



УКРАЇНА

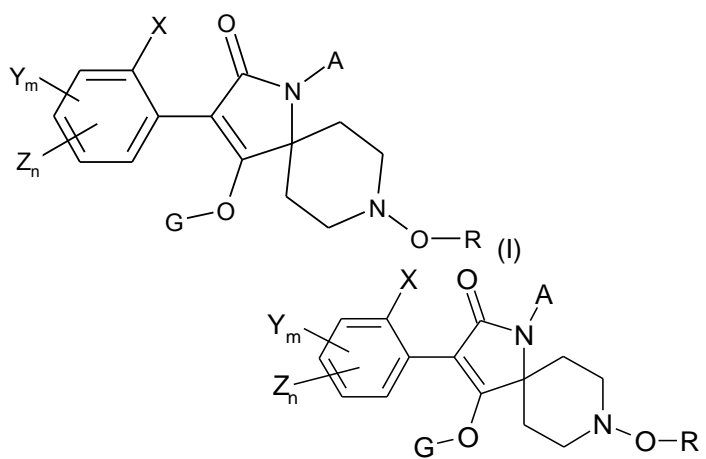
(19) **UA** (11) **105372** (13) **C2**
(51) МПК**C07D 211/94** (2006.01)**C07D 471/10** (2006.01)**A01N 43/90** (2006.01)**A01P 7/02** (2006.01)**A01P 7/04** (2006.01)ДЕРЖАВНА СЛУЖБА
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
УКРАЇНИ**(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВІНАХІД**

(21) Номер заявки: а 2011 08589	(72) Винахідник(и): Мюлебах Міхель (CH), Піттерна Томас (AT/CH), Кассеір Жером Ів (FR/CH), Едмундс Ендрю (GB/CH), Корсі Камілла (IT/CH), Ель Касемі Мір'єм (FR/CH), Холл Роджер Грехем (GB/CH), Жангена Андре (CH), Штоллер Андре (CH), Годфрі Крістофер Річард (GB/CH), Шетцер Іюрген Харрі (DE/CH), Луазелер Олів'є (CH), Майєнфіш Петер (CH), Картер Нейл Брайан (GB)
(22) Дата подання заявки: 09.12.2009	(73) Власник(и): СІНГЕНТА ПАРТІСІПЕЙШНС АГ, Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel, Switzerland (CH), СІНГЕНТА ЛІМІТЕД, European Regional Centre, Priestley Road, Surrey Research Park, Guildford, Surrey GU2 7YH, United Kingdom (GB)
(24) Дата, з якої є чинними права на винахід: 12.05.2014	(74) Представник: Петров Андрій Володимирович, реєстр. №139
(31) Номер попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції: 0822748.0, 0905237.4	(56) Перелік документів, взятих до уваги експертизою: WO 9948869, А, 30.09.1999 US 6 774 133, А, 10.08.2004 WO 2009049851, А, 23.04.2009
(32) Дата подання попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції: 12.12.2008, 26.03.2009	
(33) Код держави-учасниці Паризької конвенції, до якої подано попередню заявку: GB, GB	
(41) Публікація відомостей про заявку: 10.10.2011, Бюл.№ 19	
(46) Публікація відомостей про видачу патенту: 12.05.2014, Бюл.№ 9	
(86) Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору РСТ: РСТ/EP2009/066710, 09.12.2009	

(54) СПІРОГЕТЕРОЦИКЛІЧНІ N-ОКСИПІПЕРИДИНИ ЯК ПЕСТИЦИДИ**(57) Реферат:**

Сполука формули I, у якій замісники є такими, як визначено у пункті 1 формули винаходу, які застосовують як пестициди.

UA 105372 C2



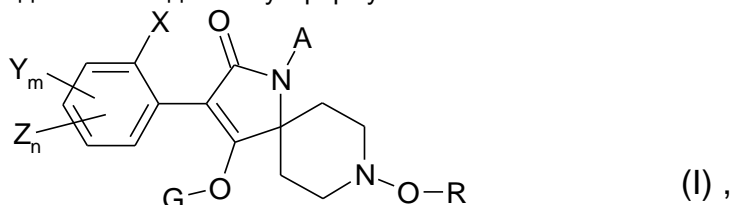
(I) ,

Даний винахід належить до нових N-алкіламідів заміщених спірогетероциклічних похідних піролідиндіону, до способів їх одержання, до пестицидних, зокрема, інсектицидних, акаріцидних, молюскоцидних і нематоцидних композицій, які їх містять, і до способів їх застосування для боротьби з комахами-, кліщами-, молюсками- і нематодами-шкідниками і їх знищення.

Спірогетероциклічні похідні піролідиндіону розкриті, наприклад, у US 6555567, US 6479489, US 6774133, EP 596298, WO 98/05638 і WO 99/48869. Крім того, спірогетероциклічні похідні піролідиндіону відомі, наприклад, з WO 09/049851.

Згідно винаходу неочікувано встановлено, що деякі нові N-алкілміди заміщених спірогетероциклічних похідних піролідиндіону мають гарну інсектицидну властивість.

Тому даний винахід належить до сполук формули I



в якій

X, Y і Z незалежно один від одного означають C₁-C₄-алкіл, C₃-C₆-циклоалкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-алкоксигрупу, галоген, феніл або феніл, що містить в якості замісників C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, галоген або ціаногрупу;

m і n незалежно один від одного дорівнюють 0, 1, 2 або 3 і m+n дорівнює 0, 1, 2 або 3;

G означає водень, метал, амоній, сульфоній або захисну групу;

R означає водень, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галогеналкіл, C₁-C₆-ціаноалкіл, бензил, C₁-C₄-алокси(C₁-C₄)алкіл, C₁-C₄-алокси(C₁-C₄)алкокси(C₁-C₄)алкіл або групу, вибрану з числа груп G;

A означає C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галогеналкіл, C₃-C₆-циклоалкіл, C₃-C₆-циклоалкіл(C₁-C₄)алкіл або C₃-C₆-циклоалкіл(C₁-C₄)алкіл, в якому метиленова група циклоалкільного фрагменту замінена на O, S або NR₀, де R₀ означає C₁-C₆-алкіл або C₁-C₆-алкоксигрупу, або A означає C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₆-галогеналкеніл, C₃-C₆-алкініл, C₁-C₆-ціаноалкіл, бензил, C₁-C₄-алокси(C₁-C₄)алкіл, C₁-C₄-алокси(C₁-C₄)алкокси(C₁-C₄)алкіл, оксетаніл, тетрагідрофураніл, тетрагідропіраніл, C₁-C₆-алкілкарбоніл, C₁-C₆-алкоксикарбоніл, C₃-C₆-циклоалкілкарбоніл, N-ди(C₁-C₆-алкіл)карбамоіл, бензоіл, C₁-C₆-алкілсульфоніл, фенілсульфоніл, C₁-C₄-алкілтіо(C₁-C₄)алкіл, C₁-C₄-алкілсульфініл(C₁-C₄)алкіл або C₁-C₄-алкілсульфоніл(C₁-C₄)алкіл;

або до їх агрохімічно прийнятних солей або N-оксидів.

В сполуках формули I кожен алкільний фрагмент окремо або у вигляді частини більшої групи має лінійний або розгалужений ланцюг і означає, наприклад, метил, етил, н-пропіл, н-бутил, ізопропіл, втор-бутил, ізобутил, трет-бутил, н-пентил, ізопентил і н-гексил.

Алкоксигрупи бажано мають ланцюг довжиною від 1 до 4 атомів вуглецю. Алкоксигрупа являє собою, наприклад, метоксигрупу, етоксигрупу, пропоксигрупу, ізопропоксигрупу, н-бутоксигрупу, ізобутоксигрупу, втор-бутоксигрупу і трет-бутоксигрупу. Такі групи можуть бути частиною більш великої групи, такої як алкоксиалкіл і алкоксиалкоксиалкіл. Алкоксиалкільні групи бажано мають ланцюг довжиною від 1 до 4 атомів вуглецю. Алкоксиалкіл являє собою, наприклад, метоксиметил, метоксиетил, етоксиметил, етоксиетил, н-пропоксиметил, н-пропоксиетил або ізопропоксиметил.

Галоген зазвичай означає фтор, хлор, бром або йод. Відповідно, це також належить до комбінацій галогену з іншими значеннями, такими як галогеналкіл.

Галогеналкільні групи бажано мають ланцюг довжиною від 1 до 6 атомів вуглецю. Галогеналкіл являє собою, наприклад, фторметил, дифторметил, трифторметил, хлорметил, дихлорметил, трихлорметил, 2,2,2-трифторетил, 2-фторетил, 2-хлоретил, пентафторетил, 1,1-дифтор-2,2,2-трихлоретил, 2,2,3,3-тетрафторетил і 2,2,2-трихлоретил; бажано трихлорметил, дифторхлорметил, дифторметил, трифторметил і дихлорфторметил.

Циклоалкільні групи бажано містять від 3 до 6 кільцевих атомів вуглецю, наприклад, циклопропіл, циклобутил, циклопентил і циклогексил. В цих кільцях метиленова група може бути замінена на атом кисню та/або сірки, що приводить до утворення, наприклад, оксетанільного, тетрагідрофуранільного, тетрагідропіранільного, фуранільного, тетрагідротіофуранільного і тетрагідротіопіранільного кілець.

Феніл, а також у вигляді частини таких замісників, як бензил, може бути заміщеним, бажано алкільними, галогеналкільними або галогенідними групами. У цьому випадку замісники можуть перебувати в орто-, мета- та/або пара-положенні. Бажаними положеннями замісників є орто- і пара-положення по відношенню до положення приєднання циклу.

Захисні групи G вибрані так, щоб їх можна було видалити за допомогою біохімічного, хімічного або фізичного процесу або їх комбінації з одержанням сполук формули I, в якій G означає водень, до, під час, або після нанесення на ділянки або рослини, які оброблюються. Приклади цих процесів включають ферментативне розщеплення, хімічний гідроліз і фотоліз.

5 Сполуки, які містять такі групи G, можуть забезпечувати певні переваги, такі як покращене проникнення у кутикулу рослин, які оброблюються, покращена переносимість культурами, покращена сумісність або стабільність у готових сумішах, які містять інші гербіциди, антидоти гербіцидів, регулятори росту рослин, фунгіциди або інсектициди, або зменшене вилужування у ґрунтах.

10 Захисна група G бажано вибрана з групи, яка включає C₁-C₈-алкіл, C₂-C₈-галогеналкіл, феніл-C₁-C₈-алкіл (де феніл необов'язково може містити в якості замісників C₁-C₃-алкіл, C₁-C₃-галогеналкіл, C₁-C₃-алкоксигрупу, C₁-C₃-галогеналкоксигрупу, C₁-C₃-алкілтіогрупу, C₁-C₃-алкілсульфініл, C₁-C₃-алкілсульфоніл, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу), гетероарил-C₁-C₈-алкіл (де гетероарил необов'язково може містити в якості замісників C₁-C₃-алкіл, C₁-C₃-галогеналкіл, C₁-C₃-алкоксигрупу, C₁-C₃-галогеналкоксигрупу, C₁-C₃-алкілтіогрупу, C₁-C₃-алкілсульфініл, C₁-C₃-алкілсульфоніл, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу), C₃-C₈-алкеніл, C₃-C₈-галогеналкеніл, C₃-C₈-алкініл, C(X^a)-R^a, C(X^b)-X^c-R^b, C(X^d)-N(R^c)-R^d, -SO₂-R^e, -P(X^e)(R^f)-R^g або CH₂-X^f-R^h, де X^a, X^b, X^c, X^d, X^e і X^f незалежно один від одного означають кисень або сірку;

20 R^a означає H, C₁-C₁₈-алкіл, C₂-C₁₈-алкеніл, C₂-C₁₈-алкініл, C₁-C₁₀-галогеналкіл, C₁-C₁₀-ціаноалкіл, C₁-C₁₀-нітроалкіл, C₁-C₁₀-аміноалкіл, C₁-C₅-алкіламіно-C₁-C₅-алкіл, C₂-C₈-діалкіламіно-C₁-C₅-алкіл, C₃-C₇-циклоалкіл-C₁-C₅-алкіл, C₁-C₅-алкокси-C₁-C₅-алкіл, C₃-C₅-алкенілокси-C₁-C₅-алкіл, C₃-C₅-алкініл-C₁-C₅-оксиалкіл, C₁-C₅-алкілтіо-C₁-C₅-алкіл, C₁-C₅-алкілсульфініл-C₁-C₅-алкіл, C₁-C₅-алкілсульфоніл-C₁-C₅-алкіл, C₂-C₈-алкіліденаміноокси-C₁-C₅-алкіл, C₁-C₅-алкілкарбоніл-C₁-C₅-алкіл, C₁-C₅-алкоксикарбоніл-C₁-C₅-алкіл, амінокарбоніл-C₁-C₅-алкіл, C₁-C₅-алкіламінокарбоніл-C₁-C₅-алкіл, C₂-C₈-діалкіламінокарбоніл-C₁-C₅-алкіл, C₁-C₅-алкілкарбоніламіно-C₁-C₅-алкіл, N-C₁-C₅-алкілкарбоніл-N-C₁-C₅-алкіламіно-C₁-C₅-алкіл, C₃-C₆-триалкілсиліл-C₁-C₅-алкіл, феніл-C₁-C₅-алкіл (де феніл необов'язково може містити в якості замісників C₁-C₃-алкіл, C₁-C₃-галогеналкіл, C₁-C₃-алкоксигрупу, C₁-C₃-галогеналкоксигрупу, C₁-C₃-алкілтіогрупу, C₁-C₃-алкілсульфініл, C₁-C₃-алкілсульфоніл, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу), гетероарил-C₁-C₅-алкіл, (де гетероарил необов'язково може містити в якості замісників C₁-C₃-алкіл, C₁-C₃-галогеналкіл, C₁-C₃-алкоксигрупу, C₁-C₃-галогеналкоксигрупу, C₁-C₃-алкілтіогрупу, C₁-C₃-алкілсульфініл, C₁-C₃-алкілсульфоніл, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу), C₂-C₅-галогеналкеніл, C₃-C₈-циклоалкіл, феніл або феніл, який містить в якості замісників C₁-C₃-алкіл, C₁-C₃-галогеналкіл, C₁-C₃-алкоксигрупу, C₁-C₃-галогеналкоксигрупу, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу, гетероарил або гетероарил, який містить в якості замісників C₁-C₃-алкіл, C₁-C₃-галогеналкіл, C₁-C₃-алкоксигрупу, C₁-C₃-галогеналкоксигрупу, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу,

35 R^b означає C₁-C₁₈-алкіл, C₃-C₁₈-алкеніл, C₃-C₁₈-алкініл, C₂-C₁₀-галогеналкіл, C₁-C₁₀-ціаноалкіл, C₁-C₁₀-нітроалкіл, C₂-C₁₀-аміноалкіл, C₁-C₅-алкіламіно-C₁-C₅-алкіл, C₂-C₈-діалкіламіно-C₁-C₅-алкіл, C₃-C₇-циклоалкіл-C₁-C₅-алкіл, C₁-C₅-алкокси-C₁-C₅-алкіл, C₃-C₅-алкенілокси-C₁-C₅-алкіл, C₃-C₅-алкінілокси-C₁-C₅-алкіл, C₁-C₅-алкілтіо-C₁-C₅-алкіл, C₁-C₅-алкілсульфініл-C₁-C₅-алкіл, C₁-C₅-алкілсульфоніл-C₁-C₅-алкіл, C₂-C₈-алкіліденаміноокси-C₁-C₅-алкіл, C₁-C₅-алкілкарбоніл-C₁-C₅-алкіл, C₁-C₅-алкоксикарбоніл-C₁-C₅-алкіл, амінокарбоніл-C₁-C₅-алкіл, C₁-C₅-алкіламінокарбоніл-C₁-C₅-алкіл, C₂-C₈-діалкіламінокарбоніл-C₁-C₅-алкіл, C₁-C₅-алкілкарбоніламіно-C₁-C₅-алкіл, N-C₁-C₅-алкілкарбоніл-N-C₁-C₅-алкіламіно-C₁-C₅-алкіл, C₃-C₆-триалкілсиліл-C₁-C₅-алкіл, феніл-C₁-C₅-алкіл (де феніл необов'язково може містити в якості замісників C₁-C₃-алкіл, C₁-C₃-галогеналкіл, C₁-C₃-алкоксигрупу, C₁-C₃-галогеналкоксигрупу, C₁-C₃-алкілтіогрупу, C₁-C₃-алкілсульфініл, C₁-C₃-алкілсульфоніл, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу), гетероарил-C₁-C₅-алкіл, (де гетероарил необов'язково може містити в якості замісників C₁-C₃-алкіл, C₁-C₃-галогеналкіл, C₁-C₃-алкоксигрупу, C₁-C₃-галогеналкоксигрупу, C₁-C₃-алкілтіогрупу, C₁-C₃-алкілсульфініл, C₁-C₃-алкілсульфоніл, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу), C₃-C₅-галогеналкеніл, C₃-C₈-циклоалкіл, феніл або феніл, який містить в якості замісників C₁-C₃-алкіл, C₁-C₃-галогеналкіл, C₁-C₃-алкоксигрупу, C₁-C₃-галогеналкоксигрупу, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу, гетероарил або гетероарил, який містить в якості замісників C₁-C₃-алкіл, C₁-C₃-галогеналкіл, C₁-C₃-алкоксигрупу, C₁-C₃-галогеналкоксигрупу, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу,

50 R^c і R^d всі незалежно один від одного означають водень, C₁-C₁₀-алкіл, C₃-C₁₀-алкеніл, C₃-C₁₀-алкініл, C₂-C₁₀-галогеналкіл, C₁-C₁₀-ціаноалкіл, C₁-C₁₀-нітроалкіл, C₁-C₁₀-аміноалкіл, C₁-C₅-алкіламіно-C₁-C₅-алкіл, C₂-C₈-діалкіламіно-C₁-C₅-алкіл, C₃-C₇-циклоалкіл-C₁-C₅-алкіл, C₁-C₅-алкокси-C₁-C₅-алкіл, C₃-C₅-алкенілокси-C₁-C₅-алкіл, C₃-C₅-алкінілокси-C₁-C₅-алкіл, C₁-C₅-алкілтіо-

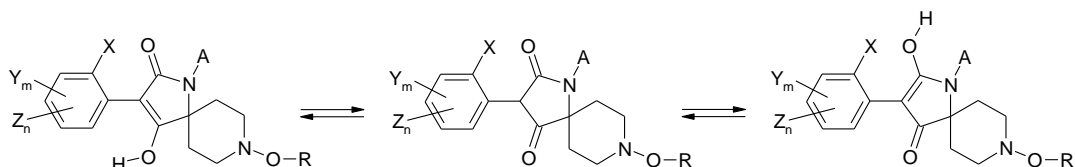
[illegible]

- алкіліденаміноокси-С₁-С₅-алкіл, С₁-С₅-алкілкарбоніл-С₁-С₅-алкіл, С₁-С₅-алкоксикарбоніл-С₁-С₅-алкіл, амінокарбоніл-С₁-С₅-алкіл, С₁-С₅-алкіламінокарбоніл-С₁-С₅-алкіл, С₂-С₈-діалкіламінокарбоніл-С₁-С₅-алкіл, С₁-С₅-алкілкарбоніламіно-С₁-С₅-алкіл, N-С₁-С₅-алкілкарбоніл-N-С₂-С₅-алкіламіноалкіл, С₃-С₆-триалкілсиліл-С₁-С₅-алкіл, феніл-С₁-С₅-алкіл (де феніл
- 5 необов'язково може містити в якості замісників С₁-С₃-алкіл, С₁-С₃-галогеналкіл, С₁-С₃-алкоксигрупу, С₁-С₃-галогеналкоксигрупу, С₁-С₃-алкілтіогрупу, С₁-С₃-алкілсульфініл, С₁-С₃-алкілсульфоніл, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу), гетероарил-С₁-С₅-алкіл (де гетероарил необов'язково може містити в якості замісників С₁-С₃-алкіл, С₁-С₃-галогеналкіл, С₁-С₃-алкоксигрупу, С₁-С₃-галогеналкоксигрупу, С₁-С₃-алкілтіогрупу, С₁-С₃-алкілсульфініл, С₁-С₃-алкілсульфоніл, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу), С₂-С₅-галогеналкеніл, С₃-С₈-циклоалкіл, феніл або феніл, який містить в якості замісників С₁-С₃-алкіл, С₁-С₃-галогеналкіл, С₁-С₃-алкоксигрупу, С₁-С₃-галогеналкоксигрупу, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу, гетероарил або гетероарил, який містить в якості замісників С₁-С₃-алкіл, С₁-С₃-галогеналкіл, С₁-С₃-алкоксигрупу, С₁-С₃-галогеналкоксигрупу, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу, гетероариламіногрупу або гетероариламіногрупу, яка містить в якості замісників С₁-С₃-алкіл, С₁-С₃-галогеналкіл, С₁-С₃-алкоксигрупу, С₁-С₃-галогеналкоксигрупу, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу, дигетероариламіногрупу або дигетероариламіногрупу, яка містить в якості замісників С₁-С₃-алкіл, С₁-С₃-галогеналкіл, С₁-С₃-алкоксигрупу, С₁-С₃-галогеналкоксигрупу, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу, феніламіногрупу або феніламіногрупу, яка містить в якості замісників С₁-С₃-алкіл, С₁-С₃-галогеналкіл, С₁-С₃-алкоксигрупу, С₁-С₃-галогеналкоксигрупу, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу, дифеніламіногрупу або дифеніламіногрупу, яка містить в якості замісників С₁-С₃-алкіл, С₁-С₃-галогеналкіл, С₁-С₃-алкоксигрупу, С₁-С₃-галогеналкоксигрупу, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу, або С₃-С₇-циклоалкіламіногрупу, ди-С₃-С₇-циклоалкіламіногрупу або С₃-С₇-циклоалкоксигрупу, С₁-С₁₀-галогеналкоксигрупу, С₁-С₅-алкіламіногрупу або С₂-С₈-діалкіламіногрупу, бензилоксигрупу або феноксигрупу, де бензильні і фенільні групи, в свою чергу, можуть містити в якості замісників С₁-С₃-алкіл, С₁-С₃-галогеналкіл, С₁-С₃-алкоксигрупу, С₁-С₃-галогеналкоксигрупу, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу, і
- 10 R^h означає С₁-С₁₀-алкіл, С₃-С₁₀-алкеніл, С₃-С₁₀-алкініл, С₁-С₁₀-галогеналкіл, С₁-С₁₀-ціаноалкіл, С₁-С₁₀-нітроалкіл, С₂-С₁₀-аміноалкіл, С₁-С₅-алкіламіно-С₁-С₅-алкіл, С₂-С₈-діалкіламіно-С₁-С₅-алкіл, С₃-С₇-циклоалкіл-С₁-С₅-алкіл, С₁-С₅-алкокси-С₁-С₅-алкіл, С₃-С₅-алкенілокси-С₁-С₅-алкіл, С₃-С₅-алкінілокси-С₁-С₅-алкіл, С₁-С₅-алкілтіо-С₁-С₅-алкіл, С₁-С₅-алкілсульфініл-С₁-С₅-алкіл, С₁-С₅-алкілсульфоніл-С₁-С₅-алкіл, С₂-С₈-алкіліденаміноокси-С₁-С₅-алкіл, С₁-С₅-алкілкарбоніл-С₁-С₅-алкіл, С₁-С₅-алкоксикарбоніл-С₁-С₅-алкіл, амінокарбоніл-С₁-С₅-алкіл, С₁-С₅-алкіламінокарбоніл-С₁-С₅-алкіл, С₂-С₈-діалкіламінокарбоніл-С₁-С₅-алкіл, С₁-С₅-алкілкарбоніламіно-С₁-С₅-алкіл, N-С₁-С₅-алкілкарбоніл-N-С₁-С₅-алкіламіно-С₁-С₅-алкіл, С₃-С₆-триалкілсиліл-С₁-С₅-алкіл, феніл-С₁-С₅-алкіл (де феніл необов'язково може містити в якості замісників С₁-С₃-алкіл, С₁-С₃-галогеналкіл, С₁-С₃-алкоксигрупу, С₁-С₃-галогеналкоксигрупу, С₁-С₃-алкілтіогрупу, С₁-С₃-алкілсульфініл, С₁-С₃-алкілсульфоніл, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу), гетероарил-С₁-С₅-алкіл (де гетероарил необов'язково може містити в якості замісників С₁-С₃-алкіл, С₁-С₃-галогеналкіл, С₁-С₃-алкоксигрупу, С₁-С₃-галогеналкоксигрупу, С₁-С₃-алкілтіогрупу, С₁-С₃-алкілсульфініл, С₁-С₃-алкілсульфоніл, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу), фенокси-С₁-С₅-алкіл (де феніл необов'язково може містити в якості замісників С₁-С₃-алкіл, С₁-С₃-галогеналкіл, С₁-С₃-алкоксигрупу, С₁-С₃-галогеналкоксигрупу, С₁-С₃-алкілтіогрупу, С₁-С₃-алкілсульфініл, С₁-С₃-алкілсульфоніл, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу), гетероарилокси-С₁-С₅-алкіл (де гетероарил необов'язково може містити в якості замісників С₁-С₃-алкіл, С₁-С₃-галогеналкіл, С₁-С₃-алкоксигрупу, С₁-С₃-галогеналкоксигрупу, С₁-С₃-алкілтіогрупу, С₁-С₃-алкілсульфініл, С₁-С₃-алкілсульфоніл, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу), С₃-С₅-галогеналкеніл, С₃-С₈-циклоалкіл, феніл або феніл, який містить в якості замісників С₁-С₃-алкіл, С₁-С₃-галогеналкіл, С₁-С₃-алкоксигрупу, С₁-С₃-галогеналкоксигрупу, галоген або
- 15 нітрогрупу, або гетероарил або гетероарил, який містить в якості замісників С₁-С₃-алкіл, С₁-С₃-галогеналкіл, С₁-С₃-алкоксигрупу, С₁-С₃-галогеналкоксигрупу, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу.

Бажано, якщо захисна група G являє собою групу -C(X^a)-R^a або -C(X^b)-X^c-R^b і значення X^a, R^a, X^b, X^c і R^b є такими, як визначено вище.

- 55 Бажано, якщо G означає водень, лужний метал або лужноземельний метал, або амонієву або сульфонієву групу, де водень є особливо бажаним.

В залежності від природи замісників сполуки формули I можуть існувати у різних ізомерних формах. Якщо G означає, наприклад, водень, то сполуки формули I можуть існувати у різних таутомерних формах:



У обсяг даного винаходу входять всі такі ізомери і таутмери і їх суміші у всіх співвідношеннях. Крім того, якщо замісники містять подвійні зв'язки, то можуть існувати цис- і транс-ізомери. Такі ізомери також входять в обсяг заявлених сполук формули I.

Даний винахід також належить до сільськогосподарсько прийнятних солей, які сполуки формули I можуть утворювати із основами перехідних металів, лужних металів і лужноземельних металів, амінами, четвертинними амонієвими основами або четвертинними сульфонієвими основами.

Із таких, які являються солеутворювачами гідроксидів перехідних металів, лужних металів і лужноземельних металів слід особливо відзначити гідроксиди міді, заліза, літію, натрію, калію, магнію і кальцію, але бажано гідроксиди, бікарбонати і карбонати натрію і калію.

Приклади амінів, придатних для утворення солей амонію, включають аміак, а також первинні, вторинні і третинні C₁-C₁₈-алкіламіни, C₁-C₄-гідроксиалкіламіни і C₂-C₄-алкоксиалкіламіни, наприклад, метиламін, етиламін, н-пропіламін, ізопропіламін, чотири ізомери бутиламіну, н-аміламін, ізоаміламін, гексиламін, гептиламін, октиламін, ноніламін, дециламін, пентадециламін, гексадециламін, гептадециламін, октадециламін, метилетиламін, метилізопропіламін, метилгексиламін, метилноніламін, метилпентадециламін, метилоктадециламін, етилбутиламін, етилгептиламін, етилоктиламін, гексилгептиламін, гексилноктиламін, диметиламін, діетиламін, ди-н-пропіламін, діізопропіламін, ди-н-бутиламін, ди-н-аміламін, діізоаміламін, дигексиламін, дигептиламін, діоктиламін, етаноламін, н-пропаноламін, ізопропаноламін, N,N-діетаноламін, N-етилпропаноламін, н-бутилетаноламін, аліламін, н-бут-2-еніламін, н-пент-2-еніламін, 2,3-диметилбут-2-еніламін, дибут-2-еніламін, н-гекс-2-еніламін, пропілендіамін, триметиламін, триетиламін, три-н-пропіламін, триізопропіламін, три-н-бутиламін, триізобутиламін, три-втор-бутиламін, три-н-аміламін, метоксиетиламін і етоксиетиламін; гетероциклічні аміни, наприклад, піридин, хінолін, ізохінолін, морфолін, піперидин, піролідін, індолин, хінуклідін і азепін; первинні арилами́ни, наприклад, аніліни, метоксианіліни, етоксианіліни, о-, м- і п-толуїдини, фенілендіаміни, бензидини, нафтиламіни і о-, м- і п-хлораніліни; але бажано триетиламін, ізопропіламін і діізопропіламін.

Бажані четвертинні амонієві основи, які можуть бути застосовані для утворення солей, відповідають, наприклад, формулі [N(R_aR_bR_cR_d)]OH, в якій R_a, R_b, R_c і R_d всі незалежно від інших означають водень або C₁-C₄-алкіл. Інші підходящі тетраалкіламонієві основи з іншими аніонами можна одержати, наприклад, за допомогою аніонообмінних реакцій.

Бажані третинні сульфонієві основи, які можуть бути застосовані для утворення солей, відповідають, наприклад, формулі [SR_eR_fR_g]]OH, в якій R_e, R_f і R_g всі незалежно від інших означають C₁-C₄-алкіл. Особливо бажаним є триметилсульфонійгідроксид. Підходящі сульфонієві основи можна одержати за реакцією з простими тіоефірами, зокрема, із діалкілсульфідами, із алкілгалогенідами з наступним перетворенням у підходящу основу, наприклад, гідроксид за допомогою аніонообмінних реакцій.

Слід розуміти, що в сполуках формули I, в якій G означає метал, амоній або сульфоній, як це вказано вище, і являє собою катіон, відповідний негативний заряд в значному ступені делокалізований за фрагментом O=C=C-C=O.

Сполуки формули I, запропоновані в даному винаході, також включають гідрати, які можуть утворюватися при одержанні солей.

Бажано, якщо в сполуках формули I замісник R означає водень, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галогеналкіл, C₂-C₆-алкеніл, C₃-C₆-алкініл, бензил або C₁-C₄-алкокси(C₁-C₄)алкіл, більш бажано водень, метил, етил, трифторметил, аліл, пропаргіл, бензил, метоксиметил, етоксиметил або метоксиетил.

Бажано, якщо X, Y і Z означають C₁-C₄-алкіл, C₃-C₆-циклоалкіл, C₁-C₄-алкоксигрупу або галоген, більш бажано метил, етил, циклопропіл, метоксигрупу, фтор, бром або хлор, коли m+n дорівнює 1-3, бажано, коли m+n дорівнює 1-2.

Альтернативно, Y і Z незалежно один від одного означають C₁-C₄-алкіл, C₃-C₆-циклоалкіл, C₁-C₄-алкоксигрупу, галоген, феніл або феніл, який містить в якості замісників C₁-C₄-алкіл або галоген, бажано метил, етил, циклопропіл, метоксигрупу, фтор, хлор, бром, феніл або феніл, заміщений галогеном, бажано фтором або хлором, бажано у положенні 4, коли m+n дорівнює 1-3, бажано, коли m+n дорівнює 1-2.

У сполуках формули I замісник А бажано означає C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_6 -галогеналкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл(C_1 - C_4)алкіл або C_3 - C_6 -циклоалкіл(C_1 - C_4)алкіл, в якому метиленова група циклоалкільного фрагмента замінена на O, S або NR_0 , де R_0 означає C_1 - C_6 -алкіл або C_1 - C_6 -алкоксигрупу, або А означає C_2 - C_6 -алкеніл, C_3 - C_6 -алкініл, бензил, C_1 - C_4 -алкокси(C_1 - C_4)алкіл, C_1 - C_4 -алкокси(C_1 - C_4)алкокси(C_1 - C_4)алкіл або C_1 - C_4 -алкілтіо(C_1 - C_4)алкіл, бажано метил, етил, ізопропіл, трифторметил, 2,2,2-трифторетил, 2,2-дифторетил, 2-фторетил, циклопропіл, циклобутил, циклопентил, циклогексил, циклопропілметил, циклобутилметил, циклопентилметил, циклогексилметил, оксетан-3-ілметил, тетрагідрофуран-2-ілметил, тетрагідропіран-2-ілметил, тетрагідрофуран-3-ілметил, тетрагідропіран-3-ілметил, тетрагідропіран-4-ілметил, аліл, пропаргіл, бензил, метоксиметил, етоксиметил, метоксиетил, метоксипропіл, метоксиетоксиметил, метоксиметоксиетил, оксетаніл-3-іл, тетрагідропіран-4-іл або метилтіоетил.

В іншій бажаній групі сполук формули (I) R означає водень, метил, етил, трифторметил, аліл, пропаргіл, бензил, метоксиметил, етоксиметил або метоксиетил, X означає метил, етил, циклопропіл, метоксигрупу, фтор, бром або хлор, Y і Z, незалежно один від одного означають метил, етил, циклопропіл, метоксигрупу, фтор, хлор, бром, феніл або феніл, який містить в якості замісників галоген або C_1 - C_2 -алкіл, G означає водень і А має значеннями, які були привласнені йому вище.

В особливо бажаній групі сполук формули (I) R означає метил, етил, аліл, пропаргіл, метоксиметил, X означає метил, етил, циклопропіл, метоксигрупу, фтор, бром або хлор, Y і Z, незалежно один від одного означають метил, етил, циклопропіл, метоксигрупу, фтор, хлор, бром, феніл або феніл, який містить в якості замісників галоген C_1 - C_2 -алкіл, G означає водень і А має значення, які були привласнені йому вище.

У ще більш бажаній групі сполук формули (I) R означає метил, етил, метоксиметил, X означає метил, етил, циклопропіл, метоксигрупу, фтор, бром або хлор, Y і Z, незалежно один від одного означають метил, етил, циклопропіл, метоксигрупу, фтор, хлор, бром, феніл або феніл, який містить в якості замісників галоген або C_1 - C_2 -алкіл, G означає водень і А означає метил, етил, ізопропіл, трифторметил, 2,2,2-трифторетил, 2,2-дифторетил, 2-фторетил, циклопропіл, циклобутил, циклопентил, циклогексил, циклопропілметил, циклобутилметил, циклопентилметил, циклогексилметил, оксетан-3-ілметил, тетрагідрофуран-2-ілметил, тетрагідропіран-2-ілметил, тетрагідрофуран-3-ілметил, тетрагідропіран-3-ілметил, тетрагідропіран-4-ілметил, аліл, пропаргіл, бензил, метоксиметил, етоксиметил, метоксиетил, метоксипропіл, метоксиетоксиметил, метоксиметоксиетил, оксетаніл-3-іл, тетрагідропіран-4-іл або метилтіоетил.

У винятково бажаній групі сполук формули (I) R означає метил, етил, метоксиметил, X означає метил, етил, циклопропіл, метоксигрупу, фтор, бром або хлор, Y і Z, незалежно один від одного означають метил, етил, циклопропіл, метоксигрупу, фтор, хлор, бром, феніл або феніл, який містить в якості замісників галоген або C_1 - C_2 -алкіл, G означає водень і А означає метил, етил, ізопропіл, трифторметил, 2,2,2-трифторетил, 2,2-дифторетил, 2-фторетил, циклопропіл, циклогексил, циклопропілметил, аліл, пропаргіл, бензил, метоксиметил, етоксиметил, метоксиетил, метоксиетоксиметил, метоксиметоксиетил, оксетаніл-3-іл.

Даний винахід також належить до солей сполук формули I з амінами, з основами лужних металів і лужноземельних металів або з четвертинними амонієвими основами.

Із таких, які являються солеутворювачами гідроксидів перехідних металів, лужних металів і лужноземельних металів слід особливо відзначити гідроксиди літію, натрію, калію, магнію і кальцію, але бажано гідроксиди, натрію і калію.

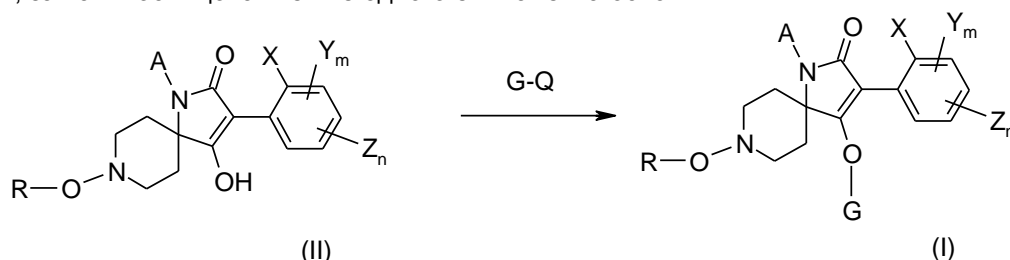
Сполуки формули I, запропоновані в даному винаході, також включають гідрати, які можуть утворитися при одержанні солей.

Приклади амінів, придатних для утворення солей амонію, включають аміак, а також первинні, вторинні і третинні C_1 - C_{18} -алкіламіни, C_1 - C_4 -гідроксиалкіламіни і C_2 - C_4 -алкоксиалкіламіни, наприклад, метиламін, етиламін, н-пропіламін, ізопропіламін, чотири ізомери бутиламіну, н-аміламін, ізоаміламін, гексиламін, гептиламін, октиламін, ноніламін, дециламін, пентадециламін, гексадециламін, гептадециламін, октадециламін, метилетиламін, метилізопропіламін, метилгексиламін, метилноніламін, метилпентадециламін, метилоктадециламін, етилбутиламін, етилгептиламін, етилоктиламін, гексилгептиламін, гексилктиламін, диметиламін, діетиламін, ди-н-пропіламін, діізопропіламін, ди-н-бутиламін, ди-н-аміламін, діізоаміламін, дигексиламін, дигептиламін, діоктиламін, етаноламін, н-пропаноламін, ізопропаноламін, N,N-діетаноламін, N-етилпропаноламін, н-бутилетаноламін, аліламін, н-бут-2-ениламін, н-пент-2-ениламін, 2,3-диметилбут-2-ениламін, дибут-2-ениламін, н-гекс-2-ениламін, пропілендіамін, триметиламін, триетиламін, три-н-пропіламін, тріізопропіламін, три-н-бутиламін,

тріізобутиламін, три-втор-бутиламін, три-н-аміламін, метоксиетиламін і етоксиетиламін; гетероциклічні аміни, наприклад, піридин, хінолін, ізохінолін, морфолін, піперидин, піролідін, індолін, хінуклідін і азепін; первинні ариламіни, наприклад, аніліни, метоксианіліни, етоксианіліни, о-, м- і п-толуїдини, фенілєндіаміни, бензидини, нафтиламіни і о-, м- і п-хлораніліни; але бажано триетиламін, ізопропіламін і дізопропіламін.

Бажані четвертинні амонієві основи, які можуть бути застосовані для утворення солей, відповідають, наприклад, формулі $[N(R_a R_b R_c R_d)]OH$, в якій R_a , R_b , R_c і R_d всі незалежно від інших означають C_1 - C_4 -алкіл. Інші підходящі тетраалкіламонієві основи з іншими аніонами можна одержати, наприклад, за допомогою аніонообмінних реакцій.

Сполуки, запропоновані в даному винаході, можна одержати за різними методиками. Наприклад, сполуки формули I, в якій замісники мають привласнені їм вище значення, можна одержати за методиками, які самі по собі відомі, наприклад, шляхом обробки сполук формули II алкілюючим, ацилюючим, фосфорилуючим або сульфонілюючим реагентом G-Q, де G означає алкільну, ацильну, фосфорильну або сульфонільну групу, яку необхідно приєднати, і Q означає нуклеофіл, за наявності щонайменше одного еквівалента основи:



Сполуки формули I, в якій G означає захисну групу формули $-C(X^a)-R^a$, $C(X^b)-X^c-R^b$ або $-C(X^d)-NR^cR^d$, можна одержати за методиками, відомими в даній галузі техніки, описаними, наприклад, в WO 09/049851. Зазвичай сполуки формули II обробляють ацилюючим реагентом, таким, як галогенангідрид кислоти (бажано хлорангідрид кислоти), ангідрид кислоти, галогенформіат (бажано хлорформіат), галогентіоформіат (бажано хлортіоформіат), ізоціанат, ізотіоціанат, карбамоїлгалогенід (бажано карбамоїлхлорид) або тіокарбамоїлгалогенід (бажано тіокарбамоїлхлорид), за наявності щонайменше одного еквівалента підходящої основи, необов'язково за наявності підходящого розчинника. Основа може бути неорганічною, такою як карбонат або гідроксид лужного металу або гідрид металу, або органічною основою, такою як третинний амін або алкоксид металу. Приклади підходящих неорганічних основ включають карбонат натрію, гідроксид натрію або калію, гідрид натрію і підходящі органічні основи включають триалкіламіни, такі як триметиламін і триетиламін, піридини або інші аміни-основи, такі як 1,4-діазабіцикло[2.2.2]октан і 1,8-діазабіцикло[5.4.0]ундец-7-ен. Бажані основи включають триетиламін і піридин. Підходящі для цієї реакції розчинники вибирають так, щоб вони були сумісні з реагентами, і вони включають прості ефіри, такі як тетрагідрофуран і 1,2-диметоксиетан, і галогеновані розчинники, такі як дихлорметан і хлороформ. Деякі основи, такі як піридин і триетиламін, можна з успіхом використовувати в якості і основи, і розчинника. У випадках, коли ацилюючим реагентом є карбонова кислота, ацилювання бажано проводити за наявності реагенту сполучення, такого як 2-хлор-1-метилпіридиніййодид, N,N'-дициклогексилкарбодімід, 1-(3-диметиламінопропіл)-3-етилкарбодімід і N,N'-карбодімідазол, і основи, такої як триетиламін або піридин, у підходящому розчиннику, такому як тетрагідрофуран, дихлорметан і ацетонітрил.

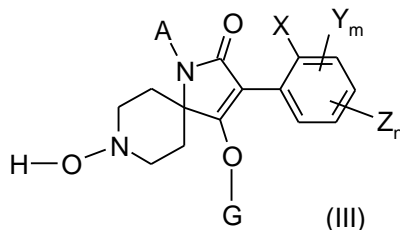
Сполуки формули I, в якій G означає захисну групу формули $C(X^b)-X^c-R^b$ або $-C(X^d)-NR^cR^d$, також можна одержати шляхом обробки сполук формули II фосгеном або еквівалентом фосгену, необов'язково за наявності розчинника, такого як толуол або етилацетат, і основи і реакцією хлорформіату, який утворився, або його еквівалента зі спиртом, тіолом або аміном при відомих умовах, як описано, наприклад, в US 6774133, US 6555567 і US 6479489.

Сполуки формули I, в якій G означає захисну групу формули $-P(X^e)R^fR^g$, можна одержати із сполук формули II за методиками, описаними, наприклад, в US 6774133, US 6555567 і US 6479489.

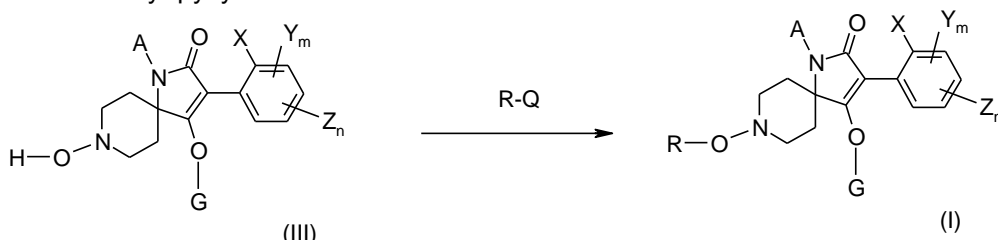
Сполуки формули I, в якій G означає захисну групу формули $-SO_2R^e$, можна одержати за реакцією сполук формули II з алкіл- або арилсульфонілгалогенідом, бажано за наявності щонайменше одного еквівалента основи.

Сполуки формули I, в якій G означає C_1 - C_6 -алкіл, C_2 - C_6 -алкеніл, C_3 - C_6 -алкініл або захисну групу формули $CH_2-X^f-R^h$, можна одержати шляхом обробки сполуки формули II сполукою формули G-Y, в якій Y означає галоген (бажано бром або йод), сульфат (бажано мезилат або тозилат) або сульфат, бажано за наявності основи, за відомих умов.

Сполуки формули III



можна одержати шляхом каталітичного гідрування сполук формули I, в якій R означає бензильну групу.



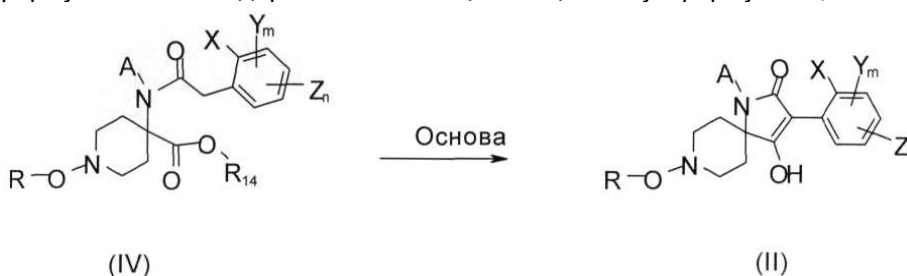
5

Сполуки формули I, в якій R означає $-C(X^a)-R^a$, $C(X^b)-X^c-R^b$ або $-C(X^d)-NR^cR^d$, SO_2R^e , $P(X^e)R^fR^g$ або $CH_2-X^f-R^h$, можна одержати шляхом обробки сполук формули III алкілюючим, ацилюючим, фосфорилюючим або сульфонілюючим реагентом R-Q, де Q означає нуклеофіл, за наявності щонайменше одного еквівалента основи.

10

Підходящими умовами є такі ж, як описані вище для перетворення сполук формули II в сполуки формули I.

Сполуки формули II можна одержати шляхом циклізації сполук формули IV,



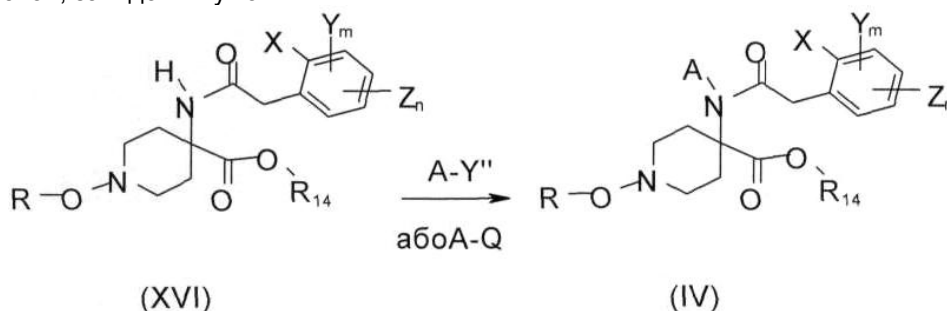
15

в якій R_{14} означає C_1-C_6 -алкіл, бажано за наявності основи і необов'язково за наявності підходящого розчинника, за відомими методиками, аналогічними описаним, наприклад, у WO 09/049851.

20

Сполуки формули IV, в якій R_{14} є таким, як визначено вище, і в якій A означає C_1-C_6 -алкіл, C_1-C_6 -галогеналкіл, C_3-C_6 -циклоалкіл, C_3-C_6 -циклоалкіл(C_1-C_4)алкіл або C_3-C_6 -циклоалкіл(C_1-C_4)алкіл, в якому метиленова група циклоалкільного фрагмента замінена на O, S або NR_0 , де R_0 означає C_1-C_6 -алкіл або C_1-C_6 -алкоксигрупу, або A означає C_2-C_6 -алкеніл, C_2-C_6 -галогеналкеніл, C_3-C_6 -алкініл, C_1-C_6 -ціаноалкіл, бензил, C_1-C_4 -алкокси(C_1-C_4)алкіл, C_1-C_4 -алкокси(C_1-C_4)алкокси(C_1-C_4)алкіл, оксетаніл, тетрагідрофураніл, тетрагідропіраніл або C_1-C_4 -алкілтїо(C_1-C_4)алкіл, можна одержати шляхом обробки сполуки формули XVI алкілюючим реагентом формули A-Y'', в якій A означає алкільну групу, яку необхідно приєднати, і Y'' означає галоген (бажано бром або йод), сульфонат (бажано мезилат або тозілат) або сульфат, бажано за наявності основи, за відомих умов.

25



30

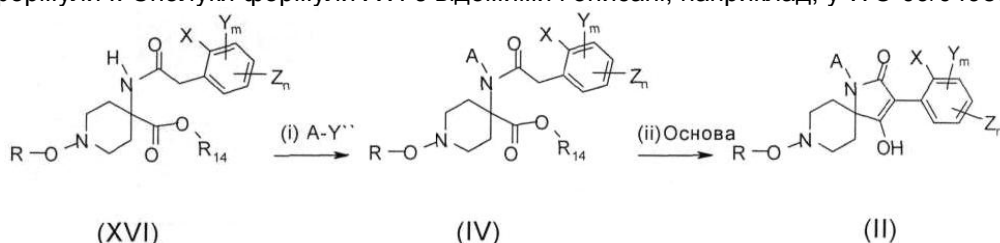
Сполуки формули IV, в якій R_{14} є таким, як визначено вище, і в якій A означає C_1-C_6 -алкілкарбоніл, C_1-C_6 -алкоксикарбоніл, C_3-C_6 -циклоалкілкарбоніл, N-ди(C_1-C_6 -алкіл)карбамоїл, бензоїл, C_1-C_6 -алкілсульфоніл або фенілсульфоніл, можна одержати шляхом обробки сполук

формули XVI алкілюючим або сульфонілюючим реагентом A-Q, де A означає ацильну або сульфонільну групу, яку необхідно приєднати, і Q означає нуклеофіл, за наявності щонайменше одного еквівалента основи, за відомих умов, описаних, наприклад, у публікації S.M.B. Fraga et al., Eur. J. Org. Chem. (2004), (8), 1750-1760.

5 Сполуки формули IV, в якій R₁₄ є таким, як визначено вище, і в якій A означає C₁-C₆-алкілкарбоніл, C₁-C₆-алкоксикарбоніл, C₃-C₆-циклоалкілкарбоніл або N-ди(C₁-C₆-алкіл)карбамоїл, також можна одержати шляхом обробки сполук формули XVI фосгеном або еквівалентом фосгену, необов'язково за наявності розчинника, такого як толуол або етилацетат, і основи і реакцією хлорформіату, який утворився, або його еквівалента зі спиртом або аміном за відомих умов.

10 Сполуки формули IV, в якій R₁₄ є таким, як визначено вище, і в якій A означає C₁-C₆-алкілсульфоніл або фенілсульфоніл, можна одержати за реакцією сполук формули XVI з алкіл- або фенілсульфонілгалогенідом, бажано за наявності щонайменше одного еквівалента основи, за відомих умов.

15 Підходящими умовами є такі ж, як описані вище для перетворення сполук формули II в сполуки формули I. Сполуки формули XVI є відомими і описані, наприклад, у WO 09/049851.

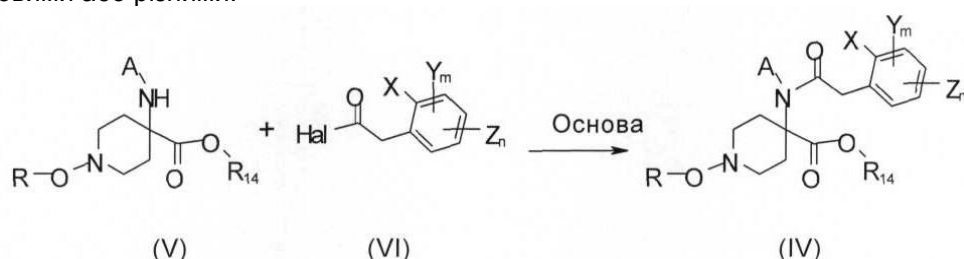


20 Сполуки формули II, в якій A означає C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галогеналкіл, C₃-C₆-циклоалкіл, C₃-C₆-циклоалкіл(C₁-C₄)алкіл або C₃-C₆-циклоалкіл(C₁-C₄)алкіл, в якому метиленова група циклоалкільного фрагмента замінена на O, S або NR₀, де R₀ означає C₁-C₆-алкіл або C₁-C₆-алкоксигрупу, або A означає C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₆-галогеналкеніл, C₃-C₆-алкініл, C₁-C₆-ціаноалкіл, бензил, C₁-C₄-алкокси(C₁-C₄)алкіл, C₁-C₄-алкокси(C₁-C₄)алкокси(C₁-C₄)алкіл, оксетаніл, тетрагідрофураніл, тетрагідропіраніл або C₁-C₄-алкілтіо(C₁-C₄)алкіл, також можна одержати за двостадійною однореакторною методикою, яка включає

25 (i) N-алкілювання амідів формули XVI реагентом A-Y'', де A означає алкільну групу, яку необхідно приєднати, і де Y'' означають нуклеофіл, визначений вище, за наявності щонайменше одного еквівалента основи, і

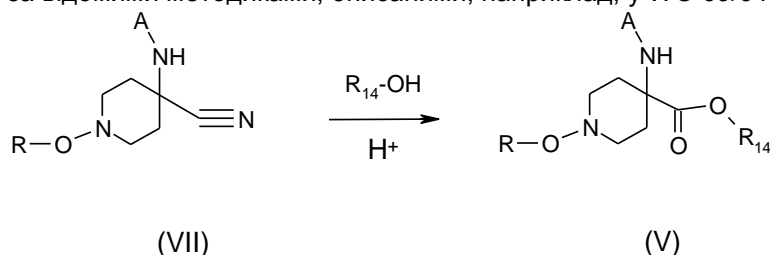
(ii) циклізацію проміжних продуктів формули IV, бажано за наявності щонайменше ще одного еквівалента додаткової основи, і необов'язково за наявності підходящого розчинника, за методами, описаними вище.

30 R₁₄ зазвичай означає C₁-C₆- алкіл. Основа, яка використовується на стадіях (i) і (ii), можуть бути однаковими або різними.



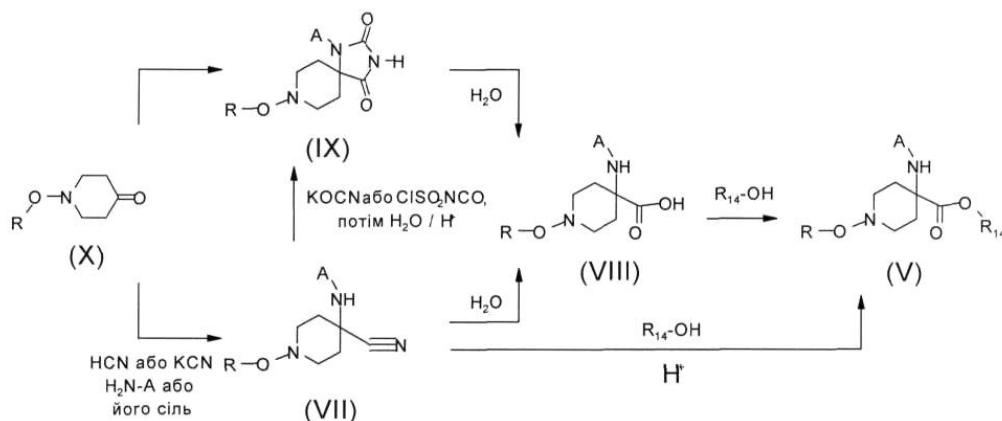
35 Сполуки формули IV можна одержати за реакцією похідних N-заміщених амінокислот формули V з фенілацетилгалогенідами формули VI, бажано за наявності основи в підходящому розчиннику, за відовими методиками, аналогічними описаним, наприклад, у WO 09/049851. Основа може бути неорганічною, такою як карбонат або гідроксид лужного металу або гідрид металу, або органічною основою, такою як третинний амін або алкоксид металу. Приклади підходящих неорганічних основ включають карбонат натрію, гідроксид натрію або калію, гідрид натрію і підходящі органічні основи включають триалкіламіни, такі як триметиламін і триетиламін, піридини або інші аміни-основи, такі як 1,4-діазабіцикло[2.2.2]-октан і 1,8-діазабіцикло[5.4.0]ундец-7-ен. Бажані основи включають триетиламін і піридин. Підходящі для цієї реакції розчинники вибирають так, щоб вони були сумісні з реагентами, і вони включають прості ефіри, такі як тетрагідрофуран і 1,2-диметоксиетан і галогеновані розчинники, такі як дихлорметан і хлороформ. Деякі основи, такі як піридин і триетиламін, можна з успіхом використовувати в якості і основи, і розчинника.

Фенілацетилгалогеніди формули VI, в якій Hal означає Cl або Br, є відомими сполуками або їх можна одержати за відомими методиками, описаними, наприклад, у WO 09/049851.



Ефіри N-заміщених амінокислот формули V, в якій R_{14} означає C_1 - C_6 -алкіл, можна одержати за реакцією N-заміщених амініонітрilів формули VII зі спиртом формули $R_{14}OH$, бажано за наявності сильної кислоти (бажано сірчаної кислоти або хлористоводневої кислоти) за відомих умов.

Ефіри N-заміщених амінокислот формули V, в якій R_{14} означає C_1 - C_6 -алкіл, також можна одержати за відомими методиками із N-заміщених амінокислот формули VIII. Етерифікація сполуки VIII спиртом формули $R_{14}OH$ при активуванні тіонілхлоридом є типовим прикладом одержання складних ефірів V, як описано, наприклад, у WO09/049851, але також можна використовувати інші методики етерифікації, такі як, наприклад, обробка сполуки формули VIII спиртом формули $R_{14}OH$ у кислому середовищі (зазвичай у H_2SO_4 або HCl). У конкретному випадку, коли R_{14} означає метил, сполуку формули VIII також можна обробити діазометаном або триметилсилілдіазометаном, або ацетилхлоридом у метанолі. Сполуки VIII, VII і V можна ввести в реакцію та/або виділити у вигляді вільних амінів або солей амінів (наприклад, гідрогалогеніду, більш бажано гідрохлориду або гідроброміду, або будь-якої іншої еквівалентної солі).



Самі N-заміщені амінокислоти формули VIII можна одержати за відомими методиками, зазвичай за умов проведення гідролізу, зазвичай кислотного або лужного, із N-заміщених амініонітрilів формули VII. Типовий приклад гідролізу нітрилу з утворенням відповідної карбонової кислоти при умовах використання водного розчину H_2SO_4 або HCl описаний, наприклад, у публікації E.F.G. Duynstee et al., Recueil Trav. Chim. Pays-Bas 84, 1442-1451, (1965) або у публікації B. Wang et al., Eur. J. Org. Chem. (2008), (2), 350-355.

Крім того, N-заміщені амінокислоти формули VIII можна одержати із кетонів формули X шляхом синтезу за Штрекером через N-заміщені амініонітрили формули VII. Перетворення кетону X в N-заміщені амініонітрили VII (реакція Штрекера) є докладно описаною одnoreакторною трьохкомпонентною реакцією комбінації, яка включає використання, крім кетонів X, ціаніду водню, HCN , або різних ціанідів лужних металів (наприклад, KCN , $NaCN$ і т. п.) у забуференому водному середовищі, або триметилсилілціаніду $TMSCN$, необов'язково за наявності каталітичної кількості кислоти Л'юїса, наприклад, ZnI_2 , і N-заміщеного аміну формули H_2N-A у вигляді вільного аміну або солі аміну (наприклад, гідрогалогеніду, більш бажано гідрохлориду або гідроброміду, або будь-якої іншої еквівалентної солі аміну H_2N-A). Відповідне джерело ціанід-іону (наприклад, HCN) також можна додати до кетиміну (або імінієвої солі), попередньо отриманому за реакцією кетону X і N-заміщеного аміну H_2N-A або його солі. Короткий опис області застосування реакції Штрекера наведений, наприклад, у публікації L. Kürti, B. Czako, "Strategic Applications of Named Reactions in Organic Synthesis", Elsevier Academic Press, 2005, pp. 446-447 and 690-691. Типові умови проведення реакції Штрекера також описані, наприклад, у публікації M.M. Mehrotra et al., J. Med. Chem. (2004), 47, 2037-2061, або у публікації

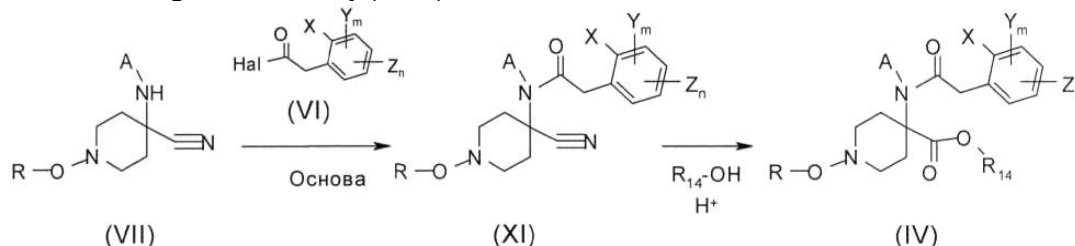
B.J. Mavunkel et al., J. Med. Chem. (1996), 39, 3169-3173, або у публікації P.L. Feldman et al., J. Org. Chem. (1990), 55, 4207-4209, або у публікації J.L. Marco et al., Tetrahedron (1999), 55, 7625-7644.

Альтернативно, амінокислоти формули VIII також можна одержати із кетонів формули X за реакцією Бухерера-Бергса, описаній, наприклад, у публікації Th. Wieland et al., Methoden Org. Chem. (Houben-Weyl) (1959), Bd. XI/2, 305-306, через N1-заміщені гідантоїни формули IX. Перетворення кетону X у гідантоїн IX можна провести, наприклад, за методикою, аналогічною описаній у публікації L. Tang et al., Heterocycles (2007), 74, 999-1008. N1-Заміщені гідантоїни IX можна також легко одержати із N-заміщених аміонітрилів VII шляхом обробки ціанатом лужного металу (наприклад, ціанатом калію KOCN) з наступним гідролізом у кислому водному середовищі, наприклад, за методикою, аналогічною описаній у публікації G.M. Carrera et al., J. Heterocyclic Chem. (1992), 29, 847-850, або у публікації I.M. Bell et al., Bioorg. Med. Chem. Lett. (2006), 16, 6165-6169. Ще однією можливістю циклізації N-заміщених аміонітрилів VII з утворенням спірогідантоїнів IX є реакція з хлорсульфонілізоціанатом ClSO₂NCO, наприклад, у дихлорметані, з наступним гідролізом кислотою у водному середовищі, наприклад, за методикою, аналогічною описаній у публікації P.L. Feldman et al., J. Org. Chem. (1990), 55, 4207-4209, або в публікації M.W. Rowbottom, Bioorg. Med. Chem. Lett. (2007), 17, 2171-2178.

N-заміщені амінокислоти формули VIII можна одержати за відомими методиками, зазвичай за умов проведення термічного гідролізу, зазвичай кислотного або лужного, із N1-заміщених гідантоїнів IX. Типовий приклад гідролізу гідантоїну з утворенням відповідної амінокислоти за умов використання водного розчину NaOH описаний, наприклад, у публікації P.L. Feldman et al., J. Org. Chem. (1990), 55, 4207-4209.

Сполуки VIII, VII і V можна ввести в реакцію та/або виділити у вигляді вільних амінів або солей амінів (наприклад, гідрогалогеніду, більш бажано гідрохлориду або гідроброміду, або будь-якої іншої еквівалентної солі).

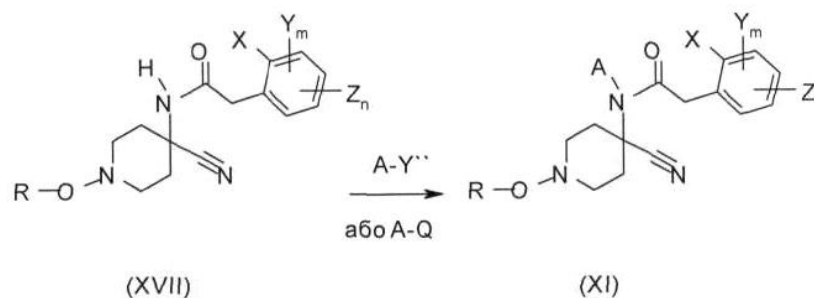
Сполуки формули X, в якій R означає C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галогеналкіл, C₂-C₆-алкеніл, C₃-C₆-алкініл, C₁-C₆-ціаноалкіл, бензил, C₁-C₄-алкокси(C₁-C₄)алкіл або C₁-C₄-алкокси(C₁-C₄)алкокси(C₁-C₄)алкіл, є відомими або їх можна одержати, наприклад, у відповідності до публікації Major and Dursch, Journal of Organic Chemistry (1961), 26, 1867-74.



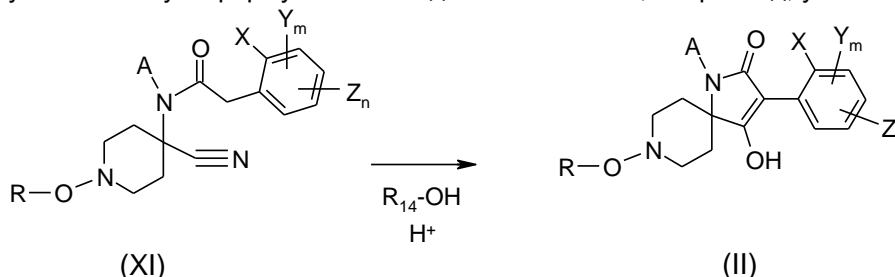
Альтернативно, сполуки формули IV можна одержати шляхом алкоголізу похідних формули XI за допомогою R₁₄OH, бажано за наявності сильної кислоти (бажано сірчаної кислоти або хлористоводневої кислоти) за відомими методиками, аналогічними описаним, наприклад, у WO 09/049851.

Самі сполуки формули XI можна одержати за реакцією N-заміщених аміонітрилів формули VII з фенілацетилгалогенідами формули VI, бажано за наявності основи у підходящому розчиннику, за відомими методиками, аналогічними описаним, наприклад, у WO 09/049851. Основа може бути неорганічною, такою як карбонат або гідроксид лужного металу або гідрид металу, або органічною основою, такою як третинний амін або алкоксид металу. Приклади підходящих неорганічних основ включають карбонат натрію, гідроксид натрію або калію, гідрид натрію і підходящі органічні основи включають триалкіламіни, такі як триметиламін і триетиламін, піридини або інші аміни-основи, такі як 1,4-діазабіцикло[2.2.2]-октан і 1,8-діазабіцикло[5.4.0]ундец-7-ен. Бажані основи включають триетиламін і піридин. Підходящі для цієї реакції розчинники вибирають так, щоб вони були сумісні з реагентами, і вони включають прості ефіри, такі як тетрагідрофуран і 1,2-диметоксиетан і галогеновані розчинники, такі як дихлорметан і хлороформ. Деякі основи, такі як піридин і триетиламін, можна з успіхом використовувати у якості і основи, і розчинника.

Сполуки формули XI також можна одержати шляхом обробки сполуки формули XVII алкілюючим реагентом формули A-Y'', в якій A означає алکیلну групу, яку необхідно приєднати, і Y'' означає галоген (бажано бром або йод), сульфат (бажано мезилат або тозилат) або сульфат, або ацилюючим або сульфонілюючим реагентом A-Q, де A означає ацильну або сульфонільну групу, яку необхідно приєднати, і Q означає нуклеофіл, бажано за наявності основи, за відомих умов.

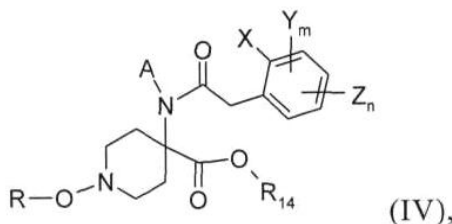


Підходящими умовами є такі ж, як описані вище для перетворення сполук формули XVI в сполуки формули IV. Сполуки формули XVII є відомими і описані, наприклад, у WO 09/049851.

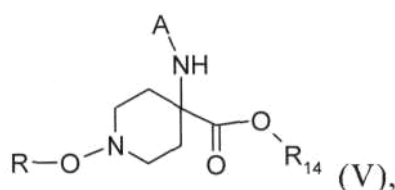


5 Сполуки формули II також можна одержати за реакцією нітрилів формули XI з $R_{14}OH$ за наявності сильної кислоти (бажано сірчаної кислоти або хлористоводневої кислоти), необов'язково за наявності розчинника, бажано при підвищеній температурі, наприклад, від 50 до 150 °C, з наступним гідролізом, наприклад, шляхом виливання неочищеної реакційної суміші на лід, у прямій послідовності реакцій циклізації.

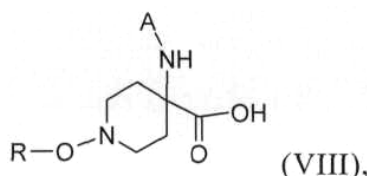
10 Приведені нижче сполуки формули IV, V, VII, VIII, IX і XI, і їх солі є новими і були розроблені спеціально для синтезу сполук формули I:
сполуки формули IV



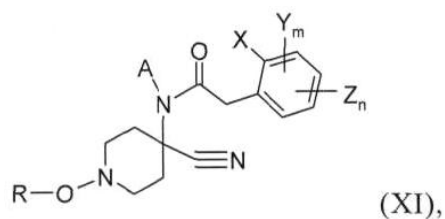
15 і їх солі, в якій X, Y, Z, m, n, R і A мають привласнені їм вище значення і R_{14} означає C_1-C_6 -алкіл;
сполуки формули V



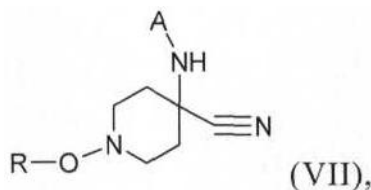
і їх солі, в якій R і A мають привласнені їм вище значення і R_{14} означає C_1-C_6 -алкіл;
сполуки формули VIII



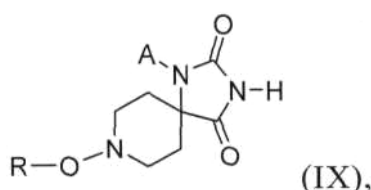
20 і їх солі, в якій R і A мають привласнені їм вище значення;
сполуки формули XI



і їх солі, в якій X, Y, Z, m, n, R і A мають привласнені їм вище значення;
сполуки формули VII



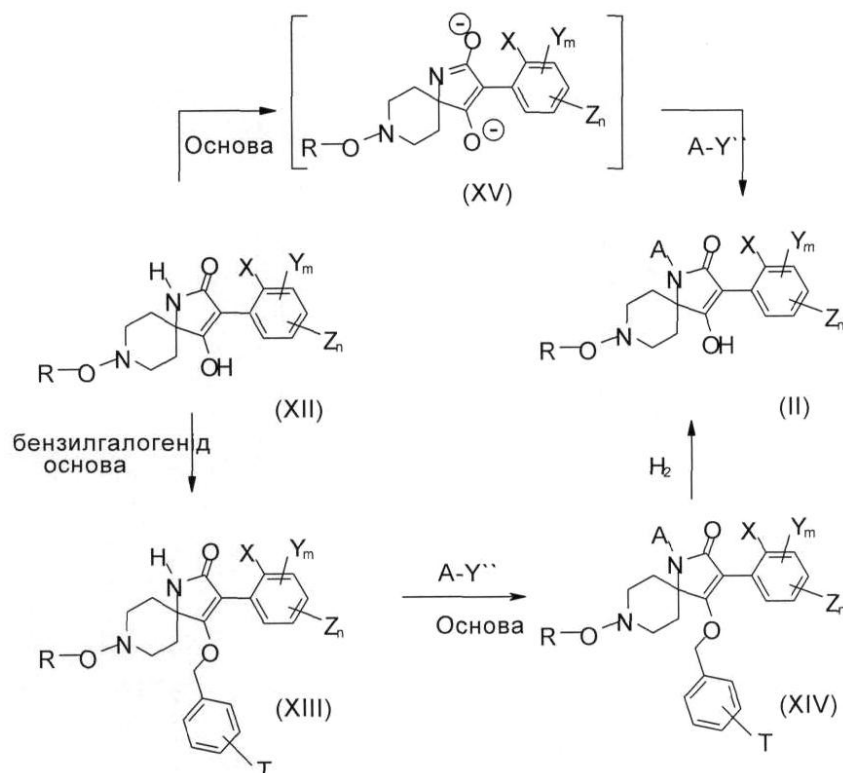
5 і їх солі, в якій R і A мають привласнені їм вище значення, і
сполуки формули IX



і їх солі, в якій R і A мають привласнені їм вище значення.

10 Інші вихідні речовини і проміжні продукти, зазначені на схемах реакцій, є відомими або їх
можна одержати за методиками, відомими фахівцю в даній галузі техніки.

Інший спосіб одержання сполук формули II включає каталітичне гідрування сполук формули
XIV, які містять простий бензиловий ефір гідроксигрупи енольної форми, в яких бензильна група
необов'язково може бути заміщена за допомогою T, де T означає, наприклад, 4-метоксигрупу
або 3,4-диметоксигрупу. Умови обробки сполуки XIV воднем (тиск 1-100 бар) і каталітичною
15 кількістю паладію (наприклад, паладій на вугіллі 1-30 мас. %) у розчинниках, таких як метанол
або тетрагідрофуран, необов'язково таких, що додатково містять воду або кислоти, такі як HCl,
при 0-100 °C є типовими умовами проведення реакції гідрогенолітичного дебензилювання.
Типова методика описана, наприклад, у публікації Schobert et al., Organic & Biomolecular
Chemistry 2004, 2, 3524-3529. Інші м'які умови реакції видалення бензильної групи включають
20 використання триетилсилану і каталітичної кількості ацетату паладію(II) за наявності основи,
наприклад, у відповідності до публікації Paintner et al., Synlett 2003, 627-30.



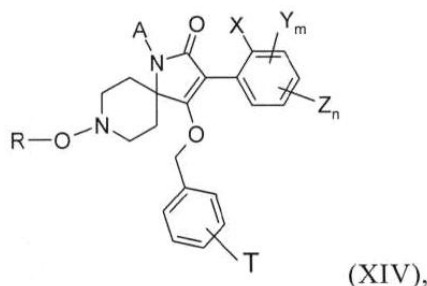
Сполуки формули XIV можна одержати шляхом обробки сполуки формули XIII алкілюючим реагентом формули A-Y'', в якій А означає алکیلну групу, яку необхідно приєднати, і Y'' означає галоген (бажано бром або йод), сульфонат (бажано мезилат або тозілат) або сульфат, бажано за наявності основи, при відомих умовах.

Сполуки формули XIII можна одержати шляхом обробки сполуки формули XII бензилгалогенідом, який необов'язково може бути заміщений за допомогою Т, де Т є таким, як визначено вище, за наявності основи, при відомих умовах, наприклад, за методикою, аналогічною описаній у публікації R. Labruere et al., Synthesis (2006), (24), 4163-4166, або у публікації Y. Bourdreux et al., Tetrahedron (2008), 64(37), 8930-8937.

Підходящими умовами проведення перетворень XII у XIII і XIII у XIV є, наприклад, такі ж, як описані вище для перетворення сполук формули II у сполуки формули I. Сполуки формули XII і XIII є відомими і описані, наприклад, у WO 09/049851.

Ще один спосіб одержання сполук формули II включає обробку сполук формули XII щонайменше двома еквівалентами основи за наявності підходящого розчинника і при відповідній температурі з утворенням проміжного діаніону формули XV, який потім обробляють алкілюючим реагентом формули A-Y'', у якій А означає алکیلну групу, яку необхідно приєднати, і Y'' означає галоген (бажано бром або йод), сульфонат (бажано мезилат або тозілат) або сульфат, за відомих умов.

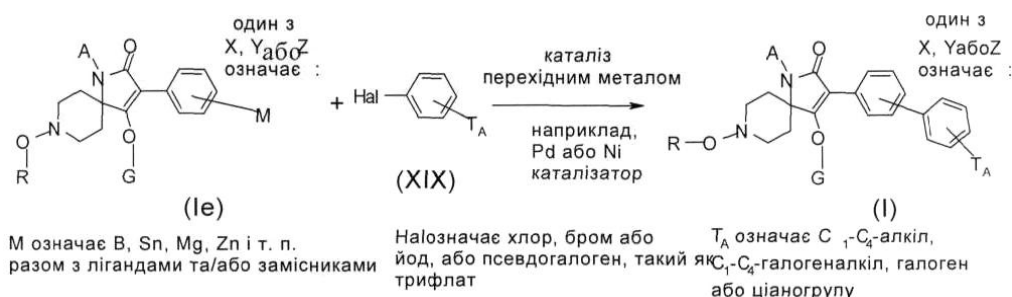
Сполуки формули XIV



в якій X, Y, Z, m, n, R, T і А мають привласнені їм вище значення, є новими і були розроблені спеціально для синтезу сполук формули I.



Сполуки формули I, в якій X, Y або Z означає феніл який містить в якості замісників C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, галоген або ціаногрупу, можна одержати за реакцією відповідного галогеновмісного попередника формули Id, в якій Hal означає хлор, бром, йод або псевдогалоген, такий як C₁-C₄-галогеналкілсульфонат, бажано трифлат, відповідними металоорганічними фенільними сполуками формули XVIII, в якій T_A означає C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, галоген або ціаногрупу і M означає, наприклад, B, Sn, Si, Mg або Zn разом з додатковими лігандами та/або замісниками, за реакцією, каталізованою перехідним металом. Металоорганічною сполукою формули XVIII є, наприклад, арилборонова кислота T_A-феніл-B(OH)₂, або її підходяща сіль або ефір, які вступають у реакцію із сполукою формули Id при умовах каталізу паладієм або нікелем, таких як, наприклад, умови реакції Судзукі-Міяура. У реакції цього типу можна використовувати різні метали, каталізатори і ліганди. Умови проведення реакцій і каталітичні системи для проведення такого перетворення описані, наприклад, у WO08/071405.



Фахівець у даній галузі техніки повинен розуміти, що в цій реакції перехресного сполучення полярність двох реакційних центрів може бути оберненою. Сполуки формули I, в якій X, Y або Z означає феніл або феніл, який містить в якості замісників C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, галоген або ціаногрупу, також можна одержати за реакцією відповідної металоорганічної сполуки формули Ie, в якій M означає, наприклад, B, Sn, Si, Mg або Zn разом з додатковими лігандами та/або замісниками, з арилгалогенідом формули XIX, в якій Hal означає хлор, бром, йод або псевдогалоген, такий як C₁-C₄-галогеналкілсульфонат, бажано трифлат, за реакцією, каталізованою перехідним металом і за умов, аналогічних описаним вище.

Сполуки формули I, II, III, IV, XI і XIV і проміжні продукти формули, VII, VIII і IX, в якій A означає групу, яка містить атом S, що знаходиться в окисленому стані, наприклад, у випадку, якщо A означає C₁-C₄-алкілтіо(C₁-C₄)алкіл, можна легко перетворити із сульфідів у сульфоксиди або сульфони за реакцією окислення, в якій наряду з багатьма іншими використовуються такі реагенти, як, наприклад, м-хлорпербензойна кислота (МХПБК), оксон, періодат натрію, гіпохлорит натрію або трет-бутилгіпохлорит.

Реагенти можна ввести в реакцію за наявності основи. Прикладами підходящих основ є гідроксиди лужних і лужноземельних металів, гідриди лужних і лужноземельних металів, амідні лужних і лужноземельних металів, алкоксиди лужних і лужноземельних металів, ацетати лужних і лужноземельних металів, карбонати лужних і лужноземельних металів, діалкіламіди лужних і лужноземельних металів або алкілсиліламіди лужних і лужноземельних металів, алкіламіни, алкілендіаміни, незаміщені або N-алкіловані насичені і ненасичені циклоалкіламіни, основні гетероцикли, гідроксиди амонію і карбоциклічні аміни. Прикладами, які можна відзначити, є гідроксид натрію, гідрид натрію, амід натрію, метоксид натрію, ацетат натрію, карбонат натрію, трет-бутоксид калію, гідроксид калію, карбонат калію, гідрид калію, діізопропіламід літію, біс(триметилсиліл)амід калію, гідрид кальцію, триетиламін, діізопропілетиламін, триетилендіамін, циклогексиламін, N-циклогексил-N,N-диметиламін, N,N-діетиламінін, піридин, 4-(N,N-диметиламіно)піридин, хінуклідин, N-метилморфолін, бензилтриметиламонійгідроксид і 1,8-діазабіцикло[5.4.0]ундец-7-ен (ДБУ).

Реагенти можна ввести в реакцію один з одним як такі, тобто без додавання розчинника або розріджувача. Однак у більшості випадків бажано додати інертний розчинник або розріджувач або їх суміш. Якщо реакцію проводять за наявності основи, то основи використовують у надлишку і такі основи, як триетиламін, піридин, N-метилморфолін або N,N-діетиламінін, також

5

можуть виступати в якості розчинників або розріджувачів. Реакцію бажано проводити в температурному діапазоні від приблизно -80 до приблизно +140 °C, бажано від приблизно -30 до приблизно +100 °C, у багатьох випадках - у діапазоні від температури навколишнього середовища і приблизно до +80 °C.

10

Сполука формули I за методикою, яка сама по собі відома, можна перетворити в іншу сполуку формули I шляхом заміни одного або більшої кількості замісників вихідної сполуки формули I, яка проводиться звичайним способом, на іншій (інші) замісник (замісники), запропоновані в даному винаході.

15

В залежності від вибору умов проведення реакції і вихідних речовин, які є підходящими у кожному випадку, можна, наприклад, тільки на одній стадії реакції замінити один замісник на інший замісник, запропонований у даному винаході, або на тій же стадії реакції замінити велику кількість замісників на інші замісники, запропоновані у даному винаході.

20

Солі сполук формули I можна одержати за методиками, які самі по собі відомі. Так, наприклад, солі приєднання з кислотами сполук формули I одержують шляхом обробки підходящою кислотою або підходящим іонообмінним реагентом і солі з основами одержують шляхом обробки підходящою основою або підходящим іонообмінним реагентом.

25

Солі сполук формули I можна звичайним способом перетворити у вільні сполуки формули I, солі приєднання з кислотами, наприклад, шляхом обробки підходящою основою або підходящим іонообмінним реагентом, і солі з основами, наприклад, шляхом обробки підходящою кислотою або підходящим іонообмінним реагентом.

30

Солі сполук формули I за методиками, які самі по собі відомі, можна перетворити в інші солі сполук формули I, солі приєднання з кислотами, наприклад, в інші солі приєднання з кислотами, наприклад, шляхом обробки солі неорганічної кислоти, такої як гідрохлорид, підходящою сіллю металу, такої як сіль натрію, барію або срібла, наприклад, ацетатом срібла, у підходящому розчиннику, у якому неорганічна сіль, яка утворюється, наприклад, хлорид срібла, нерозчинна і тому осаджується із реакційної суміші.

Залежно від методики або умов проведення реакції сполуки формули I, які мають солеутворюючу здатність, можна одержати у вільній формі або у формі солі.

35

Сполуки формули I і, якщо це доцільно, їх таутомери, у кожному випадку у вільній формі або у формі солі, можуть міститися у формі одного з ізомерів, який є можливим, або у вигляді їх суміші, наприклад, у вигляді чистих ізомерів, таких як антиподи та/або діастереоізомери, або у вигляді сумішей ізомерів, таких як суміші енантіомерів, наприклад, рацематів, сумішей діастереоізомерів або сумішей рацематів залежно від кількості, абсолютної або відносної конфігурації асиметричних атомів вуглецю, які містяться у молекулі, та/або залежно від конфігурації неароматичних подвійних зв'язків, які містяться у молекулі; даний винахід належить до чистих ізомерів, а також до всіх сумішей ізомерів, які є можливими і у кожному випадку вище і нижче у даному винаході їх слід розуміти у такому значенні, навіть якщо у кожному випадку не вказані подробиці стереохімії.

40

Суміші діастереоізомерів або суміші рацематів сполук формули I, у вільній формі або у формі солі, які можна одержати залежно від того, які вихідні речовини і методики вибрані, за відомими методиками можна розділити на чисті діастереоізомери або рацемати на основі відмінностей фізико-хімічних характеристик компонентів, наприклад, шляхом фракційної кристалізації, перегонки та/або хроматографії.

45

Суміші енантіомерів, такі як рацемати, які можна одержати аналогічним способом, можна розділити на оптичні антиподи за відомими методиками, наприклад, шляхом перекристалізації із оптично активного розчинника, за допомогою хроматографії на хіральних сорбентах, наприклад, за допомогою вискоєфективної рідинної хроматографії (ВЕРХ) на ацетилцелюлозі, за допомогою підходящих мікроорганізмів, шляхом розщеплення за допомогою специфічних іммобілізованих ферментів, шляхом утворення сполук включення, наприклад, з використанням хіральних краун-ефірів, з якими утворює комплекс тільки один енантіомер, або шляхом перетворення у солі діастереоізомерів, наприклад, за реакцією рацемату основного кінцевого продукту з оптично активною кислотою, такою як карбонова кислота, наприклад, камфорна, винна або яблучна кислота, або сульфенова кислота, наприклад, камфорсульфенова кислота, і розділення суміші діастереоізомерів, які можна одержати таким способом, наприклад, за допомогою фракційної кристалізації, заснованої на відмінності їх розчинностей, з одержанням

50

55

діастереоізомерів, з яких можна виділити шуканий енантіомер шляхом обробки підходящими реагентами, наприклад, основними реагентами.

5 Чисті діастереоізомери або енантіомери у контексті даного винаходу можна одержати не тільки шляхом розділення підходящих сумішей ізомерів, але і за загальновідомими методиками діастереоселективного або енантіоселективного синтезу, наприклад, шляхом здійснення способу, запропонованого в даному винаході, з вихідними речовинами, які мають підходящу стереохімічну конфігурацію.

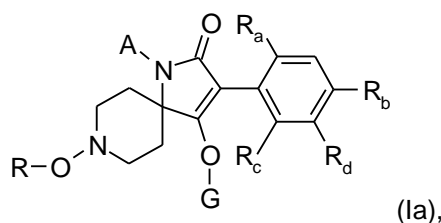
10 У кожному випадку бажано виділяти або синтезувати біологічний більш ефективний ізомер, наприклад, енантіомер або діастереоізомер, або суміш ізомерів, наприклад, суміш енантіомерів або суміш діастереоізомерів, якщо окремі компоненти мають різну біологічну активність.

Сполуки формули I і, якщо це доцільно, їх таутомери, у кожному випадку у вільній формі або у формі солі, також можна, якщо це доцільно одержати у формі гідратів та/або у формі, яка включає інші розчинники, наприклад, ті, які могли використовуватися для кристалізації сполук, які перебувають у твердій формі.

15 Сполуки, приведені нижче у таблицях 1-116, можна одержати за описаними вище методиками. Приведені нижче приклади призначені для ілюстрації даного винаходу і в них вказані бажані сполуки формули I.

Таблиця 1: В цій таблиці розкриті 132 сполуки від T1.001 до T1.132 формули Ia:

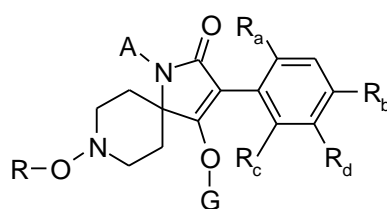
Таблиця 1



в якій R означає CH₃, A означає CH₃, G означає водень і R_a, R_b, R_c і R_d є такими, як визначено нижче:

№	R _a	R _b	R _c	R _d
T1.001	Br	H	H	H
T1.002	Cl	H	H	H
T1.003	CH ₃	H	H	H
T1.004	CH ₂ CH ₃	H	H	H
T1.005	OCH ₃	H	H	H
T1.006	Br	Cl	H	H
T1.007	Cl	Br	H	H
T1.008	Cl	Cl	H	H
T1.009	Cl	CH ₃	H	H
T1.010	CH ₃	Cl	H	H
T1.011	CH ₃	CH ₃	H	H
T1.012	Cl	H	Cl	H
T1.013	Cl	H	CH ₃	H
T1.014	Cl	H	CH ₂ CH ₃	H
T1.015	Cl	H	OCH ₃	H
T1.016	CH ₃	H	CH ₃	H
T1.017	CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	H
T1.018	CH ₃	H	OCH ₃	H
T1.019	CH ₂ CH ₃	H	CH ₂ CH ₃	H
T1.020	CH ₂ CH ₃	H	OCH ₃	H
T1.021	OCH ₃	H	OCH ₃	H
T1.022	Br	H	H	Cl
T1.023	Br	H	H	CH ₃
T1.024	Br	H	H	4-Cl-C ₆ H ₄
T1.025	Cl	H	H	Cl
T1.026	Cl	H	H	CH ₃
T1.027	Cl	H	H	4-Cl-C ₆ H ₄

Таблиця 1

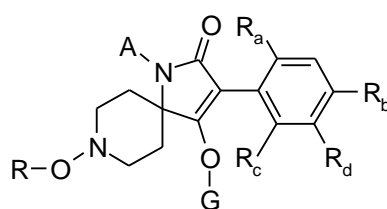


(Ia),

в якій R означає CH₃, А означає CH₃, G означає водень і R_a, R_b, R_c і R_d є такими, як визначено нижче:

№	R _a	R _b	R _c	R _d
T1.028	CH ₃	H	H	Br
T1.029	CH ₃	H	H	Cl
T1.030	CH ₃	H	H	CH ₃
T1.031	CH ₃	H	H	C ₆ H ₅
T1.032	CH ₃	H	H	4-Cl-C ₆ H ₄
T1.033	CH ₂ CH ₃	H	H	CH ₃
T1.034	CH ₂ CH ₃	H	H	4-Cl-C ₆ H ₄
T1.035	OCH ₃	H	H	CH ₃
T1.036	OCH ₃	H	H	4-Cl-C ₆ H ₄
T1.037	Cl	H	Cl	Br
T1.038	CH ₃	H	CH ₃	Br
T1.039	CH ₃	H	CH ₃	Cl
T1.040	CH ₃	H	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄
T1.041	Br	Cl	H	CH ₃
T1.042	Br	CH ₃	H	CH ₃
T1.043	Cl	Cl	H	Cl
T1.044	Cl	Br	H	CH ₃
T1.045	Cl	Cl	H	CH ₃
T1.046	Cl	CH ₃	H	Cl
T1.047	Cl	CH ₃	H	CH ₃
T1.048	CH ₃	Br	H	CH ₃
T1.049	CH ₃	Cl	H	CH ₃
T1.050	CH ₃	CH ₃	H	CH ₃
T1.051	CH ₃	CH ₃	H	4-Cl-C ₆ H ₄
T1.052	Br	Br	CH ₃	H
T1.053	Br	Cl	CH ₃	H
T1.054	Br	CH ₃	Br	H
T1.055	Br	CH ₃	Cl	H
T1.056	Cl	Br	CH ₃	H
T1.057	Cl	Cl	Cl	H
T1.058	Cl	Cl	CH ₃	H
T1.059	Cl	CH ₃	Cl	H
T1.060	Cl	CH ₃	CH ₂ CH ₃	H
T1.061	Cl	CH ₃	OCH ₃	H
T1.062	Cl	4-Cl-C ₆ H ₄	Cl	H
T1.063	Cl	4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	H
T1.064	Cl	4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₂ CH ₃	H
T1.065	Cl	4-Cl-C ₆ H ₄	OCH ₃	H
T1.066	CH ₃	Br	CH ₃	H
T1.067	CH ₃	Cl	CH ₃	H
T1.068	CH ₃	CH ₃	Br	H
T1.069	CH ₃	CH ₃	Cl	H
T1.070	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H
T1.071	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	H
T1.072	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	H

Таблиця 1

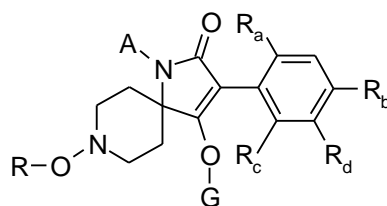


(Ia),

в якій R означає CH₃, A означає CH₃, G означає водень і R_a, R_b, R_c і R_d є такими, як визначено нижче:

№	R _a	R _b	R _c	R _d
T1.073	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	H
T1.074	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₂ CH ₃	H
T1.075	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	OCH ₃	H
T1.076	CH ₂ CH ₃	Br	Br	H
T1.077	CH ₂ CH ₃	Br	Cl	H
T1.078	CH ₂ CH ₃	Br	CH ₃	H
T1.079	CH ₂ CH ₃	Br	CH ₂ CH ₃	H
T1.080	CH ₂ CH ₃	Br	OCH ₃	H
T1.081	CH ₂ CH ₃	Cl	Br	H
T1.082	CH ₂ CH ₃	Cl	Cl	H
T1.083	CH ₂ CH ₃	Cl	CH ₃	H
T1.084	CH ₂ CH ₃	Cl	CH ₂ CH ₃	H
T1.085	CH ₂ CH ₃	Cl	OCH ₃	H
T1.086	CH ₂ CH ₃	CH ₃	Br	H
T1.087	CH ₂ CH ₃	CH ₃	Cl	H
T1.088	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	H
T1.089	CH ₂ CH ₃	CH ₃	OCH ₃	H
T1.090	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H
T1.091	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H
T1.092	CH ₂ CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	Br	H
T1.093	CH ₂ CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₂ CH ₃	H
T1.094	CH ₂ CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	OCH ₃	H
T1.095	OCH ₃	Br	CH ₃	H
T1.096	OCH ₃	Cl	CH ₃	H
T1.097	OCH ₃	CH ₃	Br	H
T1.098	OCH ₃	CH ₃	Cl	H
T1.099	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	H
T1.100	OCH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	OCH ₃	H
T1.101	CH ₃	CH ₃	CH ₃	F
T1.102	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl
T1.103	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Br
T1.104	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
T1.105	CH ₃	CH ₃	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄
T1.106	Cl	CH ₃	CH ₃	CH ₃
T1.107	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₃
T1.108	CH ₃	CH ₃	Cl	CH ₃
T1.109	CH ₂ CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
T1.110	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
T1.111	Цикло-C ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
T1.112	CH ₃	CH ₃	Цикло-C ₃	H
T1.113	CH ₃	F	H	Br
T1.114	CH ₃	CH ₃	H	Br
T1.115	CH ₂ CH ₃	CH ₃	H	CH ₃
T1.116	OCH ₃	CH ₃	H	CH ₃
T1.117	Цикло-C ₃	CH ₃	H	CH ₃

Таблиця 1



(Ia),

в якій R означає CH_3 , A означає CH_3 , G означає водень і R_a , R_b , R_c і R_d є такими, як визначено нижче:

№	R_a	R_b	R_c	R_d
T1.118	CH_2CH_3	Cl	H	CH_3
T1.119	OCH_3	Cl	H	CH_3
T1.120	Цикло- C_3	Cl	H	CH_3
T1.121	Cl	H	CH_3	CH_3
T1.122	CH_3	H	CH_3	CH_3
T1.123	CH_2CH_3	H	CH_3	CH_3
T1.124	OCH_3	H	CH_3	CH_3
T1.125	Цикло- C_3	H	CH_3	CH_3
T1.126	F	H	Cl	CH_3
T1.127	Cl	H	F	CH_3
T1.128	H	CH_3	CH_3	CH_3
T1.129	Br	CH_3	CH_3	CH_3
T1.130	CH_3	H	Cl	CH_3
T1.131	CH_3	H	Br	CH_3
T1.132	Br	H	CH_3	CH_3

Цикло- C_3 означає циклопропіл

Таблиця 2: У цій таблиці розкриті 132 сполуки від T2.001 до T2.132 формули Ia, в якій R означає CH_3 , A означає CH_2CH_3 , G означає водень, і R_a , R_b , R_c і R_d є такими, як визначено у таблиці 1.

Таблиця 3: У цій таблиці розкриті 132 сполуки від T3.001 до T3.132 формули Ia, в якій R означає CH_3 , A означає n- C_3H_7 , G означає водень, і R_a , R_b , R_c і R_d є такими, як визначено у таблиці 1.

Таблиця 4: У цій таблиці розкриті 132 сполуки від T4.001 до T4.132 формули Ia, в якій R означає CH_3 , A означає i- C_3H_7 , G означає водень, і R_a , R_b , R_c і R_d є такими, як визначено у таблиці 1.

Таблиця 5: У цій таблиці розкриті 132 сполуки від T5.001 до T5.132 формули Ia, в якій R означає CH_3 , A означає n- C_4H_9 , G означає водень, і R_a , R_b , R_c і R_d є такими, як визначено у таблиці 1.

Таблиця 6: У цій таблиці розкриті 132 сполуки від T6.001 до T6.132 формули Ia, в якій R означає CH_3 , A означає i- C_4H_9 , G означає водень, і R_a , R_b , R_c і R_d є такими, як визначено у таблиці 1.

Таблиця 7: У цій таблиці розкриті 132 сполуки від T7.001 до T7.132 формули Ia, в якій R означає CH_3 , A означає t- C_4H_9 , G означає водень, і R_a , R_b , R_c і R_d є такими, як визначено у таблиці 1.

Таблиця 8: У цій таблиці розкриті 132 сполуки від T8.001 до T8.132 формули Ia, в якій R означає CH_3 , A означає циклопропіл, G означає водень, і R_a , R_b , R_c і R_d є такими, як визначено у таблиці 1.

Таблиця 9: У цій таблиці розкриті 132 сполуки від T9.001 до T9.132 формули Ia, в якій R означає CH_3 , A означає цикlopентил, G означає водень, і R_a , R_b , R_c і R_d є такими, як визначено у таблиці 1.

Таблиця 10: У цій таблиці розкриті 132 сполуки від T10.001 до T10.132 формули Ia, в якій R означає CH_3 , A означає циклогексил, G означає водень, і R_a , R_b , R_c і R_d є такими, як визначено у таблиці 1.

Таблиця 11: У цій таблиці розкриті 132 сполуки від T11.001 до T11.132 формули Ia, в якій R означає CH_3 , A означає 2,2-(CH_3)₂-пропіл, G означає водень, і R_a , R_b , R_c і R_d є такими, як визначено у таблиці 1.

Таблиця 32: У цій таблиці розкриті 132 сполуки від T32.001 до T32.132 формули Ia, в якій R означає CH₃, A означає бензил, G означає водень, і R_a, R_b, R_c і R_d є такими, як визначено у таблиці 1.

Таблиця 33: У цій таблиці розкриті 132 сполуки від T33.001 до T33.132 формули Ia, в якій R
5 означає CH_3 , A означає $\text{C}(\text{O})\text{-CH}_3$, G означає водень, і R_a , R_b , R_c і R_d є такими, як визначено у
таблиці 1.

Таблиця 34: У цій таблиці розкриті 132 сполуки від T34.001 до T34.132 формули Ia, в якій R означає CH_3 , A означає $\text{C}(\text{O})\text{-OCH}_3$, G означає водень, і R_a , R_b , R_c і R_d є такими, як визначено у таблиці 1.

10 Таблиця 35: У цій таблиці розкриті 132 сполуки від T35.001 до T35.132 формули Ia, в якій R означає CH₃, A означає C(O)-циклопропіл, G означає водень, і R_a, R_b, R_c і R_d є такими, як визначено у таблиці 1.

Таблиця 36: У цій таблиці розкриті 132 сполуки від T36.001 до T36.132 формули Ia, в якій R означає CH_3 , A означає $\text{C(O)-N(CH}_3)_2$, G означає водень, і R_a , R_b , R_c і R_d є такими, як визначено у таблиці 1.

Таблиця 37: У цій таблиці розкриті 132 сполуки від T37.001 до T37.132 формули Ia, в якій R означає CH_3 , A означає $\text{C}(\text{O})\text{-C}_6\text{H}_5$, G означає водень, і R_a , R_b , R_c і R_d є такими, як визначено у таблиці 1.

Таблиця 38: У цій таблиці розкриті 132 сполуки від Т38.001 до Т38.132 формули Ia, в якій R означає CH₃, А означає SO₂CH₃, G означає водень, і R_a, R_b, R_c і R_d є такими, як визначено у таблиці 1.

Таблиця 39: У цій таблиці розкриті 132 сполуки від T39.001 до T39.132 формули Ia, в якій R означає CH₃, A означає SO₂C₆H₅, G означає водень, і R_a, R_b, R_c і R_d є такими, як визначено у таблиці 1.

25 Таблиця 40: У цій таблиці розкриті 132 сполуки від T40.001 до T40.132 формули Ia, в якій R означає водень, A означає CH₃, G означає водень, і R_a, R_b, R_c і R_d є такими, як визначено у таблиці 1.

Таблиця 41: У цій таблиці розкриті 132 сполуки від T41.001 до T41.132 формули Ia, в якій R означає водень, A означає CH_2CH_3 , G означає водень, і R_a , R_b , R_c і R_d є такими, як визначено у таблиці 1.

Таблиця 42: У цій таблиці розкриті 132 сполуки від T42.001 до T42.132 формули Ia, в якій R означає водень, A означає $i\text{-C}_3\text{H}_7$, G означає водень, і R_a , R_b , R_c і R_d є такими, як визначено у таблиці 1.

Таблиця 43: У цій таблиці розкриті 132 сполуки від T43.001 до T43.132 формули Ia, в якій R означає водень, А означає циклопропіл, G означає водень, і R_a, R_b, R_c і R_d є такими, як визначено у таблиці 1.

Таблиця 44: У цій таблиці розкриті 132 сполуки від T44.001 до T44.132 формули Ia, в якій R означає водень, A означає CH₂-циклопропіл, G означає водень, і R_a, R_b, R_c і R_d є такими, як визначено у таблиці 1.

40 Таблиця 45: У цій таблиці розкриті 132 сполуки від T45.001 до T45.132 формули Ia, в якій R означає водень, A означає CH_2OCH_3 , G означає водень, і R_a , R_b , R_c і R_d є такими, як визначено у таблиці 1.

Таблиця 46: У цій таблиці розкриті 132 сполуки від T46.001 до T46.132 формули Ia, в якій R означає водень, A означає $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$, G означає водень, і R_a , R_b , R_c і R_d є такими, як визначено у таблиці 1.

Таблиця 47: У цій таблиці розкриті 132 сполуки від T47.001 до T47.132 формули Ia, в якій R означає водень, А означає $\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$, G означає водень, і R_a , R_b , R_c і R_d є такими, як визначено у таблиці 1.

Таблиця 48: У цій таблиці розкриті 132 сполуки від T48.001 до T48.132 формули Ia, в якій R означає водень, A означає $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{OCH}_3$, G означає водень, і R_a , R_b , R_c і R_d є такими, як визначено у таблиці 1.

Таблиця 49: У цій таблиці розкриті 132 сполуки від T49.001 до T49.132 формули Ia, в якій R означає водень, А означає оксетан-3-іл, G означає водень, і R_a, R_b, R_c і R_d є такими, як визначено у таблиці 1.

55 Таблиця 50: У цій таблиці розкриті 132 сполуки від T50.001 до T50.132 формули Ia, в якій R означає водень, A означає CH_2CHF_2 , G означає водень, і R_a , R_b , R_c і R_d є такими, як визначено у таблиці 1.

Таблиця 51: У цій таблиці розкриті 132 сполуки від T51.001 до T51.132 формули Ia, в якій R означає водень, A означає CH_2CF_3 , G означає водень, і R_a , R_b , R_c і R_d є такими, як визначено у таблиці 1.

Таблиця 112: У цій таблиці розкриті 132 сполуки від T112.001 до T112.132 формули Ia, в якій R означає CH_2CH_3 , A означає метоксипропіл, G означає водень, і R_a , R_b , R_c і R_d є такими, як визначено у таблиці 1.

5 Таблиця 113: У цій таблиці розкриті 132 сполуки від T113.001 до T113.132 формули Ia, в якій R означає $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$, A означає метоксипропіл, G означає водень, і R_a , R_b , R_c і R_d є такими, як визначено у таблиці 1.

Таблиця 114: У цій таблиці розкриті 132 сполуки від T114.001 до T114.132 формули Ia, в якій R означає H, A означає тетрагідрофуран-2-ілметил, G означає водень, і R_a , R_b , R_c і R_d є такими, як визначено у таблиці 1.

10 Таблиця 115: У цій таблиці розкриті 132 сполуки від T115.001 до T115.132 формули Ia, в якій R означає CH_2CH_3 , A означає тетрагідрофуран-2-ілметил, G означає водень, і R_a , R_b , R_c і R_d є такими, як визначено у таблиці 1.

15 Таблиця 116: У цій таблиці розкриті 132 сполуки від T116.001 до T116.132 формули Ia, в якій R означає $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$, A означає тетрагідрофуран-2-ілметил, G означає водень, і R_a , R_b , R_c і R_d є такими, як визначено у таблиці 1.

Сполуки, запропоновані в даному винаході, є цінними для попереджувальної та/або лікувальної обробки активними інгредієнтами в області боротьби із шкідниками навіть при низьких нормах витрати, які мають досить сприятливий біоцидний спектр і добре переносяться теплокровними видами, рибами і рослинами. Активні інгредієнти, запропоновані у даному винаході, діють на всіх або окремих стадіях розвитку зазвичай сприйнятливих, але також і резистентних тварин-шкідників, таких як комахи або представники виду кліщів Інсектицидна або акарицидна активність активних інгредієнтів, запропонованих в даному винаході, може проявлятися безпосередньо, тобто шляхом знищення шкідників, яке відбувається відразу ж або через деякий час, наприклад, під час линьки, або побічно, наприклад, у вигляді зменшення кількості яєць, які відкладаються, та/або виведення з яєць, і добра активність відповідає знищенню (загибелі) щонайменше від 50 до 60 %.

Сполуки формули I можна використовувати для боротьби з нашествиями зазначених нижче шкідників-комах і їх знищення, таких як лускокрилі, двокрилі, клопи, бахромчатокрилі, прямокрилі, таргани, твердокрилі, блохи, перетинчастокрилі і терміти, а також інші безхребетні шкідники, наприклад, кліщі-, нематоди-і молюски-шкідники Комахи, кліщі, нематоди і молюски далі спільно будуть називатися шкідниками. Шкідники, з якими можна боротися і яких можна знищувати шляхом застосування сполук, які пропонуються в даному винаході, включають шкідників, пов'язаних із землеробством (цей термін включає вирощування врожаю для одержання харчових продуктів і продуктів з волокон), плідівництвом і тваринництвом, домашніми тваринами, лісівництвом і зберіганням продуктів рослинного походження (таких як плоди, зерно і деревина); шкідників, пов'язаних з пошкодженням штучних споруд і передачею хвороб людині і тваринам; а також дратівних шкідників (таких як мухи).

Приклади видів шкідників, боротися з якими можна за допомогою сполук формули I, включають: *Myzus persicae* (попелиця), *Aphis gossypii* (попелиця), *Aphis fabae* (попелиця), *Lygus* spp (клопи), *Dysdercus* spp (клопи), *Nilaparvata lugens* (дельфацид), *Nephotettix inciticeps* (цикадка), *Nezara* spp (щитники), *Euschistus* spp (щитники), *Leptocorisa* spp (щитники), *Frankliniella occidentalis* (трипс), *Thrips* spp (трипси), *Leptinotarsa decemlineata* (колорадський жук), *Anthonomus grandis* (довгоносик бавовняний), *Aonidiella* spp (червці), *Trialeurodes* spp (білокрилки), *Bemisia tabaci* (білокрилка), *Ostrinia nubilalis* (метелик кукурудзяний), *Spodoptera littoralis* (гусениця совки бавовняної), *Heliothis virescens* (гусениця тютюнової листовійки-брунькоїда), *Helicoverpa armigera* (коробковий хробак), *Helicoverpa zea* (коробковий хробак), *Sylepta derogata* (листовійка бавовняна), *Pieris brassicae* (капустниця), *Plutella xylostella* (моль капустяна), *Agrotis* spp (совки), *Chilo suppressalis* (свердлильник рисовий стеблевий), *Locusta migratoria* (сарана), *Chortiocetes terminifera* (сарана), *Diabrotica* spp (листоїди), *Panonychus ulmi* (кліщ червоний плодовий), *Panonychus citri* (кліщик червоний цитрусовий), *Tetranychus urticae* (кліщ двоплямовий ПАРутинний), *Tetranychus cinnabarinus* (кліщ ПАРутинний червоний), *Phyllocoptruta oleivora* (кліщ іржастий (іржавий) цитрусовий), *Polyphagotarsonemus latus* (широкий кліщ), *Brevipalpus* spp (плоскі кліщі), *Boophilus microplus* (кліщ боофілюс), *Dermacentor variabilis* (іксодовий кліщ собачий), *Ctenocephalides felis* (блоха котяча), *Liriomyza* spp (мінуючі мушки), *Musca domestica* (муха кімнатна), *Aedes aegypti* (комар), *Anopheles* spp (кровопивні комарі), *Culex* spp (кровопивні комарі), *Lucillia* spp (м'ясні мухи), *Blattella germanica* (тарган), *Periplaneta americana* (тарган), *Blatta orientalis* (тарган), терміти сімейства *Mastotermitidae* (наприклад *Mastotermes* spp.), сімейства *Kalotermitidae* (наприклад *Neotermes* spp.), сімейства *Rhinotermitidae* (наприклад *Coptotermes formosanus*, *Reticulitermes flavipes*, *R speratu*, *R virginicus*, *R hesperus* і *R santonensis*) і сімейства *Termitidae* (наприклад *Globitermes sulphureus*),

Solenopsis geminata (вогняний мураха), Monomorium pharaonis (фараонів мураха), Damalinia spp і Linognathus spp (пухоїди і воші), Meloidogyne spp (кореневі нематоди), Globodera spp і Heterodera spp (гетеродериди), Pratylenchus spp (нематоди, що ушкоджують рослини), Rhodopholus spp (бананові норіві або свердлувальні нематоди), Tylenchulus spp (цитрусові нематоди), Haemonchus contortus (ремонтус), Caenorhabditis elegans (оцтова нематода), Trichostrongylus spp (шлунково-кишкові нематоди) і Deroceras reticulatum (слимаки).

Іншими прикладами зазначених вище шкідників є:

із ряду кліщів (Acarina), наприклад,

Acarus siro, Aceria sheldoni, Aculus schlechtendali, Amblyomma spp., Argas spp., Boophilus spp., Brevipalpus spp., Bryobia praetiosa, Calipitimerus spp., Chorioptes spp., Dermanyssus gallinae, Eotetranychus carpinii, Eriophyes spp., Hyalomma spp., Ixodes spp., Olygonychus pratensis, Ornithodoros spp., Panonychus spp., Phyllocoptura oleivora, Polyphagotarsonemus latus, Psoroptes spp., Rhipicephalus spp., Rhizoglyphus spp., Sarcoptes spp., Tarsonemus spp і Tetranychus spp.;

з ряду вошей (Anoplura), наприклад,

Haematopinus spp., Linognathus spp., Pediculus spp., Pemphigus spp і Phylloxera spp.;

з ряду твердокрилих (Coleoptera), наприклад,

Agriotes spp., Anthonomus spp., Atomaria linearis, Chaetocnema tibialis, Cosmopolites spp., Curculio spp., Dermestes spp., Diabrotica spp., Epilachna spp., Eremnus spp., Leptinotarsa decemlineata, Lissorhoptrus spp., Melolontha spp., Oryzaephilus spp., Otiorhynchus spp., Phlyctinus spp., Popillia spp., Psylliodes spp., Rhizopertha spp., Scarabeidae, Sitophilus spp., Sitotroga spp., Tenebrio spp., Tribolium spp і Trogoderma spp.;

з ряду двокрилих (Diptera), наприклад,

Aedes spp., Antherigona soccata, Bibio hortulanus, Calliphora erythrocephala, Ceratitis spp., Chrysomya spp., Culex spp., Cuterebra spp., Dacus spp., Drosophila melanogaster, Fannia spp., Gastrophilus spp., Glossina spp., Hypoderma spp., Hyppobosca spp., Liriomyza spp., Lucilia spp., Melanagromyza spp., Musca spp., Oestrus spp., Orseolia spp., Oscinella frit, Pegomyia hyoscyami, Phorbia spp., Rhagoletis pomonella, Sciara spp., Stomoxys spp., Tabanus spp., Tannia spp і Tipula spp.;

з ряду клопів (Heteroptera), наприклад,

Cimex spp., Distantiella theobroma, Dysdercus spp., Euchistus spp., Eurygaster spp., Leptocoris spp., Nezara spp., Piesma spp., Rhodnius spp., Sahlbergella singularis, Scotinophara spp і Triatoma spp.;

з ряду рівнокрилих (Homoptera), наприклад,

Aleurothrixus floccosus, Aleyrodes brassicae, Aonidiella spp., Aphididae, Aphis spp., Aspidiotus spp., Bemisia tabaci, Ceroplastes spp., Chrysomphalus aonidium, Chrysomphalus dictyospermi, Coccus hesperidum, Empoasca spp., Eriosoma larigerum, Erythroneura spp., Gascardia spp., Laodelphax spp., Lecanium corni, Lepidosaphes spp., Macrosiphus spp., Myzus spp., Nephrotettix spp., Nilaparvata spp., Parlatoria spp., Pemphigus spp., Planococcus spp., Pseudaulacaspis spp., Pseudococcus spp., Psylla spp., Pulvinaria aethiopica, Quadraspidiotus spp., Rhopalosiphum spp., Saissetia spp., Scaphoideus spp., Schizaphis spp., Sitobion spp., Trialeurodes vaporariorum, Trioza erytrae і Unaspis citri;

з ряду перетинчастокрилих (Hymenoptera), наприклад,

Acromyrmex, Atta spp., Cephus spp., Diprion spp., Diprionidae, Gilpinia polytoma, Hoplocampa spp., Lasius spp., Monomorium pharaonis, Neodiprion spp., Solenopsis spp і Vespa spp.;

з ряду термітів (Isoptera), наприклад,

Reticulitermes spp.;

з ряду лускокрилих (Lepidoptera), наприклад,

Acleris spp., Adoxophyes spp., Aegeria spp., Agrotis spp., Alabama argillaceae, Amylois spp., Anticarsia gemmatilis, Archips spp., Argyrotaenia spp., Autographa spp., Busseola fusca, Cadra cautella, Carposina nipponensis, Chilo spp., Choristoneura spp., Clysia ambiguella, Cnaphalocrocis spp., Cnephasia spp., Cochylis spp., Coleophora spp., Crocidolomia binotalis, Cryptophlebia leucotreta, Cydia spp., Diatraea spp., Diparopsis castanea, Earias spp., Ephestia spp., Eucosma spp., Eupoecilia ambiguella, Euproctis spp., Euxoa spp., Grapholita spp., Hedya nubiferana, Heliothis spp., Hellula undalis, Hyphantria cunea, Keiferia lycopersicella, Leucoptera scitella, Lithocolletis spp., Lobesia botrana, Lymantria spp., Lyonetia spp., Malacosoma spp., Mamestra brassicae, Manduca sexta, Operophtera spp., Ostrinia nubilalis, Pammene spp., Pandemis spp., Panolis flammea, Pectinophora gossypiella, Phthorimaea operculella, Pieris rapae, Pieris spp., Plutella xylostella, Prays spp., Scirpophaga spp., Sesamia spp., Sparganothis spp., Spodoptera spp., Synanthedon spp., Thaumetopoea spp., Tortrix spp., Trichoplusia ni і Yponomeuta spp.;

з ряду пухоїдів (Mallophaga), наприклад,

- Damalinae spp і Trichodectes spp.;
з ряду прямокрилих (Orthoptera), наприклад,
Blatta spp., Blattella spp., Gryllotalpa spp., Leucophaea maderae, Locusta spp., Periplaneta spp і Schistocerca spp.;
- 5 з ряду сіноідів (Psocoptera), наприклад,
Liposcelis spp.;
- з ряду блох (Siphonaptera), наприклад,
Ceratophyllus spp., Ctenocephalides spp і Xenopsylla cheopis;
- 10 з ряду бахромчатокрилих (Thysanoptera), наприклад,
Frankliniella spp., Hercinothrips spp., Scirtothrips aurantii, Taeniothrips spp., Thrips palmi і Thrips tabaci; і
- з ряду щетинохвісток (Thysanura), наприклад,
Lepisma saccharina
- 15 Активні інгредієнти, запропоновані в даному винаході, можна застосовувати для боротьби, тобто для зменшення кількості або знищення шкідників зазначеного вище типу, які знаходяться на рослинах, особливо на корисних рослинах і декоративних рослинах, у сільському господарстві, садівництві і у лісах, або на органах таких рослин, таких як плоди, квітки, листя, стебла, бульби або корені, а у деяких випадках навіть органи рослин, які формуються у більш пізній час, залишаються захищеними від цих шкідників.
- 20 Підходящі цільові культури, зокрема, включають злаки, такі як пшениця, ячмінь, жито, овес, рис, кукурудза або сорго; буряк, такий як цукровий буряк або кормові буряки; фрукти, наприклад, зерняткові фрукти, кісточкові фрукти або м'які фрукти, такі як яблука, груші, сливи, персики, мигдаль, вишні або ягоди, наприклад, суниця, малина або чорна смородина; бобові культури, такі як боби, сочевиця, горох або соя; олійні культури, такі як олійний ріпак, гірчиця,
- 25 мак, оливи, соняшник, кокос, рицина, какао-боби або земляний горіх; огіркові культури, такі як гарбузи, огірки або дині; волокнисті рослини, такі як бавовна, льон, коноплі або джут; цитрусові фрукти, такі як апельсини, лимони, грейпфрути або мандарини; овочі, такі як шпинат, латук, спаржа, капуста, морква, луки, томати, картопля або червоний перець; лаврові, такі як авокадо, кориця, камфора; а також тютюн, горіхи, кава, баклажани, цукрова тростина, чай, перець, виноград, хміль, плантаційні рослини, каучуконосні рослини і декоративні рослини.
- 30 Термін "культури" слід розуміти, як включаючий і культури, яким надана стійкість до гербіцидів, таким як бромоксиніл, або до класів гербіцидів (таким як, наприклад, інгібітори HPPD (4-гідроксифенілпіруватдіоксигеназа), інгібітори ALS (ацетолататсинтаза), наприклад, примісульфурон, просульфурон і трифлорисульфурон, інгібітори EPSPS (5-енолпіровілішкімат-3-фосфатсинтаза), інгібітори GS (глутамінсинтетаза) за допомогою звичайних методик селекції або генної інженерії Прикладом культури, якій за допомогою звичайних методик селекції (мутагенеза) надана стійкість до імідазолінонів, наприклад, імазамоксу, є суріпиця Clearfield® (канола). Прикладами культур, яким за допомогою методики генної інженерії надана стійкість до гербіцидів або класів гербіцидів, включають сорти
- 40 кукурудзи, стійкі до гліфосату і глюфосинату, які наявні у продажу під торговельними назвами RoundupReady® і LibertyLink®.
- Термін "культури" слід розуміти, як такий, що включає і культурні рослини, які шляхом використання методики на основі рекомбінантної ДНК змінені таким способом, що вони здатні синтезувати один або більшу кількість токсинів, які виявляють селективний вплив, таких як, для
- 45 яких відомо, наприклад, що вони виробляються продукуючими токсини бактеріями, особливо роду Bacillus.
- Токсини, які можуть вироблятися такими трансгенними рослинами, включають, наприклад, інсектицидні білки, наприклад, інсектицидні білки з Bacillus cereus або Bacillus popilliae; або інсектицидні білки з Bacillus thuringiensis, такі як, such as δ-ендотоксини, наприклад, CryIA(b), CryIA(c), CryIF, CryIF(a2), CryIIA(b), CryIIIA, CryIIIB(b1) або Cry9c, або рослинні інсектицидні білки (VIP), наприклад, VIP1, VIP2, VIP3 або VIP3A; або інсектицидні білки бактерій, які колонізують нематоди, наприклад, Photorhabdus spp або Xenorhabdus spp., такі як Photorhabdus luminescens, Xenorhabdus nematophilus; токсини, які продукуються тваринами, такі як токсини скорпіона, токсини ПАРукоподібних, токсини ос та інші специфічні для комах нейротоксини; токсини, які
- 55 продукуються грибами, такі як токсини Streptomyces, лектини рослин, такі як лектини гороху, лектини ячменя і лектини проліску; аглютиніни; інгібітори протеїнази, такі як інгібітори трипсину, інгібітори серінпротеази, інгібітори пататину, цистатину, папаїну; активуючі рибосоми білки (RIP), такі як ріцин, кукурудзи-RIP, абрін, луфін, сапонін і бріудин; метаболічні ферменти стероїдів, такі як 3-гідроксистероїдоксидаза, екдистероїд-UDP-глікозилтрансфераза, холестериноксидази,
- 60 інгібітори екдізону, HMG-CoA-редуктаза, блокатори іонних каналів, такі як блокатори натрієвих і

кальцієвих каналів, ювенільна гормональна естераза, рецептори діуретичних гормонів, стільбенсинтаза, бібензилсинтаза, хітинази і глюканазі.

У контексті даного винаходу під δ-ендотоксинами слід розуміти, наприклад, CryIA(b), CryIA(c), CryIF, CryIF(a2), CryIIA(b), CryIIIA, CryIIIB(b1) або Cry9c, або рослинні інсектицидні білки (VIP), наприклад, VIP1, VIP2, VIP3 або VIP3A, а також явно гібридні токсини, укорочені токсини і модифіковані токсини. Гібридні токсини рекомбінантно продукуються за допомогою нової комбінації різних доменів цих білків (див., наприклад, WO 02/15701). Укорочені токсини, наприклад, укорочений CryIA(b), є відомими У випадку модифікованих токсинів замінюється одна або більша кількість амінокислот природного токсину. При таких замінах амінокислот в токсин бажано вставляти в токсин послідовності розпізнавання протеази, яка не являється природною, як, наприклад, у випадку CryIIIA055, у токсин CryIIIA вставляють послідовність розпізнавання катепсину-D (див WO 03/018810).

Приклади таких токсинів або трансгенних рослин, здатних синтезувати такі токсини, розкриті, наприклад, у EP-A-0374753, WO 93/07278, WO 95/34656, EP-A-0427529, EP-A-451878 і WO 03/052073.

Способи одержання таких трансгенних рослин зазвичай відомі фахівцю в даній галузі техніки і описані, наприклад, в зазначених вище публікаціях. Дезоксирибонуклеїнові кислоти типу CryI і їх одержання описано, наприклад, у WO 95/34656, EP-A-0367474, EP-A-0401979 і WO 90/13651.

Токсин, який міститься у трансгенних рослинах, надає рослинам стійкість по відношенню до шкідливих комах. Такі комахи можуть зустрічатися в будь-якій таксономічній групі комах, але особливо часто вони зустрічаються серед жуків (твердокрили), двокрилих комах (двокрилі) і метеликів (лускокрилі).

Трансгенні рослини, що містять один або більшу кількість генів, які кодують стійкість до комах і експресують один або більшу кількість токсинів, відомі і деякі з них є у продажу. Прикладами таких рослин є: YieldGard® (сорт кукурудзи, який експресує токсин CryIA(b)); YieldGard Rootworm® (сорт кукурудзи, який експресує токсин CryIIIB(b1)); YieldGard Plus® (сорт кукурудзи, який експресує токсини CryIA(b) і CryIIIB(b1)); Starlink® (сорт кукурудзи, який експресує токсин Cry9(c)); Herculex I® (сорт кукурудзи, який експресує токсин CryIF(a2) і фермент фосфінотрицин-N-ацетилтрансферазу (PAT) для надання стійкості до гербіциду глюфосинат-амонію); NuCOTN 33B® (сорт бавовни, який експресує токсин CryIA(c)); Bollgard I® (сорт бавовни, який експресує токсин CryIA(c)); Bollgard II® (сорт бавовни, який експресує токсин CryIA(c) і а CryIIA(b)); VIPCOT® (сорт бавовни, який експресує токсин VIP); NewLeaf® (сорт картоплі, який експресує токсин CryIIIA); NatureGard® Agrisure® GT Advantage (GA21, який надає стійкості до гліфосату), Agrisure® CB Advantage (Bt11, який надає стійкості до метелика кукурудзяного (МК)) і Protecta®.

Іншими прикладами таких трансгенних культур є:

1 Кукурудза Bt11, яка випускається фірмою Syngenta Seeds SAS, яка розташована за адресою: Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St Sauveur, France, реєстраційний номер C/FR/96/05/10. Генетично модифікована Zea mays, якій надана стійкість до нападу метелика кукурудзяного (*Ostrinia nubilalis* і *Sesamia nonagrioides*) шляхом трансгенного експресування укороченого токсину CryIA(b). Кукурудза Bt11 також трансгенно експресує фермент PAT для надання стійкості до гербіциду глюфосинат-амонію.

2 Кукурудза Bt176, яка випускається фірмою Syngenta Seeds SAS, яка розташована за адресою: Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St Sauveur, France, реєстраційний номер C/FR/96/05/10. Генетично модифікована Zea mays, якій надана стійкість до нападу метелика кукурудзяного (*Ostrinia nubilalis* і *Sesamia nonagrioides*) шляхом трансгенного експресування токсину CryIA(b). Кукурудза Bt176 також трансгенно експресує фермент PAT для надання стійкості до гербіциду глюфосинат-амонію.

3 Кукурудза MIR604, яка випускається фірмою Syngenta Seeds SAS, яка розташована за адресою: Chemin de l'Hobit 27, F-31 790 St Sauveur, France, реєстраційний номер C/FR/96/05/10. Кукурудза, якій надана стійкість до комах шляхом трансгенного експресування модифікованого токсину CryIIIA Цей токсин є токсином Cry3A055, модифікованим шляхом вставки послідовності розпізнавання катепсин-D-протеази Одержання таких трансгенних рослин кукурудзи описано у WO 03/018810.

4 Кукурудза MON 863, яка випускається фірмою Monsanto Europe S.A., яка розташована за адресою: 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium, реєстраційний номер C/DE/02/9 MON 863 експресує токсин CryIIIB(b1) і має стійкість відносно деяких жорсткокрилих комах.

5 Бавовна IPC 531, яка випускається фірмою Monsanto Europe S.A., яка розташована за адресою: 270-272 Avenue de Tervuren, B-1150 Brussels, Belgium, реєстраційний номер C/ES/96/02.

6 Кукурудза 1507, яка випускається фірмою Pioneer Overseas Corporation, яка розташована за адресою: Avenue Tedesco, 7 B-1160 Brussels, Belgium, реєстраційний номер C/NL/00/10 Генетично модифікована кукурудза для експресування білка Cry1F для надання стійкості до деяких лускокрилих комах і експресування білка PAT для надання стійкості до гербіциду глюфосинат-амонію.

7 Кукурудза NK603 × MON 810, яка випускається фірмою Monsanto Europe S.A., яка розташована за адресою: 270-272 Avenue de Tervuren, B1150 Brussels, Belgium, реєстраційний номер C/GB/02/M3/03. Включає гібридні сорти кукурудзи, отримані зазвичай селекцією шляхом схрещування генетично модифікованих сортів NK603 і MON 810. Кукурудза NK603 × MON 810 трансгенно експресує білок CP4 EPSPS, отриманий із штаму *Agrobacterium* sp CP4, який надає стійкість до гербіциду Roundup® (містить гліфосат), а також токсин CryIA(b), отриманий із *Bacillus thuringiensis* subsp *kurstaki*, який надає стійкість до деяких лускокрилих, включаючи метелика кукурудзяного.

Трансгенні культури, стійкі відносно комах, також описані у публікації BATS (Zentrum für Biosicherheit und Nachhaltigkeit, Zentrum BATS, Clarastrasse 13, 4058 Basel, Switzerland) Report 2003.

Термін "культури" слід розуміти, як такий, що включає і культурні рослини, які шляхом використання методики на основі рекомбінантної ДНК змінені таким чином, що вони здатні синтезувати протипатогенні речовини, які здійснюють селективний вплив, таких як, наприклад, так називані "зв'язані з патогенезом білки" (PRP, див., наприклад, EP-A-0392225). Приклади таких протипатогенних речовин і трансгенних рослин, здатних синтезувати такі протипатогенні речовини, наведені, наприклад, у EP-A-0392225, WO 95/33818, і EP-A-0353191 Методики одержання таких трансгенних рослин зазвичай відомі фахівцю в даній галузі техніки і описані, наприклад, у зазначених вище публікаціях.

Протипатогенні речовини, які можуть експресуватися такими трансгенними рослинами, включають, наприклад, блокатори іонних каналів, такі як блокатори натрієвих і кальцієвих каналів, наприклад, вірусні токсини KP1, KP4 і KP6; стильбенсинтази; бібензилсинтази; хітинази; глюканази; так називані "зв'язані з патогенезом білки" (PRP, див., наприклад, EP-A-0392225); протипатогенні речовини, які продукуються мікроорганізмами, наприклад, пептидні антибіотики або гетероциклічні антибіотики (див., наприклад, WO 95/33818) або білкові або поліпептидні фактори, які беруть участь у захисті рослин від патогенів (так називані "гени резистентності рослин по відношенню до хвороб", описані у WO 03/000906).

Іншими областями застосування сполук і композицій, запропонованих у даному винаході, є захист продукції, яка зберігається і сховищ і захист матеріалів, таких як деревина, текстильні матеріали, покриття підлог і будівлі, а також в галузі гігієни, особливо захист людей, домашніх тварин і продуктивної худоби від шкідників зазначеного типу.

У галузі гігієни сполуки і композиції, запропоновані у даному винаході, активні відносно ектопаразитів, таких як тверді кліщі, м'які кліщі, зудні коростяні, червонотелиці, мухи (що жалять и лижуть) личинки мух, що паразитують, воші, волосяні воші, пташині воші і блохи.

Прикладами таких паразитів є:

3 ряду вошей (Anoplurida): *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp і *Phtirus* spp., *Solenopotes* spp...

3 ряду пухогідів (Mallophagida): *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Damalina* spp., *Trichodectes* spp і *Felicola* spp...

3 ряду двокрилих (Diptera) і підрядів *Nematocera* і *Brachycera*, наприклад, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Simulium* spp., *Eusimulium* spp., *Phlebotomus* spp., *Lutzomyia* spp., *Culicoides* spp., *Chrysops* spp., *Hybomitra* spp., *Atylotus* spp., *Tabanus* spp., *Haematopota* spp., *Philipomyia* spp., *Braula* spp., *Musca* spp., *Hydrotaea* spp., *Stomoxys* spp., *Haematobia* spp., *Morellia* spp., *Fannia* spp., *Glossina* spp., *Calliphora* spp., *Lucilia* spp., *Chrysomyia* spp., *Wohlfahrtia* spp., *Sarcophaga* spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Gasterophilus* spp., *Hippobosca* spp., *Lipoptena* spp і *Melophagus* spp...

3 ряду бліх (Siphonapterida), наприклад, *Pulex* spp., *Ctenocephalides* spp., *Xenopsylla* spp., *Ceratophyllus* spp...

3 ряду клопів (Heteropterida), наприклад, *Cimex* spp., *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus* spp...

3 ряду тарганових (Blattarida), наприклад, *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blattelagermanica* і *Supella* spp...

Із підкласу кліщів (*Acaria* (*Acarida*)) і рядів *Meta-* і *Meso-stigmata*, наприклад, *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Otobius* spp., *Ixodes* spp., *Amblyomma* spp., *Boophilus* spp., *Dermacentor* spp., *Haemophysalis* spp., *Hyalomma* spp., *Rhipicephalus* spp., *Dermanyssus* spp., *Raillietia* spp., *Pneumonyssus* spp., *Sternostoma* spp і *Varroa* spp...

5 Із рядів *Actinedida* (*Prostigmata*) і *Acaridida* (*Astigmata*), наприклад, *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Ornithocheyletia* spp., *Myobia* spp., *Psorergates*spp., *Demodex* spp., *Trombicula* spp., *Listrophorus* spp., *Acarus* spp., *Tyrophagus* spp., *Caloglyphus* spp., *Hypodectes* spp., *Pterolichus* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Otodectes* spp., *Sarcoptes* spp., *Notoedres* spp., *Knemidocoptes* spp., *Cytodites* spp і *Laminosioptes* spp...

10 Сполуки і композиції, запропоновані у даному винаході, також придатні для захисту від зараження комахами таких матеріалів, як деревина, текстильні матеріали, пластмаси, клеючі матеріали, клеї, фарби, папір і картон, шкіра, покриття для підлоги і споруди.

Композиції, запропоновані у даному винаході, можна застосовувати, наприклад, для боротьби із наступними шкідниками: жуками, такими як *Hylotrupes bajulus*, *Chlorophorus pilosis*, *Anobium punctatum*, *Xestobium rufovillosum*, *Ptilinuspsecticornis*, *Dendrobium pertinex*, *Ernobius mollis*, *Priobium carpini*, *Lyctus brunneus*, *Lyctus africanus*, *Lyctus planicollis*, *Lyctus linearis*, *Lyctus pubescens*, *Trogoxylon aequale*, *Minthesrugicollis*, *Xyleborus* spec., *Tryptodendron* spec., *Apate monachus*, *Bostrychus capucins*, *Heterobostrychus brunneus*, *Sinoxylon* spec. і *Dinoderus minutus*, а також перетинчастокрилими, такими як *Sirex juvencus*, *Urocerus gigas*, *Urocerus gigas taignus* і *Urocerus augur*, і термітами, такими як *Kaloterms flavicollis*, *Cryptotermes brevis*, *Heterotermes indicola*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes santonensis*, *Reticulitermes lucifugus*, *Mastotermes darwiniensis*, *Zootermopsis nevadensis* і *Coptotermes formosanus*, і щетинохвістками, такими як *Lepisma saccharina*.

25 Тому даний винахід належить до способу боротьби із комахами, кліщами, нематодами або молюсками або їх знищення, який включає нанесення сполуки формули I або композиції, яка містить сполуку формули I, в інсектицидно, акарицидно, нематоцидно або молюскоцидно ефективній кількості на шкідників, на осередок шкідників або на рослини, що піддалися нашестю шкідників. Сполуки формули I бажано використовувати проти комах або кліщів.

При використанні у даному винаході термін "рослина" включає сіянці, чагарники і дерева.

30 Крім добрих інсектицидної і акарицидної активності і характеристик, активні інгредієнти, запропоновані в даному винаході, характеризуються гарною переносимістю рослинами/культурами. При використанні різних способів внесення сполуки формули I або композиції, що їх містять, запропоновані в даному винаході, характеризуються гарною переносимістю рослинами/культурами, при цьому значно зменшується пошкодження рослин/культур (фітотоксичність). Терміни "культура" і "рослина" слід розуміти так, як визначено вище, тоді як термін "способи нанесення" описаний нижче.

35 Тому даний винахід також належить до пестицидних композицій, таких як концентрати, що емульгуються, концентрати суспензій, придатні для безпосереднього обприскування або розчини, що розбавляються, пасти, які розкидаються, розведені емульсії, розчинні порошки, диспергуючі порошки, порошки, що змочуються, дисти, гранули або капсульовані у полімерах речовини, які включають щонайменше один із активних інгредієнтів, запропонованих у даному винаході, і які слід вибирати відповідно до вирішуваних задач і переважними умовами.

40 У цих композиціях активний інгредієнт використовується у чистому вигляді, твердий активний інгредієнт, наприклад, із заданим розміром частинок або, бажано, спільно щонайменше з однією із допоміжних речовин, зазвичай застосовуються в області приготування композицій, таких як розріджувачі, наприклад, розчинники або тверді носії, або таких як поверхнево-активні речовини.

45 Прикладами підходящих розчинників є: негідровані або частково гідровані ароматичні вуглеводні, бажано фракції C_8 - C_{12} -алкілбензолів, такі як суміші ксилолів, алкіловані нафталіни або тетрагідронафталін, аліфатичні або циклоаліфатичні вуглеводні, такі як парафіни або циклогексан, спирти, такі як етанол, пропанол або бутанол, гліколи і їх прості і складні ефіри, такі як простий ефір пропіленгліколю, етиленгліколю або монометиловий ефір етиленгліколю, або моноетиловий ефір етиленгліколю, кетони, такі як циклогексанон, ізофорон або діацетоновий спирт, сильно полярні розчинники, такі як N-метилпіролід-2-он, диметилсульфоксид або N,N-диметилформамід, вода, неепоксидовані або епоксидовані рослинні олії, такі як неепоксидована або епоксидована рапсова олія, касторова, кокосова або соєва олія і силіконові олії.

50 Тверді носії, які застосовуються, наприклад, для дустів і порошків, які диспергуються, як правило, представляють собою розмелені природні мінерали, такі як кальцит, тальк, каолін, монтморилоніт або атапульгіт. Для поліпшення фізичних характеристик також можна додавати

високодисперсні марки діоксиду кремнію або високодисперсні вбираючі полімери. Підходящими подрібненими вбираючими носіями для гранул є пористі речовини, такі як пемза, цегельна крихта, сепіоліт або бентоніт, і підходящими невбираючими носіями є кальцит або пісок. Крім того, можна використовувати велику кількість гранульованих матеріалів неорганічного або

органічного характеру, зокрема, доломіт або подрібнені рослинні залишки.

Підходящими поверхнево-активними речовинами є, в залежності від типу активного інгредієнта, який вноситься у композицію, неіоногенні, катіоногенні та/або аніоногенні поверхнево-активні речовини або суміші поверхнево-активних речовин, які мають добру емульгуючу, диспергуючу і змочувальну здатність. Зазначені нижче поверхнево-активні речовини слід розглядати тільки в якості прикладів; велику кількість додаткових поверхнево-активних речовин, які зазвичай використовуються в галузі приготування препаратів і є придатними в контексті цього винаходу, описано у відповідній літературі.

Відповідними неіоногенними поверхнево-активними речовинами є, зокрема, похідні полігліколевих ефірів аліфатичних або циклоаліфатичних спиртів, насичених або ненасичених жирних кислот або алкілфенолів, які можуть містити від приблизно 3 до приблизно 30 гліколевих ефірних груп і від приблизно 8 до приблизно 20 атомів вуглецю у (цикло)аліфатичному вуглеводневому радикалі або від приблизно 6 до приблизно 18 атомів вуглецю у алкільному фрагменті алкіл фенолів. Також є підходящими розчинні у воді адукти поліетиленоксиду з поліпропіленгліколем, етилендіамінополіпропіленгліколем або алкілполіпропіленгліколем, які містять від 1 до приблизно 10 атомів вуглецю в алкільному ланцюзі і від приблизно 20 до приблизно 250 етиленгліколевих ефірних груп і від приблизно 10 до приблизно 100 пропіленгліколевих ефірних груп. Зазвичай зазначені вище сполуки містять від 1 до приблизно 5 етиленгліколевих ланок у перерахуванні на одну пропіленгліколеву ланку. Прикладами, які можна відзначити, є нонілфеноксиполіетоксиетанол, полігліколевий простий ефір касторової олії, адукти поліпропіленгліколя/поліетиленоксиду, трибутилфеноксиполіетоксиетанол, поліетиленгліколь або октилфеноксиполіетоксиетанол. Підходящими також є складні ефіри жирних кислот і поліоксиетиленсорбітану, такі як поліоксиетиленсорбітантріолеат.

Катіоногенними поверхнево-активними речовинами є, зокрема, четвертинні амонієві солі, які містять в якості замісника щонайменше 1 алкільний радикал, який містить від приблизно 8 до приблизно 22 атомів С, і в якості додаткових замісників (негалогенований або галогенований) нижч алкільний або гідроксиалкільний або бензильний радикали. Солями бажано є галогеніди, метилсульфат або етил сульфати. Прикладами є стеарилтриметиламонійхлорид і бензил-біс (2-хлоретил) етиламонійбромід.

Прикладами відповідних аніоногенних поверхнево-активних речовин є розчинні у воді мила і розчинні у воді синтетичні поверхнево-активні речовини. Прикладами підходящих мил є солі лужних, лужноземельних металів і (незаміщені або заміщені) амонієві солі жирних кислот, які містять від приблизно 10 до приблизно 22 атомів С, такі як натрієві або калієві солі олеїнової або стеаринової кислоти або сумішей натуральних жирних кислот, які одержують, наприклад, з кокосової або талової олії; також слід відзначити метилтаурати жирних кислот. Однак частіше застосовують синтетичні поверхнево-активні речовини, особливо сульфонати жирних кислот, сульфати жирних кислот, сульфонати похідних бензімідазолу або алкіларилсульфонати. Як правило, сульфонати жирних кислот і сульфати жирних кислот містяться у вигляді солей лужних, лужноземельних металів або (незаміщених або заміщених) амонієвих солей і зазвичай вони включають алкільний радикал, який містить від приблизно 8 до приблизно 22 атомів С, алкіл також слід розуміти, як такий, що включає і алкільний фрагмент ацильних радикалів; прикладами, які можна відзначити, є натрієві або кальцієві солі лігносульфонової кислоти, додецилової ефіру сірчаної кислоти і суміші сульфатів жирних спиртів, отриманої з натуральних жирних кислот. Ця група також включає солі ефірів сірчаної і сульфонової кислот і адуктів жирного спирту/етиленоксиду. Сульфонати похідних бензімідазолу бажано містять 2 сульфонільні групи і радикал жирної кислоти, який містить від приблизно 8 до приблизно 22 атомів С. Прикладами алкіларилсульфонатів є натрієві, кальцієві або триетаноламонієві солі децилбензолсульфонової кислоти, дибутилнафталінсульфонової кислоти або продукт конденсації нафталінсульфонової кислоти з формальдегідом. Крім того, можливими є і підходящі фосфати, такі як солі ефіру фосфорної кислоти і адукту п-нонілфенол/(4-14)етиленоксид, і фосфоліпіди. Іншими підходящими фосфатами є трис-ефіри фосфорної кислоти з аліфатичними або ароматичними спиртами або біс-ефіри алкілфосфорних кислот з аліфатичними або ароматичними спиртами, які представляють собою допоміжну речовину типу олії, що має високу ефективність. Такі трис-ефіри описані, наприклад, у WO0147356, WO0056146, EP-A-0579052 або EP-A-1018299 або вони наявні у продажу під своїми

торговельними назвами. Для використання в нових композиціях бажаними трис-ефірами фосфорної кислоти є трис-(2-етилгексил)фосфат, трис-н-октилфосфат і трис-бутоксietiлфосфат, найбільш бажаним є трис-(2-етилгексил)фосфат. Підходящими біс-ефірами алкілфосфорних кислот є біс-(2-етилгексил)-(2-етилгексил)-фосфонат, біс-(2-етилгексил)-(н-октил)-фосфонат, дибутилбутилфосфонат і біс(2-етилгексил)-трипропіленфосфонат, особливо бажаним є біс-(2-етилгексил)-(н-октил)-фосфонат.

Композиції, запропоновані у даному винаході, бажано можуть додатково включати добавку, яка включає олію рослинного або тваринного походження, мінеральну олію, складні алкілові ефіри таких олій або суміші таких олій і похідних олій. Кількість добавки олії, що використовується у композиції, запропонованій у даному винаході, зазвичай складає від 0,01 до 10 % в перерахуванні на суміш для обприскування. Наприклад, добавку олії можна додати у бак для обприскування в необхідній концентрації після приготування суміші для обприскування. Бажані олії, що додаються, включають мінеральні олії або олії рослинного походження, наприклад, рапсову олію, таку як ADIGOR® і MERO®, оливкову олію або соняшникову олію, емульговану рослинну олію, таку як AMIGO® (Rhône-Poulenc Canada Inc.). Складні алкілові ефіри олій рослинного походження, наприклад, метилпохідні, або олію тваринного походження, таку як риб'ячий жир або яловичий жир. Бажана добавка містить в якості активних компонентів, наприклад, 80 мас. % алкілових ефірів риб'ячого жиру і 15 мас. % метилованого рапсового масла, а також і 5 мас. % звичних емульгаторів і речовин, що змінюють рН. Особливо бажані добавки олії включають складні алкілові ефіри C₈-C₂₂-жирних кислот, бажано метилпохідні C₁₂-C₁₈-жирних кислот, наприклад, особливо бажаними є метилові ефіри лауринової кислоти, пальмітинової кислоти і олеїнової кислоти. Ці складні ефіри відомі, як метиллаурат (CAS-111-82-0), метилпальмітат (CAS-112-39-0) і метилолеат (CAS-112-62-9). Бажаним похідним метилового ефіру жирної кислоти є Emery® 2230 і 2231 (Cognis GmbH). Ці та інші добавки олії також описані у публікації Compendium of Herbicide Adjuvants, 5th Edition, Southern Illinois University, 2000 У композиціях, запропонованих у даному винаході, в якості добавок також можна використовувати алкоксилізовані жирні кислоти, а також добавки на основі поліметилсилоксану, які описані у WO08/037373.

Внесення і вплив добавок олії можна додатково поліпшити шляхом їх комбінування з поверхнево-активними речовинами, такими як неіоногенні, аніоногенні або катіоногенні поверхнево-активні речовини. Приклади підходящих аніоногенних, неіоногенних і катіоногенних поверхнево-активних речовин приведені на стор 7 і 8 у WO 97/34485. Бажаними поверхнево-активними речовинами є аніоногенні поверхнево-активні речовини типу додецилбензолсульфонату, особливо їх кальцієві солі, а також неіоногенні поверхнево-активні речовина типу етоксилатів жирних спиртів. Особлива перевага віддається етоксильованим C₁₂-C₂₂-жирним спиртам, які мають ступінь етоксильування, яка становить від 5 до 40. Прикладами наявних у продажу поверхнево-активних речовин є речовини типу Genapol (Clariant AG). Також бажаними є силіконові поверхнево-активні речовини, особливо модифіковані поліалкілоксидом гептаметилтрисілоксани, які наявні у продажу, наприклад, під назвою Silwet L-77®, а також перфторовані поверхнево-активні речовини Концентрація поверхнево-активних речовин в перерахунок на всю добавку зазвичай становить від 1 до 30 мас. %. Прикладами добавок масел, які складаються з суміші олій або мінеральних олій або їх похідних з поверхнево-активними речовинами є Edenor ME SU®, Turbocharge® (Syngenta AG, CH) і Actipron® (BP Oil UK Limited, GB).

Зазначені поверхнево-активні речовини також можна використовувати в композиціях окремо, тобто без добавки олії.

Крім того, додавання органічного розчинника до суміші добавка олії/поверхнево-активна речовина також може привести до додаткового посилення впливу. Підходящими розчинниками є, наприклад, Solvesso® (ESSO) і Aromatic Solvent® (Exxon Corporation). Концентрація таких розчинників може становити від 10 до 80 мас. % в перерахунок на повну масу. Такі добавки олії, які містяться у суміші з розчинниками, описані, наприклад, у US-A-4834908. Описані у ньому наявні у продажу добавки олії, відомі під назвою MERGE® (BASF Corporation). Іншою добавкою олії, яка бажана для даного винаходу, є SCORE® (Syngenta Crop Protection Canada).

На додаток до добавок олії, перерахованим вище, для посилення впливу композицій, які пропонуються в даному винаході, в суміш для обприскування також можна додавати композиції алкілпіролідонів (наприклад, Agrimax®). Також можна використовувати композиції синтетичних латексів, такі як, наприклад, поліакриламід, полівінілові сполуки і полі-1-п-ментен (наприклад, Bond®, Courier® або Emerald®). В якості посилюючих вплив агентів із сумішшю для обприскування також можна змішати розчини, які містять пропіонову кислоту, наприклад, Eurogkem Pen-e-trate®.

Як правило, композиції включають від 0,1 до 99 %, бажано від 0,1 до 95 %, активного інгредієнта формули I, і від 1 до 99,9 %, бажано від 5 до 99,9 %, щонайменше одної рідкої або твердої допоміжної речовини, як правило, можлива, щоб від 0 до 25 %, бажано від 0,1 до 20 % від композиції становили поверхнево-активні речовини (% у кожному випадку означає мас. %).

5 Хоча в якості таких, що випускаються у продаж товарів концентровані композиції є більш бажаними, кінцевий споживач, як правило, використовує розведені композиції, які містять значно менші концентрації активного інгредієнта.

Бажані композиції переважно мають наступні склади (% = мас. %):

Концентрати, що емульгуються:

- 10 активний інгредієнт: від 1 до 95 %, бажано від 5 до 50 %, більш бажано від 5 до 20 %
поверхнево-активна речовина: від 1 до 30 %, бажано від 10 до 20 %
розчинник: від 5 до 98 %, бажано від 70 до 85 %

Дусти:

- 15 активний інгредієнт: від 0,1 до 10 %, бажано від 2 до 5 %
твердий носій: від 99,9 до 90 %, бажано від 99,9 до 99 %

Концентрати суспензій:

- активний інгредієнт: від 5 до 75 %, бажано від 10 до 50 %, більш бажано від 10 до 40 %
вода: від 94 до 24 %, бажано від 88 до 30 %
поверхнево-активна речовина: від 1 до 40 %, бажано від 2 до 30 %

20 Концентрати суспензій на масляній основі:

- активний інгредієнт: від 2 до 75 %, бажано від 5 до 50 %, більш бажано від 10 до 25 %
олія: від 94 до 24 %, бажано від 88 до 30 %
поверхнево-активна речовина: від 1 до 40 %, бажано від 2 до 30 %

Порошки, що змочуються:

- 25 активний інгредієнт: від 0,5 до 90 %, бажано від 1 до 80 %, більш бажано від 25 до 75 %
поверхнево-активна речовина: від 0,5 до 20 %, бажано від 1 до 15 %
твердий носій: від 5 до 99 %, бажано від 15 до 98 %

Гранули:

- 30 активний інгредієнт: від 0,5 до 30 %, бажано від 3 до 25 %, більш бажано від 3 до 15 %
твердий носій: від 99,5 до 70 %, бажано - від 97 до 85 %

Термін "активний інгредієнт" бажано означає одну із сполук, вибрану з приведених вище таблиць 1-116. Цей термін також означає суміші сполуки формули I, бажано сполуки, вибраної із зазначених таблиць 1-116, з іншими інсектицидами, фунгіцидами, гербіцидами, антидотами, допоміжними речовинами і т.п., такі суміші докладно описані нижче.

- 35 Композиції також можуть включати додаткові тверді або рідкі допоміжні речовини, такі як стабілізатори, наприклад, неепоксидовані або епоксидовані рослинні олії (наприклад, епоксидовану кокосову олію, рапсову олію або соєву олію), протипінні речовини, наприклад, силіконова олія, консерванти, регулятори в'язкості, сполучні та/або речовини, що надають липкість; добрива, бажано азотовмісні добрива, такі як нітрат амонію і сечовина, як це описано у WO08/017388, які можуть посилювати ефективність сполук, які пропонуються в даному винаході; або інші активні інгредієнти, необхідні для забезпечення певних ефектів, наприклад, амонієві або фосфонієві солі, бажано галогеніди, (гідро) сульфати, нітрати, (гідро) карбонати, цитрати, тартрат, форміат і ацетати, як це описано в WO07/068427 і WO07/068428, які також можуть посилювати ефективність сполук, які пропонуються в даному винаході, і які можна використовувати в комбінації з засобами, що підвищують проникність, такими як алкоксировані жирні кислоти; бактерицидами, фунгіцидами, нематоцидами, активаторами зростання рослин, молюскоцидами або гербіцидами.

- Композиції, запропоновані в даному винаході, готують способами, які самі по собі відомі, за відсутності допоміжних речовин, наприклад, шляхом розмелювання, просіювання та / або пресування твердого активного інгредієнта, и за наявності щонайменш однієї допоміжної речовини, наприклад, шляхом ретельного перемішування та / або розмелювання активного інгредієнта із допоміжною речовиною (допоміжними речовинами). Ці способи приготування композицій і застосування сполук формули I для приготування цих композицій також є об'єктами цього винаходу.

- 55 Способи внесення композицій, які є способами боротьби зі шкідниками зазначеного вище типу, такі як обприскування, розпилення, обпилення, нанесення щіткою, протруювання, розкидання або полив, - які слід вибирати відповідно до вирішуваних завдань і переважаючих умов - і застосування композицій для боротьби зі шкідниками зазначеного вище типу є іншими об'єктами цього винаходу. Типові діапазони концентрацій становлять від 0,1 до 1000 мас част./млн, бажано від 0,1 до 500 мас част./млн, активного інгредієнта. Норма внесення на

гектар, зазвичай становить від 1 до 2000 г активного інгредієнта на гектар, бажано від 10 до 1000 г/га, більш бажано від 10 до 600 г/га.

Бажаним способом внесення в ґалузі захисту рослин є нанесення на листя рослин (позакореневе внесення), і частоту і норму внесення можна підбирати відповідно до загрози зараження розглянутими шкідниками. Альтернативно, активний інгредієнт може надходити в рослини через кореневу систему (системна дія), що забезпечується шляхом зрошення ділянки виростання рослин рідкою композицією або шляхом внесення активного інгредієнта у твердій формі на ділянку виростання рослин, наприклад, в ґрунт, наприклад, у вигляді гранул (внесення в ґрунт). У випадку рису-падді такі гранули можна дозувати в затоплюване рисове поле.

Композиції, запропоновані в даному винаході, також придатні для захисту матеріалу для розмноження рослин, наприклад, насіння, таких як плоди, бульби або зерна, або саджанців, від шкідників зазначеного вище типу. Матеріал для розмноження можна обробити за допомогою композицій до висаджування, наприклад, насіння можна протравити до висіву. Альтернативно, композиції можна нанести на зерна (нанесення покриття) або шляхом намочування зерен в рідкій композиції, або шляхом нанесення шару твердої композиції якщо матеріал для розмноження висаджується, то композиції також можна внести на місце посадки, наприклад, в борозни для насіння під час рядового посіву. Ці способи обробки матеріалу для розмноження рослин і оброблений таким способом матеріал для розмноження рослин є додатковими об'єктами даного винаходу.

Інші способи внесення композицій, які пропонуються в даному винаході, включають крапельне зрошення ґрунту, занурення частин рослини, таких як коріння, цибулини або бульби, полив ґрунту, а також внесення в ґрунт інжектором. Ці способи відомі в даній ґалузі техніки.

Для нанесення сполуки формули I у вигляді інсектициду, акаріциду, нематоциду або молюскоциду на шкідників, на осередок шкідників або на рослини, піддані нашестю шкідників, сполуку формули I зазвичай вносять у композицію, яка в доповнення до сполуки формули I включає підходящий інертний розріджувач або носій і необов'язково допоміжну речовину для приготування препаратів у формі поверхнево-активної речовини (ПАР), описаної в даному винаході або, наприклад, у EP-B-1062217 ПАР є хімікатами, які здатні змінювати властивості меж розділу (наприклад, меж розділу рідина/тверда речовина, рідина/повітря або рідина/рідина) шляхом зниження поверхневого натягу, що приводить до змін інших властивостей (наприклад, диспергування, емульгування і змочування). Бажано, щоб всі композиції (і тверді, і рідкі препарати) включали, у мас. %, від 0,0001 до 95 %, більш бажано від 1 до 85 %, наприклад, від 5 до 60 % сполуки формули I. Композицію зазвичай застосовують для боротьби зі шкідниками таким способом, щоб сполука формули I наносилася у кількості, що становить від 0,1 г до 10 кг на гектар, бажано від 1 г до 6 кг на гектар, більш бажано від 1 г до 1 кг на гектар.

При використанні для протравляння насіння сполука формули I застосовується у кількості, що становить від 0,0001 до 10 г (наприклад, 0,001 г або 0,05 г), бажано від 0,005 до 10 г, більш бажано від 0,005 до 4 г на 1 кг насіння.

Іншим об'єктом даного винаходу є інсектицидна, акаріцидна, нематоцидна або молюскоцидна композиція, яка включає сполуку формули I в інсектицидно, акаріцидно, нематоцидно або молюскоцидно ефективній кількості і його підходящий носій або розріджувач.

Ще одним об'єктом даного винаходу є спосіб боротьби зі шкідниками в осередку і їх знищення, який включає обробку шкідників або осередку шкідників, за допомогою композиції, яка включає сполуку формули I в інсектицидно, акаріцидно, нематоцидно або молюскоцидно ефективній кількості.

Композиції можна вибрати із цілого ряду типів препаратів, включаючи порошки для обпилення (ПО), розчинні порошки (РП), розчинні у воді гранули (ВГ), диспергуючі у воді гранули (ДГ), порошки, що змочуються (ЗП), гранули (ГР) (з повільним або швидким вивільненням), розчинні концентрати (РК), рідини, які змішуються з олією (ОР), рідини надмалого об'єму (РЗ), емульгуючі концентрати (ЕК), диспергуючі концентрати (ДК), емульсії (і олія-у-воді (ЕО), і вода-у-олії (ЕВ)), мікроемульсії (МЕ), концентрати суспензій (СК), концентрати суспензій на масляній основі (СМ), аерозолі, препарати для дрібнокраплинного обприскування/фумігації, капсульовані суспензії (КС) і препарати для обробки насіння. Вибраний тип композиції в будь-якому випадку буде залежати від конкретного призначення і фізичних, хімічних і біологічних характеристик сполуки формули I.

Порошки для обпилення (ПО) можна одержати шляхом змішування сполуки формули I з одним або більшою кількістю твердих розріджувачів (наприклад, природними глинами, каоліном, пірофілітом, бентонітом, оксидом алюмінію, монтморилонітом, кізельгуром, крейдою, діатомовою землею, фосфатами кальцію, карбонатами кальцію і магнезію, сіркою, вапном,

різними типами борошна, тальком та іншими органічними і неорганічними твердими носіями) і механічного розмелу суміші в тонкоподрібнений порошок.

Розчинні порошки (РП) можна отримати шляхом змішування сполуки формули (I) з одним або більшою кількістю розчинних у воді неорганічних солей (таких як бікарбонат натрію, карбонат натрію або сульфат магнію) чи з одним або більшою кількістю розчинних у воді органічних твердих речовин (таких як полісахарид) і, необов'язково, з одним або більшою кількістю змочувальних агентів, з одним або більшою кількістю диспергуючих агентів або сумішшю таких агентів для покращення диспергування/розчинності у воді. Потім суміш розмелюють у тонкоподрібнений порошок. Аналогічні композиції також можна гранулювати з одержанням розчинних у воді гранул (ВГ).

Порошки, що змочуються (ЗП) можна отримати шляхом змішування сполуки формули (I) з одним або більшою кількістю твердих розріджувачів або носіїв, з одним або більшою кількістю змочувальних агентів та, бажано, з одним або більшою кількістю диспергуючих агентів та, необов'язково, з одним або більшою кількістю суспендуючих агентів для спрощення диспергування в рідинах. Потім суміш розмелюють у тонкоподрібнений порошок. Аналогічні композиції також можна гранулювати з одержанням диспергуючих у воді гранул (ДГ).

Гранули (ГР) можна отримати або шляхом гранулювання суміші сполуки формули (I) з одним або більшою кількістю порошкоподібних твердих розріджувачів або носіїв, або із заздалегідь сформованих гранул, що не містять активного інгредієнта, шляхом абсорбції сполуки формули (I) (або його розчину в підходящому агенті) в пористому гранульованому матеріалі (такому як пемза, атапульгітова глина, фулерова земля, кізельгур, діатомова земля або розмелені кукурудзяні качани) або шляхом адсорбції сполуки формули (I) (або його розчину в підходящому агенті) в твердому наповнювачі (такому як пісок, силікати, неорганічні карбонати, сульфати або фосфати) з проведенням сушки у випадку необхідності. Агенти, що зазвичай застосовуються для сприяння абсорбції або адсорбції, включають розчинники (такі як аліфатичні та ароматичні нафтові розчинники, спирти, прості ефіри, кетони і складні ефіри) та склеючі агенти (такі як полівінілацетати, полівінілові спирти, декстрини, цукри і рослинні олії). У гранули також можна включити одну або більшу кількість інших добавок (наприклад, емульгуючий агент, агент, що змочує або диспергуючий агент).

Диспергуючі концентрати (ДК) можна одержати шляхом розчинення сполуки формули (I) у воді або органічному розчиннику, такому як кетон, спирт або простий ефір гліколю. Ці розчини можуть містити поверхнево-активну речовину (наприклад, для покращення розведення водою або запобігання кристалізації в баку для обприскування).

Емульгуючі концентрати (ЕК) або емульсії олія-в-воді (ЕО) можна одержати шляхом розчинення сполуки формули (I) в органічному розчиннику (який необов'язково містить один або більшу кількість змочувальних агентів, один або більшу кількість емульгуючих агентів або суміш таких агентів). Органічні розчинники, що підходять для використання в ЕК включають ароматичні вуглеводні (такі як алкілбензоли або алкілнафталіни, прикладами яких є SOLVESSO 100, SOLVESSO 150 та SOLVESSO 200; SOLVESSO є зареєстрованим товарним знаком), кетони (такі як циклогексанон або метилциклогексанон) і спирти (такі як бензиловий спирт, фурфуріловий спирт або бутанол), N-алкілпіролідони (такі як N-метилпіролідон або N-октилпіролідон), диметиламід жирних кислот (такі як диметиламід жирної кислоти C₈-C₁₀) та хлоровані вуглеводні. Готовий ЕК може самовільно емульгуватися при додаванні до води з утворенням емульсії, що має достатню стабільність, щоб за допомогою підходящого обладнання було можливе проведення обприскування. Одержання ЕО включає одержання сполуки формули (I) у вигляді рідини (якщо при кімнатній температурі воно не є рідиною, то його можна розплавити при підходящій температурі, зазвичай нижче 70 °C) або розчину (шляхом розчинення в підходящому розчиннику) з наступним емульгуванням одержаної рідини або розчину у воді, що містить одну або більшу кількість ПАР, при більшому русі зусиллі, з одержанням емульсії. Розчинники, що підходять для використання в ЕО включають рослинні олії, хлоровані вуглеводні (такі як хлорбензоли), ароматичні розчинники (такі як алкілбензоли або алкілнафталіни) та інші підходящі органічні розчинники, що мають низьку розчинність у воді.

Мікроемульсії (МЕ) можна отримати шляхом змішування води із сумішшю одного або більшої кількості розчинників з однією або більшою кількістю ПАР для забезпечення самовільного утворення термодинамічно стабільного ізотропного рідкого препарату. Сполука формули (I) знаходиться первісно або у воді, або у суміші розчинник/ПАР. Розчинники, що підходять для використання в МЕ включають зазначені вище для застосування в ЕК або ЕО. МЕ може являти собою систему олія-у-воді або вода-у-олії (визначити тип наявної системи можна шляхом виміру електропровідності) і вона може виявитися підходящою для змішування розчинюваних у воді і розчинюваних у маслі пестицидів в одному і тому ж препараті МЕ

придатна для розведення водою, в якій вона залишиться мікроемульсією або утворить звичайну емульсію олія-у-воді.

Концентрати суспензій (СК) можуть включати водні або неводні суспензії тонкоподрібнених нерозчинних твердих часток сполуки формули (I). СК можна отримати шляхом розмелу на шаровому або бісерному млині твердої сполуки формули (I) у відповідному середовищі, необов'язково з одним або більшою кількістю диспергуючих агентів і отримати тонкоподрібнену суспензію сполуки. В композицію можна включити один або більшу кількість змочувальних агентів і можна включити агент, що суспендує для зниження швидкості осідання часток. Альтернативно, сполуку формули (I) можна піддати сухому розмелу і додати до води, що містить агенти, зазначені вище в даному винаході, та отримати шуканий готовий продукт.

Концентрати суспензій на масляній основі (СО) можна одержати аналогічним способом шляхом суспендування тонкоподрібнених нерозчинних твердих часток сполуки формули I в органічній рідині (наприклад, щонайменше одної мінеральної олії або рослинної олії). СО також можуть додатково містити щонайменше один засіб, підвищуючий проникність (наприклад, етоксилат спирту або споріднену сполуку), щонайменше одну неіоногенну поверхнево-активну речовину та/або щонайменше одну аніоногенну поверхнево-активну речовину, і необов'язково щонайменше одну добавку, вибрану з групи, яка включає емульгатори, інгібітори піноутворення, консерванти, антиоксиданти, барвники та/або інертні наповнювачі СО призначений і придатний для розведення водою перед застосуванням з одержанням розчину для обприскування, що має достатню стабільність, щоб за допомогою підходящого устаткування було можливе проведення обприскування.

Аерозольні препарати включають сполуку формули (I) і підходящий пропілент (наприклад, н-бутан). Сполуку формули (I) також можна розчинити або диспергувати у підходящому середовищі (наприклад, у воді або з рідиною, що змішується з водою, такою як н-пропанол) і одержати композиції для використання в ємностях для розпилення, що не перебувають під тиском і діють за допомогою ручних насосів.

Сполуку формули (I) можна у сухому вигляді змішати з піротехнічною сумішшю і одержати композицію, придатну для утворення у закритому просторі диму, що містить сполуку.

Капсульовані суспензії (КС) можна одержати способом, подібним до способу одержання препаратів ЕО, але із включенням додаткової стадії полімеризації, так щоб утворилася водна дисперсія крапельок масла, у якій кожна крапелька масла капсульована за допомогою полімерної оболонки і містить сполуку формули (I) і, необов'язково, її носій або розріджувач. Полімерну оболонку можна одержати за допомогою міжфазової реакції поліконденсації або за методикою коацервації. Композиції можуть використовуватися для врегульованого вивільнення сполуки формули (I) і їх можна використовувати для обробки насіння. Сполуку формули (I) також можна включити в полімерну матрицю, що біологічно розкладається, та забезпечити повільне, врегульоване вивільнення сполуки.

Сполуку формули (I) також можна приготувати для застосування в якості засобу для обробки насіння, наприклад, у вигляді порошкоподібної композиції, включаючи порошок для сухої обробки насіння (ПС), розчинний у воді порошок (ВП) і диспергуючий у воді порошок для обробки суспензією (ДП), або у вигляді рідкої композиції, включаючи текучий концентрат (ТК), розчин (РЗ) і капсульовану суспензію (КС). Одержання композицій ПС, ВП, ДП, ТК і РЗ є дуже подібним до одержання зазначених вище композицій ПО, РП, ЗП, СК і ДК відповідно. Композиції для обробки насіння можуть включати агент, що сприяє адгезії композиції до насіння (наприклад, мінеральна олія або плівкоутворювальна захисна речовина).

Композиція, запропонована в даному винаході, може включати одну або більшу кількість добавок для поліпшення біологічних робочих характеристик композиції (наприклад, шляхом поліпшення змочування, утримання або розподілу на поверхнях; стійкості до впливу дощу на оброблені поверхні; або усмоктування або рухливості сполуки формули I). Такі добавки включають поверхнево-активні речовини (ПАР), добавки для обприскування на основі олій, наприклад, деяких мінеральних олій або натуральних рослинних олій (таких як соєва олія і рапсова олія), і їх суміші з іншими посилюючими біологічний вплив допоміжними речовинами (інгредієнтами, які можуть сприяти впливу сполуки формули I або змінювати його вплив). Посилення впливу сполуки формули I можна забезпечити, наприклад, шляхом додавання амонієвих та / або фосфонієвих солей, та / або необов'язково щонайменше одного засобу, що підвищує проникність, такого як алкоксилати жирних спиртів (наприклад, метиловий ефір рапсової олії) або ефіри рослинних олій.

Змочувальні агенти, диспергуючі агенти та емульгуючі агенти можуть являти собою ПАР катіоногенного, аніоногенного, амфотерного або нейоногенного типу.

Підходящі ПАР катіоногенного типу включають четвертинні амонієві сполуки (наприклад, цетилтриметиламонійбромід), імідазоліни та солі амінів.

Підходящі аніоногенні ПАР включають солі лужних металів жирних кислот, солі аліфатичних моноефірів сірчаної кислоти (наприклад, лаурилсульфат натрію), солі сульфонованих ароматичних сполук (наприклад, додецилбензолсульфонат натрію, додецилбензолсульфонат кальцію, бутилнафталінсульфонат і суміші діізопропіл- і триізопропілнафталінсульфонатов натрію), сульфати простих ефірів, сульфати простих ефірів спиртів (наприклад, лаурет-3-сульфат натрію), карбоксилати простих ефірів (наприклад, лаурет-3-карбоксилат натрію), фосфатні складні ефіри (продукти реакції одного або більшої кількості жирних спиртів з фосфорною кислотою (переважно складні моноефіри) або з пентаоксидом фосфору (переважно складні діефіри), наприклад, продукти реакції лаурилового спирту з тетрафосфорною кислотою; ці продукти також можуть бути етоксиковані), сульфосукцинамат, сульфосукцинати парафінів або олефінів, таурати і лігносульфонати.

Підходящі ПАР амфотерного типу включають бетаїни, пропіонати та гліцинати.

Підходящі ПАР неіоногенного типу включають продукти конденсації алкіленоксидів, таких як етиленоксид, пропіленоксид, бутиленоксид, або їх сумішей з жирними спиртами (такими як олеїловий спирт або цетиловий спирт) або з алкілфенолами (такими як октилфенол, нонілфенол або октилкрезол); часткові складні ефіри, отримані з жирних кислот з довгими ланцюгами або ангідридів гекситу; продукти конденсації зазначених часткових складних ефірів з етиленоксидом; блок-полімери (що включають етиленоксид і пропіленоксид); алканоламіди; звичайні складні ефіри (наприклад, поліетиленгліколеві ефіри жирних кислот); оксиди амінів (наприклад, лаурилдиметиламіноксид); та лецитини.

Підходящі суспензуючі агенти включають гідрофільні колоїди (такі як полісахариди, полівінілпіролідон або натрієва сіль карбоксиметилцелюлози) та глини, що набухають (такі як бентоніт або атапульгіт).

Сполуку формули I можна вносити будь-якими відомими способами нанесення пестицидних сполук. Наприклад, її можна нанести, одну або в композиції, на шкідників або на осередок шкідників (такий як місце проживання шкідників або на рослину, що вирощується та піддана зараженню шкідниками) або на будь-яку частину рослини, включаючи листя, стебла, гілки або коріння, на насіння перед їх висіванням або на інші середовища, в яких виростає або повинна бути посіяна рослина (такі як ґрунт, що оточує коріння, ґрунт у цілому, вода для затоплення або гідропонні системи вирощування), безпосередньо або її можна вносити шляхом розбризкування, обпилення, наносити зануренням, вносити у вигляді препарату, що представляє собою крем або пасту, вносити у вигляді пару або вносити шляхом розподілу композиції (такий як гранульована композиція або композиція, упакована в розчинний у воді пакет) у ґрунті або у водному середовищі або включення в нього.

Сполуку формули I також можна ввести в рослини шляхом ін'єкції або обприскування рослинного покриву з використанням електродинамічних методик обприскування або інших малооб'ємних методик або внести на ділянку за допомогою наземних або авіаційних систем зрошення.

Композиції для застосування в якості водних препаратів (водяних розчинів або дисперсій) зазвичай поставляються у вигляді концентрату, що містить значну частку активного інгредієнта, і перед застосуванням концентрат додають до води. Ці концентрати, які можуть являти собою ДК, СК, ЕК, ЕО, МЕ, ВГ, РП, ЗП, ДГ і КС, часто повинні витримувати зберігання протягом тривалих періодів часу і після такого зберігання після додавання до води повинні бути здатні утворювати водні препарати, які залишаються однорідними протягом часу, достатнього для того, щоб їх можна було вносити за допомогою звичайного обладнання для розбризкування. Такі водні препарати можуть містити різні кількості сполуки формули I (наприклад, від 0,0001 до 10 мас. %) залежно від мети їх застосування.

Сполуку формули I можна застосовувати в сумішах з добривами (наприклад, азото-, каліє- або фосфоровмісними добривами). Підходящі типи препаратів включають гранули добрива. Бажано, щоб суміші містили до 25 мас. % сполуки формули I.

Тому даний винахід також належить до композиції добрива, що містить добриво і сполуку формули I.

Композиції, запропоновані в даному винаході, можуть містити інші сполуки, що мають біологічну активність, наприклад, мікродобрива або сполуки, що мають фунгіцидну активність або, що мають регулюючу ріст рослини, гербіцидну, інсектицидну, нематодцидну або акарицидну активність.

Сполука формули I може бути єдиним активним інгредієнтом композиції або вона може бути змішана з одним або більшою кількістю додаткових активних інгредієнтів, таких як пестицид

(інсектицидний, акарицидний, молюскоцидний і нематоцидний пестицид), фунгіцид, синергетик, гербіцид, антидот або регулятор росту рослин, якщо це доцільно. Таким способом активність композицій, запропонованих в даному винаході, можна значно розширити і вони можуть мати додаткові несподіваними корисними властивостями, які в широкому значенні також можна охарактеризувати, як синергетичну. Додатковий активний інгредієнт може: давати композицію, що має більш широкий спектр активності або підвищену стійкість в осередку розповсюдження; давати композицію, яка краще переноситься рослинами/культурами внаслідок зменшення фітотоксичності; давати композицію, яка знищує комах на різних стадіях розвитку; підсилювати вплив або доповнювати вплив (наприклад, шляхом збільшення швидкості впливу або подолання несприйнятливості) сполуки формули I; або сприяти подоланню чи попередженню розвитку резистентності стосовно окремих компонентів. Те, який конкретний додатковий активний інгредієнт буде використовуватися, залежить від призначення композиції. Приклади пестицидів, які підходять, наступні:

a) Піретроїди, такі як перметрин, циперметрин, фенвалерат, есфенвалерат, дельтаметрин, цигалотрин (зокрема, лямбда-цигалотрин), біфентрін, фенпропатрін, цифлутрин, тефлутрін, безпечні для риб піретроїди (наприклад, етофенпрокс), натуральний піретрин, тетраметрін, sbioallethrin, фенфлутрін, праллетрін або 5-бензил-3-фурілметил-(E) - (1R, 3S) -2,2-диметил-3 - (2-оксотіолан-3-іліденметил) циклопропанкарбоксилат;

b) Фосфорорганічні сполуки, такі як профенофос, сульпрофос, ацефат, метилпаратіон, азінфос-метил, деметон-s-метил, гептенофос, тіометон, фенаміфос, монокротофос, профенофос, тріазофос, метамідофос, диметоату, фосфамідон, малатіон, хлорпирифос, фозалон, тербуфос, фенсульфотіон, фонофос, форат, фоксим, піріміфос-метил, піріміфос-етил, фенітротіон, фостіазат або діазинон;

c) Карбамати (включаючи арілкарбамати), такі як пірімікарб, тріазамат, клоетокарб, карбофуран, фураціокарб, етіофенкарб, альдікарб, тіофурокс, карбосульфат, бендіокарб, фенобукарб, пропоксур, метоміл або оксаміл;

d) Бензоїлсечовини, такі як діфлубензурон, тріфлумурон, гексафлумурон, флуфеноксурон або хлорфлуазурон;

e) Органічні сполуки олова, такі як цігексатін, фенбутатіноксид або азоціклотін;

f) Піразоли, такі як тебуфенпірад і фенпіроксимат;

g) Макроліди, такі як авермектини або мілбеміціни, наприклад, абамектін, емабектінбензоат, івермектин, мілбеміцин, спіносад, азадірахтін, спінеторам або азадірахтін;

h) Гормони і феромони;

i) Хлорорганічні сполуки, такі як ендосульфат (зокрема, альфа-ендосульфат), бензолгексахлорід, ДДТ, хлордан або діельдрін;

j) Амідини, такі як хлордимеформ або амітраз;

k) Фуміганти, такі як хлорпікрин, діхлорпропан, метилбромід або метам;

l) Неонікотиноїдні сполуки, такі як імідаклоприд, тіаклоприд, ацетаміприд, клотіанідин, нітенпірам, динотефуран або тіаметоксам;

m) Діацилгідразини, такі як тебуфенозид, хромафенозид або метоксифенозид;

n) Дифенілові ефіри, такі як діофенолан або пірипроксифен;

o) Індоксакарб;

p) Хлорфенапір;

q) Піметрозин або пірифлуквіназон;

r) Спіротетрамат, спіродиклофен або спіромезифен;

s) Флубендіамід, хлорантраніліпрол або ціантраніліпрол;

t) Ціенопірафен або цифлуметофен; або

u) Сульфоксафлор

В доповнення, до основних хімічних класів пестицидів, що перераховані вище, у композиціях можна використовувати інші пестициди, що впливають на певних шкідників, якщо це доцільно для призначення композиції. Наприклад, можна використовувати інсектициди, селективні для конкретних культур, наприклад, специфічні по відношенню до стеблових пильщиків інсектициди (такі як картап) або специфічні для амбарів інсектициди (такі як бупрофезин) для застосування для рису. Альтернативно, у композицію також можна включати інсектициди або акарициди, специфічні для конкретних видів/стадій розвитку комах (наприклад, акарицидні оволарвіциди, такі як клофентезин, флукбензімін, гекситіазокс або тетрадіфон; акарицидні мотиліциди, такі як дикофол або пропаргіт; акарициди, такі як бромпропілат або хлорбензилат; або регулятори росту, такі як гідраметилнон, циромазин, метопрен, хлорфлуазурон або дифлубензурон).

Бажаними є зазначені нижче суміші сполук формули I з активними інгредієнтами, де термін "сполука формули I" бажано означає сполуку, вибрану з таблиць 1-116:

допоміжну речовину, вибрану з групи речовин, яка включає олію рослинного або тваринного походження, мінеральну олію, складні алкілові ефіри таких олій або суміші таких олій, і мінеральні олії (альтернативна назва) (628) + сполука формули I,

- 5 акаріцид, вибраний з групи речовин, яка включає 1,1-біс(4-хлорфеніл)-2-етоксиетанол (назва за номенклатурою ІЮПАК (Міжнародний союз теоретичної і прикладної хімії)) (910) + сполука формули I, 2,4-дихлорфенілбензолсульфонат (назва за номенклатурою ІЮПАК/Chemical Abstracts) (1059) + сполука формули I, 2-фтор-N-метил-N-1-нафтилацетамід (назва за номенклатурою ІЮПАК) (1295) + сполука формули I, 4-хлорфенілфенілсульфон (назва за номенклатурою ІЮПАК) (981) + сполука формули I, абамектин (1) + сполука формули I, ацехіноцил (3) + сполука формули I, ацетопрол [CCN] + сполука формули I, акринатрин (9) + сполука формули I, альдикарб (16) + сполука формули I, альдоксикарб (863) + сполука формули I, альфа-циперметрин (202) + сполука формули I, амідітін (870) + сполука формули I, амідофлумет [CCN] + сполука формули I, амідотіоат (872) + сполука формули I, амітон (875) + сполука формули I, гідрооксалат амітону (875) + сполука формули I, амітраз (24) + сполука формули I, араміт (881) + сполука формули I, триоксид миш'яку (882) + сполука формули I, AVI 382 (код сполуки) + сполука формули I, AZ 60541 (код сполуки) + сполука формули I, азинфос-етил (44) + сполука формули I, азинфос-метил (45) + сполука формули I, азобензол (назва за номенклатурою ІЮПАК) (888) + сполука формули I, азоциклотин (46) + сполука формули I, азотоат (889) + сполука формули I, беноміл (62) + сполука формули I, беноксафос (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, бензоксимат (71) + сполука формули I, бензилбензоат (назва за номенклатурою ІЮПАК) [CCN] + сполука формули I, біфеназат (74) + сполука формули I, біфентрин (76) + сполука формули I, бінапакрил (907) + сполука формули I, брофенвалерат (альтернативна назва) + сполука формули I, бромоциклен (918) + сполука формули I, бромфос (920) + сполука формули I, бромфос-етил (921) + сполука формули I, бромпропілат (94) + сполука формули I, бупрофезин (99) + сполука формули I, бутокاربоксим (103) + сполука формули I, бутоксикарбоксим (104) + сполука формули I, бутилпіридабен (альтернативна назва) + сполука формули I, полісульфід кальцію (назва за номенклатурою ІЮПАК) (111) + сполука формули I, камфехлор (941) + сполука формули I, карбанолат (943) + сполука формули I, карбарил (115) + сполука формули I, карбофуран (118) + сполука формули I, карбофенотіон (947) + сполука формули I, CGA 50'439 (науково-дослідницький код) (125) + сполука формули I, хінометіонат (126) + сполука формули I, хлорбензид (959) + сполука формули I, хлордимеформ (964) + сполука формули I, гідрохлорид хлордимеформа (964) + сполука формули I, хлорфенапір (130) + сполука формули I, хлорфенетол (968) + сполука формули I, хлорфенсон (970) + сполука формули I, хлорфенсульфід (971) + сполука формули I, хлорфенвінфос (131) + сполука формули I, хлорбензилат (975) + сполука формули I, хлоромебуформ (977) + сполука формули I, хлорометіурон (978) + сполука формули I, хлорпропілат (983) + сполука формули I, хлорпіріфос (145) + сполука формули I, хлорпіріфос-метил (146) + сполука формули I, хлортіофос (994) + сполука формули I, цинерин I (696) + сполука формули I, цинерин II (696) + сполука формули I, цинерини (696) + сполука формули I, клофентезин (158) + сполука формули I, клозантел (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, кумафос (174) + сполука формули I, кротамітон (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, кротоксифос (1010) + сполука формули I, куфранеб (1013) + сполука формули I, ціантоат (1020) + сполука формули I, ціенопірафен [CCN] + сполука формули I, цифлуметофен (реєстраційний № CAS: 400882-07-7) + сполука формули I, цигалотрин (196) + сполука формули I, цигексатин (199) + сполука формули I, циперметрин (201) + сполука формули I, DCPM (1032) + сполука формули I, DDT (219) + сполука формули I, демефіон (1037) + сполука формули I, демефіон-О (1037) + сполука формули I, демефіон-S (1037) + сполука формули I, деметон (1038) + сполука формули I, деметон-метил (224) + сполука формули I, деметон-О (1038) + сполука формули I, деметон-О-метил (224) + сполука формули I, деметон-S (1038) + сполука формули I, деметон-S-метил (224) + сполука формули I, деметон-S-метилсульфон (1039) + сполука формули I, діафентиурон (226) + сполука формули I, діаліфос (1042) + сполука формули I, діазінон (227) + сполука формули I, дихлофлуанід (230) + сполука формули I, дихлорвос (236) + сполука формули I, дикліфос (альтернативна назва) + сполука формули I, дикофол (242) + сполука формули I, дикротофос (243) + сполука формули I, діенохлор (1071) + сполука формули I, дифловідазин [CCN] + сполука формули I, димефокс (1081) + сполука формули I, диметоат (262) + сполука формули I, динактин (альтернативна назва) (653) + сполука формули I, дінекс (1089) + сполука формули I, дінекс-диклексин (1089) + сполука формули I, дінобутон (269) + сполука формули I, дінокап (270) + сполука формули I, дінокап-4 [CCN] + сполука формули I, дінокап-6 [CCN] + сполука формули I, діноктон (1090) + сполука формули I, дінопентон (1092) + сполука формули I, діносульфон (1097) + сполука

формули I, дінотербон (1098) + сполука формули I, діоксатион (1102) + сполука формули I, дифенілсульфон (назва за номенклатурою ІЮПАК) (1103) + сполука формули I, дисульфірам (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, дисульфотон (278) + сполука формули I, DНОС (282) + сполука формули I, дофенапін (1113) + сполука формули I, дорамектин (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, ендосульфан (294) + сполука формули I, ендотион (1121) + сполука формули I, ЕРН (297) + сполука формули I, еприномектин (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, етіон (309) + сполука формули I, етоатметил (1134) + сполука формули I, етоксазол (320) + сполука формули I, етримфос (1142) + сполука формули I, феназафлор (1147) + сполука формули I, феназахін (328) + сполука формули I, фенбутатиноксид (330) + сполука формули I, фенотіокарб (337) + сполука формули I, фенпропатрин (342) + сполука формули I, фенпірад (альтернативна назва) + сполука формули I, фенпіроксимат (345) + сполука формули I, фензон (1157) + сполука формули I, фентрифаніл (1161) + сполука формули I, фенвалерат (349) + сполука формули I, фіпроніл (354) + сполука формули I, флуакрипірим (360) + сполука формули I, флуазурон (1166) + сполука формули I, флубензімін (1167) + сполука формули I, флуциклоксурон (366) + сполука формули I, флуцитринат (367) + сполука формули I, флуенетіл (1169) + сполука формули I, флуфеноксурон (370) + сполука формули I, флуметрин (372) + сполука формули I, фторбензид (1174) + сполука формули I, флувалінат (1184) + сполука формули I, FMC 1137 (науководослідницький код) (1185) + сполука формули I, форметанат (405) + сполука формули I, гідрохлорид форметанату (405) + сполука формули I, формотіон (1192) + сполука формули I, формпаранат (1193) + сполука формули I, гамма-НСН (430) + сполука формули I, глідін (1205) + сполука формули I, галфенпрокс (424) + сполука формули I, гептенофос (432) + сполука формули I, гексадецилциклопропанкарбоксилат (назва за номенклатурою ІЮПАК/Chemical Abstracts) (1216) + сполука формули I, гекситіазокс (441) + сполука формули I, ІКА 2002 (реєстраційний № CAS: 211923-74-9) + сполука формули I, йодметан (назва за номенклатурою ІЮПАК) (542) + сполука формули I, ізокарбофос (альтернативна назва) (473) + сполука формули I, ізопропіл-О-(метоксиамінотіофосфорил)саліцилат (назва за номенклатурою ІЮПАК) (473) + сполука формули I, івермектин (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, жасмолін I (696) + сполука формули I, жасмолін II (696) + сполука формули I, іодфенфос (1248) + сполука формули I, ліндан (430) + сполука формули I, луфенурон (490) + сполука формули I, малатіон (492) + сполука формули I, малонобен (1254) + сполука формули I, мекарбам (502) + сполука формули I, мефосфолан (1261) + сполука формули I, месульфен (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, метакріфос (1266) + сполука формули I, метамідофос (527) + сполука формули I, метидатіон (529) + сполука формули I, метіокарб (530) + сполука формули I, метоміл (531) + сполука формули I, метилбромід (537) + сполука формули I, метолкарб (550) + сполука формули I, мевінфос (556) + сполука формули I, мексакарбат (1290) + сполука формули I, мілбемектин (557) + сполука формули I, мілбеміциноксим (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, міпафокс (1293) + сполука формули I, монокротофос (561) + сполука формули I, морфотіон (1300) + сполука формули I, моксидектин (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, налед (567) + сполука формули I, NC-184 (код сполуки) + сполука формули I, NC-512 (код сполуки) + сполука формули I, ніфлуридід (1309) + сполука формули I, нікоміцини (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, нітрилакарб (1313) + сполука формули I, комплекс нітрилакарбу з хлоридом цинку складу 1:1 (1313) + сполука формули I, NNI-0101 (код сполуки) + сполука формули I, NNI-0250 (код сполуки) + сполука формули I, ометоат (594) + сполука формули I, оксаміл (602) + сполука формули I, оксидепрофос (1324) + сполука формули I, оксидисульфотон (1325) + сполука формули I, pp'-DDT (219) + сполука формули I, паратіон (615) + сполука формули I, перметрин (626) + сполука формули I, мінеральні олії (альтернативна назва) (628) + сполука формули I, фенкаптон (1330) + сполука формули I, фентоат (631) + сполука формули I, форат (636) + сполука формули I, фозалон (637) + сполука формули I, фосфолан (1338) + сполука формули I, фосмет (638) + сполука формули I, фосфамідон (639) + сполука формули I, фоксим (642) + сполука формули I, піриміфос-метил (652) + сполука формули I, поліхлортерпени (традиційна назва) (1347) + сполука формули I, полінактини (альтернативна назва) (653) + сполука формули I, проклонол (1350) + сполука формули I, профенофос (662) + сполука формули I, промацил (1354) + сполука формули I, пропаргіт (671) + сполука формули I, пропетамфос (673) + сполука формули I, пропоксур (678) + сполука формули I, протидатіон (1360) + сполука формули I, протоат (1362) + сполука формули I, піретрин I (696) + сполука формули I, піретрин II (696) + сполука формули I, піретрини (696) + сполука формули I, піридабен (699) + сполука формули I, піридафентіон (701) + сполука формули I, піримідифен (706) + сполука формули I, піримітат (1370) + сполука формули I, хіналфос (711) + сполука формули I, хінтіофос (1381) + сполука формули I, R-1492 (науково-

- дослідницький код) (1382) + сполука формули I, RA-17 (науково-дослідницький код) (1383) + сполука формули I, ротенон (722) + сполука формули I, шрадан (1389) + сполука формули I, себуфос (альтернативна назва) + сполука формули I, селаментин (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, SI-0009 (код сполуки) + сполука формули I, софамід (1402) + сполука формули I, спіродиклофен (738) + сполука формули I, спіромезифен (739) + сполука формули I, SSI-121 (науково-дослідницький код) (1404) + сполука формули I, сульфірам (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, сульфлурамід (750) + сполука формули I, сульфотеп (753) + сполука формули I, сірку (754) + сполука формули I, SZI-121 (науково-дослідницький код) (757) + сполука формули I, тау-флувалінат (398) + сполука формули I, тебуфенпірад (763) + сполука формули I, ТЕРР (1417) + сполука формули I, тербам (альтернативна назва) + сполука формули I, тетрачлорвінфос (777) + сполука формули I, тетрадіфон (786) + сполука формули I, тетранактин (альтернативна назва) (653) + сполука формули I, тетрасул (1425) + сполука формули I, тіафенокс (альтернативна назва) + сполука формули I, тіокарбоксим (1431) + сполука формули I, тіофанокс (800) + сполука формули I, тіометон (801) + сполука формули I, тіохінокс (1436) + сполука формули I, турингенсин (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, тріаміфос (1441) + сполука формули I, тріаратен (1443) + сполука формули I, тріазофос (820) + сполука формули I, тріазурон (альтернативна назва) + сполука формули I, трихлорфон (824) + сполука формули I, трифенофос (1455) + сполука формули I, трінактін (альтернативна назва) (653) + сполука формули I, вамідотіон (847) + сполука формули I, ваніліпрол [CCN] і YI-5302 (код сполуки) + сполука формули I,
- альгіцид, вибраний із групи речовин, яка включає бетоксазин [CCN] + сполука формули I, діоктаноат міді (назва за номенклатурою ІЮПАК) (170) + сполука формули I, сульфат міді (172) + сполука формули I, цибуترین [CCN] + сполука формули I, дихлон (1052) + сполука формули I, дихлорофен (232) + сполука формули I, ендотал (295) + сполука формули I, фентин (347) + сполука формули I, гашене вапно [CCN] + сполука формули I, набам (566) + сполука формули I, хінокламін (714) + сполука формули I, хінонамід (1379) + сполука формули I, сімазін (730) + сполука формули I, трифенілоловоацетат (назва за номенклатурою ІЮПАК) (347) і трифенілоловогідроксид (назва за номенклатурою ІЮПАК) (347) + сполука формули I,
- антигельмінтик, вибраний із групи речовин, яка включає абамектин (1) + сполука формули I, круфомат (1011) + сполука формули I, дорамектин (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, емаектин (291) + сполука формули I, емаектинбензоат (291) + сполука формули I, еприномектин (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, івермектин (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, мілбемициноксим (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, моксидектин (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, піперазин [CCN] + сполука формули I, селаментин (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, спіносад (737) і тіофанат (1435) + сполука формули I,
- авіцид, вибраний із групи речовин, яка включає хлоралозу (127) + сполука формули I, ендрин (1122) + сполука формули I, фентіон (346) + сполука формули I, піридин-4-амін (назва за номенклатурою ІЮПАК) (23) і стрихнін (745) + сполука формули I,
- бактеріцид, вибраний із групи речовин, яка включає 1-гідрокси-1Н-піридин-2-тіон (назва за номенклатурою ІЮПАК) (1222) + сполука формули I, 4-(хіноксалин-2-іламіно)бензолсульфонамід (назва за номенклатурою ІЮПАК) (748) + сполука формули I, 8-гідроксихінолінсульфат (446) + сполука формули I, бронопол (97) + сполука формули I, діоктаноат міді (назва за номенклатурою ІЮПАК) (170) + сполука формули I, гідроксид міді (назва за номенклатурою ІЮПАК) (169) + сполука формули I, крезол [CCN] + сполука формули I, дихлорофен (232) + сполука формули I, дипіритион (1105) + сполука формули I, додіцин (1112) + сполука формули I, фенаміносулф (1144) + сполука формули I, формальдегід (404) + сполука формули I, гідраргафен (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, касугаміцин (483) + сполука формули I, гідрат касугаміцингідрохлориду (483) + сполука формули I, біс(диметилдитіокарбамат) нікеля (назва за номенклатурою ІЮПАК) (1308) + сполука формули I, нітрапирин (580) + сполука формули I, октиліон (590) + сполука формули I, оксолінову кислоту (606) + сполука формули I, окситетрациклин (611) + сполука формули I, гідроксихінолінсульфат калію (446) + сполука формули I, пробеназол (658) + сполука формули I, стрептоміцин (744) + сполука формули I, сесквісульфат стрептоміцину (744) + сполука формули I, теклофталам (766) + сполука формули I і тіомерсал (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I,
- біологічний агент, вибраний із групи речовин, яка включає *Adoxophyes orana* GV (альтернативна назва) (12) + сполука формули I, *Agrobacterium radiobacter* (альтернативна назва) (13) + сполука формули I, *Amblyseius* spp (альтернативна назва) (19) + сполука формули I, *Anagrapta falcifera* NPV (альтернативна назва) (28) + сполука формули I, *Anagrus atomus* (альтернативна назва) (29) + сполука формули I, *Aphelinus abdominalis* (альтернативна назва)

- (33) + сполука формули I, *Aphidius colemani* (альтернативна назва) (34) + сполука формули I, *Aphidoletes aphidimyza* (альтернативна назва) (35) + сполука формули I, *Autographa californica* NPV (альтернативна назва) (38) + сполука формули I, *Bacillus firmus* (альтернативна назва) (48) + сполука формули I, *Bacillus sphaericus* Neide (наукова назва) (49) + сполука формули I, *Bacillus thuringiensis* Berliner (наукова назва) (51) + сполука формули I, *Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai* (наукова назва) (51) + сполука формули I, *Bacillus thuringiensis* subsp. *israelensis* (наукова назва) (51) + сполука формули I, *Bacillus thuringiensis* subsp. *japonensis* (наукова назва) (51) + сполука формули I, *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki* (наукова назва) (51) + сполука формули I, *Bacillus thuringiensis* subsp. *tenebrionis* (наукова назва) (51) + сполука формули I, *Beauveria bassiana* (альтернативна назва) (53) + сполука формули I, *Beauveria brongniartii* (альтернативна назва) (54) + сполука формули I, *Chrysoperla carnea* (альтернативна назва) (151) + сполука формули I, *Cryptolaemus montrouzieri* (альтернативна назва) (178) + сполука формули I, *Cydia pomonella* GV (альтернативна назва) (191) + сполука формули I, *Dacnusa sibirica* (альтернативна назва) (212) + сполука формули I, *Diglyphus isaea* (альтернативна назва) (254) + сполука формули I, *Encarsia formosa* (наукова назва) (293) + сполука формули I, *Eretmocerus eremicus* (альтернативна назва) (300) + сполука формули I, *Helicoverpa zea* NPV (альтернативна назва) (431) + сполука формули I, *Heterorhabditis bacteriophora* і *H. megidis* (альтернативна назва) (433) + сполука формули I, *Hippodamia convergens* (альтернативна назва) (442) + сполука формули I, *Leptomastix dactylopii* (альтернативна назва) (488) + сполука формули I, *Macrolophus caliginosus* (альтернативна назва) (491) + сполука формули I, *Mamestra brassicae* NPV (альтернативна назва) (494) + сполука формули I, *Metaphycus helvolus* (альтернативна назва) (522) + сполука формули I, *Metarhizium anisopliae* var. *acridum* (наукова назва) (523) + сполука формули I, *Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae* (наукова назва) (523) + сполука формули I, *Neodiprion sertifer* NPV і *N. lecontei* NPV (альтернативна назва) (575) + сполука формули I, *Orius* spp (альтернативна назва) (596) + сполука формули I, *Paecilomyces fumosoroseus* (альтернативна назва) (613) + сполука формули I, *Phytoseiulus persimilis* (альтернативна назва) (644) + сполука формули I, мультикапсидний ядерний поліедрозний вірус *Spodoptera exigua* (наукова назва) (741) + сполука формули I, *Steinernema bibionis* (альтернативна назва) (742) + сполука формули I, *Steinernema carpocapsae* (альтернативна назва) (742) + сполука формули I, *Steinernema feltiae* (альтернативна назва) (742) + сполука формули I, *Steinernema glaseri* (альтернативна назва) (742) + сполука формули I, *Steinernema riobrave* (альтернативна назва) (742) + сполука формули I, *Steinernema riobravis* (альтернативна назва) (742) + сполука формули I, *Steinernema scapterisci* (альтернативна назва) (742) + сполука формули I, *Steinernema* spp. (альтернативна назва) (742) + сполука формули I, *Trichogramma* spp. (альтернативна назва) (826) + сполука формули I, *Typhlodromus occidentalis* (альтернативна назва) (844) і *Verticillium lecanii* (альтернативна назва) (848) + сполука формули I,
- стерилізатор ґрунту, вибраний із групи речовин, яка включає йодметан (назва за номенклатурою ІЮПАК) (542) і метилбромід (537) + сполука формули I,
- хемостерилізатор, вибраний із групи речовин, яка включає афолат [CCN] + сполука формули I, бісазір (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, бісульфан (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, дифлубензурон (250) + сполука формули I, діматиф (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, хемель [CCN] + сполука формули I, хемпа [CCN] + сполука формули I, метепа [CCN] + сполука формули I, метіотепа [CCN] + сполука формули I, метилафолат [CCN] + сполука формули I, морзид [CCN] + сполука формули I, пенфлурон (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, тепа [CCN] + сполука формули I, тіохемпа (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, тіотепа (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, третамін (альтернативна назва) [CCN] і уредепа (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I,
- феромон комах, вибраний із групи речовин, яка включає (Е)-дец-5-ен-1-ілацетат з (Е)-дец-5-ен-1-олом (назва за номенклатурою ІЮПАК) (222) + сполука формули I, (Е)-тридец-4-ен-1-ілацетат (назва за номенклатурою ІЮПАК) (829) + сполука формули I, (Е)-6-метилгепт-2-ен-4-ол (назва за номенклатурою ІЮПАК) (541) + сполука формули I, (Е, Z)-тетрадека-4,10-діен-1-ілацетат (назва за номенклатурою ІЮПАК) (779) + сполука формули I, (Z)-додец-7-ен-1-ілацетат (назва за номенклатурою ІЮПАК) (285) + сполука формули I, (Z)-гексадец-11-еналь (назва за номенклатурою ІЮПАК) (436) + сполука формули I, (Z)-гексадец-11-ен-1-ілацетат (назва за номенклатурою ІЮПАК) (437) + сполука формули I, (Z)-гексадец-13-ен-11-ін-1-ілацетат (назва за номенклатурою ІЮПАК) (438) + сполука формули I, (Z)-ікоз-13-ен-10-он (назва за номенклатурою ІЮПАК) (448) + сполука формули I, (Z)-тетрадец-7-ен-1-аль (назва за номенклатурою ІЮПАК) (782) + сполука формули I, (Z)-тетрадец-9-ен-1-ол (назва за

- номенклатурою ІЮПАК) (783) + сполука формули I, (Z)-тетрадец-9-ен-1-ілацетат (назва за номенклатурою ІЮПАК) (784) + сполука формули I, (7E, 9Z)-додека-7,9-діен-1-ілацетат (назва за номенклатурою ІЮПАК) (283) + сполука формули I, (9Z, 11E)-тетрадека-9,11-діен-1-ілацетат (назва за номенклатурою ІЮПАК) (780) + сполука формули I, (9Z, 12E)-тетрадека-9,12-діен-1-ілацетат (назва за номенклатурою ІЮПАК) (781) + сполука формули I, 14-метилоктадец-1-ен (назва за номенклатурою ІЮПАК) (545) + сполука формули I, 4-метилнонан-5-ол с 4-метилнонан-5-оном (назва за номенклатурою ІЮПАК) (544) + сполука формули I, альфа-мультистріатин (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, бревікомін (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, кодлелур (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, кодлемон (альтернативна назва) (167) + сполука формули I, куелур (альтернативна назва) (179) + сполука формули I, диспарлур (277) + сполука формули I, додец-8-ен-1-ілацетат (назва за номенклатурою ІЮПАК) (286) + сполука формули I, додец-9-ен-1-ілацетат (назва за номенклатурою ІЮПАК) (287) + сполука формули I, додека-8 + сполука формули I, 10-діен-1-ілацетат (назва за номенклатурою ІЮПАК) (284) + сполука формули I, домінікалур (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, етил 4-метилоктаноат (назва за номенклатурою ІЮПАК) (317) + сполука формули I, евенол (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, фронталін (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, госсіплур (альтернативна назва) (420) + сполука формули I, грандлур (421) + сполука формули I, грандлур I (альтернативна назва) (421) + сполука формули I, грандлур II (альтернативна назва) (421) + сполука формули I, грандлур III (альтернативна назва) (421) + сполука формули I, грандлур IV (альтернативна назва) (421) + сполука формули I, гексалур [CCN] + сполука формули I, іпсдіенол (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, іпсенол (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, японілур (альтернативна назва) (481) + сполука формули I, лінеатін (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, літлур (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, лооплур (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, медлур [CCN] + сполука формули I, мегатомоеву кислоту (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, метилевгенол (альтернативна назва) (540) + сполука формули I, мускалур (563) + сполука формули I, октадека-2,13-діен-1-ілацетат (назва за номенклатурою ІЮПАК) (588) + сполука формули I, октадека-3,13-діен-1-ілацетат (назва за номенклатурою ІЮПАК) (589) + сполука формули I, орфралур (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, орикталур (альтернативна назва) (317) + сполука формули I, острамон (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, сиглур [CCN] + сполука формули I, сордідин (альтернативна назва) (736) + сполука формули I, сулкатол (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, тетрадец-11-ен-1-ілацетат (назва за номенклатурою ІЮПАК) (785) + сполука формули I, тримедлур (839) + сполука формули I, тримедлур А (альтернативна назва) (839) + сполука формули I, тримедлур В₁ (альтернативна назва) (839) + сполука формули I, тримедлур В₂ (альтернативна назва) (839) + сполука формули I, тримедлур С (альтернативна назва) (839) і trunc-call (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I,
- репелент для комах, вибраний із групи речовин, яка включає 2-(октилтіо)етанол (назва за номенклатурою ІЮПАК) (591) + сполука формули I, бутопіроноксил (933) + сполука формули I, бутокси(поліпропіленгліколь) (936) + сполука формули I, дибутиладіпат (назва за номенклатурою ІЮПАК) (1046) + сполука формули I, дибутилфталат (1047) + сполука формули I, дибутилсукцинат (назва за номенклатурою ІЮПАК) (1048) + сполука формули I, діетилтолуамід [CCN] + сполука формули I, диметилкарбат [CCN] + сполука формули I, диметилфталат [CCN] + сполука формули I, етилгександиол (1137) + сполука формули I, гексамід [CCN] + сполука формули I, метохін-бутил (1276) + сполука формули I, метилнеодеканамід [CCN] + сполука формули I, оксамат [CCN] і пікарідин [CCN] + сполука формули I,
- інсектицид, вибраний із групи речовин, яка включає 1-дихлор-1-нітроетан (назва за номенклатурою ІЮПАК/Chemical Abstracts) (1058) + сполука формули I, 1,1-дихлор-2,2-біс(4-етилфеніл)етан (назва за номенклатурою ІЮПАК) (1056), + сполука формули I, 1,2-дихлорпропан (назва за номенклатурою ІЮПАК/Chemical Abstracts) (1062) + сполука формули I, 1,2-дихлорпропан с 1,3-дихлорпропеном (назва за номенклатурою ІЮПАК) (1063) + сполука формули I, 1-бром-2-хлоретан (назва за номенклатурою ІЮПАК/Chemical Abstracts) (916) + сполука формули I, 2,2,2-трихлор-1-(3,4-дихлорфеніл)етилацетат (назва за номенклатурою ІЮПАК) (1451) + сполука формули I, 2,2-дихлорвініл-2-етилсульфінетилметилфосфат (назва за номенклатурою ІЮПАК) (1066) + сполука формули I, 2-(1,3-дитіолан-2-іл)фенілдиметилкарбамат (назва за номенклатурою ІЮПАК/Chemical Abstracts) (1109) + сполука формули I, 2-(2-бутоксietокси)етилтіоціанат (назва за номенклатурою ІЮПАК/Chemical Abstracts) (935) + сполука формули I, 2-(4,5-диметил-1,3-діоксолан-2-ил)фенілметилкарбамат

- (назва за номенклатурою ІЮПАК/Chemical Abstracts) (1084) + сполука формули I, 2-(4-хлор-3,5-ксиліокси)етанол (назва за номенклатурою ІЮПАК) (986) + сполука формули I, 2-хлорвінілдіетилфосфат (назва за номенклатурою ІЮПАК) (984) + сполука формули I, 2-імідазолідон (назва за номенклатурою ІЮПАК) (1225) + сполука формули I, 2-ізовалериліндан-1,3-діон (назва за номенклатурою ІЮПАК) (1246) + сполука формули I, 2-метил(проп-2-ініл)амінофенілметилкарбамат (назва за номенклатурою ІЮПАК) (1284) + сполука формули I, 2-тіоціанатоетиллаурат (назва за номенклатурою ІЮПАК) (1433) + сполука формули I, 3-бром-1-хлорпроп-1-ен (назва за номенклатурою ІЮПАК) (917) + сполука формули I, 3-метил-1-фенілпіразол-5-ілдиметилкарбамат (назва за номенклатурою ІЮПАК) (1283) + сполука формули I, 4-метил(проп-2-ініл)аміно-3,5-ксилілметилкарбамат (назва за номенклатурою ІЮПАК) (1285) + сполука формули I, 5,5-диметил-3-оксоциклогекс-1-енілдиметилкарбамат (назва за номенклатурою ІЮПАК) (1085) + сполука формули I, абамектин (1) + сполука формули I, ацефат (2) + сполука формули I, ацетаміпрід (4) + сполука формули I, ацетіон (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, ацетопрол [CCN] + сполука формули I, акринатрин (9) + сполука формули I, акрилонітрил (назва за номенклатурою ІЮПАК) (861) + сполука формули I, аланікарб (15) + сполука формули I, альдікарб (16) + сполука формули I, альдоксикарб (863) + сполука формули I, альдрин (864) + сполука формули I, алетрин (17) + сполука формули I, алосамідин (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, алілоксикарб (866) + сполука формули I, альфа-циперметрин (202) + сполука формули I, альфа-екдізон (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, альфа-ендосульфат [CCN] + сполука формули I, фосфід алюмінію (640) + сполука формули I, амідитіон (870) + сполука формули I, амідотіоат (872) + сполука формули I, амінокарб (873) + сполука формули I, амітон (875) + сполука формули I, гідрооксалат амітону (875) + сполука формули I, амітраз (24) + сполука формули I, анабазин (877) + сполука формули I, атидатіон (883) + сполука формули I, AVI 382 (код сполуки) + сполука формули I, AZ 60541 (код сполуки) + сполука формули I, азадирахтін (альтернативна назва) (41) + сполука формули I, азаметифос (42) + сполука формули I, азинфос-етил (44) + сполука формули I, азинфос-метил (45) + сполука формули I, азотоат (889) + сполука формули I, дельта-ендотоксини *Bacillus thuringiensis* (альтернативна назва) (52) + сполука формули I, гексафторсилікат барію (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, полісульфід барію (назва за номенклатурою ІЮПАК/Chemical Abstracts) (892) + сполука формули I, бартрин [CCN] + сполука формули I, Bayer 22/190 (науково-дослідницький код) (893) + сполука формули I, Bayer 22408 (науково-дослідницький код) (894) + сполука формули I, бендіокарб (58) + сполука формули I, бенфуракарб (60) + сполука формули I, бенсултап (66) + сполука формули I, бета-цифлутрин (194) + сполука формули I, бета-циперметрин (203) + сполука формули I, біфентрин (76) + сполука формули I, біоалетрин (78) + сполука формули I, S-циклопентенильний ізомер біоалетрина (альтернативна назва) (79) + сполука формули I, біоетанометрин [CCN] + сполука формули I, біоперметрин (908) + сполука формули I, біоресметрин (80) + сполука формули I, біс(2-хлоретилловий)ефір (назва за номенклатурою ІЮПАК) (909) + сполука формули I, бістрифлурон (83) + сполука формули I, буру (86) + сполука формули I, брофенвалерат (альтернативна назва) + сполука формули I, бромфенвінфос (914) + сполука формули I, бромоециклен (918) + сполука формули I, бром-DDT (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, бромфос (920) + сполука формули I, бромфос-етил (921) + сполука формули I, буфенкарб (924) + сполука формули I, бупрофезин (99) + сполука формули I, бутаккарб (926) + сполука формули I, бутатіофос (927) + сполука формули I, бутоксикарбоксим (103) + сполука формули I, бутонат (932) + сполука формули I, бутоксикарбоксим (104) + сполука формули I, бутілпіридабен (альтернативна назва) + сполука формули I, кадусафос (109) + сполука формули I, арсенат кальцію [CCN] + сполука формули I, ціанід кальцію (444) + сполука формули I, полісульфід кальцію (назва за номенклатурою ІЮПАК) (111) + сполука формули I, камфехлор (941) + сполука формули I, карбанолат (943) + сполука формули I, карбарил (115) + сполука формули I, карбофуран (118) + сполука формули I, дисульфід вуглецю (назва за номенклатурою ІЮПАК/Chemical Abstracts) (945) + сполука формули I, тетрахлорид вуглецю (назва за номенклатурою ІЮПАК) (946) + сполука формули I, карбофенотіон (947) + сполука формули I, карбосульфат (119) + сполука формули I, картап (123) + сполука формули I, картапгідрохлорид (123) + сполука формули I, цевадин (альтернативна назва) (725) + сполука формули I, хлорантраніліпрол [CCN] + сполука формули I, хлорбіциклен (960) + сполука формули I, хлордан (128) + сполука формули I, хлордекон (963) + сполука формули I, хлордимеформ (964) + сполука формули I, гідрохлорид хлордимеформа (964) + сполука формули I, хлоретоксифос (129) + сполука формули I, хлорфенапір (130) + сполука формули I, хлорфенвінфос (131) + сполука формули I, хлорфлуазурон (132) + сполука формули I, хлормефос (136) + сполука формули I, хлороформ [CCN] + сполука формули I, хлорпікрин (141)

- + сполука формули I, хлорфоксим (989) + сполука формули I, хлорпразофос (990) + сполука формули I, хлорпіріфос (145) + сполука формули I, хлорпіріфос-метил (146) + сполука формули I, хлортіофос (994) + сполука формули I, хромафенозид (150) + сполука формули I, цинерин I (696) + сполука формули I, цинерин II (696) + сполука формули I, цинерини (696) + сполука формули I, цис-ресметрин (альтернативна назва) + сполука формули I, цисметрин (80) + сполука формули I, клоцитрин (альтернативна назва) + сполука формули I, клоетокарб (999) + сполука формули I, клозантел (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, клотіанідин (165) + сполука формули I, ацетоарсеніт міді [CCN] + сполука формули I, арсенат міді [CCN] + сполука формули I, олеат міді [CCN] + сполука формули I, кумафос (174) + сполука формули I, кумітоат (1006) + сполука формули I, кротамітон (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, кротоксифос (1010) + сполука формули I, круфомат (1011) + сполука формули I, кріоліт (альтернативна назва) (177) + сполука формули I, CS 708 (науково-дослідницький код) (1012) + сполука формули I, ціанофенфос (1019) + сполука формули I, ціанофос (184) + сполука формули I, ціантоат (1020) + сполука формули I, ціантраніліпрол [CCN] + сполука формули I, циклетрин [CCN] + сполука формули I, циклопротрин (188) + сполука формули I, цифлутрин (193) + сполука формули I, цигалотрин (196) + сполука формули I, циперметрин (201) + сполука формули I, цифенотрин (206) + сполука формули I, циромазин (209) + сполука формули I, цитіоат (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, d-лімонен (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, d-тетраметрин (альтернативна назва) (788) + сполука формули I, DAEP (1031) + сполука формули I, дазомет (216) + сполука формули I, DDT (219) + сполука формули I, декарбофуран (1034) + сполука формули I, дельтаметрин (223) + сполука формули I, демефіон (1037) + сполука формули I, демефіон-О (1037) + сполука формули I, демефіон-S (1037) + сполука формули I, деметон (1038) + сполука формули I, деметон-метил (224) + сполука формули I, деметон-О (1038) + сполука формули I, деметон-О-метил (224) + сполука формули I, деметон-S (1038) + сполука формули I, деметон-S-метил (224) + сполука формули I, деметон-S-метилсульфон (1039) + сполука формули I, діафентіурон (226) + сполука формули I, діаліфос (1042) + сполука формули I, діамідафос (1044) + сполука формули I, діазінон (227) + сполука формули I, дикаптон (1050) + сполука формули I, дихлофентіон (1051) + сполука формули I, дихлорвос (236) + сполука формули I, дикліфос (альтернативна назва) + сполука формули I, дикрезил (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, дикротофос (243) + сполука формули I, дицикланіл (244) + сполука формули I, діельдрин (1070) + сполука формули I, діетил-5-метилпіразол-3-ілфосфат (назва за номенклатурою ІЮПАК) (1076) + сполука формули I, дифлубензурон (250) + сполука формули I, дилор (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, димефлутрин [CCN] + сполука формули I, димефокс (1081) + сполука формули I, диметан (1085) + сполука формули I, диметоат (262) + сполука формули I, диметрин (1083) + сполука формули I, диметилвінфос (265) + сполука формули I, диметилан (1086) + сполука формули I, динекс (1089) + сполука формули I, динекс-диклексин (1089) + сполука формули I, динопроп (1093) + сполука формули I, диносам (1094) + сполука формули I, диносеб (1095) + сполука формули I, динотефуран (271) + сполука формули I, діофенолан (1099) + сполука формули I, діоксабензофос (1100) + сполука формули I, діоксакарб (1101) + сполука формули I, діоксатион (1102) + сполука формули I, дисульфотон (278) + сполука формули I, дитикрофос (1108) + сполука формули I, DNOC (282) + сполука формули I, дорамектин (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, DSP (1115) + сполука формули I, екдилстерон (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, EI 1642 (науково-дослідницький код) (1118) + сполука формули I, емаектин (291) + сполука формули I, емаектинбензоат (291) + сполука формули I, EMPC (1120) + сполука формули I, емпентрин (292) + сполука формули I, ендосульфат (294) + сполука формули I, ендотіон (1121) + сполука формули I, ендрин (1122) + сполука формули I, EPBP (1123) + сполука формули I, EPN (297) + сполука формули I, епофенонан (1124) + сполука формули I, епріномектин (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, есфенвалерат (302) + сполука формули I, етафос (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, етіофенкарб (308) + сполука формули I, етіон (309) + сполука формули I, етипрол (310) + сполука формули I, етоат-метил (1134) + сполука формули I, етопрофос (312) + сполука формули I, етилформіат (назва за номенклатурою ІЮПАК) [CCN] + сполука формули I, етил-DDD (альтернативна назва) (1056) + сполука формули I, етилендибромід (316) + сполука формули I, етилендихлорид (хімічна назва) (1136) + сполука формули I, етиленоксид [CCN] + сполука формули I, етофенпрокс (319) + сполука формули I, етримфос (1142) + сполука формули I, EXD (1143) + сполука формули I, фампур (323) + сполука формули I, фенаміфос (326) + сполука формули I, феназафлор (1147) + сполука формули I, фенхлорфос (1148) + сполука формули I, фенетакарб (1149) + сполука формули I, фенфлутрин (1150) + сполука формули I, фенітротіон (335) + сполука формули I, фенобукарб (336) + сполука формули I,

феноксакрим (1153) + сполука формули I, феноксикарб (340) + сполука формули I, фенпіритрин (1155) + сполука формули I, фенпропатрин (342) + сполука формули I, фенпірад (альтернативна назва) + сполука формули I, фенсульфотіон (1158) + сполука формули I, фентіон (346) + сполука формули I, фентіон-етил [CCN] + сполука формули I, фенвалерат (349) + сполука формули I, фіпроніл (354) + сполука формули I, флонікамід (358) + сполука формули I, флубендіамід (гексафторсилікат барію: 272451-65-7) + сполука формули I, флукофурон (1168) + сполука формули I, флуциклоксурон (366) + сполука формули I, флуцитринат (367) + сполука формули I, флуенетіл (1169) + сполука формули I, флуфенерим [CCN] + сполука формули I, флуфеноксурон (370) + сполука формули I, флуфенпрокс (1171) + сполука формули I, флуметрин (372) + сполука формули I, флувалінат (1184) + сполука формули I, FMC 1137 (науково-дослідницький код) (1185) + сполука формули I, фонофос (1191) + сполука формули I, форметанат (405) + сполука формули I, гідрохлорид форметаната (405) + сполука формули I, формотіон (1192) + сполука формули I, формпаранат (1193) + сполука формули I, фосметилан (1194) + сполука формули I, фоспірат (1195) + сполука формули I, фостіазат (408) + сполука формули I, фосіетан (1196) + сполука формули I, фураціокарб (412) + сполука формули I, фуретрин (1200) + сполука формули I, гамма-цигалотрин (197) + сполука формули I, гамма-HCH (430) + сполука формули I, гуазатин (422) + сполука формули I, гуазатинацетати (422) + сполука формули I, GY-81 (науково-дослідницький код) (423) + сполука формули I, галфенпрокс (424) + сполука формули I, галофенозид (425) + сполука формули I, HCH (430) + сполука формули I, HEOD (1070) + сполука формули I, гептахлор (1211) + сполука формули I, гептенофос (432) + сполука формули I, гетерофос [CCN] + сполука формули I, гексафлумурон (439) + сполука формули I, HHDN (864) + сполука формули I, гідраметилнон (443) + сполука формули I, ціанід водню (444) + сполука формули I, гідропрен (445) + сполука формули I, хіквінкарб (1223) + сполука формули I, імідаклопрід (458) + сполука формули I, іміпротрин (460) + сполука формули I, індоксакарб (465) + сполука формули I, йодметан (назва за номенклатурою ІЮПАК) (542) + сполука формули I, IPSP (1229) + сполука формули I, ізазофос (1231) + сполука формули I, ізобензан (1232) + сполука формули I, ізокарбофос (альтернативна назва) (473) + сполука формули I, ізодрин (1235) + сполука формули I, ізофенфос (1236) + сполука формули I, ізолан (1237) + сполука формули I, ізопрокарб (472) + сполука формули I, ізопропіл-О-(метоксиамінотіофосфорил)саліцилат (назва за номенклатурою ІЮПАК) (473) + сполука формули I, ізопротіолан (474) + сполука формули I, ізотіоат (1244) + сполука формули I, ізоксатіон (480) + сполука формули I, івермектин (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, жасмолін I (696) + сполука формули I, жасмолін II (696) + сполука формули I, іодфенфос (1248) + сполука формули I, ювенільний гормон I (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, ювенільний гормон II (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, ювенільний гормон III (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, келеван (1249) + сполука формули I, кінопрен (484) + сполука формули I, лямбда-цигалотрин (198) + сполука формули I, арсенат свинцю [CCN] + сполука формули I, лепімектин (CCN) + сполука формули I, лептофос (1250) + сполука формули I, ліндан (430) + сполука формули I, лірімфос (1251) + сполука формули I, луфенурон (490) + сполука формули I, літидатіон (1253) + сполука формули I, м-куменілметилкарбамат (назва за номенклатурою ІЮПАК) (1014) + сполука формули I, фосфід магнію (назва за номенклатурою ІЮПАК) (640) + сполука формули I, малатіон (492) + сполука формули I, малонобен (1254) + сполука формули I, мазидокс (1255) + сполука формули I, мекарбам (502) + сполука формули I, мекарфон (1258) + сполука формули I, меназон (1260) + сполука формули I, мефосфолан (1261) + сполука формули I, хлорид ртуті(II) (513) + сполука формули I, месульфенфос (1263) + сполука формули I, метафлумізон (CCN) + сполука формули I, метам (519) + сполука формули I, метам-калій (альтернативна назва) (519) + сполука формули I, метам-натрій (519) + сполука формули I, метакріфос (1266) + сполука формули I, метамідофос (527) + сполука формули I, метансульфонілфторид (назва за номенклатурою ІЮПАК/Chemical Abstracts) (1268) + сполука формули I, метидатіон (529) + сполука формули I, метіокарб (530) + сполука формули I, метокротофос (1273) + сполука формули I, метоміл (531) + сполука формули I, метопрен (532) + сполука формули I, метохін-бутил (1276) + сполука формули I, метотрин (альтернативна назва) (533) + сполука формули I, метоксихлор (534) + сполука формули I, метоксифенозид (535) + сполука формули I, метилбромід (537) + сполука формули I, метилізотіоціанат (543) + сполука формули I, метилхлороформ (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, метиленхлорид [CCN] + сполука формули I, метофлутрин [CCN] + сполука формули I, метолкарб (550) + сполука формули I, метоксadiaзон (1288) + сполука формули I, мевінфос (556) + сполука формули I, мексакарбат (1290) + сполука формули I, мілбемектин (557) + сполука формули I, мілбеміциноксим (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, міпафокс (1293) + сполука

формули I, мірекс (1294) + сполука формули I, монокротофос (561) + сполука формули I, морфотіон (1300) + сполука формули I, моксибектин (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, нафталофос (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, налед (567) + сполука формули I, нафталін (назва за номенклатурою ІЮПАК/Chemical Abstracts) (1303) +
 5 сполука формули I, NC-170 (науково-дослідницький код) (1306) + сполука формули I, NC-184 (код сполуки) + сполука формули I, нікотин (578) + сполука формули I, нікотинсульфат (578) + сполука формули I, ніфлурідид (1309) + сполука формули I, нітенпірам (579) + сполука формули I, нітіазин (1311) + сполука формули I, нітрилакарб (1313) + сполука формули I, комплекс нітрилакарба з хлоридом цинку складу 1:1 (1313) + сполука формули I, NNI-0101 (код сполуки) +
 10 сполука формули I, NNI-0250 (код сполуки) + сполука формули I, норнікотин (традиційна назва) (1319) + сполука формули I, новалурон (585) + сполука формули I, новіфлумурон (586) + сполука формули I, О-5-дихлор-4-йодфеніл-О-етилетилфосфонотіоат (назва за номенклатурою ІЮПАК) (1057) + сполука формули I, О, О'-діетил-О-4-метил-2-оксо-2Н-хромен-7-ілфосфоротіоат (назва за номенклатурою ІЮПАК) (1074) + сполука формули I, О, О'-діетил-О-6-метил-2-пропілпіримідин-4-ілфосфоротіоат (назва за номенклатурою ІЮПАК) (1075) + сполука формули I, О, О',О'-тетрапропілдітіопірофосфат (назва за номенклатурою ІЮПАК) (1424) +
 15 сполука формули I, олеїнову кислоту (назва за номенклатурою ІЮПАК) (593) + сполука формули I, ометоат (594) + сполука формули I, оксаміл (602) + сполука формули I, оксидеметон-метил (609) + сполука формули I, оксидепрофос (1324) + сполука формули I, оксидисульфотон (1325) + сполука формули I, pp'-DDT (219) + сполука формули I, парадихлорбензол [CCN] + сполука формули I, паратіон (615) + сполука формули I, паратіон-метил (616) + сполука формули I, пенфлурон (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, пентахлорфенол (623) + сполука формули I, пентахлорфеніллаурат (назва за номенклатурою ІЮПАК) (623) + сполука формули I, перметрин (626) + сполука формули I, мінеральні олії (альтернативна назва) (628) + сполука формули I, PH 60-38 (науково-дослідницький код) (1328) + сполука формули I, фенкаптон (1330) + сполука формули I, фенотрин (630) + сполука формули I, фентоат (631) + сполука формули I, форат (636) + сполука формули I, фозалон (637) + сполука формули I, фосфолан (1338) + сполука формули I, фосмет (638) + сполука формули I, фосніхлор (1339) + сполука формули I, фосфамідон (639) + сполука формули I, фосфін (назва за номенклатурою ІЮПАК) (640) + сполука формули I, фоксім (642) + сполука формули I, фоксім-метил (1340) + сполука формули I, піриметафос (1344) + сполука формули I, пірімікарб (651) + сполука формули I, піріміфос-етил (1345) + сполука формули I, піріміфос-метил (652) + сполука формули I, ізомери поліхлордициклопентадієну (назва за номенклатурою ІЮПАК) (1346) + сполука формули I, поліхлортерпени (традиційна назва) (1347) + сполука формули I, арсеніт калію [CCN] + сполука формули I, тіоціанат калію [CCN] + сполука формули I, пралетрин (655) + сполука формули I, прекоцен I (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, прекоцен II (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, примідофос (1349) + сполука формули I, профенофос (662) + сполука формули I, профлутрин [CCN] + сполука формули I, промацил (1354) + сполука формули I, промекарб (1355) + сполука формули I, пропафос (1356) + сполука формули I, пропетамфос (673) + сполука формули I, пропоксур (678) + сполука формули I, протидатіон (1360) + сполука формули I, протіофос (686) + сполука формули I, протоат (1362) + сполука формули I, протрифенбут [CCN] + сполука формули I, піметрозин (688) + сполука формули I, піраклофос (689) + сполука формули I, пірафлупрол [CCN] + сполука формули I, піразофос (693) + сполука формули I, піресметрин (1367) + сполука формули I, піретрин I (696) + сполука формули I, піретрин II (696) + сполука формули I, піретрини (696) + сполука формули I, піридабен (699) + сполука формули I, піридаліл (700) + сполука формули I, піридафентіон (701) + сполука формули I, пірифлуквіназон [CCN] + сполука формули I, піримідифен (706) + сполука формули I, піримітат (1370) + сполука формули I, пірипрол [CCN] + сполука формули I, пірипроксифен (708) + сполука формули I, касія (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, хіналфос (711) + сполука формули I, хіналфос-метил (1376) + сполука формули I, хінотіон (1380) + сполука формули I, хінтіофос (1381) + сполука формули I, R-1492 (науково-дослідницький код) (1382) + сполука формули I, рафоксанід (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, ресметрин (719) + сполука формули I, ротенон (722) + сполука формули I, RU 15525 (науково-дослідницький код) (723) + сполука формули I, RU 25475 (науково-дослідницький код) (1386) + сполука формули I, ріанія (альтернативна назва) (1387) + сполука формули I, ріанодин (традиційна назва) (1387) + сполука формули I, сабадилу (альтернативна назва) (725) + сполука формули I, шрадан (1389) + сполука формули I, себуфос (альтернативна назва) + сполука формули I, селабектин (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, SI-0009 (код сполуки) + сполука формули I, SI-0205 (код сполуки) + сполука формули I, SI-0404

- (код сполуки) + сполука формули I, SI-0405 (код сполуки) + сполука формули I, силафлуофен (728) + сполука формули I, SN 72129 (науково-дослідницький код) (1397) + сполука формули I, арсеніт натрію [CCN] + сполука формули I, ціанід натрію (444) + сполука формули I, фторид натрію (назва за номенклатурою ІЮПАК/Chemical Abstracts) (1399) + сполука формули I, гексафторсилікат натрію (1400) + сполука формули I, пентахлорфеноксид натрію (623) + сполука формули I, селенат натрію (назва за номенклатурою ІЮПАК) (1401) + сполука формули I, тіоціанат натрію [CCN] + сполука формули I, софамід (1402) + сполука формули I, спінеторам [CCN] + сполука формули I, спіносад (737) + сполука формули I, спіромезифен (739) + сполука формули I, спіротетрамат [CCN] + сполука формули I, сулкофурон (746) + сполука формули I, сульфурон-натрій (746) + сполука формули I, сульфлурамід (750) + сполука формули I, сульфотеп (753) + сполука формули I, сульфоксафлор [CCN] + сполука формули I, сульфурилфторид (756) + сполука формули I, сульфпрофос (1408) + сполука формули I, смоляні олії (альтернативна назва) (758) + сполука формули I, тау-флувалінат (398) + сполука формули I, тазимкарб (1412) + сполука формули I, TDE (1414) + сполука формули I, тебуфенозид (762) + сполука формули I, тебуфенпірад (763) + сполука формули I, тебупірімфос (764) + сполука формули I, тефлубензурон (768) + сполука формули I, тефлутрин (769) + сполука формули I, темефос (770) + сполука формули I, ТЕРР (1417) + сполука формули I, тераллетрин (1418) + сполука формули I, тербам (альтернативна назва) + сполука формули I, тербуфос (773) + сполука формули I, тетрахлоретан [CCN] + сполука формули I, тетрахлорвінфос (777) + сполука формули I, тетраметрин (787) + сполука формули I, тетраметилфлутрин (гексафторсилікат барію: 84937-88-2) + сполука формули I, тета-циперметрин (204) + сполука формули I, тіаклопрід (791) + сполука формули I, тіафенокс (альтернативна назва) + сполука формули I, тіаметоксам (792) + сполука формули I, тікрофос (1428) + сполука формули I, тіокарбоксим (1431) + сполука формули I, тіоциклам (798) + сполука формули I, гідрооксалат тіоциклама (798) + сполука формули I, тіодикарб (799) + сполука формули I, тіофанокс (800) + сполука формули I, тіометон (801) + сполука формули I, тіоназин (1434) + сполука формули I, тіосултап (803) + сполука формули I, тіосултап-натрій (803) + сполука формули I, турингенсин (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, толфенпірад (809) + сполука формули I, тралометрин (812) + сполука формули I, трансфлутрин (813) + сполука формули I, трансперметрин (1440) + сполука формули I, триаміфос (1441) + сполука формули I, триазамат (818) + сполука формули I, триазофос (820) + сполука формули I, триазурон (альтернативна назва) + сполука формули I, трихлорфон (824) + сполука формули I, трихлорметафос-3 (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, трихлоронат (1452) + сполука формули I, трифенофос (1455) + сполука формули I, трифлумурон (835) + сполука формули I, триметакарб (840) + сполука формули I, трипрен (1459) + сполука формули I, вамідотіон (847) + сполука формули I, ваніліпрол [CCN] + сполука формули I, вератридин (альтернативна назва) (725) + сполука формули I, вератрин (альтернативна назва) (725) + сполука формули I, ХМС (853) + сполука формули I, ксилілкарб (854) + сполука формули I, YI-5302 (код сполуки) + сполука формули I, зета-циперметрин (205) + сполука формули I, зетаметрин (альтернативна назва) + сполука формули I, фосфід цинку (640) + сполука формули I, золапрофос (1469) і ZXI 8901 (науково-дослідницький код) (858) + сполука формули I, молюскоцид, вибраний із групи речовин, яка включає біс(трибутилолово)оксид (назва за номенклатурою ІЮПАК) (913) + сполука формули I, бромацетамід [CCN] + сполука формули I, арсенат кальцію [CCN] + сполука формули I, клоетокарб (999) + сполука формули I, ацетоарсеніт міді [CCN] + сполука формули I, сульфат міді (172) + сполука формули I, фентин (347) + сполука формули I, фосфат заліза (III) (назва за номенклатурою ІЮПАК) (352) + сполука формули I, метальдегід (518) + сполука формули I, метіокарб (530) + сполука формули I, ніклосамід (576) + сполука формули I, ніклосамід-оламін (576) + сполука формули I, пентахлорфенол (623) + сполука формули I, пентахлорфеноксид натрію (623) + сполука формули I, тазимкарб (1412) + сполука формули I, тіодикарб (799) + сполука формули I, tralorpyl [CCN] + сполука формули I, трибутилоловооксид (913) + сполука формули I, трифенморф (1454) + сполука формули I, триметакарб (840) + сполука формули I, трифенілоловоацетат (назва за номенклатурою ІЮПАК) (347) і трифенілоловогідроксид (назва за номенклатурою ІЮПАК) (347) + сполука формули I, нематоцид, вибраний із групи речовин, яка включає AKD-3088 (код сполуки) + сполука формули I, 1,2-дибром-3-хлорпропан (назва за номенклатурою ІЮПАК/Chemical Abstracts) (1045) + сполука формули I, 1,2-дихлорпропан (назва за номенклатурою ІЮПАК/Chemical Abstracts) (1062) + сполука формули I, 1,2-дихлорпропан с 1,3-дихлорпропеном (назва за номенклатурою ІЮПАК) (1063) + сполука формули I, 1,3-дихлорпропен (233) + сполука формули I, 3,4-дихлортетрагідротіофен-1,1-діоксид (назва за номенклатурою ІЮПАК/Chemical Abstracts)

- (1065) + сполука формули I, 3-(4-хлорфеніл)-5-метилпропанін (назва за номенклатурою ІЮПАК) (980) + сполука формули I, 5-метил-6-тіоксо-1,3,5-тіадіазінан-3-ілоцтову кислоту (назва за номенклатурою ІЮПАК) (1286) + сполука формули I, 6-ізопентеніламінопурин (альтернативна назва) (210) + сполука формули I, абамектин (1) + сполука формули I, ацетопрол [CCN] +
- 5 сполука формули I, аланікарб (15) + сполука формули I, альдікарб (16) + сполука формули I, альдоксикарб (863) + сполука формули I, AZ 60541 (код сполуки) + сполука формули I, бенклотіаз [CCN] + сполука формули I, беноміл (62) + сполука формули I, бутилпіридабен (альтернативна назва) + сполука формули I, кадусафос (109) + сполука формули I, карбофуран (118) + сполука формули I, дисульфід вуглецю (945) + сполука формули I, карбосульфат (119) +
- 10 сполука формули I, хлорпікрин (141) + сполука формули I, хлорпірифос (145) + сполука формули I, клоетокарб (999) + сполука формули I, цитокініні (альтернативна назва) (210) + сполука формули I, дазомет (216) + сполука формули I, DBCP (1045) + сполука формули I, DCIP (218) + сполука формули I, діамідафос (1044) + сполука формули I, дихлофентіон (1051) + сполука формули I, дикліфос (альтернативна назва) + сполука формули I, диметоат (262) +
- 15 сполука формули I, дорамактин (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, емаектин (291) + сполука формули I, емаектинбензоат (291) + сполука формули I, епріномектин (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, етопрофос (312) + сполука формули I, етилендібромід (316) + сполука формули I, фенаміфос (326) + сполука формули I, фенпірад (альтернативна назва) + сполука формули I, фенсульфотіон (1158) + сполука формули I, флуенсульфон (гексафторсилікат барію: 318290-98-1) + сполука формули I, фостіазат (408) +
- 20 сполука формули I, фостіетан (1196) + сполука формули I, фурфураль (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, GY-81 (науково-дослідницький код) (423) + сполука формули I, гетерофос [CCN] + сполука формули I, іміціафос [CCN] + сполука формули I, йодметан (назва за номенклатурою ІЮПАК) (542) + сполука формули I, ізамідофос (1230) + сполука формули I, ізазофос (1231) + сполука формули I, івермектин (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, кінетин (альтернативна назва) (210) + сполука формули I, мекарфон (1258) +
- 25 сполука формули I, метам (519) + сполука формули I, метам-калій (альтернативна назва) (519) + сполука формули I, метам-натрій (519) + сполука формули I, метилбромід (537) + сполука формули I, метилізотіоціанат (543) + сполука формули I, милбеміциноксим (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, моксидектин (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, композицію *Murothecium verrucaria* (альтернативна назва) (565) + сполука формули I, NC-184 (код сполуки) + сполука формули I, оксаміл (602) + сполука формули I, форат (636) +
- 30 сполука формули I, фосфамідон (639) + сполука формули I, фосфокарб [CCN] + сполука формули I, себуфос (альтернативна назва) + сполука формули I, селамектин (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I, спіносад (737) + сполука формули I, тербам (альтернативна назва) + сполука формули I, тербуфос (773) + сполука формули I, тетрахлортіофен (назва за номенклатурою ІЮПАК/Chemical Abstracts) (1422) + сполука формули I, тіафенокс (альтернативна назва) + сполука формули I, тіоназин (1434) + сполука формули I, триазофос (820) + сполука формули I, триазурон (альтернативна назва) + сполука формули I, ксиленоли [CCN] +
- 40 сполука формули I, YI-5302 (код сполуки) і зеатин (альтернативна назва) (210) + сполука формули I, інгібітор нітрифікації, вибраний із групи речовин, яка включає етилксантат калію [CCN] і нітрапірин (580) + сполука формули I, активатор рослин, вибраний із групи речовин, яка включає ацибензолар (6) + сполука
- 45 формули I, ацибензолар-S-метил (6) + сполука формули I, пробеназол (658) і екстракт *Reynoutria sachalinensis* (альтернативна назва) (720) + сполука формули I, родентицид, вибраний із групи речовин, яка включає 2-ізовалериліндан-1,3-діон (назва за номенклатурою ІЮПАК) (1246) + сполука формули I, 4-(хіноксалін-2-іламіно)бензолсульфонамід (назва за номенклатурою ІЮПАК) (748) + сполука формули I, альфа-хлоргідрин [CCN] + сполука
- 50 формули I, фосфід алюмінію (640) + сполука формули I, анту (880) + сполука формули I, триоксид миш'яку (882) + сполука формули I, карбонат барію (891) + сполука формули I, бістіосеми (912) + сполука формули I, бродифакум (89) + сполука формули I, бромадіолон (91) + сполука формули I, брометалін (92) + сполука формули I, ціанід кальцію (444) + сполука формули I, хлоралозу (127) + сполука формули I, хлорофацинон (140) + сполука формули I, холекальциферол (альтернативна назва) (850) + сполука формули I, кумахлор (1004) + сполука
- 55 формули I, кумафурил (1005) + сполука формули I, куматетраліл (175) + сполука формули I, кримідин (1009) + сполука формули I, дифенакум (246) + сполука формули I, дифетіалон (249) + сполука формули I, дифацінон (273) + сполука формули I, ергокальциферол (301) + сполука формули I, флокумафен (357) + сполука формули I, фторацетамід (379) + сполука формули I, флупропадин (1183) + сполука формули I, флупропадингідрохлорид (1183) + сполука формули
- 60

I, гамма-HCH (430) + сполука формули I, HCH (430) + сполука формули I, ціанід водню (444) + сполука формули I, йодметан (назва за номенклатурою ІЮПАК) (542) + сполука формули I, ліндан (430) + сполука формули I, фосфід магнію (назва за номенклатурою ІЮПАК) (640) + сполука формули I, метилбромід (537) + сполука формули I, норбормід (1318) + сполука формули I, фосацетим (1336) + сполука формули I, фосфін (назва за номенклатурою ІЮПАК) (640) + сполука формули I, фосфор [CCN] + сполука формули I, піндон (1341) + сполука формули I, арсеніт калію [CCN] + сполука формули I, піринурон (1371) + сполука формули I, сцилірозид (1390) + сполука формули I, арсеніт натрію [CCN] + сполука формули I, ціанід натрію (444) + сполука формули I, фторацетат натрію (735) + сполука формули I, стрихнін (745) + сполука формули I, сульфат талію [CCN] + сполука формули I, варфарин (851) і фосфід цинку (640) + сполука формули I,

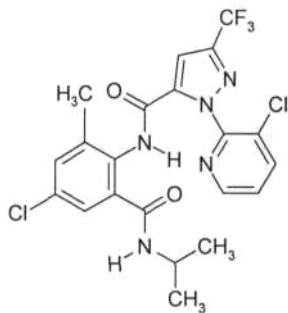
синергетик, вибраний із групи речовин, яка включає 2-(2-бутоксietокси)етилпіперонілат (назва за номенклатурою ІЮПАК) (934) + сполука формули I, 5-(1,3-бензодииоксол-5-іл)-3-гексилциклогекс-2-енон (назва за номенклатурою ІЮПАК) (903) + сполука формули I, фарнезол с неролідолом (альтернативна назва) (324) + сполука формули I, MB-599 (науково-дослідницький код) (498) + сполука формули I, MGK 264 (науково-дослідницький код) (296) + сполука формули I, піперонілбутоксид (649) + сполука формули I, піпротал (1343) + сполука формули I, ізомер пропілу (1358) + сполука формули I, S421 (науково-дослідницький код) (724) + сполука формули I, сезамекс (1393) + сполука формули I, сезасмолін (1394) і сульфоксид (1406) + сполука формули I,

репелент для тварин, вибраний із групи речовин, яка включає антрахінон (32) + сполука формули I, хлоралозу (127) + сполука формули I, нафтенат міді [CCN] + сполука формули I, оксихлорид міді (171) + сполука формули I, діазинон (227) + сполука формули I, дициклопентадієн (хімічна назва) (1069) + сполука формули I, гуазатин (422) + сполука формули I, гуазатинацетати (422) + сполука формули I, метіокарб (530) + сполука формули I, піридин-4-амін (назва за номенклатурою ІЮПАК) (23) + сполука формули I, тірам (804) + сполука формули I, триметакарб (840) + сполука формули I, нафтенат цинку [CCN] і зірам (856) + сполука формули I,

віруліцид, вибраний із групи речовин, яка включає іманін (альтернативна назва) [CCN] і рибавірин (альтернативна назва) [CCN] + сполука формули I,

протруйник ран рослин, вибраний із групи речовин, яка включає оксид ртуті (512) + сполука формули I, октилінон (590) і тіофанат-метил (802) + сполука формули I,

інсектицид, вибраний із групи, яка включає сполуки формули A-1



(A-1) + сполука формули I,

формули A-2



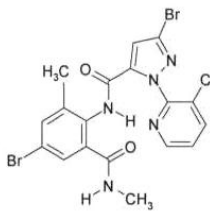
(A-2) + сполука формули I

формули A-3



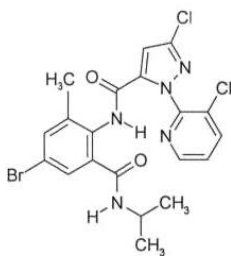
(A-3) + сполука формули I,

формули A-4



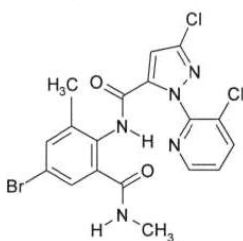
(A-4) + сполука формули I,

формули A-5



(A-5) + сполука формули I,

формули A-6



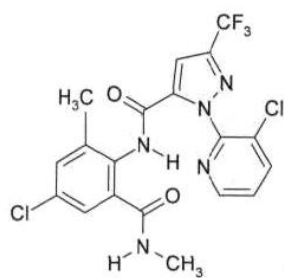
(A-6) + сполука формули I,

формули A-7



(A-7) + сполука формули I,

формули A-8



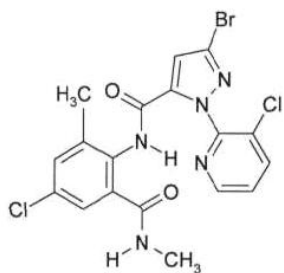
(A-8) + сполука формули I,

формули A-9



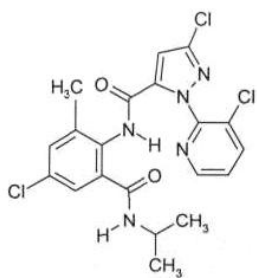
(A-9) + сполука формули I,

формули A-10



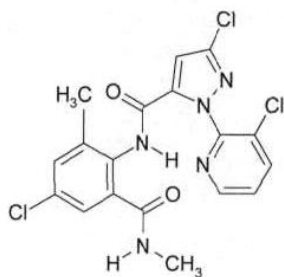
(A-10) + сполука формули I,

формули A-11



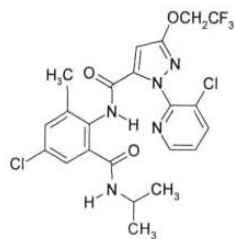
(A-11) + сполука формули I,

формули A-12



(A-12) + сполука формули I,

формули A-13



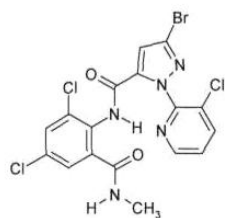
(A-13) + сполука формули I,

формули A-14



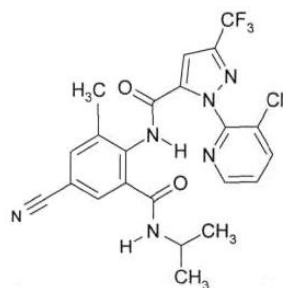
(A-14) + сполука формули I,

формули A-15



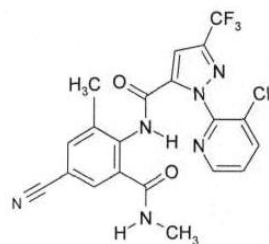
(A-15) + сполука формули I,

формули A-16



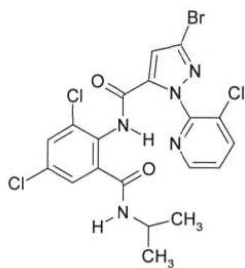
(A-16) + сполука формули I,

формули A-17



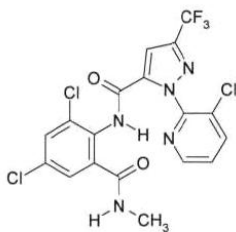
(A-17) + сполука формули I,

формули A-18



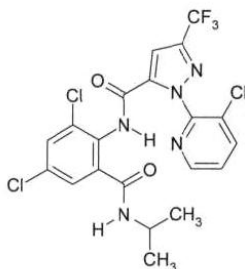
(A-18) + сполука формули I,

формули A-19



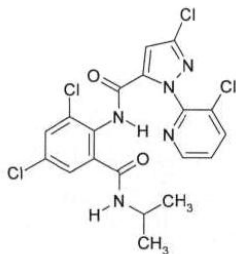
(A-19) + сполука формули I,

формули A-20



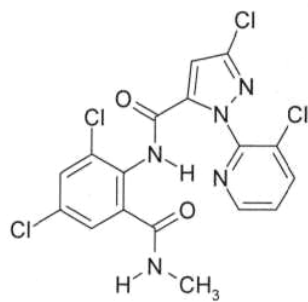
(A-20) + сполука формули I,

формули A-21

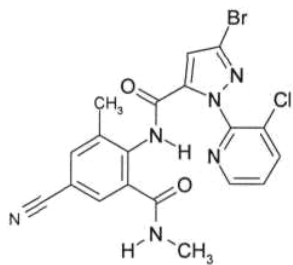


(A-21) + сполука формули I,

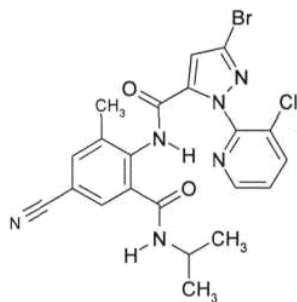
формули A-22



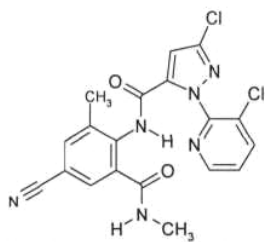
(A-22) + сполука формули I,
формули A-23



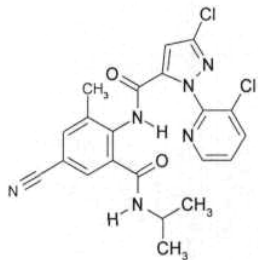
(A-23) + сполука формули I,
формули A-24



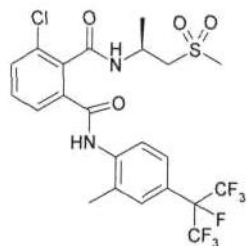
(A-24) + сполука формули I,
формули A-25



(A-25) + сполука формули I,
формули A-26



(A-26) + сполука формули I,
і формули A-27



(A-27) + сполука формули I.

Посилання у квадратних дужках після активних інгредієнтів, наприклад, [3878-19-1] означають реєстраційний номер Chemical Abstracts. Сполуки формул A-1-A-26 описані у WO 03/015518 або у WO 04/067528. Сполука формули A-27 описана у WO 06/022225 і у WO 07/112844. Зазначені вище компоненти для змішування є відомими якщо активні інгредієнти включені у публікацію "The Pesticide Manual" [The Pesticide Manual-A World Compendium; Thirteenth Edition; Editor: C D S Tomlin; The British Crop Protection Council], то вище у даному винаході вони описані із зазначенням у круглих дужках номеру позиції для конкретної сполуки; наприклад, сполука "абамектин" описана із зазначенням номеру позиції (1). якщо вище в даному винаході для конкретної сполуки зазначено "[CCN]", то розглянута сполука включена у публікацію "Compendium of Pesticide Common Names", з якою можна ознайомитися у інтернеті [A Wood; Compendium of Pesticide Common Names, Copyright© 1995-2004]; наприклад, сполука "ацетопрол" описана у інтернеті за адресою <http://www.alanwood.net/pesticides/ацетопрол.html>.

Для більшості активних інгредієнтів, описаних вище, в даному винаході приведена так звана "загальноприйнята назва", в окремих випадках використовується відповідна "загальноприйнята назва ISO" або інша "загальноприйнята назва". якщо наведена назва не є "загальноприйнятою назвою", то характеристика назви, використаної замість нього для конкретної сполуки, вказана в круглих дужках; в цьому випадку використовується назва за номенклатурою ІЮПАК, назва за номенклатурою ІЮПАК/Chemical Abstracts, "хімічна назва", "традиційна назва", "назва сполуки" або "науково-дослідницький код" або, якщо не використовується ні одна із цих назв і не використовується "загальноприйнята назва", то використовується вислів "альтернативна назва". "Реєстраційний № CAS" означає реєстраційний номер у журналі Chemical Abstracts.

Сполуки формули I, запропоновані в даному винаході, також можна застосовувати у комбінації з одним або більшою кількістю фунгіцидів. Зокрема, у зазначених нижче сумішах сполук формули I з фунгіцидами термін "сполука формули I" бажано означає сполуку, вибрану із однієї з таблиць 1-116:

сполука формули I + (E)-N-метил-2-[2-(2,5-диметилфеноксиметил)феніл]-2-метоксиіміноацетамід (SSF-129), сполука формули I + 4-бром-2-ціано-N,N-диметил-6-трифторметилбензімідазол-1-сульфонамід, сполука формули I + α-[N(3-хлор-2,6-ксиліл)-2-метоксиацетамідо]-γ-бутиролактон, сполука формули I + 4-хлор-2-ціано-N,N-диметил-5-п-толлілімідазол-1-сульфонамід (IKF-916, ціамідазосульфамід), сполука формули I + 3-5-дихлор-N-(3-хлор-1-етил-1-метил-2-оксопропіл)-4-метилбензамід (RH-7281, зоксамід), сполука формули I + N-аліл-4,5-диметил-2-триметилсилілітїофен-3-карбоксамід (MON65500), сполука формули I + N-(1-ціано-1,2-диметилпропіл)-2-(2,4-дихлорфенокси)пропіонамід (AC382042), сполука формули I + N-(2-метокси-5-піридил)циклопропан карбоксамід, сполука формули I + ацибензолар, сполука формули I + аланікарб, сполука формули I + альдиморф, сполука формули I + амісулбром,

сполука формули I + анілазин, сполука формули I + азаконазол, сполука формули I + азоксистробін, сполука формули I + беналаксіл, сполука формули I + беналаксіл-М, сполука формули I + беноміл, сполука формули I + бентіавалікарб, сполука формули I + білоксазол, сполука формули I + бітертанол, сполука формули I + біксафен, сполука формули I + бластицидин S, сполука формули I + боскалід, сполука формули I + бромуконазол, сполука формули I + бупіримат, сполука формули I + каптафол, сполука формули I + каптан, сполука формули I + карбендазим, сполука формули I + карбендазим хлоргідрат, сполука формули I + карбоксин, сполука формули I + карпропамід, карвон, сполука формули I + CGA41396, сполука формули I + CGA41397, сполука формули I + хінометионат, сполука формули I + хлазафенон, сполука формули I + хлороталоніл, сполука формули I + хлорозолінат, сполука формули I + клозілакон, сполука формули I + сполуки, які містять мідь, такі як оксихлорид міді, оксигінолят міді, сульфат міді, талат міді і бордоська рідина, сполука формули I + ціазофамід, сполука формули I + цифлуфенамід, сполука формули I + цимоксаніл, сполука формули I + ципроконазол, сполука формули I + ципродиніл, сполука формули I + дебакарб, сполука формули I + ди-2-піридилдисульфід-1,1'-діоксид, сполука формули I + дихлофлуанід, сполука

формули I + дикломезин, сполука формули I + диклоран, сполука формули I + діетофенкарб,
 сполука формули I + дифеноконазол, сполука формули I + дифензокват, сполука формули I +
 дифлуметорим, сполука формули I+O,O-діізопропіл-S-бензилтіофосфат, сполука формули I +
 5 димефлуазол, сполука формули I + диметконазол, сполука формули I + диметоморф, сполука
 формули I + диметиримол, сполука формули I + димоксистробін, сполука формули I +
 диніконазол, сполука формули I + дінокап, сполука формули I + дитіанон, сполука формули I +
 додецил диметилхлорид амонію, сполука формули I + додеморф, сполука формули I + додин,
 сполука формули I + догуадин, сполука формули I + едифенфос, сполука формули I +
 10 епоксиконазол, сполука формули I + етиримол, сполука формули I + етил-(Z)-N-бензил-
 N([метил(метилтіоетиліденамінооксикарбоніл)аміно]тіо)-β-аланінат, сполука формули I +
 етридіазол, сполука формули I + фамоксадон, сполука формули I + фенамідон (RPA407213),
 сполука формули I + фенаримол, сполука формули I + фенбуконазол, сполука формули I +
 фенфурам, сполука формули I + фенгексамід (KBR2738), сполука формули I + феноксаніл,
 15 сполука формули I + фенпіклоніл, сполука формули I + фенпропідин, сполука формули I +
 фенпропіморф, сполука формули I + фенпіразамін/іпфенпіразолон, сполука формули I +
 фентин ацетат, сполука формули I + фентингідроксид, сполука формули I + фербам, сполука
 формули I + феримзон, сполука формули I + флуазинам, сполука формули I + флудіоксоніл,
 сполука формули I + флуметовер, сполука формули I + флуморф, сполука формули I +
 20 флуопіколід, сполука формули I + флуопірам, сполука формули I + флуоксастробін, сполука
 формули I + фторимід, сполука формули I + флукхінконазол, сполука формули I + флусилазол,
 сполука формули I + флутаніл, сполука формули I + флутоланіл, сполука формули I +
 флутриафол, сполука формули I + флуксапіроксад, сполука формули I + фолпет, сполука
 формули I + фуберидазол, сполука формули I + фуралаксил, сполука формули I + фураметпир,
 25 сполука формули I + гуазатин, сполука формули I + гексаконазол, сполука формули I +
 гідроксізоксазол, сполука формули I + гимексазол, сполука формули I + імазаліл, сполука
 формули I + імібенконазол, сполука формули I + іміноктадин, сполука формули I +
 іміноктадинтриацетат, сполука формули I + іпконазол, сполука формули I + іпробенфос, сполука
 формули I + іпродіон, сполука формули I + іпровалікарб (SZX0722), сполука формули I +
 30 ізопропанілбутилкарбамат, сполука формули I + ізопротіолан, сполука формули I + ізопіразам,
 сполука формули I + ізотіаніл, сполука формули I + касугаміцин, сполука формули I +
 крезоксим-метил, сполука формули I+LY186054, сполука формули I+LY211795, сполука
 формули I+LY248908, сполука формули I + манкозеб, сполука формули I + мандипропамід,
 сполука формули I + манеб, сполука формули I + мефеноксам, сполука формули I +
 35 мепаніпірим, сполука формули I + мепроніл, сполука формули I + мептилдінокап, сполука
 формули I + металаксил, сполука формули I + метконазол, сполука формули I + метирам,
 сполука формули I + метирам-цинк, сполука формули I + метоміностробін, сполука формули I +
 метрафенон, сполука формули I + миклобутаніл, сполука формули I + неоасозин, сполука
 формули I + диметилдитіокарбамат нікелю, сполука формули I + нікобіфен, сполука формули I +
 40 нітротал-ізопропіл, сполука формули I + нуаримол, сполука формули I + офурац, сполука
 формули I + ртутьорганічні сполуки, сполука формули I + орисастробін, сполука формули I +
 оксациклі, сполука формули I + оксасульфурон, сполука формули I + оксолінова кислота,
 сполука формули I + окспоконазол, сполука формули I + оксикарбоксин, сполука формули I +
 перфуразоат, сполука формули I + пенконазол, сполука формули I + пенцикурон, сполука
 формули I + пентіопірад, сполука формули I + феназиноксид, сполука формули I + фосетил-Al,
 45 сполука формули I + фосфорвмісні кислоти, сполука формули I + фталід, сполука формули I +
 пікоксистробін (ZA1963), сполука формули I + поліоксин D, сполука формули I + полірам,
 сполука формули I + пробеназол, сполука формули I + прохлораз, сполука формули I +
 процимідон, сполука формули I + пропамокарб, сполука формули I + пропіконазол, сполука
 формули I + пропінеб, сполука формули I + пропіонова кислота, сполука формули I +
 50 проквіназид, сполука формули I + протіоконазол, сполука формули I + піраклостробін, сполука
 формули I + піразофос, сполука формули I + пірібенкарб, сполука формули I + піріфенокс,
 сполука формули I + піриметаніл, сполука формули I + пірохилон, сполука формули I +
 піроксифур, сполука формули I + піролнітрин, сполука формули I + четвертинні амонієві
 сполуки, сполука формули I + хінометіонат, сполука формули I + хіноксифен, сполука формули I +
 55 квінтоцен, сполука формули I + седаксан, сполука формули I + сипконазол (F-155), сполука
 формули I + пентахлорфенат натрію, сполука формули I + спіроксамін, сполука формули I +
 стрептоміцин, сполука формули I + сірка, сполука формули I + тебуконазол, сполука формули I +
 теклофталам, сполука формули I + текназен, сполука формули I + тетраконазол, сполука
 формули I + тіабендазол, сполука формули I + тифлузамід, сполука формули I +
 60 I+2(тіюціанометилтію)бензотіазол, сполука формули I + тіофанат-метил, сполука формули I +

тірам, сполука формули I + тіадиніл, сполука формули I + тимибенконазол, сполука формули I + толклофос-метил, сполука формули I + толілфлуанід, сполука формули I + триадимефон, сполука формули I + триадименол, сполука формули I + триазбутил, сполука формули I + триазоксид, сполука формули I + трициклазол, сполука формули I + тридеморф, сполука формули I + трифлуксиробин, сполука формули I + трифорин, сполука формули I + трифлумізол, сполука формули I + тритиконазол, сполука формули I + валідаміцин А, сполука формули I + валіфенал, сполука формули I + вапам, сполука формули I + вінклозолін, сполука формули I + зінеб і сполука формули I + зірам.

Сполуки формули I можна змішувати з ґрунтом, торфом або іншими середовищами для укорінення з метою захисту рослин від таких, що розповсюджуються насінням, або таких, що передаються через ґрунт, листових грибкових хвороб.

Сполуки формули I, запропоновані в даному винаході, також можна застосовувати у комбінації з одним або більшою кількістю інших синергістів Зокрема, важливими є зазначені нижче суміші сполуки формули I, де цей термін бажано означає сполуку, вибрану із однієї з таблиць 1-116:

сполука формули I + піперонілбутоксид, сполука формули I + сезамекс, сполука формули I + сафроксан і сполука формули I + додецилімідазол.

Сполуки формули I, запропоновані в даному винаході, також можна застосовувати у комбінації з одним або більшою кількістю гербіцидів Зокрема, важливими є зазначені нижче суміші сполуки формули I, де цей термін бажано означає сполуку, вибрану із однієї з таблиць 1-116:

сполука формули I + ацетохлор, сполука формули I + ацифлюорфен, сполука формули I + ацифлюорфен-натрій, сполука формули I + аклоніфен, сполука формули I + акролеїн, сполука формули I + алахлор, сполука формули I + алоксидим, сполука формули I + аліловий спирт, сполука формули I + аметрин, сполука формули I + амікарбазон, сполука формули I + амідосульфурон, сполука формули I + аміноциклопірахлор, сполука формули I + амінопіралід, сполука формули I + амітрол, сполука формули I + сульфамат амонію, сполука формули I + анілофос, сполука формули I + асулам, сполука формули I + атратон, сполука формули I + атразин, сполука формули I + азимсульфурон, сполука формули I+BCPC, сполука формули I + бефлбутамід, сполука формули I + беназолін, сполука формули I + бенкарбазон, сполука формули I + бенфлуралін, сполука формули I + бенфуресат, сполука формули I + бенсульфурон, сполука формули I + бенсульфурон-метил, сполука формули I + бенсулід, сполука формули I + бентазон, сполука формули I + бензфендізон, сполука формули I + бензобіциклон, сполука формули I + бензофенап, сполука формули I + біциклопірон, сполука формули I + біфенокс, сполука формули I + біланафос, сполука формули I + біспірибак, сполука формули I + біспірибак-натрій, сполука формули I + буру, сполука формули I + бромацил, сполука формули I + бромобутид, сполука формули I + бромоксиніл, сполука формули I + бутахлор, сполука формули I + бутафенацил, сполука формули I + бутаміфос, сполука формули I + бутралін, сполука формули I + бутроксидим, сполука формули I + бутилат, сполука формули I + какодилова кислота, сполука формули I + хлорат кальцію, сполука формули I + кафенстрол, сполука формули I + карбетамід, сполука формули I + карфентразон, сполука формули I + карфентразон-етил, сполука формули I+CDEA, сполука формули I+CEPC, сполука формули I + хлорфлуренол, сполука формули I + хлорфлуренол-метил, сполука формули I + хлоридазон, сполука формули I + хлоримурон, сполука формули I + хлоримурон-етил, сполука формули I + хлороцтова кислота, сполука формули I + хлортолурун, сполука формули I + хлорпрофам, сполука формули I + хлорсульфурон, сполука формули I + хлортал, сполука формули I + хлортал-диметил, сполука формули I + цинідон-етил, сполука формули I + цинметилін, сполука формули I + циносульфурон, сполука формули I + цисанілід, сполука формули I + клетодим, сполука формули I + клодинафоп, сполука формули I + клодинафоп-пропаргіл, сполука формули I + кломазон, сполука формули I + кломеппроп, сполука формули I + клопіралід, сполука формули I + клорансулам, сполука формули I + клорансулам-метил, сполука формули I+СМА, сполука формули I+4-CPB, сполука формули I+CPMF, сполука формули I+4-CPР, сполука формули I+CPPC, сполука формули I + крезол, сполука формули I + кумілурун, сполука формули I + ціанамід, сполука формули I + ціаназин, сполука формули I + циклоат, сполука формули I + циклосульфамурон, сполука формули I + циклоксидим, сполука формули I + цигалофоп, сполука формули I + цигалофоп-бутил, сполука формули I+2,4-D, сполука формули I+3,4-DA, сполука формули I + даімурун, сполука формули I + далапон, сполука формули I + дазомет, сполука формули I+2,4-DB, сполука формули I+3,4-DB, сполука формули I+2,4-DEB, сполука формули I + десмедіфам, сполука формули I + дикамба, сполука формули I + дихлобеніл, сполука формули I + орто-дихлорбензол, сполука формули I + пара-дихлорбензол,

- сполука формули I + дихлорпроп, сполука формули I + дихлорпроп-Р, сполука формули I + диклофоп, сполука формули I + диклофоп-метил, сполука формули I + диклосулам, сполука формули I + дифензокват, сполука формули I + дифензокват-метилсульфат, сполука формули I + дифлуфенікан, сполука формули I + дифлubenзопір, сполука формули I + димефурон, сполука формули I + димепіперат, сполука формули I + диметаклор, сполука формули I + диметаметрин, сполука формули I + диметенамід, сполука формули I + диметенамід-Р, сполука формули I + диметипін, сполука формули I + диметиларсинова кислота, сполука формули I + динітрамін, сполука формули I + динотерб, сполука формули I + дифенамід, сполука формули I + дикват, сполука формули I + дикват дибромід, сполука формули I + дитіопір, сполука формули I + діурон, сполука формули I+DNOC, сполука формули I+3,4-DP, сполука формули I+DSMA, сполука формули I+EBEP, сполука формули I + ендотал, сполука формули I+EPTC, сполука формули I + еспрокарб, сполука формули I + еталфлуралін, сполука формули I + етаметсульфурон, сполука формули I + етаметсульфурон-метил, сполука формули I + етофумезат, сполука формули I + етоксифен, сполука формули I + етоксисульфурон, сполука формули I + етобензанід, сполука формули I + феноксапроп-Р, сполука формули I + феноксапроп-Р-етил, сполука формули I + фентразамід, сполука формули I + сульфат заліза(II), сполука формули I + флампроп-М, сполука формули I + флазасульфурон, сполука формули I + флорасулам, сполука формули I + флуазифоп, сполука формули I + флуазифоп-бутил, сполука формули I + флуазифоп-Р, сполука формули I + флуазифоп-Р-бутил, сполука формули I + флукарбазон, сполука формули I + флукарбазон-натрій, сполука формули I + флуцетосульфурон, сполука формули I + флухлоралін, сполука формули I + флуфенацет, сполука формули I + флуфенпір, сполука формули I + флуфенпір-етил, сполука формули I + флуметсулам, сполука формули I + флуміклорак, сполука формули I + флуміклорак-пентил, сполука формули I + флуміоксазин, сполука формули I + флуометурон, сполука формули I + фторогликофен, сполука формули I + фторогликофен-етил, сполука формули I + флупропанат, сполука формули I + флупірсульфурон, сполука формули I + флупірсульфурон-метилнатрій, сполука формули I + флуренол, сполука формули I + флуридон, сполука формули I + флуорохлоридон, сполука формули I + флуороксіпір, сполука формули I + флуртамон, сполука формули I + флутіацет, сполука формули I + флутіацет-метил, сполука формули I + фомесафен, сполука формули I + форамсульфурон, сполука формули I + фосамін, сполука формули I + глуфосинат, сполука формули I + глуфосинат-амоній, сполука формули I + глуфосинат-Р, сполука формули I + гліфосат, сполука формули I + гліфосат-тримезій, сполука формули I + галосульфурон, сполука формули I + галосульфурон-метил, сполука формули I + галоксифоп, сполука формули I + галоксифоп-Р, сполука формули I+HC-252, сполука формули I + гексазіон, сполука формули I + імазаметабенз, сполука формули I + імазаметабенз-метил, сполука формули I + імазамокс, сполука формули I + імазапек, сполука формули I + імазапір, сполука формули I + імазахін, сполука формули I + імазетапір, сполука формули I + імазосульфурон, сполука формули I + інданофан, сполука формули I + індазифлам, сполука формули I + йодметан, сполука формули I + йодосульфурон, сполука формули I + йодосульфурон-метилнатрій, сполука формули I + іоксиніл, сполука формули I + іпфенкарбазон, сполука формули I + ізопротурон, сполука формули I + ізоурон, сполука формули I + ізоксабен, сполука формули I + ізоксахлортол, сполука формули I + ізоксафлутол, сполука формули I + карбутилат, сполука формули I + лактофен, сполука формули I + ленацил, сполука формули I + лінурон, сполука формули I+MAA, сполука формули I+MAMA, сполука формули I+MCPA, сполука формули I+MCPA-тіетил, сполука формули I+MCPB, сполука формули I + мекопроп, сполука формули I + мекопроп-Р, сполука формули I + мефенацет, сполука формули I + мефлуїдид, сполука формули I + мезосульфурон, сполука формули I + мезосульфурон-метил, сполука формули I + мезотріон, сполука формули I + метам, сполука формули I + метаміфоп, сполука формули I + метамітрон, сполука формули I + метазахлор, сполука формули I + метабензтіазурон, сполука формули I + метиларсонова кислота, сполука формули I + метилдимрон, сполука формули I + метилізотіоціанат, сполука формули I + метобензурон, сполука формули I + метолахлор, сполука формули I+S-метолахлор, сполука формули I + метосулам, сполука формули I + метоксурон, сполука формули I + метрибузин, сполука формули I + метсульфурон, сполука формули I + метсульфурон-метил, сполука формули I+МК-616, сполука формули I + молінат, сполука формули I + монолінурон, сполука формули I+MSMA, сполука формули I + напроанілід, сполука формули I + напропамід, сполука формули I + напталам, сполука формули I + небурон, сполука формули I + нікосульфурон, сполука формули I + нонанова кислота, сполука формули I + норфлуразон, сполука формули I + олеїнова кислота (жирні кислоти), сполука формули I + орбенкарб, сполука формули I + ортосульфамурон, сполука формули I + оризалін, сполука формули I + оксациаргіл, сполука

формули I + оксадіазон, сполука формули I + оксасульфурон, сполука формули I + оксазикломефон, сполука формули I + оксифлуорфен, сполука формули I + паракват, сполука формули I + паракват дихлорид, сполука формули I + пебулат, сполука формули I + пендиметалін, сполука формули I + феноксулам, сполука формули I + пентахлорфенол, 5 сполука формули I + пентанохлор, сполука формули I + пентоксазон, сполука формули I + пентоксамід, сполука формули I + нафтові олії, сполука формули I + фенмедифам, сполука формули I + фенмедифам-етил, сполука формули I + піклорам, сполука формули I + піколінафен, сполука формули I + піноксаден, сполука формули I + піперофос, сполука формули I + арсеніт калію, сполука формули I + азид калію, сполука формули I + претилахлор, 10 сполука формули I + примісульфурон, сполука формули I + примісульфурон-метил, сполука формули I + продіамін, сполука формули I + профлуазол, сполука формули I + профоксидим, сполука формули I + прометон, сполука формули I + прометрин, сполука формули I + пропахлор, сполука формули I + пропаніл, сполука формули I + пропахізафоп, сполука формули I + пропазин, сполука формули I + профам, сполука формули I + пропізохлор, сполука формули I + пропоксикарбазон, сполука формули I + пропоксикарбазон-натрій, сполука формули I + пропірісульфурон, сполука формули I + пропізамід, сполука формули I + просульфокарб, 15 сполука формули I + просульфурон, сполука формули I + піраклоніл, сполука формули I + пірафлуфен, сполука формули I + пірафлуфен-етил, сполука формули I + пірасульфутол, сполука формули I + піразолінат, сполука формули I + піразосульфурон, сполука формули I + піразосульфурон-етил, сполука формули I + піразоксифен, сполука формули I + пірибензоксим, 20 сполука формули I + пірибутикарб, сполука формули I + піридафол, сполука формули I + піридат, сполука формули I + пірифталід, сполука формули I + піримінобак, сполука формули I + піримінобак-метил, сполука формули I + піримісульфан, сполука формули I + піритіобак, сполука формули I + піритіобак-натрій, сполука формули I + піроксулам, сполука формули I + піроксасульфон, сполука формули I + хінклорак, сполука формули I + хінмерак, сполука формули I + хінокламін, сполука формули I + хізалофоп, сполука формули I + хізалофоп-Р, 25 сполука формули I + римсульфурон, сполука формули I + сафлуфенацил, сполука формули I + сетоксидим, сполука формули I + сидурон, сполука формули I + сімазин, сполука формули I + симетрин, сполука формули I + SMA, сполука формули I + арсеніт натрію, сполука формули I + азид натрію, сполука формули I + хлорат натрію, сполука формули I + сулкотрион, сполука формули I + сульфентразон, сполука формули I + сульфометурон, сполука формули I + сульфометурон-метил, сполука формули I + сульфосат, сполука формули I + сульфосульфурон, сполука формули I + сірчана кислота, сполука формули I + смоляні олії, 30 сполука формули I + 2,3,6-TBA, сполука формули I + TCA, сполука формули I + TCA-натрій, сполука формули I + тебутіурон, сполука формули I + тефурилтріон, сполука формули I + темботріон, сполука формули I + тепралоксидим, сполука формули I + тербацил, сполука формули I + тербуметон, сполука формули I + тербутилазин, сполука формули I + тербутрин, сполука формули I + тенілхлор, сполука формули I + тіазопір, сполука формули I + тіенкарбазон, сполука формули I + тифенсульфурон, сполука формули I + тифенсульфурон-метил, сполука формули I + тіобенкарб, сполука формули I + тіокарбазил, сполука формули I + топрамезон, 40 сполука формули I + тралкоксидим, сполука формули I + три-алат, сполука формули I + триасульфурон, сполука формули I + триазіфлам, сполука формули I + трибенурон, сполука формули I + трибенурон-метил, сполука формули I + трикамба, сполука формули I + триклопір, сполука формули I + триетазин, сполука формули I + трифлуксисульфурон, сполука формули I + трифлуралін, сполука формули I + трифлусульфурон, сполука формули I + трифлусульфурон-метил, сполука формули I + тригідрокситриазин, сполука формули I + тритосульфурон, сполука формули I + етиловий ефір [3-[2-хлор-4-фтор-5-(1-метил-6-трифторметил-2,4-діоксо-1,2,3,4-тетрагідропіримідин-3-іл)фенокси]-2-піридилокси]оцтової кислоти (реєстраційний № CAS 353292-31-6), сполука формули I + 4-[(4,5-дигідро-3-метокси-4-метил-5-оксо)-1H-1,2,4-триазол-1-ілкарбонілсульфамойл]-5-метилтиофен-3-карбонова кислота (BAY636), сполука формули I + BAY747 (реєстраційний № CAS 335104-84-2), сполука формули I + топрамезон (реєстраційний № CAS 210631-68-8), 45 сполука формули I + 4-гідрокси-3-[[2-[(2-метоксиетокси)метил]-6-(трифторметил)-3-піридиніл]карбоніл]-біцикло[3.2.1]окт-3-ен-2-он (реєстраційний № CAS 352010-68-5) і сполука формули I + 4-гідрокси-3-[[2-(3-метоксипропіл)-6-(дифторметил)-3-піридиніл]карбоніл]-біцикло[3.2.1]окт-3-ен-2-он.

Сполуки формули (I), запропоновані в даному винаході, також можна застосовувати у комбінації з антидотами. Бажано, якщо в цих сумішах сполука формули (I) є однією із сполук, 60 приведених вище у таблицях 1-116. Приведені нижче суміші, які містять антидоти, є особливо важливими:

сполука формули (I) + клохінтоцет-мексил, сполука формули (I) + клохінтоцетова кислота і її солі, сполука формули (I) + фенхлоразол-етил, сполука формули (I) + фенхлоразолова кислота і її солі, сполука формули (I) + мефенпір-діетил, сполука формули (I) + мефенпіру дикислота, сполука формули (I) + ізоксадифен-етил, сполука формули (I) + ізоксадифенова кислота, сполука формули (I) + фурилазол, сполука формули (I) + R-ізомер фурилазолу, сполука формули (I) + беноксакор, сполука формули (I) + дихлормід, сполука формули (I) + AD-67, сполука формули (I) + оксабетриніл, сполука формули (I) + ціометриніл, сполука формули (I) + Z-ізомер ціометринілу, сполука формули (I) + фенклорим, сполука формули (I) + ципросульфамід, сполука формули (I) + нафтойний ангідрид, сполука формули (I) + флуразол, сполука формули (I) + N-(2-метоксибензоіл)-4-[(метиламінокарбоніл)аміно]бензолсульфонамід, сполука формули (I) + CL 304,415, сполука формули (I) + дициклонон, сполука формули (I) + флуксофенім, сполука формули (I) + DKA-24, сполука формули (I) + R-29148 і сполука формули (I) + PPG-1292 Антидотний ефект також можна виявити для сумішей сполуки формули (I) + димрон, сполуки формули (I) + МСРА, сполуки формули (I) + мекопроп і сполуки формули (I) + мекопроп-Р.

Компоненти для змішування зі сполукою формули I також можуть перебувати у формі складних ефірів або солей, як це зазначено, наприклад, у публікації The Pesticide Manual, 12th Edition (BCPC), 2000.

У приведених вище різних переліках активних інгредієнтів, які змішуються зі сполукою формули I, сполука формули I бажано є сполукою, приведеною в таблицях 1-116; і більш бажано сполукою, вибраною з групи, яка включає T1.011, T1.016, T1.023, T1.026, T1.030, T1.042, T1.047, T1.049, T1.050, T1.066, T1.067, T1.068, T1.069, T1.070, T1.071, T1.072, T1.104, T1.116, T1.117, T1.118, T1.120, T1.121, T1.125, T1.130, T1.131, де G може означати водень, C(O)OEt або C(O)OiPr, або сполукою, вибраною із групи, яка включає T19.011, T19.016, T19.023, T19.026, T19.030, T19.042, T19.047, T19.049, T19.050, T19.066, T19.067, T19.068, T19.069, T19.070, T19.071, T19.072, T19.104, T19.116, T19.117, T19.118, T19.120, T19.121, T19.125, T19.130, T19.131, де G може означати водень, C(O)OEt або C(O)OiPr; або сполукою, вибраною із групи, яка включає T21.011, T21.016, T21.023, T21.026, T21.030, T21.042, T21.047, T21.049, T21.050, T21.066, T21.067, T21.068, T21.069, T21.070, T21.071, T21.072, T21.104, T21.116, T21.117, T21.118, T21.120, T21.121, T21.125, T21.130, T21.131, де G може означати водень, C(O)OEt або C(O)OiPr; або сполукою, вибраною із групи, яка включає T22.011, T22.016, T22.023, T22.026, T22.030, T22.042, T22.047, T22.049, T22.050, T22.066, T22.067, T22.068, T22.069, T22.070, T22.071, T22.072, T22.104, T22.116, T22.117, T22.118, T22.120, T22.121, T22.125, T22.130, T22.131, де G може означати водень, C(O)OEt або C(O)OiPr; або сполукою, вибраною із групи, яка включає T23.011, T23.016, T23.023, T23.026, T23.030, T23.042, T23.047, T23.049, T23.050, T23.066, T23.067, T23.068, T23.069, T23.070, T23.071, T23.072, T23.104, T23.116, T23.117, T23.118, T23.120, T23.121, T23.125, T23.130, T23.131, де G може означати водень, C(O)OEt або C(O)OiPr;

і ще більш бажано, сполукою, приведеною у таблицях P1-P5.

У зазначених вище сумішах сполук формули I, бажано сполуки, вибраної із зазначених таблиць 1-116, з іншими інсектицидами, фунгіцидами, гербіцидами, антидотами, допоміжними речовинами і т.п. співвідношення змішування можуть змінюватися у широкому діапазоні і становлять бажано від 100:1 до 1:6000, особливо бажано від 50:1 до 1:50, ще більш бажано від 20:1 до 1:20, ще більш бажано від 10:1 до 1:10. Слід розуміти, що ці співвідношення включають, з однієї сторони, масові співвідношення, а з іншої сторони, молярні співвідношення.

Суміші з успіхом можна використовувати у зазначених вище препаратах (в цьому випадку "активний інгредієнт" належить до відповідної суміші сполуки формули I з компонентом для змішування).

Деякі суміші можуть включати активні інгредієнти, які мають істотно інші фізичні, хімічні або біологічні характеристики, так що самі по собі вони нелегко включаються в такий же звичайний тип препарату. У таких випадках можна отримати інші види препаратів. Наприклад, якщо один активний інгредієнт являє собою нерозчинну в воді тверду речовину, а інший - нерозчинну у воді рідину, все ж можна диспергувати кожен активний інгредієнт в одній і тій же безперервній водній фазі шляхом диспергування твердого активного інгредієнта у вигляді суспензії (з використанням методики, аналогічної тій, яка застосовується для одержання СК), але диспергування рідкого активного інгредієнта у вигляді емульсії (з використанням методики, аналогічної тій, яка застосовується для одержання ЕМ). Отримана композиція являє собою препарат суспензія-емульсія (СЕ).

Суміші, що включають сполуку формули I, вибрану з таблиць 1-116, і один або більшу кількість активних інгредієнтів, описаних вище, можна використовувати, наприклад, у вигляді

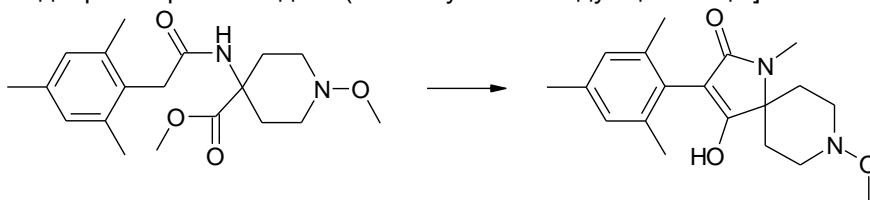
однієї готової до застосування суміші, у вигляді комбінованої суміші для обприскування, складеної з окремих препаративних форм активних інгредієнтів поодиноці, такий як бакова суміш, і належить до комбінованого застосування активних інгредієнтів поодиноці при їх нанесенні послідовно, тобто одного за іншим через досить нетривалий проміжок часу, такий що становить кілька годин або днів. При практичному здійсненні цього винаходу порядок внесення сполук формули I, вибраних з таблиць 1-116, і активних інгредієнтів, описаних вище, не є істотним.

Даний винахід ілюструється приведеними нижче прикладами одержання сполук. Дані Н-ЯМР деяких сполук, які пропонуються в даному винаході, показують розширення ліній при кімнатній температурі, що вказує на існування численних конформаційних ізомерів внаслідок, наприклад, кето-енольної таутомерії, загальмованого обертання, інверсії кільця в піперидиновому фрагменті і інверсії азоту в центрі N-OR піперидинілі. Широки сигнали позначені, як "br".

ПРИКЛАД 1: Одержання етилового ефіру, 8-метокси-1-метил-2-оксо-3-(2,4,6-триметилфеніл)-1,8-діазаспіро[4.5]дец-3-ен-4-ілового ефіру карбонової кислоти (сполука P1.2)

Стадія 1: Одержання 4-гідрокси-8-метокси-1-метил-3-(2,4,6-триметилфеніл)-1,8-діазаспіро[4.5]дец-3-ен-2-ону (сполука P2.2)

[двостадійна однореакторна методика (N-алкілювання амідів і циклізація)]

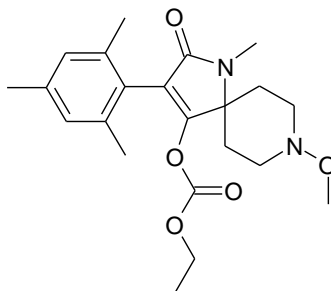


До розчину метилового ефіру 1-метокси-4-[2-(2,4,6-триметилфеніл)-ацетиламіно]-піперидин-4-карбонової кислоти [одержували відповідно до WO09/049851] (850 мг, 2,44 ммоль) у диметилформаміді (20 мл) при 0 °C двома порціями додавали гідрид натрію (122 мг, 55 % мас./мас дисперсія в мінеральній олії, 2,81 ммоль). Реакційну суміш перемішували при 0 °C протягом 1 г, по краплям обробляли метилйодидом (0,175 мл, 398 мг, 2,81 ммоль) і потім перемішували при 0 °C протягом 1 г і при кімнатній температурі протягом 3 г. До суміші, повторно охолодженої до 0 °C, однією порцією додавали метоксид натрію (198 мг, 3,66 ммоль) і перемішування продовжували при кімнатній температурі протягом 2 г, при 40 °C протягом 30 хв і після повторного додавання метоксиду натрію (~20 мг) перемішування продовжували при 50 °C протягом 45 хв. Реакційну суміш виливали у водний розчин хлориду амонію з льодом, підкисляли до pH 5-6 водним розчином HCl і ретельно екстрагували етилацетатом. Об'єднані органічні шари промивали розсолон, сушили над сульфатом натрію і концентрували. Неочищений олієподібний очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (етилацетат) і потім розтирали з холодним діетиловим ефіром, фільтрували і сушили. Вихід: 338 мг 4-гідрокси-8-метокси-1-метил-3-(2,4,6-триметилфеніл)-1,8-діазаспіро[4.5]дец-3-ен-2-ону (сполука P2.2) у вигляді твердої речовини, Т пл (температура плавлення) 241-243 °C.

¹H-ЯМР (CD₃OD): 1,44 (br m, 1H), 1,72 (br m, 1H), 2,10 (s, 6H), 2,25 (s, 3H), 2,33 (br m, 1H), 2,48 (br m, 1H), 2,89 (широкий сигнал, 3H), 3,20 (br m, 1H), 3,27-3,43 (широкі сигнали, всього 3H), 3,54 (s, 3H), 6,89 (s, 2H).

PX/МС (рідинна хроматографія/мас-спектрометрія) (ЕР (електророзпилення)+): 331 (M+H)⁺, PX/МС (ЕР-): 329 (M-H)⁻

Стадія 2: Одержання етилового ефіру, 8-метокси-1-метил-2-оксо-3-(2,4,6-триметилфеніл)-1,8-діазаспіро[4.5]дец-3-ен-4-ілового ефіру карбонової кислоти (шукана сполука P1.2)



До розчину 4-гідрокси-8-метокси-1-метил-3-(2,4,6-триметилфеніл)-1,8-діазаспіро[4.5]дец-3-ен-2-ону (238 мг, 0,72 ммоль), триетиламіну (0,15 мл, 109 мг, 1,08 ммоль) і 4-

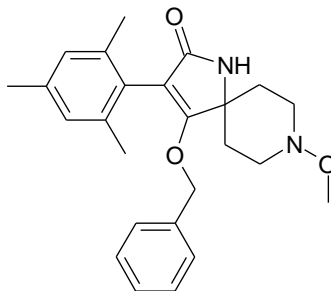
диметиламінопіридин (2 мг) в тетрагідрофурані (10 мл) при 0 °С по краплям додавали етилхлорформіат (0,075 мл, 85 мг, 0,79 ммоль). Суспензію перемішували при 0 °С протягом 1 г Реакційну суміш розбавляли етилацетатом і водою, шари розділяли, водну фазу екстрагували етилацетатом, об'єднані органічні фази промивали розсоллом, сушили над сульфатом натрію і концентрували. Залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (етилацетат/гептан 5:1). Вихід: 145 мг етилового ефіру, 8-метокси-1-метил-2-оксо-3-(2,4,6-триметилфеніл)-1,8-діазаспіро[4.5]дец-3-ен-4-ілового ефіру карбонової кислоти (шукана сполука Р1.2) у вигляді білої твердої речовини, Т пл 134-136 °С.

¹H-ЯМР (CDCl₃): 1,05 (t, 3H), 1,59 (br m, 1H), 1,83 (br m, 1H), 2,15 (s, 6H), 2,25 (s, 3H), 2,36 (br m, 2H), 2,88 (br m, 1H), 2,95 (br s, 3H), 3,22 (br m, 1H), 3,38 (m, 2H), 3,55 (s, 3H), 3,98 (q, 2H), 6,84 (s, 2H).

РХ/МС (ЕР⁺): 403 (М+Н)⁺

ПРИКЛАД 2: Одержання 4-гідрокси-8-метокси-1-метил-3-(2,4,6-триметилфеніл)-1,8-діазаспіро[4.5]дец-3-ен-2-ону (сполука Р2.2)

Стадія 1: Одержання 4-бензилокси-8-метокси-3-(2,4,6-триметилфеніл)-1,8-діазаспіро[4.5]дец-3-ен-2-ону (сполука Р3.4)

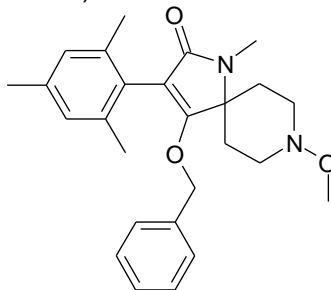


До суспензії 4-гідрокси-8-метокси-3-(2,4,6-триметилфеніл)-1,8-діазаспіро[4.5]дец-3-ен-2-ону [одержували відповідно до WO09/049851] (67,0 г, 211,7 ммоль) в ацетоні (900 мл) додавали карбонат калію (35,1 г, 254,1 ммоль), потім по краплям додавали бензилбромід (35,3 мл, 50,7 г, 296,4 ммоль). Суспензію перемішували при кип'ятінні зі зворотним холодильником протягом 1 г, потім виливали у воду з льодом і етилацетат. Отриманий осад відфільтровували, розчиняли у метиленхлориді, сушили над сульфатом натрію, концентрували і сушили над пентаоксидом фосфору у вакуумі при 50 °С протягом ночі і одержували першу порцію продукту у вигляді білої твердої речовини (55,8 г). Шари маткового розчину розділяли, водну фазу екстрагували етилацетатом, об'єднані органічні фази промивали розсоллом, сушили над сульфатом натрію і концентрували. Залишок суспендували в діетиловому ефірі, фільтрували і сушили і одержували ще 22,6 г продукту. Вихід: 78,4 г 4-бензилокси-8-метокси-3-(2,4,6-триметилфеніл)-1,8-діазаспіро[4.5]дец-3-ен-2-ону (сполука Р3.4) у вигляді твердої речовини, Т пл 184-186 °С.

¹H-ЯМР (CDCl₃): 1,66 (m, 2H), 2,11 (s, 6H), 2,28 (s, 3H), 2,33 (m, 2H), 2,47 (m, 2H), 3,45 (m, 2H), 3,55 (s, 3H), 4,68 (s, 2H), 6,13 (br s, 1H), 6,87 (s, 2H), 7,04 (m, 2H), 7,28 (m, 3H).

РХ/МС (ЕР⁺): 407 (М+Н)⁺

Стадія 2: Одержання 4-бензилокси-8-метокси-1-метил-3-(2,4,6-триметилфеніл)-1,8-діазаспіро[4.5]дец-3-ен-2-ону (сполука Р3.5)



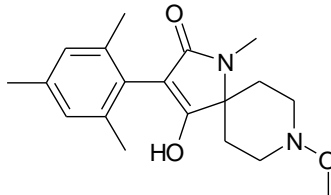
До розчину 4-бензилокси-8-метокси-3-(2,4,6-триметилфеніл)-1,8-діазаспіро[4.5]дец-3-ен-2-ону (40,0 г, 98,4 ммоль) у тетрагідрофурані (500 мл) при 0 °С протягом 1 г по краплям додавали 1,0 М розчин біс(триметилсиліл)аміду літію в тетрагідрофурані (108,3 мл, 108,3 ммоль). Суміш перемішували при 0 °С протягом 30 хв і при кімнатній температурі протягом 30 хв, потім при 0 °С протягом 10 хв по краплям обробляли метилйодидом (6,75 мл, 15,4 г, 108,2 ммоль). Перемішування продовжували при кімнатній температурі протягом ночі і реакцію зупиняли холодним насиченим водним розчином хлориду амонію. Шари розділяли, водну фазу екстрагували двічі етилацетатом, об'єднані органічні фази промивали розсоллом, сушили над

сульфатом натрію і концентрували. Залишок суспендували в діетиловому ефірі, перемішували протягом 30 хв, фільтрували і сушили. Вихід: 28,6 г 4-бензилокси-8-метокси-1-метил-3-(2,4,6-триметилфеніл)-1,8-діазаспіро[4.5]дец-3-ен-2-ону (сполука Р3.5) у вигляді твердої речовини, Т пл 139-141 °С.

¹H-ЯМР (CDCl₃): 1,52 (br m, 1H), 1,74 (br m, 1H), 2,11 (br s, 6H), 2,28 (s, 3H), 2,34 (br m, 2H), 2,92 (широкий сигнал, 3H), 3,12 (br m, 1H), 3,30 (m, 3H), 3,52 (s, 3H), 4,67 (широкий сигнал, 2H), 6,85 (s, 2H), 7,04 (m, 2H), 7,28 (m, 3H).

PX/МС (E⁺): 421 (M+H)⁺

Стадія 3: Одержання 4-гідрокси-8-метокси-1-метил-3-(2,4,6-триметилфеніл)-1,8-діазаспіро[4.5]дец-3-ен-2-ону (шукана сполука Р2.2)

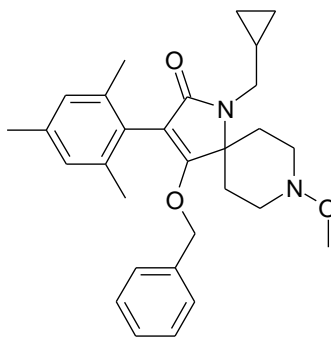


У апараті для гідрування типу Парра із струшуючим пристроєм до розчину 4-бензилокси-8-метокси-1-метил-3-(2,4,6-триметилфеніл)-1,8-діазаспіро[4.5]дец-3-ен-2-ону (22,6 г, 53,7 ммоль) в метанолі (226 мл) і воді (22,6 мл) додавали 5 % Pd/C (22,6 г). Після гідрування при тиску H₂, що дорівнює 4 бар, при 36 °С протягом 22 г реакційну суміш фільтрували і концентрували. Залишок розбавляли етилацетатом і екстрагували при охолодженні льодом насиченим водним розчином карбонату натрію. Органічний шар відкидали, водну лужну фазу при охолодженні підкисляли до pH 5-6 водним розчином HCl і ретельно екстрагували етилацетатом. Об'єднані органічні шари промивали розсолон, сушили над сульфатом натрію і концентрували. Вихід: 13,0 г 4-гідрокси-8-метокси-1-метил-3-(2,4,6-триметилфеніл)-1,8-діазаспіро[4.5]дец-3-ен-2-ону (шукана сполука Р2.2) у вигляді твердої речовини, Т пл 239-241 °С.

Спектральні характеристики являлись такими ж, як описані вище в методиці одержання сполуки прикладу 1, стадія 1

ПРИКЛАД 3: Одержання 1-циклопропілметил-4-гідрокси-8-метокси-3-(2,4,6-триметилфеніл)-1,8-діазаспіро[4.5]дец-3-ен-2-ону (сполука Р2.8)

Стадія 1: Одержання 4-бензилокси-1-циклопропілметил-8-метокси-3-(2,4,6-триметилфеніл)-1,8-діазаспіро[4.5]дец-3-ен-2-ону (сполука Р3.8)

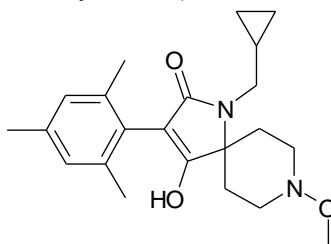


До розчину 4-бензилокси-8-метокси-3-(2,4,6-триметилфеніл)-1,8-діазаспіро[4.5]дец-3-ен-2-ону (сполука Р3.4) (1,0 г, 2,46 ммоль) в діоксані (40 мл) додавали бромметилциклопропан (1,257 мл, 1,78 г, 13,16 ммоль) і трет-бутоксид калію (1,50 г, 13,37 ммоль). Реакційну суміш перемішували при 100 °С протягом 5 днів, потім виливали у воду і екстрагували етилацетатом. Об'єднані органічні фази промивали розсолон, сушили над сульфатом натрію і концентрували. Залишок суспендували у суміші етилацетаті/гептан складу 1:5, перемішували протягом ночі, фільтрували і сушили і одержували першу порцію продукту у вигляді білої твердої речовини (350 мг). Матковий розчин концентрували і залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (дихлорметан/ацетон 10:1) і одержували ще 205 мг продукту. Вихід: 555 мг 4-бензилокси-1-циклопропілметил-8-метокси-3-(2,4,6-триметилфеніл)-1,8-діазаспіро[4.5]дец-3-ен-2-ону (сполука Р3.8) у вигляді твердої речовини, Т пл 119-121 °С.

¹H-ЯМР (CD₃OD): 0,34 (m, 2H), 0,52 (m, 2H), 1,10 (m, 1H), 1,48 (br m, 1H), 1,83 (br m, 1H), 2,11 (br s, 6H), 2,29 (s, 3H), 2,41 (br m, 1H), 2,60 (br m, 1H), 3,12 (br m, 1H), 3,23 (m, 2H), 3,24-3,41 (широкі сигнали, всього 3H), 3,50 (s, 3H), 4,72 (широкий сигнал, 2H), 6,91 (s, 2H), 7,06 (m, 2H), 7,29 (m, 3H).

PX/МС (E⁺): 461 (M+H)⁺

Стадія 2: Одержання 1-циклопропілметил-4-гідрокси-8-метокси-3-(2,4,6-триметилфеніл)-1,8-діазаспіро[4.5]дец-3-ен-2-ону (шукана сполука P2.8)



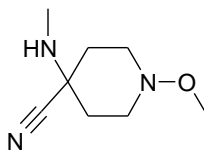
Дебензилювання проводили в апараті для гідрування в безперервному потоці H-Cube®: 4-бензилокси-1-циклопропілметил-8-метокси-3-(2,4,6-триметилфеніл)-1,8-діазаспіро[4.5]дец-3-ен-2-он (546 мг, 1,34 ммоль) розчиняли в метанолі (47 мл) і цей розчин субстрату (0,029 М) двічі прокачували через картридж, наповнений за допомогою 5 % Pd/C, при швидкості потоку 1 мл/хв, температурі 35 °С і тиску 2-3 бар. Розчин продукту збирали, концентрували, і залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (етилацетат/гептан 1:1). Вихід: 215 мг 1-циклопропілметил-4-гідрокси-8-метокси-3-(2,4,6-триметилфеніл)-1,8-діазаспіро[4.5]дец-3-ен-2-ону (шукана сполука P2.8) у вигляді білої твердої речовини, Т пл 223-225 °С

¹H-ЯМР (CD₃OD): 0,34 (m, 2H), 0,52 (m, 2H), 1,11 (m, 1H), 1,43 (br m, 1H), 1,78 (br m, 1H), 2,11 (s, 6H), 2,25 (s, 3H), 2,41 (br m, 1H), 2,62 (br m, 1H), 3,23 (широкий сигнал, всього 3H), 3,28-3,45 (широкі сигнали, всього 3H), 3,55 (s, 3H), 6,90 (s, 2H).

РХ/МС (ЕР+): 371 (М+Н)⁺, 369 (М-Н)⁻

ПРИКЛАД 4: Одержання 4-гідрокси-8-метокси-1-метил-3-(2,4,6-триметилфеніл)-1,8-діазаспіро[4.5]дец-3-ен-2-ону (сполука P2.2)

Стадія 1: Одержання 1-метокси-4-метиламінопіперидин-4-карбонітрилу (сполука P5.1)

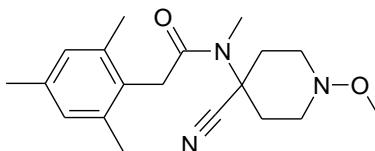


До розчину 1-метоксипіперидин-4-ону [одержували відповідно з публікацією Journal of Organic Chemistry (1961), 26, 1867-74] (100 г, 0,77 моля), водного розчину метиламіну (40 мас. % в Н₂О, 86 мл) і метиламінгідрохлориду (57,5 г, 0,85 моля) у воді (700 мл) при 0 °С протягом 1 г по краплям додавали розчин ціаніду калію (55,5 г, 0,85 моля) у воді (150 мл). Реакційну суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 2 днів. Протягом наступних 5 днів суміш додатково обробляли метиламінгідрохлоридом (5×2,6 г, всього 13,0 г), водним розчином метиламіну (5×4,3 мл, всього 21,5 мл) і ціанідом калію (5×2,5 г, всього 12,5 г), і перемішування продовжували при кімнатній температурі до завершення реакції за даними тонкошарової хроматографії. Водну реакційну суміш екстрагували дихлорметаном (1×500 мл і 4×200 мл), об'єднані органічні фази сушили над сульфатом натрію і випарювали. Вихід: 113,0 г 1-метокси-4-метиламінопіперидин-4-карбонітрилу (сполука P5.1) у вигляді червоної рідини Цю речовину використовували на наступній стадії без додаткової очистки.

¹H-ЯМР (CDCl₃): 1,36 (br s, 1H), 1,62-2,22 (широкі сигнали, всього 4H), 2,51 (s, 3H), 2,63-3,41 (широкі сигнали, всього 4H), 3,51 (s, 3H).

ІК (інфрачервоний спектр) (CN): ν 2220 см⁻¹ РХ/МС (ЕР+): 170 (М+Н)⁺

Стадія 2: Одержання N-(4-ціано-1-метоксипіперидин-4-іл)-N-метил-2-(2,4,6-триметилфеніл)-ацетаміду (сполука P4.1)



Методика А: До розчину 1-метокси-4-метиламінопіперидин-4-карбонітрилу (20,0 г, 118,2 ммоль), триетиламіну (24,6 мл, 17,9 г, 177,3 ммоль) і 4-диметиламінопіридину (ДМАП, 0,1 г) в тетрагідрофурані (250 мл) при 0-5 °С протягом 1,5 г по краплям додавали розчин (2,4,6-триметилфеніл)-ацетилхлориду (25,6 г, 130,0 ммоль) в тетрагідрофурані (ТГФ) (25 мл). Реакційну суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 3 г і в цей час її додатково обробляли (2,4,6-триметилфеніл)-ацетилхлоридом (5,4 г) і триетиламіном (7 мл). Реакційну суміш розбавляли етилацетатом і водою, шари розділяли, водну фазу екстрагували двічі

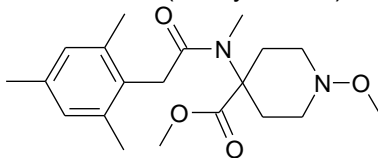
етилацетатом, об'єднані органічні фази промивали двічі насиченим водним розчином гідрокарбонату натрію і розсоллом, сушили над сульфатом натрію і концентрували. Твердий залишок суспендували в діетиловому ефірі (500 мл), перемішували протягом ночі при кімнатній температурі, фільтрували і сушили. Вихід: 27,5 г N-(4-ціано-1-метоксипіперидин-4-іл)-N-метил-2-(2,4,6-триметилфеніл)-ацетаміду (сполука Р4.1) у вигляді білої твердої речовини, Т пл 171-178 °С Цю речовину використовували на наступній стадії без додаткової очистки.

¹H-ЯМР (CDCl₃): 2,01 (br m, 1H), 2,11 (br m, 1H), 2,20 (s, 6H), 2,25 (s, 3H), 2,34 (br m, 1H), 2,57 (br m, 1H), 2,83 (br m, 1H), 3,12 (s, 3H), 3,20 (br m, 1H), 3,34 (br m, 2H), 3,50 (br s, 3H), 3,66 (s, 2H), 6,85 (s, 2H).

ІЧ (CN): ν 2231 см⁻¹ РХ/МС (ЕР+): 330 (М+Н)⁺

Методика В: До розчину 1-метокси-4-метиламінопіперидин-4-карбонітрилу (20,0 г, 118,2 ммоль) в піридині (250 мл) при 0 °С по краплям додавали (2,4,6-триметилфеніл)-ацетилхлорид (25,6 г, 130,0 ммоль). Реакційну суміш перемішували при 0 °С протягом 1 г і при кімнатній температурі протягом ночі, виливали у воду з льодом і підкисляли 2 н водним розчином НСІ до рН 7. Отриманий густий осад відфільтровували, промивали холодною водою, розчиняли в дихлорметані, сушили над сульфатом натрію і концентрували. Твердий залишок суспендували в гексані, перемішували при кімнатній температурі, фільтрували і сушили. Вихід: 32,7 г N-(4-ціано-1-метоксипіперидин-4-іл)-N-метил-2-(2,4,6-триметилфеніл)-ацетаміду (сполука Р4.1) у вигляді блідо-жовтої твердої речовини, Т пл 175-177 °С. Спектральні характеристики цієї речовини являлись такими ж, як описані вище у методиці одержання сполуки прикладу 4, стадія 2, методика А.

Стадія 3: Одержання метилового ефіру 1-метокси-4-{метил-[2-(2,4,6-триметилфеніл)-ацетил]-аміно}-піперидин-4-карбонової кислоти (сполука Р4.2)

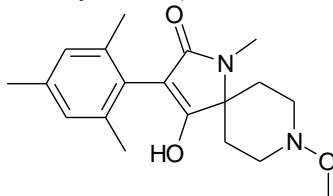


До суспензії N-(4-ціано-1-метоксипіперидин-4-іл)-N-метил-2-(2,4,6-триметилфеніл)-ацетаміду (106,0 г, 0,322 моля) в метанолі (222 мл) при 15-20 °С протягом 75 хв по краплям додавали концентровану сірчану кислоту (85,7 мл, 157,8 г, 1,609 моля) і реакційну суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 1 г. Суміш виливали на лід (1 кг), перемішували протягом 1 г, потім обережно нейтралізовували 30 % водним розчином гідроксиду натрію до рН 5-5,5 (при зовнішньому охолодженні льодом). Густу пастоподібну суміш розбавляли водою (1000 мл) і фільтрували. Твердий залишок промивали водою і гексаном, сушили на повітрі і потім сушили над пентаоксидом фосфору у вакуумі при 40 °С протягом 2 г. Для видалення неорганічних домішок (сульфат натрію!) тверду речовину розбавляли дихлорметаном (600 мл), промивали водою (2×300 мл), водні фази один раз екстрагували дихлорметаном, об'єднані органічні фази сушили над сульфатом натрію і випарювали. Вихід: 85,4 г метилового ефіру 1-метокси-4-{метил-[2-(2,4,6-триметилфеніл)-ацетил]-аміно}-піперидин-4-карбонової кислоти (сполука Р4.2) у вигляді білої твердої речовини, Т пл 133-135 °С.

¹H-ЯМР (CDCl₃): 1,92 (br m, 1H), 2,04 (br m, 1H), 2,16 (s, 6H), 2,23 (s, 3H), 2,27-2,49 (br m, 2H), 2,82 (br m, 2H), 3,14 (br m, 2H), 3,22 (br s, 3H), 3,52 (s, 3H), 3,62 (br s, 5H), 6,82 (s, 2H).

РХ/МС (ЕР+): 363 (М+Н)⁺

Стадія 4: Одержання 4-гідрокси-8-метокси-1-метил-3-(2,4,6-триметилфеніл)-1,8-діазаспіро[4.5]дец-3-ен-2-ону (шукана сполука Р2.2)

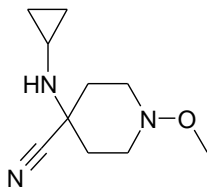


До розчину метилового ефіру 1-метокси-4-{метил-[2-(2,4,6-триметилфеніл)-ацетил]-аміно}-піперидин-4-карбонової кислоти (85,0 г, 234,5 ммоль) в диметилформаміді (800 мл) при 0 °С чотирма порціями додавали метоксид натрію (38,0 г, 703,5 ммоль) і перемішування продовжували при 0 °С протягом 30 хв, потім при кімнатній температурі протягом 1 г. Реакційну суміш виливали в суміш льоду і насиченого водного розчину хлориду амонію, підкисляли до рН 5-6 концентрованою НСІ і ретельно екстрагували етилацетатом. Об'єднані органічні шари промивали водою, сушили над сульфатом натрію, концентрували і залишок сушили у вакуумі.

Вихід: 72,7 г 4-гідрокси-8-метокси-1-метил-3-(2,4,6-триметилфеніл)-1,8-діазаспіро[4.5]дец-3-ен-2-ону (шукана сполука P2.2) у вигляді твердої речовини.

Спектральні характеристики цієї неочищеної речовини являлись такими ж, як описані вище у методиці одержання сполуки прикладу 1, стадія 1.

5 ПРИКЛАД 5: Одержання 4-циклопропіламіно-1-метоксипіперидин-4-карбонітрилу (сполука P5.2)



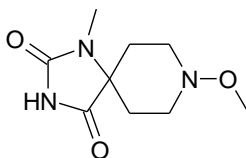
10 До розчину циклопропіламіну (1,4 мл, 1,14 г, 20,0 ммоль) в метанолі (20 мл) при 0 °С по краплям додавали 1 н розчин хлористоводневої кислоти (20 мл, 20,0 ммоль) і суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 30 хв. Потім при 0 °С по краплям додавали 1-метоксипіперидин-4-он [одержували відповідно до публікації Journal of Organic Chemistry (1961), 26, 1867-74] (2,58 г, 20,0 ммоль), потім через 10 хв додавали ціанід калію (1,3 г, 20,0 ммоль) у воді (10 мл). Реакційну суміш нагрівали до кімнатної температури і перемішували протягом ночі, розбавляли водою і діетиловим ефіром, шари розділяли і водну фазу ретельно екстрагували діетиловим ефіром. Об'єднані органічні шари промивали розсолон, сушили над сульфатом натрію і випарювали. Вихід: 3,19 г 4-циклопропіламіно-1-метоксипіперидин-4-карбонітрилу (шукана сполука P5.2) у вигляді олії Цю речовину використовували на наступній стадії без

20 додаткової очистки.
¹H-ЯМР (CDCl₃): 0,42 (br m, 2H), 0,56 (m, 2H), 1,57-2,30 (широкі сигнали, всього 5H), 2,31 (m, 1H), 2,63-3,41 (широкі сигнали, всього 4H), 3,51 (br s, 3H).

ІК (CN): ν 2223 см⁻¹ PX/MC (EP+): 196 (M+H)⁺

ПРИКЛАД 6: Одержання метилового ефіру 1-метокси-4-метиламінопіперидин-4-карбонової кислоти (сполука P5.4)

Стадія 1: Одержання 8-метокси-1-метил-1,3,8-триазаспіро[4.5]декан-2,4-діону (сполука P5.6)

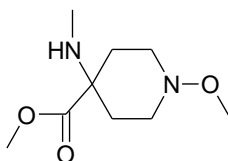


25 До розчину 1-метокси-4-метиламінопіперидин-4-карбонітрилу (сполука P5.1) (10,0 г, 59,09 ммоль) в дихлорметані (180 мл) при 20-30 °С протягом 15 хв по краплям додавали хлорсульфонізоціанат (5,14 мл, 8,36 г, 59,05 ммоль). Жовтувату суспензію перемішували при кімнатній температурі протягом 30 хв і концентрували і одержували блідо-жовту тверду речовину. Цю речовину розчиняли в 1 н водному розчині хлористоводневої кислоти (180 мл), кип'ятили із зворотним холодильником протягом 1 г, охолоджували до 0 °С і підкисляли 4 н водним розчином NaOH до pH 5,5. Водну фазу екстрагували етилацетатом (4×), об'єднані органічні шари промивали розсолон, сушили над сульфатом натрію і концентрували. Залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (етилацетат/гептан 1:1). Вихід: 3,86 г 8-метокси-1-метил-1,3,8-триазаспіро[4.5]декан-2,4-діону (сполука P5.6) у вигляді твердої речовини.

35 ¹H-ЯМР (CDCl₃): 1,33-2,41 (широкі сигнали, всього 4H), 2,86 (br s, 3H), 3,09-3,42 (широкі сигнали, всього 4H), 3,52 (br s, 3H), 7,76 (br s, 1H).

PX/MC (EP+): 214 (M+H)⁺

40 Стадія 2: Одержання метилового ефіру 1-метокси-4-метиламінопіперидин-4-карбонової кислоти (шукана сполука P5.4)



45 До суспензії 8-метокси-1-метил-1,3,8-триазаспіро[4.5]декан-2,4-діону (3,36 г, 15,76 ммоль) у воді (100 мл) додавали гідроксид натрію (0,63 г, 15,75 ммоль) і суміш нагрівали в мікровхвильовому апараті при 190 °С протягом 30 хв, при 200 °С протягом 1 г і потім при 210 °С протягом 1 г до завершення реакції за даними аналізу PX-MC. Реакційну суміш підкисляли до

pH 3 (при охолодженні льодом) водним розчином HCl, концентрували у вакуумі, твердий залишок переносили в теплий метанол (40 °C), фільтрували і фільтрат випарювали. Залишок сушили над пентаоксидом фосфору при 40 °C протягом ночі. Вихід: 2,08 г гідрохлориду 1-метокси-4-метиламінопіперидин-4-карбонової кислоти.

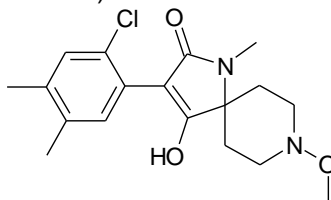
5 РХ/МС (ЕР+): 189 (М+Н)⁺ для вільної основи.

До суспензії гідрохлориду 1-метокси-4-метиламінопіперидин-4-карбонової кислоти (2,08 г, 9,26 ммоль) в метанолі (20 мл) при 0-5 °C додавали тіонілхлорид (2,41 мл, 3,97 г, 33,40 ммоль) і реакційну суміш кип'ятили із зворотним холодильником протягом 7 днів. Після охолодження суміш концентрували, залишок розбавляли водою з льодом і нейтралізували водним розчином бікарбонату натрію. Водну фазу екстрагували етилацетатом (4×), об'єднані органічні шари промивали розсолон, сушили над сульфатом натрію і концентрували. Залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (градієнтний режим: етилацетат → етилацетат/метанол 20:1). Вихід: 76 мг метилового ефіру 1-метокси-4-метиламінопіперидин-4-карбонової кислоти (шукана сполука Р5.4) у вигляді олії.

15 ¹Н-ЯМР (CDCl₃): 1,46-2,33 (широкі сигнали, всього 5H), 2,22 (br s, 3H), 2,51-3,31 (широкі сигнали, всього 4H), 3,51 (s, 3H), 3,72 (br s, 3H).

ІК (COOMe): ν 1726 см⁻¹ РХ/МС (ЕР+): 203 (М+Н)⁺

ПРИКЛАД 7: Одержання 3-(2-хлор-4,5-диметилфеніл)-4-гідрокси-8-метокси-1-метил-1,8-діазаспіро[4.5]дец-3-ен-2-ону (сполука Р2.26)

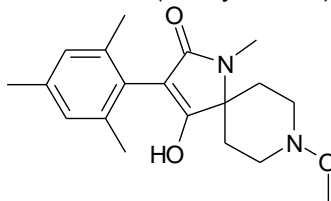


20 До розчину 2-(2-хлор-4,5-диметилфеніл)-N-(4-ціано-1-метоксипіперидин-4-ил)-N-метилацетаміду (сполука Р4.27) (1,15 г, 3,29 ммоль) в метанолі (~3 мл) при 10 °C по краплям додавали концентровану сірчану кислоту (0,876 мл, 16,43 ммоль) і реакційну суміш перемішували при кімнатній температурі протягом ночі. Після додаткової обробки концентрованою сірчаною кислотою (0,876 мл, 16,43 ммоль) і перемішування при 80 °C протягом ночі додавали додаткову кількість концентрованої сірчаної кислоти (0,876 мл, 16,43 ммоль) і перемішування продовжували при 90 °C протягом ще однієї ночі. Суміш виливали на лід, обережно нейтралізували 30 % водним розчином гідроксиду натрію до pH 5-6, отриманий осад відфільтровували і сушили і одержували першу порцію продукту у вигляді бежевої твердої речовини (225 мг). Матковий розчин концентрували, і залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (етилацетат) і одержували ще 462 мг продукту у вигляді жовтуватої твердої речовини. Вихід: 687 мг 3-(2-хлор-4,5-диметилфеніл)-4-гідрокси-8-метокси-1-метил-1,8-діазаспіро[4.5]дец-3-ен-2-ону (шукана сполука Р2.26) у вигляді твердої речовини, Т пл 191-192 °C.

35 ¹Н-ЯМР (CD₃Cl₃): 1,49-2,57 (широкі сигнали, всього 4H), 2,20 (s, 3H), 2,21 (s, 3H), 2,79-3,46 (широкі сигнали, всього 4H), 3,00 (br s, 3H), 3,52 (br s, 3H), 4,40 (br s, 1H), 6,87 (s, 1H), 7,16 (s, 1H).

РХ/МС (ЕР+): 351/353 (М+Н)⁺

40 ПРИКЛАД 8: Альтернативна методика одержання 4-гідрокси-8-метокси-1-метил-3-(2,4,6-триметилфеніл)-1,8-діазаспіро[4.5]дец-3-ен-2-он (сполука Р2.2)



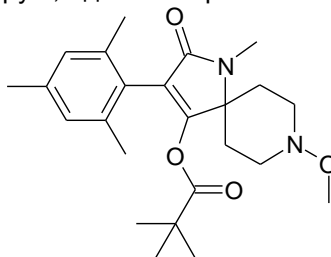
45 До розчину 4-гідрокси-8-метокси-3-(2,4,6-триметилфеніл)-1,8-діазаспіро[4.5]дец-3-ен-2-ону [вихідна речовина (ВР) одержували відповідно до WO09/049851] (500 мг, 1,58 ммоль) в тетрагідрофурані (20 мл) при 0 °C протягом 15 хв по краплям додавали 1,0 М розчин біс(триметилсиліл)аміду літію в гексанах (3,32 мл, 3,32 ммоль). Суміш перемішували при 0 °C протягом 1 г, протягом 10 хв по краплям обробляли метилйодидом (0,099 мл, 225 мг, 1,59 ммоль) і потім перемішували при 0 °C протягом 30 хв і при кімнатній температурі протягом 1 г. Реакцію зупиняли холодним насиченим водним розчином хлориду амонію і суміш екстрагували

трет-бутилметилом ефіром (3×), об'єднані органічні фази промивали розсолон, сушили над сульфатом натрію і концентрували. Залишок (210 мг) суспендували в гексані, перемішували при кімнатній температурі протягом 10 хв, фільтрували і сушили. Вихід: 171 мг чистої суміші вихідної речовини (ВР) і 4-гідрокси-8-метокси-1-метил-3-(2,4,6-триметилфеніл)-1,8-діазаспіро[4.5]дец-3-ен-2-ону (шукана сполука Р2.2) у вигляді бежевої твердої речовини. Аналіз неочищеної речовини за допомогою ^1H -ЯМР і РХ-МС показав, що ця суміш ВР/сполука Р2.2 мала склад ~1:2,5.

^1H -ЯМР (CD_3OD , тільки окремі сигнали): 6,86 (s, 2H, $\text{H}_{\text{ароматичний}}$ ВР), 6,89 (s, 2H, $\text{H}_{\text{ароматичний}}$ сполуки Р2.2); обидва сигнали у відношенні 1:2,6.

РХ/МС (ЕР+): 317 ($\text{M}+\text{H}^+$); $R_t=1,40$ хв для ВР РХ/МС (ЕР+): 331 ($\text{M}+\text{H}^+$); $R_t=1,46$ хв для сполуки Р2.2 Відношення вмістів цих сполук, що складає 1:2,5, визначали за площами піків в УФ-спектрі при 220 нм.

ПРИКЛАД 9: Одержання 8-метокси-1-метил-2-оксо-3-(2,4,6-триметилфеніл)-1,8-діазаспіро[4.5]дец-3-ен-4-ілового ефіру 2,2-диметилпропіонової кислоти (сполука Р1.31)



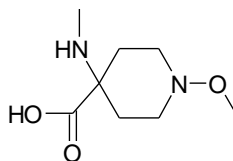
До розчину 4-гідрокси-8-метокси-1-метил-3-(2,4,6-триметилфеніл)-1,8-діазаспіро[4.5]дец-3-ен-2-ону (сполука Р2.2) (350 мг, 1,06 ммоль) і триетиламіну (0,221 мл, 160,7 мг, 1,59 ммоль) в тетрагідрофурани (10 мл) при 0 °С по краплям додавали півалоїлхлорид (0,143 мл, 140,1 мг, 1,16 ммоль). Суспензію перемішували при 0 °С протягом 2 г. Реакційну суміш розбавляли етилацетатом і водою, шари розділяли, водну фазу екстрагували етилацетатом, об'єднані органічні фази промивали розсолон, сушили над сульфатом натрію і концентрували. Залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (етилацетат). Вихід: 344 мг 8-метокси-1-метил-2-оксо-3-(2,4,6-триметилфеніл)-1,8-діазаспіро[4.5]дец-3-ен-4-ілового ефіру 2,2-диметилпропіонової кислоти (сполука Р1.31) у вигляді безбарвної смолоподібної речовини.

^1H -ЯМР (CDCl_3): 1,02 (br s, 9H), 1,46-2,51 (широкі сигнали, всього 4H), 2,14 (s, 6H), 2,23 (s, 3H), 2,70-3,46 (широкі сигнали, всього 4H), 2,95 (br s, 3H), 3,54 (s, 3H), 6,82 (s, 2H).

РХ/МС (ЕР+): 415 ($\text{M}+\text{H}^+$)

ПРИКЛАД 10: Одержання метилового ефіру 4-{[2-(2,5-диметилфеніл)-ацетил]-метиламіно}-1-метоксипіперидин-4-карбонової кислоти (сполука Р4.46)

Стадія 1: Одержання 1-метокси-4-метиламінопіперидин-4-карбонової кислоти (сполука Р5.7)

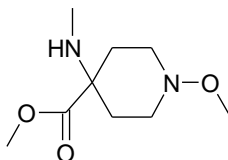


1-Метокси-4-метиламінопіперидин-4-карбонітрил (сполука Р5.1) (3,0 г, 17,73 ммоль) при 0 °С двома порціями додавали до концентрованої сірчаної кислоти (30 мл). Після перемішування протягом 20 хв одержували жовтий розчин, який витримували при кімнатній температурі протягом ночі. Реакційну суміш обережно розбавляли водою з льодом (60 мл), кип'ятили із зворотним холодильником протягом 4 г, потім виливали на лід (50 г) і при охолодженні нейтралізували 25 % водним розчином аміаку до рН 7-8. Реакційну суміш випарювали і білий твердий залишок розтирали з теплим (40 °С) метанолом (3×50 мл), фільтрували і об'єднані фази, які містять метанол, концентрували. Залишок обробляли толуолом (3×50 мл) для азеотропного видалення води до постійної маси, потім розтирали з тетрагідрофураном, фільтрували і сушили. Вихід: 2,30 г 1-метокси-4-метиламінопіперидин-4-карбонової кислоти (сполука Р5.7) у вигляді білої твердої речовини, $T_{\text{пл}} > 250$ °С.

^1H -ЯМР (D_2O): 1,73 (m, 1H), 2,02 (m, 2H), 2,32 (m, 1H), 2,54 (такий, що здається d, 3H), 2,69 (m, 1H), 2,99 (m, 1H), 3,18 (m, 1H), 3,33 (m, 1H), 3,49 (такий, що здається d, 3H). Спектральні характеристики вказували на існування двох основних конформерів у співвідношенні 1:1

РХ/МС (ЕР+): 189 ($\text{M}+\text{H}^+$)

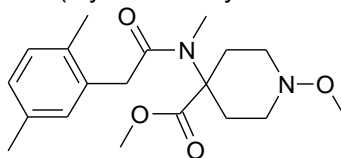
Стадія 2: Одержання метилового ефіру 1-метокси-4-метиламінопіперидин-4-карбонової кислоти (сполука Р5.4)



До суспензії 1-метокси-4-метиламінопіперидин-4-карбонової кислоти (2,0 г, 10,63 ммоль) в метанолі (50 мл) при 0-10 °С додавали тіонилхлорид (2,29 мл, 3,76 г, 31,57 ммоль) і реакційну суміш кип'ятили із зворотним холодильником протягом ночі. Після охолодження, суміш концентрували, залишок розбавляли водою з льодом (20 мл) і нейтралізовували водним розчином бікарбонату натрію. Водну фазу екстрагували етилацетатом (4×25 мл) і дихлорметаном (4×50 мл), об'єднані органічні шари промивали водним розчином бікарбонату натрію (15 мл) і розсолем (15 мл), сушили над сульфатом натрію і концентрували. Вихід: 0,76 г метилового ефіру 1-метокси-4-метиламінопіперидин-4-карбонової кислоти (сполука Р5.4) у вигляді грузлої помаранчевої олії. Спектральні характеристики цієї неочищеної речовини являлись такими ж, як описані вище в методиці одержання сполуки прикладу 6, стадія 2.

PX/МС (ЕР⁺): 203 (М+Н)⁺

Стадія 3: Одержання метилового ефіру 4-[[2-(2,5-диметилфеніл)-ацетил]-метиламіно]-1-метоксипіперидин-4-карбонової кислоти (шукана сполука Р4.46)



До розчину метилового ефіру 1-метокси-4-метиламінопіперидин-4-карбонової кислоти (200 мг, 0,99 ммоль) в піридині (5 мл) при 0 °С по краплям додавали (2,5-диметилфеніл)-ацетилхлорид (240 мг, 1,31 ммоль). Реакційну суміш перемішували при 0 °С протягом 1 г і при кімнатній температурі протягом 6 г, виливали у воду з льодом, підкисляли 2 н водним розчином НСІ до рН 7 і розбавляли етилацетатом (50 мл). Шари розділяли, водну фазу екстрагували етилацетатом (3×25 мл), об'єднані органічні фази промивали водою (3×15 мл) і розсолем, сушили над сульфатом натрію і концентрували. Залишок очищали за допомогою хроматографії на силікагелі (циклогексан/етилацетат 2:1). Вихід: 170 мг метилового ефіру 4-[[2-(2,5-диметилфеніл)-ацетил]-метиламіно]-1-метоксипіперидин-4-карбонової кислоти (шукана сполука Р4.46) у вигляді безбарвної смолоподібної речовини.

¹Н-ЯМР (CD₃OD): 1,99 (br m, 2H), 2,17 (s, 3H), 2,26 (s, 3H), 2,36 (br m, 2H), 2,79 (br m, 1H), 2,93 (br m, 1H), 3,06 (такий, що здається d, 3H), 3,21 (br m, 2H), 3,50 (s, 3H), 3,67 (s, 3H), 3,68 (br s, 2H), 6,91 (br s, 1H), 6,95 (d, 1H), 7,04 (d, 1H).

PX/МС (ЕР⁺): 349 (М+Н)⁺

Сполуки формули I таблиці Р1, сполуки формули II таблиці Р2 і проміжні продукти, приведені в таблицях Р3, Р4 і Р5, можна одержати за аналогічними методиками. Для характеристики сполук використовували одну з приведених нижче методик РХ-МС:

Методика А

МС: Мас-спектрометр ZQ фірми Waters (мас-спектрометр з однією квадрульною лінзою), методика іонізації: електророзпилення, полярність: позитивні/негативні іони, напруга на капілярі 3,00 В, напруга на конусі 30,00 В, напруга на екстракторі 2,00 В, температура джерела 100 °С, температура десольватації 250 °С, швидкість потоку газу на конусі 50 л/г, швидкість потоку газу при десольватації 400 л/г, діапазон мас: від 150 до 1000 або від 100 до 900 Да.

РХ: НР 1100 HPLC фірми Agilent: пристрій дегазування розчинника, насос для подачі чотирьох компонентів (ZCQ)/насос для подачі двох компонентів (ZDQ), термостатируемый блок колонки і детектор на діодній матриці Колонка: Phenomenex Gemini C18, розмір часток 3 мкм, 110 Å, 30×3 мм, температура 60 °С, ДДМ (детектор на діодній матриці) діапазон довжин хвиль: від 200 до 500 нм; градієнтний режим розчинника: А = вода + 0,05 % об./об НСООН, В = ацетонітрil/метанол (4:1) + 0,04 % об./об НСООН.

Час (хв) А% В% Швидкість потоку (мл/хв)

0,00	95,0	5,0	1,700
2,00	0,0	100,0	1,700
2,80	0,0	100,0	1,700
2,90	95,0	5,0	1,700
3,00	95,0	5,0	1,700

Методика В

МС: Мас-спектрометр ZMD фірми Waters (мас-спектрометр з однією квадрупольною лінзою), методика іонізації: електророзпилення, полярність: позитивні/негативні іони, напруга на капілярі 3,80 В, напруга на конусі 30,00 В, напруга на екстракторі 3,00 В, температура джерела 150 °С, температура десольватації 350 °С, швидкість потоку газу на конусі - виключено, швидкість потоку газу при десольватації 600 л/г, діапазон мас: від 150 до 1000 (от 100 до 1500 для низьких мас) або від 100 до 900 Да.

РХ: HP 1100 HPLC фірми Agilent: пристрій дегазування розчинника, насос для подачі двох компонентів, термостатуруваний блок колонки і детектор на діодній матриці. Колонка: Phenomenex Gemini C18, розмір часток 3 мкм, 110 Å, 30×3 мм, температура 60 °С, ДДМ діапазон довжин хвиль: від 200 до 500 нм, градієнтний режим розчинника: А = вода + 0,05 % об./об НСООН, В = ацетонітрил/метанол (4:1) + 0,04 % об./об НСООН.

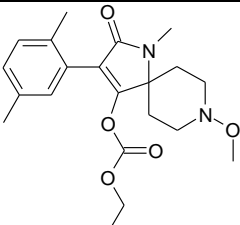
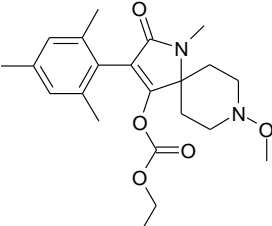
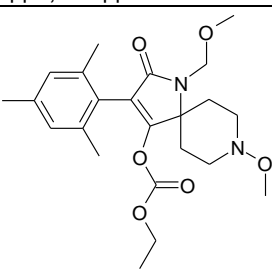
Час (хв) А% В% Швидкість потоку (мл/хв)

0,00	95,0	5,0	1,700
2,00	0,0	100,0	1,700
2,80	0,0	100,0	1,700
2,90	95,0	5,0	1,700
3,00	95,0	5,0	1,700

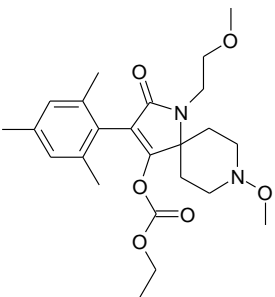
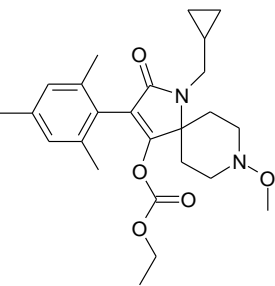
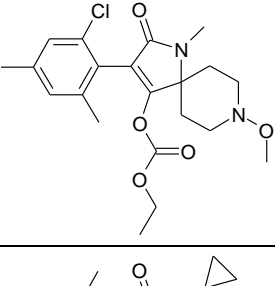
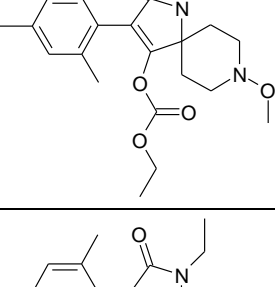
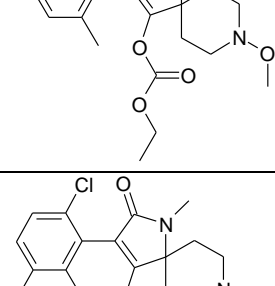
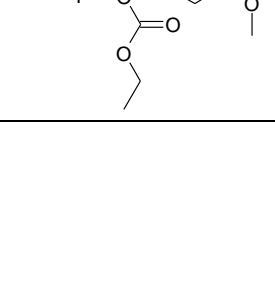
Характеристичні значення, отримані для кожної сполуки, якими являлись час утримання ("R_t", приведено в хвиликах) і молекулярний іон, приведені в таблиці Р1, таблиці Р2, таблиці Р3, таблиці Р4 і таблиці Р5.

Таблиця Р1

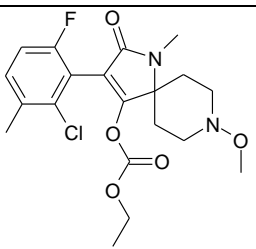
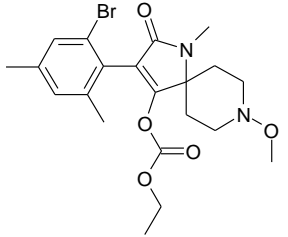
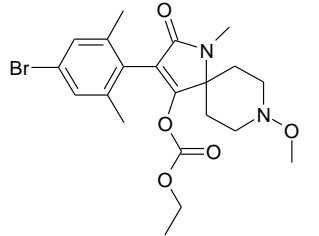
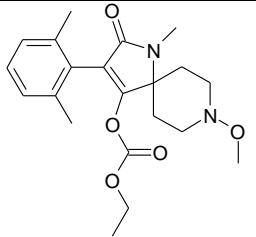
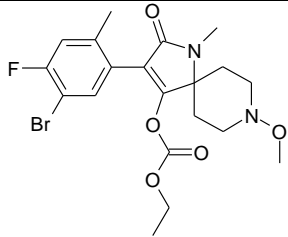
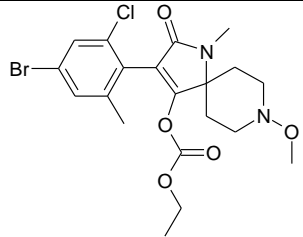
Фізичні характеристики сполук формули I

Сполука №	Структури	Температура плавлення	МС/ЯМР
P1.1		96 - 110 °С	PX/MC: 389 (M+H) ⁺ R _t =1,82 хв
P1.2	 приклад 1, стадія 2	134 - 136 °С	PX/MC: 403 (M+H) ⁺ R _t =1,81 хв
P1.3		смолоподібна речовина	¹ H-ЯМР (CD ₃ OD, тільки окремі сигнали): 1,03 (t, 3H, OCH ₂ CH ₃), 2,14 (s, 6H, CH ₃ мезитилу), 2,26 (s, 3H, CH ₃ мезитилу), 3,34 (br s, 3H, CH ₂ OCH ₃), 3,55 (s, 3H, NOCH ₃), 4,01 (q, 2H, OCH ₂ CH ₃), 6,89 (s, 2H, H _{ароматичний}).

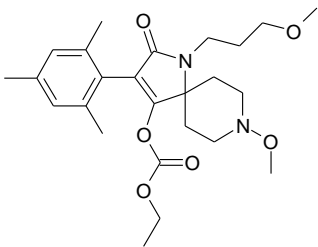
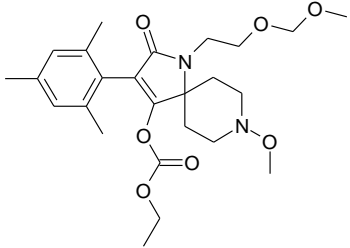
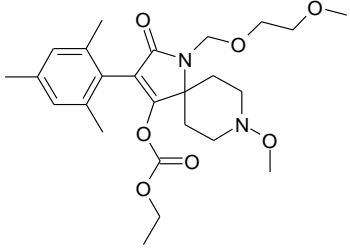
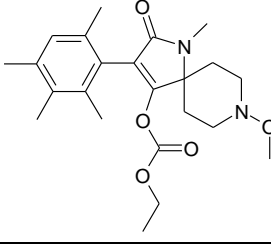
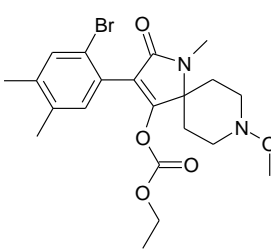
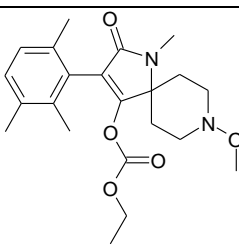
Фізичні характеристики сполук формули I

Сполука №	Структури	Температура плавлення	МС/ЯМР
P1.4		тверда речовина	PX/MC: 447 (M+H) ⁺ R _t =1,94 хв
P1.5		смолоподібна речовина	¹ H-ЯМР (CD ₃ OD): 0,38 (m, 2H), 0,55 (m, 2H), 1,02 (t, 3H), 1,15 (m, 1H), 1,54 (br m, 1H), 1,88 (br m, 1H), 2,13 (s, 6H), 2,25 (s, 3H), 2,48 (br m, 1H), 2,66 (br m, 1H), 2,83 (br m, 1H), 3,18 (br m, 1H), 3,30 (br m, 2H), 3,41 (br m, 2H), 3,55 (s, 3H), 4,00 (q, 2H), 6,87 (s, 2H). PX/MC (EP+): 443 (M+H) ⁺ ; R _t =2,06 хв
P1.6		164 - 167 °C	PX/MC: 423/425 (M+H) ⁺ R _t =1,82 хв
P1.7		смолоподібна речовина	PX/MC: 429 (M+H) ⁺ R _t =1,93 хв
P1.8		101 - 103 °C	PX/MC: 417 (M+H) ⁺ R _t =1,91 хв
P1.9		тверда речовина	PX/MC: 427/429 (M+H) ⁺ R _t =1,75 хв

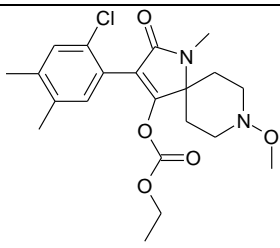
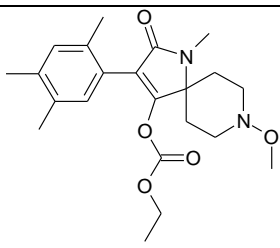
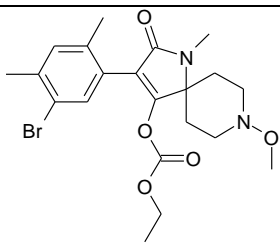
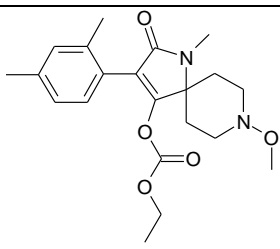
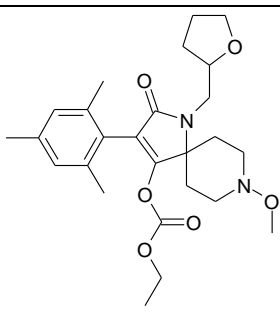
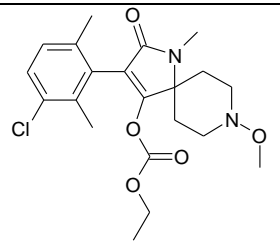
Фізичні характеристики сполук формули І

Сполука №	Структури	Температура плавлення	МС/ЯМР
P1.10		47 - 50 °C	PX/MC: 427/429 (M+H) ⁺ R _t =1,73 хв
P1.11		163 - 167 °C	PX/MC: 467/469 (M+H) ⁺ R _t =1,83 хв
P1.12		126 - 127 °C	PX/MC: 467/469 (M+H) ⁺ R _t =1,89 хв
P1.13		106 - 109 °C	PX/MC: 389 (M+H) ⁺ R _t =1,74 хв
P1.14		смолоподібна речовина	PX/MC: 471/473 (M+H) ⁺ R _t =1,81 хв
P1.15		87 - 89 °C	PX/MC: 473/475/477 (M+H) ⁺ R _t =1,80 хв

Фізичні характеристики сполук формули I

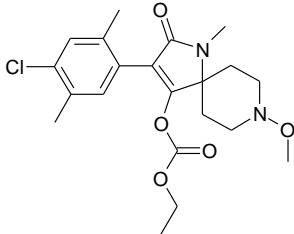
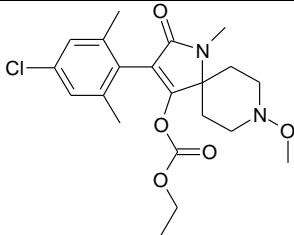
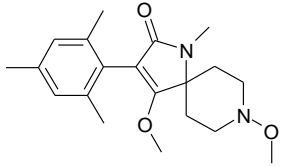
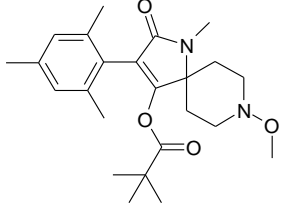
Сполука №	Структури	Температура плавлення	МС/ЯМР
P1.16		смолоподібна речовина	PX/MC: 461 (M+H) ⁺ R _t =1,91 хв
P1.17		смолоподібна речовина	PX/MC: 477 (M+H) ⁺ R _t =1,89 хв
P1.18		смолоподібна речовина	PX/MC: 477 (M+H) ⁺ R _t =1,91 хв
P1.19		тверда речовина	PX/MC: 417 (M+H) ⁺ R _t =1,86 хв
P1.20		158 - 159 °C	¹ H-ЯМР (CDCl ₃ , тільки окремі сигнали): 1,16 (t, 3H, OCH ₂ CH ₃), 2,20 (s, 3H, CH ₃ фенілу), 2,22 (s, 3H, CH ₃ фенілу), 2,94 (br s, 3H, N-CH ₃ ; сигнал, який перекривається з сигналами Н піперидинілу), 3,56 (s, 3H, NOCH ₃), 4,09 (q, 2H, OCH ₂ CH ₃), 7,07 (s, 1H, H _{ароматичний}), 7,35 (s, 1H, H _{ароматичний}).
P1.21		смолоподібна речовина	PX/MC: 403 (M+H) ⁺ R _t =1,81 хв

Фізичні характеристики сполук формули I

Сполука №	Структури	Температура плавлення	МС/ЯМР
P1.22		149 - 150 °C	PX/MC: 423/425 (M+H) ⁺ R _t =1,91 хв
P1.23		смолоподібна речовина	PX/MC: 403 (M+H) ⁺ R _t =1,83 хв
P1.24		тверда речовина	PX/MC: 467/469 (M+H) ⁺ R _t =1,88 хв
P1.25		тверда речовина	PX/MC: 389 (M+H) ⁺ R _t =1,77 хв
P1.26		смолоподібна речовина	PX/MC: 473 (M+H) ⁺ R _t =1,96 хв
P1.27		смолоподібна речовина	PX/MC: 423/425 (M+H) ⁺ R _t =1,84 хв

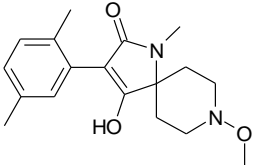
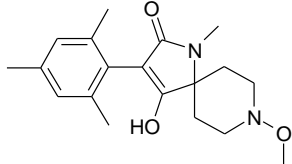
Таблиця Р1

Фізичні характеристики сполук формули I

Сполука №	Структури	Температура плавлення	МС/ЯМР
P1.28		смолоподібна речовина	PX/MC: 423/425 (M+H) ⁺ R _t =1,86 хв
P1.29		130 - 132 °C	PX/MC: 423/425 (M+H) ⁺ R _t =1,86 хв
P1.30			PX/MC: 345 (M+H) ⁺ R _t =1,77 хв
P1.31	 приклад 9	смолоподібна речовина	PX/MC: 415 (M+H) ⁺ R _t =2,00 хв

Таблиця Р2

Фізичні характеристики сполук формули II

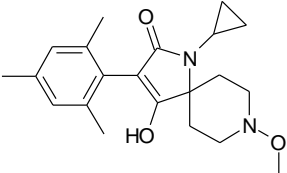
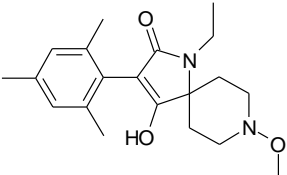
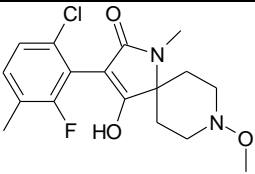
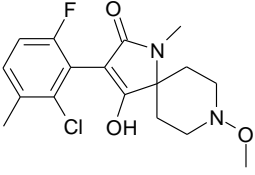
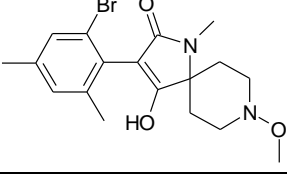
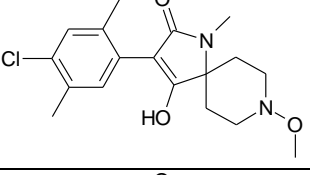
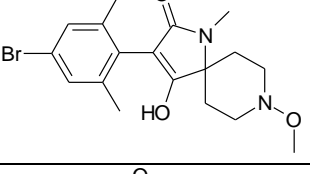
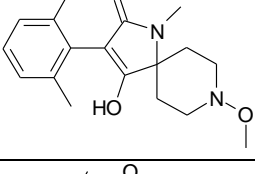
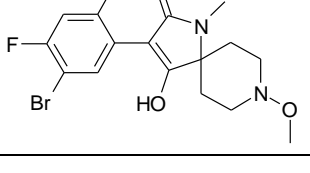
Сполука №	Структури	Температура плавлення	МС/ЯМР
P2.1		121 - 123 °C	PX/MC: 317 (M+H) ⁺ R _t =1,49 хв
P2.2	 приклад 1, стадія 1 приклад 2, стадія 3 приклад 4, стадія 4	241 - 243 °C	PX/MC: 331 (M+H) ⁺ R _t =1,44 хв

Фізичні характеристики сполук формули II

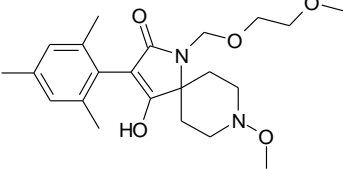
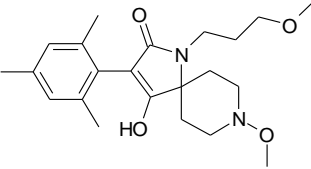
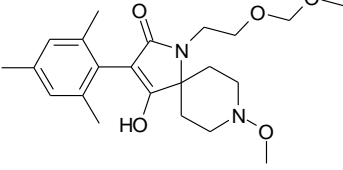
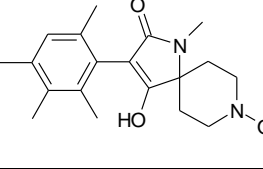
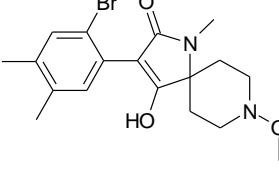
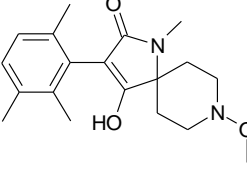
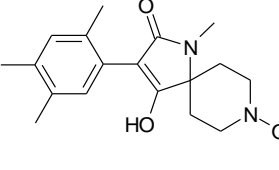
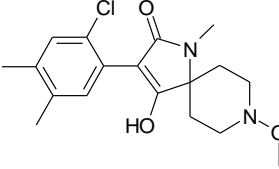
Сполука №	Структури	Температура плавлення	МС/ЯМР
P2.3		тверда речовина	^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3): 1,75 (m, 2H), 2,31 (m, 2H), 2,48 (m, 2H), 3,47 (m, 2H), 3,58 (s, 3H), 3,93 (m, 2H), 5,90 (m, 1H), 6,30 (br s, 1H), 7,25 - 7,32 (m, 2H), 7,40 (m, 1H).
P2.4		тверда речовина	^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3 , тільки окремі сигнали): 3,57 (s, 3H, NOCH_3), 5,85 (m, 1H, CHF_2), 6,52 (br s, 1H), 7,27 - 7,35 (m, 2H, $\text{H}_{\text{ароматичний}}$), 7,49 (d, 1H, $\text{H}_{\text{ароматичний}}$).
P2.5		тверда речовина	^1H -ЯМР (400 МГц, CDCl_3 , тільки окремі сигнали): 2,18 (s, 3H, CH_3 фенілу), 2,31 (s, 3H, CH_3 фенілу), 3,39 (s, 3H, NOCH_3), 5,78 (m, 1H, CHF_2), 6,19 (br s, 1H), 7,00 (s, 1H, $\text{H}_{\text{ароматичний}}$), 7,08 (d, 1H, $\text{H}_{\text{ароматичний}}$), 7,12 (d, 1H, $\text{H}_{\text{ароматичний}}$).
P2.6		205 - 207 °C	PX/MC: 361 (M+H) ⁺ R_t =1,47 хв
P2.7		тверда речовина	PX/MC: 375 (M+H) ⁺ R_t =1,58 хв
P2.8		223 - 225 °C	PX/MC: 371 (M+H) ⁺ R_t =1,76 хв
P2.9		>240 °C	PX/MC: 351/353 (M+H) ⁺ R_t =1,48 хв

приклад 3, стадія 2

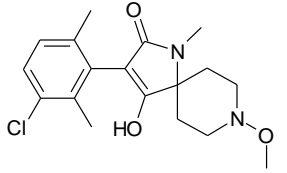
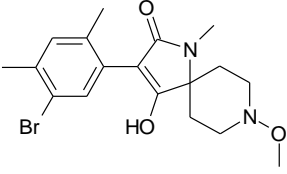
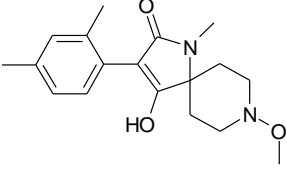
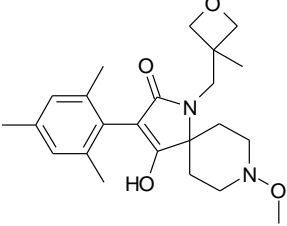
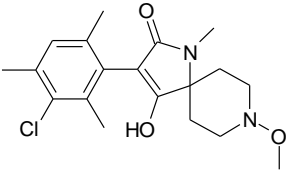
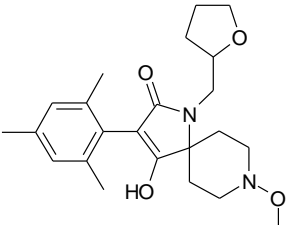
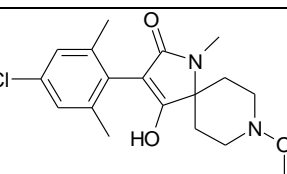
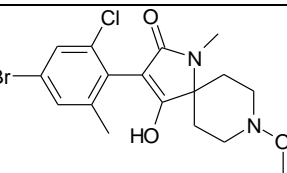
Фізичні характеристики сполук формули II

Сполука №	Структури	Температура плавлення	МС/ЯМР
P2.10		208 - 211 °C	PX/MC: 357 (M+H) ⁺ R _t =1,61 хв
P2.11		218 - 221 °C	PX/MC: 345 (M+H) ⁺ R _t =1,58 хв
P2.12		тверді речовини	PX/MC: 355/357 (M+H) ⁺ R _t =1,52 хв
P2.13		54 - 57 °C	PX/MC: 355/357 (M+H) ⁺ R _t =1,49 хв
P2.14		тверда речовина	PX/MC: 395/397 (M+H) ⁺ R _t =1,48 хв
P2.15		191 - 195 °C	PX/MC: 351/353 (M+H) ⁺ R _t =1,58 хв
P2.16		234 - 235 °C	PX/MC: 395/397 (M+H) ⁺ R _t =1,54 хв
P2.17		202 - 204 °C	PX/MC: 317 (M+H) ⁺ R _t =1,36 хв
P2.18		смолоподібна речовина	PX/MC: 399/401 (M+H) ⁺ R _t =1,54 хв

Фізичні характеристики сполук формули II

Сполука №	Структури	Температура плавлення	МС/ЯМР
P2.19		80 - 82 °C	¹ H-ЯМР (CD ₃ OD, тільки окремі сигнали): 2,12 (s, 6H, CH ₃ мезитилу), 2,27 (s, 3H, CH ₃ мезитилу), 3,37 (s, 3H, CH ₂ CH ₂ OCH ₃), 3,47 (t, 2H, CH ₂ CH ₂ OMe), 3,55 (s, 3H, NOCH ₃), 3,65 (t, 2H, CH ₂ CH ₂ OMe), 6,91 (s, 2H, H _{ароматичний}).
P2.20		79 - 81 °C	PX/MC: 389 (M+H) ⁺ R _t =1,62 хв
P2.21		181 - 183 °C	PX/MC: 405 (M+H) ⁺ R _t =1,60 хв
P2.22		тверда речовина	PX/MC: 345 (M+H) ⁺ R _t =1,55 хв
P2.23		191 - 193 °C	PX/MC: 395/397 (M+H) ⁺ R _t =1,59 хв
P2.24		192 - 194 °C	PX/MC: 331 (M+H) ⁺ R _t =1,41 хв
P2.25		183 - 186 °C	PX/MC: 331 (M+H) ⁺ R _t =1,56 хв
P2.26		191 - 192 °C	PX/MC: 351/353 (M+H) ⁺ R _t =1,60 хв
приклад 7			

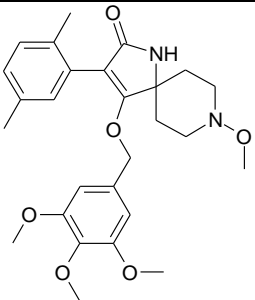
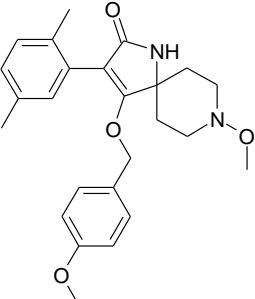
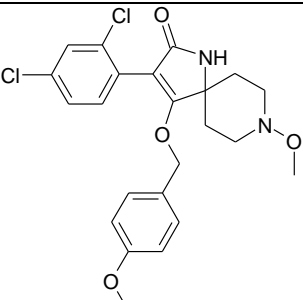
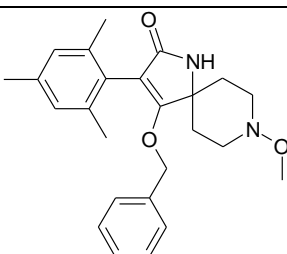
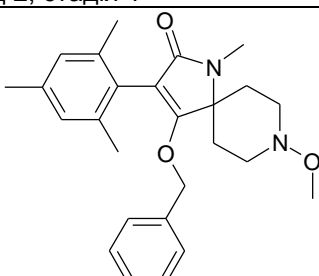
Фізичні характеристики сполук формули II

Сполука №	Структури	Температура плавлення	МС/ЯМР
P2.27		138 - 142 °C	PX/MC: 351/353 (M+H) ⁺ R _t =1,49 хв
P2.28		182 - 183 °C	PX/MC: 395/397 (M+H) ⁺ R _t =1,62 хв
P2.29		тверда речовина	PX/MC: 317 (M+H) ⁺ R _t =1,47 хв
P2.30		180 - 182 °C	PX/MC: 401 (M+H) ⁺ R _t =1,50 хв
P2.31		смолоподібна речовина	PX/MC: 365/367 (M+H) ⁺ R _t =1,59 хв
P2.32		211 - 213 °C	PX/MC: 401 (M+H) ⁺ R _t =1,60 хв
P2.33		тверда речовина	PX/MC: 351/353 (M+H) ⁺ R _t =1,50 хв
P2.34		>200 °C	PX/MC: 415/417/419 (M+H) ⁺ R _t =1,54 хв

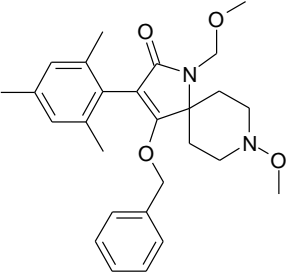
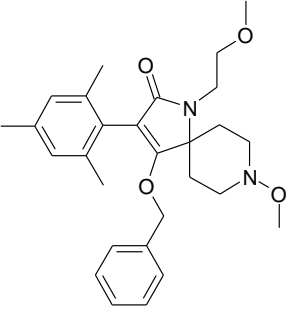
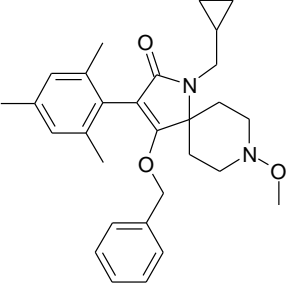
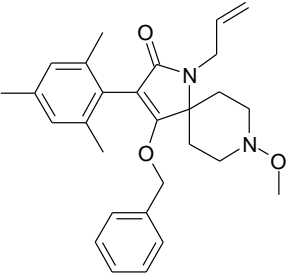
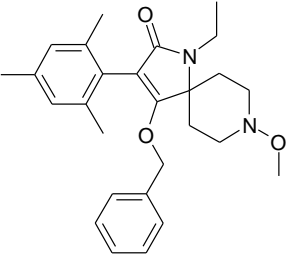
Проміжні продукти формули XIII або XIV, приведені в таблиці Р3, можна одержати за аналогічними методиками

Таблиця Р3

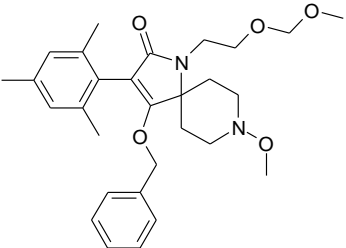
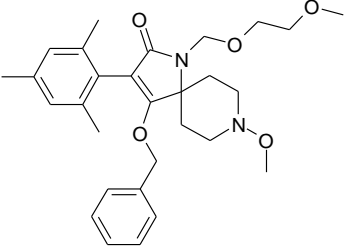
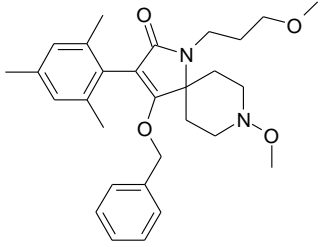
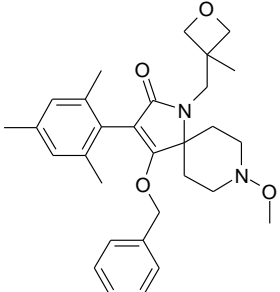
Фізичні характеристики проміжних продуктів формули XIII або XIV

Сполука №	Структури	Температура плавлення	МС/ЯМР
P3.1		128 - 131 °C	дані приведені у WO09/049851
P3.2		180 - 183 °C	дані приведені у WO09/049851
P3.3		111 - 113 °C	дані приведені у WO09/049851
P3.4	 приклад 2, стадія 1	184 - 186 °C	PX/MC: 407 (M+H) ⁺ R _t =2,02 хв
P3.5	 приклад 2, стадія 2	139 - 141 °C	PX/MC: 421 (M+H) ⁺ R _t =2,04 хв

Фізичні характеристики проміжних продуктів формули XIII або XIV

Сполука №	Структури	Температура плавлення	МС/ЯМР
P3.6		тверда речовина	PX/MC: 451 (M+H) ⁺ R _t =2,08 хв
P3.7		тверда речовина	PX/MC: 465 (M+H) ⁺ R _t =2,05 хв
P3.8	 приклад 3, стадія 1	119 - 121 °C	PX/MC: 461 (M+H) ⁺ R _t =2,19 хв
P3.9		134 - 136 °C	PX/MC: 447 (M+H) ⁺ R _t =2,14 хв
P3.10		тверда речовина	PX/MC: 435 (M+H) ⁺ R _t =2,07 хв

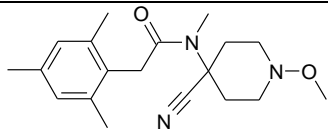
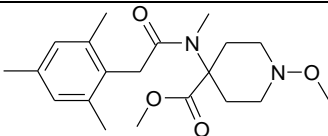
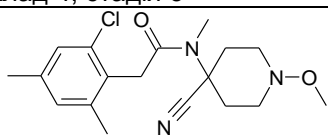
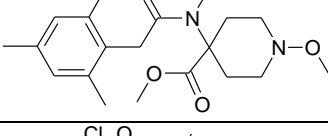
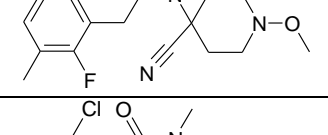
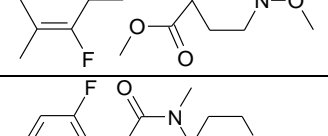
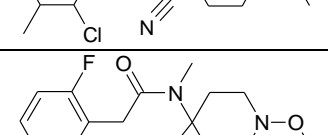
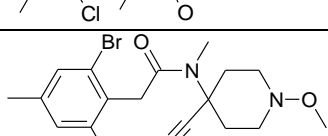
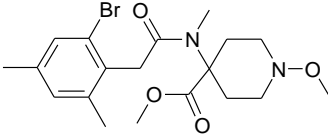
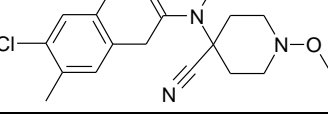

Фізичні характеристики проміжних продуктів формули XIII або XIV

Сполука №	Структури	Температура плавлення	МС/ЯМР
P3.11		90 - 92 °C	PX/MC: 495 (M+H) ⁺ R _t =2,06 хв
P3.12		68 - 70 °C	PX/MC: 495 (M+H) ⁺ R _t =2,05 хв
P3.13		тверда речовина	PX/MC: 479 (M+H) ⁺ R _t =2,07 хв
P3.14			PX/MC: 491 (M+H) ⁺ R _t =2,04 хв

Проміжні продукти формули IV або XI, приведені в таблиці Р4, можна одержати за аналогічними методиками

Таблиця Р4

Фізичні характеристики проміжних продуктів формули IV або XI

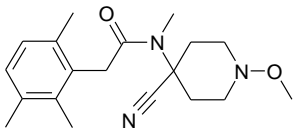
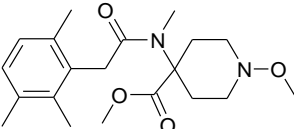
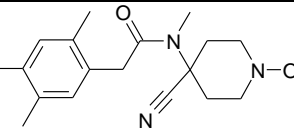
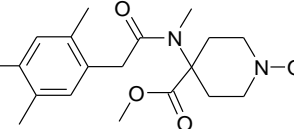
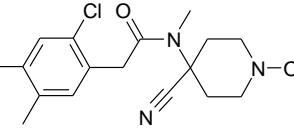
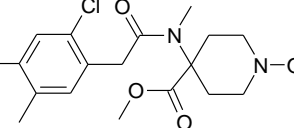
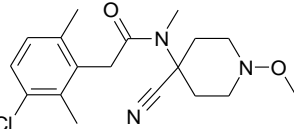
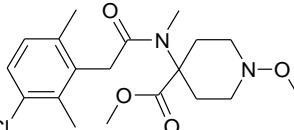
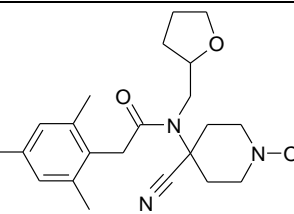
Сполука №	Структури	Температура плавлення	МС/ЯМР
P4.1	 <p>приклад 4, стадія 2</p>	175 - 177 °C	PX/MC: 330 (M+H) ⁺ R _t =1,78 хв
P4.2	 <p>приклад 4, стадія 3</p>	133 - 135 °C	PX/MC: 363 (M+H) ⁺ R _t =1,79 хв
P4.3			PX/MC: 350/352 (M+H) ⁺ R _t =1,78 хв
P4.4			PX/MC: 383/385 (M+H) ⁺ R _t =1,79 хв
P4.5			PX/MC: 354/356 (M+H) ⁺ R _t =1,71 хв
P4.6			PX/MC: 387/389 (M+H) ⁺ R _t =1,73 хв
P4.7			PX/MC: 354/356 (M+H) ⁺ R _t =1,70 хв
P4.8			PX/MC: 387/389 (M+H) ⁺ R _t =1,71 хв
P4.9			PX/MC: 394/396 (M+H) ⁺ R _t =1,78 хв
P4.10			PX/MC: 427/429 (M+H) ⁺ R _t =1,81 хв
P4.11			PX/MC: 350/352 (M+H) ⁺ R _t =1,78 хв

Фізичні характеристики проміжних продуктів формули IV або XI

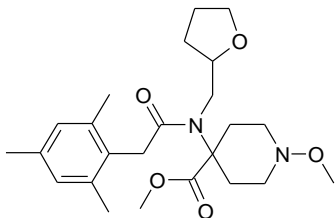
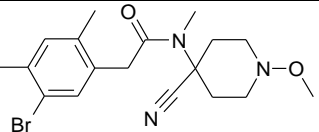
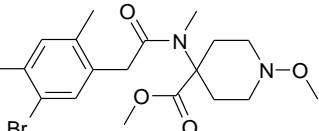
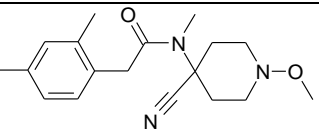
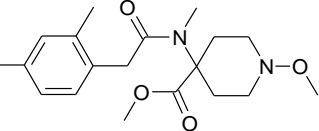
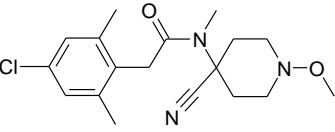
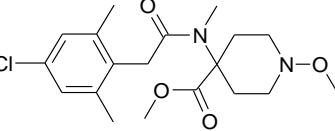
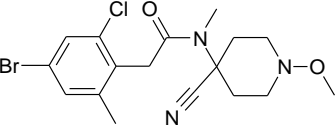
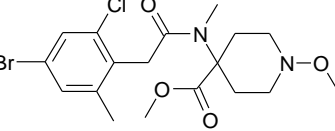
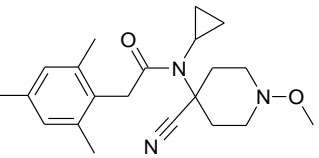
Сполука №	Структури	Температура плавлення	МС/ЯМР
P4.12			PX/MC: 383/385 (M+H) ⁺ R _t =1,78 хв
P4.13		тверда речовина	PX/MC: 394/396 (M+H) ⁺ R _t =1,78 хв
P4.14		тверда речовина	PX/MC: 427/429 (M+H) ⁺ R _t =1,80 хв
P4.15		171 - 174 °C	PX/MC: 316 (M+H) ⁺ R _t =1,64 хв
P4.16		139 - 141 °C	PX/MC: 349 (M+H) ⁺ R _t =1,64 хв
P4.17		смолоподібна речовина	PX/MC: 398/400 (M+H) ⁺ R _t =1,71 хв
P4.18		тверда речовина	PX/MC: 431/433 (M+H) ⁺ R _t =1,75 хв
P4.19			¹ H-ЯМР (CDCl ₃ , тільки окремі сигнали): 3,15 (s, 3H, N-CH ₃), 3,50 (br s, 3H, NOCH ₃), 3,75 (s, 2H, PhCH ₂ CO), 6,89 (s, 1H, H _{ароматичний}).
P4.20			PX/MC: 377 (M+H) ⁺ R _t =1,81 хв
P4.21		смолоподібна речовина	PX/MC: 427/429 (M+H) ⁺ R _t =1,82 хв
P4.22		123 - 126 °C	PX/MC: 394/396 (M+H) ⁺ R _t =1,82 хв

Таблиця Р4

Фізичні характеристики проміжних продуктів формули IV або XI

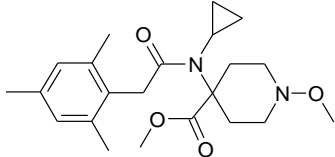
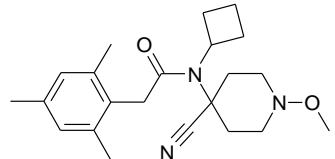
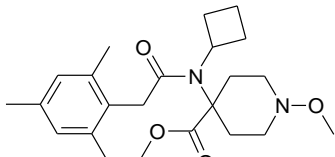
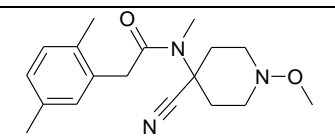
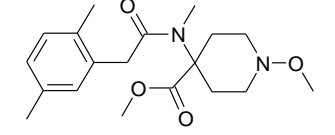
Сполука №	Структури	Температура плавлення	МС/ЯМР
P4.23			^1H -ЯМР (CDCl_3 , тільки окремі сигнали): 2,13 (s, 3H, CH_3 фенілу), 2,22 (s, 3H, CH_3 фенілу), 2,25 (s, 3H, CH_3 фенілу), 3,14 (s, 3H, N- CH_3), 3,51 (br s, 3H, NOCH_3), 3,73 (s, 2H, PhCH_2CO).
P4.24			^1H -ЯМР (CDCl_3 , тільки окремі сигнали): 3,52 (br s, 3H, NOCH_3).
P4.25			PX/MC: 330 (M+H) ⁺ $R_t=1,78$ хв
P4.26			PX/MC: 363 (M+H) ⁺ $R_t=1,77$ хв
P4.27		тверда речовина	PX/MC: 350/352 (M+H) ⁺ $R_t=1,54$ хв
P4.28			
P4.29			
P4.30			
P4.31		134 - 136 °C	PX/MC: 400 (M+H) ⁺ $R_t=1,87$ хв

Фізичні характеристики проміжних продуктів формули IV або XI

Сполука №	Структури	Температура плавлення	МС/ЯМР
P4.32		132 - 134 °C	PX/MC: 433 (M+H) ⁺ R _t =1,87 хв
P4.33		144 - 146 °C	PX/MC: 394/396 (M+H) ⁺ R _t =1,82 хв
P4.34		смолоподібна речовина	PX/MC: 427/429 (M+H) ⁺ R _t =1,84 хв
P4.35		тверда речовина	PX/MC: 316 (M+H) ⁺ R _t =1,66 хв
P4.36		тверда речовина	PX/MC: 349 (M+H) ⁺ R _t =1,67 хв
P4.37		188 - 192 °C	PX/MC: 350/352 (M+H) ⁺ R _t =1,75 хв
P4.38		150 - 152 °C	PX/MC: 383/385 (M+H) ⁺ R _t =1,77 хв
P4.39		тверда речовина	PX/MC: 414/416/418 (M+H) ⁺ R _t =1,78 хв
P4.40		смолоподібна речовина	PX/MC: 447/449/451 (M+H) ⁺ R _t =1,82 хв
P4.41			PX/MC: 356 (M+H) ⁺ R _t =1,87 хв

Таблиця Р4

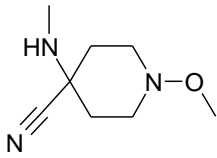
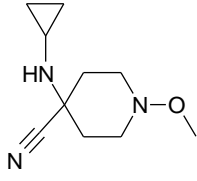
Фізичні характеристики проміжних продуктів формули IV або XI

Сполука №	Структури	Температура плавлення	МС/ЯМР
P4.42			PX/MC: 389 (M+H) ⁺ R _t =1,89 хв
P4.43		смолоподібна речовина	PX/MC: 370 (M+H) ⁺ R _t =1,99 хв
P4.44			
P4.45			
P4.46	 приклад 10, стадія 3	смолоподібна речовина	PX/MC: 349 (M+H) ⁺ R _t =1,66 хв

Проміжні продукти формули V, VII, VIII або IX, приведені у таблиці P5, можна одержати за аналогічними методиками

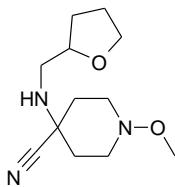
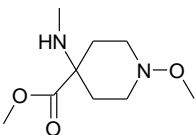
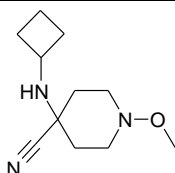
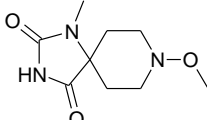
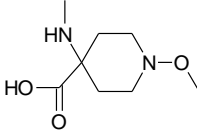
Таблиця Р5

Фізичні характеристики проміжних продуктів формули V, VII, VIII або IX

Сполука №	Структури	Температура плавлення	МС/ЯМР/ІК
P5.1	 приклад 4, стадія 1	рідина	¹ H-ЯМР (CDCl ₃): 1,36 (br s, 1H), 1,62 - 2,22 (широкі сигнали, всього 4H), 2,51 (s, 3H), 2,63 - 3,41 (широкі сигнали, всього 4H), 3,51 (s, 3H), PX/MC (EP+): 170 (M+H) ⁺ ; R _t =0,25 хв
P5.2	 приклад 5		PX/MC: 196 (M+H) ⁺ R _t =1,14 хв ІК (CN): ν 2223 см ⁻¹

Таблиця Р5

Фізичні характеристики проміжних продуктів формули V, VII, VIII або IX

Сполука №	Структури	Температура плавлення	МС/ЯМР/ІК
P5.3		олія	PX/MC: 240 (M+H) ⁺ R _t =1,18 хв
P5.4	 приклад 6, стадія 2 приклад 10, стадія 2	масло	¹ H-ЯМР (CDCl ₃): 1,46 - 2,33 (широкі сигнали, всього 5H), 2,22 (br s, 3H), 2,51 - 3,31 (широкі сигнали, всього 4H), 3,51 (s, 3H), 3,72 (br s, 3H). PX/MC (EP+): 203 (M+H) ⁺ ; R _t =0,20 хв
P5.5			PX/MC: 210 (M+H) ⁺ R _t =1,10 хв (CN): ν 2222 см ⁻¹
P5.6	 приклад 6, стадія 1	тверда речовина	PX/MC: 214 (M+H) ⁺ R _t =0,75 хв
P5.7	 приклад 6, стадія 1	> 250 °C	¹ H-ЯМР (D ₂ O): 1,73 (m, 1H), 2,02 (m, 2H), 2,32 (m, 1H), 2,54 (такий, що здається d, 3H), 2,69 (m, 1H), 2,99 (m, 1H), 3,18 (m, 1H), 3,33 (m, 1H), 3,49 (такий, що здається d, 3H). PX/MC (EP+): 189 (M+H) ⁺ ; R _t =0,21 хв

ПРИКЛАДИ ПРЕПАРАТІВ (% = мас. %)

Приклад F1: Концентрати емульсій	a)	b)	c)
Активний інгредієнт	25 %	40 %	50 %
Додецилбензолсульфонат кальцію	5 %	8 %	6 %
Поліетиленгліколевий простий ефір касторової олії (36 молей EO*)	5 %	-	-
Простий ефір трибутилфеноксиполіетиленгліколю (30 молей EO)	-	12 %	4 %
Циклогексанон	-	15 %	20 %
Суміш ксилолів	65 %	25 %	20 %

*Етиленоксид

- 5 Емульсії будь-якої необхідної концентрації можна приготувати із таких концентратів шляхом розведення водою

Приклад F2: Розчини	a)	b)	c)	d)
Активний інгредієнт	80 %	10 %	5 %	95 %
Монометилловий ефір етиленгліколю	20 %	-	-	-
Поліетиленгліколь ММ* 400	-	70 %	-	-
N-Метилпіролід-2-он	-	20 %	-	-
Епоксидована кокосова олія	-	-	1 %	5 %
Петролейний ефір (діапазон температур кипіння: 160 - 190 °C)	-	-	94 %	-

*Молекулярна маса

Ці розчини придатні для застосування у вигляді мікрокраплин

Приклад F3: Гранули	a)	b)	c)	d)
Активний інгредієнт	5 %	10 %	8 %	21 %
Каолін	94 %	-	79 %	54 %
Високодисперсний діоксид кремнію	1 %	-	13 %	7 %
Атапульгіт	-	90 %	-	18 %

5

Активний інгредієнт розчиняють у дихлорметані, розчин розприскують на носії (носії) і потім розчинник випарюють у вакуумі

Приклад F4: Дисти	a)	b)
Активний інгредієнт	2 %	5 %
Високодисперсний діоксид кремнію	1 %	5 %
Тальк	97 %	-
Каолін	-	90 %

10

Готові для застосування дисти одержують ретельним змішуванням носіїв і активного інгредієнта

Приклад F5: Порошки, що змочуються	a)	b)	c)
Активний інгредієнт	25 %	50 %	75 %
Лігносульфонат натрію	5 %	5 %	-
Лаурилсульфат натрію	3 %	-	5 %
Діізобутилнафталінсульфонат натрію	-	6 %	10 %
Простий ефір октилфеноксиполіетиленгліколю (7 - 8 молей EO)	-	2 %	-
Високодисперсний діоксид кремнію	5 %	10 %	10 %
Каолін	62 %	27 %	-

15

Активний інгредієнт змішують з добавками і суміш ретельно розмелюють на відповідному млині. Це дає порошки, що змочуються, які можна розбавити водою і одержати суспензії будь-якої необхідної концентрації.

Приклад F6: Екструдовані гранули

Активний інгредієнт	10 %
Лігносульфонат натрію	2 %
Карбоксиметилцелюлоза	1 %
Каолін	87 %

20

Активний інгредієнт змішують з добавками і суміш розмелюють, зволожують водою, екструдують, гранулюють і сушать в потоці повітря

Приклад F7: Гранули з покриттям

Активний інгредієнт	3 %
Поліетиленгліколь (ММ 200)	3 %
Каолін	94 %

У зміситель тонкоподрібнений активний інгредієнт рівномірно додають до каоліну, який зволожений полі етиленгліколем. Це дає гранули, які не містять пилу, з покриттям.

Приклад F8a: Концентрат суспензії

Активний інгредієнт	40 %
Етиленгліколь	10 %
Простий ефір нонілфеноксиполіетиленгліколю (15 молей ЕО)	6 %
Лігносульфонат натрію	10 %
Карбоксиметилцелюлоза	1 %
37 % Водний розчин формальдегіду	0,2 %
Силіконова олія (75 % емульсія у воді)	0,8 %
Вода	32 %

Приклад F8b: Концентрат суспензії

Активний інгредієнт	10 %
Натрієва сіль нафталінсульфонової кислоти, сконденсована з формальдегідом	2 %
Розчин привитого акрилового співполімеру у воді і пропіленгліколі	8 %
Силіконова протиспінна емульсія	0,5 %
DL-Пропандіол-(1,2)	3 %
Гетерополісахарид	0,5 %
1,2-Бензизотіазол- 3-он	0,2 %
Вода	75,8 %

5

Тонкоподрібнений активний інгредієнт рівномірно змішують з добавками. Із отриманого суспензійного концентрату шляхом розведення водою можна приготувати суспензії будь-якої необхідної концентрації.

Приклад F9: Порошки для сухої обробки насіння	a)	b)	c)
Активний інгредієнт	25 %	50 %	75 %
Легка хверальна олія	5 %	5 %	5 %
Високодисперсна кремнієва кислота	5 %	5 %	-
Каолін	65 %	40 %	-
Тальк			20 %

10

Активний інгредієнт ретельно змішують із допоміжними речовинами і суміш ретельно розмелюють на відповідному млині і одержують порошки, які можна безпосередньо використовувати для обробки насіння

Приклад F10: Текучий концентрат для обробки насіння

Активний інгредієнт	40 %
Пропіленгліколь	5 %
Сополімер бутанолу з ПО/ЕО*	2 %
Тристирилфенол з 10 - 20 моль ЕО	2 %
1,2-Бензизотіазолін- 3-он (у вигляді 20 % розчину у воді)	0,5 %
Кальцієва сіль моноазопігменту	5 %
Силіконова олія (у вигляді 75 % емульсії у воді)	0,2 %
Вода	45,3 %

* ПО - пропіленоксид, ЕО - етиленоксид

15

Тонкоподрібнений активний інгредієнт рівномірно змішують із допоміжними речовинами і одержують концентрат суспензії, з якого шляхом розведення водою можна приготувати суспензії будь-якої необхідної концентрації. За допомогою таких розведених систем живі рослини, а також матеріал для розмноження рослин можна обробити і захистити від зараження мікроорганізмами шляхом обприскування, поливу або занурення.

20

Приклад F11a: Концентрат суспензії на масляній основі (на основі рослинної олії)

Активний інгредієнт	10 %
Тристирилфенол с 16 моль ЕО	10 %
Блок-сополімер полігідроксистеаринової кислоти і поліалкіленгліколей	2 %
AEROSIL 200	1 %
Метилловий ефір рапсової олії	12 %
Олеїнова кислота	65 %

Приклад F11b: Концентрат суспензії на масляній основі (на основі хверальної олії)

Активний інгредієнт	10 %
Етоксировані спирти C ₁₆ -C ₁₈ і ненасичені C ₁₈	5 %
Са сіль лінійної додецилбензолсульфонової кислоти	2,5 %
Гомополімер 1-етенилгексадецил- 2-піролідинону	1 %
Органофільна глина	1 %
Суміш нафтових фракцій	80,5 %

5 Тонкоподрібнений активний інгредієнт рівномірно змішують з добавками із отриманого концентрату суспензії шляхом розведення водою можна приготувати суспензії будь-якої необхідної концентрації.

Бажано, якщо термін "активний інгредієнт", який використовується вище, означає одну із сполук, вибрану із приведених вище таблиць 1 – 116. Цей термін також означає суміші сполуки формули I, бажано сполуки, вибраної із зазначених таблиць 1 - 116, з іншими інсектицидами, фунгіцидами, гербіцидами, антидотами, допоміжними речовинами і т.п., такі суміші докладно описані вище.

БІОЛОГІЧНІ ПРИКЛАДИ

Ці приклади ілюструють пестицидні/інсектицидні характеристики сполук формули I

15 Приклад В1: Активність по відношенню до *Myzus persicae* (попелиця персикова) (змішана популяція, активність при поїданні/залишкова контактна активність, профілактична обробка).

Диски із листя соняшника поміщають на агар в 24-лункові планшети для мікротитрування і обприскують досліджуваними розчинами. Після сушки диски із листя заражають популяцією тлі змішаного віку. Після інкубаційного періоду тривалістю 6 днів зразки досліджують на загибель комах і наявність спеціальних ефектів (наприклад, фітотоксичності).

20 В цьому дослідженні сполуки, зазначені в приведених вище таблицях, виявляють хорошу активність. Зокрема, сполуки P1.2, P1.3, P1.4, P1.6, P1.7, P1.11, P1.12, P1.13, P1.16, P1.17, P1.18, P1.25, P1.27, P1.29, P2.2, P2.4, P2.6, P2.7, P2.9, P2.10, P2.14, P2.16, P2.17, P2.19, P2.20, P2.21, P2.31 і P2.33 виявляють активність, яка перевищує 80 %, при концентрації, яка дорівнює 400 част./млн..

25 Приклад В2: Активність по відношенню до *Myzus persicae* (попелиця персикова) (змішана популяція, системна активність/активність при поїданні, лікувальний вплив).

Корні розсади гороху, заражені популяцією попелиці змішаного віку, поміщають безпосередньо в досліджуваний розчин. Через 6 днів зразки досліджують на загибель комах і спеціальні ефекти впливу на рослини.

30 В цьому дослідженні сполуки, зазначені в приведених вище таблицях, виявляють хорошу активність. Зокрема, сполуки P1.2, P1.3, P1.4, P1.10, P1.11, P1.17, P1.18, P2.2, P2.6, P2.9, P2.16, P2.19, P2.20, P2.21 і P2.31 виявляють активність, яка перевищує 80 %, при концентрації, яка дорівнює 400 част./млн..

35 Приклад В3: Активність по відношенню до *Thrips tabaci* (трипс цибульний) (змішана популяція, активність при поїданні/залишкова контактна активність, профілактична обробка).

Диски із листя соняшника поміщають на агар в 24-лункові планшети для мікротитрування і обприскують досліджуваними розчинами. Після сушки диски із листя заражають популяцією трипсів змішаного віку. Після інкубаційного періоду тривалістю 6 днів зразки досліджують на загибель комах і наявність спеціальних ефектів (наприклад, фітотоксичності).

40 У цьому дослідженні сполуки, зазначені у приведених вище таблицях, виявляють хорошу активність. Зокрема, сполуки P1.2, P1.3, P1.18, P1.28, P2.2, P2.6, P2.19, P2.20, P3.1, P3.2 і P3.4 виявляють активність, яка перевищує 80 %, при концентрації, яка дорівнює 400 част./млн..

45 Приклад В4: Активність по відношенню до *Tetranychus urticae* (кліщ дволямистий павутинний) (змішана популяція, активність при поїданні/залишкова контактна активність, профілактична обробка).

Диски із листя бобів поміщають на агар в 24-лункові планшети для мікротитрування і обприскують досліджуваними розчинами. Після сушки диски із листя заражають популяцією кліщів змішаного віку. Через 8 днів диски досліджують на загибель яєць, загибель личинок і загибель дорослих особин.

5 В цьому дослідженні сполуки, зазначені у приведених вище таблицях, виявляють хорошу активність. Зокрема, сполуки P1.2, P1.3, P1.5, P1.6, P1.9, P1.12, P1.16, P1.18, P1.21, P1.25, P1.26, P2.2, P2.6, P2.9, P2.13, P2.14, P2.15, P2.19, P2.20, P2.21, P2.31, P2.32, P3.4 і P3.8 виявляють активність, яка перевищує 80 %, при концентрації, яка дорівнює 400 част./млн..

10 Приклад B5: Активність по відношенню до *Plutella xylostella* (моль капустяна): (ларвіцид, активність при поїданні/залишкова контактна активність, профілактична обробка).

24-лункові планшети для мікротитрування (ПМТ) з штучним кормом за допомогою піпетки обробляють досліджуваними розчинами. Після сушки ПМТ заражають личинками (L2) (10 - 15 на лунку). Після інкубаційного періоду тривалістю 5 днів зразки досліджують на загибель личинок, захист від поїдання і регулювання росту.

15 В цьому дослідженні сполуки, зазначені в приведених вище таблицях, виявляють хорошу активність. Зокрема, сполуки P1.3, P1.12, P2.5 і P2.6 виявляють активність, яка перевищує 80 %, при концентрації, яка дорівнює 400 част./млн..

Приклад B6: Активність по відношенню до *Frankliniella occidentalis* (трипс квітковий західний):

20 Диски із листя бобів, поміщені на агар в чашки Петри, або рослини бобів обробляють у камері для обприскування розведеними досліджуваними розчинами. Після сушки диски із листя нарізають і поміщають в пластмасові чашки на поверхню шару агару і заражають популяцією змішаного віку. Через 6 днів (диски із листя) або 14 днів (рослини) після зараження зразки досліджують на скорочення обробленої популяції і порівнюють з неопрацьованою популяцією.

25 У цьому дослідженні сполуки, зазначені в приведених вище таблицях, виявляють хорошу активність. Наприклад, сполуки P1.2, P1.4, P1.18, P2.2 і P2.7 виявляють активність, яка перевищує 80 %, при концентрації, яка дорівнює 400 част./млн..

Приклад B7: Активність по відношенню до *Bemisia tabaci* (тютюнова білокрилка): (ларвіцид, контактна активність/активність при поїданні).

30 Рослини бобів заражають 20 - 30 дорослими комахами, яких виймають через 4 дні після кладки яєць. Ще через 7 днів рослини бобів з личинками, які вилупилися (N-2) обробляють (дослідження проводять двічі) досліджуваними розчинами у камері для обприскування. Через 3 тижні зразки досліджують на кількість дорослих комах, що вилупилися. Ефективність оцінюють шляхом зіставлення кількості дорослих комах, які вилупилися в оброблених і необроблених зразках.

35 В цьому дослідженні сполуки, зазначені в приведених вище таблицях, виявляють хорошу активність. Наприклад, сполуки P1.2, P1.3, P1.4, P2.2, P2.6 і P2.7 виявляють активність, яка перевищує 80 %, при концентрації, яка дорівнює 200 част./млн..

Приклад B8: Активність по відношенню до *Nilaparvata lugens* (коричнева рисова блішка): (ларвіцид, активність при поїданні/контактна активність).

40 Розсаду рису обробляють у камері для обприскування розведеними досліджуваними розчинами. Після сушки їх заражають 20 N₃ німфами (дослідження проводять двічі). Через 6 - 12 днів після обробки зразки досліджують на загибель комах, регулювання росту і впливу на покоління F₁.

45 У цьому дослідженні сполуки, зазначені в приведених вище таблицях, виявляють хорошу активність. Наприклад, сполуки P1.2, P1.3, P1.4, P1.5, P1.11, P1.18, P2.2, P2.6, P2.7, P2.14 і P2.19 виявляють активність, яка перевищує 80 %, при концентрації, яка дорівнює 400 част./млн..

Приклад B9: Активність по відношенню до *Aphis craccivora* (попелиця люцернова): (змішана популяція, контактна активність/активність при поїданні).

50 Розсаду гороху, заражену популяцією попелиці змішаного віку, обробляють (дослідження проводять двічі) розведеними досліджуваними розчинами у камері для обприскування. Через 6 днів після обробки зразки досліджують на загибель комах.

55 У цьому дослідженні сполуки, зазначені в приведених вище таблицях, виявляють хорошу активність. Наприклад, сполуки P1.3, P1.18, P2.14 і P2.19 виявляють активність, яка перевищує 80 %, при концентрації, яка дорівнює 400 част./млн..

Приклад B10: Активність по відношенню до *Aphis craccivora* (попелиця люцернова): (змішана популяція, системна активність/активність при поїданні).

60 Корені розсади гороху, заражені популяцією попелиці змішаного віку, поміщають (дослідження проводять двічі) безпосередньо у досліджуваний розчин. Через 6 днів зразки досліджують на загибель комах.

В цьому дослідженні сполуки, зазначені в приведених вище таблицях, виявляють хорошу активність. Наприклад, сполуки P1.2, P1.3, P1.4, P1.11, P1.18, P2.2, P2.6, P2.7, P2.14 і P2.19 виявляють активність, яка перевищує 80 %, при концентрації, яка дорівнює 400 част./млн..

Приклад B11: Активність по відношенню до *Aphis craccivora* (попелиця люцернова) при впливі через листя

На зворотну сторону листя квасолі звичайної (*Phaseolus vulgaris*) поміщають приблизно 20 різновікових особин і їх утримують сточатими затискачами. Через 1 день після зараження лицьові сторони листя обробляють досліджуваним розчином шляхом намазування. Ще через 5 днів зразки досліджують на загибель комах.

В цьому дослідженні сполуки, зазначені в приведених вище таблицях, виявляють хорошу активність. Наприклад, сполуки P1.2, P1.3, P1.4, P1.5, P1.11, P1.18, P2.2, P2.6, P2.7, P2.14 і P2.19 виявляють активність, яка перевищує 80 %, при концентрації, яка дорівнює 400 част./млн..

Приклад B12: Активність по відношенню до *Aonidiella aurantii* (щитівка червона померанцева)

Бульби картоплі обробляють шляхом занурення в досліджуваний розчин. Через 1 день бульби заражають приблизно 50 гусеницями. Через 6 - 8 тижнів після нанесення на зразках визначають кількість гусениць наступного покоління (при співставленні з необробленими зразками).

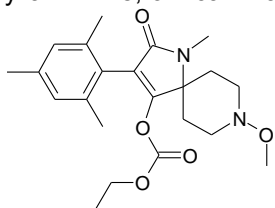
У цьому дослідженні сполуки, зазначені у приведених вище таблицях, виявляють хорошу активність. Наприклад, сполуки P1.3, P1.4, P2.2, P2.6 і P2.7 виявляють активність, яка перевищує 80 %, при концентрації, яка дорівнює 200 част./млн..

Приклад B13: Активність по відношенню до *Myzus persicae* (попелиця персикова) при поливі ґрунту.

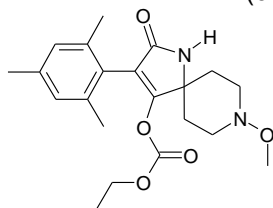
Розсаду гороху, вирощену в ґрунті у польових умовах, обробляють шляхом поливу ґрунту і заражають популяцією *M. persicae* змішаного віку. Через 7 днів після зараження зразки досліджують на загибель комах.

В цьому дослідженні сполуки, зазначені в приведених вище таблицях, виявляють хорошу активність. Наприклад, сполуки P1.2, P1.3, P1.4, P1.11, P1.18, P2.2, P2.6, P2.7, P2.14 і P2.19 виявляють активність, яка перевищує 80 %, при концентрації, яка дорівнює 25 част./млн..

Приклад B14: Співставлення інсектицидної активності і переносимості культурами сполук, запропонованих у даному винаході, і структурно найбільш близької сполуки попереднього рівня техніки (сполука № A18, описані на стор 97 у WO09/049851):



(сполука № P1.2, запропонована у даному винаході)



(сполука № A18, яка відповідає рівню техніки)

Активність по відношенню до *Myzus persicae* (попелиця персикова) при поливі ґрунту (змішана популяція, обробка шляхом поливу ґрунту, стійкість, оцінка пошкодження рослин).

6-Тижневі рослини перцю, вирощені в ґрунті у польових умовах, обробляють шляхом поливу ґрунту при різних нормах витрати (мг АІ/л ґрунту). В цей же день рослини заражають популяцією *M. persicae* змішаного віку і інкубують в теплиці при оптимальних умовах. Через 7 днів після зараження зразки досліджують на загибель комах. Оброблені рослини повторно заражають через 7, 14, 21 і 28 днів після обробки. Оцінку проводять завжди через 7 днів після зараження. Рослини також досліджують на пошкодження (фітотоксичність), результат оцінюють візуально за шкалою 0 - 100 % (100 % = повне пошкодження рослини; 0 % = відсутність пошкодження рослини).

Результати приведені у таблиці Table B14:

Таблиця В14

Активність по відношенню до *Myzus persicae* (попелиця персикова) і пошкодження рослин перцю

Сполука:	Концентрація (част./млн)	Частка загиблих комах (%) через xx днів після обробки (полив, системний вплив, стійкість)					Пошкодження (%) рослин перцю через xx днів після обробки				
		0	7	14	21	28	0	7	14	21	28
A18 (сполука, яка відповідає рівню техніки)	12,5	100	100	98	95	95	40	70	85	85	85
P1.2 (сполука, запропонована в даному винаході)	12,5	98	98	98	100	98	0	0	0	0	0

Дані, приведені в таблиці В14, показують, що сполука № P1.2, запропонована в даному винаході, виявляє інсектицидний вплив на *Myzus persicae*, який є дуже подібним з впливом сполуки, яка відповідає рівню техніки. Однак, сполука P1.2 значно краще переноситься рослинами, що проявляється у повній відсутності пошкодження рослин перцю, тоді як ступінь пошкодження, наносимого сполукою A18, є неприйнятно високим.

Приклад В15: Активність по відношенню до *Aphis craccivora* (попелиця люцернова) (змішана популяція, вплив допоміжної речовини, лікувальний вплив).

Рослини кормових бобів заражають більшою кількістю популяції попелиці змішаного віку. Через 1 день після зараження рослини в камері для обприскування обробляють розведеними досліджуваними розчинами сполуки, приготовленими як ЕС050 (дослідження проводять 4 рази). До розчину для обприскування необов'язково додають 0,1 % (об./об.) допоміжної речовини. Через 7 днів після обробки зразки досліджують на загину комах. Ефективність розраховують за формулою Аббота.

Результати приведені у таблицях В15А і В15В:

Таблиця В15А

Активність по відношенню до *Aphis craccivora* (попелиця люцернова)

Сполука:	Концентрація (част./млн)	Ефективність по Абботту (%) по відношенню до <i>Aphis craccivora</i>
P1.2, без допоміжної речовини	3	54
P1.2+Merge	3	51
P1.2 + Нітрат амонію	3	79
P1.2+Mero	3	64
P1.2+Adigor	3	99

Merge (реєстраційний номер CAS 147230 - 14 - 6) являє собою суміш суміші поверхнево-активних речовин і розчинника (вуглеводні нафти).

Нітрат амонію: "Ammonsalpeter", азотовмісне добриво, використовують композицію із вмістом азоту (N), що дорівнює 27 % (50 % N міститься у йоні амонію і 50 % N у нітрат-іоні).

Меро (реєстраційний номер CAS 85586 - 25 - 0) являє собою допоміжну речовину на основі метилового ефіру рапсової олії.

Adigor (реєстраційний номер CAS 1103981 - 66 - 3) являє собою допоміжну речовину на основі метилового ефіру рапсової олії.

Таблиця В15В

Активність по відношенню до *Aphis craccivora* (попелиця люцернова)

Сполука:	Концентрація (част./млн)	Ефективність по Абботту (%) по відношенню до <i>Aphis craccivora</i>
P1.2, без допоміжної речовини	3	25
P1.2+Agnique ME CSO 10	3	53
P1.2+Break Thru S 233	3	77
P1.2+RME	3	73

Agnique ME CSO 10 являє собою допоміжну речовину на основі етоксилату метилірованої касторової олії.

Break Thru S 233 являє собою допоміжну речовину на основі модифікованого простим поліефіром полісилоксану.

RME являє собою метиловий ефір рапсової олії.

Дані, приведені в таблицях В15А і В15В, показують, що допоміжні речовини, які належать до різних хімічних класів, такі як, але не обмежені тільки ними, поверхнево-активні речовини з додаванням або без додавання розчинника, рослинні олії, добрива, амонієві солі або модифіковані поліалкілоксидом полісилоксани, здатні значно посилювати інсектицидну активність сполуки P1.2.

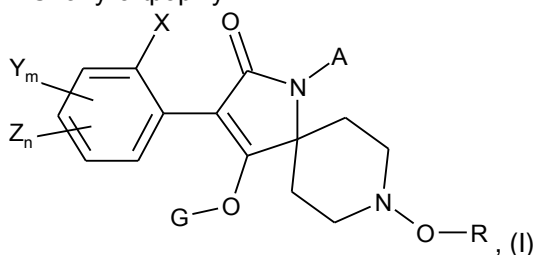
Приклад В16: Активність по відношенню до *Myzus persicae* (попелиця персикова) (змішана популяція, активність при поїданні/залишкова контактна активність, оцінка пошкодження рослин).

Рослини перцю, заражені змішаною популяцією *Myzus persicae*, обробляють у камері для обприскування розведеними досліджуваними розчинами сполук. Через 6 днів після обробки зразки досліджують на загибель комах і пошкодження рослин (фітотоксичність), результат оцінюють візуально за шкалою 0 - 100 % (100 % = повне пошкодження рослини; 0 % = відсутність пошкодження рослини).

В цьому дослідженні сполуки, зазначені в приведених вище таблицях, виявляють хорошу активність по відношенню до *Myzus persicae* і прийнятну переносимість рослинами. Наприклад, сполуки P1.2, P1.4, P1.5, P1.11, P1.12, P1.13, P1.15, P1.16, P1.21, P1.25, P1.27, P1.29, P2.2, P2.6, P2.16, P2.17, P2.21, P2.24, P2.27, P2.30, P2.31, P2.33 і P2.34 виявляють активність, яка перевищує 80 %, по відношенню до *Myzus persicae* і пошкодження рослин перцю, менше або таке, що дорівнює 10 %, при концентрації, яка дорівнює 200 част./млн..

ФОРМУЛА ВИНАХОДУ

1. Сполука формули I



в якій

X, Y і Z незалежно один від одного означають C₁-C₄-алкіл, C₃-C₆-циклоалкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-алкоксигрупу, галоген, феніл або феніл, який містить як замісники C₁-C₄-галогеналкіл, галоген або ціаногрупу;

m і n незалежно один від одного дорівнюють 0, 1, 2 або 3 і m+n дорівнює 0, 1, 2 або 3;

G означає водень, метал, амоній, сульфоній або захисну групу, вибрану з групи, яка включає C₁-C₈-алкіл, C₂-C₈-галогеналкіл, феніл-C₁-C₈-алкіл (де феніл необов'язково може містити як замісники C₁-C₃-алкіл, C₁-C₃-галогеналкіл, C₁-C₃-алкоксигрупу, C₁-C₃-галогеналкоксигрупу, C₁-C₃-алкілтіогрупу, C₁-C₃-алкілсульфініл, C₁-C₃-алкілсульфоніл, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу), гетероарил-C₁-C₈-алкіл (де гетероарил необов'язково може містити як замісники C₁-C₃-алкіл, C₁-C₃-галогеналкіл, C₁-C₃-алкоксигрупу, C₁-C₃-галогеналкоксигрупу, C₁-C₃-алкілтіогрупу, C₁-C₃-алкілсульфініл, C₁-C₃-алкілсульфоніл, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу),

С₃-С₈-алкеніл, С₃-С₈-галогеналкеніл, С₃-С₈-алкініл, C(X^a)-R^a, C(X^b)-X^c-R^b, C(X^d)-N(R^c)-R^d, -SO₂-R^e, -P(X^e)(R^f)-R^g або CH₂-X^f-R^h, де X^a, X^b, X^c, X^d, X^e і X^f незалежно один від одного означають кисень або сірку;

R^a означає H, C_1 - C_{18} -алкіл, C_2 - C_{18} -алкеніл, C_2 - C_{18} -алкініл, C_1 - C_{10} -галогеналкіл, C_1 - C_{10} -ціаноалкіл,

5 С₁-С₁₀-нітроалкіл, С₁-С₁₀-аміноалкіл, С₁-С₅-алкіламіно-С₁-С₅-алкіл, С₂-С₈-діалкіламіно-С₁-С₅-
алкіл, С₃-С₇-циклоалкіл-С₁-С₅-алкіл, С₁-С₅-алкоксі-С₁-С₅-алкіл, С₃-С₅-алкенілоксі-С₁-С₅-алкіл, С₃-
С₅-алкініл-С₁-С₅-оксіалкіл, С₁-С₅-алкілтіо-С₁-С₅-алкіл, С₁-С₅-алкілсульфініл- С₁-С₅-алкіл, С₁-С₅-
алкілсульфоніл-С₁-С₅-алкіл, С₂-С₈-алкіліденамінооксі-С₁-С₅-алкіл, С₁-С₅-алкілкарбоніл-С₁-С₅-
алкіл, С₁-С₅-алкоксикарбоніл-С₁-С₅-алкіл, амінокарбоніл-С₁-С₅-алкіл, С₁-С₅-алкіламінокарбоніл-
10 С₁-С₅-алкіл, С₂-С₈-діалкіламінокарбоніл-С₁-С₅-алкіл, С₁-С₅-алкілкарбоніламіно-С₁-С₅-алкіл, N-С₁-
С₅-алкілкарбоніл-N-С₁-С₅-алкіламіно-С₁-С₅-алкіл, С₃-С₆-триалкілсиліл-С₁-С₅-алкіл, феніл-С₁-С₅-
алкіл (де феніл необов'язково може містити як замісники С₁-С₃-алкіл, С₁-С₃-галогеналкіл, С₁-С₃-
алкоксигрупу, С₁-С₃-галогеналкоксигрупу, С₁-С₃-алкілтіогрупу, С₁-С₃-алкілсульфініл, С₁-С₃-
алкілсульфоніл, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу), гетероарил-С₁-С₅-алкіл, (де гетероарил
15 необов'язково може містити як замісники С₁-С₃-алкіл, С₁-С₃-галогеналкіл, С₁-С₃-алкоксигрупу,
С₁-С₃-галогеналкоксигрупу, С₁-С₃-алкілтіогрупу, С₁-С₃-алкілсульфініл, С₁-С₃-алкілсульфоніл,
галоген, ціаногрупу або нітрогрупу), С₂-С₅-галогеналкеніл, С₃-С₈-циклоалкіл, феніл або феніл,
який містить як замісники С₁-С₃-алкіл, С₁-С₃-галогеналкіл, С₁-С₃-алкоксигрупу, С₁-С₃-
галогеналкоксигрупу, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу, гетероарил або гетероарил, який
20 містить як замісники С₁-С₃-алкіл, С₁-С₃-галогеналкіл, С₁-С₃-алкоксигрупу, С₁-С₃-
галогеналкоксигрупу, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу,

R^b означає C₁-C₁₈-алкніл, C₃-C₁₈-алкеніл, C₃-C₁₈-алкініл, C₂-C₁₀-галогеналкіл, C₁-C₁₀-ціаноалкіл, C₁-C₁₀-нітроалкіл, C₂-C₁₀-аміноалкіл, C₁-C₅-алкіламіно-C₁-C₅-алкіл, C₂-C₈-діалкіламіно-C₁-C₅-алкіл, C₃-C₇-циклоалкіл-C₁-C₅-алкіл, C₁-C₅-алкокси-C₁-C₅-алкіл, C₃-C₅-алкенілокси-C₁-C₅-алкіл, C₃-C₅-алкінілокси-C₁-C₅-алкіл, C₁-C₅-алкілтіо-C₁-C₅-алкіл, C₁-C₅-алкілсульфініл-C₁-C₅-алкіл, C₁-C₅-алкілсульфоніл-C₁-C₅-алкіл, C₂-C₈-алкіліденаміноокси-C₁-C₅-алкіл, C₁-C₅-алкілкарбоніл-C₁-C₅-алкіл, C₁-C₅-алкоксикарбоніл-C₁-C₅-алкіл, амінокарбоніл-C₁-C₅-алкіл, C₁-C₅-алкіламінокарбоніл-C₁-C₅-алкіл, C₂-C₈-діалкіламінокарбоніл-C₁-C₅-алкіл, C₁-C₅-алкілкарбоніламіно-C₁-C₅-алкіл, N-C₁-C₅-алкілкарбоніл-N-C₁-C₅-алкіламіно-C₁-C₅-алкіл, C₃-C₆-триалкілсиліл-C₁-C₅-алкіл, феніл-C₁-C₅-алкіл (де феніл необов'язково може містити як замісники C₁-C₃-алкіл, C₁-C₃-галогеналкіл, C₁-C₃-алкоксигрупу, C₁-C₃-галогеналкоксигрупу, C₁-C₃-алкілтіогрупу, C₁-C₃-алкілсульфініл, C₁-C₃-алкілсульфоніл, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу), гетероарил-C₁-C₅-алкіл, (де гетероарил необов'язково може містити як замісники C₁-C₃-алкіл, C₁-C₃-галогеналкіл, C₁-C₃-алкоксигрупу, C₁-C₃-галогеналкоксигрупу, C₁-C₃-алкілтіогрупу, C₁-C₃-алкілсульфініл, C₁-C₃-алкілсульфоніл, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу), C₃-C₅-галогеналкеніл, C₃-C₈-циклоалкіл, феніл або феніл, який містить як замісники C₁-C₃-алкіл, C₁-C₃-галогеналкіл, C₁-C₃-алкоксигрупу, C₁-C₃-галогеналкоксигрупу, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу, гетероарил або гетероарил, який містить як замісники C₁-C₃-алкіл, C₁-C₃-галогеналкіл, C₁-C₃-алкоксигрупу, C₁-C₃-галогеналкоксигрупу, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу,

40 R^c і R^d всі незалежно один від одного означають водень, C_1 - C_{10} -алкіл, C_3 - C_{10} -алкеніл, C_3 - C_{10} -алкініл, C_2 - C_{10} -галогеналкіл, C_1 - C_{10} -ціаноалкіл, C_1 - C_{10} -нітроалкіл, C_1 - C_{10} -аміноалкіл, C_1 - C_5 -алкіламіно- C_1 - C_5 -алкіл, C_2 - C_8 -діалкіламіно- C_1 - C_5 -алкіл, C_3 - C_7 -циклоалкіл- C_1 - C_5 -алкіл, C_1 - C_5 -алкокси- C_1 - C_5 -алкіл, C_3 - C_5 -алкенілокси- C_1 - C_5 -алкіл, C_3 - C_5 -алкінілокси- C_1 - C_5 -алкіл, C_1 - C_5 -алкілтіо- C_1 - C_5 -алкіл, C_1 - C_5 -алкілсульфініл- C_1 - C_5 -алкіл, C_1 - C_5 -алкілсульфоніл- C_1 - C_5 -алкіл, C_2 - C_8 -
45 алкіліденаміноокси- C_1 - C_5 -алкіл, C_1 - C_5 -алкілкарбоніл- C_1 - C_5 -алкіл, C_1 - C_5 -алкоксикарбоніл- C_1 - C_5 -алкіл, амінокарбоніл- C_1 - C_5 -алкіл, C_1 - C_5 -алкіламінокарбоніл- C_1 - C_5 -алкіл, C_2 - C_8 -діалкіламінокарбоніл- C_1 - C_5 -алкіл, C_1 - C_5 -алкілкарбоніламіно- C_1 - C_5 -алкіл, N- C_1 - C_5 -алкілкарбоніл-
N- C_2 - C_5 -алкіламіноалкіл, C_3 - C_6 -триалкілсиліл- C_1 - C_5 -алкіл, феніл- C_1 - C_5 -алкіл (де феніл
50 необов'язково може містити як замісники C_1 - C_3 -алкіл, C_1 - C_3 -галогеналкіл, C_1 - C_3 -алкоксигрупу, C_1 - C_3 -галогеналкоксигрупу, C_1 - C_3 -алкілтіогрупу, C_1 - C_3 -алкілсульфініл, C_1 - C_3 -алкілсульфоніл, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу), гетероарил- C_1 - C_5 -алкіл, (де гетероарил необов'язково може
містити як замісники C_1 - C_3 -алкіл, C_1 - C_3 -галогеналкіл, C_1 - C_3 -алкоксигрупу, C_1 - C_3 -галогеналкоксигрупу, C_1 - C_3 -алкілтіогрупу, C_1 - C_3 -алкілсульфініл, C_1 - C_3 -алкілсульфоніл, галоген,
55 ціаногрупу або нітрогрупу), C_2 - C_5 -галогеналкеніл, C_3 - C_8 -циклоалкіл, феніл або феніл, який містить як замісники C_1 - C_3 -алкіл, C_1 - C_3 -галогеналкіл, C_1 - C_3 -алкоксигрупу, C_1 - C_3 -галогеналкоксигрупу, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу, гетероарил або гетероарил, який
містить як замісники C_1 - C_3 -алкіл, C_1 - C_3 -галогеналкіл, C_1 - C_3 -алкоксигрупу, C_1 - C_3 -галогеналкоксигрупу, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу, гетероариламіногрупу або
гетероариламіногрупу, яка містить як замісники C_1 - C_3 -алкіл, C_1 - C_3 -галогеналкіл, C_1 - C_3 -
60 алкоксигрупу, C_1 - C_3 -галогеналкоксигрупу, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу,

[illegible]

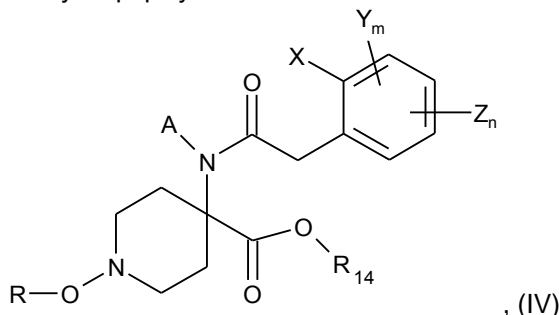
С₃-галогеналкіл, С₁-С₃-алкоксигрупу, С₁-С₃-галогеналкоксигрупу, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу, феніламіногрупу або феніламіногрупу, яка містить як замісники С₁-С₃-алкіл, С₁-С₃-галогеналкіл, С₁-С₃-алкоксигрупу, С₁-С₃-галогеналкоксигрупу, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу, дифеніламіногрупу або дифеніламіногрупу, яка містить як замісники С₁-С₃-алкіл, С₁-С₃-галогеналкіл, С₁-С₃-алкоксигрупу, С₁-С₃-галогеналкоксигрупу, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу, або С₃-С₇-циклоалкіламіногрупу, ди-С₃-С₇-циклоалкіламіногрупу або С₃-С₇-циклоалкоксигрупу, С₁-С₁₀-галогеналкоксигрупу, С₁-С₅-алкіламіногрупу або С₂-С₈-діалкіламіногрупу, бензилоксигрупу або феноксигрупу, де бензильні і фенільні групи, в свою чергу, можуть містити як замісники С₁-С₃-алкіл, С₁-С₃-галогеналкіл, С₁-С₃-алкоксигрупу, С₁-С₃-галогеналкоксигрупу, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу, і

Rⁿ означає С₁-С₁₀-алкіл, С₃-С₁₀-алкеніл, С₃-С₁₀-алкініл, С₁-С₁₀-галогеналкіл, С₁-С₁₀-ціаноалкіл, С₁-С₁₀-нітроалкіл, С₂-С₁₀-аміноалкіл, С₁-С₅-алкіламіно-С₁-С₅-алкіл, С₂-С₈-діалкіламіно-С₁-С₅-алкіл, С₃-С₇-циклоалкіл-С₁-С₅-алкіл, С₁-С₅-алкокси-С₁-С₅-алкіл, С₃-С₅-алкенілокси-С₁-С₅-алкіл, С₃-С₅-алкінілокси-С₁-С₅-алкіл, С₁-С₅-алкілтіо-С₁-С₅-алкіл, С₁-С₅-алкілсульфініл-С₁-С₅-алкіл, С₁-С₅-алкілсульфоніл-С₁-С₅-алкіл, С₂-С₈-алкіліденаміноокси-С₁-С₅-алкіл, С₁-С₅-алкілкарбоніл-С₁-С₅-алкіл, С₁-С₅-алкоксикарбоніл-С₁-С₅-алкіл, амінокарбоніл-С₁-С₅-алкіл, С₁-С₅-алкіламінокарбоніл-С₁-С₅-алкіл, С₂-С₈-діалкіламінокарбоніл-С₁-С₅-алкіл, С₁-С₅-алкілкарбоніламіно-С₁-С₅-алкіл, N-С₁-С₅-алкілкарбоніл-N-С₁-С₅-алкіламіно-С₁-С₅-алкіл, С₃-С₆-триалкілсиліл-С₁-С₅-алкіл, феніл-С₁-С₅-алкіл (де феніл необов'язково може містити як замісники С₁-С₃-алкіл, С₁-С₃-галогеналкіл, С₁-С₃-алкоксигрупу, С₁-С₃-галогеналкоксигрупу, С₁-С₃-алкілтіогрупу, С₁-С₃-алкілсульфініл, С₁-С₃-алкілсульфоніл, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу), гетероарил-С₁-С₅-алкіл (де гетероарил необов'язково може містити як замісники С₁-С₃-алкіл, С₁-С₃-галогеналкіл, С₁-С₃-алкоксигрупу, С₁-С₃-галогеналкоксигрупу, С₁-С₃-алкілтіогрупу, С₁-С₃-алкілсульфініл, С₁-С₃-алкілсульфоніл, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу), фенокси-С₁-С₅-алкіл (де феніл необов'язково може містити як замісники С₁-С₃-алкіл, С₁-С₃-галогеналкіл, С₁-С₃-алкоксигрупу, С₁-С₃-галогеналкоксигрупу, С₁-С₃-алкілтіогрупу, С₁-С₃-алкілсульфініл, С₁-С₃-алкілсульфоніл, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу), гетероарилокси-С₁-С₅-алкіл (де гетероарил необов'язково може містити як замісники С₁-С₃-алкіл, С₁-С₃-галогеналкіл, С₁-С₃-алкоксигрупу, С₁-С₃-галогеналкоксигрупу, С₁-С₃-алкілтіогрупу, С₁-С₃-алкілсульфініл, С₁-С₃-алкілсульфоніл, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу), С₃-С₆-галогеналкеніл, С₃-С₈-циклоалкіл, феніл або феніл, який містить як замісники С₁-С₃-алкіл, С₁-С₃-галогеналкіл, С₁-С₃-алкоксигрупу, С₁-С₃-галогеналкоксигрупу, галоген або нітрогрупу, або гетероарил або гетероарил, який містить як замісники С₁-С₃-алкіл, С₁-С₃-галогеналкіл, С₁-С₃-алкоксигрупу, С₁-С₃-галогеналкоксигрупу, галоген, ціаногрупу або нітрогрупу;

R означає водень, С₁-С₆-алкіл, С₁-С₆-галогеналкіл, С₁-С₆-ціаноалкіл, бензил, С₁-С₄-алкокси(С₁-С₄)алкіл, С₁-С₄-алкокси(С₁-С₄)алкокси(С₁-С₄)алкіл або групу, вибрану із числа груп G; і

A означає С₁-С₆-алкіл, С₁-С₆-галогеналкіл, С₃-С₆-циклоалкіл, С₃-С₆-циклоалкіл(С₁-С₄)алкіл або С₃-С₆-циклоалкіл(С₁-С₄)алкіл, в якому метиленова група циклоалкільного фрагмента замінена на O, S або NR₀, де R₀ означає С₁-С₆-алкіл або С₁-С₆-алкоксигрупу, або A означає С₂-С₆-алкеніл, С₂-С₆-галогеналкеніл, С₃-С₆-алкініл, С₁-С₆-ціаноалкіл, бензил, С₁-С₄-алкокси(С₁-С₄)алкіл, С₁-С₄-алкокси(С₁-С₄)алкокси(С₁-С₄)алкіл, оксетаніл, тетрагідрофураніл, тетрагідропіраніл, С₁-С₆-алкілкарбоніл, С₁-С₆-алкоксикарбоніл, С₃-С₆-циклоалкілкарбоніл, N-ді(С₁-С₆-алкіл)карбамойл, бензоїл, С₁-С₆-алкілсульфоніл, фенілсульфоніл, С₁-С₄-алкілтіо(С₁-С₄)алкіл, С₁-С₄-алкілсульфініл(С₁-С₄)алкіл або С₁-С₄-алкілсульфоніл(С₁-С₄)алкіл; або їх агрохімічно прийнятні солі або N-оксиди.

2. Спосіб одержання сполук формули I за п. 1, в якій G означає водень, що включає циклізацію сполуки формули IV



в якій X, Y, Z, m, n, R і A мають значення, визначені у п. 1, і R₁₄ означає С₁-С₆-алкіл, у лужному середовищі.

3. Пестицидна композиція, яка містить щонайменше одну сполуку формули I за п. 1 у пестицидно ефективній кількості.
4. Пестицидна композиція за п. 3, яка на додаток до того, що вона містить сполуку формули I, містить допоміжні речовини, які використовують для приготування препаратів.
- 5 5. Пестицидна композиція за п. 4, в якій допоміжна речовина, яку використовують для приготування препаратів, являє собою олію рослинного або тваринного походження, мінеральну олію, складні алкілові ефіри таких олій або суміші таких олій і похідних олій, або добриво, або амонієву або фосфонієву сіль, необов'язково у суміші із зазначеними вище оліями і похідними олій.
- 10 6. Пестицидна композиція за п. 3, яка на додаток до того, що вона містить сполуку формули I, містить щонайменше один додатковий інсектицид, акарицид, нематоцид або молюскоцид.
7. Пестицидна композиція за п. 3, яка на додаток до того, що вона містить сполуку формули I, містить щонайменше один додатковий фунгіцид, гербіцид, антидот або регулятор росту рослин.
- 15 8. Спосіб боротьби зі шкідниками або їх знищення, що включає нанесення на шкідників, на осередок шкідників або на рослини, піддані нашестю шкідників, сполуки формули I у пестицидно ефективній кількості.
9. Спосіб боротьби зі шкідниками або їх знищення, що включає нанесення на шкідників, на осередок шкідників або на рослини, піддані нашестю шкідників, пестицидної композиції за п. 3.

Комп'ютерна верстка С. Чулій

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

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