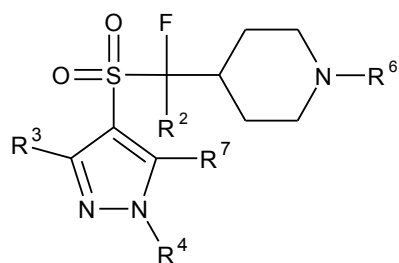


1. Спосіб одержання сполуки Формули II:



Формула II

або її солі, де:

R^2 являє собою C_1 - C_4 алкіл,

R^3 являє собою H, F, C_1 - C_4 алкіл або C_1 - C_4 галогеналкіл,

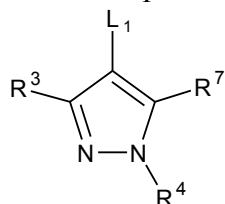
R^4 являє собою C_1 - C_4 алкіл,

R^6 являє собою H або захисну групу, і

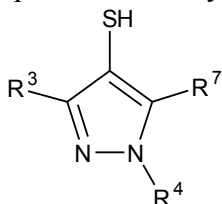
R^7 являє собою H, Cl або триалкілсиліл,

що включає етапи:

а) введення в реакцію сполуки Формули VII з елементарною сіркою в присутності основи, каталізатора та відновника з одержанням сполуки Формули VI:



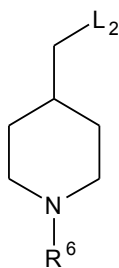
, Формула VII



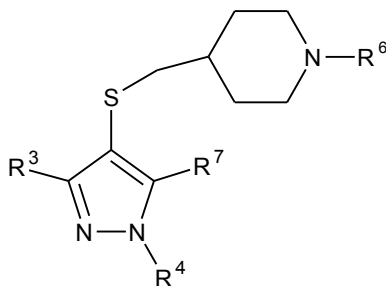
, Формула VI

де R^3 , R^4 і R^7 відповідають визначенням вище, L_1 являє собою відхідну групу;

б) введення в реакцію сполуки Формули VI зі сполукою Формули VIII з одержанням сполуки Формули V:



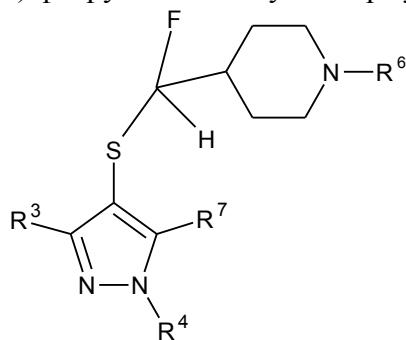
, Формула VIII



, Формула V

де L_2 являє собою відхідну групу; R^3 , R^4 , R^6 і R^7 відповідають визначенням вище;

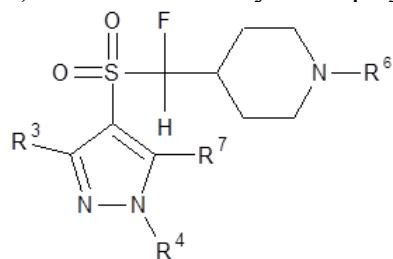
с) фторування сполуки Формули V з одержанням сполуки Формули IV:



Формула IV

де R^3 , R^4 , R^6 і R^7 відповідають визначенням вище;

д) окиснення сполуки Формули IV з одержанням сполуки Формули III:

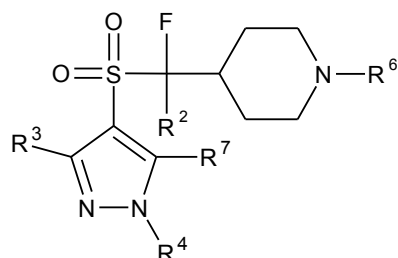


Формула III

де R^3 , R^4 , R^6 і R^7 відповідають визначенням вище; і

е) алкілювання сполуки Формули III з одержанням сполуки Формули II або її солі.

2. Спосіб одержання сполуки Формули II:



Формула II

або її солі, де:

R^2 являє собою C_1 - C_4 алкіл,

R^3 являє собою H, F, C_1 - C_4 алкіл або C_1 - C_4 галогеналкіл,

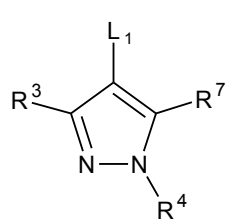
R^4 являє собою C_1 - C_4 алкіл,

R^6 являє собою H або захисну групу, і

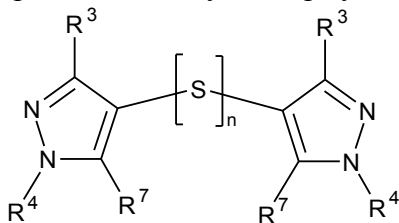
R^7 являє собою H, Cl або триалкілсиліл,

що включає етапи:

а) введення в реакцію сполуки Формули VII з елементарною сіркою в присутності основи, каталізатора та відновника з одержанням сполуки Формули VIB:



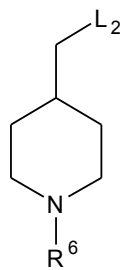
, Формула VII



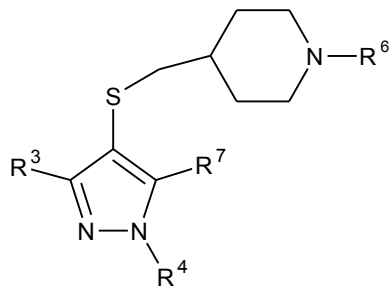
, Формула VIB

де R^3 , R^4 і R^7 відповідають визначенням вище, і L_1 являє собою відхідну групу, і де n дорівнює 2-8;

б) введення в реакцію сполуки Формули VIB зі сполукою Формули VIII з одержанням сполуки Формули V:



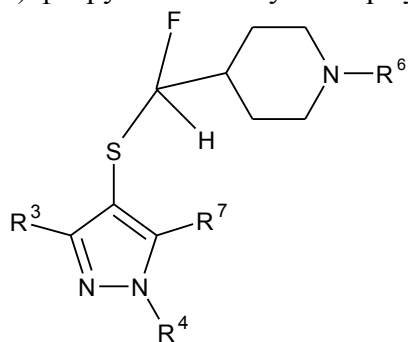
, Формула VIII



, Формула V

де R^6 відповідає визначенню вище, і L_2 являє собою відхідну групу;

с) фторування сполуки Формули V з одержанням сполуки Формули IV:

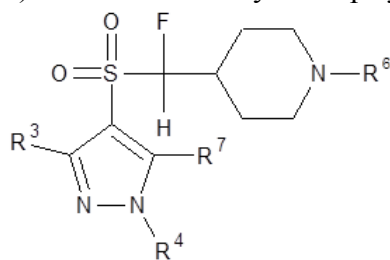


,

Формула IV

де R^3 , R^4 , R^6 і R^7 відповідають визначенням вище;

д) окиснення сполуки Формули IV з одержанням сполуки Формули III:



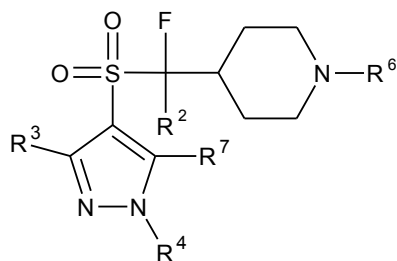
,

Формула III

де R^3 , R^4 , R^6 і R^7 відповідають визначенням вище; і

е) алкілювання сполуки Формули III з одержанням сполуки Формули II або її солі.

3. Спосіб одержання сполуки Формули II:



Формула II

або її солі, де:

R^2 являє собою C_1 - C_4 алкіл,

R^3 являє собою H, F, C_1 - C_4 алкіл або C_1 - C_4 галогеналкіл,

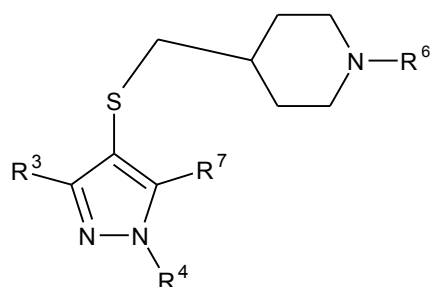
R^4 являє собою C_1 - C_4 алкіл,

R^6 являє собою H або захисну групу, і

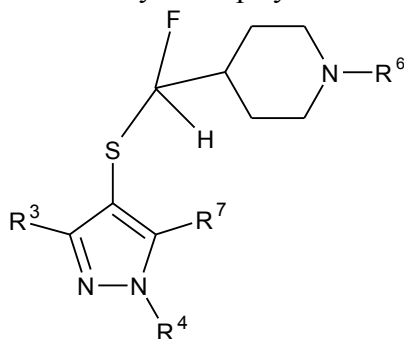
R^7 являє собою H, Cl або триалкілсиліл,

що включає етапи:

а) фторування сполуки Формули V з одержанням сполуки Формули IV:



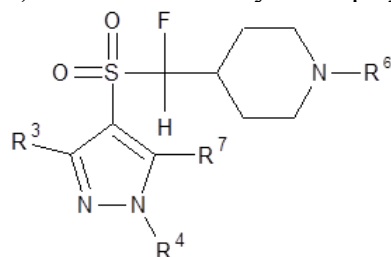
, Формула V



, Формула IV

де R^3 , R^4 , R^6 і R^7 відповідають визначенням вище;

д) окиснення сполуки Формули IV з одержанням сполуки Формули III:



,

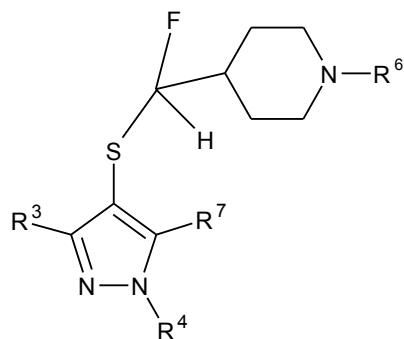
Формула III

де R^3 , R^4 , R^6 і R^7 відповідають визначенням вище; і

с) алкілювання сполуки Формули III з одержанням сполуки Формули II або її солі.

4. Спосіб за п. 3, де етапи фторування й окиснення здійснюють без виділення сполуки Формули IV.

5. Спосіб одержання сполуки Формули IV:



Формула IV

або її солі, де:

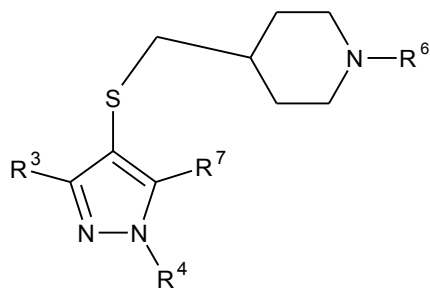
R^3 являє собою H, F, C_1 - C_4 алкіл або C_1 - C_4 галогеналкіл,

R^4 являє собою C_1 - C_4 алкіл,

R^6 являє собою H або захисну групу, і

R^7 являє собою H, Cl або триалкілсиліл,

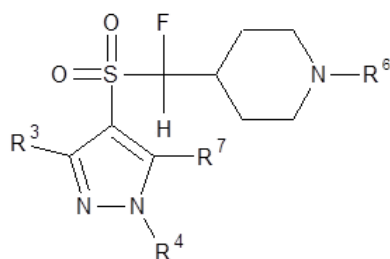
що включає етап фторування сполуки Формули V:



Формула V

де R^3 , R^4 , R^6 і R^7 відповідають визначенням вище,
з утворенням сполуки Формули IV.

6. Спосіб одержання сполуки Формули III:



Формула III

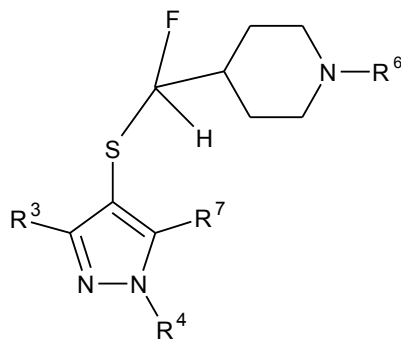
або її солі, де:

R^3 являє собою H, F, C_1 - C_4 алкіл або C_1 - C_4 галогеналкіл,

R^4 являє собою C_1 - C_4 алкіл,

R^6 являє собою H або захисну групу, і

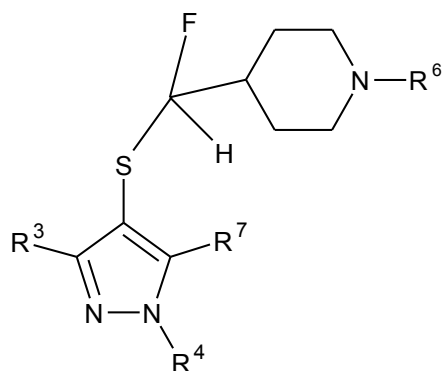
R^7 являє собою групу, вибрану з H, Cl або триалкілсилілу,
що включає етап окиснення сполуки Формули IV:



Формула IV

де R^3 , R^4 , R^6 і R^7 відповідають визначенням вище,
з утворенням сполуки формули III.

7. Сполука Формули IV:



Формула IV

або її сіль, де

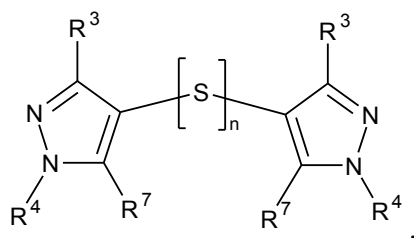
R^3 являє собою H, F, C_1 - C_4 алкіл або C_1 - C_4 галогеналкіл,

R^4 являє собою C_1 - C_4 алкіл,

R^6 являє собою H або захисну групу, і

R^7 являє собою H, Cl або триалкілсиліл.

8. Сполука Формули VIB:



Формула VIB

де R^3 являє собою F, C_1 - C_4 алкіл або C_1 - C_4 галогеналкіл,

R^4 являє собою C_1 - C_4 алкіл,

R^7 являє собою H, Cl або триалкілсиліл, і

n дорівнює 2-8.

9. Спосіб за п. 1, де основа вибрана з групи, що складається з карбонату калію, карбонату натрію, карбонату цезію, бікарбонату калію, бікарбонату натрію та бікарбонату цезію.

10. Спосіб за п. 1, де каталізатор вибраний із групи, що складається з порошку міді, хлориду міді, броміду міді та йодиду міді.

11. Спосіб за п. 1, де відновник вибраний із групи, що складається з цинку/оцтової кислоти, цинку/спиртового розчину гідроксиду калію, боргідриду натрію, боргідриду калію, літійалюмінійгідриду, трифенілфосфіну/HCl, трис(2-карбоксietил)фосфіну та борану.

12. Спосіб за п. 3, де етап фторування здійснюють в присутності фторувального агента, вибраного з групи, що складається з трифлату 1-фторпіридинію, тетрафторборату 1-фторпіридинію, тетрафторборату 1-фтор-2,4,6-триметилпіридинію, трифлату 1-фтор-2,4,6-триметилпіридинію, трифлату 1-фтор-2,6-дихлорпіридинію, тетрафторборату 2,6-дихлор-1-фторпіридинію, трифлату 1-фтор-4-метилпіридинію та тетрафторборату 1-фтор-4-метилпіридинію.

13. Спосіб за п. 3, де етап окиснення здійснюють в присутності окисника, вибраного з групи, що складається з пероксиду водню/вольфрамату натрію, peroцтової кислоти, гідропероксиду бензилу, гідропероксиду етилбензолу, гідропероксиду кумілу, гіпохлориту натрію, дигідрату щавлевої кислоти/пероксиду водню, мета-хлорпероксибензойної кислоти, аддукту сечовини - пероксиду водню, перманганату/діоксиду марганцю, гідрату хлориду рутенію/періодату натрію й $2KHSO_5 \cdot KHSO_4 \cdot K_2SO_4$.

14. Спосіб за п. 3, який додатково включає застосування алкілувального агента, вибраного з бромалкану, хлоралкану, йодалкану, діазоалкану, діалкілкарбонату, діалкілсульфонату в

присутності основи, вибраної з гідриду натрію, гідриду калію, етоксиду натрію, метоксиду натрію, трет-бутоксиду літію, трет-бутоксиду натрію, трет-бутоксиду калію, триетиламіну, н-бутиламіну, трет-бутиламіну, піридину метиллітію, н-бутиллітію, діізопропіламіду літію, 2,2,6,6-тетраметилпіперидину літію, біс(триметилсиліл)аміду натрію, біс(триметилсиліл)аміду літію, біс(триметилсиліл)аміду калію та діетиламіду літію.

15. Спосіб за п. 2, де основа вибрана з групи, що складається з карбонату калію, карбонату натрію, карбонату цезію, бікарбонату калію, бікарбонату натрію та бікарбонату цезію.

16. Спосіб за п. 2, де каталізатор вибраний із групи, що складається з порошку міді, хлориду міді, броміду міді та йодиду міді.

17. Спосіб за п. 5, де етап фторування здійснюють в присутності фторувального агента, вибраного з групи, що складається з трифлату 1-фторпіридинію, тетрафторборату 1-фторпіридинію, тетрафторборату 1-фтор-2,4,6-триметилпіридинію, трифлату 1-фтор-2,4,6-триметилпіридинію, трифлату 1-фтор-2,6-дихлорпіридинію, тетрафторборату 2,6-дихлор-1-фторпіридинію, трифлату 1-фтор-4-метилпіридинію та тетрафторборату 1-фтор-4-метилпіридинію.

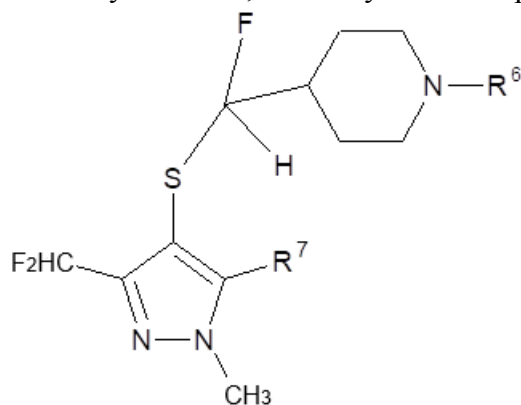
18. Спосіб за п. 6, де етап окиснення здійснюють в присутності окисника, вибраного з групи, що складається з пероксиду водню/вольфрамату натрію, пероцтової кислоти, гідропероксиду бензилу, гідропероксиду етилбензолу, гідропероксиду кумілу, гіпохлориту натрію, дигідрату щавлевої кислоти/пероксиду водню, мета-хлорпероксибензойної кислоти, аддукту сечовини - пероксиду водню, перманганату/діоксиду марганцю, гідрату хлориду рутенію/періодату натрію й $2\text{KHSO}_5 \cdot \text{KHSO}_4 \cdot \text{K}_2\text{SO}_4$.

19. Сполука за п. 7, де R^3 являє собою диформетил.

20. Сполука за п. 7, де R^4 являє собою метил.

21. Сполука за п. 7, де R^7 являє собою H або Cl.

22. Сполука за п. 7, де сполука має Формулу IVA:



Формула IVA.

23. Сполука за п. 22, де сполука являє собою трет-бутил-4-[[3-(диформетил)-1-метил-1H-піразол-4-іл]сульфаніл](фтор)метил]піперидин-1-карбоксилат.