



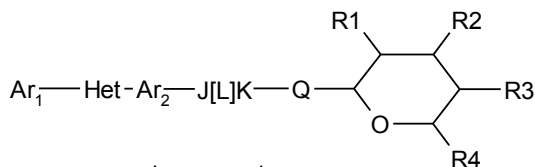
УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **110035** (13) **C2**
(51) МПК (2015.01)**A01N 43/40** (2006.01)**A61K 31/44** (2006.01)**A01N 43/16** (2006.01)**A61K 31/35** (2006.01)**C07D 315/00**ДЕРЖАВНА СЛУЖБА
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
УКРАЇНИ**(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД**

(21) Номер заявки:	а 2013 03636	(72) Винахідник(и):	Крімер Лоуренс К. (US), Крауз Гарі Д. (US), Спаркс Томас К. (US), Маклеод КаСандра Лі (US)
(22) Дата подання заявки:	25.08.2011	(73) Власник(и):	ДАУ АГРОСАЙЄНСІЗ ЕЛЕЛСІ, 9330 Zionsville Road, Indianapolis, Indiana 46268, United States of America (US)
(24) Дата, з якої є чинними права на винахід:	10.11.2015	(74) Представник:	Мошинська Ніна Миколаївна, реєстр. №115
(31) Номер попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції:	61/377,116	(56) Перелік документів, взятих до уваги експертизою:	US 2010/204165 A1, 12.08.2010 US 2009/0209476 A1, 20.08.2009 US 2009/0137667 A1, 28.05.2009
(32) Дата подання попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції:	26.08.2010		
(33) Код держави-учасниці Паризької конвенції, до якої подано попередню заявку:	US		
(41) Публікація відомостей про заявку:	13.05.2013, Бюл.№ 9		
(46) Публікація відомостей про видачу патенту:	10.11.2015, Бюл.№ 21		
(86) Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору РСТ	PCT/US2011/049037, 25.08.2011		

(54) ПЕСТИЦИДНІ КОМПОЗИЦІЇ**(57) Реферат:**

Розкриті сполуки, що мають наступну структуру. Розкриті способи застосування таких сполук.



UA 110035 C2

Перехресне посилання на споріднені заявки

За даною заявкою вимагається пріоритет за тимчасовою заявкою США № 61/377116, поданою 26 серпня 2010 року. Повний зміст даної тимчасової заявки включений в даний опис за допомогою посилання.

5 Галузь техніки, до якої належить винахід

Винахід, розкритий в даному описі, стосується способів отримання сполук, які є корисними як пестициди [наприклад, акарициди, інсектициди, молюскіциди і нематоциди], таких сполук і способів застосування таких сполук для боротьби зі шкідниками.

Передумови створення винаходу

10 Шкідники є причиною мільйонів випадків смертності людей по всьому світу кожний рік. Крім того, існує більше десяти тисяч видів шкідників, які приводять до втрат в сільському господарстві. У світовому масштабі сільськогосподарські втрати складають до мільярдів доларів США щорічно.

15 Терміти викликають пошкодження всіх видів приватних і суспільних споруд. У світовому масштабі втрати від пошкоджень, що викликаються термітами, складають до мільярдів доларів США щорічно.

20 Шкідники харчових запасів поїдають і псують харчові продукти, що зберігаються. У світовому масштабі втрати від пошкоджень, що викликаються шкідниками харчових запасів, складають до мільярдів доларів США щорічно, але, що більш важливо, вони позбавляють людей необхідної їжі.

25 Існує насущна потреба в нових пестицидах. У деяких шкідників розвивається резистентність до пестицидів, які використовують в цей час. Сотні видів шкідників є резистентними до одного або декількох пестицидів. Розвиток резистентності до деяких більш старих пестицидів, таких як DDT, карбамати і органофосфати, добре відомий. Але резистентність розвивається і до деяких нових пестицидів.

Тому існує множина причин, включаючи вказані вище причини, що приводять до необхідності в нових пестицидах.

Визначення

30 Приклади, представлені у визначеннях, як правило, не є вичерпними і не повинні розглядатися як такі, що обмежують винахід, розкритий в даному описі. Потрібно розуміти, що замісник повинен відповідати правилам хімічного зв'язування і обмеженням просторової сумісності відносно конкретної сполуки, до якої він приєднується.

"Група акарицидів" визначена під заголовком "АКАРИЦИДИ".

"AI Група" визначена в даному описі відразу після визначення "Група гербіцидів".

35 "Алкеніл" означає ациклічний ненасичений (щонайменше, один вуглець-вуглецевий подвійний зв'язок) розгалужений або нерозгалужений замісник, що складається з вуглецю і водню, наприклад, вініл, аліл, бутеніл, пентеніл і гексеніл.

"Алкенілокси" означає алкеніл, що додатково включає вуглець-кисневий простий зв'язок, наприклад, алілокси, бутенілокси, пентенілокси, гексенілокси.

40 "Алкокси" означає алкіл, що додатково включає вуглець-кисневий простий зв'язок, наприклад, метокси, етокси, пропокси, ізопропокси, бутокси, ізобутокси і трет-бутокси.

"Алкіл" означає ациклічний насичений розгалужений або нерозгалужений замісник, що складається з вуглецю і водню, наприклад, метил, етил, пропіл, ізопропіл, бутил і трет-бутил.

45 "Алкініл" означає ациклічний ненасичений (щонайменше, один вуглець-вуглецевий потрійний зв'язок) розгалужений або нерозгалужений замісник, що складається з вуглецю і водню, наприклад, етиніл, пропаргіл, бутиніл і пентиніл.

"Алкінілокси" означає алкініл, що додатково включає вуглець-кисневий простий зв'язок, наприклад, пентинілокси, гексинілокси, гептинілокси і октинілокси.

50 "Арил" означає циклічний ароматичний замісник, що складається з водню і вуглецю, наприклад, феніл, нафтил і біфеніл.

"Циклоалкеніл" означає моноциклічний або поліциклічний ненасичений (щонайменше один вуглець-вуглецевий подвійний зв'язок) замісник, що складається з вуглецю і водню, наприклад, циклобутеніл, циклопентеніл, циклогексеніл, норборненіл, біцикло[2.2.2]октеніл, тетрагідронафтил, гексагідронафтил і октагідронафтил.

55 "Циклоалкенілокси" означає циклоалкеніл, що додатково включає вуглець-кисневий простий зв'язок, наприклад, циклобутенілокси, циклопентенілокси, норборненілокси і біцикло[2.2.2]октенілокси.

60 "Циклоалкіл" означає моноциклічний або поліциклічний насичений замісник, що складається з вуглецю і водню, наприклад, циклопропіл, циклобутил, циклопентил, норборніл, біцикло[2.2.2]октил і декагідронафтил.

"Циклоалкокси" означає циклоалкіл, що додатково включає вуглець-кисневий простий зв'язок, наприклад, циклопропілокси, циклобутилокси, цикlopентилокси, норборнілокси і біцикло[2.2.2]октилокси.

"Група фунгіцидів" визначена під заголовком "ФУНГІЦИДИ".

5 "Галоген" означає фтор, хлор, бром і йод.

"Галогеналкокси" означає алкокси, що додатково містить від одного до максимально можливої кількості однакових або різних галогенів, наприклад, фторметокси, трифторметокси, 2,2-дифторпропокси, хлорметокси, трихлорметокси, 1,1,2,2-тетрафторетокси і пентафторетокси.

10 "Галогеналкіл" означає алкіл, що додатково містить від одного до максимально можливої кількості однакових або різних галогенів, наприклад, фторметил, трифторметил, 2,2-дифторпропіл, хлорметил, трихлорметил і 1,1,2,2-тетрафторетил.

"Група гербіцидів" визначена під заголовком "ГЕРБІЦИДИ".

15 "Гетероцикліл" означає циклічний замісник, який може бути повністю насиченим, частково ненасиченим або повністю ненасиченим, де циклічна структура містить, щонайменше, один вуглець і, щонайменше, один гетероатом, де вказаний гетероатом являє собою азот, сірку або кисень. Приклади ароматичних гетероциклілів включають, але не обмежуються ними, бензофураніл, бензоізотіазоліл, бензоізоксазоліл, бензоксазоліл, бензотієніл, бензотіазоліл, цинолініл, фураніл, індазоліл, індоліл, імідазоліл, ізоіндоліл, ізохінолініл, ізотіазоліл, ізоксазоліл, оксадіазоліл, оксазолініл, оксазоліл, фталазиніл, піразиніл, піразолініл, піразоліл, піридазиніл, піридил, піримідиніл, піроліл, хіназолініл, хінолініл, хіноксалініл, тетразоліл, тіазолініл, тіазоліл, тієніл, триазиніл і триазоліл. Приклади повністю насичених гетероциклілів включають, але не обмежуються ними, піперазиніл, піперидиніл, морфолініл, піролідиніл, тетрагідрофураніл і тетрагідропіраніл. Приклади частково ненасичених гетероциклілів включають, але не обмежуються ними, 1,2,3,4-тетрагідрохінолініл, 4,5-дигідрооксазоліл, 4,5-дигідро1H-піразоліл, 4,5-дигідроізоксазоліл і 2,3-дигідро[1,3,4]оксадіазоліл.

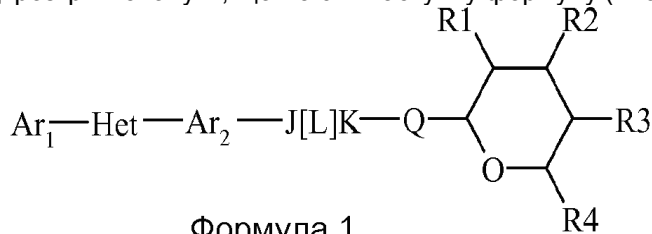
"Група інсектицидів" визначена під заголовком "ІНСЕКТИЦИДИ".

"Група нематоцидів" визначена під заголовком "НЕМАТОЦИДИ".

"Група синергістів" визначена під заголовком "СИНЕРГІЧНІ СУМІШІ І СИНЕРГІСТИ".

30 Докладний опис винаходу

У даному винаході розкриті сполуки, що мають наступну формулу ("Формула 1"):



де:

(a) Ar₁ являє собою

35 (1) фураніл, феніл, піридазиніл, піридил, піримідиніл, тієніл або

(2) заміщений фураніл, заміщений феніл, заміщений піридазиніл, заміщений піридил, заміщений піримідиніл або заміщений тієніл,

де вказані заміщений фураніл, заміщений феніл, заміщений піридазиніл, заміщений піридил, заміщений піримідиніл і заміщений тієніл, містять один або більше замісників, незалежно
40 вибраних з H, OH, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆алкілу, C₁-C₆галогеналкілу, C₁-C₆гідроксіалкілу, C₃-C₆циклоалкілу, C₃-C₆галогенциклоалкілу, C₃-C₆гідроксициклоалкілу, C₃-C₆циклоалкокси, C₃-C₆галогенциклоалкокси, C₃-C₆гідроксициклоалкокси, C₁-C₆алкокси, C₁-C₆галогеналкокси, C₂-C₆алкенілу, C₂-C₆алкінілу, S(=O)_n(C₁-C₆алкілу), S(=O)_n(C₁-C₆галогеналкілу), OSO₂(C₁-C₆алкілу), OSO₂(C₁-C₆галогеналкілу), C(=O)H, C(=O)OH, C(=O)NR_xR_y, (C₁-C₆алкіл)NR_xR_y, C(=O)(C₁-C₆алкілу), C(=O)O(C₁-C₆алкілу), C(=O)(C₁-C₆галогеналкілу), C(=O)O(C₁-C₆галогеналкілу), C(=O)(C₃-C₆циклоалкілу), C(=O)O(C₃-C₆циклоалкілу), C(=O)(C₂-C₆алкенілу), C(=O)O(C₂-C₆алкенілу), (C₁-C₆алкіл)O(C₁-C₆алкілу), (C₁-C₆алкіл)S(C₁-C₆алкілу), C(=O)(C₁-C₆алкіл)C(=O)O(C₁-C₆алкілу), фенілу, фенокси, заміщеного фенілу і заміщеного фенокси (де такий заміщений феніл і заміщений фенокси містять один або більше замісників, незалежно
50 вибраних з H, OH, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆алкілу, C₁-C₆галогеналкілу, C₁-C₆гідроксіалкілу, C₃-C₆циклоалкілу, C₁-C₆галогенциклоалкілу, C₁-C₆гідроксициклоалкілу, C₁-C₆циклоалкокси, C₁-C₆галогенциклоалкокси, C₁-C₆гідроксициклоалкокси, C₁-C₆алкокси, C₁-C₆галогеналкокси, C₂-C₆алкенілу, C₂-C₆алкінілу, S(=O)_n(C₁-C₆алкілу), S(=O)_n(C₁-C₆галогеналкілу), OSO₂(C₁-C₆алкілу),

OSO₂(C₁-C₆галогеналкілу), C(=O)H, C(=O)OH, C(=O)NR_xR_y, (C₁-C₆алкіл)NR_xR_y, C(=O)(C₁-C₆алкілу), C(=O)O(C₁-C₆алкілу), C(=O)(C₁-C₆галогеналкілу), C(=O)O(C₁-C₆галогеналкілу), C(=O)(C₃-C₆циклоалкілу), C(=O)O(C₃-C₆циклоалкілу), C(=O)(C₂-C₆алкенілу), C(=O)O(C₂-C₆алкенілу), (C₁-C₆алкіл)O(C₁-C₆алкілу), (C₁-C₆алкіл)S(C₁-C₆алкілу), C(=O)(C₁-C₆алкіл)C(=O)O(C₁-C₆алкілу), фенілу і фенокси);

(b) Нет являє собою 5 або 6-членне насичене або ненасичене гетероциклічне кільце, що містить один або більше гетероатомів, незалежно вибраних з азоту, сірки або кисню, і де Ar₁ і Ar₂ не знаходяться в ортоположенні відносно один одного (але можуть бути в мета або пароположенні, наприклад, для п'ятичленного кільця вони являють собою 1,3, і для 6-членного кільця вони являють собою або 1,3, або 1,4), і де вказане гетероциклічне кільце також може бути заміщене одним або більше замісниками, незалежно вибраними з H, OH, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, оксо, C₁-C₆алкілу, C₁-C₆галогеналкілу, C₁-C₆гідроксіалкілу, C₁-C₆циклоалкілу, C₁-C₆галогенциклоалкілу, C₁-C₆гідроксициклоалкілу, C₁-C₆циклоалкокси, C₁-C₆галогенциклоалкокси, C₁-C₆гідроксициклоалкокси, C₁-C₆алкокси, C₁-C₆галогеналкокси, C₂-C₆алкенілу, C₂-C₆алкінілу, S(=O)_n(C₁-C₆алкілу), S(=O)_n(C₁-C₆галогеналкілу), OSO₂(C₁-C₆алкілу), OSO₂(C₁-C₆галогеналкілу), C(=O)H, C(=O)OH, C(=O)NR_xR_y, (C₁-C₆алкіл)NR_xR_y, C(=O)(C₁-C₆алкілу), C(=O)O(C₁-C₆алкілу), C(=O)(C₁-C₆галогеналкілу), C(=O)O(C₁-C₆галогеналкілу), C(=O)(C₃-C₆циклоалкілу), C(=O)O(C₃-C₆циклоалкілу), C(=O)(C₂-C₆алкенілу), C(=O)O(C₂-C₆алкенілу), (C₁-C₆алкіл)O(C₁-C₆алкілу), (C₁-C₆алкіл)S(C₁-C₆алкілу), C(=O)(C₁-C₆алкіл)C(=O)O(C₁-C₆алкілу), фенілу, фенокси, заміщеного фенілу і заміщеного фенокси (де такий заміщений феніл і заміщений фенокси містять один або більше замісників, незалежно вибраних з H, OH, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆алкілу, C₁-C₆галогеналкілу, C₁-C₆гідроксіалкілу, C₃-C₆циклоалкілу, C₃-C₆галогенциклоалкілу, C₃-C₆гідроксициклоалкілу, C₃-C₆циклоалкокси, C₃-C₆галогенциклоалкокси, C₃-C₆гідроксициклоалкокси, C₁-C₆алкокси, C₁-C₆галогеналкокси, C₂-C₆алкенілу, C₂-C₆алкінілу, S(=O)_n(C₁-C₆алкілу), S(=O)_n(C₁-C₆галогеналкілу), OSO₂(C₁-C₆алкілу), OSO₂(C₁-C₆галогеналкілу), C(=O)H, C(=O)OH, C(=O)NR_xR_y, (C₁-C₆алкіл)NR_xR_y, C(=O)(C₁-C₆алкілу), C(=O)O(C₁-C₆алкілу), C(=O)(C₁-C₆галогеналкілу), C(=O)O(C₁-C₆галогеналкілу), C(=O)(C₃-C₆циклоалкілу), C(=O)O(C₃-C₆циклоалкілу), C(=O)(C₂-C₆алкенілу), C(=O)O(C₂-C₆алкенілу), (C₁-C₆алкіл)O(C₁-C₆алкілу), (C₁-C₆алкіл)S(C₁-C₆алкілу), C(=O)(C₁-C₆алкіл)C(=O)O(C₁-C₆алкілу), фенілу і фенокси);

(c) Ar₂ являє собою

(1) фураніл, феніл, піридазиніл, піридил, піримідиніл, тієніл або

(2) заміщений фураніл, заміщений феніл, заміщений піридазиніл, заміщений піридил, заміщений піримідиніл або заміщений тієніл,

де вказані заміщений фураніл, заміщений феніл, заміщений піридазиніл, заміщений піридил, заміщений піримідиніл і заміщений тієніл містять один або більше замісників, незалежно вибраних з H, OH, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆алкілу, C₁-C₆галогеналкілу, C₁-C₆гідроксіалкілу, C₃-C₆циклоалкілу, C₃-C₆галогенциклоалкілу, C₃-C₆гідроксициклоалкілу, C₃-C₆циклоалкокси, C₃-C₆галогенциклоалкокси, C₁-C₆гідроксициклоалкокси, C₁-C₆алкокси, C₁-C₆галогеналкокси, C₂-C₆алкенілу, C₂-C₆алкінілу, S(=O)_n(C₁-C₆алкілу), S(=O)_n(C₁-C₆галогеналкілу), OSO₂(C₁-C₆алкілу), OSO₂(C₁-C₆галогеналкілу), C(=O)H, C(=O)OH, C(=O)NR_xR_y, (C₁-C₆алкіл)NR_xR_y, C(=O)(C₁-C₆алкілу), C(=O)O(C₁-C₆алкілу), C(=O)(C₁-C₆галогеналкілу), C(=O)O(C₁-C₆галогеналкілу), C(=O)(C₃-C₆циклоалкілу), C(=O)O(C₃-C₆циклоалкілу), C(=O)(C₂-C₆алкенілу), C(=O)O(C₂-C₆алкенілу), (C₁-C₆алкіл)O(C₁-C₆алкілу), (C₁-C₆алкіл)S(C₁-C₆алкілу), C(=O)(C₁-C₆алкіл)C(=O)O(C₁-C₆алкілу), фенілу, фенокси, заміщеного фенілу і заміщеного фенокси (де такий заміщений феніл і заміщений фенокси містять один або більше замісників, незалежно вибраних з H, OH, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆алкілу, C₁-C₆галогеналкілу, C₁-C₆гідроксіалкілу, C₃-C₆циклоалкілу, C₃-C₆галогенциклоалкілу, C₃-C₆гідроксициклоалкілу, C₃-C₆циклоалкокси, C₃-C₆галогенциклоалкокси, C₁-C₆гідроксициклоалкокси, C₁-C₆алкокси, C₁-C₆галогеналкокси, C₂-C₆алкенілу, C₂-C₆алкінілу, S(=O)_n(C₁-C₆алкілу), S(=O)_n(C₁-C₆галогеналкілу), OSO₂(C₁-C₆алкілу), OSO₂(C₁-C₆галогеналкілу), C(=O)H, C(=O)OH, C(=O)NR_xR_y, (C₁-C₆алкіл)NR_xR_y, C(=O)(C₁-C₆алкілу), C(=O)O(C₁-C₆алкілу), C(=O)(C₁-C₆галогеналкілу), C(=O)O(C₁-C₆галогеналкілу), C(=O)(C₃-C₆циклоалкілу), C(=O)O(C₃-C₆циклоалкілу), C(=O)(C₂-C₆алкенілу), C(=O)O(C₂-C₆алкенілу), (C₁-C₆алкіл)O(C₁-C₆алкілу), (C₁-C₆алкіл)S(C₁-C₆алкілу), C(=O)(C₁-C₆алкіл)C(=O)O(C₁-C₆алкілу), фенілу і фенокси);

(d) J являє собою CR_{J1}R_{J2};

(e) L являє собою простий зв'язок;

(f) K являє собою NR_{K1};

(g) Q являє собою O;

(h) R1 являє собою H, OH, F, Cl, Br, I, оксо, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл, C₁-C₆алкокси, C₃-C₆циклоалкокси, C₁-C₆галогеналкокси, C₂-C₆алкенілокси, (C₁-C₆алкіл)O(C₁-C₆алкіл), (C₁-C₆алкіл)O(C₁-C₆алкокси), °C(=O)(C₁-C₆алкіл), °C(=O)(C₃-C₆циклоалкіл), °C(=O)(C₁-C₆галогеналкіл), °C(=O)(C₂-C₆алкеніл) або NR_xR_y;

5 (i) R2 являє собою H, OH, F, Cl, Br, I, оксо, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл, C₁-C₆алкокси, C₃-C₆циклоалкокси, C₁-C₆галогеналкокси, C₂-C₆алкенілокси, (C₁-C₆алкіл)O(C₁-C₆алкіл), (C₁-C₆)O(C₁-C₆алкокси), °C(=O)(C₁-C₆алкіл), °C(=O)(C₃-C₆циклоалкіл), °C(=O)(C₁-C₆галогеналкіл), °C(=O)(C₂-C₆алкеніл) або NR_xR_y;

10 (j) R3 являє собою H, OH, F, Cl, Br, I, оксо, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл, C₁-C₆алкокси, C₃-C₆циклоалкокси, C₁-C₆галогеналкокси, C₂-C₆алкенілокси, (C₁-C₆алкіл)O(C₁-C₆алкіл), (C₁-C₆)O(C₁-C₆алкокси), °C(=O)(C₁-C₆алкіл), °C(=O)(C₃-C₆циклоалкіл), °C(=O)(C₁-C₆галогеналкіл), °C(=O)(C₂-C₆алкеніл) або NR_xR_y;

(k) R4 являє собою H, C₁-C₆алкіл, C₁-C₆галогеналкіл, C₁-C₆алкокси, C₁-C₆галогеналкокси, C₂-C₆алкенілокси, (C₁-C₆алкіл)O(C₁-C₆алкіл); i

15 (l) R_{j1}, R_{j2} і R_{K1} незалежно вибрані з H, OH, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, C₁-C₆алкілу, C₁-C₆галогеналкілу, C₁-C₆гідроксіалкілу, C₃-C₆циклоалкілу, C₃-C₆галогенциклоалкілу, C₃-C₆гідроксициклоалкілу, C₃-C₆циклоалкокси, C₃-C₆галогенциклоалкокси, C₃-C₆гідроксициклоалкокси, C₁-C₆алкокси, C₁-C₆галогеналкокси, C₂-C₆алкенілу, C₂-C₆алкінілу, S(=O)_n(C₁-C₆алкілу), S(=O)_n(C₁-C₆галогеналкілу), OSO₂(C₁-C₆алкілу), OSO₂(C₁-C₆галогеналкілу), C(=O)H, C(=O)OH, C(=O)NR_xR_y, (C₁-C₆алкіл)NR_xR_y, C(=O)(C₁-C₆алкілу), C(=O)(C₁-C₆алкіл)C(=O)O(C₁-C₆алкілу), C(=O)O(C₁-C₆алкілу), C(=O)(C₁-C₆галогеналкілу), C(=O)O(C₁-C₆галогеналкілу), C(=O)(C₃-C₆циклоалкілу), C(=O)O(C₃-C₆циклоалкілу), C(=O)(C₂-C₆алкенілу), C(=O)O(C₂-C₆алкенілу), (C₁-C₆алкіл)O(C₁-C₆алкілу), (C₁-C₆алкіл)S(C₁-C₆алкілу), C(=O)(C₁-C₆алкіл)C(=O)O(C₁-C₆алкілу), фенілу і фенокси,

25 де кожний алкіл, галогеналкіл, гідроксіалкіл, циклоалкіл, галогенциклоалкіл, гідроксициклоалкіл, циклоалкокси, галогенциклоалкокси, гідроксициклоалкокси, алкокси, галогеналкокси, алкеніл, алкініл, феніл і фенокси необов'язково заміщені одним або більше замісниками, незалежно вибраними з OH, F, Cl, Br, I, CN, NO₂, оксо, C₁-C₆алкілу, C₁-C₆галогеналкілу, C₁-C₆гідроксіалкілу, C₃-C₆циклоалкілу, C₃-C₆галогенциклоалкілу, C₃-C₆гідроксициклоалкілу, C₃-C₆циклоалкокси, C₃-C₆галогенциклоалкокси, C₃-C₆гідроксициклоалкокси, C₁-C₆алкокси, C₁-C₆галогеналкокси, C₂-C₆алкенілу, C₂-C₆алкінілу, S(=O)_n(C₁-C₆алкілу), S(=O)_n(C₁-C₆галогеналкілу), OSO₂(C₁-C₆алкілу), OSO₂(C₁-C₆галогеналкілу), C(=O)H, C(=O)OH, C(=O)NR_xR_y, (C₁-C₆алкіл)NR_xR_y, C(=O)(C₁-C₆алкілу), C(=O)O(C₁-C₆алкілу), C(=O)(C₁-C₆галогеналкілу), C(=O)O(C₁-C₆галогеналкілу), C(=O)(C₃-C₆циклоалкілу), C(=O)O(C₃-C₆циклоалкілу), C(=O)(C₂-C₆алкенілу), C(=O)O(C₂-C₆алкенілу), (C₁-C₆алкіл)O(C₁-C₆алкілу), (C₁-C₆алкіл)S(C₁-C₆алкілу), C(=O)(C₁-C₆алкіл)C(=O)O(C₁-C₆алкілу), фенілу і фенокси;

(m) n дорівнює 0, 1 або 2; i

(n) R_x і R_y незалежно вибрані з H, C₁-C₆алкілу, C₁-C₆галогеналкілу, C₁-C₆гідроксіалкілу, C₃-C₆циклоалкілу, C₁-C₆галогенциклоалкілу, C₃-C₆гідроксициклоалкілу, C₁-C₆циклоалкокси, C₃-C₆галогенциклоалкокси, C₁-C₆гідроксициклоалкокси, C₁-C₆алкокси, C₁-C₆галогеналкокси, C₂-C₆алкенілу, C₂-C₆алкінілу, S(=O)_n(C₁-C₆алкілу), S(=O)_n(C₁-C₆галогеналкілу), OSO₂(C₁-C₆алкілу), OSO₂(C₁-C₆галогеналкілу), C(=O)H, C(=O)OH, C(=O)(C₁-C₆алкілу), C(=O)O(C₁-C₆алкілу), C(=O)(C₁-C₆галогеналкілу), C(=O)O(C₁-C₆галогеналкілу), C(=O)(C₃-C₆циклоалкілу), C(=O)O(C₃-C₆циклоалкілу), C(=O)(C₂-C₆алкенілу), C(=O)O(C₂-C₆алкенілу), (C₁-C₆алкіл)O(C₁-C₆алкілу), (C₁-C₆алкіл)S(C₁-C₆алкілу), C(=O)(C₁-C₆алкіл)C(=O)O(C₁-C₆алкілу), фенілу і фенокси.

В іншому варіанті здійснення Ag₁ являє собою заміщений феніл. В іншому варіанті здійснення Ag₁ являє собою заміщений феніл, що містить C₁-C₆галогеналкокси замісник.

В іншому варіанті здійснення Het являє собою триазоліл.

В іншому варіанті здійснення Ag₂ являє собою феніл.

50 В іншому варіанті здійснення R_{j1} і R_{j2} являють собою H.

В іншому варіанті здійснення R_{K1} являє собою H, C(=O)(C₁-C₆алкіл), C(=O)(C₁-C₆алкіл)C(=O)O(C₁-C₆алкіл), C(=O)(C₁-C₆алкіл)C(=O)OH.

Отримання піраноза-проміжних сполук

55 Для отримання сполук за даним винаходом можна використовувати множину різних піраноз (в різних структурних формах, наприклад, D і L). Наприклад, можна використовувати наступний перелік піраноз, що не є вичерпним: рибоза, арабіноза, ксилоза, ликсоза, рибулоза, ксиолулоза, алоза, альтроза, глюкоза, маноза, гулоза, ідоза, галактоза, талоза, психоза, фруктоза, сорбоза, тагатоza, фукоза, мікароза, хіновоза, алеандроза, рамноза і паратоza.

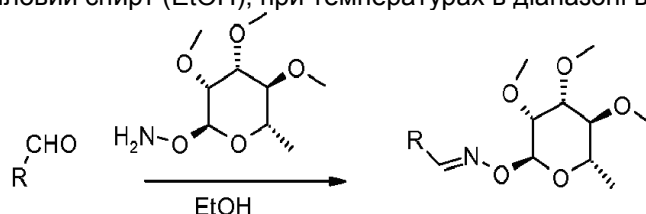
Як правило, піраноза-проміжні сполуки можна отримати способами, описаними раніше в хімічній літературі і у Crouse et al, в патентній публікації США № 2009/0209476 A1, повний опис якої спеціально включений в даний опис за допомогою посилання.

Отримання триарил-проміжних сполук

Сполуки за даним винаходом отримують шляхом зв'язування описаної вище піраноза-проміжної сполуки з триарильною проміжною сполукою, $Ar_1\text{-Het-}Ar_2$, за допомогою ковалентного лінкера J[L]KQ (визначений вище). Для отримання сполук за даним винаходом можна використовувати множину різних триарильних попередників, при умові, що вони містять прийнятну функціональну групу на Ar_2 . Прийнятні функціональні групи включають аміно, оксоалкільну, формільну або групу карбонової кислоти. Такі триарильні проміжні сполуки можна отримати способами, описаними раніше в хімічній літературі і у Crouse et al., в патентній публікації США № 2009/0209476 A1, повний опис якої спеціально включений в даний опис за допомогою посилання.

Отримання оксимзв'язаних сполук

Оксимзв'язані сполуки можна отримати з відповідних ариальдегідів або кетонів шляхом взаємодії з відповідним 2-гідроксиламіноцукром в органічному розчиннику, такому як метиловий спирт (MeOH) або етиловий спирт (EtOH), при температурах в діапазоні від 0 до 100°C.

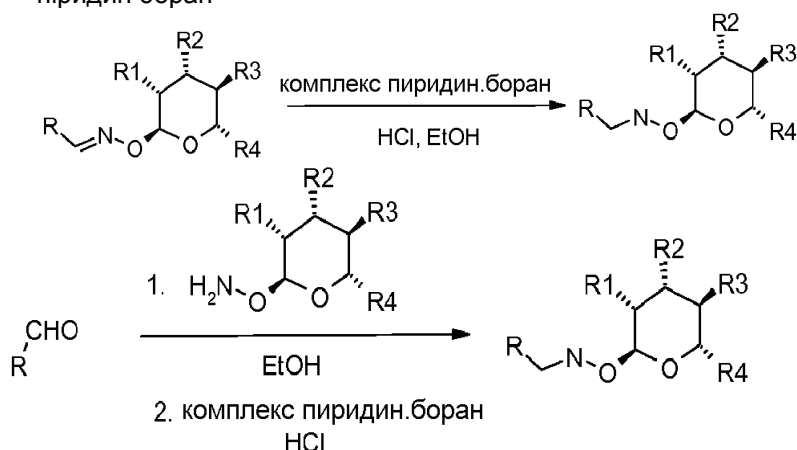


Отримання гідроксиламінзв'язаних сполук

Гідроксиламінзв'язані сполуки можна отримати з відповідних оксимзв'язаних сполук через відновлення з використанням комплексу піридин•боран в органічному розчиннику, такому як EtOH. Альтернативно, сполуки можна отримати за допомогою двостадійної методики з альдегіду або кетону шляхом взаємодії з 2-гідроксиламіноцукром, з подальшим відновленням з використанням комплексу піридин•боран в органічному розчиннику, такому як EtOH, при температурах в діапазоні від 0 до 100°C.

піридин•боран

піридин•боран



Подальше перетворення гідроксиламінзв'язаних сполук можна здійснити різними способами, такими як утворення солі з використанням хлористоводневої кислоти в діоксані в розчиннику, такому як діетиловий ефір (Et_2O); ацилювання азоту при допомозі хлорангідриду або ангідриду кислоти в присутності основи, такого як піридин; або алкілювання азоту при допомозі алкілгалогеніду в присутності основи, такої як діізопропілетиламін (DIEA) або карбонат калію, в органічному розчиннику, такому як тетрагідрофуран (ТГФ, THF).

із зворотним холодильником

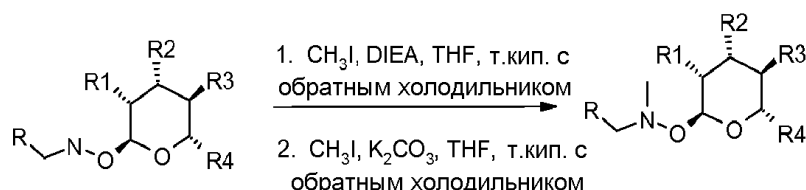
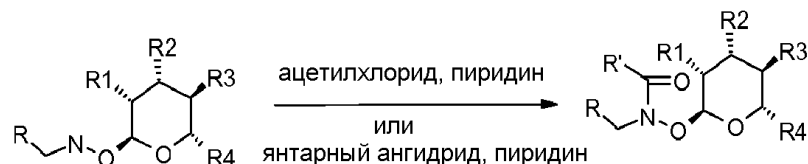
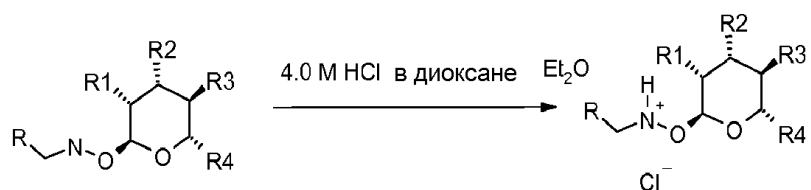
1. CH_3I , DIEA, THF, т. кип. із зворотним холодильником

або

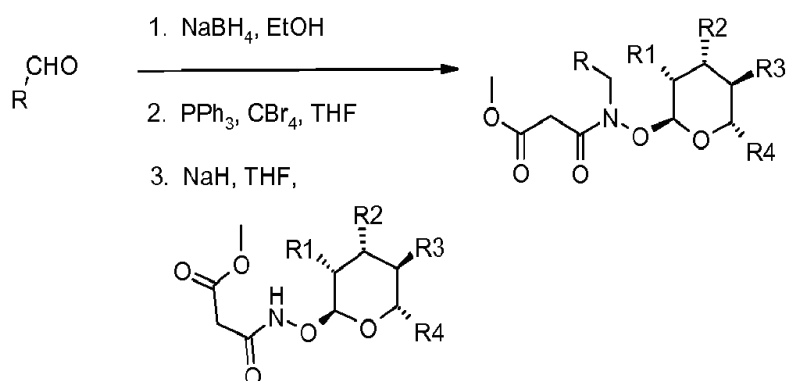
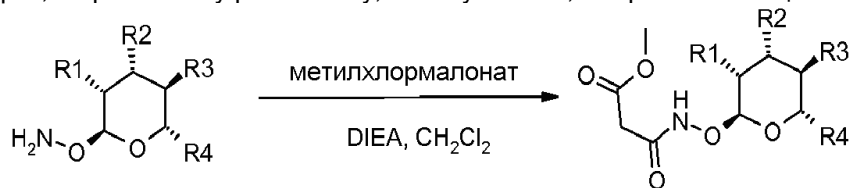
бурштиновий ангідрид, піридин

в діоксані

піридин



- Ацилювання азоту також можна здійснити багатостадійним способом, що включає ацилювання 2-гідроксиламіноцукру і відновлення альдегіду до відповідного спирту, з подальшою взаємодією з тетрабромідом вуглецю з отриманням відповідного броміду. Потім здійснюють взаємодію броміду і ацильованого гідроксиламіноцукру в присутності основи, такої як гідрид натрію, в органічному розчиннику, такому як ТГФ, з отриманням ацильованої сполуки.



ПРИКЛАДИ

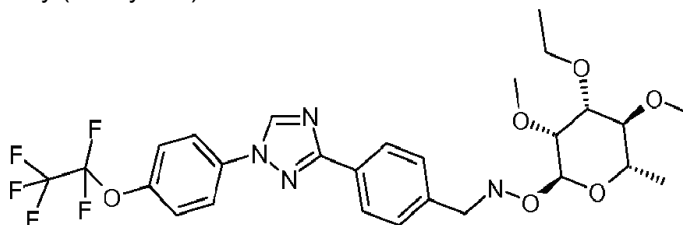
- Приклади представлені з метою ілюстрації, і не повинні розглядатися як такі, що обмежують винахід, що розкривається в даному описі, тільки варіантами здійснення, розкритими в цих прикладах.

- Вихідні речовини, реагенти і розчинники, які були отримані з комерційних джерел, використовували без додаткового очищення. Безводні розчинники закуповували під торговою маркою Sure/Seal™ у компанії Aldrich і використовували в тому вигляді, як вони були отримані. Температуру плавлення визначали на капілярному пристрої для визначення температур плавлення Thomas Hoover Unimelt або на автоматичній системі для визначення температур плавлення OptiMelt від компанії Stanford Research Systems, і вони є нескоректованими. Для сполук використовували їх відомі назви, відповідно до програм найменування, що входять в ISIS Draw, ChemDraw або ACD Name Pro. Якщо такі програми не могли визначити назву сполуки, для цього використовували традиційні правила найменування. Спектральні дані ¹H ЯМР представлені в мільйонних частках (м. ч.) (δ) і були записані при 300, 400 або 600 МГц, і

спектральні дані ^{13}C ЯМР представлені в м. ч. (δ) і були записані при 75, 100 або 150 МГц, якщо не вказано інше.

Приклади 1-9 ілюструють отримання додаткових сполук, корисних для здійснення різних варіантів здійснення даного винаходу.

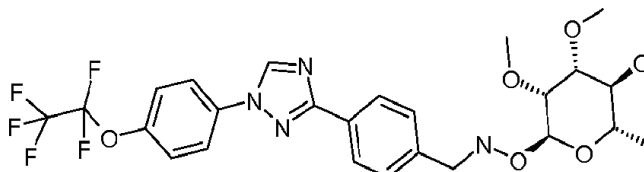
- 5 Приклад 1: Отримання O-((2S, 3R, 4R, 5S, 6S)-4-етокси-3,5-диметокси-6-метилтетрагідропіран-2-іл)-N-{4-[1-(4-пентафторетилоксибеніл)-1H-[1,2,4]триазол-3-іл]бензил}гідроксиламіну (сполука 1)



- 10 До розчину O-((2S, 3R, 4R, 5S, 6S)-4-етокси-3,5-диметокси-6-метилтетрагідропіран-2-іл)оксиму 4-[1-(4-пентафторетилоксибеніл)-1H-[1,2,4]триазол-3-іл]бензальдегіду (P-1; 257 міліграм (мг), 0,429 мілімоль (ммоль)) в 190-градусному етиловому спирті (EtOH; 10 мілілітрів (мл)) при кімнатній температурі додавали комплекс піридин•боран (200 мікролітрів (мкл), 1,99 ммоль) однією порцією. Потім додавали по краплях 3N розчин хлористоводневої кислоти (HCl; 1,4 мл). Коли додавання було завершено, суміш перемішували при кімнатній температурі
- 15 протягом 23 годин (год.). Суміш потім розбавляли сумішшю EtOH/вода (H_2O) і обробляли насиченим розчином бікарбонату натрію (NaHCO_3). Отриману водну суміш екстрагували етилацетатом (EtOAc; 2×). Органічні екстракти об'єднували, сушили, промивали насиченим розчином солі і сушили над безводним сульфатом натрію (Na_2SO_4). Розчинник випарювали при кімнатній температурі в умовах вакууму. Отриману неочищену речовину очищали
- 20 хроматографією на силікагелі (єлюючи 50 % EtOAc в гексані). Вказаний в заголовку продукт (164 мг, 63 %) виділяли у вигляді білої липкої твердої речовини:

^1H ЯМР (300 МГц, CDCl_3) δ 8,60 (с, 1H), 8,22-8,16 (м, 2H), 7,87-7,80 (м, 2H), 7,50 (д, J=8,2 Гц, 2H), 7,46-7,38 (м, 2H), 6,04 (с, 1H), 5,01 (д, J=1,4 Гц, 1H), 4,18 (с, 2H), 3,84-3,28 (м, 12H), 3,11 (дд, J=12,0, 6,5 Гц, 1H), 1,30 (ддд, J=20,9, 10,3, 4,6 Гц, 6H); ESI MC m/z 603 (M+H).

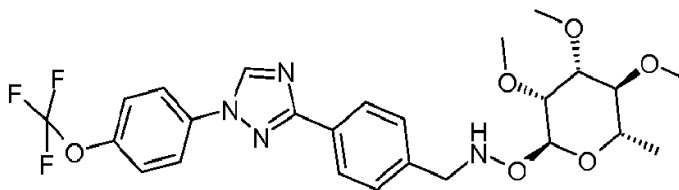
- 25 Приклад 2: (2S, 3S, 4R, 5R, 6S)-4,5-Диметокси-2-метил-6-(N-{4-[1-(4-пентафторетилоксибеніл)-1H-[1,2,4]триазол-3-іл]бензил}аміноокси)тетрагідропіран-3-ол (сполука 2)



- 30 Вказану в заголовку сполуку отримували, як описано в прикладі 1, виходячи з O-((2S, 3R, 4R, 5S, 6S)-5-гідрокси-3,4-диметокси-6-метилтетрагідропіран-2-іл)оксиму 4-[1-(4-пентафторетилоксибеніл)-1H-[1,2,4]триазол-3-іл]бензальдегіду (P-2; 173 мг, 0,30 ммоль). Бажаний продукт (113 мг, 66 %) виділяли у вигляді безбарвної склоподібної речовини: т. пл. 50-58°C;

- 35 ^1H ЯМР (300 МГц, CDCl_3) δ 8,61 (д, J=5,1 Гц, 1H), 8,30-8,13 (м, 2H), 7,93-7,76 (м, 2H), 7,51 (д, J=8,3 Гц, 2H), 7,41 (д, J=9,0 Гц, 2H), 6,10 (с, 1H), 5,07 (д, J=1,5 Гц, 1H), 4,18 (д, J=6,9 Гц, 2H), 3,76-3,12 (м, 10H), 2,44 (с, 1H), 1,48-1,28 (м, 3H); ESI MC m/z 576 (M+2H), 575 (M+H).

Приклад 3: Отримання N-{4-[1-(4-трифторметоксибеніл)-1H-[1,2,4]триазол-3-іл]бензил}-O-((2S, 3R, 4R, 5S, 6S)-3,4,5-триметокси-6-метилтетрагідропіран-2-іл)гідроксиламіну (сполука 3)

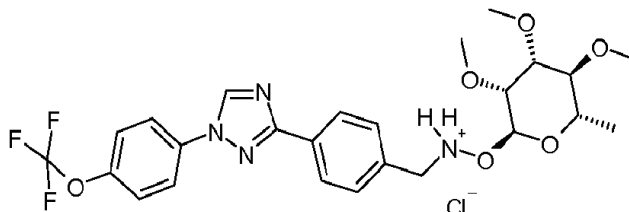


- 40 Розчин 4-[1-(4-трифторметоксибеніл)-1H-[1,2,4]триазол-3-іл]бензальдегіду (P-3; 203 мг, 0,610 ммоль) і O-((2S, 3R, 4R, 5S, 6S)-3,4,5-триметокси-6-метилтетрагідропіран-2-іл)гідроксиламіну (P-4; 179 мг, 0,81 ммоль) в EtOH (20 мл) нагрівали до температури кипіння із

зворотнім холодильником в атмосфері N_2 протягом 16 годин. Суміш потім охолоджували до кімнатної температури і додавали комплекс піридин•боран (200 мкл, 1,99 ммоль), з подальшим додаванням по краплях 3н розчину HCl (2 мл, 6,0 ммоль). Суміш залишали для перемішування при кімнатній температурі протягом 28 годин і потім упарювали при кімнатній температурі в умовах вакууму для зменшення об'єму. Концентровану суміш розбавляли $EtOAc$ і промивали насиченим розчином $NaHCO_3$. Водний розчин екстрагували додатковою кількістю $EtOAc$. Органічні фракції об'єднували, промивали насиченим розчином солі, сушили над безводним Na_2SO_4 і упарювали при кімнатній температурі в умовах вакууму. Отриману неочищену речовину очищали хроматографією на силікагелі (елюючи 50 % $EtOAc$ в гексані (100 % $EtOAc$ в одну стадію). Вказаний в заголовку продукт (223 мг, 68 % виходячи з P-3) отримували у вигляді білої склоподібної речовини.

1H ЯМР (300 МГц, $CDCl_3$) δ 8,59 (с, 1H), 8,2-8,14 (м, 2H), 7,89-7,75 (м, 2H), 7,58-7,34 (м, 4H), 6,08 (д, $J=15,0$ Гц, 1H), 5,01 (дд, $J=13,5$, 6,1 Гц, 1H), 4,16 (д, $J=9,4$ Гц, 2H), 3,71-3,41 (м, 8H), 3,42-3,24 (м, 4H), 3,10 (т, $J=9,4$ Гц, 1H), 1,61 (д, $J=19,8$ Гц, 1H), 1,38-1,24 (м, 3H); ^{13}C ЯМР (101 МГц, $CDCl_3$) δ 163,15, 148,37, 141,60, 138,97, 135,51, 129,64, 129,30, 126,65, 122,37, 121,66, 121,20, 119,10, 99,78, 25 82,04, 80,98, 76,20, 68,35, 60,83, 58,63, 57,61, 56,52, 50,59, 17,81; ESI MS m/z 539 ($M+H$).

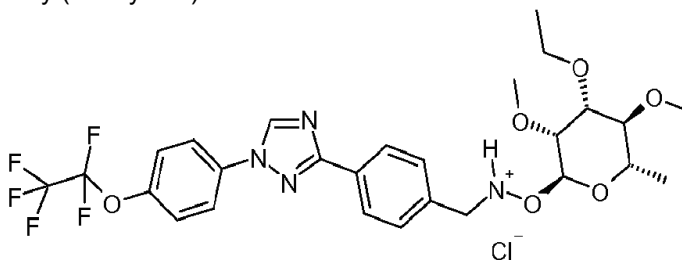
Приклад 4: Отримання гідрохлориду N-{4-[1-(4-трифторметоксифеніл)-1H-[1,2,4]триазол-3-іл]бензил}-O-((2S, 3R, 4R, 5S, 6S)-3,4,5-триметокси-6-метилтетрагідропіран-2-іл)гідроксиламіну (сполука 4)



Розчин N-{4-[1-(4-трифторметоксифеніл)-1H-[1,2,4]триазол-3-іл]бензил}-O-((2S, 3R, 4R, 5S, 6S)-3,4,5-триметокси-6-метилтетрагідропіран-2-іл)гідроксиламіну (3; 87,5 мг, 0,162 ммоль) в діетиловому ефірі (Et_2O ; 8,75 мл) обробляли шляхом додавання по краплях HCl (4М в діоксані) доти, поки більше не осаджувалась тверда речовина. Отриману суспензію піддавали центрифугуванню і розчинник декантували. Тверду речовину суспендували з використанням свіжого Et_2O , центрифугували і розчинник декантували. Отриману тверду речовину сушили упарюванням при кімнатній температурі в умовах вакууму з отриманням вказаного в заголовку продукту (70 мг, 75 %) у вигляді білої твердої речовини: т. пл. 107-121°C;

1H ЯМР (300 МГц, CD_3OD) δ 9,46 (д, $J=2,8$ Гц, 1H), 8,37-8,17 (м, 2H), 8,15-7,96 (м, 2H), 7,73 (д, $J=8,3$ Гц, 2H), 7,63-7,41 (м, 2H), 5,45 (д, $J=2,4$ Гц, 1H), 4,75-4,58 (м, 2H), 3,83-3,24 (м, 17H), 3,11 (дд, $J=9,2$, 8,3 Гц, 1H), 1,25 (д, $J=6,2$ Гц, 3H), 1,18 (тд, $J=7,2$, 2,8 Гц, 2H); ESI MS m/z 539 ($M+H$, основа).

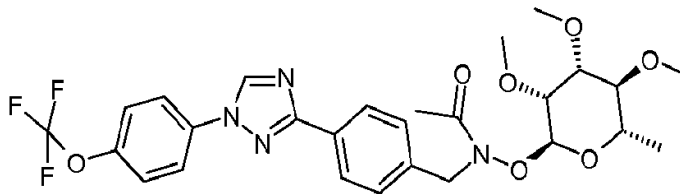
Приклад 5: Гідрохлорид O-((2S, 3R, 4R, 5S, 6S)-4-етокси-3,5-диметокси-6-метилтетрагідропіран-2-іл)-N-{4-[1-(4-пентафторетилоксифеніл)-1H-[1,2,4]триазол-3-іл]бензил}гідроксиламіну (сполука 5)



Вказану в заголовку сполуку отримували, як описано в прикладі 3, виходячи з O-((2S, 3R, 4R, 5S, 6S)-4-етокси-3,5-диметокси-6-метилтетрагідропіран-2-іл)-N-{4-[1-(4-пентафторетилоксифеніл)-1H-[1,2,4]триазол-3-іл]бензил}гідроксиламіну (105 мг, 0,17 ммоль). Вказаний в заголовку продукт (110 мг, 100 %) виділяли у вигляді білої твердої речовини: т. пл. 115-119°C;

1H ЯМР (400 МГц, CD_3OD) δ 9,44 (д, $J=7,1$ Гц, 1H), 8,28 (д, $J=8,3$ Гц, 2H), 8,16-7,96 (м, 2H), 7,74 (д, $J=8,3$ Гц, 2H), 7,55 (д, $J=9,0$ Гц, 2H), 5,47 (д, $J=2,2$ Гц, 1H), 4,69 (с, 2H), 3,82-3,25 (м, 12H), 3,14 (д, $J=9,1$ Гц, 1H), 1,38-1,20 (м, 6H); ESI MS m/z 603 ($M+H$, основа).

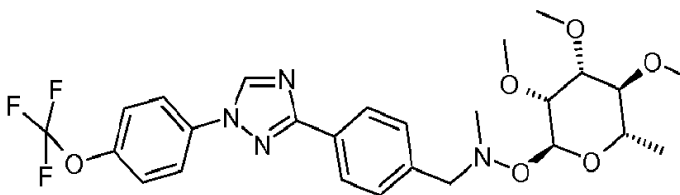
Приклад 6: Отримання N-{4-[1-(4-трифторметоксифеніл)-1H-[1,2,4]триазол-3-іл]бензил}-N-((2S, 3R, 4R, 5S, 6S)-3,4,5-триметокси-6-метилтетрагідропіран-2-ілокси)ацетаміду (сполука 6)



Розчин N-{4-[1-(4-трифторметоксибеніл)-1Н-[1,2,4]триазол-3-іл]бензил}-О-((2S, 3R, 4R, 5S, 6S)-3,4,5-триметокси-6-метилтетрагідропіран-2-іл)гідроксиламіну (3; 94,4 мг, 0,175 ммоль) в піридині (2 мл) обробляли ацетилхлоридом (70 мкл, 0,98 ммоль) і суміш залишали для перемішування при кімнатній температурі протягом 2,5 годин. Суміш потім упарювали при кімнатній температурі в умовах вакууму для зменшення об'єму. Концентрат розбавляли EtOAc і промивали 1н розчином HCl. Водний шар екстрагували 3 рази EtOAc. Органічні фракції об'єднували і сушили над безводним MgSO₄. Розчинник потім випарювали при кімнатній температурі в умовах вакууму. Отриману неочищену речовину очищали хроматографією на силікагелі (елюючи 50 % EtOAc в гексані → 90 % EtOAc в гексані в одну стадію). Вказаний в заголовку продукт (96,8 мг, 95 %) виділяли у вигляді безбарвної напівтвердої речовини.

¹H ЯМР (300 МГц, CDCl₃) δ 8,56 (с, 1H), 8,16 (д, J=8,4 Гц, 2H), 7,87-7,69 (м, 2H), 7,39 (д, J=8,1 Гц, 4H), 5,19 (дд, J=9,3, 6,6 Гц, 2H), 4,71 (д, J=16,1 Гц, 1H), 3,70-3,28 (м, 12H), 3,12 (дд, J=9,2, 7,9 Гц, 1H), 2,24 (с, 3H), 1,60 (с, 1H); ¹³C ЯМР (101 МГц, CDCl₃) δ 163,17, 141,89, 135,74, 129,76, 128,21, 126,89, 122,44, 121,26, 81,74, 79,82, 73,74, 69,61, 60,33, 58,86, 58,10, 21,05, 18,12; ESI MS m/z 581 (M+H).

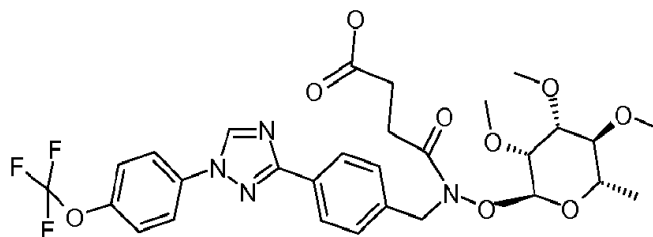
Приклад 7: Отримання N-Метил-N-{4-[1-(4-трифторметоксибеніл)-1Н-[1,2,4]триазол-3-іл]бензил}-О-((2S, 3R, 4R, 5S, 6S)-3,4,5-триметокси-6-метилтетрагідропіран-2-іл)гідроксиламіну (сполука 7)



До розчину N-{4-[1-(4-трифторметоксибеніл)-1Н-[1,2,4]триазол-3-іл]бензил}-О-((2S, 3R, 4R, 5S, 6S)-3,4,5-триметокси-6-метилтетрагідропіран-2-іл)гідроксиламіну (3; 205 мг, 0,38 ммоль) в тетрагідрофурані (ТГФ; 10 мл) додавали діізопропілетиламін (DIEA; 300 мкл, 1,7 ммоль) з подальшим додаванням метилйодиду (250 мкл, 4,0 ммоль). Отриманий розчин нагрівали до температури кипіння із зворотним холодильником. Через 1 годину, через видиме осадження кватернізованого DIEA, до суміші додавали безводний карбонат калію (K₂CO₃) разом з метилйодидом (200 мкл, 3,2 ммоль) і суспензію залишали для перемішування при температурі кипіння із зворотним холодильником ще протягом 21 години. Суміш потім охолоджували до кімнатної температури, розбавляли H₂O і екстрагували EtOAc (2×). Органічні фракції об'єднували, промивали насиченим розчином солі, сушили над безводним Na₂SO₄ і упарювали при кімнатній температурі в умовах вакууму. Отриману неочищену речовину очищали хроматографією на силікагелі (елюючи 60 % EtOAc в гексані). Вказаний в заголовку продукт (131 мг, 63 %) виділяли у вигляді блідо-жовтої твердої речовини: т. пл. 93-100°C;

¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 8,63 (д, J=4,1 Гц, 1H), 8,16 (д, J=8,3 Гц, 2H), 7,88-7,75 (м, 2H), 7,52 (т, J=10,7 Гц, 2H), 7,39 (т, J=9,5 Гц, 2H), 4,37 (д, J=13,2 Гц, 2H), 3,98-2,89 (м, 15H), 1,25 (дд, J=24,7, 6,2 Гц, 3H); ESI MS m/z 553 (M+H).

Приклад 8: Отримання N-{4-[1-(4-трифторметоксибеніл)-1Н-[1,2,4]триазол-3-іл]бензил}-N-((2S, 3R, 4R, 5S, 6S)-3,4,5-триметокси-6-метилтетрагідропіран-2-ілокси)напівамідом бурштинової кислоти (сполука 8)

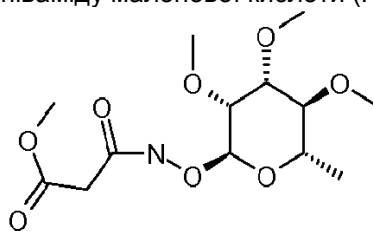


До розчину N-{4-[1-(4-трифторметоксифеніл)-1H-[1,2,4]триазол-3-іл]бензил}-O-((2S, 3R, 4R, 5S, 6S)-3,4,5-триметокси-6-метилтетрагідропіран-2-іл)гідроксиламіну (3; 140 мг, 0,26 ммоль) в піридині (5 мл) додавали бурштиновий ангідрид (великий надлишок) і суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 3,5 годин. Суміш розбавляли EtOAc і промивали 1н розчином HCl. Водну фракцію екстрагували EtOAc (2×). Органічні фракції об'єднували, промивали насиченим розчином солі, сушили над безводним MgSO₄ і упарювали при кімнатній температурі в умовах вакууму. Отриману неочищену речовину очищали хроматографією на силікагелі (елюючи 80 % EtOAc в гексані(100 % EtOAc з коротким градієнтом). Вказаний в заголовку продукт (64 мг, 39 %) виділяли у вигляді білої твердої речовини: т. пл. 61-75°C;

¹H ЯМР (300 МГц, CDCl₃) δ 8,63 (с, 1H), 8,16 (д, J=8,3 Гц, 2H), 7,93-7,68 (м, 2H), 7,40 (д, J=8,4 Гц, 4H), 5,40-5,10 (м, 2H), 4,76 (д, J=16,1 Гц, 1H), 3,73-3,25 (м, 13H), 3,15 (дд, J=9,1, 7,9 Гц, 1H), 3,04-2,60 (м, 4H), 1,27 (дд, J=9,8, 4,3 Гц, 3H); ESI MS m/z 639 (M+H), 638 (M+).

Приклад 9: Отримання метилового ефіру N-{4-[1-(4-трифторметоксифеніл)-1H-[1,2,4]триазол-3-іл]бензил}-N-((2S, 3R, 4R, 5S, 6S)-3,4,5-триметокси-6-метилтетрагідропіран-2-ілокси)напівамиду маленової кислоти (сполука 9)

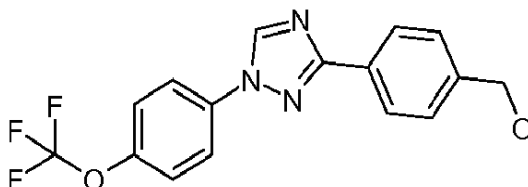
Стадія А: Отримання метилового ефіру N-((2S, 3R, 4R, 5S, 6S)-3,4,5-триметокси-6-метилтетрагідропіран-2-ілокси)напівамиду маленової кислоти (P-5)



До розчину O-((2S, 3R, 4R, 5S, 6S)-3,4,5-триметокси-6-метилтетрагідропіран-2-іл)гідроксиламіну (P-4; 157 мг, 0,71 ммоль) в дихлорметані (CH₂Cl₂; 8 мл) додавали DIEA (230 мкл, 1,3 ммоль) з подальшим додаванням розчину метилхлормалонату (137 мг, 1,0 ммоль), розчиненого в CH₂Cl₂ (2 мл). Отриману суміш залишали для перемішування при кімнатній температурі протягом 4 годин. Суміш потім розбавляли CH₂Cl₂ і промивали 1н розчином HCl. Водну фракцію екстрагували CH₂Cl₂. Органічні фракції об'єднували, сушили над безводним Na₂SO₄ і упарювали при кімнатній температурі в умовах вакууму. Отриману неочищену речовину очищали хроматографією на силікагелі (елюючи 75 % EtOAc в гексані). Вказаний в заголовку продукт (132 мг, 58 %) виділяли у вигляді безбарвного масла:

¹H ЯМР (300 МГц, CDCl₃) δ 10,00-9,38 (м, 1H), 5,06 (д, J=55,9 Гц, 1H), 4,02-2,92 (м, 18H), 1,39 (т, J=20,4 Гц, 3H); ¹³C ЯМР (101 МГц, CDCl₃) δ 189,13, 101,59, 81,56, 77,24, 75,39, 69,66, 59,26, 57,89, 52,86, 39,75, 26,47, 17,85; ESI MS m/z 320 (M+H).

Стадія В: Отримання {4-[1-(4-трифторметоксифеніл)-1H-[1,2,4]триазол-3-іл]феніл}метанолу (P-6)

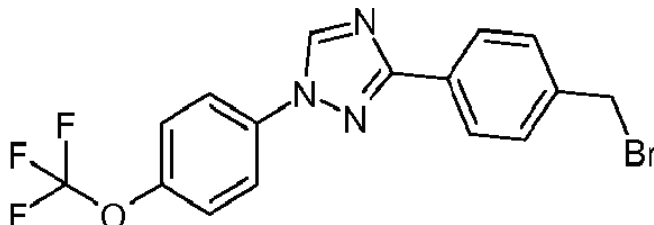


До розчину 4-[1-(4-трифторметоксифеніл)-1H-[1,2,4]триазол-3-іл]бензалдегід (P-3; 2,59 г, 7,79 ммоль) в EtOH (120 мл) порціями додавали борогідрид натрію (725,8 мг, 19,18 ммоль) у вигляді твердої речовини при кімнатній температурі. Коли додавання було завершено, суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 90 хвилин (хв.). Суміш потім розбавляли EtOAc і промивали H₂O. Водну фракцію екстрагували EtOAc. Органічні фракції об'єднували, сушили над безводним MgSO₄ і упарювали при кімнатній температурі в умовах вакууму.

Неочищену речовину абсорбували на силікагелі з використанням EtOAc і елюювали 50 % EtOAc в гексані. Вказаний в заголовку продукт (2,43 г, 93 %) виділяли у вигляді білої твердої речовини: т. пл. 112-114°C;

¹H ЯМР (300 МГц, CDCl₃) δ 8,55 (с, 1H), 8,29-8,12 (м, 2H), 7,91-7,69 (м, 2H), 7,43 (ддд, J=9,0, 5,7, 4,5 Гц, 4H), 4,78 (д, J=6,0 Гц, 2H), 2,07 (т, J=6,0 Гц, 1H); ESI MC m/z 336 (M+H).

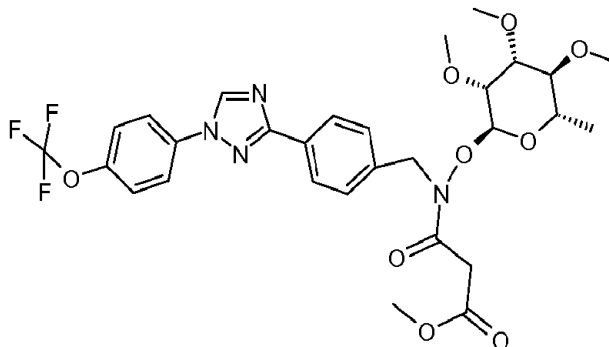
Стадія C: Отримання 3-(4-бромметилфеніл)-1-(4-трифторметоксифеніл)-1H-[1,2,4]триазолу (P-7)



До розчину {4-[1-(4-трифторметоксифеніл)-1H-[1,2,4]триазол-3-іл]феніл}метанолу (P-6; 5,033 г, 15,01 ммоль) в ТГФ (100 мл) додавали трифенілфосфін (6,009 г, 22,91 ммоль). Потім додавали по краплях тетрабромід вуглецю (7,704 г, 23,23 ммоль), розчинений в ТГФ (20 мл), при кімнатній температурі. Суміш залишали для перемішування при кімнатній температурі протягом 23 годин. Потім суміш фільтрували через целіт і розчинник випарювали при кімнатній температурі в умовах вакууму. Неочищену речовину очищали хроматографією на силікагелі, елюючи 50 % EtOAc/гексан (70 % EtOAc/гексан і потім 100 % EtOAc з двостадійним градієнтом. Вказаний в заголовку продукт (4,61 г, 77 %) виділяли у вигляді бежевої твердої речовини: т. пл. 124-126°C;

¹H ЯМР (300 МГц, CDCl₃) δ 8,59 (с, 1H), 8,25-8,13 (м, 2H), 7,89-7,72 (м, 2H), 7,60-7,47 (м, 2H), 7,47-7,34 (м, 2H), 4,57 (с, 2H); ESI MC m/z 400 (M+2H), 399 (M+H).

Стадія D: Отримання метилового ефіру N-{4-[1-(4-трифторметоксифеніл)-1H-[1,2,4]триазол-3-іл]бензил}-N-((2S, 3R, 4R, 5S, 6S)-3,4,5-триметокси-6-метилтетрагідропіран-2-ілокси)напівамиду маленової кислоти (сполука 9)



До розчину метилового ефіру N-((2S, 3R, 4R, 5S, 6S)-3,4,5-триметокси-6-метилтетрагідропіран-2-ілокси)напівамиду маленової кислоти (P-5; 108 мг, 0,34 ммоль) в безводному ТГФ (3 мл) додавали 60 % NaH (14,4 мг, 0,36 ммоль), що спричиняло виділення газу. До отриманої суміші додавали 3-(4-бромметилфеніл)-1-(4-трифторметоксифеніл)-1H-[1,2,4]триазол (P-7; 106 мг, 0,26 ммоль) і отриману суміш нагрівали до 50°C протягом 21 години. Суміші потім давали охолотитися до кімнатної температури, розбавляли EtOAc і промивали H₂O. Водну фракцію екстрагували EtOAc. Органічні фракції об'єднували, промивали насиченим розчином солі, сушили над безводним Na₂SO₄ і упарювали при кімнатній температурі в умовах вакууму. Отриману неочищену речовину очищали хроматографією на силікагелі (елюючи 100 % гексану → 50 % EtOAc в гексані протягом 15 хвилин, і потім 100 % EtOAc ще протягом 20 хвилин). Вказаний в заголовку продукт (56 мг, 34 %) виділяли у вигляді безбарвної склоподібної речовини:

¹H ЯМР (300 МГц, CDCl₃) δ 8,58 (с, 1H), 8,17 (д, J=8,4 Гц, 2H), 7,90-7,70 (м, 2H), 7,41 (дд, J=9,9, 8,4 Гц, 4H), 5,42-5,09 (м, 2H), 4,76 (д, J=15,9 Гц, 1H), 3,83-3,05 (м, 18H), 1,41-1,20 (м, 3H); ¹³C ЯМР (151 МГц, CDCl₃) δ 167,80, 148,87, 141,93, 137,72, 135,95, 130,20, 128,71, 127,19, 122,81, 121,66, 119,95, 105,05, 82,11, 81,97, 79,79, 76,81, 70,28, 70,04, 60,48, 59,63, 59,20, 58,37, 52,76, 41,66, 30,10, 18,58; ESI MC m/z 639 (M+H).

Приклад 10: БІОАНАЛІЗИ НА СОВЦІ МАЛІЙ (Beet Armyworm, "BAW") І ГУСЕНІ СОВКИ БАВОВНЯНОЇ АМЕРИКАНСЬКОЇ (Corn Earworm, "CEW")

BAW має незначне число ефективних паразитів, захворювань або пожирачів для зменшення його популяції. BAW заражає багато які кущі, дерева, трави, бобові і польові культури. У різних місцях він викликає економічні проблеми, уражаючи спаржу, бавовник, кукурудзу, соєві боби, тютюн, люцерну, цукровий буряк, перець, помідори, картоплю, цибулю, горох, соняшник і цитрусові, серед інших рослин. Відомо, що CEW уражає кукурудзу і помідори, але він також вражає артишок, спаржу, капусту, мускусну диню, листову капусту, вігню китайську, огірки, баклажан, салат-латук, лімську квасолю, диню, окру, горох, перець, картоплю, гарбуз, стручкову квасолю, шпинат, кабачок, солодка картопля і кавун, серед інших рослин. Також відомо, що CEW є резистентною до деяких інсектицидів. Отже, враховуючи вказані вище фактори, боротьба з цими шкідниками має важливе значення. Крім того, сполуки, які призначені для боротьби з цими шкідниками, є корисними для боротьби з іншими шкідниками.

Деякі сполуки, розкриті в даному винаході, були перевірені проти BAW і CEW з використанням методик, описаних в прикладах, що слідують нижче. При представленні результатів використовували "BAW і CEW таблицю зі шкалою оцінок" (див. розділ Таблиці).

БІОАНАЛІЗИ НА BAW (*Spodoptera exigua*)

Біоаналізи на BAW здійснювали за допомогою аналізу з використанням 128-ямкового живильного лотка, BAW личинки у віковій стадії 1-5 сек. вміщували в кожну ямку (3 мл) живильного лотка, яка була заздалегідь заповнена 1 мл штучного корму, на які було нанесено (в кожній з восьми ямок) 50 мкг/см² сполуки, що тестується (розчиненої в 50 мкл 90:10 суміші ацетон-вода), і потім давали висохти. Лотки покривали прозорим самоприлипаючим покриттям і витримували при 25°C з циклом 14:10 світло-темрява протягом п'яти-семи днів. Процент смертності реєстрували для личинок в кожній ямці; активність у восьми ямках потім усереднювали. Результати наведені в таблиці, озаглавленій "Таблиця 1" (див. розділ Таблиці).

БІОАНАЛІЗИ НА CEW (*Helicoverpa zea*)

Біоаналізи на CEW здійснювали за допомогою аналізу з використанням 128-ямкового живильного лотка, CEW личинки у віковій стадії 1-5 сек. вміщували в кожну ямку (3 мл) живильного лотка, яка була заздалегідь заповнена 1 мл штучного корму, на які було нанесено (в кожній з восьми ямок) 50 мкг/см² сполуки, що тестується (розчиненої в 50 мкл 90:10 суміші ацетон-вода), і потім давали висохти. Лотки покривали прозорим самоприлипаючим покриттям і витримували при 25°C з циклом 14:10 світло-темрява протягом п'яти-семи днів. Процент смертності реєстрували для личинок в кожній ямці; активність у восьми ямках потім усереднювали. Результати наведені в таблиці, озаглавленій "Таблиця 1" (див. розділ Таблиці).

Приклад 11: БІОАНАЛІЗИ НА ТЛІ ЗЕЛЕНІЙ ПЕРСИКОВІЙ ("GPA") (*Myzus persicae*)

GPA є найбільш суттєвою зі шкідників тлі персикових дерев, що спричиняє зниження росту, в'янення листя і загибель різних тканин. Вона також є небезпечною, оскільки діє як вектор для транспорту вірусів рослин, таких як вірус Y картоплі і вірус, що спричиняє скручування листя картоплі для членів сімейства пасльонових/картоплі Solanaceae, і різні мозаїчні віруси для багатьох інших продовольчих культур. GPA уражає такі рослини, як броколі, лопух, капуста, морква, цвітна капуста, японська редька, баклажан, зелена квасоля, салат-латук, австралійський горіх, папайя, перець, солодка картопля, помідори, крес водяний і цукіні, серед інших рослин. GPA також уражає багато які декоративні рослини, такі як гвоздика, хризантема, квітуча білокачанна капуста, пуансетія (*poinsettia*) і троянди. GPA набула резистентності до багатьох пестицидів.

Деякі сполуки, розкриті в даному винаході, були перевірені проти GPA з використанням методик, описаних в прикладі, що йде нижче. При представленні результатів використовували "GPA таблицю з шкалою оцінок" (див. розділ Таблиці).

Саджанці капусти, вирощені в 3-дюймових горщиках з 2-3 маленьким (3-5 см) справжнім листям, використовували як субстрат, що тестується. Саджанці заражали 20-50 GPA (в стадіях безкрилих дорослих і личинок) за день до нанесення хімікату. Для кожної обробки використовували чотири горщики з індивідуальними саджанцями. Тестовані сполуки (2 мг) розчиняли в 2 мл розчинника ацетон/метанол (1:1) з утворенням вихідних розчинів 1000 ч/млн. сполуки, що тестується. Вихідні розчини розбавляли 5× 0,025 % Tween 20 в H₂O з отриманням розчину при 200 ч/млн. сполуки, що тестується. Використовували ручний розбризкувач типу аспілятора для нанесення розчину розбризкуванням на обидві сторони капустяного листя до стікання розчину з листя. Порівняльні рослини (контроль з використанням розчинника) окроплювали розріджувачем, що містить тільки 20 % по об'єму розчинника ацетон/метанол (1:1). Оброблені рослини витримували в спеціальному приміщенні протягом трьох днів при приблизно 25°C і відносній вологості навколишнього середовища (RH) перед сортуванням. Оцінку здійснювали шляхом підрахунку кількості живої тлі на кожній рослині під мікроскопом. Процент контролю визначали з використанням коректувальної формули Аббота (W.S. Abbott, "A Method

of Computing the Effectiveness of an Insecticide" J. Econ. Entomol. 18 (1925), pp. 265-267) таким чином.

Скоректований % контролю= $100 \cdot (X-Y)/X$,

де

5 X =кількість живих особин тлі на контрольних рослинах, оброблених розчинником, і

Y =кількість живих особин тлі на оброблених рослинах

Результати наведені в таблиці, озаглавленій "Таблиця 1" (див. розділ Таблиці).

Пестицидно прийнятні кислотно-адитивні солі, сольові похідні, сольвати, складноефірні похідні, поліморфи, ізотопи і радіонукліди

10 Сполуки формули 1 можуть бути перетворені в пестицидно прийнятні кислотно-адитивні солі. Як необмежувальний приклад, функціональна група аміну може утворювати солі з хлористоводневою, бромистоводневою, сірчаною, фосфорною, оцтовою, бензойною, лимонною, маленовою, саліциловою, яблучною, умаровою, щавлевою, бурштиною, винною, молочною, глюконовою, аскорбіною, малеїною, аспарагіною, бензолсульфоною, метансульфоною, етансульфоною, гідроксиметансульфоною і гідроксietансульфоною, 15 кислотами. Крім того, як необмежувальний приклад, кислотна функціональна група може утворювати солі, включаючи солі, утворені з лужних або лужноземельних металів, і солі, утворені з аміаку і амінів. Приклади переважних катіонів включають натрій, калій і магній.

20 Сполуки формули 1 можуть бути перетворені в сольові похідні. Як необмежувальний приклад, сольові похідні можна отримати шляхом контактування вільної основи з достатньою кількістю бажаної кислоти для отримання солі. Вільну основу можна відновити шляхом обробки солі прийнятним розбавленим водним розчином основи, таким як розбавлений водний розчин гідроксиду натрію (NaOH), карбонату калію, аміаку і бікарбонату натрію. Як приклад, в багатьох випадках пестицид, такий як 2,4-D, роблять більш водорозчинним шляхом перетворення в його 25 диметиламінову сіль.

Сполуки формули 1 можуть бути перетворені в стабільні комплекси з розчинником, так щоб комплекс залишався непошкодженим після видалення не зв'язаного в комплекс розчинника. Такі комплекси часто називають "сольватами". Однак особливо бажане утворення стабільних гідратів з водою як розчинником.

30 Сполуки формули 1 можуть бути отримані у вигляді складноефірних похідних. Такі складноефірні похідні потім можна застосовувати аналогічно тому, як розкрито в описі даного винаходу.

Сполуки формули 1 можуть бути отримані у вигляді різних кристалічних поліморфів. Поліморфізм є важливим в розробці агрохімікатів, оскільки різні кристалічні поліморфи або структури однієї і тієї ж сполуки можуть мати фізичні властивості і біологічну активність, що 35 сильно відрізняються.

Сполуки формули 1 можуть бути отримані з різними ізотопами. Особливо важливе значення мають сполуки, що містять $2H$ (також відомий як дейтерій) замість $1H$.

40 Сполуки формули 1 можуть бути отримані з різними радіонуклідами. Особливо важливе значення мають сполуки, що містять $14C$.

СТЕРЕОІЗОМЕРИ

Сполуки формули 1 можуть існувати у вигляді одного або декількох стереоізомерів. Таким чином, деякі сполуки можуть бути отримані у вигляді рацемічних сумішей. Фахівцям в даній 45 галузі буде зрозуміло, що один стереоізомер може бути більш активним в порівнянні з іншими стереоізомерами. Індивідуальні стереоізомери можуть бути отримані за допомогою відомих селективних синтетичних методик, традиційних синтетичних методик з використанням розділених вихідних речовин або традиційних методів розділення.

ІНСЕКТИЦИДИ

Сполуки формули 1 також можна використовувати в комбінації (наприклад, в композиційній 50 суміші або для одночасного або послідовного нанесення) з одним або декількома з наступних інсектицидів, таких як: 1,2-дихлорпропан, абамектин, ацефат, ацетаміпрід, ацетіон, ацетопрол, акринатрин, акрилонітрил, аланікарб, алдікарб, альдоксикарб, алдрин, алетрин, алосамідин, аліксикарб, альфа-циперметрин, альфа-екдисон, альфа-ендосульфат, амідитіон, амінокарб, амітон, амітон оксалат, амітрац, анабазин, атидатіон, азадирахтин, азаметинос, азинфос-етил, азинфос-метил, азотат, барій гексафторсилікат, бартрин, бендіокарб, бенфуракарб, бенсултап, бета-цифлутрин, бета-циперметрин, біфентрин, біоалетрин, біоетанометрин, біоперметрин, бістрифлурон, боракас, борна кислота, бромфенвінфос, бромциклен, бром-ДДТ, бромфос, бромфос-етил, буфенкарб, бупрофезин, бутакарб, бутатіофос, бутоткарбоксим, бутонат, бутоткарбоксим, кадусафос, арсенат кальцію, полісульфід кальцію, камфехлор, 60 карбанолат, карбарил, карбофуран, дисульфід вуглецю, тетрахлорид вуглецю, карбофенотіон,

карбосульфат, картап, картап гідрохлорид, хлорантраніліпрол, хлорбіциклен, хлордан, хлордекон, хлордимеформ, хлордимеформ гідрохлорид, хлоретоксифос, хлорфенапір, хлорфенвінфос, хлорфлуазурон, хлормефос, хлороформ, хлорпікрин, хлорфоксим, хлорпразофос, хлорпірифос, хлорпірифос-метил, хлортіофос, хромафенозид, цинерин I, цинерин II, цинеринф, цисметрин, клоетокарб, клосантел, клотіанідин, ацетоарсеніт міді, арсенат міді, нафтенат міді, олеат міді, кумафос, кумітоат, кротамітон, кротоксифос, круфомат, кріоліт, ціанофенфос, ціанофос, ціантоат, ціантраніліпрол, циклетрин, циклопротрин, цифлутрин, цигалотрин, циперметрин, цифенотрин, циромазин, цитіоат, ДДТ, декарбофуран, дельтаметрин, демефіон, демефіон-О, демефіон-S, деметон, деметон-метил, деметон-О, деметон-О-метил, деметон-S, деметон-S-метил, деметон-S-метилсульфон, діафентіурон, діаліфос, діатомова земля, діазинон, дикафон, дихлофентіон, дихлорвос, дикрезил, дикротофос, дицикланіл, діелдрин, дифлубензурон, дилор, димефлутрин, димефокс, диметан, диметоат, диметрин, диметилвінфос, диметилан, динекс, динекс-диклексин, динопроп, диносам, динотефуран, діофенолан, діоксабензофос, діоксакарб, діоксатіон, дисульфотон, дитикрофос, d-лімонен, DNOC, DNOC-амоній, DNOC-калій, DNOC-натрій, дорамектин, екдистерон, емаметин, емаметин бензоат, EMPC, емпентрин, ендосульфат, ендотіон, ендрин, EPN, епофенонан, еприномектин, есдепалетрин, есфенвалерат, етафос, етіофенкарб, етіон, етипрол, етоат-метил, етопрофос, етилформіат, етил-DDD, етилендібромід, етилендихлорид, етиленоксид, етофенпрокс, етримфос, EXD, фамфур, фенаміфос, феназафлор, фенхлорфос, фенетакарб, фенфлутрин, фенітротіон, фенобукарб, феноксакрим, феноксикарб, фенпіритрин, фенпропатрин, фенсульфотіон, фентіон, фентіон-етил, фенвалерат, фіпроніл, флومتохін, флонікамід, флубендіамід (його додатково розділені ізомери), флукофуран, флуциклоксурон, флуцитринат, флуфенерим, флуфеноксурон, флуфенпрокс, флупірадіфуран, флувалінат, фонофос, форметанат, форметанат гідрохлорид, формотіон, формпаранат, формпаранат гідрохлорид, фосметилан, фоспірат, фостіетан, фуфенозид, фуратіокарб, фуретрин, гамма-цигалотрин, гамма-RCR, галфенпрокс, галогенфенозид, HCH, HEOD, гептахлор, гептенофос, гетерофос, гексафлумурон, HHDN, гідраметилнон, ціаністий водень, гідропрен, гіхінкарб, імідаклопрід, іміпротрин, індоксакарб, йодметан, IPSP, ізазофос, ізобензан, ізокарбофос, ізодрин, ізофенфос, ізофенфос-метил, ізопрокарб, ізопротіолан, ізотіоат, ізоксатіон, івермектин, жасмолін I, жасмолін II, джодфенфос, ювенільний гормон I, ювенільний гормон II, ювенільний гормон III, келеван, кінопрен, лямбда-цигалотрин, арсенат свинцю, лепіомектин, лептофос, ліндан, ліримфос, луфенурон, літидатіон, малатіон, малонобен, мазидокс, мекарбам, мекарфон, меназон, меперфлутрин, мефосфолан, хлорид ртуті, месулфенфос, метафлумізон, метакрифос, метамідофос, метидатіон, метіокарб, метокротофос, метоміл, метопрен, метотрин, метоксиклор, метоксифенозид, метилбромід, метилізотіоціанат, метилхлороформ, метиленхлорид, метофлутрин, метолкарб, метоксadiaзон, мевінфос, мексакарбат, мілбемектин, мілбеміцин оксим, міпафокс, мірекс, молосультат, монокротофос, мономегіпо, моносультат, морфотіон, моксидектин, нафталофос, налед, нафталін, нікотин, ніфлуридин, нітенпірам, нітіазин, нітрилакарб, новалурон, новіфлумурон, ометоат, оксаміл, оксидеметон-метил, оксидепрофос, оксидисульфотон, пара-дихлорбензол, паратіон, паратіон-метил, пенфлурон, пентахлорфенол, перметрин, фенкаптон, фенотрин, фентоат, форат, фосалон, фосфолан, фосмет, фосніхлор, фосфамідон, фосфін, фоксим, фоксим-метил, піриметафос, піримікарб, піриміфос-етил, піриміфос-метил, арсеніт калію, тіоціанат калію, pp'-ДДТ, пралетрин, прекоцин I, прекоцин II, прекоцин III, піримдофос, профенофос, профлуралін, профлутрин, промацил, промекарб, пропафос, пропетамфос, пропоксур, протидатіон, протіофос, протоат, протрифенбуте, піметрозин, піраклофос, пірафлупрол, піразофос, піресметрин, піретрин I, піретрин II, піретрини, піридабен, піридаліл, піридафентіон, пірифлуксіназон, піримідифен, піримітат, пірипрол, пірипроксифен, квасія, хіналфос, хіналфос-метил, хінотіон, рафоксанід, ресметрин, ротенон, ріанія, сабадила, шрадан, селаментин, силафлуофен, силікагель, арсеніт натрію, фторид натрію, гексафторсилікат натрію, тіоціанат натрію, софамід, спінеторам, спіносад, спіромезифен, спіротетрамат, сулкофуран, сулкофуран-натрій, сульфурамід, сульфотеп, сульфоксафлор, сульфурилфторид, сулпрофос, тау-флувалінат, тазимкарб, TDE, тебуфенозид, тебуфенпірад, тебупіримфос, тефлубензурон, тефлутрин, темефос, TEPP, тералетрин, тербуфос, тетрахлоретан, тетрахлорвінфос, тетраметрин, тетраметилфлутрин, тета-циперметрин, тіаклопрід, тіаметоксам, тикрофос, тіокарбоксим, тіоциклам, тіоциклам оксалат, тіодикарб, тіофанокс, тіометон, тіосультат, тіосультат-динатрій, тіосультат-мононатрій, турінгієнсин, толфенпірад, тралометрин, трансфлутрин, трансперметрин, триатен, триазамат, триазофос, трихлорфон, трихлорметафос-3, трихлорнат, трифенофос, трифлумурон, триметакарб, трипрен, вамідотіон, ваніліпрол, ХМС, ксилілкарб, зета-циперметрин і золапрофос (всі разом інсектициди, що мають ці традиційні назви, визначені як "група інсектицидів").

АКАРИЦИДИ

Сполуки формули 1 також можна використовувати в комбінації (наприклад, в композиційній суміші або для одночасного або послідовного нанесення) з одним або декількома з наступних акарицидів, таких як: ацехіноцил, амідофлумет, оксид миш'яку, азобензол, азоциклотин, беноміл, беноксафос, бензоксимат, бензилбензоат, біфеназат, бінапакрил, бромпропілат, хінометіонат, хлорбензид, хлорфенетол, хлорфенсон, хлорфенсульфід, хлорбензилат, хлормебуформ, хлорметіурон, хлорпропілат, клофентезин, цієнопірафен, цифлуметофен, цигексатин, дихлофлуанід, дикофол, дієнохлор, дифловідазин, динобутон, динокап, динокап-4, динокап-6, диноктон, динопентон, диносультон, динотербон, дифенілсульфон, дисульфідрам, дофенапін, етоксазол, феназахін, фенбутатин оксид, фенотіокарб, фенпіроксимат, фенсон, фентрифаніл, флуакрипірим, флуазурон, флубензімін, флуенетил, флуметрин, фторбензид, гекситіазокс, месулфен, MNAF, нікоміцини, проклонол, пропаргіт, хинтіофос, спіродиклофен, сульфідрам, сірка, тетрадифон, тетранактин, тетрасулі тіохінокс (всі разом ці акарициди, що мають традиційні назви, визначені як "група акарицидів").

НЕМАТОДОЦИДИ

Сполуки формули 1 також можна використовувати в комбінації ((наприклад, в композиційній суміші або для одночасного або послідовного нанесення) з одним або декількома з наступних нематододів, таких як: 1,3-дихлорпропен, бенклотіаз, дазомет, дазомет-натрій, DBCP, DCIP, діамідафос, флуенсульфон, фостіазат, фурфурал, іміціяфос, ізамідофос, ізазофос, метам, метам-амоній, метам-калій, метам-натрій, фосфокарб і тіоназин (всі разом ці нематододиди, що мають традиційні назви, визначені як "група нематододів"))

ФУНГІЦИДИ

Сполуки формули 1 також можна використовувати в комбінації (наприклад, в композиційній суміші або для одночасного або послідовного нанесення) з одним або декількома з наступних фунгіцидів, таких як: бромід (3-етоксипропіл)ртуті, хлорид 2-метоксіетилртуті, 2-фенілфенол, 8-гідроксигінолінсульфат, 8-фенілртуть оксигінолін, ацибензолар, ацибензолар-S-метил, аципетакс, аципетакс-мідь, аципетакс-цинк, алдиморф, аліловий спирт, аметоктрадин, амисулбром, ампропілфос, анілазин, ауреофунгін, азокназол, азитирам, азоксистробін, полісульфід барію, беналаксил, беналаксил-M, беноданіл, беноміл, бенхінокс, бенталурон, бентіавалікарб, бентіавалікарб-ізопропіл, бензалконіхлорид, бензамакрил, бензамакрил-ізобутил, бензаморф, бензогідроксамова кислота, бетоксазин, бінапакрил, біфеніл, бітертанол, бітінол, біксафен, бластицидин-S, бордоська рідина, боскалід, бромукназол, бупіримат, бургундська суміш, бутіобат, бутиламін, полісульфід кальцію, каптафол, каптан, карбаморф, карбендазим, карбоксин, карпропамід, карвон, Cheshunt суміш, хінометіонат, хлорбензіазон, хлораніформетан, хлораніл, хлорфеназол, хлординітронафталін, хлорнеб, хлоропікрин, хлороталоніл, хлорхінокс, хлоролінат, клімбазол, клотримазол, ацетат міді, карбонат міді, основний, гідроксид міді, нафтенат міді, олеат міді, оксигінолін міді, силікат міді, сульфат міді, хромат міді-цинку, крезол, куфранеб, купробам, оксид міді, ціазофамід, циклафурамід, циклогексимід, цифлуфенамід, цимоксаніл, ципендазол, ципроконазол, ципродиніл, дазомет, дазомет-натрій, DBCP, дебакарб, декафентин, дегідрооцтова кислота, дихлофлуанід, дихлон, дихлорфен, дихлоролін, диклобутразол, диклоцимет, дикломезин, дикломезин-натрій, диклоран, діетофенкарб, діетилпірокарбонат, дифеноконазол, дифлуметорим, диметиримол, диметоморф, димоксистробін, диніконазол, диніконазол-M, динобутон, динокап, динокап-4, динокап-6, диноктон, динопентон, диносультон, динотербон, дифеніламін, дипіритон, дисульфідрам, диталімфос, дитіанон, DNOC, DNOC-амоній, DNOC-калій, DNOC-натрій, додеморф, додеморф ацетат, додеморф бензоат, додицин, додицин-натрій, додин, дразоксолон, едифенфос, епоксиконазол, етакназол, етем, етабоксам, етиримол, етоксигін, 2,3-дигідроксипропілмеркаптід етилртуті, ацетат етилртуті, бромід етилртуті, хлорид етилртуті, фосфат етилртуті, етридіазол, фамоксадон, фенамідон, фенаміносульф, фенапаніл, фенаримол, фенбуконазол, фенфурам, фенгексамід, фенітропан, феноксаніл, фенпіклоніл, фенпропідин, фенпропмморф, фентин, фентин хлорид, фентин гідроксид, фербам, феримзон, флуазинам, флудіоксоніл, флуметовер, флуморф, флуопіколід, флуопірам, флуороімід, флуотримазол, флуоксастробін, флухінконазол, флусилазол, флусульфамід, флутіаніл, флутоланіл, флутриафол, флукаспіроксад, фолпет, формальдегід, фосетил, фосетил-алюміній, фуберідазол, фліралаксил, фураметпір, фуркарбаніл, фурконазол, фурконазол-цис, фурфурал, фурмециклокс, фуорофанат, гліодин, гризеофулвін, гуазатин, галакринат, гексахлорбензол, гексахлорбутадієн, гексакназол, гексилтіофос, гідраргафен, гімексазол, імазаліл, імазаліл нітрат, імазаліл сульфат, імібенконазол, іміноктадин, іміноктадин триацетат, іміноктадин триалбесилат, йодметан, іпконазол, іпробенфос, іпродіон, іпровалікарб, ізопротіолан, ізопіразам, ізотіаніл, ізоваледіон, касугаміцин, крезоксим-метил, манкоппер,

манкозєб, мандипропамід, манєб, мебеніл, мекарбінзид, мепаніпірим, мепроніл, мептилдинокап, дихлорид ртуті, оксид ртуті, хлорид ртуті, металаксил, металаксил-М, метам, метам-амоній, метам-калій, метам-натрій, метазоксолон, метконазол, метасульфокарб, метфуроксам, метилбромід, метилізотіоціанат, бензоат метилртуті, диціандіамід метилртуті, пентахлорфеноксид метилртуті, метирам, метоміностробін, метрафенон, метсульфовакс, мілнеб, міклобутаніл, міклозолін, N-(етилртуті)-п-толуолсульфонанілід, набам, натамицин, нітrostирол, нітротал-ізопропіл, нуаримол, ОСН, октилінон, офураце, орисастробін, оксидиксил, оксин-мідь, окспоконазол, окспоконазол фумарат, оксикарбоксин, пефуразоат, пенконазол, пенцикурон, пенфлуфен, пентахлорфенол, пентіопірад, фенілртутьсечовина, ацетат фенілртуті, хлорид фенілртуті, фенілртуть-похідне пірокатехіну, нітрат фенілртуті, саліцилат фенілртуті, фосдифен, фталід, пікоксистробін, піпералін, полікарбамат, поліоксини, поліоксорим, поліоксорим-цинк, азид калію, полісульфід калію, тіоціанат калію, пробеназол, прохлораз, процимідон, пропамокарб, пропамокарб гідрохлорид, пропіконазол, пропінеб, прохіназид, протіокарб, протіокарб гідрохлорид, протіоконазол, піракарболід, піраклостробін, піраклостробін, піраметостробін, піраоксистробін, піразофос, пірибенкарб, піридинітрил, пірифенокс, піриметаніл, піріофенон, піроквілон, піроксихлор, піроксифур, хінацетол, хінацетол сульфат, хіназамід, хінконазол, хіноксифен, хінтозен, рабензазол, саліциланілід, седаксан, силтіофам, симеконазол, азид натрію, ортофенілфеноксид натрій, пентахлорфеноксид натрію, полісульфід натрію, спіроксамін, стрептоміцин, сірка, султропен, ТСМТВ, тебуконазол, тебуфлоквін, теклофталам, текназен, текорам, тетраконазол, тіабендазол, тіадифтор, тиціофен, тифлузамід, тіохлорфенфін, тіомерсал, тіофанат, тіофанат-метил, тіохінокс, тирам, тіадиніл, тіоксимід, толклофос-метил, толілфлуанід, ацетат толілртуті, триадимефон, триадименол, триаміфос, триаримол, триазбутил, триазоксид, оксид трибутилолова, трихламід, трициклазол, тридеморф, трифлуксистробін, трифлумізол, трифорин, тритиконазол, уніконазол, уніконазол-Р, валідаміцин, валіфеналат, вінклолін, зариламід, нафтенат цинку, зинеб, зирам, зоксамід (всі разом ці фунгіциди, що мають традиційні назви, визначені як "група фунгіцидів").

ГЕРБІЦИДИ

Сполуки формули 1 також можна використовувати в комбінації (наприклад, в композиційній суміші або для одночасного або послідовного нанесення) з одним або декількома з наступних гербіцидів, таких як: 2,3,6-ТВА, 2,3,6-ТВА-диметиламоній, 2,3,6-ТВА-натрій, 2,4,5-Т, 2,4,5-Т-2-бутоксипропіл, 2,4,5-Т-2-етилгексил, 2,4,5-Т-3-бутоксипропіл, 2,4,5-ТВ, 2,4,5-Т-бутометил, 2,4,5-Т-бутотил, 2,4,5-Т-бутил, 2,4,5-Т-ізобутил, 2,4,5-Т-ізоктил, 2,4,5-Т-ізопропіл, 2,4,5-Т-метил, 2,4,5-Т-пентил, 2,4,5-Т-натрій, 2,4,5-Т-триетиламоній, 2,4,5-Т-троламін, 2,4-D, 2,4-D-2-бутоксипропіл, 2,4-D-2-етилгексил, 2,4-D-3-бутоксипропіл, 2,4-D-амоній, 2,4-DB, 2,4-DB-бутил, 2,4-DB-диметиламоній, 2,4-DB-ізоктил, 2,4-DB-калій, 2,4-DB-натрій, 2,4-D-бутотил, 2,4-D-бутил, 2,4-D-діетиламоній, 2,4-D-диметиламоній, 2,4-D-діоламін, 2,4-D-додєциламоній, 2,4-DEB, 2,4-DEP, 2,4-D-етил, 2,4-D-гептиламоній, 2,4-D-ізобутил, 2,4-D-ізоктил, 2,4-D-ізопропіл, 2,4-D-ізопропіламоній, 2,4-D-літій, 2,4-D-мептил, 2,4-D-метил, 2,4-D-октил, 2,4-D-пентил, 2,4-D-калій, 2,4-D-пропіл, 2,4-D-натрій, 2,4-D-тефурил, 2,4-D-тетрадециламоній, 2,4-D-триетиламоній, 2,4-D-трис(2-гідроксипропіл)амоній, 2,4-D-троламін, 3,4-DA, 3,4-DB, 3,4-DP, 4-CPA, 4-CPB, 4-CPD, ацетохлор, ацифторфен, ацифторфен-метил, ацифторфен-натрій, аклоніфен, акролеїн, алахлор, алідохлор, алоксидим, алоксидим-натрій, аліловий спирт, алорак, аметридіон, аметрин, амібузин, амікарбазон, амідосульфурон, аміноциклопірахлор, аміноциклопірахлор-метил, аміноциклопірахлор-калій, амінопіралід, амінопіралід-калій, амінопіралід-трис(2-гідроксипропіл)амоній, аміпрофос-метил, амітрол, амонійсульфамат, анілофос, анізурон, асулам, асулам-калій, асулам-натрій, атратон, атразин, азафенідин, азимсульфурон, азипротрин, барбан, BCPC, бєфлубутамід, беназолін, беназолін-диметиламоній, беназолін-етил, беназолін-калій, бенкарбазон, бенфлуралін, бенфуресат, бенсульфурон, бенсульфурон-метил, бенсулід, бєнтазон, бєнтазон-натрій, бензадокс, бензадокс-амоній, бензфєндизон, бензипрам, бензобіциклон, бензофєнап, бензофтор, бензоїлпроп, бензоїлпроп-етил, бензтіазурон, біциклопірон, біфєнокс, біланафос, біланафос-натрій, біспірибак, біспірибак-натрій, боракс, бромацил, бромацил-літій, бромацил-натрій, бромбоніл, бромбутид, бромфєноксим, бромксиніл, бромксиніл бутират, бромксиніл гептанеат, бромксиніл октанеат, бромксиніл-калій, бромпіразон, бутахлор, бутафєнацил, бутаміфос, бутєнахлор, бутидазол, бутіурон, бутралін, бутроксидим, бутурон, бутилат, каєодилова кислота, кафєнстрол, хлорат кальцію, ціанамід кальцію, камбєндихлор, карбасулам, карбєтамід, карбоксазол, карфєнтразон, карфєнтразон-етил, CDEA, CEPD, хлєметоксифєн, хлорамбєн, хлорамбєн-амоній, хлорамбєн-діоламін, хлорамбєн-метил, хлорамбєн-метиламоній, хлорамбєн-натрій, хлоранокрил, хлоразифоп, хлоразифоп-пропаргїл, хлоразин, хлорбромурон, хлорбуфам, хлорєтурон, хлорфєнак, хлорфєнак-натрій, хлорфєнпроп, хлорфєнпроп-метил, хлорфлуразол,

хлорфлуренол, хлорфлуренол-метил, хлоридазон, хлоримурон, хлоримурон-етил, хлорнітрофен, хлоропон, хлоротолурон, хлороксурон, хлороксиніл, хлорпрокарб, хлорпрофам, хлорсульфурон, хлортал, хлортал-диметил, хлортал-монометил, хлортіамід, цинідон-етил, цинметилін, циносульфурон, цисанілід, клетодим, кліодинат, клодинафоп, клодинафоп-пропаргіл, клофоп, клофоп-ізобутил, кломазон, кломепроп, клопроп, клопроксидим, клопіралід, клопіралід-метил, клопіралід-оламін, клопіралід-калій, клопіралід-трис(2-гідроксипропіл)амоній, клорансулам, клорансулам-метил, СМА, сульфат міді, СРМФ, СРРС, кредазин, крезол, кумілурун, ціанамід, ціанатрин, ціаназин, циклоат, циклосульфамурон, циклоксидим, циклурун, цигалофоп, цигалофоп-бутил, циперкват, циперкват хлорид, ципразин, ципразол, ципромід, даімурун, далапон, далапон-кальцій, далапон-магній, далапон-натрій, дазомет, дазомет-натрій, делахлор, десмедифам, десметрин, ди-алат, диамба, диамба-диметиламоній, диамба-діоламін, диамба-ізопропіламоній, диамба-метил, диамба-оламін, диамба-калій, диамба-натрій, диамба-троламін, дихлобеніл, дихлоралсечовина, дихлормат, дихлорпроп, дихлорпроп-2-етилгексил, дихлорпроп-бутотил, дихлорпроп-диметиламоній, дихлорпроп-етиламоній, дихлорпроп-ізоктил, дихлорпроп-метил, дихлорпроп-Р, дихлорпроп-п-диметиламоній, дихлорпроп-калій, дихлорпроп-натрій, диклофоп, диклофоп-метил, диклосулам, діетамкват, діетамкват дихлорид, діетатил, діетатил-етил, дифенопентен, дифенопентен-етил, дифеноксурон, дифензокват, дифензокват метилсульфат, дифлуфенікан, дифлуфензопір, дифлуфензопір-натрій, димефурон, димепіперат, диметахлор, диметаметрин, диметенамід, диметенамід-Р, димексано, димідазон, динітрамін, динофенат, динопроп, диносам, диносеб, диносеб ацетат, диносеб-амоній, диносеб-діоламін, диносеб-натрій, диносеб-троламін, динотерб, динотерб ацетат, дифацинон-натрій, дифенамід, дипропетрин, дикват, дикват дибромід, дисул, дисул-натрій, дитіопір, діурон, DMPA, DNOC, DNOC-амоній, DNOC-калій, DNOC-натрій, DSMA, ЕВЕР, егліназин, егліназин-етил, ендотал, ендотал-діамоній, ендотал-дикалій, ендотал-динатрій, епроназ, ЕРТС, ербон, еспрокарб, еталфлуралвн, етаметсульфурон, етаметсульфурон-метил, етидимурон, етіолат, етофумесат, етоксифен, етоксифен-етил, етоксисульфурон, етинофен, етніпромід, етобензанід, EXD, фенасулам, фенопроп, фенопроп-3-бутоксипропіл, фенопроп-бутометил, фенопроп-бутотил, фенопроп-бутил, фенопроп-ізоктил, фенопроп-метил, фенопроп-калій, феноксапроп, феноксапроп-етил, феноксапроп-Р, феноксапроп-п-етил, феноксасульфон, фентеракол, фентіапроп, фентіапроп-етил, фентразамід, фенурун, фенурун ТСА, сульфат заліза, флампроп, флампроп-ізопропіл, флампроп-М, флампроп-метил, флампроп-М-ізопропіл, флампроп-М-щметил, флазасульфурон, флорасулам, флуазифоп, флуазифоп-бутил, флуазифоп-метил, флуазифоп-Р, флуазифоп-п-бутил, флуазолат, флукарбазон, флукарбазон-натрій, флуцетосульфурон, флухлоралін, флуфенацет, флуфенікан, флуфенпір, флуфенпір-етил, флуметсулам, флумезин, флуміклорак, флуміклорак-пентил, флуміоксазин, флуміпропін, флуометурон, фтордифен, фторглікофен, фторглікофен-етил, фтормідин, фторнітрофен, флуотіурон, флуороксам, флупропацил, флупропанат, флупропанат-натрій, флупірсульфурон, флупірсульфурон-метил-натрій, флуридон, флурохлоридон, флуороксіпір, флуороксіпір-бутометил, флуороксіпір-метил, флуртамон, флутіацет, флутіацет-метил, фомезафен, фомезафен-натрій, форамсульфурон, фосамін, фосамін-амоній, фурилоксифен, глуфосинат, глуфосинат-амоній, глуфосинат-Р, глуфосинат-Р-амоній, глуфосинат-Р-натрій, гліфосат, гліфосат-діамоній, гліфосат-диметиламоній, гліфосат-ізопропіламоній, гліфосат-моноамоній, гліфосат-калій, гліфосат-сесквінатрій, гліфосат-тримезіум, галосафен, галосульфурон, галосульфурон-метил, галоксидин, галоксифоп, галоксифоп-етотил, галоксифоп-метил, галоксифоп-Р, галоксифоп-Р-етотіл, галоксифоп-Р-метил, галоксифоп-натрій, гексахлорацетон, гексафлурат, гексазинон, імазаметабенз, імазаметабенз-метил, імазамокс, імазамокс-амоній, імазапек, імазапек-амоній, імазапек, імазапек-ізопропіламоній, імазахін, імазахін-амоній, імазахін-метил, імазахін-натрій, імазетапек, імазетапек-амоній, імазосульфурон, інданофан, індазифлам, йодобоніл, йодметан, йодсульфурон, йодсульфурон-метил-натрій, йофенсульфурон, іоксиніл, іоксиніл октаноат, іоксиніл-літій, іоксиніл-натрій, іпазин, іпфенкарбазон, іпримідам, ізокарбамід, ізоцил, ізометіозин, ізонорурон, ізополінат, ізопропалін, ізопротурон, ізоурон, ізоксабен, ізоксахлортол, ізоксафлутол, ізоксапірифоп, карбутилат, кетоспірадокс, лактофен, ленацил, лінурун, МАА, МАМА, МСРА, МСРА-2-етилгексил, МСРА-бутотил, МСРА-бутил, МСРА-диметиламоній, МСРА-діоламін, МСРА-етил, МСРА-ізобутил, МСРА-ізоктил, МСРА-ізопропіл, МСРА-метил, МСРА-оламін, МСРА-калій, МСРА-натрій, МСРА-тіоетил, МСРА-троламін, МСРВ, МСРВ-етил, МСРВ-метил, МСРВ-натрій, мекопроп, мекопроп-2-етилгексил, мекопроп-диметиламоній, мекопроп-діоламін, мекопроп-етадил, мекопроп-ізоктил, мекопроп-метил, мекопроп-Р, мекопроп-Р-діметиламоній, мекопроп-Р-ізобутил, мекопроп-калій, мекопроп-Р-калій, мекопроп-натрій, мекопроп-троламін, мединотерб, мединотерб ацетат, мефенацет, мефлуїдид, мефлуїдид-

діоламін, мефлуїдид-калій, мезопразин, мезосульфурон, мезосульфурон-метил, мезотрион, метам, метам-амоній, метаміфоп, метамітрон, метам-калій, метам-натрій, метазаклор, метазосульфурон, метфлуразон, метабензтіазурон, металпропалін, метазол, метіобенкарб, метіозолін, метіурон, метометон, метопротрин, метилбромід, метилізотіоціанат, метилдимрон, метобензулон, метолахлор, метосулам, метоксурон, метрибузин, метсульфурон, метсульфурон-метил, молінат, моналід, монісоурон, монохлороцтова кислота, монолінулон, монурон, монурон ТСА, морфамкват, морфамкват дихлорид, MSMA, напроанілід, напропамід, напалам, напалам-натрій, небурон, нікосульфурон, ніпіраклофен, нітралін, нітрофен, нітрофторфен, норфлуразон, норурон, ОСН, орбенкарб, орто-дихлорбензол, ортосульфамурон, оризалін, оксадіаргіл, оксадіазон, оксапіразон, оксапіразон-димоламін, оксапіразон-натрій, оксасульфурон, оксасикломефон, оксифторфен, парафлулон, паракват, паракват дихлорид, паракват диметилсульфат, пебулат, пеларгонова кислота, пендиметалін, пенноксулам, пентахлорфенол, пентанохлор, пентоксазон, перфлуїдон, петоксамід, фенізофам, фенмедифам, фенмедифам-етил, фенобензулон, ацетат фенілтруті, піклорам, піклорам-2-етилгексил, піклорам-ізоктил, піклорам-метил, піклорам-оламін, піклорам-калій, піклорам-триетиламоній, піклорам-трис(2-гідроксипропіл)амоній, піколінафен, пінокаден, піперофос, арсеніт калію, азид калію, ціанат калію, претілахлор, піримсульфурон, піримсульфурон-метил, просуазин, продіамін, профлуазол, профлулалін, профоксидим, прогліназин, прогліназин-етил, прометон, прометрин, пропахлор, пропаніл, пропаквізафоп, пропазин, профам, пропізохлор, пропоксикарбазон, пропоксикарбазон-натрій, пропірисульфурон, пропізамід, просульфалін, просульфокарб, просульфурон, проксан, проксан-натрій, принахлор, піданон, піраклоніл, пірафлуфен, пірафлуфен-етил, пірасульфотол, піразолінат, піразосульфурон, піразосульфурон-етил, піразоксифен, пірибензоксим, пірибутикарб, пірикlor, піридафол, піридат, пірифталід, піримінобак, піримінобак-метил, піримісульфан, піритіобак, піритіобак-натрій, піроксасульфон, піроксулам, хінклорак, хінмерак, хінокламін, хінонамід, квізалофоп, квізалофоп-етил, квізалофоп-Р, квізалофоп-Р-етил, квізалофоп-Р-тефурил, родетаніл, римсульфурон, сафлуфенацил, себутилазин, секбуметон, сетоксидим, сидурон, симазин, симетон, симетрин, SMA, S-метолахлор, арсеніт натрію, азид натрію, хлорат натрію, сулкотрион, сульфалат, сульфентразон, сульфометурон, сульфометурон-метил, сульфосульфурон, сірчана кислота, сулглікапін, свеп, ТСА, ТСА-амоній, ТСА-кальцій, ТСА-етадил, ТСА-магній, ТСА-натрій, тебутам, тебутіурон, тефурилтрион, темботрион, тепралоксидим, тербацил, тербукарб, тербухлор, тербуметон, тербутилазин, тербутрин, тетрафлулон, тенілхлор, тіазафлулон, тіазопір, тіадіазимін, тидіазурон, тієнкарбазон, тієнкарбазон-метил, тифенсульфурон, тифенсульфурон-метил, тіобенкарб, тіокарбазил, тіоклорим, топрамезон, тралоксидим, три-алат, триасульфурон, триазифлам, трибенурон, трибенурон-метил, трикамба, триклопір, триклопір-бутотил, триклопір-етил, триклопір-триетиламоній, тридифан, триетазин, трифлорисульфурон, трифлорисульфурон-натрій, трифлулалін, трифлусульфурон, трифлусульфурон-метил, трифоп, трифоп-метил, трифопсиме, тригідрокситриазин, триметурон, трипропіндан, тритак, тритосульфурон, вернолат, ксилахлор, (всі разом ці гербіциди, що мають традиційні назви, визначені як "група гербіцидів").

БІОПЕСТИЦИДИ

Сполуку формули 1 також можна використовувати в комбінації (наприклад, в композиційній суміші або для одночасного або послідовного нанесення) з одним або декількома біопестицидами. Термін "біопестицид" використовують як бактеріальні біологічні засоби боротьби зі шкідниками, які застосовують таким же чином, як і хімічні пестициди. Як правило, вони є бактеріальними, але також є приклади грибових засобів, включаючи *Trichoderma* spp. і *Ampelomyces quisqualis* (засіб для боротьби з даною борошнистою росою винограду). *Bacillus subtilis* використовують для боротьби з фітопатогенами. Для боротьби з бур'янами і гризунами також використовують бактеріальні засоби. Одним добре відомим прикладом інсектициду є *Bacillus thuringiensis* - бактеріальне захворювання лускокрилих (Lepidoptera), жорсткокрилих (Coleoptera) і двокрилих (Diptera). Оскільки він не чинить якої-небудь істотної дії на інші організми, він вважається більш екологічно сприятливим, ніж синтетичні пестициди. Біологічні інсектициди включають продукти на основі:

1. ентомопатогенних грибів (наприклад, *Metarhizium anisopliae*);
2. ентомопатогенних нематод (наприклад, *Steinernema feltiae*); і
3. ентомопатогенних вірусів (наприклад, грануловірус *Cydia pomonella*).

Інші приклади ентомопатогенних організмів включають, але не обмежуються ними, бакуловіруси, бактерії і інші прокаріотні організми, гриби, протозойні і *Microsporidia*. Інсектициди, що мають біологічне походження, включають, але не обмежуються ними, ротенон, вератридин, а також бактеріальні токсини; стійкі або резистентні до комах різновиди рослин; і

організми, модифіковані з використанням методу рекомбінантної ДНК, або для продукції інсектицидів, або для надання властивості резистентності до комах генетично модифікованому організму. В одному варіанті здійснення сполуки формули 1 можна використовувати з одним або декількома біопестицидами на ділянці обробки насіння і поліпшення ґрунту. The Manual of Biocontrol Agents представляє огляд наявних біологічних інсектицидних (і інших біологічних засобів боротьби) продуктів. Copping L.G. (ed.) (2004). The Manual of Biocontrol Agents (раніше називався Biopesticide Manual) 3rd Edition. British Crop Production Council (BCPC), Farnham, Surrey UK.

ІНШІ АКТИВНІ СПОЛУКИ

Сполуки формули 1 також можна використовувати в комбінації (наприклад, в композиційній суміші або для одночасного або послідовного нанесення) з однією або декількома з наступних сполук, таких як:

1. 3-(4- хлор-2,6-диметилфеніл)-4-гідрокси-8-окса-1-азаспіро[4,5]дец-3-ен-2-он;
2. 3-(4'- хлор-2,4-диметил[1,1'-біфеніл]-3-іл)-4- гідрокси-8-окса-1-азаспіро[4,5]дец-3-ен-2-он;
3. 4-[[[6-хлор-3-піридиніл)метил]метиламіно]-2(5H)-фуранон;
4. 4-[[[6- хлор-3-піридиніл)метил]циклопропіламіно]-2(5H)-фуранон;
5. 3-хлор-N2-[(1S)-1-метил-2-(метилсульфоніл)етил]-N1-[2-метил-4-[1,2,2,2-тетрафтор-1-(трифторметил)етил]феніл]-1,2-бензолдикарбоксамід;
6. 2-ціано-N-етил-4-фтор-3-метоксибензолсульфонамід;
7. 2-ціано-N-етил-3-метоксибензолсульфонамід;
8. 2-ціано-3-дифторметокси-N-етил-4-фторбензолсульфонамід;
9. 2-ціано-3-фторметокси-N-етилбензолсульфонамід;
10. 2-ціано-6-фтор-3-метокси-N, N-диметилбензолсульфонамід;
11. 2-ціано-N-етил-6-фтор-3-метокси-N-метилбензолсульфонамід;
12. 2-ціано-3-дифторметокси-N, N-диметилбензолсульфонамід;
13. 3-(дифторметил)-N-[2-(3,3-диметилбутил)феніл]-1-метил-1H-піразол-4-карбоксамід;
14. N-етил-2,2-диметилпропіонамід-2-(2,6-дихлор- α,α,α -трифтор-п-толіл)гідразон;
15. N-етил-2,2-дихлор-1-метилциклопропанкарбоксамід-2-(2,6-дихлор- α,α,α -трифтор-п-толіл)гідразоннікотин;
16. O-[(E)-[2-(4-хлорфеніл)-2-ціано-1-(2-трифторметилфеніл)вініл]]-S-метилтіокарбонат;
17. (E)-N1-[(2-хлор-1,3-тіазол-5-ілметил)]- N2-ціано-N1-метилацетамідин;
18. 1-(6-хлорпіридин-3-ілметил)-7-метил-8-нітро-1,2,3,5,6,7-гексагідроімідазо[1,2-a]піридин-5-ол;
19. 4-[4-хлорфеніл-(2-бутилідингідразоно)метил)]фенілмезилат і
20. N-Етил-2,2-дихлор-1-метилциклопропанкарбоксамід-2-(2,6-дихлор-альфа, альфа, альфа-трифтор-п-толіл)гідразон.

Сполуки формули 1 також можна використовувати в комбінації (наприклад, в композиційній суміші або для одночасного або послідовного нанесення) з однією або декількома сполуками в наступних групах: альгіциди, шкідливі для комах поживні речовини, що містяться в рослинах, авіциди, бактерициди, засоби, що лякають птахів, хімічні стерилізатори, антидоди гербіцидів, аттрактанти для комах, репеленти для комах, репеленти для ссавців, засоби, що перешкоджають спаровуванню, молюскіциди, активатори росту рослин, регулятори росту рослин, родентициди і/або віруліцидні засоби (всі разом ці групи, що мають традиційні назви, визначені як "A1 група"). Необхідно зазначити, що сполуки, що входять до A1 групи, групи інсектицидів, групи фунгіцидів, групи гербіцидів, групи акарицидів або групи нематоцидів, можуть належати до декількох груп, оскільки сполука має декілька типів активності. Більш докладну інформацію див. в "COMPENDIUM OF PESTICIDE COMMON NAMES", розміщеному на <http://www.alanwood.net/pesticides/index.html>. Також можна знайти інформацію в "THE PESTICIDE MANUAL" 14th Edition, edited by CDS Tomlin, copyright 2006 by British Crop Production Council, або в більш ранніх або попередніх виданнях даної публікації.

СИНЕРГІЧНІ СУМІШІ І СИНЕРГІСТИ

Сполуки формули 1 можна використовувати із сполуками, що входять до групи інсектицидів, для отримання синергічних сумішей, де спосіб дії таких сполук в порівнянні зі способом дії сполук формули 1 є таким же, подібним або відмінним. Приклади способів дії включають, але не обмежуються ними: інгібітор ацетилхолінестерази; модулятор натрієвих каналів; інгібітор біосинтезу хітину; антагоніст GABA-залежних ворітних хлоридних каналів; агоніст GABA і глутамат-залежних ворітних хлоридних каналів; агоніст ацетилхолінового рецептора; інгібітор MET I; інгібітор Mg-стимульованої АТФази; нікотинний ацетилхоліновий рецептор; руйнівник мембрани тонкого кишечника; порушник окиснювального фосфорилування і рецептор ріодоніну (R_yR). Крім того, сполуки формули 1 можна використовувати із сполуками, що входять до групи

фунгіцидів, групи акарицидів, групи гербіцидів або групи нематоцидів, для отримання синергічних сумішей. Крім того, сполуки формули 1 можна використовувати з іншими активними сполуками, такими як сполуки, вказані як "ІНШІ АКТИВНІ СПОЛУКИ", альгіциди, авіциди, бактерициди, моллюскіциди, родентициди, віруліцидні засоби, антидоди гербіцидів, ад'юванти і/або поверхнево-активні речовини, для отримання синергічних сумішей. Як правило, масові співвідношення сполук формули 1 в синергічній суміші з іншою сполукою становлять від близько 10:1 до близько 1:10, переважно від близько 5:1 до близько 1:5, і більш переважно від близько 3:1, і ще більш переважно близько 1:1. Крім того, наступні сполуки є відомими як синергісти, і їх можна використовувати із сполуками, описаними в формулі 1: піпероніл бутоксид, піпротал, пропіл ізом, сесамекс, сесамолін, сульфоксид і трибуфос (всі разом ці синергісти визначені як "група синергістів").

КОМПОЗИЦІЇ

Пестицид рідко є прийнятним для нанесення його в чистій формі. Звичайно необхідно додати до нього інші речовини, щоб можна було використовувати пестицид в необхідній концентрації і у прийнятній формі, забезпечуючи простоту нанесення, поводження з препаратом, транспортування, зберігання і максимальну пестицидну активність. Таким чином, пестициди формують, наприклад, у вигляді приманок, концентрованих емульсій, дустів, концентратів, що емульгуються, фумігантів, гелів, гранул, мікроінкапсульованих препаратів, для обробки насіння, концентратів, що суспендуються, суспоемульсій, таблеток, водорозчинних рідин, гранул, що диспергуються водою, або сухих текучих речовин, змочуваних порошків і розчинів надмалого об'єму. Більш докладну інформацію, що стосується типів композицій, див. в "Catalogue of Pesticide Formulation Types and International Coding System" Technical Monograph n°2, 5th Edition by CropLife International (2002).

Пестициди найчастіше наносять у вигляді водних суспензій або емульсій, отриманих з концентрованих складів таких пестицидів. Такі склади, що розчиняються водою, суспендуються водою або емульгуються, являють собою або тверді речовини, звичайно відомі як змочувані порошки, або гранули або рідини, що диспергуються водою, звичайно відомі як концентрати або водні суспензії, що емульгуються. Змочувані порошки, які можуть бути спресовані з утворенням гранул, що диспергуються водою, включають тісну суміш пестициду, носія і поверхнево-активних речовин. Концентрація пестициду звичайно становить від близько 10 % до близько 90 % маси. Носій звичайно вибирають з таких речовин, як атапульгітові глини, монтморилонітові глини, діатомові землі або очищені силікати. Ефективні поверхнево-активні речовини, що складають від близько 0,5 % до близько 10 % змочуваного порошку, вибирають з таких речовин, як сульфоновані лігніни, конденсовані нафталінсульфонати, нафталінсульфонати, алкілбензолсульфонати, алкілсульфати і неіонні поверхнево-активні речовини, такі як етиленоксидні продукти приєднання алкілфенолів.

Концентрати пестицидів, що емульгуються, включають зручну концентрацію пестициду, таку як від близько 50 до близько 500 грам на літр рідини, розчиненої в носії, який являє собою або розчинник, що змішується з водою, або суміш органічного розчинника, що не змішується з водою, і емульгаторів. Корисні органічні розчинники включають сполуки ароматичного ряду, зокрема, ксилоли і нафтові фракції, зокрема, висококиплячу нафталінову і олефінову фракції нафти, такі як важка ароматична нафта. Також можна використовувати інші органічні розчинники, такі як терпенові розчинники, включаючи похідні каніфолі, аліфатичні кетони, такі як циклогексанон, і комплексні спирти, такі як 2-етоксіетанол. Прийнятні емульгатори для концентратів, що емульгуються, вибирають із звичайних аніонних і неіонних поверхнево-активних речовин.

Водні суспензії включають суспензії нерозчинних у воді пестицидів, диспергованих у водному носії при концентрації в межах від близько 5 % до близько 50 % маси. Суспензії отримують шляхом тонкого подрібнення пестициду і інтенсивного змішування його з носієм, що складається з води і поверхнево-активних речовин. Інгредієнти, такі як неорганічні солі і синтетичні або природні смоли, також можуть бути додані, для підвищення густини і в'язкості водного носія. Найбільш ефективним часто буває подрібнення і змішування пестициду одночасне з отриманням водної суміші і її гомогенізації в пристрої, такому як піщаний млин, кульовий млин або поршневий гомогенізатор.

Пестициди також можна наносити у вигляді гранульованих композицій, які особливо корисні для нанесення на ґрунт. Гранульовані композиції звичайно містять від близько 0,5 % до близько 10 % мас. пестициду, диспергованого в носії, який включає глину або подібну речовину. Такі композиції звичайно отримують шляхом розчинення пестициду у прийнятному розчиннику і нанесення його на гранульований носій, який був заздалегідь сформований таким чином, щоб він мав прийнятний розмір частинок в межах від близько 0,5 до близько 3 мм. Такі композиції

також можуть бути сформульовані при отриманні тістоподібної або пастоподібної маси з носія і сполуки і подрібненні й сушінні, з отриманням бажаного розміру гранульованих частинок.

Дусти, що містять пестицид, отримують шляхом тісного змішування пестициду в порошкоподібній формі з прийнятним роздрібненим сільськогосподарським носієм, таким як
5 каолінова глина, подрібнена вулканічна порода і подібні. Дусти прийнятним чином можуть містити від близько 1 % до близько 10 % пестициду. Їх можна наносити на насіння у вигляді покриття або шляхом нанесення на листя з використанням машини для опудрювання.

Також з практичної точки зору вигідно наносити пестицид в формі розчину у прийнятному органічному розчиннику, звичайно в мінеральному маслі, такому як масла, що розбризкуються,
10 які широко використовуються в сільськогосподарській хімії.

Пестициди також можна наносити в формі аерозольної композиції. У таких композиціях пестицид розчинений або диспергований в носії, який являє собою суміш, що утворюється під тиском пропеленту. Аерозольну композицію упаковують в контейнер, з якого суміш розподіляють через розпилюючий клапан.

15 Пестицидні приманки утворюються, коли пестицид змішують з їжею або аттрактантом, або і тим, і іншим. Коли шкідники з'їдають приманку, вони також поглинають пестицид. Приманки можуть бути в формі гранул, гелів, текучих порошків, рідин або твердих речовин. Їх можна використовувати в житлах шкідників.

Фуміганти являють собою пестициди, які мають відносно високий тиск парів і, отже, можуть
20 бути присутніми у вигляді газу в достатніх концентраціях для знищення шкідників в ґрунті або закритих просторах. Токсичність фуміганта пропорційна його концентрації і часу впливу. Вони характеризуються хорошою здатністю для дифузії і діють шляхом penetрації в дихальну систему шкідника або шляхом абсорбції через шкірку шкідника. Фуміганти застосовують для боротьби зі шкідниками харчових продуктів, що зберігаються під газовими непроникними
25 оболонками, в газонепроникних кімнатах або спорудах або в спеціальних камерах.

Пестициди можуть бути мікроінкапсульовані шляхом суспендування частинок або крапельок пестициду в полімерних пластиках різних типів. Шляхом зміни хімічного складу полімеру або шляхом зміни факторів в процесі переробки можуть бути отримані мікрокапсули з різними
30 розмірами, розчинністю, товщиною оболонки і ступенем проникності. Ці фактори визначають швидкість, з якою вивільняється активний інгредієнт, що міститься в капсулі, що, в свою чергу, впливає на залишкові експлуатаційні характеристики, швидкість дії і запах продукту.

Концентрати масляних розчинів отримують шляхом розчинення пестициду в розчиннику, який буде втримувати пестицид в розчині. Масляні розчини пестициду звичайно забезпечують більш швидку нищівну дію і знищення шкідників в порівнянні з іншими складами, оскільки самі
35 розчинники мають пестицидну дію, і розчинення воскового покриття панцира збільшує швидкість поглинання пестициду. Інші переваги масляних розчинів включають кращу стабільність при зберіганні, кращу penetрацію через тріщини і кращу адгезію до слизьких поверхонь.

Інший варіант здійснення являє собою емульсію масло-в-воді, де така емульсія включає
40 масляні крапельки, кожна з яких має пошарове рідкокристалічне покриття, і які дисперговані у водній фазі, де кожна масляна крапелька включає, щонайменше, одну сполуку, яка є посільськогосподарському активною, і кожна покрита моноламельярним або оліголамельярним шаром, що включає: (1) щонайменше, одну неіонну ліпофільну поверхнево-активну речовину, (2) щонайменше, одну неіонну гідрофільну поверхнево-активну речовину і (3), щонайменше,
45 одну іонну поверхнево-активну речовину, де крапельки мають середній діаметр частинок менш ніж 800 нанометрів. Додаткова інформація, що стосується даного варіанту здійснення, розкрита в патентній публікації США № 20070027034, опублікованій 1 лютого 2007 року, з серійним номером патентної публікації 11/495228. Для простоти використання, цей варіант здійснення буде вказаний як "OIWE".

Додаткову інформацію можна знайти в "Insect Pest Management" 2nd Edition by D. Dent, copyright CAB International (2000). Крім того, більш докладну інформацію можна знайти в "Handbook of Pest Control-The Behavior, Life History and Control of Household Pests" by Arnold Mallis, 9th Edition, copyright 2004 by GIE Media Inc.

ІНШІ КОМПОНЕНТИ КОМПОЗИЦІЇ

55 Як правило, коли сполуки, описані в формулі 1, використовують в композиції, така композиція також може містити інші компоненти. Ці компоненти включають, але не обмежуються ними (це не є вичерпним взаємовиключаючим переліком), змочувальні речовини, речовини, що сприяють розподілу, клейкі речовини, речовини, що полегшують penetрацію, буфери, зв'язувальні речовини, агенти, що зменшують зміщення, агенти сумісності,
60 протистіпнювальні речовини, очищувачі і емульгатори. Деякі компоненти описані нижче.

Змочувальна речовина являє собою речовину, яка при додаванні до рідини збільшує здатність розподілу або penetрації рідини шляхом зменшення натягу на поверхні розділу між рідиною і поверхнею, на якій вона розподіляється. Змочувальні речовини використовують для двох основних функцій в композиціях агрохімікатів: в процесі переробки і отримання для збільшення швидкості змочування порошків у воді для отримання концентратів для розчинних рідин або концентратів суспензій; і в процесі змішування продукту з водою в розпилювальному резервуарі для зменшення часу змочування змочуваних порошків і для поліпшення penetрації води у вододисперговані гранули. Приклади змочувальних речовин, що використовуються в композиціях змочуваних порошків, концентратів, що суспендуються, і гранул, що диспергуються водою, являють собою наступні: лаурилсульфат натрію; діоктилсульфосукцинат натрію; алкілфенолетоксилати і етоксилати аліфатичних спиртів.

Диспергуюча речовина являє собою речовину, яка адсорбується на поверхні частинок і допомагає зберегти стан дисперсії частинок і запобігає їх повторній агрегації. Диспергуючі речовини додають до композицій агрохімікатів для полегшення диспергування і суспендування в процесі отримання композицій і для забезпечення повторного диспергування частинок у воді в розпилювальному резервуарі. Їх широко використовують в змочуваних порошках, концентратах, що суспендуються, і гранулах, що диспергуються водою. Поверхнево-активні речовини, які використовують як диспергуючі речовини, мають здатність сильно адсорбуватися на поверхні частинок і забезпечують заряджений або просторовий бар'єр для повторної агрегації частинок. Поверхнево-активними речовинами, що найбільш широко використовуються, є аніонні, неіонні речовини або суміші цих двох типів речовин. Для композицій змочуваних порошків диспергуючі речовини, що найбільш широко використовуються, являють собою лігносульфонати натрію. Що стосується концентратів, що суспендуються, дуже хорошу адсорбцію і стабілізацію отримують з використанням поліелектролітів, таких як конденсати нафталінсульфонату натрію з формальдегідом. Також використовують тристирилфенолетоксилат фосфатний складний ефір. Неіонні речовини, такі як алкіларилетиленоксидні конденсати і EO-PO блок-співполімери іноді об'єднують з аніонними речовинами як диспергуючими речовинами для концентратів, що суспендуються. В останні роки були розроблені нові типи дуже високомолекулярних полімерних поверхнево-активних речовин як диспергуючих речовин. Вони мають дуже довгі гідрофобні 'скелети' і велику кількість етиленоксидних ланцюгів, що утворюють 'зубці' 'гребінчастої' поверхнево-активної речовини. Ці високомолекулярні полімери можуть забезпечувати дуже хорошу тривалу стабільність концентратів, що суспендуються, оскільки гідрофобні скелети мають множину точок прикріплення на поверхнях частинок. Приклади диспергуючих речовин, що використовуються в композиціях агрохімікатів, включають наступні: лігносульфонати натрію; конденсати нафталінсульфонату натрію з формальдегідом; тристирилфенолетоксилат фосфатні складні ефіри; етоксилати аліфатичних спиртів; алкілетоксилати; EO-PO блок-співполімери і прищеплені співполімери.

Емульгатор являє собою речовину, яка стабілізує суспензію крапельок однієї рідкої фази в іншій рідкій фазі. Без емульгатора дві рідини будуть розділитися на дві рідкі фази, що не змішуються. Суміші емульгаторів, що найбільш широко використовуються, містять алкілфенол або аліфатичний спирт з дванадцятьма або більше етиленоксидними ланками і масло-розчинну кальцієву сіль додецилбензолсульфонові кислоти. Значення гідрофільно-ліпофільного балансу ("ГЛБ") в межах від 8 до 18 звичайно забезпечують хороші стабільні емульсії. Стабільність емульсії іноді можна поліпшити шляхом додавання невеликої кількості EO-PO блок-співполімеру як поверхнево-активної речовини.

Солюбілізує агент являє собою поверхнево-активну речовину, яка буде утворювати міцели у воді при концентраціях вище критичної концентрації міцел. Міцели потім можуть розчиняти або солюбілізувати нерозчинні у воді речовини всередині гідрофобної частини міцели. Типи поверхнево-активних речовин, що звичайно використовуються для солюбілізації, являють собою неіонні речовини, сорбітанмоноолеати, сорбітанмоноолеатетоксилати і метилолеатні складні ефіри.

Іноді використовують поверхнево-активні речовини, або окремо, або з іншими добавками, такими як мінеральні або рослинні масла як ад'юванти для розбризкування з сумішшю резервуара для поліпшення біологічної активності пестициду на мішені. Типи поверхнево-активних речовин, що використовуються для посилення біологічної активності, як правило, залежать від природи і способу дії пестициду. Однак часто вони являють собою неіонні речовини, такі як: алкілетоксилати; етоксилати аліфатичних спиртів з лінійним ланцюгом; аліфатичні амінетоксилати.

Носій або розріджувач в сільськогосподарській композиції являє собою речовину, що додається до пестициду для отримання продукту необхідної концентрації. Носії звичайно

являють собою речовини з високою абсорбційною здатністю, тоді як розріджувачі звичайно являють собою речовини з низькою абсорбційною здатністю. Носії і розріджувачі використовують в композиціях дустів, змочуваних порошків, гранул і гранул, що диспергуються водою.

5 Органічні розчинники використовують в основному в композиціях концентратів, що емульгуються, емульсій масло-в-воді, суспоемульсій і композиціях надмалого об'єму і, в меншій мірі, в гранульованих композиціях. Іноді використовують суміші розчинників. Перша основна група розчинників включає аліфатичні парафінові масла, такі як гас або очищені парафіни. Друга основна група (і найбільш традиційна) включає ароматичні розчинники, такі як ксилол і

10 більш високомолекулярні фракції C9 і C10 ароматичних розчинників. Хлоровані вуглеводні є корисними як співрозчинники для запобігання кристалізації пестицидів при емульгуванні композиції у воді. Спирти іноді використовують як співрозчинники для поліпшення дії розчинника. Інші розчинники можуть включати рослинні олії, олії з насіння рослин і складні ефіри рослинних і отриманих з насіння олій.

15 Загусники або гелеутворювальні агенти використовують головним чином в композиціях концентратів, емульсій і суспоемульсій, що суспендуються, для модифікації реологічних властивостей або властивостей текучості рідини і для запобігання розділенню і осадженню диспергованих частинок або крапель. Загусники, гелеутворювальні і речовини, що оберігають від осадження, як правило, поділяються на дві категорії, зокрема, нерозчинні у воді тверді частинки і водорозчинні полімери. Можна отримати композиції концентратів, що суспендуються,

20 з використанням глини і кремнезему. Приклади таких типів речовин включають, але не обмежуються ними, монтморилоніт, бентоніт, алюмосилікат магнію і атапульгіт. Водорозчинні полісахариди використовують як загущувальні-гелеутворювальні агенти вже багато років. Типи полісахаридів, що найбільш широко використовуються, включають природні екстракти з насіння і морських водоростей або синтетичні похідні целюлози. Приклади таких типів речовин включають, але не обмежуються ними, гуарову камедь; камедь з плодів річкового дерева; караген; альгінати; метилцелюлозу; натрієву сіль карбоксиметилцелюлози (SCMC); гідроксietилцелюлозу (HEC). Інші типи речовин, що оберігають від осадження, засновані на модифікованому крохмалі, поліакрилатах, полівініловому спирті і поліетиленоксиді. Ще однією речовиною, що добре оберігають від осадження, є ксантанова камедь.

Мікроорганізми можуть викликати псування або гниття отриманих формулюванням продуктів. Тому для усунення або зменшення їх дії використовують консерванти. Приклади таких речовин включають, але не обмежуються ними: пропіонову кислоту і її натрієву сіль; сорбінову кислоту і її натрієву або калієву сіль; бензойну кислоту і її натрієву сіль; натрієву сіль п-оксибензойної кислоти; метил-п-гідроксibenзоат і 1,2-бензизотіазолін-3-он (BIT).

35

Присутність поверхнево-активних речовин часто спричиняє спінування композицій на водній основі в процесі змішування при отриманні композицій і при нанесенні через розпилювальний резервуар. Для зменшення тенденції до спінування часто додають протиспінувальні агенти або на стадії отримання композицій, або перед розподілом в бутлі. В основному, існують два

40 типи протиспінувальних агентів: силікони і не-силікони. Силікони звичайно являють собою водні емульсії диметилполісиліоксану, тоді як не-силіконові протиспінувальні агенти являють собою нерозчинні у воді масла, такі як останол і нонанол, або діоксид кремнію. В обох випадках, функцією протиспінувального агента є витіснення поверхнево-активної речовини з поверхні розділу повітря-вода.

45 "Зелені" (тобто екологічно чисті) речовини (наприклад, ад'юванти, поверхнево-активні речовини, розчинники) можуть зменшити загальний вплив на навколишнє середовище композицій, що захищають сільськогосподарські культури. Екологічно чисті засоби є такими, що біологічно розкладаються, і їх, як правило, отримують з природних і/або джерел, що безперервно поповнюються, наприклад, рослинних і тваринних джерел. Конкретні приклади включають: рослинні олії, олії, отримані з насіння, і їх складні ефіри, а також алкоксильовані алкілполіглюкозиди.

Додаткову інформацію див. в "Chemistry and Technology of Agrochemicals Formulations" edited by D.A. Knowles, copyright 1998 by Kluwer Academic Publishers. Також див. "Insecticides in Agriculture and Environment-Retrospects and Prospects" by A.S. Perry, I. Yamamoto, I. Ishaaya and

55 R. Perry, copyright 1998 by Springer-Verlag.

ШКІДНИКИ

Як правило, сполуки формули 1 можна використовувати для боротьби зі шкідниками, наприклад, жуками, щипавками, тарганами, двокрилими комахами, тлею, лускатими, білокрилками, цикадками, мурашками, осаами, термітами, міллю, метеликами, вошами,

кониками, сараною перелітною, цвіркунами, блохами, трипсами, щетинохвістками, клопами, кліщами, нематодами і симфілами.

В іншому варіанті здійснення сполуки формули 1 можна використовувати для боротьби зі шкідниками, що належать до таких типів як нематоди (*Nematoda*) і/або членистоногі (5 *Arthropoda*).

В іншому варіанті здійснення сполуки формули 1 можна використовувати для боротьби зі шкідниками, що належать до таких підтипів як хеліцерові (*Chelicerata*), багатоніжки (*Myriapoda*) і/або шестиногі (*Hexapoda*).

В іншому варіанті здійснення сполуки формули 1 можна використовувати для боротьби зі шкідниками, що належать до класів павукоподібних (*Arachnida*), симфіл (*Symphyla*) і/або комах (10 *Insecta*).

В іншому варіанті здійснення сполуки формули 1 можна використовувати для боротьби зі шкідниками загону вошів (*Anoplura*). Перелік конкретних родів, що не є вичерпним, включає, але не обмежується ними, *Haematopinus* spp., *Noroplopleura* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp. і 15 *Polyplax* spp. Перелік конкретних видів, що не є вичерпним, включає, але не обмежується ними, *Haematopinus asini*, *Haematopinus suis*, *Linognathus setosus*, *Linognathus ovillus*, *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus humanus* і *Pthirus pubis*.

В іншому варіанті здійснення сполуки формули 1 можна використовувати для боротьби зі шкідниками, що належать до загону жуків (*Coleoptera*). Перелік конкретних родів, що не є вичерпним, включає, але не обмежується ними, *Acanthoscelides* spp., *Agriotes* spp., *Anthonomus* 20 spp., *Apion* spp., *Apogonia* spp., *Aulacophora* spp., *Bruchus* spp., *Cerosterna* spp., *Cerotoma* spp., *Ceutorhynchus* spp., *Chaetocnema* spp., *Colaspis* spp., *Ctenicera* spp., *Curculio* spp., *Cyclocephala* spp., *Diabrotica* spp., *Hypera* spp., *Ips* spp., *Lyctus* spp., *Megascelis* spp., *Meligethes* spp., *Otiorhynchus* spp., *Pantomorus* spp., *Phyllophaga* spp., *Phyllotreta* spp., *Rhizotrogus* spp., 25 *Rhynchites* spp., *Rhynchophorus* spp., *Scolytus* spp., *Sphenophorus* spp., *Sitophilus* spp. і *Tribolium* spp. Перелік конкретних видів, що не є вичерпним, включає, але не обмежується ними, *Acanthoscelides obtectus*, *Agrius planipennis*, *Anoplophora glabripennis*, *Anthonomus grandis*, *Ataenius spretulus*, *Atomaria linearis*, *Bothynoderes punctiventris*, *Bruchus pisorum*, *Callosobruchus maculatus*, *Carpophilus hemipterus*, *Cassida vittata*, *Cerotoma trifurcata*, *Ceutorhynchus assimilis*, 30 *Ceutorhynchus napi*, *Conoderus scalaris*, *Conoderus stigmatus*, *Conotrachelus nenuphar*, *Cotinis nitida*, *Crioceris asparagi*, *Cryptolestes ferrugineus*, *Cryptolestes pusillus*, *Cryptolestes turcicus*, *Cylindrocopturus adspersus*, *Deporaus marginatus*, *Dermestes lardarius*, *Dermestes maculatus*, *Epilachna varivestis*, *Faustinus cubae*, *Hylobius pales*, *Hypera postica*, *Hypothenemus hampei*, *Lasioderma serricornis*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Liogenys fuscus*, *Liogenys suturalis*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Maecolaspis joliveti*, *Melanotus communis*, *Meligethes aeneus*, *Melolontha melolontha*, 35 *Oberea brevis*, *Oberea linearis*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus mercator*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Oulema melanopus*, *Oulema oryzae*, *Phyllophaga cuyabana*, *Popillia japonica*, *Prostephanus truncatus*, *Rhyzopertha dominica*, *Sitona lineatus*, *Sitophilus granarius*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Stegobium paniceum*, *Tribolium castaneum*, *Tribolium confusum*, 40 *Trogoderma variabile* і *Zabrus tenebrioides*.

В іншому варіанті здійснення сполуки формули 1 можна використовувати для боротьби зі шкідниками загону щипавок (*Dermaptera*).

В іншому варіанті здійснення сполуки формули 1 можна використовувати для боротьби зі шкідниками загону тараканових (*Blattaria*). Перелік конкретних видів, що не є вичерпним, включає, але не обмежується ними, *Blattella germanica*, *Blatta orientalis*, *Parcoblatta pennsylvanica*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta australasiae*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Pyrenocelus surinamensis* і *Supella longipalpa*. 45

В іншому варіанті здійснення сполуки формули 1 можна використовувати для боротьби зі шкідниками загону двокрилих (*Diptera*). Перелік конкретних родів, що не є вичерпним, включає, але не обмежується ними, *Aedes* spp., *Agromyza* spp., *Anastrepha* spp., *Anopheles* spp., 50 *Bactrocera* spp., *Ceratitis* spp., *Chrysops* spp., *Cochliomyia* spp., *Contarinia* spp., *Culex* spp., *Dasineura* spp., *Delia* spp., *Drosophila* spp., *Fannia* spp., *Hylemyia* spp., *Liriomyza* spp., *Musca* spp., *Phorbia* spp., *Tabanus* spp. і *Tipula* spp. Перелік конкретних видів, що не є вичерпним, включає, але не обмежується ними, *Agromyza frontella*, *Anastrepha suspensa*, *Anastrepha ludens*, 55 *Anastrepha obliqua*, *Bactrocera cucurbitae*, *Bactrocera dorsalis*, *Bactrocera invadens*, *Bactrocera zonata*, *Ceratitis capitata*, *Dasineura brassicae*, *Delia platura*, *Fannia canicularis*, *Fannia scalaris*, *Gasterophilus intestinalis*, *Gracillia perseae*, *Haematobia irritans*, *Hypoderma lineatum*, *Liriomyza brassicae*, *Melophagus ovinus*, *Musca autumnalis*, *Musca domestica*, *Oestrus ovis*, *Oscinella frit*, *Pegomya betae*, *Psila rosae*, *Rhagoletis cerasi*, *Rhagoletis pomonella*, *Rhagoletis mendax*, 60 *Sitodiplosis mosellana* і *Stomoxys calcitrans*.

В іншому варіанті здійснення сполюки формули 1 можна використовувати для боротьби зі шкідниками загону напівжорсткокрилих (Hemiptera). Перелік конкретних родів, що не є вичерпним, включає, але не обмежується ними, *Adelges* spp., *Aulacaspis* spp., *Aphrophora* spp., *Aphis* spp., *Bemisia* spp., *Ceroplastes* spp., *Chionaspis* spp., *Chrysomphalus* spp., *Coccus* spp., *Empoasca* spp., *Lepidosaphes* spp., *Lagynotomus* spp., *Lygus* spp., *Macrosiphum* spp., *Nephotettix* spp., *Nezara* spp., *Philaenus* spp., *Phytocoris* spp., *Piezodorus* spp., *Planococcus* spp., *Pseudococcus* spp., *Rhopalosiphum* spp., *Saissetia* spp., *Therioaphis* spp., *Toumeyella* spp., *Toxoptera* spp., *Trialeurodes* spp., *Triatoma* spp. і *Unaspis* spp. Перелік конкретних видів, що не є вичерпним, включає, але не обмежується ними, *Acrosternum hilare*, *Acyrtosiphon pisum*, *Aleyrodes proletella*, *Aleurodicus dispersus*, *Aleurothrix floccosus*, *Amrasca biguttula biguttula*, *Aonidiella aurantii*, *Aphis gossypii*, *Aphis glycines*, *Aphis pomi*, *Aulacorthum solani*, *Bemisia argentifolii*, *Bemisia tabaci*, *Blissus leucopterus*, *Brachycorynella asparagi*, *Brevennia rehi*, *Brevicotyne brassicae*, *Calocoris norvegicus*, *Ceroplastes rubens*, *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Dagbertus fasciatus*, *Dichelops furcatus*, *Diuraphis noxia*, *Diaphorina citri*, *Dysaphis plantaginea*, *Dysdercus suturellus*, *Edessa meditabunda*, *Eriosoma lanigerum*, *Eurygaster maura*, *Euschistus hews*, *Euschistus servus*, *Helopeltis antonii*, *Helopeltis theivora*, *Icerya purchasi*, *Idioscopus nitidulus*, *Laodelphax striatellus*, *Leptocorisa oratorius*, *Leptocorisa varicornis*, *Lygus hesperus*, *Maconellicoccus hirsutus*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Macrosiphum granarium*, *Macrosiphum rosae*, *Macrosteles quadrilineatus*, *Mahanarva frimbiolata*, *Metopolophium dirhodum*, *Mictis longicornis*, *Myzus persicae*, *Nephotettix cinctipes*, *Neurocolpus longirostris*, *Nezara viridula*, *Nilaparvata lugens*, *Parlatoria pergandii*, *Parlatoria ziziphi*, *Peregrinus maidis*, *Phylloxera vitifoliae*, *Physokermes piceae*, *Phytocoris calif ornicus*, *Phytocoris relativus*, *Piezodorus guildinii*, *Poecilocapsus eatus*, *Psallus vaccinicola*, *Pseudacysta perseae*, *Pseudococcus brevipes*, *Quadraspidiotus perniciosus*, *Rhopalosiphum maidis*, *Rhopalosiphum padi*, *Saissetia oleae*, *Scaptocoris castanea*, *Schizaphis graminum*, *Sitobion avenae*, *Sogatella furcifera*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Trialeurodes abutiloneus*, *Unaspis yanonensis* і *Zulia entrerriana*.

В іншому варіанті здійснення сполюки формули 1 можна використовувати для боротьби зі шкідниками загону перетинчастокрилих (Hymenoptera). Перелік конкретних родів, що не є вичерпним, включає, але не обмежується ними, *Acromyrmex* spp., *Atta* spp., *Camponotus* spp., *Diprion* spp., *Formica* spp., *Monomorium* spp., *Neodiprion* spp., *Pogonomyrmex* spp., *Polistes* spp., *Solenopsis* spp., *Vespula* spp. і *Xylocopa* spp. Перелік конкретних видів, що не є вичерпним, включає, але не обмежується ними, *Athalia rosae*, *Atta texana*, *Iridomyrmex humilis*, *Monomorium minimum*, *Monomorium pharaonis*, *Solenopsis invicta*, *Solenopsis geminata*, *Solenopsis molesta*, *Solenopsis richteri*, *Solenopsis xyloni* і *Tapinoma sessile*.

В іншому варіанті здійснення сполюки формули 1 можна використовувати для боротьби зі шкідниками загону термітів (Isoptera). Перелік конкретних родів, що не є вичерпним, включає, але не обмежується ними, *Coptotermes* spp., *Cornitermes* spp., *Cryptotermes* spp., *Heterotermes* spp., *Kaloterms* spp., *Incisitermes* spp., *Macrotermes* spp., *Marginitermes* spp., *Microcerotermes* spp., *Procornitermes* spp., *Reticulitermes* spp., *Schedorhinotermes* spp. і *Zootermopsis* spp. Перелік конкретних видів, що не є вичерпним, включає, але не обмежується ними, *Coptotermes curvignathus*, *Coptotermes frenchi*, *Coptotermes formosanus*, *Heterotermes aureus*, *Microtermes obesi*, *Reticulitermes banyulensis*, *Reticulitermes grassei*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes hageni*, *Reticulitermes hesperus*, *Reticulitermes santonensis*, *Reticulitermes speratus*, *Reticulitermes tibialis* і *Reticulitermes virginicus*.

В іншому варіанті здійснення сполюки формули 1 можна використовувати для боротьби зі шкідниками загону лускокрилих (Lepidoptera). Перелік конкретних родів, що не є вичерпним, включає, але не обмежується ними, *Adoxophyes* spp., *Agrotis* spp., *Argyrotaenia* spp., *Casocesia* spp., *Caloptilia* spp., *Chilo* spp., *Chrysodeixis* spp., *Colias* spp., *Crambus* spp., *Diaphania* spp., *Diatraea* spp., *Earias* spp., *Ephestia* spp., *Epimecis* spp., *Feltia* spp., *Gortyna* spp., *Helicoverpa* spp., *Heliothis* spp., *Indarbela* spp., *Lithocolletis* spp., *Loxagrotis* spp., *Malacosoma* spp., *Peridroma* spp., *Phyllonorycter* spp., *Pseudaletia* spp., *Sesamia* spp., *Spodoptera* spp., *Synanthedon* spp. і *Yponomeuta* spp. Перелік конкретних видів, що не є вичерпним, включає, але не обмежується ними, *Achaea janata*, *Adoxophyes orana*, *Agrotis ipsilon*, *Alabama argillacea*, *Amorbia cuneana*, *Amyelois transitella*, *Anacamptodes defectaria*, *Anarsia lineatella*, *Anomis sabulifera*, *Anticarsia gemmatilis*, *Archips argyrospila*, *Archips rosana*, *Argyrotaenia citrana*, *Autographa gamma*, *Bonagota cranaodes*, *Borbo cinnara*, *Bucculatrix thurberiella*, *Capua reticulana*, *Carposina niponensis*, *Chlumetia transversa*, *Choristoneura rosaceana*, *Cnaphalocrocis medinalis*, *Conopomorpha cramerella*, *Cossus cossus*, *Cydia caryana*, *Cydia funebrana*, *Cydia molesta*, *Cydia nigricana*, *Cydia pomonella*, *Darna diducta*, *Diatraea saccharalis*, *Diatraea grandiosella*, *Earias insulana*, *Earias vittella*, *Ecdytolopha aurantianum*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Ephestia cautella*, *Ephestia elutella*, *Ephestia*

kuehniella, *Epinotia aporema*, *Epiphyas postvittana*, *Erionota thrax*, *Eupoecilia ambiguella*, *Euxoa auxiliaris*, *Grapholita molesta*, *Hedylepta indicata*, *Helicoverpa armigera*, *Helicoverpa zea*, *Heliothis virescens*, *Hellula undalis*, *Keiferia lycopersicella*, *Leucinodes orbonalis*, *Leucoptera coffeella*, *Leucoptera malifoliella*, *Lobesia botrana*, *Loxagrotis albicosta*, *Lymantria dispar*, *Lyonetia clerkella*,
 5 *Mahasena corbetti*, *Mamestra brassicae*, *Maruca testulalis*, *Metisa plana*, *Mythimna unipuncta*, *Neoleucinodes elegantalis*, *Nymphula depunctalis*, *Operophtera brumata*, *Ostrinia nubilalis*, *Oxydia vesulia*, *Pandemis cerasana*, *Pandemis heparana*, *Papilio demodocus*, *Pectinophora gossypiella*, *Peridroma saucia*, *Perileucoptera coffeella*, *Phthorimaea operculella*, *Phyllocnistis citrella*, *Pieris rapae*, *Plathypena scabra*, *Plodia interpunctella*, *Plutella xylostella*, *Polychrosis viteana*, *Prays endocarpa*, *Prays oleae*, *Pseudaletia unipuncta*, *Pseudoplusia includens*, *Rachiplusia nu*,
 10 *Scirpophaga incertulas*, *Sesamia inferens*, *Sesamia nonagrioides*, *Setora nitens*, *Sitotroga cerealella*, *Sparganothis pilleriana*, *Spodoptera exigua*, *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera eridania*, *Thecla basilides*, *Tineola bisselliella*, *Trichoplusia ni*, *Tuta absoluta*, *Zeuzera coffeae* i *Zeuzera pyrina*.

В іншому варіанті здійснення сполуки формули 1 можна використовувати для боротьби зі шкідниками загону пухотидів (Mallophaga). Перелік конкретних родів, що не є вичерпним, включає, але не обмежується ними, *Anaticola* spp., *Bovicola* spp., *Chelopistes* spp., *Goniodes* spp.,
 15 *Menacanthus* spp. i *Trichodectes* spp. Перелік конкретних видів, що не є вичерпним, включає, але не обмежується ними, *Bovicola bovis*, *Bovicola caprae*, *Bovicola ovis*, *Chelopistes meleagridis*, *Goniodes dissimilis*, *Goniodes gigas*, *Menacanthus stramineus*, *Menopon gallinae* i *Trichodectes canis*.
 20

В іншому варіанті здійснення сполуки формули 1 можна використовувати для боротьби зі шкідниками загону прямокрилих (Orthoptera). Перелік конкретних родів, що не є вичерпним, включає, але не обмежується ними, *Melanoplus* spp. i *Pterophylla* spp. Перелік конкретних видів, що не є вичерпним, включає, але не обмежується ними, *Anabrus simplex*, *Gryllotalpa africana*,
 25 *Gryllotalpa australis*, *Gryllotalpa brachyptera*, *Gryllotalpa hexadactyla*, *Locusta migratoria*, *Microcentrum retinerve*, *Schistocerca gregaria* i *Scudderia furcata*.

В іншому варіанті здійснення сполуки формули 1 можна використовувати для боротьби зі шкідниками загону Siphonaptera. Перелік конкретних видів, що не є вичерпним, включає, але не обмежується ними, *Ceratophyllus gallinae*, *Ceratophyllus niger*, *Ctenocephaloides canis*,
 30 *Ctenocephaloides felis* i *Pulex irritans*.

В іншому варіанті здійснення сполуки формули 1 можна використовувати для боротьби зі шкідниками загону пухиронігих (Thysanoptera). Перелік конкретних родів, що не є вичерпним, включає, але не обмежується ними, *Caliothrips* spp., *Frankliniella* spp., *Scirtothrips* spp. i *Thrips* spp. Перелік конкретних видів, що не є вичерпним, включає, але не обмежується ними,
 35 *Frankliniella fusca*, *Frankliniella occidentalis*, *Frankliniella schultzei*, *Frankliniella williamsi*, *Heliothrips haemorrhoidalis*, *Rhipiphorothrips cruentatus*, *Scirtothrips citri*, *Scirtothrips dorsalis* i *Taeniothrips rhopalantennalis*, *Thrips hawaiiensis*, *Thrips nigropilosus*, *Thrips orientalis*, *Thrips tabaci*.

В іншому варіанті здійснення сполуки формули 1 можна використовувати для боротьби зі шкідниками загону щетинохвісток (Thysanura). Перелік конкретних родів, що не є вичерпним, включає, але не обмежується ними, *Lepisma* spp. i *Thermobia* spp.
 40

В іншому варіанті здійснення сполуки формули 1 можна використовувати для боротьби зі шкідниками загону Acarina. Перелік конкретних родів, що не є вичерпним, включає, але не обмежується ними, *Acarus* spp., *Aculops* spp., *Boophilus* spp., *Demodex* spp., *Dermacentor* spp., *Epitrimerus* spp., *Eriophyes* spp., *Ixodes* spp., *Oligonychus* spp., *Panonychus* spp., *Rhizoglyphus* spp. i *Tetranychus* spp. Перелік конкретних видів, що не є вичерпним, включає, але не обмежується ними, *Acarapis woodi*, *Acarus siro*, *Aceria mangiferae*, *Aculops lycopersici*, *Aculus pelekassi*, *Aculus schlechtendali*, *Amblyomma americanum*, *Brevipalpus obovatus*, *Brevipalpus phoenicis*, *Dermacentor variabilis*, *Dermatophagoides pteronyssinus*, *Eotetranychus carpini*, *Notoedres cati*, *Oligonychus coffeae*, *Oligonychus ilicis*, *Panonychus citri*, *Panonychus ulmi*,
 45 *Phyllocoptruta oleivora*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Sarcoptes scabiei*, *Tegolophus perseae*, *Tetranychus urticae* i *Varroa destructor*.
 50

В іншому варіанті здійснення сполуки формули 1 можна використовувати для боротьби зі шкідниками загону симфіл (Symphyla). Перелік конкретних видів, що не є вичерпним, включає, але не обмежується ними, *Scutigera* spp. i *Scutigera* spp.
 55

В іншому варіанті здійснення сполуки формули 1 можна використовувати для боротьби зі шкідниками, що належать до типу нематод (Nematoda). Перелік конкретних родів, що не є вичерпним, включає, але не обмежується ними, *Aphelenchoides* spp., *Belonolaimus* spp., *Crictonemella* spp., *Ditylenchus* spp., *Heterodera* spp., *Hirschmanniella* spp., *Hoplolaimus* spp., *Meloidogyne* spp., *Pratylenchus* spp. i *Radopholus* spp. Перелік конкретних видів, що не є

вичерпним, включає, але не обмежується ними, *Dirofilaria immitis*, *Heterodera zeae*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne javanica*, *Onchocerca volvulus*, *Radopholus similis* і *Rotylenchulus reniformis*.

Додаткову інформацію можна знайти в "HANDBOOK of PEST CONTROL-THE BEHAVIOR, LIFE HISTORY and CONTROL of HOUSEHOLD PESTS" by Arnold Mallis, 9th Edition, copyright 2004 by GIE Media Inc.

ЗАСТОСУВАННЯ

Сполуки формули 1, як правило, використовують в кількостях від близько 0,01 грам на гектар до близько 5000 грам на гектар для забезпечення контролю. Кількості від близько 0,1 грам на гектар до близько 500 грамів на гектар, як правило, є переважними, і кількості від близько 1 граму на гектар до близько 50 грамів на гектар, як правило, є більш переважними.

Ділянка, на якій застосовують сполуки формули 1, може являти собою будь-яку ділянку, заселену (або ділянку можливого заселення або перетину) шкідниками, наприклад: де вирощують зернові культури, дерева, фрукти, хлібні злаки, корм для худоби, виноград, штучний дерен і декоративні рослини; де знаходяться домашні тварини; внутрішні або зовнішні поверхні будівель (такі як місця зберігання зерна), будівельні матеріали, що використовуються в будівництві (такі як деревина, просочена антисептиками) і ґрунт навколо будівель. Конкретні посівні площі для використання сполуки формули 1 включають площі, де вирощують яблуни, кукурудзу, соняшник, бавовник, соєві боби, канолу, пшеницю, рис, сорго, ячмінь, овес, картоплю, апельсини, люцерну, салат-латук, полуниці, помідори, перець, хрестоцвіті, груші, тютюн, мигдаль, цукровий буряк, бобові і інші цінні культури, або площі, призначені для посадки насіння таких рослин. Також вигідно використовувати сульфат алюмінію із сполукою формули 1 при вирощуванні різних рослин.

Контроль шкідників, як правило, означає, що популяції шкідників, активність шкідників або і те, й інше, зменшуються на певній ділянці. Це відбувається, коли: популяції шкідників відштовхують від ділянки; коли шкідники стають нездатними на певній ділянці або навколо неї; або шкідників викорінюють, повністю або частково, на певній ділянці або навколо неї. Звичайно, може мати місце комбінація таких результатів. Як правило, популяції шкідників, активність шкідників або і те, й інше, бажано зменшуються більш ніж на п'ятдесят процентів, переважно більш ніж на 90 процентів. Як правило, ділянка не знаходиться в організмі або на поверхні тіла людини; отже, ця ділянка, як правило, знаходиться не у людини.

Сполуки формули 1 можна використовувати в сумішах, наносити одночасно або послідовно, окремо або з іншими сполуками для посилення потужності рослин (наприклад, для кращого росту кореневої системи, для кращої стійкості до стресових умов росту). Такі інші сполуки являють собою, наприклад, сполуки, які модулюють етиленові рецептори рослини, особливо переважним є 1-метилциклопропен (також відомий як 1-MCP).

Сполуки формули 1 можна наносити на листяні і плодоносні частини рослин для боротьби зі шкідниками. Сполуки або безпосередньо контактують зі шкідниками, або шкідники будуть поглинати пестицид при поїданні листя, плодової маси або соку, що виділяється, які містять пестицид. Сполуки формули 1 також можна наносити на ґрунт, і при нанесенні таким способом можна контролювати шкідників, що поїдають коріння і стебла. Коріння може абсорбувати сполуку, доставляючи її вище в листяну частину рослини, для боротьби з наземними шкідниками, що жують і харчуються соком рослин.

Як правило, що стосується приманок, приманки розміщують в ґрунті, де, наприклад, терміти можуть контактувати з приманкою і/або бути привабленими приманкою. Приманки також можна наносити на поверхню будівель, (горизонтальні, вертикальні або похилі поверхні), де, наприклад, мурашки, терміти, таргани або моль можуть контактувати з приманкою і/або бути привабленими приманкою. Приманки можуть включати сполуки формули 1.

Сполуки формули 1 можуть бути інкапсульовані всередині або розміщені на поверхні капсули. Розмір капсул може знаходитися в діапазоні від нанометрового (близько 100-900 нанометрів в діаметрі) до мікрометрового (близько 10-900 мікрон в діаметрі).

Через унікальну здатність яєць деяких шкідників до стійкості проти деяких пестицидів, може бути бажаним повторне нанесення сполук формули 1 для боротьби з личинками, що знову з'являються.

Системне рушення пестицидів в рослині можна використовувати для боротьби зі шкідниками на одній частині рослини шляхом нанесення (наприклад, шляхом окроплення ділянки) сполук формули 1 на іншу частину рослини. Наприклад, контроль комах, що поїдають листя, можна здійснити шляхом краплинного зрошування або борозенками, шляхом обробки ґрунту, наприклад, шляхом змочування ґрунту перед посадкою або після посадки або шляхом обробки насіння рослини перед посадкою.

Обробку можна застосовувати до всіх типів насіння, включаючи такі, з яких будуть виростати рослини, генетично модифіковані для прояву певних характеристик. Репрезентативні приклади включають такі типи, які експресують білки, токсичні для безхребетних шкідників, такі як *Bacillus thuringiensis* або інші інсектицидні токсини, такі типи, які проявляють гербіцидну резистентність, такі як насіння "Roundup Ready" або інше насіння, що має стійкість до гліфосату, глюфосинату, дикамба, імідазолінонів або 2,4-D, або такими типами, які мають "стекінг" чужорідних генів, що експресують інсектицидні токсини, гербіцидну резистентність, посилене живлення, стійкість до засухи або будь-які інші корисні характеристики. Крім того, такі види обробки насіння сполуками формули 1 також можуть посилювати здатність рослини краще витримувати стресові умови росту. Це дає більш здорову, більш сильну рослину, що може привести до більш високих урожаїв, що збираються. Як правило, близько 1 грам сполуки формули 1 до близько 500 грамів на 100000 насіння, як можна чекати, забезпечать хорошу користь, кількості від близько 10 грам до близько 100 грам на 100000 насіння, як можна чекати, забезпечать кращу користь, і кількості від близько 25 грам до близько 75 грам на 100000 насіння, як можна чекати, забезпечать ще більш кращу користь.

Повинне бути очевидним, що сполуки формули 1 можна використовувати на рослинах, в рослинах або навколо рослин, генетично модифікованих для експресії спеціальних характерних особливостей, таких як *Bacillus thuringiensis* або інших інсектицидних токсинів, або рослин, що проявляють резистентність до гербіцидів, або рослин зі "стекінгом" чужорідних генів, що експресують інсектицидні токсини, гербіцидну резистентність, посилене живлення або будь-які інші корисні характеристики.

Сполуки формули 1 можна використовувати для боротьби з ендопаразитами і ектопаразитами у ветеринарній медицині або в галузі утримання тварин, що відрізняються від людини.

Сполуки формули 1 використовують, наприклад, шляхом перорального введення в формі, наприклад, таблеток, капсул, напоїв, гранул, шляхом нанесення на шкіру, наприклад, шляхом занурення, розбризкування, виливання на поверхню, нанесення у вигляді плями і розпилення, і шляхом парентерального введення, наприклад, в формі ін'єкції.

Сполуки формули 1 також з вигодою можна використовувати в галузі розведення худоби, наприклад, корів, овець, свиней, курей і гусей. Їх також з вигодою можна використовувати для домашніх тварин, таких як, коні, собаки і кішки. Конкретними шкідниками, яких можна контролювати, можуть бути блохи і кліщі, і літаючі комахи, що кусаються, які непокоїть таких тварин. Прийнятні композиції вводять перорально тваринам з питною водою або їжею. Дози і композиції, які є прийнятними, залежать від видів.

Сполуки формули 1 також можна використовувати для боротьби з черв'яками-паразитами, зокрема, в кишечнику перерахованих вище тварин.

Сполуки формули 1 також можна використовувати в галузі охорони здоров'я в способах терапевтичного лікування людини. Такі способи включають, але не обмежуються ними, пероральне введення в формі, наприклад, таблеток, капсул, напоїв, гранул, і нанесення на шкіру.

Шкідники по всьому світу мігрують в нові середовища оточення (для таких шкідників) і потім стають новими інвазивними видами в такому новому навколишньому середовищі. Сполуки формули 1 також можна використовувати на таких нових інвазивних видах для боротьби з ними в такому новому навколишньому середовищі.

Сполуки формули 1 також можна використовувати на ділянці, де вирощують рослини, такі як зернові культури (наприклад, перед посадкою, під час садження, перед збором урожаю), з низькими рівнями присутності (навіть без фактичної присутності) шкідників, які можуть завдати комерційної шкоди таким рослинам. Використання таких сполук на таких ділянках корисне для рослин, що вирощуються на такій ділянці. Такі корисні впливи можуть включати, але не обмежуються ними, поліпшення здоров'я рослини, поліпшення врожайності рослини (наприклад, збільшення біомаси і/або збільшення вмісту цінних інгредієнтів), підвищення потужності рослини (наприклад, поліпшення росту рослини і/або більш зелене листя), поліпшення якості рослини (наприклад, поліпшений вміст або склад деяких інгредієнтів) і підвищення стійкості рослини до абіотичного і/або біотичного стресу.

Перед тим, як дозволити використання пестициду або його комерційний продаж, такий пестицид проходить тривалий процес оцінки різними державними органами (місцевими, регіональними, на рівні штату, державними і міжнародними). Об'ємисті вимоги до даних визначаються регулюючими органами, і повинні бути розглянуті через формування даних і усвідомлення особою, що подає заяву про реєстрацію продукту, або третьою стороною від імені особи, що подає заяву про реєстрацію продукту, часто з використанням комп'ютера з

приєднанням до World Wide Web. Ці державні органи потім розглядають такі дані і, якщо приходять до висновку про безпеку продукту, потенційному користувачеві або продавцеві видається дозвіл на реєстрацію продукту. Потім в тій місцевості, де отримано і підтверджено дозвіл на реєстрацію продукту, такий користувач або продавець може використовувати або продавати такий пестицид.

Сполука, представлена формулою 1, може бути перевірена для визначення її ефективності проти шкідників. Крім того, можна провести випробування способу дії, щоб визначити, відрізняється чи ні спосіб дії вказаної сполуки від інших пестицидів. Після цього такі отримані дані можуть бути передані, наприклад, через інтернет, третій стороні.

Заголовки в даному описі представлені тільки для зручності, і не повинні використовуватися для інтерпретації якої-небудь його частини.

ТАБЛИЦІ

BAW і CEW, шкала оцінок

% контролю (або смертності)	Оцінка
50-100	A
Більше ніж 0 – менше ніж 50	B
Не випробовували	C
Якій-небудь активності не відмічено в даному біоаналізі	D

GPA, шкала оцінок

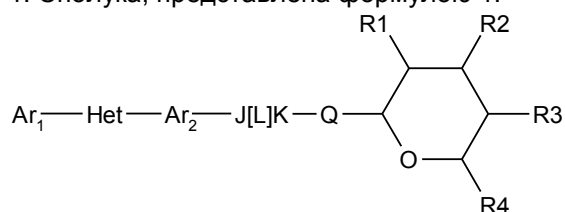
% контролю (або смертності)	Оцінка
80-100	A
Більше ніж - 0 менше ніж 80	B
Не випробовували	C
Якій-небудь активності не відмічено в даному біоаналізі	D

Таблиця 1

Номер сполуки	% смертності CEW 50 мкг/см ²	% смертності BAW 50 мкг/см ²	% смертності GPA 200 ч/млн.
1	A	A	B
2	A	A	B
3	A	A	B
4	B	A	C
5	A	A	D
6	A	A	B
7	A	A	D
8	D	D	D
9	A	A	B

ФОРМУЛА ВИНАХОДУ

1. Сполука, представлена формулою 1:



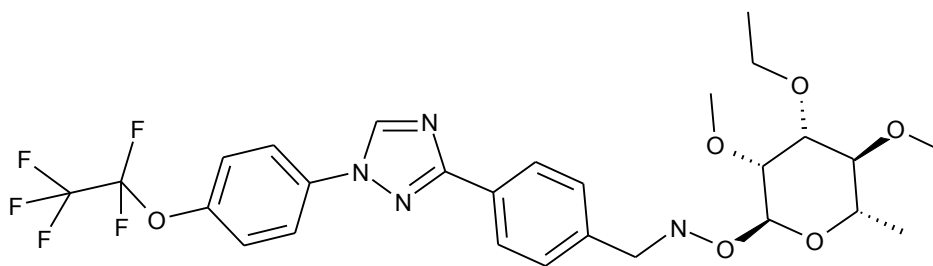
, Формула 1

де:

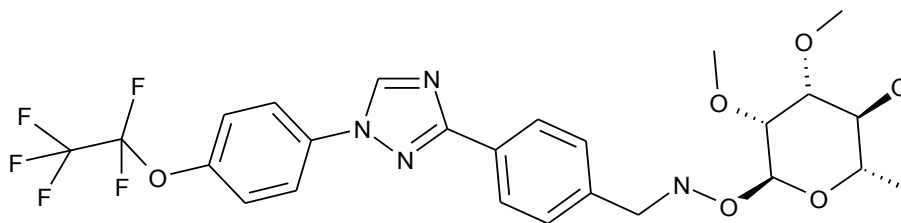
(а) Ar₁ являє собою

заміщений феніл, де вказаний заміщений феніл містить один або більше замісників, незалежно вибраних з C₁-C₆галогеналкілу і C₁-C₆галогеналкокси;

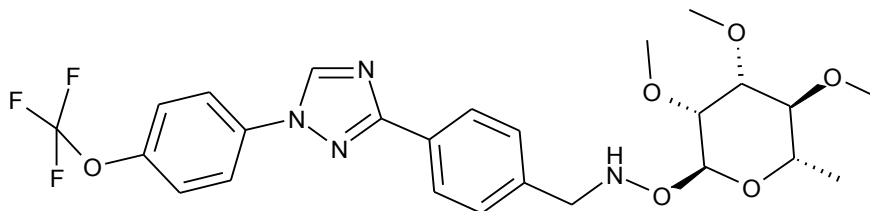
- (b) Нет являє собою триазоліл;
 (c) Ar₂ являє собою феніл;
 (d) J являє собою CR_{J1}R_{J2}, де CR_{J1} і R_{J2} є воднями;
 (e) L являє собою простий зв'язок;
 5 (f) K являє собою NR_{K1};
 (g) Q являє собою O;
 (h) R1 являє собою C₁-C₆алкокси;
 (i) R2 являє собою C₁-C₆алкокси;
 (j) R3 являє собою OH або C₁-C₆алкокси;
 10 (k) R4 являє собою C₁-C₆алкіл; і
 (l) R_{K1} незалежно вибраний з H, C₁-C₆алкілу, C(=O)(C₁-C₆алкілу) і C(=O)(C₁-C₆алкіл)C(=O)O(C₁-C₆алкілу).
 2. Сполука за п. 1, що має структуру, яка відповідає
 Сполуці 1



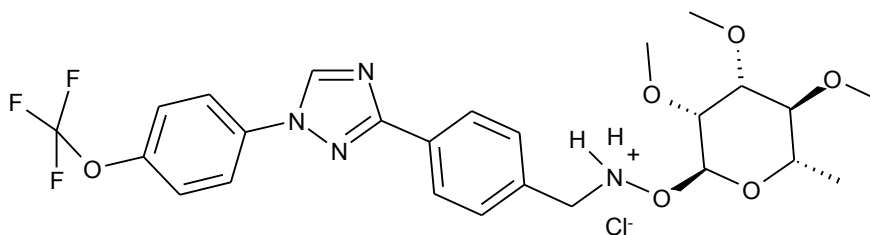
Сполуці 2



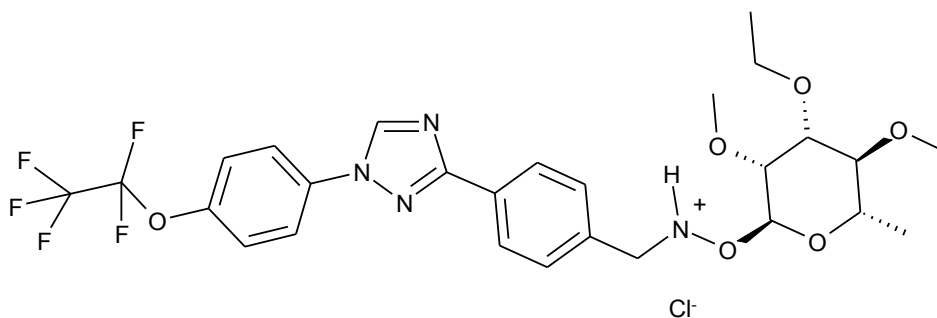
Сполуці 3



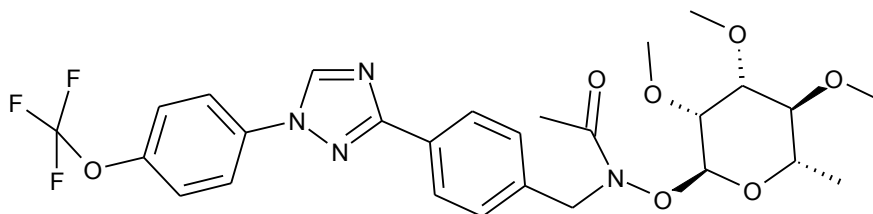
Сполуці 4



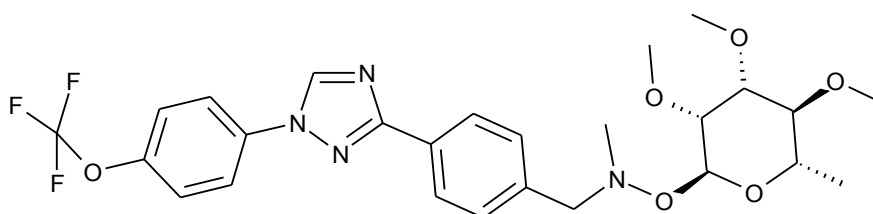
Сполуці 5



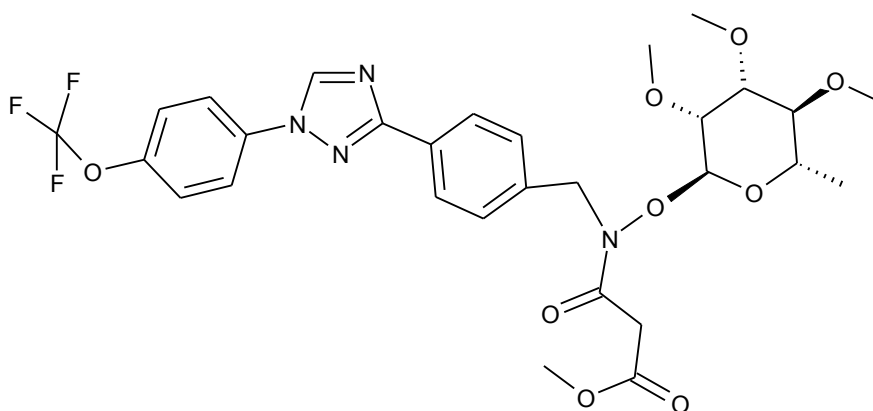
Сполуці 6



Сполуці 7



Сполуці 9



3. Спосіб боротьби зі шкідниками, що включає нанесення сполуки за п. 1 на ділянку в кількості, достатній для боротьби з такими шкідниками.
4. Спосіб за п. 3, де вказана ділянка являє собою ділянку, де вирощують яблуні, кукурудзу, соняшник, бавовник, соєві боби, канолу, пшеницю, рис, сорго, ячмінь, овес, картоплю, апельсини, люцерну, салат-латук, полуниці, помідори, перець, хрестоцвіті, груші, тютюн, мигдаль, цукровий буряк або бобові, або де повинно бути висаджено насіння таких рослин.
5. Сполука, яка являє собою пестицидно прийнятну кислотно-адитивну сіль, сольове похідне, сольват або складноефірне похідне сполуки за п. 1.
6. Сполука за п. 1, де щонайменше один Н являє собою ^2H або щонайменше один С являє собою ^{14}C .
7. Композиція, що містить сполуку за п. 1 і щонайменше одну іншу сполуку, вибрану з групи інсектицидів, групи акарицидів, групи нематоцидів, групи фунгіцидів, групи гербіцидів, AI-групи або групи синергістів.
8. Композиція, що містить сполуку за п. 1 і насіння.
9. Композиція за п. 8, де вказане насіння було генетично модифіковане для експресії однієї або декількох спеціальних характеристик.

10. Спосіб, що включає нанесення сполуки за п. 1 на генетично модифіковану рослину, яка була генетично модифікована для експресії однієї або декількох спеціальних характеристик.
11. Спосіб, що включає пероральне введення або місцеве нанесення сполуки за п. 1 тварині, що відрізняється від людини, для боротьби з ендопаразитами, ектопаразитами або і тими, й іншими.
- 5

Комп'ютерна верстка І. Скворцова

Державна служба інтелектуальної власності України, вул. Василя Липківського, 45, м. Київ, МСП, 03680, Україна

ДП "Український інститут інтелектуальної власності", вул. Глазунова, 1, м. Київ – 42, 01601