4-F	2-F	
1.622	NH	4-F	3-F	
1.623	NH	4-F	4-F	
1.624	NH	4-F	2-Cl	
1.625	NH	4-F	3-Cl	
1.626	NH	4-F	4-Cl	
1.627	NH	4-F	2-CF ₃	
1.628	NH	4-F	3-CF ₃	
1.629	NH	4-F	4-CF ₃	
1.630	NH	4-F	2-OCF ₃	
1.631	NH	4-F	3-OCF ₃	
1.632	NH	4-F	4-OCF ₃	
1.633	NH	4-F	2,3-Cl ₂	
1.634	NH	4-F	2,4-Cl ₂	
1.635	NH	4-F	2,5-Cl ₂	
1.636	NH	4-F	2,6-Cl ₂	

RU 2 296 747 C2

5

1.637	NH	4-F	3,4-Cl ₂	
1.638	NH	4-F	3,5-Cl ₂	
1.639	NH	2-Cl	H	
1.640	NH	2-Cl	2-CH ₃	
1.641	NH	2-Cl	3-CH ₃	
1.642	NH	2-Cl	4-CH ₃	
1.643	NH	2-Cl	2-F	
1.644	NH	2-Cl	3-F	
1.645	NH	2-Cl	4-F	
1.646	NH	2-Cl	2-Cl	
1.647	NH	2-Cl	3-Cl	
1.648	NH	2-Cl	4-Cl	
1.649	NH	2-Cl	2-CF ₃	
1.650	NH	2-Cl	3-CF ₃	
1.651	NH	2-Cl	4-CF ₃	T _{пл} 142-143°C
1.652	NH	2-Cl	2-OCF ₃	
1.653	NH	2-Cl	3-OCF ₃	
1.654	NH	2-Cl	4-OCF ₃	
1.655	NH	2-Cl	2,3-Cl ₂	
1.656	NH	2-Cl	2,4-Cl ₂	

10

15

20

25

30

35

40

45

50

№	X	R ₁	R ₂	Физические характеристики
1.657	NH	2-Cl	2,5-Cl ₂	
1.658	NH	2-Cl	2,6-Cl ₂	
1.659	NH	2-Cl	3,4-Cl ₂	
1.660	NH	2-Cl	3,5-Cl ₂	
1.661	NH	3-Cl	H	
1.662	NH	3-Cl	2-CH ₃	
1.663	NH	3-Cl	3-CH ₃	
1.664	NH	3-Cl	4-CH ₃	
1.665	NH	3-Cl	2-F	
1.666	NH	3-Cl	3-F	
1.667	NH	3-Cl	4-F	
1.668	NH	3-Cl	2-Cl	
1.669	NH	3-Cl	3-Cl	
1.670	NH	3-Cl	4-Cl	
1.671	NH	3-Cl	2-CF ₃	
1.672	NH	3-Cl	3-CF ₃	
1.673	NH	3-Cl	4-CF ₃	
1.674	NH	3-Cl	2-OCF ₃	
1.675	NH	3-Cl	3-OCF ₃	
1.676	NH	3-Cl	4-OCF ₃	
1.677	NH	3-Cl	2,3-Cl ₂	
1.678	NH	3-Cl	2,4-Cl ₂	
1.679	NH	3-Cl	2,5-Cl ₂	
1.680	NH	3-Cl	2,6-Cl ₂	
1.681	NH	3-Cl	3,4-Cl ₂	
1.682	NH	3-Cl	3,5-Cl ₂	
1.683	NH	4-Cl	H	
1.684	NH	4-Cl	2-CH ₃	
1.685	NH	4-Cl	3-CH ₃	
1.686	NH	4-Cl	4-CH ₃	
1.687	NH	4-Cl	2-F	
1.688	NH	4-Cl	3-F	
1.689	NH	4-Cl	4-F	
1.690	NH	4-Cl	2-Cl	
1.691	NH	4-Cl	3-Cl	

RU 2 296 747 C2

5

1.692	NH	4-Cl	4-Cl	
1.693	NH	4-Cl	2-CF ₃	
1.694	NH	4-Cl	3-CF ₃	
1.695	NH	4-Cl	4-CF ₃	
1.696	NH	4-Cl	2-OCF ₃	
1.697	NH	4-Cl	3-OCF ₃	
1.698	NH	4-Cl	4-OCF ₃	
1.699	NH	4-Cl	2,3-Cl ₂	

10

№	X	R ₁	R ₂	Физические характеристики
1.700	NH	4-Cl	2,4-Cl ₂	
1.701	NH	4-Cl	2,5-Cl ₂	
1.702	NH	4-Cl	2,6-Cl ₂	
1.703	NH	4-Cl	3,4-Cl ₂	
1.704	NH	4-Cl	3,5-Cl ₂	
1.705	NH	2-CF ₃	H	
1.706	NH	2-CF ₃	2-CH ₃	
1.707	NH	2-CF ₃	3-CH ₃	
1.708	NH	2-CF ₃	4-CH ₃	
1.709	NH	2-CF ₃	2-F	
1.710	NH	2-CF ₃	3-F	
1.711	NH	2-CF ₃	4-F	
1.712	NH	2-CF ₃	2-Cl	
1.713	NH	2-CF ₃	3-Cl	
1.714	NH	2-CF ₃	4-Cl	
1.715	NH	2-CF ₃	2-CF ₃	
1.716	NH	2-CF ₃	3-CF ₃	
1.717	NH	2-CF ₃	4-CF ₃	t _{пл} 162-163°C
1.718	NH	2-CF ₃	2-OCF ₃	
1.719	NH	2-CF ₃	3-OCF ₃	
1.720	NH	2-CF ₃	4-OCF ₃	t _{пл} 119-120°C
1.721	NH	2-CF ₃	2,3-Cl ₂	
1.722	NH	2-CF ₃	2,4-Cl ₂	
1.723	NH	2-CF ₃	2,5-Cl ₂	
1.724	NH	2-CF ₃	2,6-Cl ₂	
1.725	NH	2-CF ₃	3,4-Cl ₂	
1.726	NH	2-CF ₃	3,5-Cl ₂	
1.727	NH	3-CF ₃	H	
1.728	NH	3-CF ₃	2-CH ₃	
1.729	NH	3-CF ₃	3-CH ₃	
1.730	NH	3-CF ₃	4-CH ₃	
1.731	NH	3-CF ₃	2-F	
1.732	NH	3-CF ₃	3-F	
1.733	NH	3-CF ₃	4-F	
1.734	NH	3-CF ₃	2-Cl	
1.735	NH	3-CF ₃	3-Cl	
1.736	NH	3-CF ₃	4-Cl	
1.737	NH	3-CF ₃	2-CF ₃	
1.738	NH	3-CF ₃	3-CF ₃	
1.739	NH	3-CF ₃	4-CF ₃	
1.740	NH	3-CF ₃	2-OCF ₃	

35

40

45

50

№	X	R ₁	R ₂	Физические характеристики
1.741	NH	3-CF ₃	3-OCF ₃	
1.742	NH	3-CF ₃	4-OCF ₃	
1.743	NH	3-CF ₃	2,3-Cl ₂	
1.744	NH	3-CF ₃	2,4-Cl ₂	

RU 2 296 747 C2

5

1.745	NH	3-CF ₃	2,5-Cl ₂	
1.746	NH	3-CF ₃	2,6-Cl ₂	
1.747	NH	3-CF ₃	3,4-Cl ₂	
1.748	NH	3-CF ₃	3,5-Cl ₂	
1.749	NH	4-CF ₃	H	
1.750	NH	4-CF ₃	2-CH ₃	
1.751	NH	4-CF ₃	3-CH ₃	
1.752	NH	4-CF ₃	4-CH ₃	
1.753	NH	4-CF ₃	2-F	
1.754	NH	4-CF ₃	3-F	
1.755	NH	4-CF ₃	4-F	
1.756	NH	4-CF ₃	2-Cl	
1.757	NH	4-CF ₃	3-Cl	
1.758	NH	4-CF ₃	4-Cl	
1.759	NH	4-CF ₃	2-CF ₃	
1.760	NH	4-CF ₃	3-CF ₃	
1.761	NH	4-CF ₃	4-CF ₃	
1.762	NH	4-CF ₃	2-OCF ₃	
1.763	NH	4-CF ₃	3-OCF ₃	
1.764	NH	4-CF ₃	4-OCF ₃	
1.765	NH	4-CF ₃	2,3-Cl ₂	
1.766	NH	4-CF ₃	2,4-Cl ₂	
1.767	NH	4-CF ₃	2,5-Cl ₂	
1.768	NH	4-CF ₃	2,6-Cl ₂	
1.769	NH	4-CF ₃	3,4-Cl ₂	
1.770	NH	4-CF ₃	3,5-Cl ₂	
1.771	NH	2-OCF ₃	H	
1.772	NH	2-OCF ₃	2-CH ₃	
1.773	NH	2-OCF ₃	3-CH ₃	
1.774	NH	2-OCF ₃	4-CH ₃	
1.775	NH	2-OCF ₃	2-F	
1.776	NH	2-OCF ₃	3-F	
1.777	NH	2-OCF ₃	4-F	
1.778	NH	2-OCF ₃	2-Cl	
1.779	NH	2-OCF ₃	3-Cl	
1.780	NH	2-OCF ₃	4-Cl	
1.781	NH	2-OCF ₃	2-CF ₃	

10

15

20

25

30

35

40

45

50

№	X	R ₁	R ₂	Физические характеристики
1.782	NH	2-OCF ₃	3-CF ₃	
1.783	NH	2-OCF ₃	4-CF ₃	
1.784	NH	2-OCF ₃	2-OCF ₃	
1.785	NH	2-OCF ₃	3-OCF ₃	
1.786	NH	2-OCF ₃	4-OCF ₃	
1.787	NH	2-OCF ₃	2,3-Cl ₂	
1.788	NH	2-OCF ₃	2,4-Cl ₂	
1.789	NH	2-OCF ₃	2,5-Cl ₂	
1.790	NH	2-OCF ₃	2,6-Cl ₂	
1.791	NH	2-OCF ₃	3,4-Cl ₂	
1.792	NH	2-OCF ₃	3,5-Cl ₂	
1.793	NH	3-OCF ₃	H	
1.794	NH	3-OCF ₃	2-CH ₃	
1.795	NH	3-OCF ₃	3-CH ₃	
1.796	NH	3-OCF ₃	4-CH ₃	
1.797	NH	3-OCF ₃	2-F	
1.798	NH	3-OCF ₃	3-F	
1.799	NH	3-OCF ₃	4-F	

5

1.800	NH	3-OCF ₃	2-Cl	
1.801	NH	3-OCF ₃	3-Cl	
1.802	NH	3-OCF ₃	4-Cl	
1.803	NH	3-OCF ₃	2-CF ₃	
1.804	NH	3-OCF ₃	3-CF ₃	
1.805	NH	3-OCF ₃	4-CF ₃	
1.806	NH	3-OCF ₃	2-OCF ₃	
1.807	NH	3-OCF ₃	3-OCF ₃	
1.808	NH	3-OCF ₃	4-OCF ₃	
1.809	NH	3-OCF ₃	2,3-Cl ₂	
1.810	NH	3-OCF ₃	2,4-Cl ₂	
1.811	NH	3-OCF ₃	2,5-Cl ₂	
1.812	NH	3-OCF ₃	2,6-Cl ₂	
1.813	NH	3-OCF ₃	3,4-Cl ₂	
1.814	NH	3-OCF ₃	3,5-Cl ₂	
1.815	NH	4-OCF ₃	H	
1.816	NH	4-OCF ₃	2-CH ₃	
1.817	NH	4-OCF ₃	3-CH ₃	
1.818	NH	4-OCF ₃	4-CH ₃	
1.819	NH	4-OCF ₃	2-F	
1.820	NH	4-OCF ₃	3-F	
1.821	NH	4-OCF ₃	4-F	
1.822	NH	4-OCF ₃	2-Cl	

10

15

20

25

30

35

40

45

50

№	X	R ₁	R ₂	Физические характеристики
1.823	NH	4-OCF ₃	3-Cl	
1.824	NH	4-OCF ₃	4-Cl	
1.825	NH	4-OCF ₃	2-CF ₃	
1.826	NH	4-OCF ₃	3-CF ₃	
1.827	NH	4-OCF ₃	4-CF ₃	
1.828	NH	4-OCF ₃	2-OCF ₃	
1.829	NH	4-OCF ₃	3-OCF ₃	
1.830	NH	4-OCF ₃	4-OCF ₃	
1.831	NH	4-OCF ₃	2,3-Cl ₂	
1.832	NH	4-OCF ₃	2,4-Cl ₂	
1.833	NH	4-OCF ₃	2,5-Cl ₂	
1.834	NH	4-OCF ₃	2,6-Cl ₂	
1.835	NH	4-OCF ₃	3,4-Cl ₂	
1.836	NH	4-OCF ₃	3,5-Cl ₂	
1.837	NH	2,3-Cl ₂	H	
1.838	NH	2,3-Cl ₂	2-CH ₃	
1.839	NH	2,3-Cl ₂	3-CH ₃	
1.840	NH	2,3-Cl ₂	4-CH ₃	
1.841	NH	2,3-Cl ₂	2-F	
1.842	NH	2,3-Cl ₂	3-F	
1.843	NH	2,3-Cl ₂	4-F	
1.844	NH	2,3-Cl ₂	2-Cl	
1.845	NH	2,3-Cl ₂	3-Cl	
1.846	NH	2,3-Cl ₂	4-Cl	
1.847	NH	2,3-Cl ₂	2-CF ₃	
1.848	NH	2,3-Cl ₂	3-CF ₃	
1.849	NH	2,3-Cl ₂	4-CF ₃	
1.850	NH	2,3-Cl ₂	2-OCF ₃	
1.851	NH	2,3-Cl ₂	3-OCF ₃	
1.852	NH	2,3-Cl ₂	4-OCF ₃	
1.853	NH	2,3-Cl ₂	2,3-Cl ₂	
1.854	NH	2,3-Cl ₂	2,4-Cl ₂	

RU 2 296 747 C2

5

1.855	NH	2,3-Cl ₂	2,5-Cl ₂	
1.856	NH	2,3-Cl ₂	2,6-Cl ₂	
1.857	NH	2,3-Cl ₂	3,4-Cl ₂	
1.858	NH	2,3-Cl ₂	3,5-Cl ₂	
1.859	NH	2,4-Cl ₂	H	
1.860	NH	2,4-Cl ₂	2-CH ₃	
1.861	NH	2,4-Cl ₂	3-CH ₃	
1.862	NH	2,4-Cl ₂	4-CH ₃	
1.863	NH	2,4-Cl ₂	2-F	

10

№	X	R ₁	R ₂	Физические характеристики
1.864	NH	2,4-Cl ₂	3-F	
1.865	NH	2,4-Cl ₂	4-F	
1.866	NH	2,4-Cl ₂	2-Cl	
1.867	NH	2,4-Cl ₂	3-Cl	
1.868	NH	2,4-Cl ₂	4-Cl	
1.869	NH	2,4-Cl ₂	2-CF ₃	
1.870	NH	2,4-Cl ₂	3-CF ₃	
1.871	NH	2,4-Cl ₂	4-CF ₃	
1.872	NH	2,4-Cl ₂	2-OCF ₃	
1.873	NH	2,4-Cl ₂	3-OCF ₃	
1.874	NH	2,4-Cl ₂	4-OCF ₃	
1.875	NH	2,4-Cl ₂	2,3-Cl ₂	
1.876	NH	2,4-Cl ₂	2,4-Cl ₂	
1.877	NH	2,4-Cl ₂	2,5-Cl ₂	
1.878	NH	2,4-Cl ₂	2,6-Cl ₂	
1.879	NH	2,4-Cl ₂	3,4-Cl ₂	
1.880	NH	2,4-Cl ₂	3,5-Cl ₂	
1.881	NH	2,5-Cl ₂	H	
1.882	NH	2,5-Cl ₂	2-CH ₃	
1.883	NH	2,5-Cl ₂	3-CH ₃	
1.884	NH	2,5-Cl ₂	4-CH ₃	
1.885	NH	2,5-Cl ₂	2-F	
1.886	NH	2,5-Cl ₂	3-F	
1.887	NH	2,5-Cl ₂	4-F	
1.888	NH	2,5-Cl ₂	2-Cl	
1.889	NH	2,5-Cl ₂	3-Cl	
1.890	NH	2,5-Cl ₂	4-Cl	
1.891	NH	2,5-Cl ₂	2-CF ₃	
1.892	NH	2,5-Cl ₂	3-CF ₃	
1.893	NH	2,5-Cl ₂	4-CF ₃	
1.894	NH	2,5-Cl ₂	2-OCF ₃	
1.895	NH	2,5-Cl ₂	3-OCF ₃	
1.896	NH	2,5-Cl ₂	4-OCF ₃	
1.897	NH	2,5-Cl ₂	2,3-Cl ₂	
1.898	NH	2,5-Cl ₂	2,4-Cl ₂	
1.899	NH	2,5-Cl ₂	2,5-Cl ₂	
1.900	NH	2,5-Cl ₂	2,6-Cl ₂	
1.901	NH	2,5-Cl ₂	3,4-Cl ₂	
1.902	NH	2,5-Cl ₂	3,5-Cl ₂	
1.903	NH	2,6-Cl ₂	H	
1.904	NH	2,6-Cl ₂	2-CH ₃	

15

20

25

30

35

40

45

50

№	X	R ₁	R ₂	Физические характеристики
1.905	NH	2,6-Cl ₂	3-CH ₃	
1.906	NH	2,6-Cl ₂	4-CH ₃	
1.907	NH	2,6-Cl ₂	2-F	

RU 2 296 747 C2

5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

1.908	NH	2,6-Cl ₂	3-F	
1.909	NH	2,6-Cl ₂	4-F	
1.910	NH	2,6-Cl ₂	2-Cl	
1.911	NH	2,6-Cl ₂	3-Cl	
1.912	NH	2,6-Cl ₂	4-Cl	
1.913	NH	2,6-Cl ₂	2-CF ₃	
1.914	NH	2,6-Cl ₂	3-CF ₃	
1.915	NH	2,6-Cl ₂	4-CF ₃	
1.916	NH	2,6-Cl ₂	2-OCF ₃	
1.917	NH	2,6-Cl ₂	3-OCF ₃	
1.918	NH	2,6-Cl ₂	4-OCF ₃	
1.919	NH	2,6-Cl ₂	2,3-Cl ₂	
1.920	NH	2,6-Cl ₂	2,4-Cl ₂	
1.921	NH	2,6-Cl ₂	2,5-Cl ₂	
1.922	NH	2,6-Cl ₂	2,6-Cl ₂	
1.923	NH	2,6-Cl ₂	3,4-Cl ₂	
1.924	NH	2,6-Cl ₂	3,5-Cl ₂	
1.925	NH	3,4-Cl ₂	H	
1.926	NH	2,6-Cl ₂	2-CH ₃	
1.927	NH	2,6-Cl ₂	3-CH ₃	
1.928	NH	2,6-Cl ₂	4-CH ₃	
1.929	NH	2,6-Cl ₂	2-F	
1.930	NH	2,6-Cl ₂	3-F	
1.931	NH	2,6-Cl ₂	4-F	
1.932	NH	2,6-Cl ₂	2-Cl	
1.933	NH	2,6-Cl ₂	3-Cl	
1.934	NH	2,6-Cl ₂	4-Cl	
1.935	NH	2,6-Cl ₂	2-CF ₃	
1.936	NH	2,6-Cl ₂	3-CF ₃	
1.937	NH	2,6-Cl ₂	4-CF ₃	
1.938	NH	2,6-Cl ₂	2-OCF ₃	
1.939	NH	2,6-Cl ₂	3-OCF ₃	
1.940	NH	2,6-Cl ₂	4-OCF ₃	
1.941	NH	2,6-Cl ₂	2,3-Cl ₂	
1.942	NH	2,6-Cl ₂	2,4-Cl ₂	
1.943	NH	2,6-Cl ₂	2,5-Cl ₂	
1.944	NH	2,6-Cl ₂	2,6-Cl ₂	
1.945	NH	2,6-Cl ₂	3,4-Cl ₂	

№	X	R ₁	R ₂	Физические характеристики
1.946	NH	3,4-Cl ₂	3,5-Cl ₂	
1.947	NH	3,5-Cl ₂	H	
1.948	NH	3,5-Cl ₂	2-CH ₃	
1.949	NH	3,5-Cl ₂	3-CH ₃	
1.950	NH	3,5-Cl ₂	4-CH ₃	
1.951	NH	3,5-Cl ₂	2-F	
1.952	NH	3,5-Cl ₂	3-F	
1.953	NH	3,5-Cl ₂	4-F	
1.954	NH	3,5-Cl ₂	2-Cl	
1.955	NH	3,5-Cl ₂	3-Cl	
1.956	NH	3,5-Cl ₂	4-Cl	
1.957	NH	3,5-Cl ₂	2-CF ₃	
1.958	NH	3,5-Cl ₂	3-CF ₃	
1.959	NH	3,5-Cl ₂	4-CF ₃	
1.960	NH	3,5-Cl ₂	2-OCF ₃	
1.961	NH	3,5-Cl ₂	3-OCF ₃	
1.962	NH	3,5-Cl ₂	4-OCF ₃	

1.963	NH	3,5-Cl ₂	2,3-Cl ₂	
1.964	NH	3,5-Cl ₂	2,4-Cl ₂	
1.965	NH	3,5-Cl ₂	2,5-Cl ₂	
1.966	NH	3,5-Cl ₂	2,6-Cl ₂	
1.967	NH	3,5-Cl ₂	3,4-Cl ₂	
1.968	NH	3,5-Cl ₂	3,5-Cl ₂	

5

Биологические примеры

1. Опыт *in vivo* на когтистых монгольских песчанках (*Meriones unsuiculatus*) по борьбе с нематодами *Trichostrongylus colubriformis* и *Haemonchus contortus* путем перорального введения действующего вещества

10

Когтистых монгольских песчанок возрастом от шести до восьми недель заражали путем искусственного кормления личинками *T. colubriformis* и *H. contortus* третьей возрастной стадии в количестве примерно по 2000 особей каждого паразита. Через 6 дней после заражения песчанок подвергали легкой анестезии с помощью N₂O и им перорально вводили тестируемые соединения, растворенные в смеси из 2-х частей ДМСО и 1-й части полиэтиленгликоля (ПЭГ 300), в дозах 100, 32 и 10-0,1 мг/кг. На 9-й день (через 3 дня после введения тестируемых соединений), на который большинство все еще присутствующих личинок *H. contortus* достигали 4-й возрастной стадии, а большинство личинок *T. colubriformis* достигали неполовозрелой стадии имаго, песчанок умерщвляли для подсчета гельминтов. Эффективность тестируемых соединений рассчитывали как выраженное в процентах уменьшение количества гельминтов у каждой песчанки по сравнению с геометрическим средним количества гельминтов у 8 зараженных и не получавших тестируемые соединения песчанок.

15

20

По результатам этого опыта было установлено, что соединения формулы I обеспечивают значительное уменьшение количества нематод у зараженных животных.

25

Инсектицидное и/или акарицидное действие соединений формулы I на животных и растениях можно проверять в соответствии с рассмотренными ниже экспериментами.

2. Акарицидное действие против *Voorphilus microplus* (штамм Biarra)

К пластине из ПВХ по горизонтали прикрепляют кусок липкой ленты такой длины, чтобы к нему можно было в один ряд приклеить их спинками 10 полностью насосавшихся крови женских особей клеща *Voorphilus microplus* (штамм Biarra). После этого в тельце каждого клеща с помощью инъекционной иглы инъецируют 1 мкл жидкости. Такая жидкость представляет собой смесь полиэтиленгликоля и ацетона в соотношении 1:1 и содержит определенное количество растворенного в ней действующего вещества, составляющее 1, 0,1 или 0,01 мкг из расчета на одного клеща. Клещам контрольной группы делают инъекцию без действующего вещества. После обработки клещей помещают в инсектарий, где они находятся при нормальных условиях при температуре около 28°C и 80%-ной относительной влажности до кладки яиц и до вылупления личинок из яиц клещей контрольной группы. Эффективность тестируемого соединения определяют по показателю IR₉₀, т.е. определяют ту дозу действующего вещества, при которой 9 из 10 женских особей клещей (соответствует 90%) откладывают яйца, из которых личинки не вылупляются даже по истечении 30 дней.

30

35

40

3. Оценка эффективности *in vitro* в опыте на насосавшихся крови женских особях *Voorphilus microplus* (BIARRA)

45

Насосавшихся крови женских особей клеща, устойчивого к фосфорорганическим соединениям штамма BIARRA, прикрепляют 4 группами по 10 особей в каждой к липкой ленте и на 1 ч накрывают куском ваты, пропитанным эмульсией или суспензией тестируемого соединения в концентрации 500, 125, 31 и 8 ч./млн соответственно. Эффективность тестируемых соединений оценивают через 28 дней по смертности клещей, откладыванию ими яиц и вылуплению личинок из яиц.

50

Мерой активности тестируемых соединений служит количество женских особей, которые

- гибнут незадолго до кладки яиц,
- выживают в течение некоторого периода времени, не откладывая яйца,

- откладывают яйца, в которых не формируются эмбрионы,
- откладывают яйца, в которых формируются эмбрионы, но из которых не вылупляются личинки, и
- откладывают яйца, в которых формируются эмбрионы и из которых обычно на 26-27-й день вылупляются личинки.

4. Оценка эффективности *in vitro* в опыте на нимфах *Amblyomma hebraeum*

Примерно 5 голодных нимф помещают в опытную пробирку из полистирола, содержащую 2 мл раствора, суспензии или эмульсии тестируемого соединения.

После погружения нимф на 10 мин в тестируемый раствор суспензию или эмульсию и двукратного встряхивания на вибрационном смесителе каждый раз в течение 10 с опытные пробирки укупоривают плотным комком ваты и переворачивают дном вверх. После впитывания всей жидкости ватным шариком его примерно наполовину проталкивают во все еще находящуюся в перевернутом положении пробирку, выжимая таким путем из ватного шарика большее количество впитанной им жидкости, стекающей в установленную под пробиркой чашку Петри.

После этого пробирки до оценки результатов опыта выдерживают при комнатной температуре в помещении с естественным освещением. Через 14 дней опытные пробирки погружают в лабораторный стакан с кипящей водой. Если в ответ на такое тепловое воздействие клещи начинают двигаться, то подобный эффект указывает на отсутствие акарицидного действия у тестируемого соединения в исследуемой концентрации, а если клещи остаются неподвижными, что свидетельствует об их гибели, то тестируемое соединение классифицируется как обладающее акарицидным действием в исследуемой концентрации. Все соединения исследуют в интервале концентраций от 0,1 до 100 ч./млн.

5. Действие против *Dermanyssus gallinae*

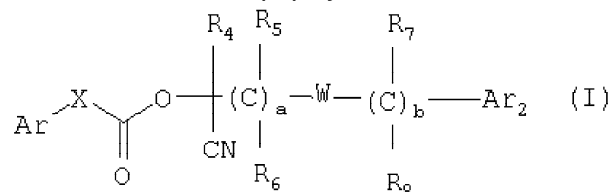
2-3 мл раствора, содержащего действующее вещество в концентрации 10 ч./млн, и примерно 200 особей клеща (*Dermanyssus gallinae*) различных стадий развития помещают в открытую сверху стеклянную емкость. После этого емкость закрывают комком ваты, встряхивают в течение 10 мин до полного смачивания раствором всех клещей и затем кратковременно переворачивают дном вверх, чтобы оставшийся раствор мог впитаться в вату. Через 3 дня определяют смертность клещей, подсчитывая количество погибших особей и выражая полученный результат в процентном отношении.

6. Действие против *Musca domestica*

Кубик сахара обрабатывают раствором тестируемого соединения с таким расчетом, чтобы его концентрация в сахаре после сушки в течение ночи составляла 250 ч./млн. Обработанный таким путем кубик сахара помещают в накрытую лабораторным стаканом алюминиевую чашку с влажной ватой и 10 взрослыми особями *Musca domestica*, устойчивого к фосфорорганическим соединениям штамма, и инкубируют при 25°C. Смертность мух определяют через 24 ч.

Формула изобретения

1. Соединения формулы



в которой Ar_1 и Ar_2 независимо друг от друга обозначают незамещенный фенил либо одно- или многозамещенный фенил, заместители которого выбраны из группы, включающей галоген, C_1 - C_6 алкил, гало- C_1 - C_6 алкил или гало- C_1 - C_6 алкоксигруппу, R_4 , R_5 , R_6 независимо друг от друга обозначают водород или C_1 - C_6 алкил, W обозначает O, X обозначает $\text{N}(\text{R}_{10})$, где R_{10} обозначает водород, а обозначает 1 и

b обозначает 0.

2. Соединения формулы I по п.1, в которой Ar₁ и Ar₂ независимо друг от друга обозначают незамещенный фенил либо одно- или двухзамещенный фенил, заместители которого выбраны из группы, включающей хлор, фтор, метил, трифторметил или трифторметоксигруппу,

R₄ обозначает метил,

R₅ и R₆ каждый обозначает водород,

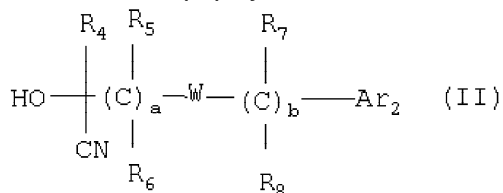
W обозначает O,

X обозначает N(R₁₀), где R₁₀ обозначает водород,

a обозначает 1 и

b обозначает 0.

3. Способ получения соединений формулы I по п.1, заключающийся в том, что соединение формулы



в котором R₄, R₅, R₆, R₇, R₈, Ar₂, W, a и b имеют указанные для формулы I значения, подвергают взаимодействию, необязательно в присутствии основного катализатора, с соединением формулы



в котором Ar₁ имеет указанные для формулы I значения.

4. Композиция для борьбы с паразитами, выбранными из группы, включающей гельминты, клещи, паразитиформные клещи и насекомые, которая содержит в качестве действующего вещества по меньшей мере одно соединение формулы I по п.1, а также носители и/или диспергаторы.

5. Применение соединений формулы I по п.1 для борьбы с паразитами, выбранными из группы, включающей гельминты, клещи, паразитиформные клещи и насекомые.

6. Способ борьбы с паразитами, выбранными из группы, включающей гельминты, клещи, паразитиформные клещи и насекомые, заключающийся в воздействии на паразитов эффективным количеством по меньшей мере одного соединения формулы I по п.1.

7. Применение соединения формулы I по п.1 в способе борьбы с паразитами теплокровных животных, выбранными из группы, включающей гельминты, клещи, паразитиформные клещи и насекомые.

8. Применение соединения формулы I по п.1 для получения фармацевтической композиции с направленным действием против паразитов теплокровных животных, выбранных из группы, включающей гельминты, клещи, паразитиформные клещи и насекомые.