



УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **110953** (13) **C2**
(51) МПК
C07D 471/04 (2006.01)
A01N 43/54 (2006.01)

ДЕРЖАВНА СЛУЖБА
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
УКРАЇНИ

(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВІНАХІД

(21) Номер заявки:	а 2013 08111	(72) Винахідник(и):	Пахутські Томас Френсіс мол. (US)
(22) Дата подання заявки:	22.12.2011	(73) Власник(и):	Е. І. ДЮ ПОН ДЕ НЕМУР ЕНД КОМПАНІ, 1007 Market Street, Wilmington, Delaware 19898, United States of America (US)
(24) Дата, з якої є чинними права на винахід:	10.03.2016	(74) Представник:	Мамуня Олександр Сергійович, реєстр. №357
(31) Номер попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції:	61/427,855, 61/550,675	(56) Перелік документів, взятих до уваги експертизою:	WO 2009/099929 A1, 13.08.2009
(32) Дата подання попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції:	29.12.2010, 24.10.2011		
(33) Код держави-учасниці Паризької конвенції, до якої подано попередню заявку:	US, US		
(41) Публікація відомостей про заявку:	10.09.2013, Бюл.№ 17		
(46) Публікація відомостей про видачу патенту:	10.03.2016, Бюл.№ 5		
(86) Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору РСТ	PCT/US2011/066798, 22.12.2011		

(54) МЕЗОІОННІ ПІРИДО[1,2-а]ПІРИМІДИНОВІ ПЕСТИЦИДИ

(57) Реферат:

Винахід належить до сполук піримідинію, їх композицій, що підходять для агрохімічних та відмінних від агрохімічних застосувань, і способу боротьби з безхребетним шкідником, що включають приведення в контакт безхребетного шкідника або його середовища проживання з біологічно ефективною кількістю сполуки або композиції даного винаходу. Також розкриті способи збільшення сили росту оброблюваної рослини, що включають приведення в контакт оброблюваної рослини, насіння, з якого проростає оброблювана рослина, або місця зростання оброблюваної рослини з біологічно ефективною кількістю сполуки або композиції даного винаходу.

UA 110953 C2

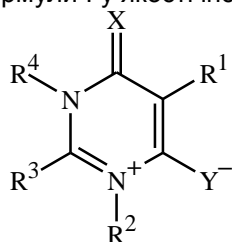
Галузь винаходу

Даний винахід відноситься до певних сполук піримідинію, їхнім композиціям, що підходять для агрономічних та відмінних від агрономічних застосувань, і способам їх застосування для боротьби з безхребетними шкідниками, такими як членистоногі, як в агрономічному середовищі, так і у відмінному від агрономічного середовищі.

Передумови винаходу

Боротьба з безхребетними шкідниками надзвичайно важлива при досягненні високого виходу врожаю. Шкода від безхребетних шкідників сільськогосподарським культурам, які зростають, та сільськогосподарським культурам, що зберігаються, може викликати значне скорочення врожайності та таким чином привести до підвищених цін для споживачів. Також дуже важлива боротьба з безхребетними шкідниками в лісовому господарстві, у тепличних культур, декоративних рослин, культур у розплідниках, у їжі, що зберігається, і виробках з волокна, у домашньої худоби, у домашньому господарстві, торфі, у лісоматеріалах і в суспільній охороні здоров'я. Безліч продуктів є комерційно доступними для даних цілей, але залишається нестача нових сполук, які є більш ефективними, менш дорогими, менш токсичними, більш безпечними для навколишнього середовища або мають різні місця докладання дії.

РСТ патентна публікація WO 09/099929 розкриває певні мезоіонні сполуки піримідинію формули I у якості інсектицидів,

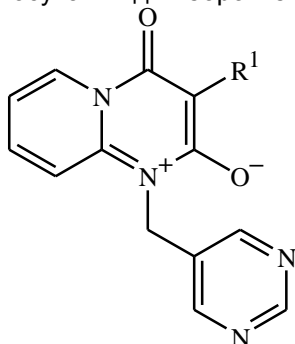


i

де, inter alia, X та Y є O, R1 заміщений фенілом, R2 є CH2Q, і Q необов'язково заміщений 5- або 6-членним гетероароматичним кільцем, і R3, і R4 узяті разом з утворенням необов'язково заміщеного 6-членного кільця.

Короткий опис даного винаходу

Даний винахід спрямований на сполуки формули 1, композиції, що містять їх, та їхнє застосування для боротьби з безхребетними шкідниками:



1

де

R1 є фенілом або піридинілом, кожний необов'язково заміщений Q та має до 3 замісників, незалежно обраних з R2;

кожний R2 незалежно є галогеном, ціано, SF5, C1-C4алкілом, C1-C4галогеналкілом, C1-C4алкокси, C1-C4галогеналкокси, C1-C4алкілтіо або C1-C4галогеналкілтіо; і

Q є фенілом або піридинілом, кожний необов'язково має до 5 замісників, незалежно обраних із групи, що складається з галогену, ціано, C1-C4алкілу, C1-C4галогеналкілу, C1-C4алкокси та C1-C4галогеналкокси.

Даний винахід забезпечує композицію, що містить сполуку формули 1 і щонайменше один додатковий компонент, обраний із групи, що складається з поверхнево-активних речовин, твердих розріджувачів та рідких розріджувачів. В одному варіанті здійснення даний винахід також забезпечує композицію для боротьби з безхребетним шкідником, що містить сполуку формули 1 і щонайменше один додатковий компонент, обраний із групи, що складається з

поверхнево-активних речовин, твердих розріджувачів та рідких розріджувачів, причому зазначена композиція також містить щонайменше одну додаткову біологічно активну сполуку або один додатковий біологічно активний засіб.

Даний винахід також забезпечує спосіб боротьби з безхребетним шкідником, що включає приведення в контакт безхребетного шкідника або його середовища проживання з біологічно ефективною кількістю сполуки формули 1 (наприклад у вигляді композиції, описаної в даному документі). Даний винахід також відноситься до такого способу, де безхребетного шкідника або його середовище проживання приводять у контакт із композицією, що містить біологічно ефективну кількість сполуки формули 1 і щонайменше один додатковий компонент, обраний із групи, що складається з поверхнево-активних речовин, твердих розріджувачів та рідких розріджувачів, причому зазначена композиція також необов'язково містить біологічно ефективну кількість щонайменше однієї додаткової біологічно активної сполуки або одного додаткового біологічно активного засобу.

Даний винахід також забезпечує спосіб боротьби з безхребетним шкідником, що включає приведення в контакт безхребетного шкідника або його середовища проживання з біологічно ефективною кількістю кожної з вищевказаних композицій, де середовищем проживання є рослина.

Даний винахід також забезпечує спосіб боротьби з безхребетним шкідником, що включає приведення в контакт безхребетного шкідника або його середовища проживання з біологічно ефективною кількістю кожної з вищевказаних композицій, де середовищем проживання є насіння.

Даний винахід також забезпечує спосіб захисту насіння від безхребетного шкідника, що включає приведення в контакт насіння з біологічно ефективною кількістю сполуки формули 1 (наприклад у вигляді композиції, описаної в даному документі). Даний винахід також відноситься до протравленого насіння (тобто насіння, приведенному в контакт зі сполукою формули 1).

Даний винахід також забезпечує спосіб збільшення сили росту оброблюваної рослини, що включає приведення в контакт оброблюваної рослини, насіння, з якого проростає оброблювана рослина, або місця зростання (наприклад середовища для вирощування) оброблюваної рослини з біологічно ефективною кількістю сполуки формули 1 (наприклад у вигляді композиції, описаної в даному документі).

Докладний опис даного винаходу

Як використовується в даному документі вирази "містить", "що містить", "включає", "що включає", "має", "що має", "містить у собі", "що включає в себе", "одмінний тим, що" або будь-які інші їхні варіації призначені для того, щоб охопити невиняткове включення, з умовою дотримання будь-якого явно позначеного обмеження. Наприклад композиція, суміш, процес або спосіб, який включає перелік елементів, не обов'язково обмежений тільки тими елементами, але може включати інші елементи, прямо не перераховані або властиві такій композиції, суміші, процесу або способу.

Перехідна фраза "що складається з" виключає будь-який точно не зазначений елемент, етап або інгредієнт. Якщо подібне зустрічається в пункті формули винаходу, то воно закріплює пункт формули винаходу для включення матеріалів, відмінних від перерахованих, за винятком сторонніх включень, зазвичай з ними зв'язаних. Якщо фраза "що складається з" з'являється в головній частині пункту формули винаходу, замість того, щоб іти безпосередньо за вступною частиною, вона обмежує тільки елемент, описаний у тій головній частині; при цьому інші елементи в цілому не виключаються з пункту формули винаходу.

Перехідна фраза "що, по суті, складається з" використовується для визначення композиції або способу, який включає матеріали, етапи, ознаки, компоненти або елементи, на додаток до тих, які точно розкриті, причому дані додаткові матеріали, етапи, ознаки, компоненти або елементи суттєво не впливають на основну та нову характеристику(и) заявленого винаходу. Вираз "що, по суті, складається з" займає проміжне положення між "що містить" і "що складається з".

Якщо заявники визначили обсяг винаходу або його частини необмежуваним виразом, таким як "що містить", явно слід розуміти, що (якщо інше не зазначене) опис потрібно тлумачити, як такий, що також описує такий винахід, із застосуванням виразів "що, по суті, складається з" або "що складається з".

Також якщо прямо не зазначено зворотне, "або" відноситься до "або", що включає, а не до виняткового "або". Наприклад, умова А або В задовольняється кожним з наступного: А є дійсним (або є присутнім) і В є неправильним (або не є присутнім), А є неправильним (або не є присутнім) і В є дійсним (або є присутнім), і як А, так і В є дійсними (або присутніми).

Також одиниця елемента або компонента даного винаходу призначена бути

необмежувальною відносно ряду прикладів (тобто випадків) елемента або компонента. Отже, слід розуміти, що однина включає один або щонайменше один, і словоформа однини елемента або компонента також включає множину, якщо явно не означається однина.

Як викладено в даному розкритті, вираз "безхребетний шкідник" включає членистоногих, червононогих молюсків, нематод та гельмінтів, що мають економічне значення у якості шкідників. Вираз "членистоноге" включає комах, кліщів, павуків, скорпіонів, губоногих, двопарноногих, мокриць та симфіл. Вираз "червоногий молюск" включає равликів, слимаків та інших представників *Stylommatophora*. Вираз "нематода" включає представників типу *Nematoda*, таких як рослиноїдні нематоди та гельмінти-нематоди, що паразитують на тварині. Вираз "гельмінт" включає всіх паразитичних хробаків, таких як круглі хробаки (тип *Nematoda*), серцеві гельмінти (тип *Nematoda*, клас *Secernentea*), трематоди (тип *Platyhelminthes*, клас *Trematoda*), скреблики (тип *Acanthocephala*) та стрічкові хробаки (тип *Platyhelminthes*, клас *Cestoda*).

У контексті даного розкриття "боротьба з безхребетним шкідником" означає інгібування розвитку безхребетного шкідника (включаючи смертність, зменшення харчування та/або спосіб дезорієнтації самців) та споріднені вислови визначаються аналогічним образом.

Вираз "агрономічний" відноситься до одержання польових культур, таких як для забезпечення їжі та волокна, і включає вирощування маїсу або кукурудзи, соєвих бобів та інших бобових, рису, зернових культур (наприклад пшениці, вівса, ячменя, жита та рису), листових овочів (наприклад салату-латуку, капусти та інших капустяних культур), овочів, що плодоносять (наприклад видів помідорів, перцю, баклажана, хрестоцвітих і гарбузових культур), видів картоплі, видів солодкої картоплі, видів винограду, бавовни, плодів дерев (наприклад зерняткових, кісточкових і цитрусових), кущових плодових культур (наприклад тих, що плодоносять ягодами та вишнями) та інших спеціалізованих сільськогосподарських культур (наприклад каноли, соняшника та маслин).

Вираз "відмінний від агрономічного" відноситься до відмінних від польових культур, таких як садові культури (наприклад тепличні рослини, рослини в розпліднику або декоративні рослини, не вирощені в полі), житлові, сільськогосподарські, комерційні та промислові структури, дерен (наприклад ферми із заораним лугом, пасовище угіддя, поле для гольфа, газон, спортивне поле і т.д.), лісоматеріали, продукти, що зберігаються, агролісомеліорація та контроль рослинності, застосування в суспільній охороні здоров'я (тобто для людини) і ветеринарії (наприклад для одомашнених тварин, таких як свійські тварини, домашня худоба та домашній птах, неодомашнених тварин, таких як дикі тварини).

Вираз "сила росту культури" відноситься до швидкості росту або накопичення біомаси оброблюваної рослини. "Збільшення сили росту" відноситься до збільшення росту або накопичення біомаси в оброблюваної рослини в порівнянні з необробленою контрольною оброблюваною рослиною. Вираз "урожайність" відноситься до виходу вирощеного матеріалу, як у якісному, так і у кількісному вираженні, отриманого після збору врожаю в оброблюваної рослини. "Збільшення врожайності" відноситься до збільшення врожайності в порівнянні з необробленою контрольною оброблюваною рослиною.

Вираз "біологічно ефективна кількість" відноситься до кількості біологічно активної сполуки (наприклад сполуки формули 1) достатньої для того, щоб дати необхідний біологічний ефект при застосуванні (тобто при контакті з) до безхребетного шкідника, з яким борються, або його середовища проживання, або до рослини, насіння, з якого проростає рослина, або місця зростання рослини (наприклад середовища для вирощування) для захисту рослини від ушкодження безхребетним шкідником, або для іншого необхідного ефекту (наприклад збільшення сили росту рослини).

Відмінні від агрономічних застосування включають захист тварини від безхребетного паразитичного шкідника за допомогою введення тварині, яку необхідно захистити, антипаразитарно ефективною (тобто біологічно ефективною) кількості сполуки даного винаходу, зазвичай у формі композиції, складеної для застосування у ветеринарії. Як відзначається в даному розкритті та формулі винаходу вираз "антипаразитарний" та "антипаразитарно" відносяться до видимих ефектів на безхребетного паразитичного шкідника для забезпечення захисту тварині від шкідника. Антипаразитарні ефекти зазвичай відносяться до скорочення поширення або активності цільового безхребетного паразитичного шкідника. Такі ефекти на шкідника включають некроз, смерть, уповільнений ріст, знижену рухливість або зменшену здатність залишатися на або у тварині-хазяїні, зменшене харчування та інгібування розмноження. Дані ефекти на безхребетних паразитичних шкідників забезпечують регулювання (включаючи попередження, зниження або обмеження) зараження паразитами або інфікування тварини.

У вищевказаних перерахуваннях вираз "алкіл", використаний або самостійно, або в

складному слові, такому як "галогеналкіл", включає алкіл з нерозгалуженим ланцюгом або розгалужений алкіл, такий як метил, етил, n-пропіл, i-пропіл або різні ізомери бутилу.

Вираз "галоген" або самостійно, або в складному слові, такому як "галогеналкіл", включає фтор, хлор, бром або йод. Також при використанні в складному слові, такому як "галогеналкіл", зазначений алкіл може бути частково або повністю заміщений атомами галогену, які можуть бути однаковими або різними. Приклади "галогеналкілу" включають CF_3 , CH_2Cl , CH_2CF_3 та CCl_2CF_3 . Вираз "галогеналкокси" і "галогеналкілтіо" визначені за аналогією з виразом "галогеналкіл". Приклади "галогеналкокси" включають CF_3O , $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O}$, $\text{HCF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}$ і $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}$. Приклади "галогеналкілтіо" включають CCl_3S , CF_3S , $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{S}$ і $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}$.

"Алкокси" включає, наприклад, метокси, етокси, n-пропокси, ізопропокси та різні ізомери бутокси.

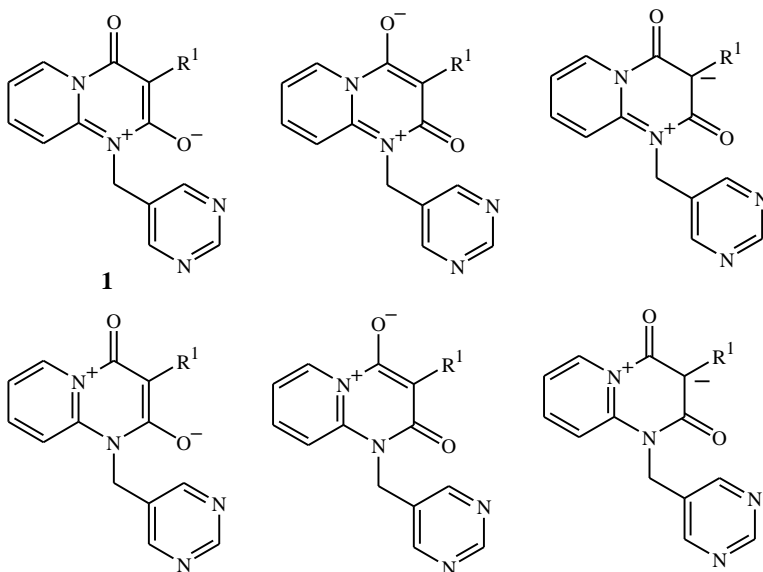
Вираз "алкілтіо" включає фрагменти алкілтіо з розгалуженим ланцюгом або фрагменти нерозгалуженого алкілтіо, такі як метилтіо, етилтіо та різні ізомери пропілтіо та бутилтіо.

Загальне число атомів вуглецю в групі замісника позначають приставкою "Ci-Cj", де i та j є числами від 1 до 4. Наприклад, C1-C4алкіл означає від метилу до бутилу.

Якщо радикал необов'язково має перерахованими замісниками із зазначеним числом замісників (наприклад "до 3"), тоді радикал може не мати або мати число замісників, що перебуває у діапазоні до найбільшого зазначеного числа (наприклад "3"), а приєднані замісники незалежно обрані з перерахованих замісників.

Число необов'язкових замісників може бути звуженим установленим обмеженням. Наприклад, фраза "що необов'язково має до 3 замісників, незалежно обраних з R2" означає, що 0, 1, 2 або 3 замісника можуть бути присутніми (якщо число можливих точок приєднання дозволяє). Якщо діапазон, певний для числа замісників, перевищує число положень доступних для замісників на кільці, дійсна верхня межа діапазону вважається числом доступних положень.

Сполуки формули 1 є мезоіонними внутрішніми солями. "Внутрішні солі", також відомі в даній галузі техніки як "цвіттер-іони", є електрично нейтральними молекулами, але несуть формальні позитивний і негативний заряди на різних атомах у кожній валентній структурі згідно з теорією валентного зв'язку. Крім того, молекулярна структура сполук формули 1 може бути представлена шістьма валентними структурами, показаними нижче, причому на кожній формальний позитивний і негативний заряди розміщені на різних атомах. Через даний резонанс сполуки формули 1 також описуються як "мезоіонні". Хоча з метою простоти в даному документі молекулярна структура формули 1 зображується у вигляді окремої валентної структури, при цьому слід розуміти, що дана певна валентна структура представляє всі шість валентних структур (зображених після даного абзацу), що мають відношення до зв'язування в молекули сполук формули 1. Отже, посилання на формулу 1 у даному документі відноситься до всіх шести відповідних валентних структурам та іншим (наприклад за теорією молекулярних орбіталей) структурам, якщо не обумовлено інше.



Сполуки даного винаходу можуть існувати у вигляді одного або декількох конфірмаційних ізомерів у зв'язку з обмеженим обертанням зв'язку, обумовленим стеричною перешкодою. Наприклад, сполука формули 1, де R1 є фенілом, заміщеним в орто-положенні стерично вимогливою алкільною групою (наприклад ізопропілом), може існувати у вигляді двох ротамерів

у зв'язку з обмеженим обертанням навколо зв'язку R1-кільця піримідинію. Даний винахід містить суміші конфірмаційних ізомерів. До того ж даний винахід включає сполуки, які доповнено одним конформером у порівнянні з іншими.

Сполуки, обрані з формули 1, зазвичай існують у більш ніж одній формі, і формула 1, таким чином, включає всі кристалічні та некристалічні форми сполук, які представлені формулою 1. Некристалічні форми включають варіанти здійснення, які є твердими речовинами, такими як воски та смоли, а також варіанти здійснення, які є рідинами, такими як розчини та розплави. Кристалічні форми включають варіанти здійснення, які представляють, по суті, окремий кристалічний тип і варіанти здійснення, які представляють суміш поліморфів (тобто різних кристалічних типів). Вираз "поліморф" відноситься до певної кристалічної форми хімічної сполуки, яка може кристалізуватися у різні кристалічні форми, причому дані форми мають різні структури та/або конформації молекул у кристалічній решітці. Хоча поліморфи можуть мати однаковий хімічний склад, вони також можуть відрізнятися за складом у зв'язку із присутністю або відсутністю співкристалізованої води або інших молекул, які можуть бути слабо або сильно зв'язані в решітці. Поліморфи можуть відрізнятися за такими хімічними, фізичними та біологічними властивостями, як форма кристала, щільність, твердість, колір, хімічна стабільність, точка плавлення, гігроскопічність, суспендованість, швидкість розчинення та біологічна доступність. Фахівець в даній галузі визнає, що поліморф сполуки, представленої формулою 1, може проявляти сприятливі ефекти (наприклад зручність в одержанні корисних складів, поліпшені біологічні характеристики) щодо іншого поліморфа або суміші поліморфів тієї ж сполуки, представленої формулою 1. Одержання та виділення конкретного поліморфа сполуки, представленого формулою 1, може бути досягнуте способами, відомими фахівцям у даній галузі техніки, включаючи, наприклад, кристалізацію за допомогою обраних розчинників і температур.

Фахівець у даній галузі розуміє, що, тому що в навколишньому середовищі та при фізіологічних умовах солі хімічних сполук рівноважні їх відповідним несольовим формам, солі розділяють біологічну корисність несольових форм. У такий спосіб велика різноманітність солей сполук формули 1 придатна для боротьби з безхребетними шкідниками та паразитами тварин (тобто підходять для застосування у ветеринарії). Солі сполук формули 1 включають солі, отримані додаванням кислоти, на основі неорганічних або органічних кислот, таких як бромистоводнева, хлористоводнева, азотна, фосфорна, сірчана, оцтова, масляна, фумарова, молочна, малеїнова, малінова, щавлева, пропіонова, саліцилова, винна, 4-толуолсульфонова або валеріанова кислоти.

Варіанти здійснення даного винаходу, як описується в короткому описі даного винаходу, включають описані нижче. У наступних варіантах здійснення посилання на "сполуку формули 1" включає визначення замісників, описаних у короткому описі даного винаходу, якщо вони далі не визначаються у варіантах здійснення.

Варіант здійснення 1. Сполука формули 1, де R1 є фенілом, необов'язково заміщеним Q і має до 3 замісників, незалежно обраних з R2.

Варіант здійснення 1a. Сполука варіанта здійснення 1, де R1 є фенілом, що необов'язково має до 3 замісників, незалежно обраних з R2.

Варіант здійснення 2. Сполука формули 1, де R1 є піридинілом, що необов'язково заміщений Q і має до 3 замісників, незалежно обраних з R2.

Варіант здійснення 2a. Сполука варіанта здійснення 2, де R1 є піридинілом, що необов'язково має до 3 замісників, незалежно обраних з R2.

Варіант здійснення 3. Сполука формули 1 або кожного з варіантів здійснення 1-2a, де кожний R2 є незалежно галогеном, C1-C4алкілом, C1-C4галогеналкілом, C1-C4алкокси або C1-C4галогеналкокси.

Варіант здійснення 3a. Сполука варіанта здійснення 3, де кожний R2 є незалежно галогеном, C1-C2алкілом, C1-C2галогеналкілом, C1-C2алкокси або C1-C2галогеналкокси.

Варіант здійснення 3b. Сполука варіанта здійснення 3, де кожний R2 є незалежно галогеном.

Варіант здійснення 3c. Сполука варіанта здійснення 3, де кожний R2 є незалежно C1-C4алкілом.

Варіант здійснення 3d. Сполука варіанта здійснення 3, де кожний R2 є незалежно C1-C4галогеналкілом.

Варіант здійснення 3e. Сполука варіанта здійснення 3, де кожний R2 є незалежно C1-C4алкокси.

Варіант здійснення 3f. Сполука варіанта здійснення 3, де кожний R2 є незалежно C1-C4галогеналкокси.

Варіант здійснення 4. Сполука формули 1 або будь-якого з варіантів здійснення 1, 2 і 3-3f, де Q є фенілом, що необов'язково має до 5 замісників, незалежно обраних із групи, що складається з галогену, ціано, C1-C4алкілу, C1-C4галогеналкілу, C1-C4алкокси та C1-C4галогеналкокси.

5 Варіант здійснення 4a. Сполука формули 1 або будь-якого з варіантів здійснення 1, 2 і 3-3f, де Q є піридинілом, що необов'язково має до 4 замісників, незалежно обраних із групи, що складається з галогену, ціано, C1-C4алкілу, C1-C4галогеналкілу, C1-C4алкокси та C1-C4галогеналкокси.

10 Варіант здійснення 4b. Сполука варіанта здійснення 4, де Q є фенілом, що необов'язково має до 3 замісників, незалежно обраних із групи, що складається із ціано та C1-C4алкілу.

Варіант здійснення 5. Сполука формули 1, де R1 є фенілом, що має до 2 замісників, незалежно обраних із групи, що складається з галогену, C1-C4галогеналкілу та C1-C4галогеналкокси.

15 Варіант здійснення 6. Сполука формули 1, де R1 є фенілом, заміщеним галогеном, C1-C4галогеналкілом або C1-C4галогеналкокси.

Варіант здійснення 7. Сполука формули 1, де R1 є фенілом, заміщеним C1-C4галогеналкілом або C1-C4галогеналкокси.

20 Варіанти здійснення даного винаходу, включаючи вищевказані варіанти здійснення 1-7, а також будь-які інші варіанти здійснення, описані в даному документі, можуть поєднуватися будь-яким способом, а описи змінних характеристик у варіантах здійснення підходять не тільки для сполук формули 1, але також вихідних сполук та проміжних сполук, придатних для одержання сполук формули 1. До того ж варіанти здійснення даного винаходу, включаючи вищевказані варіанти здійснення 1-7, а також будь-які інші варіанти здійснення, описані в даному документі, і будь-яка їхня комбінація, підходять для композицій та способів даного винаходу.

25 Комбінації варіантів здійснення 1-7 ілюструються за допомогою:

Варіанта здійснення A. Сполука формули 1, де

R1 є фенілом, що необов'язково заміщений Q і має до 3 замісників, незалежно обраних з R2; і

30 Q є фенілом або піридинілом, кожний необов'язково має до 3 замісників, незалежно обраних із групи, що складається з галогену, ціано, C1-C4алкілу, C1-C4галогеналкілу, C1-C4алкокси та C1-C4галогеналкокси.

Варіант здійснення B. Сполука варіанта здійснення A, де

35 R1 є фенілом, що необов'язково має до 3 замісників, незалежно обраних із групи, що складається з галогену, C1-C4алкілу, C1-C4галогеналкілу, C1-C4алкокси та C1-C4галогеналкокси.

Конкретні варіанти здійснення включають сполуки формули 1, обрані із групи, що складається з

внутрішньої солі 2-гідрокси-4-оксо-3-феніл-1-(5-піримідинілметил)-4Н-піридо[1,2-а]піримідинію (тобто сполуки 1 таблиці A індексів);

внутрішньої солі 3-(4-фторфеніл)-2-гідрокси-4-оксо-1-(5-піримідинілметил)-4Н-піридо[1,2-а]піримідинію (тобто сполуки 2 таблиці A індексів);

внутрішньої солі 2-гідрокси-4-оксо-1-(5-піримідинілметил)-3-[3-(трифторметил)феніл]-4Н-піридо[1,2-а]піримідинію (тобто сполуки 3 таблиці A індексів);

внутрішньої солі 2-гідрокси-3-(2-метоксифеніл)-4-оксо-1-(5-піримідинілметил)-4Н-піридо[1,2-а]піримідинію (тобто сполуки 4 таблиці A індексів);

внутрішньої солі 2-гідрокси-3-(3-метоксифеніл)-4-оксо-1-(5-піримідинілметил)-4Н-піридо[1,2-а]піримідинію (тобто сполуки 5 таблиці A індексів);

внутрішньої солі 3-(2,4-дифторфеніл)-2-гідрокси-4-оксо-1-(5-піримідинілметил)-4Н-піридо[1,2-а]піримідинію (тобто сполуки 6 таблиці A індексів);

внутрішньої солі 2-гідрокси-4-оксо-1-(5-піримідинілметил)-3-[3-(трифторметокси)феніл]-4Н-піридо[1,2-а]піримідинію (тобто сполуки 7 таблиці A індексів);

внутрішньої солі 3-(2-бромфеніл)-2-гідрокси-4-оксо-1-(5-піримідинілметил)-4Н-піридо[1,2-а]піримідинію (тобто сполуки 8 таблиці A індексів);

внутрішньої солі 3-(2-фторфеніл)-2-гідрокси-4-оксо-1-(5-піримідинілметил)-4Н-піридо[1,2-а]піримідинію (тобто сполуки 9 таблиці A індексів);

внутрішньої солі 3-[2-фтор-5-(трифторметил)феніл]-2-гідрокси-4-оксо-1-(5-піримідинілметил)-4Н-піридо[1,2-а]піримідинію (тобто сполуки 10 таблиці A індексів);

внутрішньої солі 2-гідрокси-3-(3-метилфеніл)-4-оксо-1-(5-піримідинілметил)-4Н-піридо[1,2-а]піримідинію (тобто сполуки 11 таблиці A індексів);

внутрішньої солі 3-[4-фтор-3-(трифторметил)феніл]-2-гідрокси-4-оксо-1-(5-піримідинілметил)-

4Н-піридо[1,2-а]піримідинію (тобто сполуки 12 таблиці А індексів);
 внутрішньої солі 3-(4-хлор-2-фторфеніл)-2-гідрокси-4-оксо-1-(5-піримідинілметил)-4Н-піридо[1,2-а]піримідинію (тобто сполуки 13 таблиці А індексів);
 внутрішньої солі 3-(2-хлорфеніл)-2-гідрокси-4-оксо-1-(5-піримідинілметил)-4Н-піридо[1,2-а]піримідинію (тобто сполуки 14 таблиці А індексів);
 внутрішньої солі 3-[3-хлор-5-(трифторметил)феніл]-2-гідрокси-4-оксо-1-(5-піримідинілметил)-4Н-піридо[1,2-а]піримідинію (тобто сполуки 15 таблиці А індексів);
 внутрішньої солі 3-(3,5-дихлорфеніл)-2-гідрокси-4-оксо-1-(5-піримідинілметил)-4Н-піридо[1,2-а]піримідинію (тобто сполуки 16 таблиці А індексів);
 внутрішньої солі 3-(3,5-дихлор-4-фторфеніл)-2-гідрокси-4-оксо-1-(5-піримідинілметил)-4Н-піридо[1,2-а]піримідинію (тобто сполуки 17 таблиці А індексів);
 внутрішньої солі 3-(4'-ціано-5,2'-диметил[1,1'-біфеніл]-3-іл)-2-гідрокси-4-оксо-1-(5-піримідинілметил)-4Н-піридо[1,2-а]піримідинію (тобто сполуки 18 таблиці А індексів); і
 внутрішньої солі 3-(3-хлорфеніл)-2-гідрокси-4-оксо-1-(5-піримідинілметил)-4Н-піридо[1,2-а]піримідинію (тобто сполуки 19 таблиці А індексів).

Варто зазначити, що сполуки даного винаходу характеризуються сприятливим метаболічним характером і/або характером залишкового змісту в ґрунті та проявляють активну боротьбу з різноманітністю безхребетних шкідників в агрономічній галузі та відмінній від агрономічної галузі.

- 5 Особливо варто зазначити, що через боротьбу з безхребетним шкідником і економічну значимість, захист сільськогосподарських культур від шкоди або ушкодження, заподіяваної(ого) безхребетними шкідниками, при боротьбі з безхребетними шкідниками є варіантами здійснення даного винаходу. Сполуки даного винаходу через їхні сприятливі характеристики переміщення або системності в рослинах також захищають листяну або інші частини рослини, які
- 10 безпосередньо не приводяться в контакт зі сполукою формули 1 або композицією, що містить сполуку.

Також заслуговує на увагу те, що варіанти здійснення даного винаходу є композиціями, що містять сполуку будь-якого з попередніх варіантів здійснення, а також будь-яких інших варіантів здійснення, описаних у даному документі, і будь-який їх комбінацій, і щонайменше один

15 додатковий компонент, обраний із групи, що складається з поверхнево-активної речовини, твердого розріджувача та рідкого розріджувача, причому зазначені композиції також необов'язково містять щонайменше одну додаткову біологічно активну сполуку або один додатковий біологічно активний засіб.

Також заслуговує на увагу те, що варіанти здійснення даного винаходу є композиціями для боротьби з безхребетним шкідником, що містять сполуку (тобто в біологічно ефективній кількості) будь-якого з попередніх варіантів здійснення, а також будь-яких інших варіантів здійснення, описаних у даному документі, і будь-яких їхніх комбінацій, і щонайменше один

20 додатковий компонент, обраний із групи, що складається з поверхнево-активної речовини, твердого розріджувача та рідкого розріджувача, причому зазначені композиції також

25 необов'язково містять щонайменше одну додаткову біологічно активну сполуку або один додатковий біологічно активний засіб (тобто в біологічно ефективній кількості).

Варіанти здійснення даного винаходу також включають композицію, що містить сполуку будь-якого з попередніх варіантів здійснення у формі рідкого складу просочення для ґрунту. Варіанти здійснення даного винаходу також включають способи боротьби з безхребетним

30 шкідником, що включають приведення в контакт ґрунту з рідкою композицією у вигляді просочення для ґрунту, що містить біологічно ефективну кількість сполуки будь-якого з попередніх варіантів здійснення.

Варіанти здійснення даного винаходу також включають композицію для обприскування для боротьби з безхребетним шкідником, що містить сполуку (тобто в біологічно ефективній кількості) будь-якого з попередніх варіантів здійснення та розпилюючу речовину. Варіанти здійснення даного винаходу також включають композицію-приманку для боротьби з

35 безхребетним шкідником, котра містить сполуку (тобто в біологічно ефективній кількості) будь-якого з попередніх варіантів здійснення, один або кілька харчових матеріалів, необов'язково атрактант і необов'язково зволожувач. Варіанти здійснення даного винаходу також включають

40 обладнання для боротьби з безхребетним шкідником, що містить зазначену композицію-приманку та корпус, пристосований для вміщення зазначеної композиції-приманки, де корпус має щонайменше один отвір, розрахований на те, щоб допускати проникнення безхребетного шкідника через отвір, внаслідок чого безхребетний шкідник може одержати доступ до

45 зазначеної композиції-приманки з місця поза корпусом, і де корпус також пристосований для розміщення на території або поблизу місця потенційної або відомої активності безхребетного

шкідника.

Варіанти здійснення даного винаходу також включають способи боротьби з безхребетним шкідником, що включають приведення в контакт безхребетного шкідника або його середовища проживання з біологічно ефективною кількістю сполуки формули 1 (наприклад у вигляді композиції, описаної в даному документі), причому способи не є способами медичного лікування організму людини або тварини при терапії.

Даний винахід також відноситься до таких способів, де безхребетного шкідника або його середовище проживання приводять у контакт із композицією, що містить біологічно ефективну кількість сполуки формули 1 і щонайменше один додатковий компонент, обраний із групи, що складається з поверхнево-активних речовин, твердих розріджувачів і рідких розріджувачів, причому зазначена композиція також необов'язково містить біологічно ефективну кількість щонайменше однієї додаткової біологічно активної сполуки або одного додаткового біологічно активного засобу, причому способи не є способами лікування лікарськими засобами організму людини або тварину при терапії.

Варіанти здійснення даного винаходу також включають будь-який з попередніх варіантів здійснення, де безхребетним шкідником є членистоноге. Варіанти здійснення даного винаходу також включають будь-який з попередніх варіантів здійснення, при цьому членистоноге вибирають із групи, що складається з комах, кліщів, павуків, скорпіонів, губоногих, двопарноногих, мокриць і симфіл. Варіанти здійснення даного винаходу також включають будь-який з попередніх варіантів здійснення, при цьому членистоногим є комаха. Варіанти здійснення даного винаходу також включають будь-який з попередніх варіантів здійснення, де комахою є комаха ряду Hemiptera. Варіанти здійснення даного винаходу також включають будь-який з попередніх варіантів здійснення, де комахою є комаха надродини Fulgoroidea. Варіанти здійснення даного винаходу також включають будь-який з попередніх варіантів здійснення, де комахою є комаха надродини Fulgoroidea сімейства Delphacidae. Варіанти здійснення даного винаходу також включають будь-який з попередніх варіантів здійснення, де комахою є цикадка. Варіанти здійснення даного винаходу також включають будь-який з попередніх варіантів здійснення, де комахою є цикадка сімейства Cicadellidae.

Варіанти здійснення даного винаходу також включають будь-який з попередніх варіантів здійснення, де безхребетним шкідником є черевоногий молюск. Варіанти здійснення даного винаходу також включають будь-який з попередніх варіантів здійснення, де черевоногий молюск обраний із групи, що складається з равликів, слимаків та інших представників Stylommatophora.

Варіанти здійснення даного винаходу також включають будь-який з попередніх варіантів здійснення, де безхребетним шкідником є нематода. Варіанти здійснення даного винаходу також включають будь-який з попередніх варіантів здійснення, де нематода обрана з рослиноїдних нематод.

Варіанти здійснення даного винаходу також включають будь-який з попередніх варіантів здійснення, де безхребетним шкідником є гельмінт. Варіанти здійснення даного винаходу також включають будь-який з попередніх варіантів здійснення, де гельмінт обраний із групи, що складається із круглих хробаків, серцевих гельмінтів, трематод, скребликів та стрічкових хробаків.

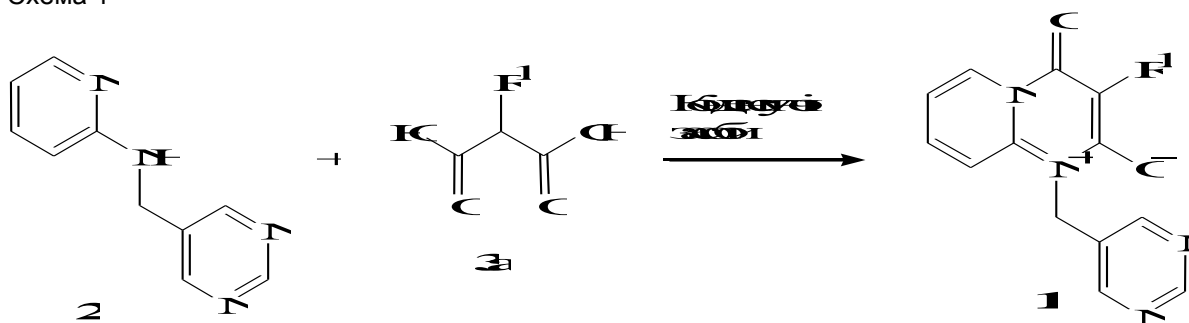
Варіанти здійснення даного винаходу також включають варіанти здійснення, що відносяться до способу збільшення сили росту оброблюваної рослини, розкриті в короткому описі даного винаходу, де сполука формули 1 (наприклад у вигляді композиції, описаної в даному документі) обрана з будь-якого з варіантів здійснення 1-4b, та B, i, зокрема, сполук, розкритих у даному документі.

Один або кілька наступних способів і варіацій, які описані на схемах 1-13, можуть застосовуватися для одержання сполук формули 1. Визначення R1 у сполуках формули 1-13 нижче є такими, як визначено вище в короткому описі даного винаходу, якщо інше не зазначене. Формули 1a та 1b є різними підмножинами формули 1, і всі замісники для формул 1a і 1e є такими, як визначено вище для формули 1, якщо інше не зазначене. Температура навколишнього середовища або кімнатна температура визначається як приблизно 20-25 °C.

Сполуки формули 1 можуть бути отримані конденсацією сполуки формули 2 з необов'язково заміщеними малоновими кислотами формули 3a при наявності конденсуючих засобів, як показано на схемі 1. Конденсуючі засоби можуть бути карбодіімідами, такими як дициклогексилкарбодіімід (див. наприклад Koch, A. et al. Tetrahedron 2004, 60, 10011–10018), або іншими засобами, загальновідомими в даній галузі техніки, для утворення амідних зв'язків з або без активуючих засобів, таких як N-гідроксибензотриазол, як описано в Science of Synthesis 2005, 21, 17-25 and Tetrahedron 2005, 61, 10827-10852. Дану реакцію зазвичай проводять в інертному органічному розчиннику, такому як дихлорметан або 1,2-дихлоретан, при

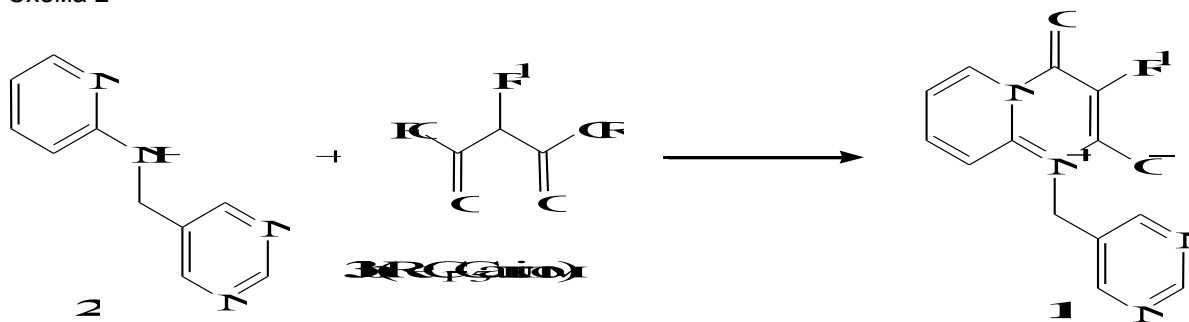
температурах від приблизно 0 до приблизно 80 °С строком на від 10 хвилин до декількох днів.

Схема 1



Сполуки формули 1 також можуть бути отримані конденсацією сполуки формули 2 зі складними ефірами маленової кислоти формули 3b, де R є C1-C5алкільною групою, як показано на схемі 2. Дані реакції можуть проводитися без сторонніх засобів або при наявності інертних розчинників, як описано в Bulletin of the Chemical Society of Japan 1999, 72(3), 503–509. Інертні розчинники включають, у тому числі, киплячі за високих температур вуглеводні, такі як мезитилен, тетралін або цимол, або киплячі за високих температур ефіри, такі як дифеніловий ефір. Стандартні температури варіюють від 50 до 250°C. Вартими уваги є температури від 150 до 200°C, при яких зазвичай забезпечуються швидкий час реакції та високий вихід. Дані реакції можуть також проводитися в мікрохвильових реакторах у рамках тих же діапазонів температури. Стандартний час реакції варіює від 5 хвилин до декількох годин.

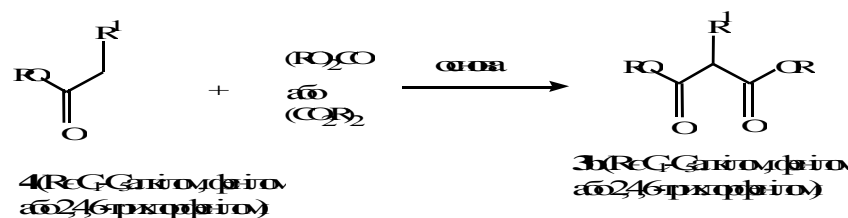
Схема 2



Сполуки формули 3a можуть бути отримані різними способами, відомими в даній галузі техніки, наприклад, основним гідролізом сполук формули 3b.

Сполуки формули 3b можуть бути отримані арилуванням складних ефірів-малонатів (із застосуванням сполук формули R₁ × 1, де X₁ є Cl, Br або I, приклади яких знаходяться у таблицях I-24a, I-24-b і I-24c), яке каталізують палладієм (J. Org. Chem 2002, 67, 541-555) або міддю (Org. Lett. 2002, 4, 269–272 і Org. Lett. 2005, 7, 4693-4695). Альтернативно сполуки формули 3b можуть бути отримані способом, показаним на схемі 2a (див. наприклад J. Med. Chem 1982, 25(6), 745–747).

Схема 2a

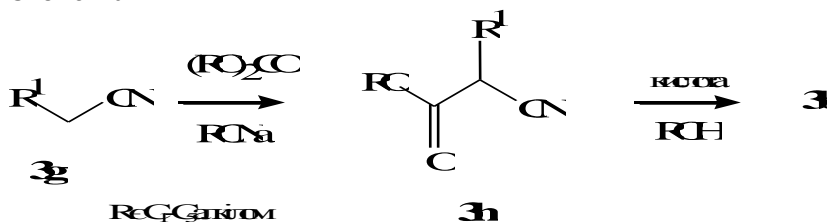


Складні ефіри формули 4 можуть бути отримані з відповідних кислот способами, широко відомими у даній галузі техніки. Кислоти формули 4, де R є H (приклади перераховані в таблиці I-1) легко одержують способами, відомими в даній галузі техніки, і багато з них комерційно доступні.

Сполуки формули 3b також можуть бути отримані способом, показаним на схемі 2b. Реакція нітрилів формули 3g з діалкілкарбонатами дає складні ефіри нітрилу формули 3h, і наступний кислотний гідроліз у присутності спирту забезпечує сполуки формули 3b (див. наприклад

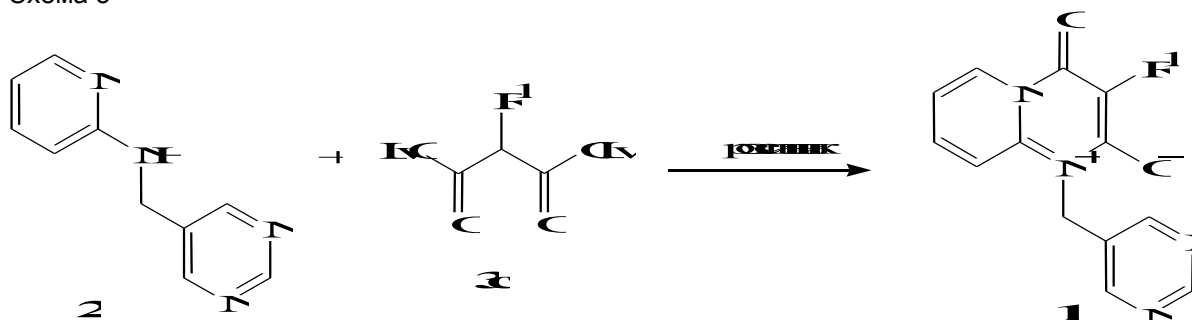
Helvetica Chimica Acta 1991, 74(2), 309–314). Нітрили формули 3g дуже легко одержують способами, відомими в даній галузі техніки, і багато з них комерційно доступні.

Схема 2b



Сполуки формули 1 також можуть бути отримані обробкою сполуки формули 2 активованими складними ефірами формули 3с, де LvO є активованою заміщуваною групою, як показано на схемі 3. Прикладами Lv, переважними для простоти синтезу або реакційної здатності, є фенол, 4-нітрофеніл або галогензаміщений фенол (наприклад 2,4,6-трихлорфеніл, пентахлорфеніл або пентафторфеніл), які описані в Archiv der Pharmazie (Weinheim, Germany) 1991, 324, 863–866. Інші активовані складні ефіри є загальновідомими в даній галузі техніки та включають, у тому числі, складні ефіри N-гідроксисукциніміду (див. наприклад J. Am. Chem. Soc. 2002, 124, 6872–6878). Стандартні температури варіюють від 50 до 200 °C. Варти уваги є температури від 50 до 150 °C, які зазвичай забезпечують швидкий час реакції та високий вихід. Дані реакції можуть проводитися з або без розчинника, такого як толуол, і в мікрохвильових реакторах у рамках тих же діапазонів температур. Стандартний час реакції варіює від 5 хвилин до 2 годин.

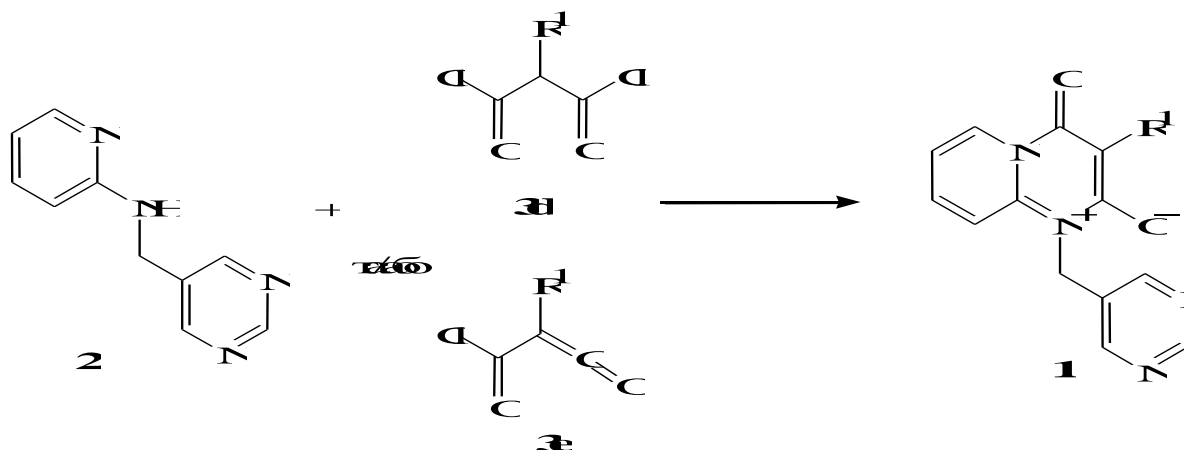
Схема 3



Сполуки формули 3с можуть бути отримані наприклад зі сполук формули 3а (див. наприклад J. Het. Chem. 1980, 17, 337).

Сполуки формули 1 також можуть бути отримані конденсацією сполуки формули 2 зі сполуками формули 3d або 3е або конденсацією сполуки формули 2 із сумішами сполук формули 3d і 3е, як показано на схемі 4. Дані реакції звичайно проводять в інертному розчиннику, такому як дихлорметан, і необов'язково при наявності двох або більше еквівалентів акцептора кислоти (див. наприклад Zeitschrift für Naturforschung, Teil B: Anorganische Chemie, Organische Chemie 1982, 37B(2), 222–233). Стандартні акцептори кислоти включають, у тому числі, триетиламін, N, N-діізопропілетиламін, піридин і заміщені піридини та гідроксиди, карбонати та бікарбонати металів.

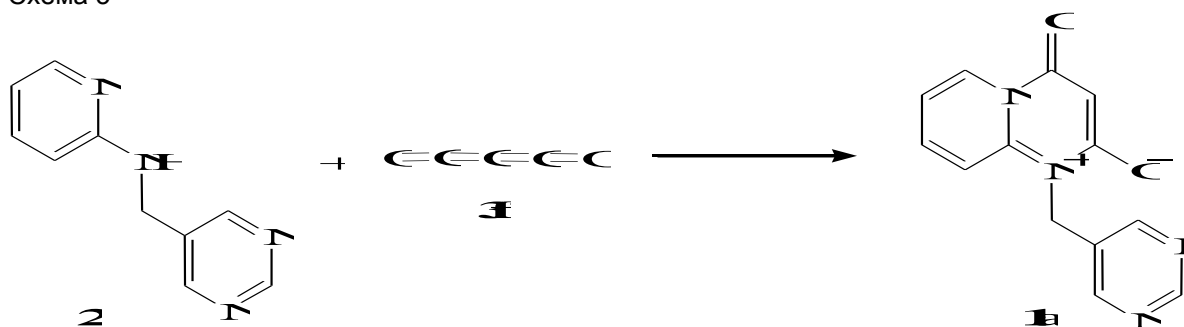
Схема 4



Сполуки формули 1a можуть бути отримані конденсацією сполуки формули 2 з недокисом вуглецю (3f) (див. наприклад J. Org. Chem. 1972, 37(9), 1422–1425), як показано на схемі 5.

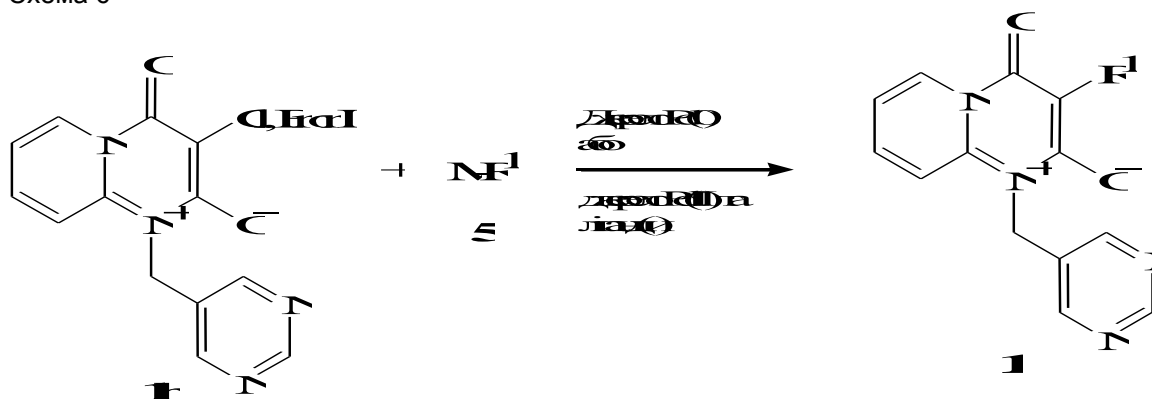
5 Реакції зазвичай проводять в інертному розчиннику, такому як простий ефір, і можуть включати застосування каталізатора, такого як AlCl_3 .

Схема 5



10 Сполуки формули 1 можуть бути отримані зі сполук формули 1b і сполук формули 5, де M з R1 утворює боронову кислоту, складний ефір боронової кислоти або трифторборатну сіль, або M є триалкілстанілом або цинком, як показано на схемі 6.

Схема 6

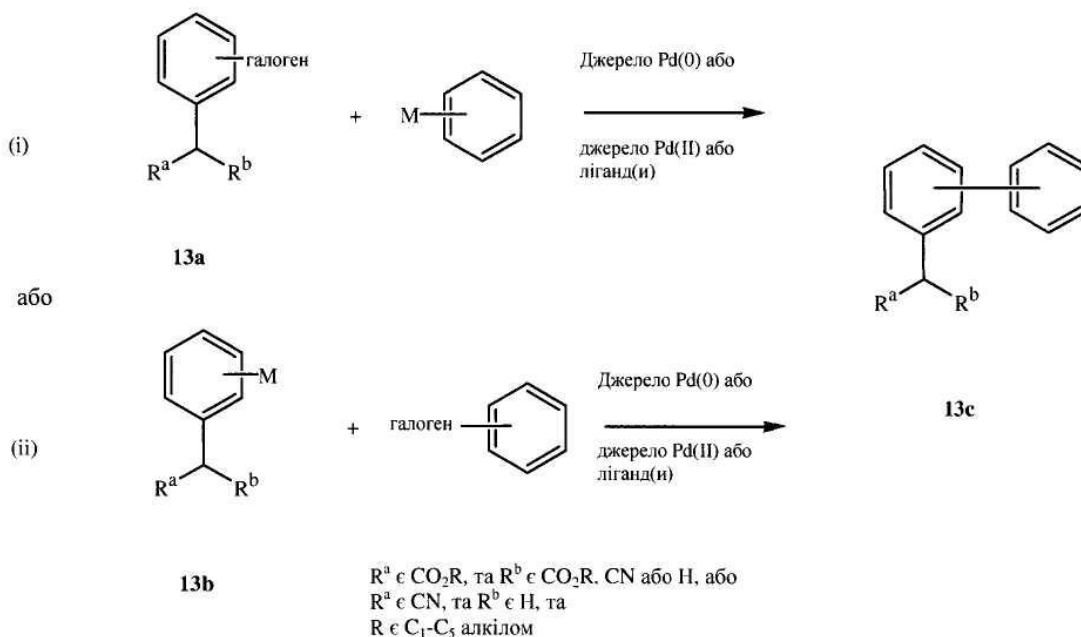


15 Подібним чином можуть бути отримані сполуки формули 1, де R1 складається із двох безпосередньо зв'язаних ароматичних кілець (наприклад фенільне кільце зв'язане із другим фенільним кільцем, фенільне кільце зв'язане з піридинільним кільцем, або піридинільне кільце зв'язане із другим піридинільним кільцем), можуть бути оброблені паладій-каталізованим сполученням двох відповідно заміщених ароматичних кілець. Дані паладій-каталізовані

20 сполучення між хлоридом, бромідом або йодидом ароматичного ряду та бороноювою кислотою або складним ефіром ароматичного ряду, або реагентом олова або цинку ароматичного ряду загальновідомі та докладно описані в даній галузі техніки. Наприклад, див. схему 6a, де сполука формули 13a або 13b поєднують із відповідно до заміщених фенільним кільцем з одержанням біфенільної сполуки формули 13c. M є таким, як визначено вище для схеми 6.

25

Схема 6а

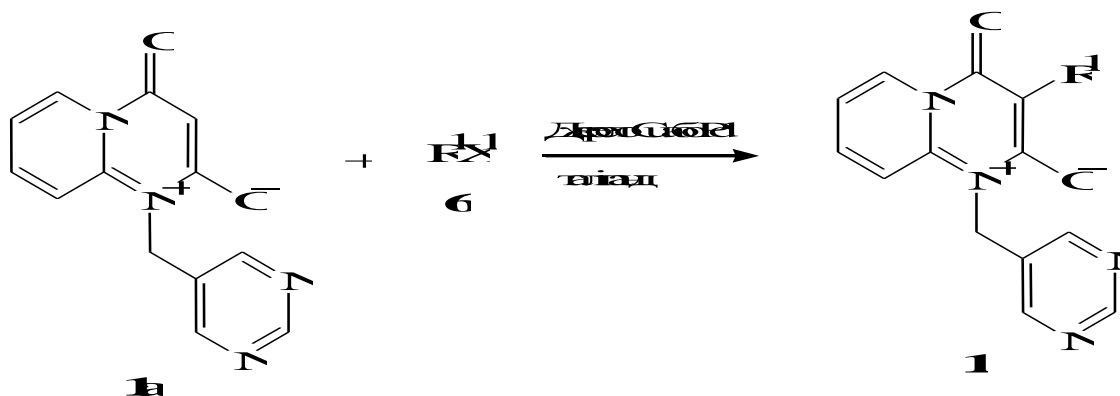


Дані реакції сполучення зазвичай проводять у присутності палладієвого каталізатора та основи необов'язково в інертній атмосфері. Палладієві каталізатори, застосовувані для даних реакцій сполучення, зазвичай включають палладій у формальному ступені окиснення або 0 (тобто Pd(0)), або 2 (тобто Pd(II)). Велика різноманітність таких сполук і комплексів, які містять палладій, придатні в якості каталізаторів для даних реакцій. Приклади сполук і комплексів, які містять палладій, придатних у якості каталізаторів у способах, включають $\text{PdCl}_2(\text{PPh}_3)_2$, (біс(трифенілфосфін)палладію (II) дихлорид), $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$, (тетракіс(трифенілфосфін)палладій(0)), $\text{Pd}(\text{C}_5\text{H}_7\text{O}_2)_2$, (палладію(II) ацетилацетонат), $\text{Pd}_2(\text{dba})_3$, (трис(добензиліденацетон)дипалладій(0)) та [1,1'-біс(дифенілфосфіно)ферроцен]дихлорпалладій(II). Дані способи сполучення в основному проводять у рідкій фазі, і, отже, палладієвий каталізатор переважно має гарну розчинність у рідкій фазі. Придатні розчинники включають, наприклад, воду, прості ефіри, такі як 1,2-диметоксигетан, амід, такі як N, N-диметилацетамід, і негалогеновані ароматичні вуглеводні, такі як толуол.

Способи сполучення можуть бути проведені в широкому діапазоні температур, що коливаються від 25 до приблизно 200°C. Примітними є температури від приблизно 60 до приблизно 150°C, які зазвичай забезпечують швидкий час реакції та високі виходи продуктів. Загальні способи та методи комбінації Стилле, Негіши та Сузукі з арилйодидами, арилбромідами або арилхлоридами та арилоловом, арилцинком або арилбориною кислотою відповідно, загальновідомі в літературі; див. наприклад E. Negishi, Handbook of Organopalladium Chemistry for Organical Synthesis, Wiley-Interscience, 2002, New York, New York.

Сполуки формули 1 можуть бути отримані зі сполук формули 1a (тобто формули 1, де R1 є H) і сполук формули 6, де X1 є Cl, Br або I (переважно Br або I), як показано на схемі 7.

Схема 7

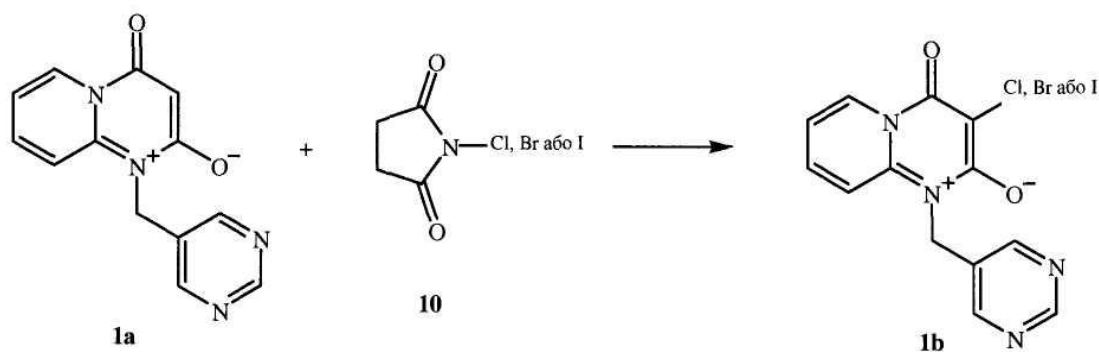


Дані реакції зазвичай проводять у присутності мідного або палладієвого каталізатора переважно в інертній атмосфері. Мідні каталізатори, застосовувані для даного способу, зазвичай містять мідь у металевій формі (наприклад у вигляді порошку) або мідь у формальному ступені окиснення 1 (тобто Cu(I)). Приклади сполук, які містять мідь, придатних у якості каталізаторів у способі за схемою 7, включають Cu, CuI, CuBr, CuCl. Приклади сполук, які містять палладій, придатних у якості каталізаторів у способі за схемою 7, включають Pd(OAc)₂. Придатні розчинники для способу за схемою 7 включають, наприклад, прості ефіри, такі як 1,4-діоксан, амід, такі як N, N-диметилацетамід, і диметилсульфоксид.

Спосіб за схемою 7 може бути проведений у широкому діапазоні температур від 25 до 200°C. Вартими уваги є температури від 40 до 150°C. Спосіб за схемою 7 може бути проведений у присутності ліганду. Велика різноманітність зв'язувальних мідь сполук придатна в якості лігандів для даного способу. Приклади придатних лігандів включають, у тому числі, 1,10-фенантролін, N, N-диметилетилендіамін, L-пролін та 2-піколінову кислоту. Загальні методи та способи каналізованих міддю реакцій сполучення за Ульманом широко відомі в літературі; див. наприклад Xie, Ma, et al. Org. Lett. 2005, 7, 4693–4695.

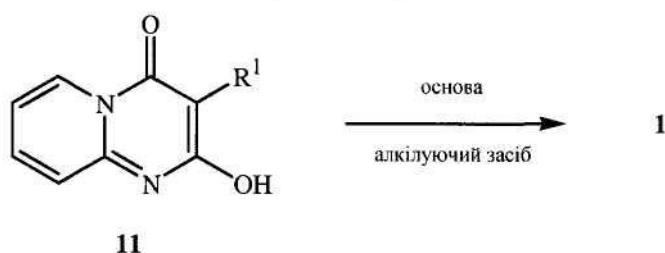
Сполуки формули 1b можуть бути отримані зі сполук формули 1a галогенуванням із застосуванням, наприклад, рідкого броду або N-галогенсукцинімідів формули 10, як показано на схемі 11. Зазвичай реакцію проводять в інертному розчиннику, більш звичайно у галогенованому розчиннику, такому як метиленхлорид або 1, 2-дихлоретан. Реакцію звичайно проводять при температурах від 0 до 80°C, більш звичайно при температурі навколишнього середовища.

Схема 11



Сполуки формули 1 також можуть бути отримані алкілюванням сполук формули 11 із застосуванням відповідно заміщених алкілюючих засобів та основ, таких як калію карбонат, як показано на схемі 12 (див. наприклад Kappe, T. et al. Monatshefte für Chemie 1971, 102, 412-424; і Urban, M. G.; Arnold, W. Helvetica Chimica Acta 1970, 53, 905-922). Алкілюючі засоби включають, у тому числі, алкілхлориди, алкілброміди, алкіліодиди та ефіри алкілсульфофосфати. Велика різноманітність основ і розчинників може бути застосована в способі за схемою 12, і дані основи та розчинники загальновідомі в даній галузі техніки.

Схема 12



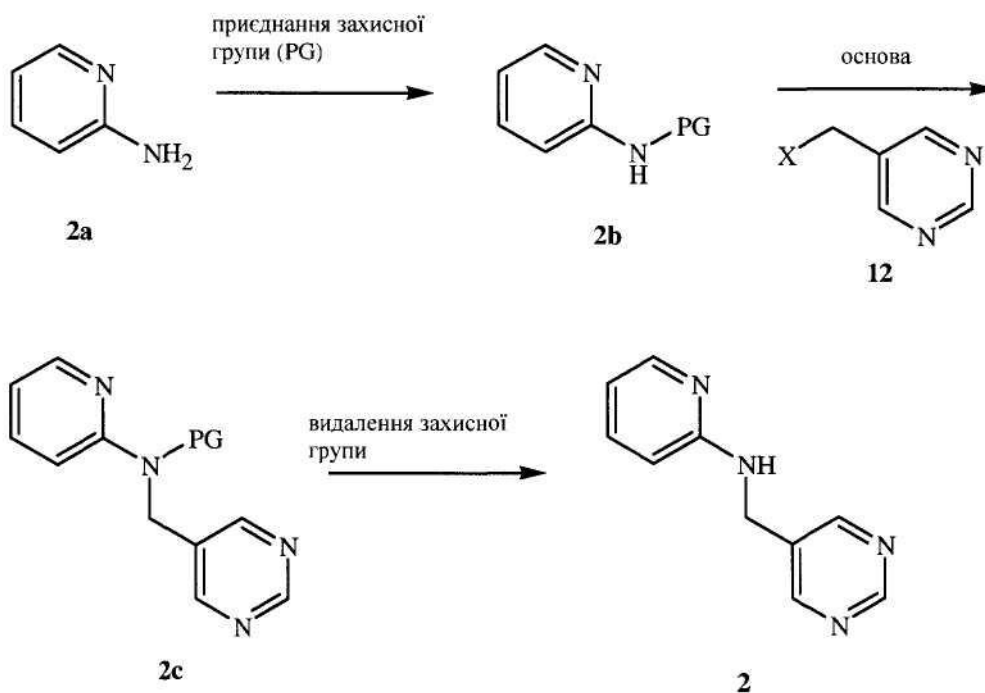
Сполуки формули 11 можуть бути отримані з 2-амінопіридину способами, аналогічними тим, які показані на схемах 1-5.

Як показано на схемах 1-5, сполука формули 2 є важливою проміжною сполукою, придатною в одержанні сполук формули 1. Сполука формули 2 є варіантом здійснення даного винаходу. Додатковим варіантом здійснення даного винаходу є застосування сполуки формули 2 в одержанні сполук формули 1.

Фахівець у даній галузі визнає, що сполука формули 2 також може застосовуватися в якості його солі, отриманої додаванням кислоти, (наприклад, хлористоводнева сіль або сіль оцтової кислоти) у способах сполучення за схемами 1-5.

Зокрема придатний спосіб одержання сполуки формули 2 показаний на схемі 13. У способі за схемою 13 2-амінопіридин (2a) захищений підходящими захисними групами, такими як, у тому числі, трет-бутоксикарбоніл, ацетил або форміл, для утворення проміжної сполуки формули 2b, де PG є захисною групою. Сполуку формули 2b потім алкілюють сполукою формули 12 (де X є заміщуваною групою, такою як галоген) з одержанням проміжної сполуки формули 2c. Захисну групу видаляють з одержанням сполуки формули 2. Умови для утворення та видалення захисних груп на аміній функціональній групі відомі в літературі (див. наприклад Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. *Protective Groups in Organic Synthesis*, 2nd ed.; Wiley: New York, 1991).

Схема 13



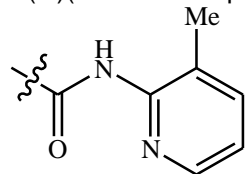
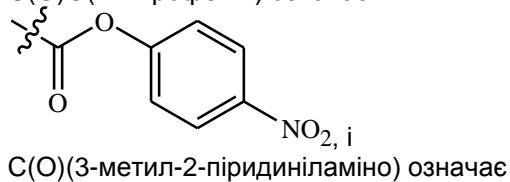
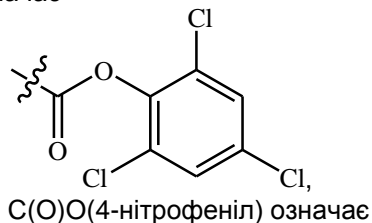
Альтернативний спосіб одержання сполуки формули 2 здійснюють відновленням амінуванням відповідної карбонільної сполуки. Даний спосіб показаний на етапах А і В прикладу 1 синтезу.

Інший альтернативний спосіб одержання сполуки формули 2 здійснюють реакцією

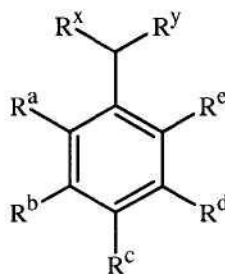
відповідного аміну з галогензаміщеною сполукою, аналогічною сполуці формули 2a (тобто формули 2a, де аміногрупа заміщена галогеном) при наявності мідного або палладієвого каталізатора.

5 Сполуки формули 1, у яких замісники R1 відмінні від тих, які, зокрема, зазначено для схем 1-13, можуть бути отримані основними способами, відомими в галузі синтетичної органічної хімії, включаючи способи, аналогічні тим, які описано для схем 1-13.

Приклади проміжних сполук, придатних в одержанні сполук даного винаходу, показані в таблицях I-1-I-43. Наступні скорочення використовуються в таблицях, які слідують: Me означає метил, Et означає етил, Pr означає пропіл, Ph означає феніл, C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл) означає



ТАБЛИЦЯ I-1



$R^x \in C(O)OH$; $R^y \in H$; R^b, R^c, R^d і $R^e \in H$;

R^a	R^a	R^a	R^a
H	O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-фтор-4-хлорфеніл
Cl	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-метил-4-хлорфеніл
Br	OCHF ₂	4-бромфеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
I	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
ціано	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл

Et	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Pr	феніл	2-фтор-6-хлор-3-піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	2-бром-5-хлор-4-піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-бром-5-фторфеніл	2,5-дифторфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
OMe	3-(OCF ₃)феніл	2,4-дихлорфеніл	2,5-дихлорфеніл
OEt	4-фторфеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
			2-хлор-5-(CF ₃)феніл

R^x ∈ C(O)OH; R^y ∈ H; R^a, R^c, R^d i R^e ∈ H;

<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-фтор-4-хлорфеніл
Cl	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-метил-4-хлорфеніл
Br	OCHF ₂	4-бромфеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
I	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
ціано	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
Et	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Pr	феніл	2-фтор-6-хлор-3-піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	2-бром-5-хлор-4-піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-бром-5-фторфеніл	2,5-дифторфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл

CHF ₂	3- ціанофеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
OMe	3- (OCF ₃)феніл	2,4-дихлорфеніл	2,5-дихлорфеніл
OEt	4- фторфеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
			2-хлор-5-(CF ₃)феніл

$R^X \in C(O)OH$; $R^Y \in H$; R^a, R^b, R^d і $R^e \in H$;

R^c	R^c	R^c	R^c
H	O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-фтор-4-хлорфеніл
Cl	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-метил-4-хлорфеніл
Br	OCHF ₂	4-бромфеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
I	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
ціано	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
Et	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Pr	феніл	2-фтор-6-хлор-3- піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
<i>i</i> -Pr	2- фторфеніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
<i>t</i> -Bu	3- хлорфеніл	2-бром-5-хлор-4- піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
CF ₃	3- (CF ₃)феніл	3-бром-5-фторфеніл	2,5-дифторфеніл
CH ₂ F	3- фторфеніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CHF ₂	3- ціанофеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
OMe	3- (OCF ₃)феніл	2,4-дихлорфеніл	2,5-дихлорфеніл
OEt	4- фторфеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
			2-хлор-5-(CF ₃)феніл

$R^X \in C(O)OH$; $R^Y \in H$; $R^a \in F$; R^c, R^d і $R^e \in H$;

R^b	R^b	R^b	R^b
H	O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-фтор-4-хлорфеніл

Cl	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-метил-4-хлорфеніл
Br	OCHF ₂	4-бромфеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
I	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
ціано	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
Et	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Pr	феніл	2-фтор-6-хлор-3-піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	2-бром-5-хлор-4-піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-бром-5-фторфеніл	2,5-дифторфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
OMe	3-(OCF ₃)феніл	2,4-дихлорфеніл	2,5-дихлорфеніл
OEt	4-фторфеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
			2-хлор-5-(CF ₃)феніл

R^x є C(O)OH; R^y є H; R^a є F; R^b, R^d і R^e є H;

<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-фтор-4-хлорфеніл
Cl	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-метил-4-хлорфеніл
Br	OCHF ₂	4-бромфеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
I	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
ціано	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
Et	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Pr	феніл	2-фтор-6-хлор-3-піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
<i>t</i> -Bu	3-	2-бром-5-хлор-4-	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл

	хлорфеніл	піридиніл	
CF ₃	3- (CF ₃)феніл	3-бром-5-фторфеніл	2,5-дифторфеніл
CH ₂ F	3- фторфеніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CHF ₂	3- ціанофеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
OMe	3- (OCF ₃)феніл	2,4-дихлорфеніл	2,5-дихлорфеніл
OEt	4- фторфеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
			2-хлор-5-(CF ₃)феніл

R^x ∈ C(O)OH; R^y ∈ H; R^a ∈ F; R^b, R^c i R^e ∈ H;

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-фтор-4-хлорфеніл
Cl	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-метил-4-хлорфеніл
Br	OCHF ₂	4-бромфеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
I	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
ціано	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
Et	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Pr	феніл	2-фтор-6-хлор-3- піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
<i>i</i> -Pr	2- фторфеніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
<i>t</i> -Bu	3- хлорфеніл	2-бром-5-хлор-4- піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
CF ₃	3- (CF ₃)феніл	3-бром-5-фторфеніл	2,5-дифторфеніл
CH ₂ F	3- фторфеніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CHF ₂	3- ціанофеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
OMe	3- (OCF ₃)феніл	2,4-дихлорфеніл	2,5-дихлорфеніл
OEt	4- фторфеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл

$R^X \in C(O)OH; R^Y \in H; R^a \in F; R^b, R^c \text{ i } R^d \in H;$

R^e	R^e	R^e	R^e
H	O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-фтор-4-хлорфеніл
Cl	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-метил-4-хлорфеніл
Br	OCHF ₂	4-бромфеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
I	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
ціано	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
Et	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Pr	феніл	2-фтор-6-хлор-3-піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	2-бром-5-хлор-4-піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-бром-5-фторфеніл	2,5-дифторфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
OMe	3-(OCF ₃)феніл	2,4-дихлорфеніл	2,5-дихлорфеніл
OEt	4-фторфеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
			2-хлор-5-(CF ₃)феніл

 $R^X \in C(O)OH; R^Y \in H; R^a \in Cl; R^c, R^d \text{ i } R^e \in H;$

R^b	R^b	R^b	R^b
H	O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-фтор-4-хлорфеніл
Cl	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-метил-4-хлорфеніл
Br	OCHF ₂	4-бромфеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
I	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
ціано	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
Et	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл

Pr	феніл	2-фтор-6-хлор-3-піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	2-бром-5-хлор-4-піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-бром-5-фторфеніл	2,5-дифторфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
OMe	3-(OCF ₃)феніл	2,4-дихлорфеніл	2,5-дихлорфеніл
OEt	4-фторфеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
			2-хлор-5-(CF ₃)феніл

R^x ∈ C(O)OH; R^y ∈ H; R^a ∈ Cl; R^b, R^d і R^e ∈ H;

<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-фтор-4-хлорфеніл
Cl	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-метил-4-хлорфеніл
Br	OCHF ₂	4-бромфеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
I	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
ціано	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
Et	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Pr	феніл	2-фтор-6-хлор-3-піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	2-бром-5-хлор-4-піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-бром-5-фторфеніл	2,5-дифторфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CHF ₂	3-	3-фтор-4-хлорфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл

OMe	ціанофеніл 3- (OCF ₃)феніл	2,4-дихлорфеніл	2,5-дихлорфеніл
OEt	4- фторфеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл 2-хлор-5-(CF ₃)феніл

 $R^X \in C(O)OH; R^Y \in H; R^a \in Cl; R^b, R^c \text{ i } R^e \in H;$

R^d	R^d	R^d	R^d
H	O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-фтор-4-хлорфеніл
Cl	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-метил-4-хлорфеніл
Br	OCHF ₂	4-бромфеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
I	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
ціано	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
Et	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Pr	феніл	2-фтор-6-хлор-3- піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
<i>i</i> -Pr	2- фторфеніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
<i>t</i> -Bu	3- хлорфеніл	2-бром-5-хлор-4- піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
CF ₃	3- (CF ₃)феніл	3-бром-5-фторфеніл	2,5-дифторфеніл
CH ₂ F	3- фторфеніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CHF ₂	3- ціанофеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
OMe	3- (OCF ₃)феніл	2,4-дихлорфеніл	2,5-дихлорфеніл
OEt	4- фторфеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл 2-хлор-5-(CF ₃)феніл

 $R^X \in C(O)OH; R^Y \in H; R^a \in Cl; R^b, R^c \text{ i } R^d \in H;$

R^e	R^e	R^e	R^e
H	O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-фтор-4-хлорфеніл
Cl	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-метил-4-хлорфеніл

Br	OCHF ₂	4-бромфеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
I	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
ціано	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
Et	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Pr	феніл	2-фтор-6-хлор-3- піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
<i>i</i> -Pr	2- фторфеніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
<i>t</i> -Bu	3- хлорфеніл	2-бром-5-хлор-4- піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
CF ₃	3- (CF ₃)феніл	3-бром-5-фторфеніл	2,5-дифторфеніл
CH ₂ F	3- фторфеніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CHF ₂	3- ціанофеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
OMe	3- (OCF ₃)феніл	2,4-дихлорфеніл	2,5-дихлорфеніл
OEt	4- фторфеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
			2-хлор-5-(CF ₃)феніл

R^x є C(O)OH; R^y є H; R^a є OMe; R^c, R^d і R^e є H;

<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-фтор-4-хлорфеніл
Cl	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-метил-4-хлорфеніл
Br	OCHF ₂	4-бромфеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
I	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
ціано	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
Et	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Pr	феніл	2-фтор-6-хлор-3- піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
<i>i</i> -Pr	2- фторфеніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
<i>t</i> -Bu	3- хлорфеніл	2-бром-5-хлор-4- піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл

CF ₃	3- (CF ₃)феніл	3-бром-5-фторфеніл	2,5-дифторфеніл
CH ₂ F	3- фторфеніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CHF ₂	3- ціанофеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
OMe	3- (OCF ₃)феніл	2,4-дихлорфеніл	2,5-дихлорфеніл
OEt	4- фторфеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
			2-хлор-5-(CF ₃)феніл

R^x є C(O)OH; R^y є H; R^a є OMe; R^b, R^d і R^e є H;

<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-фтор-4-хлорфеніл
Cl	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-метил-4-хлорфеніл
Br	OCHF ₂	4-бромфеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
I	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
ціано	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
Et	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Pr	феніл	2-фтор-6-хлор-3- піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
<i>i</i> -Pr	2- фторфеніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
<i>t</i> -Bu	3- хлорфеніл	2-бром-5-хлор-4- піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
CF ₃	3- (CF ₃)феніл	3-бром-5-фторфеніл	2,5-дифторфеніл
CH ₂ F	3- фторфеніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CHF ₂	3- ціанофеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
OMe	3- (OCF ₃)феніл	2,4-дихлорфеніл	2,5-дихлорфеніл
OEt	4- фторфеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
			2-хлор-5-(CF ₃)феніл

$R^X \in C(O)OH; R^Y \in H; R^a \in OMe; R^b, R^c \text{ i } R^e \in H;$

R^d	R^d	R^d	R^d
H	O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-фтор-4-хлорфеніл
Cl	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-метил-4-хлорфеніл
Br	OCHF ₂	4-бромфеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
I	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
ціано	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
Et	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Pr	феніл	2-фтор-6-хлор-3-піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	2-бром-5-хлор-4-піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-бром-5-фторфеніл	2,5-дифторфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
OMe	3-(OCF ₃)феніл	2,4-дихлорфеніл	2,5-дихлорфеніл
OEt	4-фторфеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
			2-хлор-5-(CF ₃)феніл

 $R^X \in C(O)OH; R^Y \in H; R^a \in OMe; R^b, R^c \text{ i } R^d \in H;$

R^e	R^e	R^e	R^e
H	O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-фтор-4-хлорфеніл
Cl	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-метил-4-хлорфеніл
Br	OCHF ₂	4-бромфеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
I	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
ціано	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
Et	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Pr	феніл	2-фтор-6-хлор-3-	2-метил-4-(CF ₃)феніл

<i>i</i> -Pr	2- фторфеніл	піридиніл 2,6-дихлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
<i>t</i> -Bu	3- хлорфеніл	2-бром-5-хлор-4- піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
CF ₃	3- (CF ₃)феніл	3-бром-5-фторфеніл	2,5-дифторфеніл
CH ₂ F	3- фторфеніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CHF ₂	3- ціанофеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
OMe	3- (OCF ₃)феніл	2,4-дихлорфеніл	2,5-дихлорфеніл
OEt	4- фторфеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
			2-хлор-5-(CF ₃)феніл

R^X ∈ C(O)OH; R^Y ∈ H; R^a ∈ Me; R^c, R^d i R^e ∈ H;

<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-фтор-4-хлорфеніл
Cl	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-метил-4-хлорфеніл
Br	OCHF ₂	4-бромфеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
I	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
ціано	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
Et	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Pr	феніл	2-фтор-6-хлор-3- піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
<i>i</i> -Pr	2- фторфеніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
<i>t</i> -Bu	3- хлорфеніл	2-бром-5-хлор-4- піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
CF ₃	3- (CF ₃)феніл	3-бром-5-фторфеніл	2,5-дифторфеніл
CH ₂ F	3- фторфеніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CHF ₂	3- ціанофеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл

OMe	3- (OCF ₃)феніл	2,4-дихлорфеніл	2,5-дихлорфеніл
OEt	4- фторфеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
			2-хлор-5-(CF ₃)феніл

$R^X \in C(O)OH$; $R^Y \in H$; $R^a \in Me$; R^b, R^d і $R^e \in H$;

R^C	R^C	R^C	R^C
H	O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-фтор-4-хлорфеніл
Cl	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-метил-4-хлорфеніл
Br	OCHF ₂	4-бромфеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
I	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
ціано	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
Et	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Pr	феніл	2-фтор-6-хлор-3- піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
<i>i</i> -Pr	2- фторфеніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
<i>t</i> -Bu	3- хлорфеніл	2-бром-5-хлор-4- піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
CF ₃	3- (CF ₃)феніл	3-бром-5-фторфеніл	2,5-дифторфеніл
CH ₂ F	3- фторфеніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CHF ₂	3- ціанофеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
OMe	3- (OCF ₃)феніл	2,4-дихлорфеніл	2,5-дихлорфеніл
OEt	4- фторфеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
			2-хлор-5-(CF ₃)феніл

$R^X \in C(O)OH$; $R^Y \in H$; $R^a \in Me$; R^b, R^c і $R^e \in H$;

R^d	R^d	R^d	R^d
H	O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-фтор-4-хлорфеніл
Cl	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-метил-4-хлорфеніл
Br	OCHF ₂	4-бромфеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл

I	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
ціано	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
Et	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Pr	феніл	2-фтор-6-хлор-3-піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	2-бром-5-хлор-4-піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-бром-5-фторфеніл	2,5-дифторфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
OMe	3-(OCF ₃)феніл	2,4-дихлорфеніл	2,5-дихлорфеніл
OEt	4-фторфеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
			2-хлор-5-(CF ₃)феніл

R^x ∈ C(O)OH; R^y ∈ H; R^a ∈ Me; R^b, R^c i R^d ∈ H;

<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-фтор-4-хлорфеніл
Cl	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-метил-4-хлорфеніл
Br	OCHF ₂	4-бромфеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
I	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
ціано	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
Et	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Pr	феніл	2-фтор-6-хлор-3-піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	2-бром-5-хлор-4-піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
CF ₃	3-	3-бром-5-фторфеніл	2,5-дифторфеніл

CH ₂ F	(CF ₃)феніл 3-фторфеніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
OMe	3-(OCF ₃)феніл	2,4-дихлорфеніл	2,5-дихлорфеніл
OEt	4-фторфеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
			2-хлор-5-(CF ₃)феніл

R^x ∈ C(O)OH; R^y ∈ H; R^d ∈ Cl; R^a, R^c i R^e ∈ H;

<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-фтор-4-хлорфеніл
Cl	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-метил-4-хлорфеніл
Br	OCHF ₂	4-бромфеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
I	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
ціано	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
Et	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Pr	феніл	2-фтор-6-хлор-3-піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	2-бром-5-хлор-4-піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-бром-5-фторфеніл	2,5-дифторфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
OMe	3-(OCF ₃)феніл	2,4-дихлорфеніл	2,5-дихлорфеніл
OEt	4-фторфеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
			2-хлор-5-(CF ₃)феніл

$R^x \in C(O)OH; R^y \in H; R^d \in CF_3; R^a, R^c \text{ i } R^e \in H;$

R^b	R^b	R^b	R^b
H	O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-фтор-4-хлорфеніл
Cl	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-метил-4-хлорфеніл
Br	OCHF ₂	4-бромфеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
I	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
ціано	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
Et	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Pr	феніл	2-фтор-6-хлор-3-піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	2-бром-5-хлор-4-піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-бром-5-фторфеніл	2,5-дифторфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
OMe	3-(OCF ₃)феніл	2,4-дихлорфеніл	2,5-дихлорфеніл
OEt	4-фторфеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
			2-хлор-5-(CF ₃)феніл

 $R^x \in C(O)OH; R^y \in H; R^b \in Br; R^a, R^c \text{ i } R^e \in H;$

R^d	R^d	R^d	R^d
H	O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-фтор-4-хлорфеніл
Cl	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-метил-4-хлорфеніл
Br	OCHF ₂	4-бромфеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
I	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
ціано	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
Et	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Pr	феніл	2-фтор-6-хлор-3-	2-метил-4-(CF ₃)феніл

<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	піридиніл 2,6-дихлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	2-бром-5-хлор-4-піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-бром-5-фторфеніл	2,5-дифторфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
OMe	3-(OCF ₃)феніл	2,4-дихлорфеніл	2,5-дихлорфеніл
OEt	4-фторфеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл 2-хлор-5-(CF ₃)феніл

R^x є C(O)OH; R^y є H; R^b є OCF₃; R^a, R^c і R^e є H;

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-фтор-4-хлорфеніл
Cl	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-метил-4-хлорфеніл
Br	OCHF ₂	4-бромфеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
I	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
ціано	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
Et	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Pr	феніл	2-фтор-6-хлор-3-піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	2-бром-5-хлор-4-піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-бром-5-фторфеніл	2,5-дифторфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл

OMe	3- (OCF ₃)феніл	2,4-дихлорфеніл	2,5-дихлорфеніл
OEt	4- фторфеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл 2-хлор-5-(CF ₃)феніл

$R^X \in C(O)OH$; $R^Y \in H$; $R^b \in OMe$; R^a, R^c і $R^e \in H$;

$\underline{R^d}$	$\underline{R^d}$	$\underline{R^d}$	$\underline{R^d}$
H	O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-фтор-4-хлорфеніл
Cl	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-метил-4-хлорфеніл
Br	OCHF ₂	4-бромфеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
I	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
ціано	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
Et	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Pr	феніл	2-фтор-6-хлор-3- піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
<i>i</i> -Pr	2- фторфеніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
<i>t</i> -Bu	3- хлорфеніл	2-бром-5-хлор-4- піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
CF ₃	3- (CF ₃)феніл	3-бром-5-фторфеніл	2,5-дифторфеніл
CH ₂ F	3- фторфеніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CHF ₂	3- ціанофеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
OMe	3- (OCF ₃)феніл	2,4-дихлорфеніл	2,5-дихлорфеніл
OEt	4- фторфеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл 2-хлор-5-(CF ₃)феніл

$R^X \in C(O)OH$; $R^Y \in H$; $R^b \in F$; R^a, R^c і $R^e \in H$;

$\underline{R^d}$	$\underline{R^d}$	$\underline{R^d}$	$\underline{R^d}$
H	O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-фтор-4-хлорфеніл
Cl	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-метил-4-хлорфеніл
Br	OCHF ₂	4-бромфеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл

I	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
ціано	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
Et	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Pr	феніл	2-фтор-6-хлор-3-піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	2-бром-5-хлор-4-піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-бром-5-фторфеніл	2,5-дифторфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
OMe	3-(OCF ₃)феніл	2,4-дихлорфеніл	2,5-дихлорфеніл
OEt	4-фторфеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
			2-хлор-5-(CF ₃)феніл

R^x ∈ C(O)OH; R^y ∈ H; R^b ∈ CN; R^a, R^c і R^e ∈ H;

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-фтор-4-хлорфеніл
Cl	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-метил-4-хлорфеніл
Br	OCHF ₂	4-бромфеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
I	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
ціано	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
Et	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Pr	феніл	2-фтор-6-хлор-3-піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	2-бром-5-хлор-4-піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
CF ₃	3-	3-бром-5-фторфеніл	2,5-дифторфеніл

CH ₂ F	(CF ₃)феніл 3-фторфеніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
OMe	3-(OCF ₃)феніл	2,4-дихлорфеніл	2,5-дихлорфеніл
OEt	4-фторфеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
			2-хлор-5-(CF ₃)феніл

R^x ∈ C(O)OH; R^y ∈ H; R^b ∈ Me; R^a, R^c i R^e ∈ H;

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-фтор-4-хлорфеніл
Cl	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-метил-4-хлорфеніл
Br	OCHF ₂	4-бромфеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
I	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
ціано	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
Et	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Pr	феніл	2-фтор-6-хлор-3-піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	2-бром-5-хлор-4-піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-бром-5-фторфеніл	2,5-дифторфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
OMe	3-(OCF ₃)феніл	2,4-дихлорфеніл	2,5-дихлорфеніл
OEt	4-фторфеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
			2-хлор-5-(CF ₃)феніл

$R^X \in C(O)OH; R^Y \in H; R^b \in I; R^a, R^c \text{ i } R^e \in H;$

R^d	R^d	R^d	R^d
H	O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-фтор-4-хлорфеніл
Cl	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-метил-4-хлорфеніл
Br	OCHF ₂	4-бромфеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
I	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
ціано	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
Et	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Pr	феніл	2-фтор-6-хлор-3-піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	2-бром-5-хлор-4-піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-бром-5-фторфеніл	2,5-дифторфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
OMe	3-(OCF ₃)феніл	2,4-дихлорфеніл	2,5-дихлорфеніл
OEt	4-фторфеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
			2-хлор-5-(CF ₃)феніл

 $R^X \in C(O)OH; R^Y \in H; R^a \text{ i } R^b \in F; R^c \text{ i } R^e \in H;$

R^d	R^d	R^d	R^d
H	O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-фтор-4-хлорфеніл
Cl	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-метил-4-хлорфеніл
Br	OCHF ₂	4-бромфеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
I	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
ціано	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
Et	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Pr	феніл	2-фтор-6-хлор-3-	2-метил-4-(CF ₃)феніл

<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	піридиніл 2,6-дихлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	2-бром-5-хлор-4-піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-бром-5-фторфеніл	2,5-дифторфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
OMe	3-(OCF ₃)феніл	2,4-дихлорфеніл	2,5-дихлорфеніл
OEt	4-фторфеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл 2-хлор-5-(CF ₃)феніл

R^x є C(O)OH; R^y є H; R^a є F; R^b є Cl; R^c і R^e є H;

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-фтор-4-хлорфеніл
Cl	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-метил-4-хлорфеніл
Br	OCHF ₂	4-бромфеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
I	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
ціано	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
Et	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Pr	феніл	2-фтор-6-хлор-3-піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	2-бром-5-хлор-4-піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-бром-5-фторфеніл	2,5-дифторфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл

OMe	3- (OCF ₃)феніл	2,4-дихлорфеніл	2,5-дихлорфеніл
OEt	4- фторфеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
			2-хлор-5-(CF ₃)феніл

$R^X \in C(O)OH$; $R^Y \in H$; $R^C \in OMe$; $R^a, R^b, R^e \in H$;

R^d	R^d	R^d	R^d
H	O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-фтор-4-хлорфеніл
Cl	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-метил-4-хлорфеніл
Br	OCHF ₂	4-бромфеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
I	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
ціано	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
Et	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Pr	феніл	2-фтор-6-хлор-3- піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
<i>i</i> -Pr	2- фторфеніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
<i>t</i> -Bu	3- хлорфеніл	2-бром-5-хлор-4- піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
CF ₃	3- (CF ₃)феніл	3-бром-5-фторфеніл	2,5-дифторфеніл
CH ₂ F	3- фторфеніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CHF ₂	3- ціанофеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
OMe	3- (OCF ₃)феніл	2,4-дихлорфеніл	2,5-дихлорфеніл
OEt	4- фторфеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
			2-хлор-5-(CF ₃)феніл

$R^X \in C(O)OH$; $R^Y \in H$; $R^C \in Me$; $R^a, R^b, R^e \in H$;

R^d	R^d	R^d	R^d
H	O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-фтор-4-хлорфеніл
Cl	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-метил-4-хлорфеніл
Br	OCHF ₂	4-бромфеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл

I	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
ціано	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
Et	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Pr	феніл	2-фтор-6-хлор-3-піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	2-бром-5-хлор-4-піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-бром-5-фторфеніл	2,5-дифторфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
OMe	3-(OCF ₃)феніл	2,4-дихлорфеніл	2,5-дихлорфеніл
OEt	4-фторфеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
			2-хлор-5-(CF ₃)феніл

R^x ∈ C(O)OH; R^y ∈ H; R^c ∈ F; R^a, R^b і R^e ∈ H;

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-фтор-4-хлорфеніл
Cl	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-метил-4-хлорфеніл
Br	OCHF ₂	4-бромфеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
I	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
ціано	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
Et	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Pr	феніл	2-фтор-6-хлор-3-піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	2-бром-5-хлор-4-піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
CF ₃	3-	3-бром-5-фторфеніл	2,5-дифторфеніл

	(CF ₃)феніл		
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
OMe	3-(OCF ₃)феніл	2,4-дихлорфеніл	2,5-дихлорфеніл
OEt	4-фторфеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
			2-хлор-5-(CF ₃)феніл

R^x ∈ C(O)OH; R^y ∈ H; R^c ∈ Cl; R^a, R^b і R^e ∈ H;

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-фтор-4-хлорфеніл
Cl	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-метил-4-хлорфеніл
Br	OCHF ₂	4-бромфеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
I	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
ціано	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
Et	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Pr	феніл	2-фтор-6-хлор-3-піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	2-бром-5-хлор-4-піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-бром-5-фторфеніл	2,5-дифторфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
OMe	3-(OCF ₃)феніл	2,4-дихлорфеніл	2,5-дихлорфеніл
OEt	4-фторфеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
			2-хлор-5-(CF ₃)феніл

$R^x \in C(O)OH; R^y \in H; R^a \text{ і } R^e \in F; R^c \text{ і } R^d \in H;$

R^b	R^b	R^b	R^b
H	O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл
F	O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-фтор-4-хлорфеніл
Cl	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-метил-4-хлорфеніл
Br	OCHF ₂	4-бромфеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
I	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
ціано	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Me	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
Et	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Pr	феніл	2-фтор-6-хлор-3-піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	2-бром-5-хлор-4-піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-бром-5-фторфеніл	2,5-дифторфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
OMe	3-(OCF ₃)феніл	2,4-дихлорфеніл	2,5-дихлорфеніл
OEt	4-фторфеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
			2-хлор-5-(CF ₃)феніл

Таблиця І-2

Таблиця І-2 ідентична таблиці І-1, крім того, що $R^x \in C(O)OMe$.

5 Таблиця І-3

Таблиця І-3 ідентична таблиці І-1, крім того, що $R^x \in C(O)OEt$.

Таблиця І-4

Таблиця І-4 ідентична таблиці І-1, крім того, що $R^x \in C(O)OPh$.

Таблиця І-5

10 Таблиця І-5 ідентична таблиці І-1, крім того, що $R^x \in C(O)OC(CH_3)_3$.

Таблиця І-6

Таблиця І-6 ідентична таблиці І-1, крім того, що $R^x \in C(O)O(2,4,6\text{-трихлорфеніл})$.

Таблиця І-7

Таблиця І-7 ідентична таблиці І-1, крім того, що $R^x \in C(O)O(4\text{-нітрофеніл})$.

15 Таблиця І-8

Таблиця І-8 ідентична таблиці І-1, крім того, що $R^x \in C(O)OH$ і $R^y \in C(O)OH$.

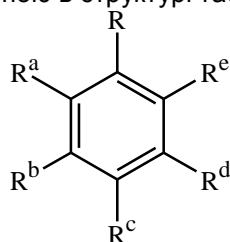
Таблиця І-9

Таблиця І-9 ідентична таблиці І-1, крім того, що $R^x \in C(O)OH$ і $R^y \in C(O)OMe$.

Таблиця І-10

- Таблиця I-10 складена в такий же спосіб, що і таблиця I-1, крім того, що R_x є $C(O)OH$ і R_y є $C(O)OEt$.
- Таблиця I-11
- 5 Таблиця I-11 ідентична таблиці I-1, крім того, що R_x є $C(O)OH$ і R_y є $C(O)OC(CH_3)_3$.
- Таблиця I-12
- Таблиця I-12 ідентична таблиці I-1, крім того, що R_x є $C(O)OH$ і R_y є $C(O)OPh$.
- Таблиця I-13
- Таблиця I-13 ідентична таблиці I-1, крім того, що R_x є $C(O)OH$ і R_y є $C(O)O(2,4,6-$
трихлорфеніл).
- 10 Таблиця I-14
- Таблиця I-14 ідентична таблиці I-1, крім того, що R_x є $C(O)OH$ і R_y є $C(O)O(4-нітрофеніл)$.
- Таблиця I-15
- Таблиця I-15 ідентична таблиці I-1, крім того, що R_x є $C(O)OPh$ і R_y є $C(O)OMe$.
- Таблиця I-16
- 15 Таблиця I-16 ідентична таблиці I-1, крім того, що R_x є $C(O)OPh$ і R_y є $C(O)OEt$.
- Таблиця I-17
- Таблиця I-17 ідентична таблиці I-1, крім того, що R_x є $C(O)OPh$ і R_y є $C(O)OC(CH_3)_3$.
- Таблиця I-18
- Таблиця I-18 ідентична таблиці I-1, крім того, що R_x є $C(O)OPh$ і R_y є $C(O)OPh$.
- 20 Таблиця I-19
- Таблиця I-19 ідентична таблиці I-1, крім того, що R_x є $C(O)OPh$ і R_y є $C(O)O(2,4,6-$
трихлорфеніл).
- Таблиця I-20
- Таблиця I-20 ідентична таблиці I-1, крім того, що R_x є $C(O)OPh$ і R_y є $C(O)O(4-нітрофеніл)$.
- 25 Таблиця I-21
- Таблиця I-21 ідентична таблиці I-1, крім того, що R_x є $C(O)Cl$ і R_y є $C(O)Cl$.
- Таблиця I-22
- Таблиця I-22 ідентична таблиці I-1, крім того, що R_x є $C(O)OMe$ і R_y є $C(O)OMe$.
- Таблиця I-23
- 30 Таблиця I-23 ідентична таблиці I-1, крім того, що R_x є $C(O)OEt$ і R_y є $C(O)OEt$.
- Таблиця I-24
- Таблиця I-24 ідентична таблиці I-1, крім того, що R_x є $C(O)OC(CH_3)_3$ і R_y є $C(O)OC(CH_3)_3$.
- Таблиця I-25
- Таблиця I-25 ідентична таблиці I-1, крім того, що R_x є $C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)$ і R_y є $C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)$.
- 35 Таблиця I-26
- Таблиця I-26 ідентична таблиці I-1, крім того, що R_x є $C(O)O(4-нітрофеніл)$ і R_y є $C(O)O(4-нітрофеніл)$.
- Таблиця I-27
- 40 Таблиця I-27 ідентична таблиці I-1, крім того, що R_x є $C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)$ і R_y є $C(O)OH$.
- Таблиця I-28
- Таблиця I-28 ідентична таблиці I-1, крім того, що R_x є $C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)$ і R_y є $C(O)OMe$.
- 45 Таблиця I-29
- Таблиця I-29 ідентична таблиці I-1, крім того, що R_x є $C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)$ і R_y є $C(O)OEt$.
- Таблиця I-30
- Таблиця I-30 ідентична таблиці I-1, крім того, що R_x є $C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)$ і R_y є $C(O)OPh$.
- 50 Таблиця I-31
- Таблиця I-31 ідентична таблиці I-1, крім того, що R_x є $C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)$ і R_y є $C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)$.
- Таблиця I-32
- 55 Таблиця I-32 ідентична таблиці I-1, крім того, що R_x є $C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)$ і R_y є $C(O)O(4-нітрофеніл)$.
- Таблиця I-33
- Таблиця I-33 ідентична таблиці I-1, крім того, що R_x є $C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)$ і R_y є $C(O)OC(CH_3)_3$.
- 60 Таблиця I-34

Таблиця I-34 ідентична таблиці I-1, крім того, що хімічну структуру під заголовком таблиці I-1 заміняють наступною структурою, і $R \in Cl$. Групи R_x і R_y , забезпечувані таблицею I-1, не відповідають таблиці I-34, оскільки фрагмент $CH(R_x)(R_y)$ у структурі таблиці I-1 заміняють R -групою в структурі таблиці I-34.



5

Наприклад, перша сполука в таблиці I-34 має структуру, показану безпосередньо вище, де R_a, R_b, R_c, R_d і $R_e \in H$, і $R \in Cl$.

Таблиця I-35

Таблиця I-35 ідентична таблиці I-34, крім того, що $R \in Br$.

10

Таблиця I-36

Таблиця I-36 ідентична таблиці I-34, крім того, що $R \in I$.

Таблиця I-37

Таблиця I-37 ідентична таблиці I-34, крім того, що $R \in CH_2OH$.

Таблиця I-38

15

Таблиця I-38 ідентична таблиці I-34, крім того, що $R \in CH_2CN$.

Таблиця I-39

Таблиця I-39 ідентична таблиці I-34, крім того, що $R \in CH_2Cl$.

Таблиця I-40

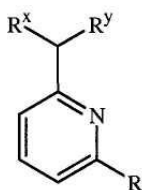
Таблиця I-40 ідентична таблиці I-34, крім того, що $R \in CH(CN)CO_2Me$.

20

Таблиця I-41

Таблиця I-41 ідентична таблиці I-34, крім того, що $R \in CH(CN)CO_2Et$.

ТАБЛИЦЯ І-42

R є CF₃;

<u>R^x</u>	<u>R^y</u>	<u>R^x</u>	<u>R^y</u>
H	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OH	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OMe	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)O(4-нітрофеніл)	H	C(O)OH
C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH ₃) ₃

R є H;

<u>R^x</u>	<u>R^y</u>	<u>R^x</u>	<u>R^y</u>
H	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OH	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OMe	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh

R^X	R^Y	R^X	R^Y
$C(O)OC(CH_3)_3$	$C(O)(3\text{-метил-2-піридиніламіно})$	$C(O)OEt$	$C(O)OPh$
$C(O)O(4\text{-нітрофеніл})$	$C(O)O(4\text{-нітрофеніл})$	H	$C(O)OH$
$C(O)O(4\text{-нітрофеніл})$	$C(O)(3\text{-метил-2-піридиніламіно})$	H	$C(O)OMe$
$C(O)O(2,4,6\text{-трихлорфеніл})$	$C(O)O(2,4,6\text{-трихлорфеніл})$	H	$C(O)OEt$
$C(O)O(2,4,6\text{-трихлорфеніл})$	$C(O)(3\text{-метил-2-піридиніламіно})$	H	$C(O)OPh$
		H	$C(O)OC(CH_3)_3$

R \in Cl;

R^X	R^Y	R^X	R^Y
H	$C(O)O(2,4,6\text{-трихлорфеніл})$	$C(O)OH$	$C(O)OH$
H	$C(O)O(4\text{-нітрофеніл})$	$C(O)OH$	$C(O)OMe$
$C(O)OH$	$C(O)O(4\text{-нітрофеніл})$	$C(O)OH$	$C(O)OEt$
$C(O)OH$	$C(O)O(2,4,6\text{-трихлорфеніл})$	$C(O)OH$	$C(O)OPh$
$C(O)OH$	$C(O)(3\text{-метил-2-піридиніламіно})$	$C(O)OH$	$C(O)OC(CH_3)_3$
$C(O)OMe$	$C(O)(3\text{-метил-2-піридиніламіно})$	$C(O)Cl$	$C(O)Cl$
$C(O)OEt$	$C(O)(3\text{-метил-2-піридиніламіно})$	$C(O)OMe$	$C(O)OMe$
$C(O)OPh$	$C(O)O(4\text{-нітрофеніл})$	$C(O)OEt$	$C(O)OEt$
$C(O)OPh$	$C(O)O(2,4,6\text{-трихлорфеніл})$	$C(O)OPh$	$C(O)OPh$
$C(O)OPh$	$C(O)(3\text{-метил-2-піридиніламіно})$	$C(O)OC(CH_3)_3$	$C(O)OC(CH_3)_3$
$C(O)OC(CH_3)_3$	$C(O)OPh$	$C(O)OMe$	$C(O)OPh$
$C(O)OC(CH_3)_3$	$C(O)(3\text{-метил-2-піридиніламіно})$	$C(O)OEt$	$C(O)OPh$
$C(O)O(4\text{-нітрофеніл})$	$C(O)O(4\text{-нітрофеніл})$	H	$C(O)OH$
$C(O)O(4\text{-нітрофеніл})$	$C(O)(3\text{-метил-2-піридиніламіно})$	H	$C(O)OMe$
$C(O)O(2,4,6\text{-трихлорфеніл})$	$C(O)O(2,4,6\text{-трихлорфеніл})$	H	$C(O)OEt$
$C(O)O(2,4,6\text{-трихлорфеніл})$	$C(O)(3\text{-метил-2-піридиніламіно})$	H	$C(O)OPh$
		H	$C(O)OC(CH_3)_3$

R \in Br;

R^X	R^Y	R^X	R^Y
H	$C(O)O(2,4,6\text{-трихлорфеніл})$	$C(O)OH$	$C(O)OH$
H	$C(O)O(4\text{-нітрофеніл})$	$C(O)OH$	$C(O)OMe$
$C(O)OH$	$C(O)O(4\text{-нітрофеніл})$	$C(O)OH$	$C(O)OEt$
$C(O)OH$	$C(O)O(2,4,6\text{-трихлорфеніл})$	$C(O)OH$	$C(O)OPh$
$C(O)OH$	$C(O)(3\text{-метил-2-піридиніламіно})$	$C(O)OH$	$C(O)OC(CH_3)_3$
$C(O)OMe$	$C(O)(3\text{-метил-2-піридиніламіно})$	$C(O)Cl$	$C(O)Cl$
$C(O)OEt$	$C(O)(3\text{-метил-2-піридиніламіно})$	$C(O)OMe$	$C(O)OMe$
$C(O)OPh$	$C(O)O(4\text{-нітрофеніл})$	$C(O)OEt$	$C(O)OEt$
$C(O)OPh$	$C(O)O(2,4,6\text{-трихлорфеніл})$	$C(O)OPh$	$C(O)OPh$
$C(O)OPh$	$C(O)(3\text{-метил-2-піридиніламіно})$	$C(O)OC(CH_3)_3$	$C(O)OC(CH_3)_3$

R^X	R^Y	R^X	R^Y
$C(O)OC(CH_3)_3$	$C(O)OPh$	$C(O)OMe$	$C(O)OPh$
$C(O)OC(CH_3)_3$	$C(O)(3\text{-метил-2-піридиніламіно})$	$C(O)OEt$	$C(O)OPh$
$C(O)O(4\text{-нітрофеніл})$	$C(O)O(4\text{-нітрофеніл})$	H	$C(O)OH$
$C(O)O(4\text{-нітрофеніл})$	$C(O)(3\text{-метил-2-піридиніламіно})$	H	$C(O)OMe$
$C(O)O(2,4,6\text{-трихлорфеніл})$			
	$C(O)O(2,4,6\text{-трихлорфеніл})$	H	$C(O)OEt$
$C(O)O(2,4,6\text{-трихлорфеніл})$			
	$C(O)(3\text{-метил-2-піридиніламіно})$	H	$C(O)OPh$
		H	$C(O)OC(CH_3)_3$

R ∈ I;

R^X	R^Y	R^X	R^Y
H	$C(O)O(2,4,6\text{-трихлорфеніл})$	$C(O)OH$	$C(O)OH$
H	$C(O)O(4\text{-нітрофеніл})$	$C(O)OH$	$C(O)OMe$
$C(O)OH$	$C(O)O(4\text{-нітрофеніл})$	$C(O)OH$	$C(O)OEt$
$C(O)OH$	$C(O)O(2,4,6\text{-трихлорфеніл})$	$C(O)OH$	$C(O)OPh$
$C(O)OH$	$C(O)(3\text{-метил-2-піридиніламіно})$	$C(O)OH$	$C(O)OC(CH_3)_3$
$C(O)OMe$	$C(O)(3\text{-метил-2-піридиніламіно})$	$C(O)Cl$	$C(O)Cl$
$C(O)OEt$	$C(O)(3\text{-метил-2-піридиніламіно})$	$C(O)OMe$	$C(O)OMe$
$C(O)OPh$	$C(O)O(4\text{-нітрофеніл})$	$C(O)OEt$	$C(O)OEt$
$C(O)OPh$	$C(O)O(2,4,6\text{-трихлорфеніл})$	$C(O)OPh$	$C(O)OPh$
$C(O)OPh$	$C(O)(3\text{-метил-2-піридиніламіно})$	$C(O)OC(CH_3)_3$	$C(O)OC(CH_3)_3$
$C(O)OC(CH_3)_3$	$C(O)OPh$	$C(O)OMe$	$C(O)OPh$
$C(O)OC(CH_3)_3$	$C(O)(3\text{-метил-2-піридиніламіно})$	$C(O)OEt$	$C(O)OPh$
$C(O)O(4\text{-нітрофеніл})$	$C(O)O(4\text{-нітрофеніл})$	H	$C(O)OH$
$C(O)O(4\text{-нітрофеніл})$	$C(O)(3\text{-метил-2-піридиніламіно})$	H	$C(O)OMe$
$C(O)O(2,4,6\text{-трихлорфеніл})$	$C(O)O(2,4,6\text{-трихлорфеніл})$	H	$C(O)OEt$
$C(O)O(2,4,6\text{-трихлорфеніл})$	$C(O)(3\text{-метил-2-піридиніламіно})$	H	$C(O)OPh$
		H	$C(O)OC(CH_3)_3$

R ∈ NH₂;

R^X	R^Y	R^X	R^Y
H	$C(O)O(2,4,6\text{-трихлорфеніл})$	$C(O)OH$	$C(O)OH$
H	$C(O)O(4\text{-нітрофеніл})$	$C(O)OH$	$C(O)OMe$
$C(O)OH$	$C(O)O(4\text{-нітрофеніл})$	$C(O)OH$	$C(O)OEt$
$C(O)OH$	$C(O)O(2,4,6\text{-трихлорфеніл})$	$C(O)OH$	$C(O)OPh$
$C(O)OH$	$C(O)(3\text{-метил-2-піридиніламіно})$	$C(O)OH$	$C(O)OC(CH_3)_3$
$C(O)OMe$	$C(O)(3\text{-метил-2-піридиніламіно})$	$C(O)Cl$	$C(O)Cl$
$C(O)OEt$	$C(O)(3\text{-метил-2-піридиніламіно})$	$C(O)OMe$	$C(O)OMe$

<u>R^x</u>	<u>R^y</u>	<u>R^x</u>	<u>R^y</u>
C(O)OPh	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)O(4-нітрофеніл)	H	C(O)OH
C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH ₃) ₃

R є 2-хлор-4-(трифторметил)феніл;

<u>R^x</u>	<u>R^y</u>	<u>R^x</u>	<u>R^y</u>
H	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OH	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OMe	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)O(4-нітрофеніл)	H	C(O)OH
C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH ₃) ₃

R є 2-фтор-5-(трифторметил)феніл;

<u>R^x</u>	<u>R^y</u>	<u>R^x</u>	<u>R^y</u>
H	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OH	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OMe	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)Cl	C(O)Cl

R^X	R^Y	R^X	R^Y
C(O)OEt	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)O(4-нітрофеніл)	H	C(O)OH
C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH ₃) ₃

R є 2-хлор-4-ціанофеніл;

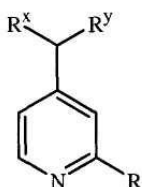
R^X	R^Y	R^X	R^Y
H	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OH	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OMe	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)O(4-нітрофеніл)	H	C(O)OH
C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH ₃) ₃

R є 2-фтор-4-ціанофеніл;

R^X	R^Y	R^X	R^Y
H	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OH	C(O)OC(CH ₃) ₃

R^X	R^Y	R^X	R^Y
C(O)OMe	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)O(4-нітрофеніл)	H	C(O)OH
C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH ₃) ₃

ТАБЛИЦЯ I-43



R ∈ H;

R^X	R^Y	R^X	R^Y
H	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OH	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OMe	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)O(4-нітрофеніл)	H	C(O)OH
C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	H	C(O)OPh

R^X	R^Y	R^X	R^Y
		H	C(O)OC(CH ₃) ₃
R ∈ CF ₃ ;			
R^X	R^Y	R^X	R^Y
H	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OH	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OMe	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)O(4-нітрофеніл)	H	C(O)OH
C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH ₃) ₃
R ∈ F;			
R^X	R^Y	R^X	R^Y
H	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OH	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OMe	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)O(4-нітрофеніл)	H	C(O)OH
C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	H	C(O)OEt

R^X	R^Y	R^X	R^Y
C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH ₃) ₃

R ∈ Cl;

R^X	R^Y	R^X	R^Y
H	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OH	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OMe	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)O(4-нітрофеніл)	H	C(O)OH
C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH ₃) ₃

R ∈ Br;

R^X	R^Y	R^X	R^Y
H	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OH	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OMe	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)O(4-нітрофеніл)	H	C(O)OH
C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	H	C(O)OMe

R^X	R^Y	R^X	R^Y
C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH ₃) ₃

$R \in I$;

R^X	R^Y	R^X	R^Y
H	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OH	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OMe	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)O(4-нітрофеніл)	H	C(O)OH
C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH ₃) ₃

$R \in NH_2$;

R^X	R^Y	R^X	R^Y
H	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OH	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OMe	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)O(4-нітрофеніл)	H	C(O)OH

<u>R^x</u>	<u>R^y</u>	<u>R^x</u>	<u>R^y</u>
C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH ₃) ₃
R є 2-хлор-4-(трифторметил)феніл;			
<u>R^x</u>	<u>R^y</u>	<u>R^x</u>	<u>R^y</u>
H	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OH	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OMe	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)O(4-нітрофеніл)	H	C(O)OH
C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH ₃) ₃
R є 2-фтор-5-(трифторметил)феніл;			
<u>R^x</u>	<u>R^y</u>	<u>R^x</u>	<u>R^y</u>
H	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OH	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OMe	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OEt	C(O)OPh

<u>R^x</u>	<u>R^y</u>	<u>R^x</u>	<u>R^y</u>
C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)O(4-нітрофеніл)	H	C(O)OH
C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH ₃) ₃
R є 2-хлор-4-ціанофеніл;			
<u>R^x</u>	<u>R^y</u>	<u>R^x</u>	<u>R^y</u>
H	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OH	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OMe	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OEt	C(O)OPh
C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)O(4-нітрофеніл)	H	C(O)OH
C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	H	C(O)OMe
C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	H	C(O)OEt
C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	H	C(O)OPh
		H	C(O)OC(CH ₃) ₃
R є 2-фтор-4-ціанофеніл;			
<u>R^x</u>	<u>R^y</u>	<u>R^x</u>	<u>R^y</u>
H	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OH	C(O)OH
H	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OH	C(O)OMe
C(O)OH	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OH	C(O)OEt
C(O)OH	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OH	C(O)OPh
C(O)OH	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OH	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OMe	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)Cl	C(O)Cl
C(O)OEt	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OMe	C(O)OMe
C(O)OPh	C(O)O(4-нітрофеніл)	C(O)OEt	C(O)OEt
C(O)OPh	C(O)O(2,4,6-трихлорфеніл)	C(O)OPh	C(O)OPh
C(O)OPh	C(O)(3-метил-2-піридиніламіно)	C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OC(CH ₃) ₃
C(O)OC(CH ₃) ₃	C(O)OPh	C(O)OMe	C(O)OPh

R^X	R^Y	R^X	R^Y
$C(O)OC(CH_3)_3$	$C(O)(3\text{-метил-2-піридиніламіно})$	$C(O)OEt$	$C(O)OPh$
$C(O)O(4\text{-нітрофеніл})$	$C(O)O(4\text{-нітрофеніл})$	H	$C(O)OH$
$C(O)O(4\text{-нітрофеніл})$	$C(O)(3\text{-метил-2-піридиніламіно})$	H	$C(O)OMe$
$C(O)O(2,4,6\text{-трихлорфеніл})$	$C(O)O(2,4,6\text{-трихлорфеніл})$	H	$C(O)OEt$
$C(O)O(2,4,6\text{-трихлорфеніл})$	$C(O)(3\text{-метил-2-піридиніламіно})$	H	$C(O)OPh$
		H	$C(O)OC(CH_3)_3$

Загальновизнано, що деякі реагенти та умови реакції, описані вище для одержання сполук формули 1, можуть бути сумісні з певними функціональними властивостями, які присутні у проміжних сполук. У даних випадках включення в синтез послідовностей для захисту/зняття захисту або взаємоперетворень функціональних груп допоможуть в одержанні необхідних продуктів. Застосування та вибір захисних груп будуть очевидні для фахівця в галузі хімічного синтезу (див. наприклад Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. *Protective Groups in Organic Synthesis*, 2nd ed.; Wiley: New York, 1991). Фахівець у даній галузі визнає, що в деяких випадках після введення даного реагенту, як зображено на будь-якій окремій схемі, може бути необхідним для виконання додаткових установлених синтетичних етапів, не описаних детально, для завершення синтезу сполук формули 1. Фахівець у даній галузі також визнає, що може бути необхідним виконання комбінації етапів, проілюстрованих у вищевказаних схемах, в іншому порядку, що передбачений конкретно представленою послідовністю для одержання сполук формули 1.

Фахівець у даній галузі також визнає, що сполуки формули 1 і проміжні сполуки, описані в даному документі, можуть бути піддані різним електрофільним, нуклеофільним, радикальним, металоорганічним реакціям, реакціям окиснення та відновлення для додавання замісників або модифікування існуючих замісників.

Без подальшого уточнення передбачається, що фахівець у даній галузі, застосовуючи попередній опис, може застосовувати даний винахід у повному його розмірі. Наступні приклади синтезу, отже, повинні тлумачитися лише як ілюстративні, а не обмежуючі розкриття взагалі яким-небудь чином. Етапи в наступних прикладах синтезу ілюструють порядок дій для кожного етапу в загальному синтетичному перетворенні, і вихідний матеріал для кожного етапу необов'язково може бути отриманий конкретно попередньою роботою, порядок дій якої описується в інших прикладах або етапах. Температура навколишнього середовища або кімнатна температура визначена як 20-25 °C. Відсотки мають на увазі по вазі, крім як для сумішей хроматографічних розчинників або якщо інше не позначено. Частини та відсотки для сумішей хроматографічних розчинників мають на увазі за обсягом, якщо інше не позначено. Спектр 1H ЯМР виражають у частинах на мільйон убік слабкого поля від тетраметилсилану; "s" означає синглет, "d" означає дублет, "dd" означає дублет дублетів, "ddd" означає дублет дублету дублетів, "t" означає триплет, "m" означає мультиплет і "br s" означає широкий синглет. Номери сполук відносяться до сполук у таблиці A індексів.

Приклад синтезу 1

Одержання внутрішньої солі 2-гідрокси-4-оксо-1-(5-піримідинілметил)-3-[3-(трифторметил)феніл]-4Н-піrido[1,2-а]піримідинію (сполуки 3).

Етап А: Одержання N-(5-піримідинілметил)-2-піридинаміну

Розчин 2-амінопіридину (11,314 г, 120,3 ммоль) і піримідин-5-карбоксальдегіду (14,0 г, 129,6 ммоль) у хлороформі (300 мл) перемішували при кімнатній температурі протягом 15 хвилин. Потім летучі речовини видаляли під зниженим тиском (1 година при 75 °C) з одержанням жовтої твердої речовини. Неочищену тверду речовину розчиняли в хлороформі (300 мл), і розчин перемішували протягом 15 хвилин. Летучі речовини потім видаляли під зниженим тиском (1 година при 75 °C) з одержанням жовтої твердої речовини. Неочищену тверду речовину знову розчиняли в хлороформі (300 мл), розчин перемішували протягом 15 хвилин, і летучі речовини видаляли під зниженим тиском (1 година при 85 °C) з одержанням жовтої твердої речовини. Дану тверду речовину висушували у вакуумній печі протягом ночі при 80 °C з одержанням 22,090 г (99,8 %) титульної сполуки. 1H ЯМР ($CDCl_3$) δ 9,26–9,32 (m, 4H), 8,52 (d, 1H), 7,82 (t, 1H), 7,42 (d, 1H), 7,26 (t, 1H).

Етап В: Одержання N-[(5-піримідиніл)метил]-2-піридинаміну

Порошкоподібний 98 % натрію борогідрид (2,868 г, 75,5 ммоль) додавали до розчину метанолу (80 мл) і тетрагідрофурану (400 мл) і суміш енергійно перемішували протягом 5

хвилин. Продукт етапу А (13,9 г, 75,5 ммоль) розчиняли в тетрагідрофурані (400 мл), і отриманий розчин по краплях додавали до суспензії натрію борогідриду при постійній швидкості приблизно 33 мл/хвилина. Зовнішній вигляд реакційної суміші змінювався від ясно-жовтої злегка мутнуватої суспензії до прозорого червоного розчину. Протікання реакції контролювали за допомогою елюювання при тонкошаровій хроматографії розчинником 10 % метанолу:40 % дихлорметану:50 % толуолу. Після закінчення реакції оцтову кислоту (3 мл) додавали по краплях, і реакційну суміш перемішували протягом 5 хвилин. Додавали оцтову кислоту (2 мл) і воду (30 мл), реакційну суміш протягом короткого періоду перемішували, і потім додавали етилацетат (500 мл). Реакційну суміш промивали 1 N водним розчином натрію гідроксиду (300 мл), висушували над магнію сульфатом, відфільтровували та розчинник видаляли під зниженим тиском при 50 °С. Отримане неочищене масло розчиняли в дихлорметані (50 мл) і розчин елюювали через пробку із силікагелю (100 г) етилацетатом (3 л). Елюант концентрували до жовто-жовтогарячого масла, яке повільно кристалізували з одержанням 8,909 г (63,4 %) титульного продукту у вигляді біло-жовтої твердої речовини. ¹H ЯМР (CDCl₃) δ 9,12 (s, 1H), 8,76 (s, 2H), 8,10 (d, 1H), 7,42 (t, 1H), 6,64 (t, 1H), 6,42 (d, 1H), 4,99 (br s, NH), 4,61 (d, 2H).

Етап С: Одержання 1,3-диметил-2-[3-(трифторметил)феніл]пропандіоату

Діоксан (100 мл) продували газоподібним азотом протягом 10 хвилин. Фенантролен (1,0 г) та міді (I) йодид (1,0 г) додавали до діоксану, суспензії дозволяли перемішуватися в атмосфері азоту протягом 5 хвилин, і потім додавали цезію карбонат (18,72 г, 57,45 ммоль), диметилмалонат (5,46 г, 50,6 ммоль) та 1-йод-3-(трифторметил)бензол (12,5 г, 46,0 ммоль). Реакційну суміш нагрівали до кипіння зі зворотним холодильником протягом 18 годин і потім охолоджували до кімнатної температури. Водну 1 N HCl додавали до реакційної суміші, шари розділяли, і водний шар екстрагували етилацетатом (3 × 100 мл). Комбіновані органічні шари висушували над магнію сульфатом і відфільтровували. Додавали до фільтрату допоміжну речовину для фільтрування на діатомовому фільтрі Celite® (5 г), і отриману суспензію концентрували під зниженим тиском при 50 °С з одержанням твердої речовини, що складається з неочищеного продукту, адсорбованого на Celite®. Дану тверду речовину очищували елююванням хроматографією із силікагелем із градієнтом від 100 % гексанів до 25 % етилацетату в гексанах для одержання 7,36 г (58,0 %) титульного продукту. ¹H ЯМР (CDCl₃) δ 7,59–7,65 (m, 3H), 7,49 (t, 1H), 4,70 (s, 1H), 3,76 (s, 6H).

Етап D: Одержання біс(2,4,6-трихлорфеніл)-2-[3-(трифторметил)феніл]пропандіоату

Продукт етапу С додавали до розчину NaOH (25 г) у воді (75 мл) і реакційну суміш енергійно перемішували в атмосфері азоту при 60 °С протягом 8 хвилин. Реакційну суміш потім додавали до льоду (100 г) і водну 6 N HCl додавали, поки не досягли pH 1. Розчин екстрагували етилацетатом (3 × 100 мл), і комбіновані органічні екстракти висушували над магнію сульфатом, фільтрували та концентрували під зниженим тиском. Дихлорметан (200 мл) додавали до отриманої білої твердої речовини з наступним додаванням оксалілхлориду (5 мл) і N, N-диметилформаміду (0,5 мл). Реакційну суміш перемішували при кімнатній температурі протягом 2 годин з наступним додаванням 2,4,6-трихлорфенолу (10,528 г, 53,32 ммоль). Після перемішування протягом ночі при кімнатній температурі реакційну суміш концентрували під зниженим тиском. До отриманого залишку додавали метанол, і тверду речовину повільно осаджували з розчину. Тверду речовину збирали фільтруванням з одержанням 8,161 г (50,43 %) титульного продукту у вигляді твердої речовини. ¹H ЯМР (CDCl₃) δ 7,91 (s, 1H), 7,83 (d, 1H), 7,70 (d, 1H), 7,59 (t, 1H), 7,37 (s, 4H), 5,38 (s, 1H).

Етап E: Одержання внутрішньої солі 2-гідрокси-4-оксо-1-(5-піримідинілметил)-3-[3-(трифторметил)феніл]-4Н-піrido[1,2-а]піримідинію

До продукту етапу D (8,16 г, 13,4 ммоль) у толуолі (100 мл) додавали продукт етапу B (3,31 г, 17,8 ммоль). Реакційну суміш нагрівали до 110 °С протягом 6 годин, за цей час жовту тверду речовину осаджували з розчину. Реакційну суміш концентрували в присутності Celite® і неочищений продукт, адсорбований на Celite®, очищували елююванням за допомогою хроматографії із силікагелем із градієнтом від 100 % етилацетату до 25 % метанолу в етилацетаті з одержанням 7,36 г (58,0 %) титульного продукту, сполуки даного винаходу.

Приклад синтезу 2

Одержання внутрішньої солі 3-(4'-ціано-5,2'-диметил[1,1'-біфеніл]-3-іл)-2-гідрокси-4-оксо-1-(5-піримідинілметил)-4Н-піrido[1,2-а]піримідинію (сполуки 18)

Етап A: Одержання 1,3-біс(1,1-диметилетил)-2-(3-йод-5-метилфеніл)пропандіоату

Міді йодид (332 мг, 1,74 ммоль), карбонат цезію (5,6 г, 17,4 ммоль) і піколінову кислоту (429 мг, 3,49 ммоль) додавали у висушену колбу в атмосфері азоту. Розчин 3,5-дійодтолуолу (3 г, 8,7 ммоль) у діоксані (10 мл) додавали з наступним додаванням ди-трет-бутилмалонату (1,3 мл, 8,7 ммоль). Повітря усередині колби видаляли під вакуумом і заміщали газоподібним азотом; даний

процес повторювали в цілому три рази. Реакційну суміш потім нагрівали до 80 °C і перемішували протягом 24 годин. Реакційну суміш потім охолоджували до кімнатної температури, гасили насиченим водяним розчином амонію хлориду (50 мл) і двічі екстрагували діетиловим ефіром (50 мл). Органічні шари комбінували, висушували над $MgSO_4$ і концентрували при зниженому тиску. Отриманий залишок очищували за допомогою хроматографії на силікагелі, елююванням етилацетатом у гексанах, з одержанням титульного продукту у вигляді жовтого гарячого масла (0,62 г).

1H ЯМР ($CDCl_3$) δ 7,50 (dd 2H), 7,15 (s, 1H), 4,30 (s, 1H), 2,30 (s, 3H), 1,47 (m, 18H).

Етап В: Одержання 1,3-біс(1,1-диметилетил)-2-(4'-ціано-5,2'-диметил[1,1'-біфеніл]-3-іл)пропандіоату

Суміш 1,3-біс(1,1-диметилетил)-2-(3-йод-5-метилфеніл)пропандіоату (продукту етапу А, 320 мг, 0,74 ммоль), 2-метилфенілборинової кислоти (178 мг, 1,11 ммоль), натрію карбонату (78 мг, 0,74 ммоль), біс(трифенілфосфін)палладію(II) дихлориду (52 мг, 0,074 ммоль), діоксану (5 мл) і води (1 мл) нагрівали до 80 °C і перемішували протягом 20 хвилин. Реакційну суміш потім охолоджували до кімнатної температури та відфільтровували через пробку із силікагелю з елююванням 20 % етилацетату в гексанах. Концентрування елюанту при зниженому тиску давало коричневе масло (430 мг), що містить неочищений продукт, яке застосували на наступному етапі без подальшого очищення.

1H ЯМР ($CDCl_3$) δ 7,70-7,10 (m, 6H), 4,436 (s, 1H), 2,402 (s, 3H), 2,289 (s, 3H), 1,469 (s, 18H).

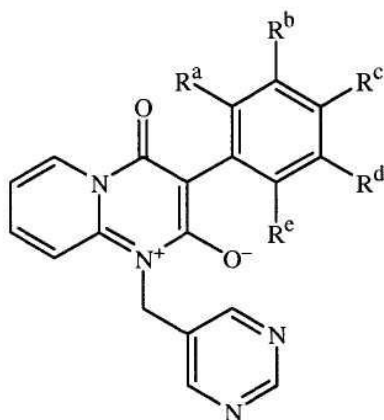
Етап С: Одержання внутрішньої солі 3-(4'-ціано-5,2'-диметил[1,1'-біфеніл]-3-іл)-2-гідрокси-4-оксо-1-(5-піримідинілметил)-4Н-піридо[1,2-а]піримідинію

Суміш N-[(5-піримідиніл)метил]-2-піридинаміну (65 мг, 0,34 ммоль) і 1,3-біс(1,1-диметилетил)-2-(4'-ціано-5,2'-диметил[1,1'-біфеніл]-3-іл)пропандіоату (продукту етапу В, 120 мг, 0,28 ммоль) у р-цимолі (2 мл) і 1,2,3,4-тетрагідронафталіні (тобто тетраліні, 1 мл) нагрівали до 178 °C і перемішували протягом 1,5 годин. Реакційну суміш потім охолоджували до кімнатної температури та очищували за допомогою хроматографії на силікагелі, елююванням 20 % метанолу в етилацетаті з одержанням 40 мг (25 %) титульної сполуки, сполуки даного винаходу, у вигляді жовтої твердої речовини.

1H ЯМР ($(CD_3)_2CO$) δ 9,5 (dd, 1H), 9,05 (s, 1H), 8,95 (d, 2H), 8,35 (m, 1H), 7,95 (dd, 1H), 7,80 (d, 1H), 7,75 (s, 1H), 7,70 (s, 1H), 7,65 (m, 1H), 7,55 (m, 1H), 7,45 (dd, 1H), 7,0 (d, 1H), 5,75 (s, 2H), 2,06 (d, 6H).

Наступні сполуки таблиць 1 і 2 можуть бути отримані способами, описаними в даному документі, разом зі способами, відомими в даній галузі техніки. Наступні скорочення застосовуються в таблиці 1: Me означає метил, Et означає етил, Pr означає пропіл і Bu означає бутил.

ТАБЛИЦЯ 1



R^b, R^c, R^d і $R^e \in H$;

R^a	R^a	R^a	R^a
H	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
F	OCHF ₂	4-бромфеніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл

Br	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Me	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
Et	ціано	2-фтор-6-хлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
Pr	феніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2-бром-5-хлор-4-піридиніл	2,5-дифторфеніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	3-бром-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2,5-дифторфеніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
OMe	3-(OCF ₃)феніл	2,4-дифторфеніл	2-хлор-5-(CF ₃)феніл
OEt	4-фторфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл	
O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-хлорфеніл	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-метил-4-хлорфеніл	

R^a, R^c, R^d і R^e є H;

<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>
H	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
F	OCHF ₂	4-бромфеніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Br	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Me	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
Et	ціано	2-фтор-6-хлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
Pr	феніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2-бром-5-хлор-4-піридиніл	2,5-дифторфеніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	3-бром-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2,5-дифторфеніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл

OMe	3- (OCF ₃)феніл	2,4-дифторфеніл	2-хлор-5-(CF ₃)феніл
OEt	4-фторфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл	
O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-хлорфеніл	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-метил-4-хлорфеніл	

R^a, R^b, R^d і $R^e \in H$;

R^c	R^c	R^c	R^c
H	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
F	OCHF ₂	4-бромфеніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Br	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Me	SCHF ₂	4,6-дихлор-3- піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
Et	ціано	2-фтор-6-хлор-3- піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
Pr	феніл	2,6-дихлор-3- піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2-бром-5-хлор-4- піридиніл	2,5-дифторфеніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	3-бром-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2,5-дифторфеніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
OMe	3- (OCF ₃)феніл	2,4-дифторфеніл	2-хлор-5-(CF ₃)феніл
OEt	4-фторфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл	
O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-хлорфеніл	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-метил-4-хлорфеніл	

$R^a \in F$; R^c, R^d і $R^e \in H$;

R^b	R^b	R^b	R^b
H	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
F	OCHF ₂	4-бромфеніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Br	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Me	SCHF ₂	4,6-дихлор-3- піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл

Et	ціано	2-фтор-6-хлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
Pr	феніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2-бром-5-хлор-4-піридиніл	2,5-дифторфеніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	3-бром-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2,5-дифторфеніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
OMe	3-(OCF ₃)феніл	2,4-дифторфеніл	2-хлор-5-(CF ₃)феніл
OEt	4-фторфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл	
O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-хлорфеніл	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-метил-4-хлорфеніл	

R^a ∈ F; R^b, R^d i R^e ∈ H:

<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>
H	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
F	OCHF ₂	4-бромфеніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Br	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Me	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
Et	ціано	2-фтор-6-хлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
Pr	феніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2-бром-5-хлор-4-піридиніл	2,5-дифторфеніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	3-бром-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2,5-дифторфеніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
OMe	3-(OCF ₃)феніл	2,4-дифторфеніл	2-хлор-5-(CF ₃)феніл
OEt	4-фторфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл	
O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-хлорфеніл	

O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-метил-4-хлорфеніл	
R ^a ∈ F; R ^b , R ^c i R ^e ∈ H;			
<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
F	OCHF ₂	4-бромфеніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Br	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Me	SCHF ₂	4,6-дихлор-3- піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
Et	ціано	2-фтор-6-хлор-3- піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
Pr	феніл	2,6-дихлор-3- піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2-бром-5-хлор-4- піридиніл	2,5-дифторфеніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	3-бром-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2,5-дифторфеніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
OMe	3- (OCF ₃)феніл	2,4-дифторфеніл	2-хлор-5-(CF ₃)феніл
OEt	4-фторфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл	
O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-хлорфеніл	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-метил-4-хлорфеніл	

R^a ∈ F; R^b, R^c i R^d ∈ H;

<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>
H	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
F	OCHF ₂	4-бромфеніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Br	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Me	SCHF ₂	4,6-дихлор-3- піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
Et	ціано	2-фтор-6-хлор-3- піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
Pr	феніл	2,6-дихлор-3- піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл

<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2-бром-5-хлор-4-піридиніл	2,5-дифторфеніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	3-бром-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2,5-дифторфеніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
OMe	3-(OCF ₃)феніл	2,4-дифторфеніл	2-хлор-5-(CF ₃)феніл
OEt	4-фторфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл	
<i>O-n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-хлорфеніл	
<i>O-i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-метил-4-хлорфеніл	

R^a ∈ Cl; R^c, R^d і R^e ∈ H;

<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>
H	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
F	OCHF ₂	4-бромфеніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Br	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Me	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
Et	ціано	2-фтор-6-хлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
Pr	феніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2-бром-5-хлор-4-піридиніл	2,5-дифторфеніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	3-бром-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2,5-дифторфеніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
OMe	3-(OCF ₃)феніл	2,4-дифторфеніл	2-хлор-5-(CF ₃)феніл
OEt	4-фторфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл	
<i>O-n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-хлорфеніл	
<i>O-i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-метил-4-хлорфеніл	

R^a ∈ Cl; R^b, R^d і R^e ∈ H;

<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>
H	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл

F	OCHF ₂	4-бромфеніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Br	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Me	SCHF ₂	4,6-дихлор-3- піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
Et	ціано	2-фтор-6-хлор-3- піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
Pr	феніл	2,6-дихлор-3- піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2-бром-5-хлор-4- піридиніл	2,5-дифторфеніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	3-бром-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2,5-дифторфеніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
OMe	3- (OCF ₃)феніл	2,4-дифторфеніл	2-хлор-5-(CF ₃)феніл
OEt	4-фторфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл	
O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-хлорфеніл	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-метил-4-хлорфеніл	

R^a ∈ Cl; R^b, R^c і R^e ∈ H;

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
F	OCHF ₂	4-бромфеніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Br	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Me	SCHF ₂	4,6-дихлор-3- піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
Et	ціано	2-фтор-6-хлор-3- піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
Pr	феніл	2,6-дихлор-3- піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2-бром-5-хлор-4- піридиніл	2,5-дифторфеніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	3-бром-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл

CH ₂ F	3-фторфеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2,5-дифторфеніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
OMe	3-(OCF ₃)феніл	2,4-дифторфеніл	2-хлор-5-(CF ₃)феніл
OEt	4-фторфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл	
O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-хлорфеніл	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-метил-4-хлорфеніл	

R^a ∈ Cl; R^b, R^c i R^d ∈ H;

<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>
H	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
F	OCHF ₂	4-бромфеніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Br	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Me	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
Et	ціано	2-фтор-6-хлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
Pr	феніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2-бром-5-хлор-4-піридиніл	2,5-дифторфеніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	3-бром-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2,5-дифторфеніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
OMe	3-(OCF ₃)феніл	2,4-дифторфеніл	2-хлор-5-(CF ₃)феніл
OEt	4-фторфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл	
O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-хлорфеніл	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-метил-4-хлорфеніл	

R^a ∈ OMe; R^c, R^d i R^e ∈ H;

<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>
H	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
F	OCHF ₂	4-бромфеніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Br	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл

Me	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
Et	ціано	2-фтор-6-хлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
Pr	феніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2-бром-5-хлор-4-піридиніл	2,5-дифторфеніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	3-бром-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2,5-дифторфеніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
OMe	3-(OCF ₃)феніл	2,4-дифторфеніл	2-хлор-5-(CF ₃)феніл
OEt	4-фторфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл	
O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-хлорфеніл	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-метил-4-хлорфеніл	

R^a є OMe; R^b, R^d і R^e є H;

<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>
H	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
F	OCHF ₂	4-бромфеніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Br	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Me	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
Et	ціано	2-фтор-6-хлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
Pr	феніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2-бром-5-хлор-4-піридиніл	2,5-дифторфеніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	3-бром-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2,5-дифторфеніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
OMe	3-(OCF ₃)феніл	2,4-дифторфеніл	2-хлор-5-(CF ₃)феніл

OEt	4-фторфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл
O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-хлорфеніл
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-метил-4-хлорфеніл

R^a ∈ OMe; R^b, R^c і R^e ∈ H;

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
F	OCHF ₂	4-бромфеніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Br	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Me	SCHF ₂	4,6-дихлор-3- піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
Et	ціано	2-фтор-6-хлор-3- піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
Pr	феніл	2,6-дихлор-3- піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2-бром-5-хлор-4- піридиніл	2,5-дифторфеніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	3-бром-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2,5-дифторфеніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
OMe	3- (OCF ₃)феніл	2,4-дифторфеніл	2-хлор-5-(CF ₃)феніл
OEt	4-фторфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл	
O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-хлорфеніл	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-метил-4-хлорфеніл	

R^a ∈ OMe; R^b, R^c і R^d ∈ H;

<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>
H	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
F	OCHF ₂	4-бромфеніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Br	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Me	SCHF ₂	4,6-дихлор-3- піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
Et	ціано	2-фтор-6-хлор-3- піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл

Pr	феніл	2,6-дихлор-3- піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2-бром-5-хлор-4- піридиніл	2,5-дифторфеніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	3-бром-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2,5-дифторфеніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
OMe	3- (OCF ₃)феніл	2,4-дифторфеніл	2-хлор-5-(CF ₃)феніл
OEt	4-фторфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл	
O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-хлорфеніл	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-метил-4-хлорфеніл	

R^a ∈ Me; R^c, R^d і R^e ∈ H;

<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>
H	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
F	OCHF ₂	4-бромфеніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Br	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Me	SCHF ₂	4,6-дихлор-3- піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
Et	ціано	2-фтор-6-хлор-3- піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
Pr	феніл	2,6-дихлор-3- піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2-бром-5-хлор-4- піридиніл	2,5-дифторфеніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	3-бром-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2,5-дифторфеніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
OMe	3- (OCF ₃)феніл	2,4-дифторфеніл	2-хлор-5-(CF ₃)феніл
OEt	4-фторфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл	
O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-хлорфеніл	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-метил-4-хлорфеніл	

R^a ∈ Me; R^b, R^d i R^e ∈ H;

<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>	<u>R^c</u>
H	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
F	OCHF ₂	4-бромфеніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Br	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Me	SCHF ₂	4,6-дихлор-3- піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
Et	ціано	2-фтор-6-хлор-3- піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
Pr	феніл	2,6-дихлор-3- піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2-бром-5-хлор-4- піридиніл	2,5-дифторфеніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	3-бром-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2,5-дифторфеніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
OMe	3- (OCF ₃)феніл	2,4-дифторфеніл	2-хлор-5-(CF ₃)феніл
OEt	4-фторфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл	
O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-хлорфеніл	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-метил-4-хлорфеніл	

R^a ∈ Me; R^b, R^c i R^e ∈ H;

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
F	OCHF ₂	4-бромфеніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Br	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Me	SCHF ₂	4,6-дихлор-3- піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
Et	ціано	2-фтор-6-хлор-3- піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
Pr	феніл	2,6-дихлор-3- піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2-бром-5-хлор-4-	2,5-дифторфеніл

		піридиніл	
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	3-бром-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2,5-дифторфеніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
OMe	3- (OCF ₃)феніл	2,4-дифторфеніл	2-хлор-5-(CF ₃)феніл
OE _t	4-фторфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл	
O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-хлорфеніл	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-метил-4-хлорфеніл	

R^a ∈ Me; R^b, R^c і R^d ∈ H;

<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>	<u>R^e</u>
H	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
F	OCHF ₂	4-бромфеніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Br	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Me	SCHF ₂	4,6-дихлор-3- піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
Et	ціано	2-фтор-6-хлор-3- піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
Pr	феніл	2,6-дихлор-3- піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2-бром-5-хлор-4- піридиніл	2,5-дифторфеніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	3-бром-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2,5-дифторфеніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
OMe	3- (OCF ₃)феніл	2,4-дифторфеніл	2-хлор-5-(CF ₃)феніл
OE _t	4-фторфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл	
O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-хлорфеніл	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-метил-4-хлорфеніл	

R^d ∈ Cl; R^a, R^c і R^e ∈ H;

<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>
H	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
F	OCHF ₂	4-бромфеніл	2,4-біс(CF ₃)феніл

Cl	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Br	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Me	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
Et	ціано	2-фтор-6-хлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
Pr	феніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2-бром-5-хлор-4-піридиніл	2,5-дифторфеніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	3-бром-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2,5-дифторфеніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
OMe	3-(OCF ₃)феніл	2,4-дифторфеніл	2-хлор-5-(CF ₃)феніл
OEt	4-фторфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл	
O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-хлорфеніл	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-метил-4-хлорфеніл	

R^d ∈ CF₃; R^a, R^c і R^e ∈ H;

<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>
H	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
F	OCHF ₂	4-бромфеніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Br	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Me	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
Et	ціано	2-фтор-6-хлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
Pr	феніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2-бром-5-хлор-4-піридиніл	2,5-дифторфеніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	3-бром-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2,5-дифторфеніл

CHF ₂	3-ціанофеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
OMe	3-(OCF ₃)феніл	2,4-дифторфеніл	2-хлор-5-(CF ₃)феніл
OEt	4-фторфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл	
O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-хлорфеніл	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-метил-4-хлорфеніл	

R^b ∈ Br; R^a, R^c і R^e ∈ H;

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
F	OCHF ₂	4-бромфеніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Br	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Me	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
Et	ціано	2-фтор-6-хлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
Pr	феніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2-бром-5-хлор-4-піридиніл	2,5-дифторфеніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	3-бром-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2,5-дифторфеніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
OMe	3-(OCF ₃)феніл	2,4-дифторфеніл	2-хлор-5-(CF ₃)феніл
OEt	4-фторфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл	
O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-хлорфеніл	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-метил-4-хлорфеніл	

R^b ∈ OCF₃; R^a, R^c і R^e ∈ H;

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
F	OCHF ₂	4-бромфеніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Br	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Me	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-	2-метил-4-(CF ₃)феніл

Et	ціано	піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
Pr	феніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2-бром-5-хлор-4-піридиніл	2,5-дифторфеніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	3-бром-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2,5-дифторфеніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
OMe	3-(OCF ₃)феніл	2,4-дифторфеніл	2-хлор-5-(CF ₃)феніл
OEt	4-фторфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл	
O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-хлорфеніл	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-метил-4-хлорфеніл	

R^b є OMe; R^a, R^c і R^e є H;

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
F	OCHF ₂	4-бромфеніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Br	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Me	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
Et	ціано	2-фтор-6-хлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
Pr	феніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2-бром-5-хлор-4-піридиніл	2,5-дифторфеніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	3-бром-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2,5-дифторфеніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
OMe	3-(OCF ₃)феніл	2,4-дифторфеніл	2-хлор-5-(CF ₃)феніл
OEt	4-фторфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл	

<i>O-n-Pr</i>	4-хлорфеніл	2-фтор-4-хлорфеніл	
<i>O-i-Pr</i>	4-(CF ₃)феніл	2-метил-4-хлорфеніл	

$R^b \in F; R^a, R^c \text{ і } R^e \in H;$

$\underline{R^d}$	$\underline{R^d}$	$\underline{R^d}$	$\underline{R^d}$
H	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
F	OCHF ₂	4-бромфеніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Br	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Me	SCHF ₂	4,6-дихлор-3- піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
Et	ціано	2-фтор-6-хлор-3- піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
Pr	феніл	2,6-дихлор-3- піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
<i>i-Pr</i>	2-фторфеніл	2-бром-5-хлор-4- піридиніл	2,5-дифторфеніл
<i>t-Bu</i>	3-хлорфеніл	3-бром-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2,5-дифторфеніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
OMe	3- (OCF ₃)феніл	2,4-дифторфеніл	2-хлор-5-(CF ₃)феніл
OEt	4-фторфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл	
<i>O-n-Pr</i>	4-хлорфеніл	2-фтор-4-хлорфеніл	
<i>O-i-Pr</i>	4-(CF ₃)феніл	2-метил-4-хлорфеніл	

$R^b \in CN; R^a, R^c \text{ і } R^e \in H;$

$\underline{R^d}$	$\underline{R^d}$	$\underline{R^d}$	$\underline{R^d}$
H	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
F	OCHF ₂	4-бромфеніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Br	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Me	SCHF ₂	4,6-дихлор-3- піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
Et	ціано	2-фтор-6-хлор-3- піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
Pr	феніл	2,6-дихлор-3-	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл

<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	піридиніл 2-бром-5-хлор-4- піридиніл	2,5-дифторфеніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	3-бром-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2,5-дифторфеніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
OMe	3- (OCF ₃)феніл	2,4-дифторфеніл	2-хлор-5-(CF ₃)феніл
OEt	4-фторфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл	
O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-хлорфеніл	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-метил-4-хлорфеніл	

R^b ∈ Me; R^a, R^c і R^e ∈ H;

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
F	OCHF ₂	4-бромфеніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Br	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Me	SCHF ₂	4,6-дихлор-3- піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
Et	ціано	2-фтор-6-хлор-3- піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
Pr	феніл	2,6-дихлор-3- піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2-бром-5-хлор-4- піридиніл	2,5-дифторфеніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	3-бром-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2,5-дифторфеніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
OMe	3- (OCF ₃)феніл	2,4-дифторфеніл	2-хлор-5-(CF ₃)феніл
OEt	4-фторфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл	
O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-хлорфеніл	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-метил-4-хлорфеніл	

$R^b \in I; R^a, R^c \text{ i } R^e \in H;$

R^d	R^d	R^d	R^d
H	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
F	OCHF ₂	4-бромфеніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Br	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Me	SCHF ₂	4,6-дихлор-3- піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
Et	ціано	2-фтор-6-хлор-3- піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
Pr	феніл	2,6-дихлор-3- піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2-бром-5-хлор-4- піридиніл	2,5-дифторфеніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	3-бром-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2,5-дифторфеніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
OMe	3- (OCF ₃)феніл	2,4-дифторфеніл	2-хлор-5-(CF ₃)феніл
OEt	4-фторфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл	
O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-хлорфеніл	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-метил-4-хлорфеніл	

 $R^a \text{ i } R^b \in F; R^c \text{ i } R^e \in H;$

R^d	R^d	R^d	R^d
H	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
F	OCHF ₂	4-бромфеніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Br	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Me	SCHF ₂	4,6-дихлор-3- піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
Et	ціано	2-фтор-6-хлор-3- піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
Pr	феніл	2,6-дихлор-3- піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2-бром-5-хлор-4-	2,5-дифторфеніл

		піридиніл	
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	3-бром-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2,5-дифторфеніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
OMe	3- (OCF ₃)феніл	2,4-дифторфеніл	2-хлор-5-(CF ₃)феніл
OEt	4-фторфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл	
O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-хлорфеніл	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-метил-4-хлорфеніл	

R^a ∈ F; R^b ∈ Cl; R^c i R^e ∈ H;

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
F	OCHF ₂	4-бромфеніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Br	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Me	SCHF ₂	4,6-дихлор-3- піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
Et	ціано	2-фтор-6-хлор-3- піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
Pr	феніл	2,6-дихлор-3- піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2-бром-5-хлор-4- піридиніл	2,5-дифторфеніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	3-бром-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2,5-дифторфеніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
OMe	3- (OCF ₃)феніл	2,4-дифторфеніл	2-хлор-5-(CF ₃)феніл
OEt	4-фторфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл	
O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-хлорфеніл	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-метил-4-хлорфеніл	

R^c ∈ OMe; R^a, R^b i R^e ∈ H;

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
F	OCHF ₂	4-бромфеніл	2,4-біс(CF ₃)феніл

Cl	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Br	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Me	SCHF ₂	4,6-дихлор-3- піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
Et	ціано	2-фтор-6-хлор-3- піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
Pr	феніл	2,6-дихлор-3- піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2-бром-5-хлор-4- піридиніл	2,5-дифторфеніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	3-бром-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2,5-дифторфеніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
OMe	3- (OCF ₃)феніл	2,4-дифторфеніл	2-хлор-5-(CF ₃)феніл
OEt	4-фторфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл	
O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-хлорфеніл	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-метил-4-хлорфеніл	

R^c ∈ Me; R^a, R^b і R^e ∈ H;

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
F	OCHF ₂	4-бромфеніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Br	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Me	SCHF ₂	4,6-дихлор-3- піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
Et	ціано	2-фтор-6-хлор-3- піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
Pr	феніл	2,6-дихлор-3- піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2-бром-5-хлор-4- піридиніл	2,5-дифторфеніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	3-бром-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2,5-дифторфеніл

CHF ₂	3-ціанофеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
OMe	3-(OCF ₃)феніл	2,4-дифторфеніл	2-хлор-5-(CF ₃)феніл
OEi	4-фторфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл	
O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-хлорфеніл	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-метил-4-хлорфеніл	

R^c ∈ F; R^a, R^b і R^e ∈ H;

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
F	OCHF ₂	4-бромфеніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Br	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Me	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
Et	ціано	2-фтор-6-хлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
Pr	феніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2-бром-5-хлор-4-піридиніл	2,5-дифторфеніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	3-бром-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2,5-дифторфеніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
OMe	3-(OCF ₃)феніл	2,4-дифторфеніл	2-хлор-5-(CF ₃)феніл
OEi	4-фторфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл	
O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-хлорфеніл	
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-метил-4-хлорфеніл	

R^c ∈ Cl; R^a, R^b і R^e ∈ H;

<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>	<u>R^d</u>
H	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
F	OCHF ₂	4-бромфеніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Br	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Me	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл

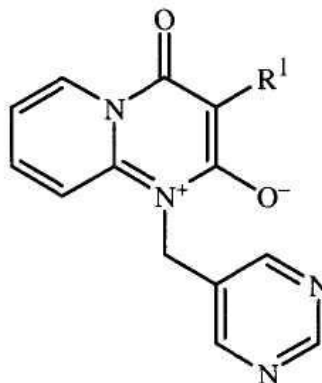
Et	ціано	піридиніл	2-фтор-6-хлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
Pr	феніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл	
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2-бром-5-хлор-4-піридиніл	2,5-дифторфеніл	
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	3-бром-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл	
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл	
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2,5-дифторфеніл	
CHF ₂	3-ціанофеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл	
OMe	3-(OCF ₃)феніл	2,4-дифторфеніл	2-хлор-5-(CF ₃)феніл	
OEt	4-фторфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл		
O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-хлорфеніл		
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-метил-4-хлорфеніл		

R^a і R^e є F; R^c і R^d є H;

<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>	<u>R^b</u>
H	OCF ₃	4-ціанофеніл	2-фтор-4-(CF ₃)феніл
F	OCHF ₂	4-бромфеніл	2,4-біс(CF ₃)феніл
Cl	OCH ₂ CF ₃	6-хлор-3-піридиніл	2-фтор-4-бромфеніл
Br	SCF ₃	6-фтор-3-піридиніл	2-хлор-4-фторфеніл
I	SCF ₃	6-(CF ₃)-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-фторфеніл
Me	SCHF ₂	4,6-дихлор-3-піридиніл	2-метил-4-(CF ₃)феніл
Et	ціано	2-фтор-6-хлор-3-піридиніл	2-хлор-4-(CF ₃)феніл
Pr	феніл	2,6-дихлор-3-піридиніл	2-(CF ₃)-4-хлорфеніл
<i>i</i> -Pr	2-фторфеніл	2-бром-5-хлор-4-піридиніл	2,5-дифторфеніл
<i>t</i> -Bu	3-хлорфеніл	3-бром-5-фторфеніл	2-фтор-5-(CF ₃)феніл
CF ₃	3-(CF ₃)феніл	3-хлор-5-фторфеніл	2-фтор-5-хлорфеніл
CH ₂ F	3-фторфеніл	3-фтор-4-хлорфеніл	2,5-дифторфеніл
CHF ₂	3-ціанофеніл	2,4-дифторфеніл	2-фтор-5-(OCF ₃)феніл
OMe	3-(OCF ₃)феніл	2,4-дифторфеніл	2-хлор-5-(CF ₃)феніл
OEt	4-фторфеніл	2-фтор-4-ціанофеніл	

O- <i>n</i> -Pr	4-хлорфеніл	2-фтор-4-хлорфеніл
O- <i>i</i> -Pr	4-(CF ₃)феніл	2-метил-4-хлорфеніл

ТАБЛИЦЯ 2



<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
2-фтор-4-піридиніл	2-хлор-4-піридиніл
2-бром-4-піридиніл	2-(трифторметил)-4-піридиніл
6-фтор-2-піридиніл	6-хлор-2-піридиніл
6-бром-2-піридиніл	6-(трифторметил)-2-піридиніл
4-фтор-2-піридиніл	4-хлор-2-піридиніл
4-бром-2-піридиніл	4-(трифторметил)-2-піридиніл

Сполука даного винаходу в основному застосовується в якості активного інгредієнта для боротьби з безхребетним шкідником у композиції, тобто складі, із щонайменше одним додатковим компонентом, обраним із групи, що складається з поверхнево-активних речовин, твердих розріджувачів і рідких розріджувачів, які служать у якості носія. Інгредієнти складу або композиції вибирають так, щоб вони відповідали фізичним властивостям активного інгредієнта, способу застосування та факторам середовища проживання, таким як тип ґрунту, вологість і температура.

Придатні складі включають як рідкі, так і тверді композиції. Рідкі композиції включають розчини (включаючи концентрати емульсії), суспензії, емульсії (включаючи мікроемульсії та/або суспоемульсії) і т.п., які необов'язково можуть бути згущені в гелі. Основними типами водних рідких композицій є розчинний концентрат, концентрат суспензії, капсульна суспензія, концентрована емульсія, мікроемульсія та суспоемульсія. Основними типами неводних рідких композицій є концентрат емульсії, концентрат мікроемульсії, диспергуючий концентрат і дисперсія в маслі.

Основними типами твердих композицій є пилоподібні препарати, порошки, гранули, драже, дробинки, пастилки, таблетки, наповнені плівки (включаючи покриття для насіння) і т.п., які можуть бути вододиспергуючими ("змочуваними") або водорозчинними. Плівки та покриття, утворені із плівкоутворювальних розчинів або рідкоплинних суспензій, особливо придатні для протравлювання насіння. Активний інгредієнт може бути (мікро)інкапсульованим і далі перетвореним у суспензію або твердий склад; альтернативно весь склад активного інгредієнта може бути інкапсульованим (або "поміченим під захисне покриття"). Інкапсулювання може регулювати або відкладати вивільнення активного інгредієнта. Гранула, яку емульгують, поєднує переваги як складу концентрату емульсії, так і сухого гранульованого складу.

Концентровані композиції в основному застосовуються в якості проміжних складів для подальшого складання.

- Розпилювані сполуки зазвичай розбавляють в підходящому середовищі перед обприскуванням. Такі рідкі та тверді склади складені таким чином, що легко розбавляються в середовищі розчину для обприскування, як правило, воді. Об'єми розчину для обприскування можуть варіювати від приблизно одного до декількох тисяч літрів на гектар, але більш звичайно перебувають у діапазоні від приблизно десяти до декількох сотень літрів на гектар. Зі розпилюваних сполук може бути приготовлена бакова суміш із водою або іншим підходящим середовищем для обробки листів за допомогою внесення авіацією, або внесення в ґрунт, або внесення в середовище вирощування рослини. Рідкі та сухі склади можуть дозуватися безпосередньо в системи краплинного зрошення або відмірюватися в борозну під час посадки. Рідкі та тверді склади можуть наноситися на насіння сільськогосподарських культур та іншу підходящу рослинність замість обробки насіння перед посадкою для захисту зростаючого кореня та інших підземних частин рослини та/або листя шляхом систематичного поглинання.
- Склади будуть зазвичай містити ефективну кількість активного інгредієнта, розріджувач та поверхнево-активну речовину в наступних приблизних діапазонах, які дають у сумі 100 вагових відсотків.

	Активний інгредієнт	Ваговий відсоток Розріджувач	Поверхнево-активна речовина
Вододиспергуючі та водорозчинні гранули, таблетки та порошки	0,001-90	0-99,999	0-15
Дисперсії в маслі, суспензії, емульсії, розчини (включаючи концентрати емульсій)	1-50	40-99	0-50
Пилоподібні препарати	1-25	70-99	0-5
Гранули та драже	0,001-95	5-99,999	0-15
Концентровані композиції	90-99	0-10	0-2

- Тверді розріджувачі включають, наприклад, глини, такі як бентоніт, монтморилоніт, атапульгіт і каолін, гіпс, целюлозу, двоокис титану, оксид цинку, крохмаль, декстрин, цукри (наприклад лактозу, сахарозу), кремнезем, тальк, слюду, діатоміт, сечовину, кальцію карбонат, карбонат і бікарбонат натрію та натрію сульфат. Стандартні тверді розріджувачі описані в Watkins et al., Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers, 2nd Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jersey.

- Рідкі розріджувачі включають, наприклад, воду, N, N-диметилалканаміди (наприклад N, N-диметилформамід), лімонен, диметилсульфоксид, N-алкілпіролідони (наприклад N-метилпіролідон), етиленгліколь, триетиленгліколь, пропіленгліколь, дипропіленгліколь, поліпропіленгліколь, пропіленкарбонат, бутиленкарбонат, парафіни (наприклад світлі мінеральні масла, нормальні парафіни, ізопарафіни), алкілбензоли, алкілнафталіни, гліцерин, гліцерол триацетат, сорбіт, триацетин, ароматичні вуглеводні, деароматизовані аліфатичні вуглеводні, алкілбензоли, алкілнафталіни, кетони, такі як циклогексанон, 2-гептанон, ізофорон і 2-пентанон, ацетати, такі як ізоамілацетат, гексилацетат, гептилацетат, октилацетат, нонілацетат, тридецилацетат та ізоборнілацетат, інші складні ефіри, такі як алкільовані складні ефіри лактату, складні ефіри двоосновних кислот та γ-бутиролактон, і спирти, які можуть бути лінійними, розгалуженими, насиченими або ненасиченими, такими як метанол, етанол, n-пропанол, ізопропіловий спирт, n-бутанол, ізобутиловий спирт, n-гексанол, 2-етилгексанол, n-октанол, деканол, ізодециловий спирт, ізооктадеканол, цетиловий спирт, лауриловий спирт, тридециловий спирт, олеїловий спирт, циклогексанол, тетрагідрофурфуріловий спирт, діацетоновий спирт та бензиловий спирт. Рідкі розріджувачі також включають гліцеринові складні ефіри насичених і ненасичених жирних кислот (звичайно C₆-C₂₂), такі як масла насіння рослин і плодів (наприклад олії маслини, рицини, насіння льону, кунжуту, кукурудзи (маїсу), арахісу, соняшника, виноградних кісточок, сафлору, насіння бавовнику, сої, насіння рапсу, кокосового горіха і ядер кокосового горіха), жири тваринного походження (наприклад яловиче сало, свиняче сало, пряжене свиняче сало, жир печінки тріски, риб'ячий жир) і їх суміші. Рідкі розріджувачі також включають алкільовані жирні кислоти (наприклад метильовані, етильовані, бутильовані), де жирні кислоти можуть бути отримані гідролізом гліцеринових складних ефірів рослинного та тваринного походження та можуть бути очищені дистиляцією. Стандартні рідкі розріджувачі описуються в Marsden, Solvents Guide, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950.

Тверді та рідкі композиції даного винаходу часто включають одну або кілька поверхнево-активних речовин. При додаванні до рідини поверхнево-активні речовини (також відомі як "поверхнево-активні засоби") в основному модифікують, найчастіше зменшують, поверхневий натяг рідини. Залежно від природи гідрофільної та ліпофільної груп у молекулі поверхнево-активної речовини, поверхнево-активні речовини можуть бути придатними в якості змочувальних засобів, диспергувальних засобів, емульгаторів або піногасників.

Поверхнево-активні речовини можуть бути класифіковані як неіонні, аніонні або катіонні. Неіонні поверхнево-активні речовини, придатні для даних композицій, включають, у тому числі, алкоксилати спиртів, такі як алкоксилати спиртів на основі природних і синтетичних спиртів (які є розгалуженими або лінійними) і отримані зі спиртів і етиленоксиду, пропіленоксиду, бутиленоксиду або їх сумішей; етоксилати амінів, алканоламіди та етоксильовані алканоламіди; алкоксильовані тригліцериди, такі як етоксильовані олії сої, рицини та насіння рапсу; алкоксилати алкілфенолів, такі як октилфенолетоксилати, нонілфенолетоксилати, динонілфенолетоксилати та додецилфенолетоксилати (отримані з фенолів і етиленоксиду, пропіленоксиду, бутиленоксиду або їх сумішей); блокспівполімери, отримані з етиленоксиду або пропіленоксиду та блокспівполімери зі зворотним порядком блоків, де термінальні блоки отримані із пропіленоксиду; етоксильовані жирні кислоти; складні ефіри та масла етоксильованих жирних кислот; етоксильовані метилові складні ефіри; етоксильований тристирилфенол (включаючи отриманий з етиленоксиду, пропіленоксиду, бутиленоксиду або їх сумішей); складні ефіри жирних кислот, складні ефіри гліцерину, ланолінові похідні, поліетоксилатні складні ефіри, такі як поліетоксильовані складні ефіри сорбітану та жирної кислоти, поліетоксильовані складні ефіри сорбіту та жирної кислоти та поліетоксильовані складні ефіри гліцерину та жирної кислоти; інші похідні сорбітану, такі як складні ефіри сорбітану; полімерні поверхнево-активні речовини, такі як статистичні співполімери, блокспівполімери, алкідні смоли на основі *peg* (поліетиленгліколю), привіті співполімери або гребінчасті полімери та зіркоподібні полімери; поліетиленгліколі (*peg*); складні ефіри поліетиленгліколю та жирної кислоти; кремнієві поверхнево-активні речовини; і похідні цукрів, такі як складні ефіри сахарози, алкілполіглікозиди та алкілполісахариди.

Придатні аніонні поверхнево-активні речовини включають, у тому числі, алкіларилсульфонові кислоти та їх солі; карбоксильовані етоксилати спиртів або алкілфенолів; дифенілсульфонатні похідні; лігнін та похідні лігніну, такі як лігносульфонати; малеїнові або бурштинові кислоти або їх ангідриди; олефісульфонати; складні ефіри фосфорної кислоти, такі як складні ефіри фосфорної кислоти алкоксилатів спирту, складні ефіри фосфорної кислоти алкоксилатів алкілфенолу та складні ефіри фосфорної кислоти етоксилатів стирилфенолу; білкові поверхнево-активні речовини; похідні саркозину; сульфат ефіру стирилфенолу; сульфати та сульфонати масел і жирних кислот; сульфати та сульфонати етоксильованих алкілфенолів; сульфати спиртів; сульфати етоксильованих спиртів; сульфонати амінів та амідів, такі як N, N-алкілтаурати; сульфонати бензолу, кумолу, толуолу, ксилолу та додецил- і тридецилбензолів; сульфонати конденсованих нафталінів; сульфонати нафталіну та алкілнафталіну; сульфонати розділеної на фракції нафти; сульфосукцимати та сульфосукцинати та їх похідні, такі як діалкілсульфосукцинатні солі.

Придатні катіонні поверхнево-активні речовини включають, у тому числі, амідів та етоксильовані амідів; аміни, такі як N-алкілпропандіаміни, трипропілентриаміни та дипропілентетрааміни, та етоксильовані аміни, етоксильовані діаміни та пропоксильовані аміни (отримані з амінів і етиленоксиду, пропіленоксиду, бутиленоксиду або їх сумішей); амініні солі, такі як аміноацетати та діамінні солі; четвертинні амонієві солі, такі як четвертинні солі, етоксильовані четвертинні солі та дичетвертинні солі; та аміноксиди, такі як алкілдиметиламіноксиди та біс-(2-гідроксietил)-алкіламіноксиди.

Також придатні для даних композицій суміші неіонних та аніонних поверхнево-активних речовин або суміші неіонних і катіонних поверхнево-активних речовин. Неіонні, аніонні та катіонні поверхнево-активні речовини та їх рекомендовані застосування розкриті в різноманітних опублікованих довідкових матеріалах, включаючи McCutcheon's Emulsifiers and Detergents, щорічні американські та міжнародні видання, опубліковані McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; Sisely and Wood, Encyclopedia of Surface Active Agents, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964; та A. S. Davidson and B. Milwidsky, Synthetic Detergents, Seventh Edition, John Wiley and Sons, New York, 1987.

Композиції даного винаходу можуть також включати допоміжні засоби та добавки складу, відомі фахівцям у даній галузі техніки у якості допоміжних речовин складів (уважається, що деякі з них можуть також функціонувати як тверді розріджувачі, рідкі розріджувачі або поверхнево-активні речовини). Такі допоміжні засоби та добавки складів можуть регулювати pH

(буфери), спінення під час одержання (піногасники, такі як поліорганосилоксани), седиментацію активних інгредієнтів (суспендуючі засоби), в'язкість (тиксотропні загусники), мікробний ріст у тарі (протимікробні засоби), заморожування продукту (антифризи), колір (дисперсії барвника/пігменту), змивання (плівкоутворювачі або клейкі речовини), випаровування (сповільнювачі випаровування) та інші характеристики сполуки. Плівкоутворювачі включають, наприклад полівінілацетати, співполімери полівінілацетату, співполімер полівінілпіролідону та вінілацетату, полівінілові спирти, співполімери полівінілового спирту та воски. Приклади допоміжних засобів і добавок включають перераховані у McCutcheon's Volume 2: Functional Materials, щорічних міжнародному та північноамериканському виданнях, опублікованих McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; і PCT публікації WO 03/024222.

Сполука формули 1 і будь-які інші активні інгредієнти зазвичай включені в дані композиції за допомогою розчинення активного інгредієнта в розчиннику або здрібнювання в рідкому або сухому розріджувачі. Розчини, включаючи концентрати емульсій, можуть бути отримані шляхом простого перемішування інгредієнтів. Якщо розчинник рідкої композиції, призначеної для застосування в якості концентрату емульсії не змішується з водою, емульгатор зазвичай додають для емульгування розчинника, що містить активну речовину, при розведенні водою. Суспензія твердих частинок в рідині активного інгредієнта з діаметрами часток до 2000 мкм може піддаватися мокрому помелу із застосуванням млинів для розмелу з одержанням часток із середніми діаметрами менше 3 мкм. Водні суспензії можуть бути перетворені в кінцеві концентрати суспензії (див. наприклад патент США № 3060084) або далі піддані розпилювальному сушінню з утвором водно-диспергуючих гранул. Сухі сполуки, як правило, мають на увазі способи сухого розмелювання, при якому виходять середні діаметри часток у діапазоні від 2 до 10 мкм. Пилоподібні препарати та порошки можуть бути отримані шляхом змішування та, як правило, здрібнювання (такого як молотковим млином або струминним млином). Гранули та драже можуть бути отримані розпиленням активного матеріалу на попередньо сформовані гранулярні носії або способами агломерації. Див. Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, December 4, 1967, pp 147–48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4th Ed., McGraw-hill, New York, 1963, pages 8–57 і наступні, і документ WO 91/13546. Драже можуть бути отримані, як описується в патенті США № 4172714. Водно-диспергуючі та водно-розчинні гранули можуть бути отримані, як зазначено в патентах США №№ 4144050, 3920442 і патенті Німеччини № 3246493. Таблетки можуть бути отримані, як зазначено в патентах США №№ 5180587, 5232701 і 5208030. Плівки можуть бути отримані, як зазначено в патенті Великобританії № 2095558 і патенті США № 3299566.

Щоб одержати додаткову інформацію щодо галузі складання, див. T. S. Woods, "The Formulator's Toolbox – Product Forms for Modern Agriculture" in Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food–Environment Challenge, T. Brooks and T. R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, pp. 120–133. Також див. патент США № 3235361, від абзацу 6, рядка 16 до абзацу 7, рядка 19 і приклади 10–41; патент США № 3309192, від абзацу 5, рядка 43 до абзацу 7, рядка 62 і приклади 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138 – 140, 162 – 164, 166, 167 і 169 – 182; патент США № 2891855, від абзацу 3, рядка 66 до абзацу 5, рядка 17 і приклади 1–4; Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pp 81–96; Hance et al., Weed Control Handbook, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989; та Developments in formulation technology, PJB Publications, Richmond, UK, 2000.

У наступних прикладах усі склади отримані традиційними способами. Номера сполук відносяться до сполук у таблиці А індексів. Можна вважатися, що без подальших уточнень фахівець у даній галузі, застосовуючи попередній опис, може використовувати даний винахід у повному його обсязі. Наступні приклади, отже, повинні сприйматися тільки як ілюстративні та не обмежуючі розкриття взагалі яким-небудь чином. Відсотки мають на увазі по вазі, крім випадків, коли зазначене інше.

Приклад А

Сильний концентрат

сполука 1	98,5 %
кварцовий аерогель	0,5 %
синтетичний аморфний тонкодисперсний кремнезем	1,0 %

Приклад В

Змочуваний порошок

сполука 2	65,0 %
-----------	--------

5	ефір додецилфенолполіетиленгліколю	2,0 %
	натрію лігнінсульфонат	4,0 %
	натрію силікоалюмінат	6,0 %
	монтморилоніт (кальцинований)	23,0 %
	Приклад С	
	Гранула	
	сполука 3	10,0 %
	атапульгітні гранули (слабколетка речовина, 0,71/0,30 мм;. сита № 25-50 по стандарту США)	90,0 %
	Приклад D	
	Екструдоване драже	
	сполука 4	25,0 %
	безводний натрій сульфат	10,0 %
	неочищений кальцію лігнінсульфонат	5,0 %
	натрію алкілнафталінсульфонат	1,0 %
	кальцію/магнію бентоніт	59,0 %
	Приклад E	
	Концентрат, що емульгують	
	сполука 5	10,0 %
	поліоксіетилен сорбіт гексаолеат	20,0 %
	метиловий ефір C6-C10 жирної кислоти	70,0 %
	Приклад F	
	Мікроемульсія	
	сполука 6	5,0 %
	співполімер полівінілпіролідону та вінілацетату	30,0 %
	алкілполіглікозид	30,0 %
	гліцерилмоноолеат	15,0 %
	вода	20,0 %
	Приклад G	
	Протравляння насіння	
	сполука 7	20,00 %
	співполімер полівінілпіролідону та вінілацетату	5,00 %
	кислий монтанвоск	5,00 %
	кальцію лігнінсульфонат	1,00 %
	блокспівполімери поліоксіетилену/поліоксипропілену	1,00 %
	стеариловий спирт (POE 20)	2,00 %
	поліоргансилан	0,20 %
	забарвлювальний червоний барвник	0,05 %
	вода	65,75 %
	Приклад H	
	Паличка-Добриво	
	сполука 8	2,50 %
	співполімер піролідону та стиролу	4,80 %
	тристирилфеніл-16-етоксилат	2,30 %
	тальк	0,80 %
	кукурудзяний крохмаль	5,00 %
	добриво, що повільно вивільняється	36,00 %
	каолін	38,00 %
	вода	10,60 %
	Приклад I	
	Концентрат суспензії	
	сполука 9	35 %
	блокспівполімер бутилполіоксіетилену/поліпропілену	4,0 %
	співполімер стеаринової кислоти/поліетиленгліколю	1,0 %
	стирол-акриловий полімер	1,0 %
	ксантанова камедь	0,1 %
	пропіленгліколь	5,0 %
	силіконовий протиспінювач	0,1 %
	1,2-бензізотіазолін-3-он	0,1 %

вода	53,7 %
Приклад J	
Емульсія у воді	
сполука 10	10,0 %
блокспівполімер бутилполіоксіетилену/поліпропілену	4,0 %
співполімер стеаринової кислоти/поліетиленгліколю	1,0 %
стирол-акриловий полімер	1,0 %
ксантанова камедь	0,1 %
пропіленгліколь	5,0 %
силіконовий протиспінювач	0,1 %
1,2-бензізотіазолін-3-он	0,1 %
ароматичний вуглеводень із нафтової сировини	20,0 %
вода	58,7 %
Приклад K	
Дисперсія в маслі	
сполука 11	25 %
поліоксіетилен сорбіт гексаолеат	15 %
органічно модифікована бентонітова глина	2,5 %
метиловий складний ефір жирної кислоти	57,5 %
Приклад L	
Суспоемульсія	
сполука 12	10,0 %
імідаклоприд	5,0 %
блокспівполімер бутилполіоксіетилену/поліпропілену	4,0 %
співполімер стеаринової кислоти/поліетиленгліколю	1,0 %
стирол-акриловий полімер	1,0 %
ксантанова камедь	0,1 %
пропіленгліколь	5,0 %
силіконовий протиспінювач	0,1 %
1,2-бензізотіазолін-3-он	0,1 %
ароматичний вуглеводень із нафтової сировини	20,0 %
вода	53,7 %

- 5 Сполуки даного винаходу проявляють активність проти широкого спектра безхребетних шкідників. Дані шкідники включають безхребетних, що живуть у різноманітних середовищах проживання, таких як, наприклад, листя, коріння рослини, ґрунт для рослини, зібраний урожай або інші харчові продукти, будівельні спорудження або покриви тіла тварин. Дані шкідники включають, наприклад, безхребетних, що харчуються листям (включаючи листи, плодоніжки, квіти та плоди), насінням, деревиною, текстильними волокнами або кров'ю або тканинами тварин, і, таким чином, викликаючи ушкодження або шкоду, наприклад, вирощуванням або сільськогосподарським культурам, які зберігаються, лісам, тепличним культурам, декоративним рослинам, культурам у розпліднику, продуктам харчування, що зберігаються, або виробам з волокна, або житлам, або іншим приміщенням, або їх складовим, або шкідливі для здоров'я тварин або суспільної охорони здоров'я. Фахівцям у даній галузі техніки буде зрозуміло, що не всі сполуки однаково ефективні проти всіх стадій росту всіх шкідників.
- 10 Дані сполуки та композиції, таким чином, придатні в агрономічному плані для захисту польових культур від рослиноїдних безхребетних шкідників, а також у відмінному від агрономічного плані для захисту інших садових культур і рослин від рослиноїдних безхребетних шкідників. Дана корисність включає захист оброблюваних рослин та інших рослин (тобто як агрономічні, так і відмінні від агрономічних), які мають генетичний матеріал, включений шляхом генної інженерії (тобто трансгенні), або модифіковані мутагенезом з одержанням кращих ознак. Приклади таких ознак включають резистентність до гербіцидів, стійкість до рослиноїдних шкідників (наприклад комах, кліщів, попелиць, павуків, нематод, равликів, фітопатогенних
- 20 грибів, бактерій та вірусів), підвищений ріст рослин, підвищена резистентність до несприятливих умов вирощування, таким як висока або низька температури, низька або висока вологість ґрунту та сильна засоленість, підвищене цвітіння або плодоношення, більші виходи врожаю, більш швидке дозрівання, більш висока якість і/або значення живильної цінності зібраного продукту, або поліпшена збережуваність, або поліпшені характеристики при переробці зібраних продуктів. Трансгенні рослини можуть бути модифіковані для експресії численних ознак. Приклади рослин, що мають ознаки, які забезпечуються генною інженерією
- 30

або мутагенезом, включають різновиди кукурудзи, бавовни, сої та картоплі, які експресують інсектицидний токсин *Bacillus thuringiensis*, такий як YIELD GARD®, KNOCKOUT®, STARLINK®, BOLLGARD®, NuCOTN® і NEWLEAF®, і стійкі до гербіцидів різновиди кукурудзи, бавовни, сої та рапсу, такі як ROUNDUP READY®, LIBERTY LINK®, IMI®, STS® і CLEARFIELD®, а також сільськогосподарські культури, які експресують N-ацетилтрансферазу (GAT) із забезпеченням стійкості до гербіциду гліфосату, або сільськогосподарські культури, що мають ген HRA із забезпеченням стійкості до гербіцидів, інгібуючий ацетолактатсинтазу (ALS). Дані сполуки та композиції можуть синергетично впливати на ознаки, введені шляхом генної інженерії або модифіковані мутагенезом, таким чином, підсилюючи фенотипічну експресію або результативність ознак, або збільшення результативності боротьби з безхребетним шкідником даних сполук і композицій. Зокрема, дані сполуки та композиції можуть синергетично впливати на фенотипічну експресію білків або інших природних продуктів, токсичних для безхребетних шкідників, для забезпечення більшої, ніж адитивна, боротьби з даними шкідниками. Також дані сполуки та композиції можуть синергетично впливати на ознаки, підвищуючи ріст рослин або інші аспекти сили росту рослини, включаючи ознаки, що надають стійкість до впливу умов середовища проживання, таких як неоптимальна вологість.

Композиції даного винаходу можуть також необов'язково містити поживні елементи для рослин, наприклад, коли композиція добрив містить щонайменше один поживний елемент для рослин, обраний з азоту, фосфору, калію, сірки, кальцію, магнію, заліза, міді, бору, марганцю, цинку та молібдену. Примітними є композиції, що містять щонайменше одну композицію добрив, що містить щонайменше один поживний елемент для рослин, обраний з азоту, фосфору, калію, сірки, кальцію та магнію. Композиції даного винаходу, які також містять щонайменше один поживний елемент для рослин, можуть бути у формі рідин або твердих речовин. Слід відзначити тверді сполуки у формі гранул, маленьких паличок або таблеток. Тверді сполуки, що містять композицію добрив, можуть бути отримані змішуванням сполуки або композиції даного винаходу з композицією добрив разом зі складовими інгредієнтами та потім одержання складу способами, такими як грануляція або екструзія. Альтернативно, тверді склади можуть бути отримані розпиленням розчину або суспензії сполуки або композиції даного винаходу в летучому розчиннику на попередньо отриману композицію добрив у формі стабільних за розміром сумішей, наприклад, гранул, маленьких паличок або таблеток, і потім випарюванням розчинника.

Приклади агрономічних або відмінних від агрономічних безхребетних шкідників включають яйця, личинки та дорослі особини ряду Лускокрилі, такі як "ратні хробаки", совки, п'ядаки та представники підродини *Heliothinae* родини *Noctuidae* (наприклад, рожевий стебловий точильник (*Sesamia inferens* Walker), точильник кукурудзяного стебла (*Sesamia nonagrioides* Lefebvre), південний "ратний хробак" (*Spodoptera eridania* Cramer), совка трав'яна (*Spodoptera fugiperda* J. E. Smith), совка мала (*Spodoptera exigua* Hübner), єгипетська бавовникова совка (*Spodoptera littoralis* Boisdual), жовтосмужна совка (*Spodoptera ornithogalli* Guenée), совка-іпсилон (*Agrotis ipsilon* Hufnagel), совка оксамитних бобів (*Anticarsia gemmatilis* Hübner), метелик-совка (*Lithophane antennata* Walker), совка капустяна (*Barathra brassicae* Linnaeus), соєвий п'ядак (*Pseudoplusia includens* Walker), совка ні (*Trichoplusia ni* Hübner), тютюнова листокрутка (*Heliothis virescens* Fabricius)); точильники, чехлоносики, метелики, гусениці яких будують павутинне гніздо, гусениці шишкової вогнівки, гусениці капустниці та шкідники із сімейства *Pyrallidae*, що скелетують листи, (наприклад, метелик кукурудзяний (*Ostrinia nubilalis* Hübner), міль фруктова смугаста (*Amyelois transitella* Walker), метелики-вогнівки (*Crambus caliginosellus* Clemens), лугові метелики (*Pyrallidae: Crambinae*), такі як луговий метелик (*Herpetogramma licarsisalis* Walker), точильник стебла цукрової тростини (*Chilo infuscatellus* Snellen), малий томатний точильник (*Neoleucinodes elegantalis* Guenée), зелена трубоквертка (*Snaphalocerus medinalis*), вогнівка виноградна (*Desmia funeralis* Hübner), вогнівка баштанна (*Diaphania nitidalis* Stoll), личинка середини капусти (*Helluala hydralis* Guenée), жовта стеблова вогнівка (*Scirpophaga incertulas* Walker), вогнівка молодих пагонів (*Scirpophaga infuscatellus* Snellen), біла стеблова вогнівка (*Scirpophaga innotata* Walker), вогнівка верхівкових пагонів (*Scirpophaga nivella* Fabricius), темноголова рисова вогнівка (*Chilo polychrysus* Meyrick), гусениця капустниці (*Crociodolomia binotalis* English)); листовертки, листовертки-почкоїди, плодожерки і гусениці-шкідники плодів родини *Tortricidae* (наприклад, плодожерка яблунева (*Cydia pomonella* Linnaeus), листовертка виноградна (*Endopiza viteana* Clemens), листовертка східна персикова (*Grapholita molesta* Busck), цитрусова несправжня плодожерка (*Cryptophlebia leucotreta* Meyrick), цитрусовий точильник (*Ecdytoplopha aurantiana* Lima), листовертка із червоною каймою (*Argyrotaenia velutinana* Walker), скошеносмугаста листовертка (*Choristoneura rosaceana* Harris), новозеландська листовертка (*Epirhyas postvittana* Walker), дворічна трубоквертка (*Eupoecilia*

ambiguella Hübner), вертуха почкова (*Pandemis pyrusana* Kearfott), всеїдна листокрутка (*Platynota stultana* Walsingham), листовійка смородинова кривовуса (*Pandemis cerasana* Hübner), вербова кривовуса листовійка (*Pandemis heparana* Denis & Schiffermüller)); і багато інших економічно важливих Лускокрилих (наприклад, міль капустяна (*Plutella xylostella* Linnaeus), рожевий коробковий хробак бавовнику (*Pectinophora gossypiella* Saunders), шовкопряд непарний (*Lymantria dispar* Linnaeus), персикова плодожерка (*Carposina niponensis* Walsingham), міль фруктова смугаста (*Anarsia lineatella* Zeller), личинка виємчатокрилої моли (*Phthorimaea operculella* Zeller), міль-пестрянка плодова нижнестороння (*Lithocolletis blancardella* Fabricius), азіатська яблунева листова міль (*Lithocolletis ringoniella* Matsumura), вогнівка рисова (*Lerodea eufala* Edwards), глідова кружечкова міль (*Leucoptera scitella* Zeller)); яйця, німфи та дорослі особини ряду Blattodea, включаючи тарганів родин Blattellidae і Blattidae (наприклад, тарган чорний (*Blatta orientalis* Linnaeus), азіатський тарган (*Blattella asahinai* Mizukubo), тарган рудий (*Blattella germanica* Linnaeus), брунотносмугастий тарган (*Supella longipalpa* Fabricius), тарган американський (*Periplaneta americana* Linnaeus), коричневий тарган (*Periplaneta brunnea* Burmeister), мадерійський тарган (*Leucophaea maderae* Fabricius)), димчасто-коричневий тарган (*Periplaneta fuliginosa* Service), тарган австралійський (*Periplaneta australasiae* Fabr.), тарган мармуровий (*Nauphoeta cinerea* Olivier) і тарган гладкий (*Symploce pallens* Stephens)); яйця, личинки, що харчуються листям, плодами, коріннями, насінням та пухирчастою тканиною, і дорослі особини ряду Coleoptera, включаючи довгоносики родин Anthribidae, Bruchidae і Curculionidae (наприклад, довгоносик бавовняний (*Anthonomus grandis* Boheman), довгоносик рисовий водяний (*Lissorhoptrus oryzophilus* Kuschel), довгоносик амбарний (*Sitophilus granarius* Linnaeus), довгоносик рисовий (*Sitophilus oryzae* Linnaeus)), довгоносик-шкідник мятлика однолітнього (*Listronotus maculicollis* Dietz), мятликовий довгоносик (*Sphenophorus parvulus* Gyllenhal), довгоносик "hunting billbug" (*Sphenophorus venatus vestitus*), довгоносик Денвера (*Sphenophorus cicatristriatus* Fahraeus)); земляні блохи, огіркові жуки, личинки, які ушкоджують коріння, листогризи, картопляні блішки та мінуючі мушки родини Chrysomelidae (наприклад, колорадський жук (*Leptinotarsa decemlineata* Say), західний кукурудзяний жук (*Diabrotica virgifera virgifera* Leconte)); хрущі і інші жуки родини Scarabaeidae (наприклад, хрущик японський (*Popillia japonica* Newman), хрущик східний (*Anomala orientalis* Waterhouse, *Exomala orientalis* (Waterhouse) Baraud), північний хрущ (*Cyclocephala borealis* Arrow), південний хрущ (*Cyclocephala immaculata* Olivier або *C. lurida* Bland), гнойовий жук і личинка хруща (*Aphodius* spp.), чорний газонний гнойовик роду *Ataenius* (*Ataenius spretulus* Haldeman), хрущ блискучий зелений (*Cotinis nitida* Linnaeus), хрущик азіатський садовий (*Maladera castanea* Arrow), травневі/червневі хрущі (*Phyllophaga* spp.) та європейський хрущ (*Rhizotrogus majalis* Razoumowsky)); килимові блохи родини Dermestidae; дротяники родини Elateridae; короїди родини Scolytidae та борошняні хрущаки родини Tenebrionidae.

До того ж агрономічні та відмінні від агрономічних шкідники включають яйця, дорослі особини та личинки ряду Dermaptera, включаючи щипавок родини Forficulidae (наприклад, щипавка європейська (*Forficula auricularia* Linnaeus), щипавку чорну (*Chelisoches morio* Fabricius)); яйця, незрілі особини, дорослі особини та німфи рядів Hemiptera та Homoptera, таких як слепняків родини Miridae, цикад родини Cicadidae, цикадки (наприклад *Empoasca* spp.) родини Cicadellidae, клопів постільних (наприклад *Cimex lectularius* Linnaeus) родини Cimicidae, комаху надродина Fulgoroidea родини Fulgoridae та Delphacidae, горбаток родини Membracidae, псилів родини Psyllidae, білокрилок родини Aleyrodidae, афід родини Aphididae, філоксера родини Phylloxeridae, червців борошнистих родини Pseudococcidae, щитівків родин Coccidae, Diaspididae і Margarodidae, клопів-мереживниць родини Tingidae, щитників родини Pentatomidae, клопів-наземників (наприклад клопа-черепашку пшеничного північноамериканського (*Blissus leucopterus hirtus* Montandon) і південного клопа-черепашку (*Blissus insularis* Barber)) та інших наземників родини Lygaeidae, пінниць родини Coreidae, клопів-ромбовиків сумних родини Coreidae, та красноклопів постільних, та красноклопів бавовняних родини Pyrrhocoridae.

Агрономічні та відмінні від агрономічних шкідники також включають яйця, личинки, німф і дорослих особин ряду Acari (кліщі), таких як кліщики павутинні і червоні кліщики родини Tetranychidae (наприклад кліщ червоний плодовий (*Panonychus ulmi* Koch), кліщик двуплямистий павутинний (*Tetranychus urticae* Koch), кліщ МакДанієла (*Tetranychus mcdanieli* McGregor)); пласких кліщів родини Tenuipalpidae (наприклад цитрусового плаского кліща (*Brevipalpus lewisi* McGregor)); кліщів виноградних войлочкових та галових кліщів родини Eriophyidae та інших кліщів, у яких некоренева харчування, та кліщів, значимих для здоров'я людини та тварин, тобто пилових кліщів родини Epidermoptidae, залозниць родини Demodicidae, зернових кліщів родини Glycyphagidae; іксодових кліщів родини Ixodidae, загальновідомих як

тверді кліщі (наприклад, чорноногий кліщ (*Ixodes scapularis* Say), австралійського паралізуючого кліща (*Ixodes holocyclus* Neumann), іксодового кліща собачого (*Dermacentor variabilis* Say), іксодового кліща *Amblyomma* (*Amblyomma americanum* Linnaeus)) та іксодових кліщів родини Argasidae, загальновідомих як м'які кліщі (наприклад, аргасовий кліщ (*Ornithodoros turicata*), звичайний перський кліщ (*Argas radiatus*)); кліщів кінських та зуднів коростяних родин Psoroptidae, Psoroptidae і Sarcoptidae; яйця, дорослих особин і незрілих особин ряду Orthoptera, включаючи коникових, справжніх саранових і цвіркунів (наприклад, кобилку (наприклад, *Melanoplus sanguinipes* Fabricius, *M. differentialis* Thomas), сарану американську (наприклад, *Schistocerca americana* Drury), сарану пустельну (*Schistocerca gregaria* Forskal), сарану перелітню (*Locusta migratoria* Linnaeus), кущову сарану (*Zonocerus* spp.), домашнього цвіркуна (*Acheta domesticus* Linnaeus), капустянок звичайних (наприклад, рудувато-буру капустянку (*Scapteriscus vicinus* Scudder) і капустянку південну (*Scapteriscus borellii* Giglio-Tos)); яйця, дорослих особин і незрілих особин ряду Diptera, включаючи мінерів (наприклад *Liriomyza* spp., таких як мінер хрестоцетий (*Liriomyza sativae* Blanchard)), дергунів, плодових мушок звичайних (Tephritidae), шведських мушок (наприклад *Oscinella frit* Linnaeus), ґрунтових личинок мух, мух кімнатних (наприклад *Musca domestica* Linnaeus), мух кімнатних малих (наприклад *Fannia canicularis* Linnaeus, *F. femoralis* Stein), жигалок осінніх (наприклад *Stomoxys calcitrans* Linnaeus), мух осінніх, жигалок коров'ячих малих, мух м'ясних синіх (наприклад *Chrysomya* spp., *Phormia* spp.) та інших мускоїдних мух-шкідників, ґедзів (наприклад *Tabanus* spp.), носоглоткових ґедзів (наприклад *Gastrophilus* spp., *Oestrus* spp.), ґедзів бичачих (наприклад *Hypoderma* spp.), оленячих ґедзів (наприклад *Chrysops* spp.), рунців овечих (наприклад *Melophagus ovinus* Linnaeus) та інших Brachycera, комарів (наприклад *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp.), попелиць чорних (наприклад *Prosimulium* spp., *Simulium* spp.), мокреців, москітів, сціарид та інших Nematocera; яйця, дорослих особин і незрілих особин ряду Thysanoptera, включаючи трипсів цибульних (*Thrips tabaci* Lindeman), трипсів звичайних (*Frankliniella* spp.) та інших трипсів некореневого харчування; комах-шкідників ряду Hymenoptera, включаючи мурах родини Formicidae, включаючи мураху-червицю флоридську (*Camponotus floridanus* Buckley), червону мураху-червицю (*Camponotus ferrugineus* Fabricius), чорну мураху-червицю (*Camponotus pennsylvanicus* De Geer), білоногу мураху (*Technomyrmex albipes* fr. Smith), великоголових мурах (*Pheidole* sp.), "мураху-примару" (*Tapinoma melanocephalum* Fabricius); мураху фараона (*Monomorium pharaonis* Linnaeus), малу вогнену мураху (*Wasmannia auropunctata* Roger), вогнену мураху (*Solenopsis geminata* Fabricius), мураху вогнену імпорту червону (*Solenopsis invicta* Buren), мураху аргентинську (*Iridomyrmex humilis* Mayr), божевільну мураху (*Paratrechina longicornis* Latreille), мураху дернову (*Tetramorium caespitum* Linnaeus), мураху садову білоногу (*Lasius alienus* Förster) та пахучу домашню мураху (*Tapinoma sessile* Say). Інші Hymenoptera включають бджіл (включаючи бджіл-теслярів), шершнів, справжніх ос, риючих ос і справжніх пильщиків (*Neodiprion* spp.; *Cephus* spp.); комах-шкідників ряду Isoptera, включаючи термітів родин Termitidae (наприклад *Macrotermes* sp., *Odontotermes obesus* Rambur), *Kalotermitidae* (наприклад *Cryptotermes* sp.) і *Rhinotermitidae* (наприклад *Reticulitermes* sp., *Coptotermes* sp., *Heterotermes tenuis* Hagen), східного підземного терміта (*Reticulitermes flavipes* Kollar), західного підземного терміта (*Reticulitermes hesperus* Banks), тайванського підземного терміта (*Coptotermes formosanus* Shiraki), західно-індського деревного терміта (*Incisitermes immigrans* Snyder), терміта-деревогриза (*Cryptotermes brevis* Walker), деревного терміта (*Incisitermes snyderi* Light), південного підземного терміта (*Reticulitermes virginicus* Banks), західного деревного терміта (*Incisitermes minor* Hagen), деревних термітів, таких як *Nasutitermes* sp. та інших термітів промислового значення; комах-шкідників ряду Thysanura, таких як лусочниця (*Lepisma saccharina* Linnaeus) і термобія хатня (*Thermobia domestica* Packard); комах-шкідників ряду Mallophaga і включаючи головну вошу (*Pediculus humanus capitis* De Geer), натільну вошу (*Pediculus humanus* Linnaeus), курячу вошу (*Menacanthus stramineus* Nitsch), власоїдів собачих (*Trichodectes canis* De Geer), пухоїдів курячих пестробрюхих (*Goniocotes gallinae* De Geer), вошу овечу (*Bovicola ovis* Schrank), вошу бичачу (*Haematopinus eurysternus* Nitzsch), вошу рогатої худоби довгоносу (*Linognathus vituli* Linnaeus) та інших паразитарних вошей, що смокчуть та жують, які нападають на людей і тварин; комах-шкідників ряду Siphonoptera, включаючи щурячу блоху (*Xenopsylla cheopis* Rothschild), котячу блоху (*Ctenocephalides felis* Bouche), собачу блоху (*Ctenocephalides canis* Curtis), курячу блоху (*Ceratophyllus gallinae* Schrank), блоху домашнього птаха (*Echidnophaga gallinacea* Westwood), блоху людську (*Pulex irritans* Linnaeus) та інших бліх, що вражають ссавців і птахів. Додаткові охоплені членистоногі-шкідники включають павуків ряду Araneae, таких як павук-пустельник бурий (*Loxosceles reclusa* Gertsch & Mulaik) і павук чорна вдова (*Latrodectus mactans* Fabricius), і губоногих ряду Scutigleromorpha, таких як мухоловка звичайна (*Scutigera coleoptrata* Linnaeus).

Приклади безхребетних шкідників зерна, що зберігається, включають капюшонника (*Prostephanus truncatus*), точильника зернового (*Rhyzopertha dominica*), рисових довгоносики (*Stiophilus oryzae*), кукурудзяного довгоносики (*Stiophilus zeamais*), зерновку китайську (*Callosobruchus maculatus*), хруща каштанового (*Tribolium castaneum*), довгоносики комірної (*Stiophilus granarius*), моль індійську борошняну (*Plodia interpunctella*), хруща борошняного (*Ephestia kuhniella*) і борошноїда малого або борошноїда рудого (*Cryptolestis ferrugineus*).

Сполуки даного винаходу демонструють зокрема високу активність проти шкідників ряду Лускокрилі (наприклад *Alabama argillacea* Hübner (совки), *Archips argyrospila* Walker (листокрутки плодівих дерев), *A. rosana* Linnaeus (листокрутки різної) і інших видів роду *Archips*, *Chilo suppressalis* Walker (точильника рисового стебловий), *Snaphalocrosis medinalis* Guenée (листокрутки рисової), *Crambus caliginosellus* Clemens (метелика-вогнівки), *Crambus teterrillus* Zincken (метелика трав'яного), *Cydia pomonella* Linnaeus (плодожерки яблуневої), *Earias insulana* Boisduval (шипуватого хробака), *Earias vittella* Fabricius (совки плямистої), *Helicoverpa armigera* Hübner (коробкового хробака), *Helicoverpa zea* Boddie (совки бавовняної), *Heliothis virescens* Fabricius (тютюнової листокрутки), *Herpetogramma licarsalis* Walker (лугових метеликів), *Lobesia botrana* Denis & Schiffermüller (листокрутки гронової), *Pectinophora gossypiella* Saunders (рожевого коробкового хробака), *Phyllocnistis citrella* Stainton (цитрусової молі, що мінує), *Pieris brassicae* Linnaeus (капустяної білявки), *Pieris rapae* Linnaeus (білявки ріпної), *Plutella xylostella* Linnaeus (молі капустяної), *Spodoptera exigua* Hübner (совки малої), *Spodoptera litura* Fabricius (азіатської бавовняної совки, гронової листокрутки), *Spodoptera frugiperda* J. E. Smith (совки трав'яної), *Trichoplusia ni* Hübner (гусениці капусниці) та *Tuta absoluta* Meyrick (томатної молі)).

Сполуки даного винаходу також мають значну активність по відношенню до представників ряду Homoptera, включаючи *Acyrtosiphon pisum* Harris (попелицю горохову), *Aphis craccivora* Koch (попелицю люцернову), *Aphis fabae* Scopoli (попелицю бобову), *Aphis gossypii* Glover (попелицю бавовняну, попелицю баштанну), *Aphis pomi* De Geer (попелицю яблуневу), *Aphis spiraeicola* Patch (попелицю таволгову), *Aulacorthum solani* Kaltenbach (попелицю картопляну звичайну), *Chaetosiphon fragaefolii* Cockerell (попелицю суничну), *Diuraphis noxia* Kurdjumov/Mordvilko (російську пшеничну попелицю), *Dysaphis plantaginea* Paaserini (попелицю яблуневу рожеву), *Eriosoma lanigerum* Hausmann (попелицю яблуневу кров'яну), *Hyalopterus pruni* Geoffroy (попелицю борошністу сливову), *Lipaphis erysimi* Kaltenbach (попелицю гірчичну листову), *Metopolophium dirhodum* Walker (попелицю велику злакову), *Macrosiphum euphorbiae* Thomas (попелицю картопляну велику), *Myzus persicae* Sulzer (персиково-картопляну попелицю, попелицю персикову зелену), *Nasonovia ribisnigri* Mosley (попелицю салатну зелену), *Pemphigus* spp. (корневу попелицю та галову попелицю), *Rhopalosiphum maidis* Fitch (зернову листову попелицю), *Rhopalosiphum padi* Linnaeus (попелицю черемхову звичайну), *Schizaphis graminum* Rondani (попелицю злакову звичайну), *Sitobion avenae* Fabricius (попелицю листову), *Therioaphis maculata* Buckton (попелицю конюшинову) Toxoptera aurantii Boyer de Fonscolombe (попелицю жовтогарячу) і Toxoptera citricida Kirkaldy (попелицю цитрусову); *Adelges* spp. (хермес); *Phylloxera devastatrix* Pergande (філоксеру гикорі); *Bemisia tabaci* Gennadius (тютюнову білокрилку, бататну білокрилку), *Bemisia argentifolii* Bellows & Perring (білокрилку магнолієву), *Dialeurodes citri* Ashmead (цитрусову білокрилку) і *Trialeurodes vaporariorum* Westwood (тепличну білокрилку); *Empoasca fabae* Harris (картопляну цикадку), *Laodelphax striatellus* Fallen (темну цикадку), *Macrostes quadrilineatus* Forbes (астрову цикадку), *Nephotettix cincticeps* Uhler (цикадку зелену), *Nephotettix nigropictus* Stål (цикадку рисову), *Nilaparvata lugens* Stål (буру рисову цикадку), *Peregrinus maidis* Ashmead (кукурудзяну цикадку), *Sogatella furcifera* Horvath (короткохвосту цикадку), *Sogatodes orizicola* Muir (рисового дельфацида), *Typhlocyba pomaria* Mcatee (цикадку яблуневу), *Erythroneoura* spp. (виноградних цикадок); *Magacidada septendecim* Linnaeus (цикаду сімнадцятирічну); *Icerya purchasi* Maskell (жолобчастого австралійського червця), *Quadraspidiotus perniciosus* Comstock (каліфорнійську щитівку); *Planococcus citri* Risso (борошністого червця виноградного); *Pseudococcus* spp. (інших червців борошністих); *Sacopsylla pyricola* Foerster (мідяницю грушеву), *Trioza diospyri* Ashmead (листоблошку хурмову).

Сполуки даного винаходу також можуть проявляти активність у відношенні представників ряду Hemiptera, включаючи *Acrosternum hilare* Say (клопа-щитника), *Anasa tristis* De Geer (клопа-ромбовика сумного), *Blissus leucopterus leucopterus* Say (клопа-черепашку), *Cimex lectularius* Linnaeus (клопа постільного), *Corythuca gossypii* Fabricius (клопа бавовняного), *Cyrtopeltis modesta* Distant (томатного клопа), *Dysdercus suturellus* Herrich-Schäffer (красноклопа бавовняного), *Euchistus servus* Say (коричневу цикадку), *Euchistus variolarius* Palisot de Beauvois (щитника з однією плямою), *Graptostethus* spp. (ряд наземників), *Leptoglossus corculus* Say (клопа-краєвика насіння сосни), *Lygus lineolaris* Palisot de Beauvois (клопа польового), *Nezara viridula* Linnaeus (зеленого овочевого клопа), *Oebalus pugnax* Fabricius (клопа-щитника

рисового), *Oncopeltus fasciatus* Dallas (клопа-солдатики), *Pseudatomoscelis seriatus* Reuter (сліпняка бавовняного). Інші ряди комах, з якими борються за допомогою сполук даного винаходу, включають *Thysanoptera* (наприклад, *Frankliniella occidentalis* Pergande (трипс квітковий західний), *Scirtothrips citri* Moulton (трипс цитрусовий), *Sericothrips variabilis* Beach (трипс соєвий), і *Thrips tabaci* Lindeman (трипс цибульний); і ряд *Coleoptera* (наприклад *Leptinotarsa decemlineata* Say (колорадський жук картопляний), *Epilachna varivestis* Mulsant (зернівка бобова мексиканська) і дротянки родів *Agriotes*, *Athous* або *Limonius*).

Сполуки даного винаходу також мають активність стосовно представників класів нематод, цестод, трематод і скребликів, включаючи економічно важливих представників рядів *Strongylida*, *Ascaridida*, *Oxyurida*, *Rhabditida*, *Spirurida* і *Enoplida*, таких як без обмеження, економічно важливі сільськогосподарські шкідники (тобто яванські галові нематоди роду *Meloidogyne*, нематоди, що раниють, роду *Pratylenchus*, кореневі нематоди роду *Trichodorus* і т.д.) і шкідники здоров'я людини та тварин (тобто усі економічно важливі трематоди, стрічкові хробаки та круглі хробаки, такі як *Strongylus vulgaris* у коней, *Toxocara canis* у собак, *Haemonchus contortus* в овець, *Dirofilaria immitis* Leidy в собак, *Anoplocephala perfoliata* у коней, *Fasciola hepatica* Linnaeus у жуйних тварин і т.д.).

Варто врахувати, що деякі сучасні системи класифікації розглядають *Homoptera* як підряд ряду *Hemiptera*.

Слід зазначити застосування сполук даного винаходу для боротьби з картопляною цикадкою (*Empoasca fabae*). Слід зазначити застосування сполук даного винаходу для боротьби з кукурудзяною цикадкою (*Peregrinus maidis*). Слід зазначити застосування сполук даного винаходу для боротьби з бавовняною попелицею (*Aphis gossypii*). Слід зазначити застосування сполук даного винаходу для боротьби з попелицею персиковою зеленою (*Myzus persicae*). Слід зазначити застосування сполук даного винаходу для боротьби з міллю капустяною (*Plutella xylostella*). Слід зазначити застосування сполук даного винаходу для боротьби із совкою трав'яною (*Spodoptera frugiperda*).

Слід зазначити застосування сполук даного винаходу для боротьби із зеленим овочевим клопом (*Nezara viridula*), клопом польовим західним (*Lygus hesperus*), довгоносиком рисовим водяним (*Lissorhoptus oryzophilus*), бурою рисовою цикадкою (*Nilaparvata lugens*), цикадкою зеленою рисовою (*Nephotettix virescens*) і вогнівкою жовтою рисовою (*Chilo suppressalis*).

Сполуки даного винаходу також придатні для збільшення сили росту оброблюваної рослини. Справжній спосіб включає приведення в контакт оброблюваної рослини (наприклад листя, квітів, плодів або кореня) або насіння, з якого проростає оброблювана рослина, зі сполукою формули 1 у кількості, достатньої для досягнення необхідного ефекту сили росту рослини (тобто біологічно ефективну кількість). Зазвичай сполуку формули 1 вносять у складеній композиції. Хоча сполуку формули 1 часто наносять безпосередньо на оброблювану рослину або її насіння, її також часто можуть наносити на місце зростання оброблюваної рослини, тобто середовище проживання оброблюваної рослини, зокрема, ділянку середовища проживання в безпосередній близькості для того, щоб дозволити сполуці формули 1 потрапити на оброблювану рослину. Місце зростання згідно із даним способом зазвичай містить середовище для вирощування (тобто середовище, що забезпечує живильні речовини для рослини), зазвичай ґрунт, у якому рослина проростає. Обробка оброблюваної рослини для підвищення сили росту оброблюваної рослини, таким чином, включає приведення в контакт оброблюваної рослини, насіння, з якого проростає оброблювана рослина, або місця зростання оброблюваної рослини з біологічно ефективною кількістю сполуки формули 1.

Підвищена сила росту рослини може привести до одного або декількох з наступних видимих ефектів: (a) оптимальній посадці сільськогосподарських культур, як продемонстровано за допомогою чудового проростання насіння, схожості сільськогосподарських культур і врожаю сільськогосподарських культур на корені; (b) поліпшеному росту сільськогосподарських культур, як продемонстровано за допомогою стрімкого та сильного росту листя (наприклад обмірюваного за допомогою індексу площі листя), висоти рослин, числа пагонів (наприклад для рису), маси кореня та загального сухої ваги рослинної маси сільськогосподарської культури; (c) підвищеної врожайності, як продемонстровано за допомогою часу цвітіння, тривалості цвітіння, кількості квітів, загального накопичення біомаси (тобто кількості врожаю) і/або сортової придатності продукції плодів або зерна (тобто якості врожаю); (d) поліпшеної здатності сільськогосподарської культури переносити або перешкоджати інфекціям захворювань рослин і зараженням шкідниками-членистоногими, нематодами або молюсками; і (e) підвищеної здатності сільськогосподарської культури переносити вплив навколишнього середовища, такий як піддання граничним значенням температури, неоптимальній вологості або фітотоксичним хімічним продуктам.

Сполуки даного винаходу можуть підвищити силу росту оброблених рослин у порівнянні з необробленими рослинами за допомогою знищення або іншим чином запобігання харчування рослиноїдних безхребетних шкідників у середовищі проживання рослин. При відсутності такого роду боротьби з рослиноїдними безхребетними шкідниками шкідники знижують силу росту

5 рослини споживанням рослинних тканин або соку або передачею рослинам патогенів, таких як віруси. Навіть при відсутності рослиноїдних безхребетних шкідників сполуки даного винаходу можуть підвищити силу росту рослини за допомогою модифікації метаболізму рослин. Загалом сила росту оброблюваної рослини буде найбільш значно підвищуватися при обробці рослини сполукою даного винаходу, якщо рослина зростає в неоптимальному середовищі проживання,

10 тобто середовищі проживання, що містить один або кілька аспектів, несприятливих для досягнення рослиною повного генетичного потенціалу, який вона може виявити в оптимальному середовищі проживання.

Слід зазначити даний спосіб збільшення сили росту оброблюваної рослини, де оброблювана рослина зростає в середовищі проживання, що містить рослиноїдних безхребетних шкідників. Також слід зазначити даний спосіб збільшення сили росту оброблюваної рослини, де оброблювана рослина зростає в середовищі проживання, що не містить рослиноїдних безхребетних шкідників. Також слід зазначити даний спосіб збільшення сили росту оброблюваної рослини, де оброблювана рослина зростає в середовищі проживання, що містить кількість вологи менше оптимальної для підтримки росту оброблюваної рослини.

20 Слід зазначити даний спосіб збільшення сили росту оброблюваної рослини, де сільськогосподарською культурою є рис. Також слід зазначити даний спосіб збільшення сили росту оброблюваної рослини, де сільськогосподарською культурою є маїс (кукурудза). Також слід зазначити даний спосіб збільшення сили росту оброблюваної рослини, де сільськогосподарською культурою є соя.

Сполуки даного винаходу також можуть бути змішані з одним або декількома іншими біологічно активними сполуками або засобами, включаючи інсектициди, фунгіциди, нематодциди, бактерициди, акарициди, гербіциди, антидоти гербіцидів, регулятори росту, такі як інгібітори линяння комах і стимулятори вкорінення, хемостерилізатори, хімічні сигнальні речовини, репеленти, аттрактанти, феромони, стимулятори харчування, інші біологічно активні сполуки або

30 ентомопатогенні бактерії, віруси або гриби, з формуванням багатокомпонентного пестициду, при цьому надаючи навіть більш широкий спектр агрономічної та відмінної від агрономічної корисності. Таким чином, даний винахід також відноситься до композиції, що містить біологічно ефективну кількість сполуки формули 1, її N-оксиду або солі, щонайменше один додатковий компонент, обраний із групи, що складається з поверхнево-активних речовин, твердих розріджувачів і рідких розріджувачів, і щонайменше одну додаткову біологічно активну сполуку або один додатковий біологічно активний засіб. Для сумішей даного винаходу інші біологічно активні сполуки або засоби можуть бути складені разом із даними сполуками, включаючи

35 сполуки формули 1, для формування преміксу, або інші біологічно активні сполуки або засоби можуть бути складені окремо від даних сполук, включаючи сполуки формули 1, і при цьому два склади комбінують разом перед застосуванням (наприклад у резервуарі обприскувача) або, альтернативно, вносяться послідовно.

Прикладами таких біологічно активних сполук або засобів, з якими сполуки даного винаходу можуть бути складені, є інсектициди, такі як абаментин, ацефат, ацеквіноцил, ацетаміпрід, акринатрин, амідифлумет, амітраз, авермектин, азадирахтин, азинфос-метил, бенсултап,

45 біфентрин, біфеназат, бістрифлурон, борат, бупрофезин, кадусафос, карбарил, карбофуран, картап, карзол, хлорантраніліпрол, хлорфенапір, хлорфлуазурон, хлорпірифос, хлорпірифос-метил, хромафенозид, клофентезин, клотіанідин, ціантраніліпрол, цифлуметофен, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, гамма-цигалотрин, лямбда-цигалотрин, циперметрин, альфа-циперметрин, зета-циперметрин, циромазин, дельтаметрин, діафентіурон, діазинон, діелдрин,

50 дифлубензурон, димефлутрин, тіосультап-динатрій, диметоат, динотефуран, діофенолан, емаментин, ендосульфат, есфенвалерат, етипрол, етофенпрокс, етоксазол, фенбутатин оксид, фенотіокарб, феноксикарб, фенпропатрин, фенвалерат, фіпроніл, флонікамід, флубендіамід, флуцитринат, флуфенерим, флуфеноксурон, флювалінат, тау-флювалінат, фонофос, форметанат, фостіазат, галофенозид, гексафлумурон, гекситіазокс, гідраметилнон,

55 імідаклопрід, індоксакарб, інсектицидні мила, ізофенфос, люфенурон, малатіон, меперфлутрин, метафлумізон, метальдегід, метамідофос, метидатіон, метіокарб, метоміл, метопрен, метоксихлор, метофлутрин, монокротофос, метоксифенозид, нітенпірам, нітіазин, новалурон, новіфлумурон, оксаміл, паратіон, паратіон-метил, перметрин, фортат, фозалон, фосмет, фосфамідон, піримікарб, профенофос, профлутрин, пропаргіт, протрифенбут,

60 піметрозин, пірафлупрол, піретрин, піридабен, піридаліл, пірифлуквіназон, пірипрол,

пірипроксифен, ротенон, ріанодин, спінеторам, спіносад, спіродиклофен, спіромезифен, спіротетрамат, сульпрофос, сульфоксафлор, тебуфенозид, тебуфенпірад, тефлубензурон, тефлутрин, тербуфос, тетрахлорвінфос, тетраметрин, тетраметилфлутрин, тіаклоприд, тіаметоксам, тіодикарб, тіосултап-натрій, толфенпірад, тралометрин, триазамат, трихлорфон, трифлумурон, дельта-ендотоксини *Bacillus thuringiensis*, ентомопатогенні бактерії, ентомопатогенні віруси та ентомопатогенні гриби.

Слід зазначити інсектициди, такі як абамектин, ацетаміприд, акринатрин, амітраз, авермектин, азадирахтин, бенсултап, біфентрин, бупрофезин, кадусафос, карбарил, картап, хлорантраніліпрол, хлорфенапір, хлорпірифос, клотіанідин, ціантраніліпрол, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, гамма-цигалотрин, лямбда-цигалотрин, циперметрин, альфа-циперметрин, зета-циперметрин, циромазин, дельтаметрин, діелдрин, динотефуран, діофенолан, емаектин, ендосульфат, есфенвалерат, етипрол, етофенпрокс, етоксазол, фенотіокарб, феноксикарб, фенвалерат, фіпроніл, флонікамід, флубендіамід, флуфеноксурон, флювалінат, форметанат, фосфіазат, гексафлумурон, гідраметилнон, імідаклоприд, індоксакарб, люфенурон, метафлумізон, метіокарб, метоміл, метопрен, метоксифенозид, нітенпірам, нітіазин, новалурон, оксаміл, піметрозин, піретрин, піридабен, піридаліл, пірипроксифен, ріанодин, спінеторам, спіносад, спіродиклофен, спіромезифен, спіротетрамат, сульфоксафлор, тебуфенозид, тетраметрин, тіаклоприд, тіаметоксам, тіодикарб, тіосултап-натрій, тралометрин, триазамат, трифлумурон, дельта-ендотоксини *Bacillus thuringiensis*, усі штами *Bacillus thuringiensis* і всі штами вірусів *Nucleo polyhydrosis*.

Один варіант здійснення біологічних засобів для змішування зі сполуками даного винаходу включає ентомопатогенні бактерії, такі як *Bacillus thuringiensis*, та інкапсульовані дельта-ендотоксини *Bacillus thuringiensis*, такі як біоінсектициди MVP® і MVPIL®, отримані способом від Cellcap® (Cellcap®, MVP® і MVPIL® є товарними знаками Mucogen Corporation, Indianapolis, Indiana, USA); ентомопатогенні гриби, такі як гриб, що викликає зелену мускардину; і ентомопатогенні (як ті, що зустрічаються в природі, так і генетично модифіковані) віруси, включаючи бакуловірус, нуклеополігедровірус (NPV), такий як нуклеополігедровірус *Helicoverpa zea* (Hznrv), нуклеополігедровірус *Anagrapha falcifera* (Afnrv); і вірус гранульозу (GV), такий як вірус гранульозу *Cydia pomonella* (Cpgv).

Особливо слід зазначити таку комбінацію, де інший активний інгредієнт для боротьби з безхребетним шкідником належить до іншого хімічного класу або має інше місце докладання дії, ніж сполука формули 1. У певних випадках комбінація із щонайменше одним іншим активним інгредієнтом для боротьби з безхребетним шкідником, у якого подібний спектр боротьби, але інше місце докладання дії, буде особливо переважною для поліпшення стійкості. Таким чином, композиція даного винаходу може додатково містити біологічно ефективну кількість щонайменше одного додаткового активного інгредієнта для боротьби з безхребетним шкідником, у якого подібний спектр боротьби, але який відноситься до іншого хімічного класу або має інше місце докладання дії. Дані додаткові біологічно активні сполуки або засоби включають, у тому числі, модулятори натрієвих каналів, такі як біфентрин, циперметрин, цигалотрин, лямбда-цигалотрин, цифлутрин, бета-цифлутрин, дельтаметрин, димефлутрин, есфенвалерат, фенвалерат, індоксакарб, метофлутрин, профлутрин, піретрин і тралометрин; інгібітори холінестерази, такі як хлорпірифос, метоміл, оксаміл, тіодикарб і триазамат; неонікотиніди, такі як ацетаміприд, клотіанідин, динотефуран, імідаклоприд, нітенпірам, нітіазин, тіаклоприд і тіаметоксам; інсектицидні макроциклічні лактони, такі як спінеторам, спіносад, абамектин, авермектин та емаектин; GABA (γ-аміномасляна кислота)-керовані антагоністи хлоридних каналів, такі як авермектин, або блокатори, такі як етипрол і фіпроніл; інгібітори синтезу хітину, такі як бупрофезин, циромазин, флуфеноксурон, гексафлумурон, люфенурон, новалурон, новіфлумурон і трифлумурон; імітатори ювенільного гормону, такі як діофенолан, феноксикарб, метопрен та пірипроксифен; ліганди октопамінового рецептора, такі як амітраз; інгібітори линяння та агоністи екдизону, такі як азадирахтин, метоксифенозид і тебуфенозид; ліганди ріанодинового рецептора, такі як ріанодин, діаміди антранілової кислоти, такі як хлорантраніліпрол, ціантраніліпрол і флубендіамід; аналоги нерейстосину, такі як картап; інгібітори мітохондріального транспорту електронів, такі як хлорфенапір, гідраметилнон і піридабен; інгібітори біосинтезу ліпідів, такі як спіродиклофен і спіромезифен; циклодієнові інсектициди, такі як діелдрин або ендосульфат; піретроїди; карбамати; інсектицидні сечовини; і біологічні засоби, включаючи нуклеополігедровіруси (NPV), представників *Bacillus thuringiensis*, інкапсульовані дельта-ендотоксини *Bacillus thuringiensis* та інші інсектицидні віруси, що зустрічаються в природі або генетично модифіковані.

Наступними прикладами біологічно активних сполук або засобів, з якими сполуки даного винаходу можуть бути складені, є фунгіциди, такі як 1-[4-[4-[5-(2,6-дифторфеніл)-4,5-дигідро-3-

ізоксазоліл]-2-тіазоліл]-1-піперидиніл]-2-[5-метил-3-(трифторметил)-1Н-піразол-1-іл]етанон, ацибензолар, алдиморф, амисулбром, азаконазол, азоксистробін, беналаксил, беноміл, бентіавалікарб, бентіавалікарб-ізопропіл, біноміал, біфеніл, бітертанол, бластицидин-S, бордоська рідина (трьохосновний сульфат міді), боскалід, бромуконазол, бупіримат, бутіобат, карбоксин, карпропамід, каптафол, каптан, карбендазим, хлоронеб, хлороталоніл, хлозолінат, клотримазол, міді оксихлорид, солі міді, такі як сульфат міді та гідроксид міді, ціазофамід, цифлунамід, цимоксаніл, ципроконазол, ципродиніл, дихлорфлуанід, диклоцимет, дикломезин, диклоран, діетофенкарб, дифеноконазол, диметоморф, димоксистробін, диніконазол, диніконазол-М, динокап, дискостробін, дитіанон, додеморф, додин, еконазол, етаконазол, едифенфос, епоксиконазол, етабоксам, етиримол, етридіазол, фамоксадон, фенамідон, фенаримол, фенбуконазол, фенкарамід, фенфурам, фенгексамід, феноксаніл, фенпіклоніл, фенпропідин, фенпропіморф, фентинацетат, фентингідроксид, фербам, ферфуразоат, феримзон, флуазилам, флудіоксоніл, флуметовер, флуопіколід, флуоксастробін, флуквінконазол, флуквінконазол, флузилазол, флусульфамід, флутоланіл, флутриафол, флуксапіроксад, фолпет, фосетил-алюміній, фталід, фуберидазол, фуралаксил, фураметпір, гексаконазол, гімексазол, гуазатин, імазаліл, імібенконазол, іміноктадин, іодокарб, іпконазол, іпробенфос, іпродіон, іпровалікарб, ізоконазол, ізопротіолан, ізотіаніл, касугаміцин, крезоксим-метил, манкозєб, мандипропамід, манєб, мапаніпірин, металаксил-м, мепроніл, металаксил, метконазол, метасульфоккарб, метирам, метоміностробін/феноміностробін, меланіпірим, метрафенон, міконазол, міклобутаніл, непро-азоцин (заліза метанарсонат), нуаримол, октилінон, офурас, орисастробін, оксациксил, оксолінова кислота, окспоконазол, оксикарбоксин, паклобутразол, пенконазол, пенцикурон, пенфлуфен, пентіопірад, перфуразоат, фосфорна кислота, фталід, пікобензамід, пікоксистробін, поліоксин, пробеназол, прохлораз, процимідон, пропамокарб, пропамокарб-гідрохлорид, пропіконазол, пропінеб, проквіназид, протіконазол, піраклостробін, піраметостробін, піраоксистробін, пріазофос, пірифенокс, піриметаніл, пірифенокс, піріофенон, піролнітрин, піроквілон, квінконазол, квіноксифен, квінтозен, силтіофам, симеконазол, спіроксамін, стрептоміцин, сірка, тебуконазол, тебуфлуквін, техранєн, теклофталам, текназен, тетраконазол, тіабендазол, тифлузамід, тіофанат, тіофанат-метил, тирам, тіадиніл, толклофос-метил, толілфлуанід, триадимефон, триадименол, триаримол, триазоксид, тридеморф, триморфамід, трициклазол, трифлуксистробін, трифорин, тритиконазол, уніконазол, валідаміцин, валіфеналат, вінклозолін, цинеб, цирам і зоксамід; нематоциди, такі як альдікарб, іміціафос, оксаміл і фенаміфос; бактеріциди, такі як стрептоміцин; акарициди, такі як амітраз, хінометіонат, хлорбензилат, цихексатин, дикофол, дієнохлор, етоксазол, феназаквін, фенбутатин оксид, фенпропатрин, фенпіроксимат, гекситіазокс, пропаргіт, піридабен і тебуфенпірад.

Слід зазначити фунгіциди та композиції, що містять фунгіциди, такі як 1-[4-[4-[5-(2,6-дифторфеніл)-4,5-дигідро-3-ізоксазоліл]-2-тіазоліл]-1-піперидиніл]-2-[5-метил-3-(трифторметил)-1Н-піразол-1-іл]етанон, азоксистробін, гідроксид міді, цимоксаніл, ципроконазол, дифеноконазол, фамоксадон, феноксаніл, феримзон, флузилазол, флутоланіл, фталід, фураметпір, гексаконазол, ізопротіолан, ізотіаніл, касугаміцин, манкозєб, метоміностробін, орисастробін, пенцикурон, пентіопірад, пікоксистробін, пробеназол, пропіконазол, проквіназид, піроквілон, симеконазол, тіадиніл, трициклазол, трифлуксистробін і валідаміцин.

У певних випадках комбінації сполуки даного винаходу з іншими біологічно активними (зокрема для боротьби з безхребетним шкідником) сполуками або засобами (тобто активними інгредієнтами) можуть приводити до більш ніж адитивного (тобто синергічного) ефекту. Зниження кількості активних інгредієнтів, виділених у навколишнє середовище, завжди бажане при забезпеченні ефективної боротьби зі шкідниками. Якщо відбувається синергізм активних інгредієнтів для боротьби з безхребетним шкідником при нормах внесення, що надають агрономічно задовільні рівні боротьби з безхребетними шкідниками, такі комбінації можуть бути переважними для зменшення вартості продукції рослинництва та зниження навантаження на навколишнє середовище. Можна також спостерігати більш ніж адитивний ефект збільшення сили росту оброблюваної рослини.

Сполуки даного винаходу та його композиції можна наносити на рослини як правило у перетвореному вигляді для експресії білків, токсичних для безхребетних шкідників (таких як дельта-ендотоксини *Bacillus thuringiensis*). Таке нанесення може забезпечити більш широкий спектр захисту рослини та може бути переважним для поліпшення стійкості. Ефект від екзогенно застосованих сполук для боротьби з безхребетним шкідником даного винаходу може бути синергічним з експресованими токсичними білками.

Основні довідкові матеріали для даних сільськогосподарських протруйників (тобто інсектицидів, фунгіцидів, нематоцидів, акарицидів, гербіцидів і біологічних засобів) включають

The Pesticide Manual, 13th Edition, C. D. S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2003 та The Biopesticide Manual, 2nd Edition, L. G. Copping, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2001.

Для варіантів здійснення, де застосовуються один або декілька даних різних учасників змішування, вагове співвідношення даних різних учасників змішування (у загальному) до сполуки формули 1, її N-оксиду або солі звичайно становить від приблизно 1:3000 до приблизно 3000:1. Слід врахувати вагові співвідношення від приблизно 1:300 до приблизно 300:1 (наприклад співвідношення від приблизно 1:30 до приблизно 30:1). Фахівець у даній галузі може легко визначити шляхом простого проведення дослідів біологічно ефективні кількості активних інгредієнтів, необхідні для бажаного спектра біологічної активності. Буде очевидно, що включення даних додаткових компонентів може розширити спектр безхребетних шкідників, з якими борються, за рамки спектра, з яким борються, за допомогою тільки сполуки формули 1.

У таблиці А перелічуються характерні комбінації сполуки формули 1 з іншим засобом для боротьби з безхребетними шкідниками, які є ілюстративними для сумішей, композицій і способів даного винаходу. У першому стовпці таблиці А перелічуються характерні засоби для боротьби з безхребетним шкідником (наприклад "Абамектин" у першому рядку). У другому стовпці таблиці А перелічуються механізми дії (якщо відомі) або хімічний клас засобів для боротьби з безхребетним шкідником. У третьому стовпці таблиці А перерахований(і) варіант(и) здійснення діапазонів вагових співвідношень для норм, при яких сполука формули 1 може вноситися, щодо засобу для боротьби з безхребетним шкідником (наприклад, "від 50:1 до 1:50" сполуки формули 1 відносно абамектину по вазі). Таким чином, наприклад, перший рядок таблиці А, зокрема, розкриває комбінацію сполуки формули 1 з абамектином, яка може вноситься у ваговому співвідношенні від 50:1 до 1:50. Інші рядки таблиці А складені подібним чином. Також примітно, що в таблиці А перелічуються характерні комбінації сполуки формули 1 з іншими засобами для боротьби з безхребетним шкідником, які є ілюстративними для сумішей, композицій і способів даного винаходу, і включені додаткові варіанти здійснення діапазонів вагових співвідношень для норм внесення.

Таблиця А

Засіб боротьби з безхребетним шкідником	Механізм дії або хімічний клас	Стандартні вагові співвідношення
Абамектин	макроциклічні лактони	від 50:1 до 1:50
Ацетаміпрід	неонікотиноїди	від 150:1 до 1:200
Амітраз	ліганди октопамінового рецептора	від 200:1 до 1:100
Авермектин	макроциклічні лактони	від 50:1 до 1:50
Азадирахтин	агоністи екдизону	від 100:1 до 1:120
Бета-цифлутрин	модулятори натрієвих каналів	від 150:1 до 1:200
Біфентрин	модулятори натрієвих каналів	від 100:1 до 1:10
Бупрофезин	інгібітори синтезу хітину	від 500:1 до 1:50
Картап	аналоги нерейстоксину	від 100:1 до 1:200
Хлорантраніліпрол	ліганди ріанодинового рецептора	від 100:1 до 1:120
Хлорфенапір	інгібітори мітохондріального транспорту електронів	від 300:1 до 1:200
Хлорпірифос	інгібітори холінестерази	від 500:1 до 1:200
Клотіанідин	неонікотиноїди	від 100:1 до 1:400
Ціантраніліпрол	ліганди ріанодинового рецептора	від 100:1 до 1:120
Цифлутрин	модулятори натрієвих каналів	від 150:1 до 1:200
Цигалотрин	модулятори натрієвих каналів	від 150:1 до 1:200
Циперметрин	модулятори натрієвих каналів	від 150:1 до 1:200
Циромазин	інгібітори синтезу хітину	від 400:1 до 1:50
Дельтаметрин	модулятори натрієвих каналів	від 50:1 до 1:400
Діелдрин	циклодієнові інсектициди	від 200:1 до 1:100
Динотефуран	неонікотиноїди	від 150:1 до 1:200
Діюфенолан	інгібітор линяння	від 150:1 до 1:200
Емаектин	макроциклічні лактони	від 50:1 до 1:10
Ендосульфат	циклодієнові інсектициди	від 200:1 до 1:100
Есфенвалерат	модулятори натрієвих каналів	від 100:1 до 1:400
Етипрол	Gaba-регульовані блокатори хлоридних	від 200:1 до 1:100

Таблиця А

Засіб боротьби з безхребетним шкідником	Механізм дії або хімічний клас	Стандартні вагові співвідношення
	каналів	
Фенотіокарб		від 150:1 до 1:200
Феноксикарб	імітатори ювенільного гормону	від 500:1 до 1:100
Фенвалерат	модулятори натрієвих каналів	від 150:1 до 1:200
Фіпроніл	Gaba-регульовані блокатори хлоридних каналів	від 150:1 до 1:100
Флонікамід		від 200:1 до 1:100
Флубендіамід	ліганди ріанодинового рецептора	від 100:1 до 1:120
Флуфенксурон	інгібітори синтезу хітину	від 200:1 до 1:100
Гексафлумурон	інгібітори синтезу хітину	від 300:1 до 1:50
Гідраметилнон	інгібітори мітохондріального транспорту електронів	від 150:1 до 1:250
Імідаклоприд	неонікотиніди	від 1000:1 до 1:1000
Індоксикарб	модулятори натрієвих каналів	від 200:1 до 1:50
Лямбда-цигалотрин	модулятори натрієвих каналів	від 50:1 до 1:250
Люфенурон	інгібітори синтезу хітину	від 500:1 до 1:250
Метафлумізон		від 200:1 до 1:200
Метоміл	інгібітори холінестерази	від 500:1 до 1:100
Метопрен	імітатори ювенільного гормону	від 500:1 до 1:100
Метоксифенозид	агоністи екдизону	від 50:1 до 1:50
Нітенпірам	неонікотиніди	від 150:1 до 1:200
Нітіазин	неонікотиніди	від 150:1 до 1:200
Новалурон	інгібітори синтезу хітину	від 500:1 до 1:150
Оксаміл	інгібітори холінестерази	від 200:1 до 1:200
Піметрозин		від 200:1 до 1:100
Піретрин	модулятори натрієвих каналів	від 100:1 до 1:10
Піридабен	інгібітори мітохондріального транспорту електронів	від 200:1 до 1:100
Піридаліл		від 200:1 до 1:100
Пірипроксифен	імітатори ювенільного гормону	від 500:1 до 1:100
Ріанодин	ліганди ріанодинового рецептора	від 100:1 до 1:120
Спінеторам	макроциклічні лактони	від 150:1 до 1:100
Спіносад	макроциклічні лактони	від 500:1 до 1:10
Спіродиклофен	інгібітори біосинтезу ліпідів	від 200:1 до 1:200
Спіромезифен	інгібітори біосинтезу ліпідів	від 200:1 до 1:200
Тебуфенозид	агоністи екдизону	від 500:1 до 1:250
Тіаклоприд	неонікотиніди	від 100:1 до 1:200
Тіаметоксам	неонікотиніди	від 1250:1 до 1:1000
Тіодикарб	інгібітори холінестерази	від 500:1 до 1:400
Тіосултап-натрій		від 150:1 до 1:100
Тралометрин	модулятори натрієвих каналів	від 150:1 до 1:200
Триамаат	інгібітори холінестерази	від 250:1 до 1:100
Трифлумурон	інгібітори синтезу хітину	від 200:1 до 1:100
Bacillus thuringiensis	біологічні засоби	від 50:1 до 1:10
дельта-ендотоксин Bacillus thuringiensis	біологічні засоби	від 50:1 до 1:10
NPV (наприклад Gemstar)	біологічні засоби	від 50:1 до 1:10

Слід зазначити композицію даного винаходу, де щонайменше одна додаткова біологічно активна сполука або один додатковий біологічно активний засіб обрана(ий) із засобів для боротьби з безхребетним шкідником, перерахованих у вищенаведеній таблиці А.

5

Вагові співвідношення сполуки, включаючи сполуку формули 1, її N-оксид або сіль до додаткового засобу для боротьби з безхребетним шкідником зазвичай складають від 1000:1 до 1:1000, при цьому в одному варіанті здійснення складають від 500:1 до 1:500, в іншому варіанті

здійснення складають від 250:1 до 1:200 і в іншому варіанті здійснення складають від 100:1 до 1:50.

Нижче перераховане в таблицях В1-В19 є варіантами здійснення конкретних композицій, що містять сполуку формули 1 (номера сполук (№ спол.) відносяться до сполук у таблиці А індексів) і додатковий засіб для боротьби з безхребетним шкідником.

Таблиця В1

№ суміші	№ спол.	i	Засіб для боротьби з безхребетним шкідником	№ суміші	№ спол.	i	Засіб для боротьби з безхребетним шкідником
B1-1	1	i	Абамектин	B1-38	1	i	Індоксакарб
B1-2	1	i	Ацетаміприд	B1-39	1	i	Лямбда-цигалотрин
B1-3	1	i	Амітраз	B1-40	1	i	Люфенурон
B1-4	1	i	Авермектин	B1-41	1	i	Метафлумізон
B1-5	1	i	Азадирахтин	B1-42	1	i	Метоміл
B1-6	1	i	Бенсултап	B1-43	1	i	Метопрен
B1-7	1	i	Бета-цифлутрин	B1-44	1	i	Метоксифенозид
B1-8	1	i	Біфентрин	B1-45	1	i	Нітенпірам
B1-9	1	i	Бупрофезин	B1-46	1	i	Нітіазин
B1-10	1	i	Картап	B1-47	1	i	Новалурон
B1-11	1	i	Хлорантраніліпрол	B1-48	1	i	Оксаміл
B1-12	1	i	Хлорфенапір	B1-49	1	i	Фосмет
B1-13	1	i	Хлорпірифос	B1-50	1	i	Піметрозин
B1-14	1	i	Клотіанідин	B1-51	1	i	Піретрин
B1-15	1	i	Ціантраніліпрол	B1-52	1	i	Піридабен
B1-16	1	i	Цифлутрин	B1-53	1	i	Піридаліл
B1-17	1	i	Цигалотрин	B1-54	1	i	Пірипроксифен
B1-18	1	i	Циперметрин	B1-55	1	i	Ріанодин
B1-19	1	i	Циромазин	B1-56	1	i	Спінеторам
B1-20	1	i	Дельтаметрин	B1-57	1	i	Спіносад
B1-21	1	i	Діелдрин	B1-58	1	i	Спіродиклофен
B1-22	1	i	Динотефуран	B1-59	1	i	Спіромезифен
B1-23	1	i	Діофенолан	B1-60	1	i	Спіротетрамат
B1-24	1	i	Емаектин	B1-61	1	i	Сульфоксафлор
B1-25	1	i	Ендосульфан	B1-62	1	i	Тебуфенозид
B1-26	1	i	Есфенвалерат	B1-63	1	i	Тефлутрин
B1-27	1	i	Етипрол	B1-64	1	i	Тіаклоприд
B1-28	1	i	Фенотіокарб	B1-65	1	i	Тіаметоксам
B1-29	1	i	Феноксикарб	B1-66	1	i	Тіодикарб
B1-30	1	i	Фенвалерат	B1-67	1	i	Тіосултап-натрій
B1-31	1	i	Фіпроніл	B1-68	1	i	Толфенпірад
B1-32	1	i	Флонікамід	B1-69	1	i	Тралометрин
B1-33	1	i	Флубендіамід	B1-70	1	i	Триазамат
B1-34	1	i	Флуфеноксурон	B1-71	1	i	Трифлумурон
B1-35	1	i	Гексафлумурон	B1-72	1	i	Bacillus thuringiensis
B1-36	1	i	Гідраметилнон	B1-73	1	i	дельта-ендотоксин Bacillus thuringiensis
B1-37	1	i	Імідаклоприд	B1-74	1	i	NPV (наприклад Gemstar)

Таблиця В2

Таблиця В2 ідентична таблиці В1, крім того, що кожне посилання на сполуку 1 у стовпці під заголовком "№ спол.", замінюють посиланням на сполуку 2. Наприклад, першу суміш у таблиці В2 позначають В2-1, і вона є сумішшю сполуки 2 і додаткового засобу для боротьби з безхребетним шкідником, абамектину.

Таблиця В3

Таблиця В3 ідентична таблиці В1, крім того, що кожне посилання на сполуку 1 у стовпці під заголовком "№ спол.", замінюють посиланням на сполуку 3. Наприклад, першу суміш у таблиці

В15 позначають В15-1, і вона є сумішшю сполуки 15 і додаткового засобу для боротьби з безхребетним шкідником, абамектину.

Таблиця В16

5 Таблиця В16 ідентична таблиці В1, крім того, що кожне посилання на сполуку 1 у стовпці під заголовком “№ спол.”, замінюють посиланням на сполуку 16. Наприклад, першу суміш у таблиці В16 позначають В16-1, і вона є сумішшю сполуки 16 і додаткового засобу для боротьби з безхребетним шкідником, абамектину.

Таблиця В17

10 Таблиця В17 ідентична таблиці В1, крім того, що кожне посилання на сполуку 1 у стовпці під заголовком “№ спол.”, замінюють посиланням на сполуку 17. Наприклад, першу суміш у таблиці В17 позначають В17-1, і вона є сумішшю сполуки 17 і додаткового засобу для боротьби з безхребетним шкідником, абамектину.

Таблиця В18

15 Таблиця В18 ідентична таблиці В1, крім того, що кожне посилання на сполуку 1 у стовпці під заголовком “№ спол.”, замінюють посиланням на сполуку 18. Наприклад, першу суміш у таблиці В18 позначають В18-1, і вона є сумішшю сполуки 18 і додаткового засобу для боротьби з безхребетним шкідником, абамектину.

Таблиця В19

20 Таблиця В19 ідентична таблиці В1, крім того, що кожне посилання на сполуку 1 у стовпці під заголовком “№ спол.”, замінюють посиланням на сполуку 19. Наприклад, першу суміш у таблиці В19 позначають В19-1, і вона є сумішшю сполуки 19 і додаткового засобу для боротьби з безхребетним шкідником, абамектину.

25 У конкретних сумішах, перерахованих у таблицях В1-В19, звичайно комбінують сполуку формули 1 з іншим засобом від безхребетного шкідника в співвідношеннях, зазначених у таблиці А.

30 Нижче перераховане в таблицях С1-С19 є сумішами, що містять сполуку формули 1 (номера сполук (№ спол.) відносяться до сполук у таблиці А індексів) і додатковий засіб для боротьби з безхребетним шкідником. У таблицях С1-С19 далі перелічуються конкретні вагові співвідношення, стандартні для сумішей таблиць С1-С19. Наприклад, перші дані вагового співвідношення в першому рядку таблиці С1, зокрема, розкривають суміш сполуки 1 таблиці А індексів з абамектином, застосовувану у ваговому співвідношенні 100 частин сполуки 1 до 1 частини абамектину.

Таблиця С1

№ суміші	№ спол.	i	Засіб для боротьби з безхребетним шкідником	Стандартні співвідношення складових суміші (по вазі)								
С1-1	1	i	Абамектин	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
С1-2	1	i	Ацетаміприд	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
С1-3	1	i	Амітраз	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
С1-4	1	i	Авермектин	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
С1-5	1	i	Азадирахтин	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
С1-6	1	i	Бенсултап	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
С1-7	1	i	Бета-цифлутрин	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
С1-8	1	i	Біфентрин	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
С1-9	1	i	Бупрофезин	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
С1-10	1	i	Картап	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
С1-11	1	i	Хлорантраніліпрол	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
С1-12	1	i	Хлорфенапір	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
С1-13	1	i	Хлорпірифос	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
С1-14	1	i	Клотіанідин	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
С1-15	1	i	Ціантраніліпрол	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
С1-16	1	i	Цифлутрин	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
С1-17	1	i	Цигалотрин	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
С1-18	1	i	Циперметрин	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
С1-19	1	i	Циромазин	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
С1-20	1	i	Дельтаметрин	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
С1-21	1	i	Діелдрин	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100

Таблиця С1

№ суміші	№ спол.	i	Засіб для боротьби з безхребетним шкідником	Стандартні співвідношення складових суміші (по вазі)								
C1-22	1	i	Динотефуран	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-23	1	i	Діюфенолан	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-24	1	i	Емаектин	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-25	1	i	Ендосульфан	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-26	1	i	Есфенвалерат	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-27	1	i	Етипрол	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-28	1	i	Фенотіокарб	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-29	1	i	Феноксикарб	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-30	1	i	Фенвалерат	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-31	1	i	Фіпроніл	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-32	1	i	Флонікамід	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-33	1	i	Флубендіамід	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-34	1	i	Флуфеноксурон	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-35	1	i	Гексафлумурон	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-36	1	i	Гідраметилнон	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-37	1	i	Імідаклоприд	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-38	1	i	Індоксакарб	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-39	1	i	Лямбда-цигалотрин	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-40	1	i	Люфенурон	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-41	1	i	Метафлумізон	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-42	1	i	Метоміл	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-43	1	i	Метопрен	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-44	1	i	Метоксифенозид	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-45	1	i	Нітенпірам	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-46	1	i	Нітіазин	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-47	1	i	Новалурон	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-48	1	i	Оксаміл	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-49	1	i	Фосмет	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-50	1	i	Піметрозин	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-51	1	i	Піретрин	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-52	1	i	Піридабен	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-53	1	i	Піридаліл	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-54	1	i	Пірипроксифен	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-55	1	i	Ріанодин	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-56	1	i	Спінеторам	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-57	1	i	Спіносад	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-58	1	i	Спіродиклофен	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-59	1	i	Спіромезифен	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-60	1	i	Спіротетрамат	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-61	1	i	Сульфоксифлор	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-62	1	i	Тебуфенозид	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-63	1	i	Тефлутрин	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-64	1	i	Тіаклоприд	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-65	1	i	Тіаметоксам	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-66	1	i	Тіодикарб	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-67	1	i	Тіосултап-натрій	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-68	1	i	Толфенпірад	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-69	1	i	Тралометрин	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-70	1	i	Триазамат	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-71	1	i	Трифлумурон	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-72	1	i	Bacillus thuringiensis	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-73	1	i	дельта-ендотоксин Bacillus thuringiensis	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100

Таблиця С1

№ суміші	№ спол.	i	Засіб для боротьби з безхребетним шкідником	Стандартні співвідношення складових суміші (по вазі)								
C1-74	1	i	NPV (наприклад Gemstar)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100

Таблиця С2

5 Таблиця С2 ідентична таблиці С1, крім того, що кожне посилання на сполуку 1 у стовпці під заголовком “№ спол.”, замінюють посиланням на сполуку 2. Наприклад, перші дані вагового співвідношення в першому рядку таблиці С2, зокрема, розкривають суміш сполуки 2 таблиці А індексів з абамектином, застосовувану у ваговому співвідношенні 100 частин сполуки 2 до 1 частини абамектину.

Таблиця С3

10 Таблиця С3 ідентична таблиці С1, крім того, що кожне посилання на сполуку 1 у стовпці під заголовком “№ спол.”, замінюють посиланням на сполуку 3. Наприклад, перші дані вагового співвідношення в першому рядку таблиці С3, зокрема, розкривають суміш сполуки 3 таблиці А індексів з абамектином, застосовувану у ваговому співвідношенні 100 частин сполуки 3 до 1 частини абамектину.

Таблиця С4

15 Таблиця С4 ідентична таблиці С1, крім того, що кожне посилання на сполуку 1 у стовпці під заголовком “№ спол.”, замінюють посиланням на сполуку 4. Наприклад, перші дані вагового співвідношення в першому рядку таблиці С4, зокрема, розкривають суміш сполуки 4 таблиці А індексів з абамектином, застосовувану у ваговому співвідношенні 100 частин сполуки 4 до 1 частини абамектину.

Таблиця С5

20 Таблиця С5 ідентична таблиці С1, крім того, що кожне посилання на сполуку 1 у стовпці під заголовком “№ спол.”, замінюють посиланням на сполуку 5. Наприклад, перші дані вагового співвідношення в першому рядку таблиці С5, зокрема, розкривають суміш сполуки 5 таблиці А індексів з абамектином, застосовувану у ваговому співвідношенні 100 частин сполуки 5 до 1 частини абамектину.

Таблиця С6

25 Таблиця С6 ідентична таблиці С1, крім того, що кожне посилання на сполуку 1 у стовпці під заголовком “№ спол.”, замінюють посиланням на сполуку 6. Наприклад, перші дані вагового співвідношення в першому рядку таблиці С6, зокрема, розкривають суміш сполуки 6 таблиці А індексів з абамектином, застосовувану у ваговому співвідношенні 100 частин сполуки 6 до 1 частини абамектину.

Таблиця С7

35 Таблиця С7 ідентична таблиці С1, крім того, що кожне посилання на сполуку 1 у стовпці під заголовком “№ спол.”, замінюють посиланням на сполуку 7. Наприклад, перші дані вагового співвідношення в першому рядку таблиці С7, зокрема, розкривають суміш сполуки 7 таблиці А індексів з абамектином, застосовувану у ваговому співвідношенні 100 частин сполуки 7 до 1 частини абамектину.

Таблиця С8

40 Таблиця С8 ідентична таблиці С1, крім того, що кожне посилання на сполуку 1 у стовпці під заголовком “№ спол.”, замінюють посиланням на сполуку 8. Наприклад, перші дані вагового співвідношення в першому рядку таблиці С8, зокрема, розкривають суміш сполуки 8 таблиці А індексів з абамектином, застосовувану у ваговому співвідношенні 100 частин сполуки 8 до 1 частини абамектину.

Таблиця С9

45 Таблиця С9 ідентична таблиці С1, крім того, що кожне посилання на сполуку 1 у стовпці під заголовком “№ спол.”, замінюють посиланням на сполуку 9. Наприклад, перші дані вагового співвідношення в першому рядку таблиці С9, зокрема, розкривають суміш сполуки 9 таблиці А індексів з абамектином, застосовувану у ваговому співвідношенні 100 частин сполуки 9 до 1 частини абамектину.

Таблиця С10

50 Таблиця С10 ідентична таблиці С1, крім того, що кожне посилання на сполуку 1 у стовпці під заголовком “№ спол.”, замінюють посиланням на сполуку 10. Наприклад, перші дані вагового співвідношення в першому рядку таблиці С10, зокрема, розкривають суміш сполуки 10 таблиці А індексів з абамектином, застосовувану у ваговому співвідношенні 100 частин сполуки 10 до 1 частини абамектину.

Таблиця D1

№ суміші.	№ спол.	i	Фунгіцид	№ суміші.	№ спол.	i	Фунгіцид
D1-1	1	i	Пробеназол	D1-17	1	i	Дифеноконазол
D1-2	1	i	Тіадиніл	D1-18	1	i	Ципроконазол
D1-3	1	i	Ізотіаніл	D1-19	1	i	Пропіконазол
D1-4	1	i	Піроквілон	D1-20	1	i	Феноксаніл
D1-5	1	i	Метоміностробін	D1-21	1	i	Феримзон
D1-6	1	i	Флутоланіл	D1-22	1	i	Фталід
D1-7	1	i	Валідаміцин	D1-23	1	i	Касугаміцин
D1-8	1	i	Фураметпір	D1-24	1	i	Пікоксистробін
D1-9	1	i	Пенцикурон	D1-25	1	i	Пентіопірад
D1-10	1	i	Симеконазол	D1-26	1	i	Фамоксадон
D1-11	1	i	Орисастробін	D1-27	1	i	Цимоксаніл
D1-12	1	i	Трифлуксистробін	D1-28	1	i	Проквіназид
D1-13	1	i	Ізопротіолан	D1-29	1	i	Флузилазол
D1-14	1	i	Азоксистробін	D1-30	1	i	Манкозєб
D1-15	1	i	Трициклазол	D1-31	1	i	Гідроксид міді
D1-16	1	i	Гексаконазол	D1-32	1	i	(a)

(a) 1-[4-[4-[5-(2,6-дифторфеніл)-4,5-дигідро-3-ізоксазоліл]-2-тіазоліл]-1-піперидиніл]-2-[5-метил-3-(трифторметил)-1Н-піразол-1-іл]етанон;

Таблиця D2

- 5 Таблиця D2 ідентична таблиці D1, крім того, що кожне посилання на сполуку 1 у стовпці під заголовком "№ спол.", замінюють посиланням на сполуку 2. Наприклад, першу суміш у таблиці D2 позначають D2-1, і вона є сумішшю сполуки 2 і додаткового фунгіциду, пробеназолу.

Таблиця D3

- 10 Таблиця D3 ідентична таблиці D1, крім того, що кожне посилання на сполуку 1 у стовпці під заголовком "№ спол.", замінюють посиланням на сполуку 3. Наприклад, першу суміш у таблиці D3 позначають D3-1, і вона є сумішшю сполуки 3 і додаткового фунгіциду, пробеназолу.

Таблиця D4

- 15 Таблиця D4 ідентична таблиці D1, крім того, що кожне посилання на сполуку 1 у стовпці під заголовком "№ спол.", замінюють посиланням на сполуку 4. Наприклад, першу суміш у таблиці D4 позначають D4-1, і вона є сумішшю сполуки 4 і додаткового фунгіциду, пробеназолу.

Таблиця D5

- 20 Таблиця D5 ідентична таблиці D1, крім того, що кожне посилання на сполуку 1 у стовпці під заголовком "№ спол.", замінюють посиланням на сполуку 5. Наприклад, першу суміш у таблиці D5 позначають D5-1, і вона є сумішшю сполуки 5 і додаткового фунгіциду, пробеназолу.

Таблиця D6

- 25 Таблиця D6 ідентична таблиці D1, крім того, що кожне посилання на сполуку 1 у стовпці під заголовком "№ спол.", замінюють посиланням на сполуку 6. Наприклад, першу суміш у таблиці D6 позначають D6-1, і вона є сумішшю сполуки 6 і додаткового фунгіциду, пробеназолу.

Таблиця D7

- 30 Таблиця D7 ідентична таблиці D1, крім того, що кожне посилання на сполуку 1 у стовпці під заголовком "№ спол.", замінюють посиланням на сполуку 7. Наприклад, першу суміш у таблиці D7 позначають D7-1, і вона є сумішшю сполуки 7 і додаткового фунгіциду, пробеназолу.

Таблиця D8

- 35 Таблиця D8 ідентична таблиці D1, крім того, що кожне посилання на сполуку 1 у стовпці під заголовком "№ спол.", замінюють посиланням на сполуку 8. Наприклад, першу суміш у таблиці D8 позначають D8-1, і вона є сумішшю сполуки 8 і додаткового фунгіциду, пробеназолу.

Таблиця D9

- 40 Таблиця D9 ідентична таблиці D1, крім того, що кожне посилання на сполуку 1 у стовпці під заголовком "№ спол.", замінюють посиланням на сполуку 9. Наприклад, першу суміш у таблиці D9 позначають D9-1, і вона є сумішшю сполуки 9 і додаткового фунгіциду, пробеназолу.

Таблиця D10

- Таблиця D10 ідентична таблиці D1, крім того, що кожне посилання на сполуку 1 у стовпці під заголовком "№ спол.", замінюють посиланням на сполуку 10. Наприклад, першу суміш у таблиці D10 позначають D10-1, і вона є сумішшю сполуки 10 і додаткового фунгіциду, пробеназолу.

Таблиця D11

Таблиця D11 ідентична таблиці D1, крім того, що кожне посилання на сполуку 1 у стовпці під заголовком “№ спол.”, заміняють посиланням на сполуку 11. Наприклад, першу суміш у таблиці D11 позначають D11-1, і вона є сумішшю сполуки 11 і додаткового фунгіциду, пробеназолу.

Таблиця D12

5 Таблиця D12 ідентична таблиці D1, крім того, що кожне посилання на сполуку 1 у стовпці під заголовком “№ спол.”, заміняють посиланням на сполуку 12. Наприклад, першу суміш у таблиці D12 позначають D12-1, і вона є сумішшю сполуки 12 і додаткового фунгіциду, пробеназолу.

Таблиця D13

10 Таблиця D13 ідентична таблиці D1, крім того, що кожне посилання на сполуку 1 у стовпці під заголовком “№ спол.”, заміняють посиланням на сполуку 13. Наприклад, першу суміш у таблиці D13 позначають D13-1, і вона є сумішшю сполуки 13 і додаткового фунгіциду, пробеназолу.

Таблиця D14

15 Таблиця D14 ідентична таблиці D1, крім того, що кожне посилання на сполуку 1 у стовпці під заголовком “№ спол.”, заміняють посиланням на сполуку 14. Наприклад, першу суміш у таблиці D14 позначають D14-1, і вона є сумішшю сполуки 14 і додаткового фунгіциду, пробеназолу.

Таблиця D15

Таблиця D15 ідентична таблиці D1, крім того, що кожне посилання на сполуку 1 у стовпці під заголовком “№ спол.”, заміняють посиланням на сполуку 15. Наприклад, першу суміш у таблиці D15 позначають D15-1, і вона є сумішшю сполуки 15 і додаткового фунгіциду, пробеназолу.

20 Таблиця D16

Таблиця D16 ідентична таблиці D1, крім того, що кожне посилання на сполуку 1 у стовпці під заголовком “№ спол.”, заміняють посиланням на сполуку 16. Наприклад, першу суміш у таблиці D16 позначають D16-1, і вона є сумішшю сполуки 16 і додаткового фунгіциду, пробеназолу.

Таблиця D17

25 Таблиця D17 ідентична таблиці D1, крім того, що кожне посилання на сполуку 1 у стовпці під заголовком “№ спол.”, заміняють посиланням на сполуку 17. Наприклад, першу суміш у таблиці D17 позначають D17-1, і вона є сумішшю сполуки 17 і додаткового фунгіциду, пробеназолу.

Таблиця D18

30 Таблиця D18 ідентична таблиці D1, крім того, що кожне посилання на сполуку 1 у стовпці під заголовком “№ спол.”, заміняють посиланням на сполуку 18. Наприклад, першу суміш у таблиці D18 позначають D18-1, і вона є сумішшю сполуки 18 і додаткового фунгіциду, пробеназолу.

Таблиця D19

35 Таблиця D19 ідентична таблиці D1, крім того, що кожне посилання на сполуку 1 у стовпці під заголовком “№ спол.”, заміняють посиланням на сполуку 19. Наприклад, першу суміш у таблиці D19 позначають D19-1, і вона є сумішшю сполуки 19 і додаткового фунгіциду, пробеназолу.

3 З безхребетними шкідниками борються при агрономічних та відмінних від агрономічних застосуваннях за допомогою внесення одного або декількох сполук даного винаходу, зазвичай у вигляді композиції, у біологічно ефективній кількості на середовище проживання шкідників, включаючи агрономічне та/або відмінне від агрономічного місце розташування зараження, на ділянку, яку необхідно захистити, або безпосередньо на шкідників, з якими необхідно боротися.

40 Таким чином, даний винахід включає спосіб боротьби з безхребетним шкідником при агрономічних та/або відмінних від агрономічних застосуваннях, що включає приведення в контакт безхребетного шкідника або його середовища проживання з біологічно ефективною кількістю одного або декількох сполук даного винаходу, або з композицією, що містить щонайменше одну таку сполуку, або композицією, що містить щонайменше одну таку сполуку та біологічно ефективну кількість щонайменше однієї додаткової біологічно активної сполуки або одного додаткового біологічно активного засобу. Приклади підходящих композицій, що містять сполуку даного винаходу та біологічно ефективну кількість щонайменше однієї додаткової біологічно активної сполуки або одного додаткового біологічно активного засобу, включають

50 гранулярні композиції, де додаткова активна сполука знаходиться на тій же гранулі, що і сполука даного винаходу, або на гранулах, окремих від таких сполуки даного винаходу.

Варіанти здійснення способу даного винаходу включають приведення в контакт середовища проживання. Слід зазначити спосіб, де середовищем проживання є рослина. Також слід зазначити спосіб, де середовищем проживання є тварина. Також слід зазначити спосіб, де

55 середовищем проживання є насіння.

Щоб досягти контакту зі сполукою або композицією даного винаходу для захисту польової культури від безхребетних шкідників, сполуку або композицію зазвичай наносять на насіння сільськогосподарської культури перед посадкою, на листя (наприклад листя, плодоніжки, квіти, плоди) оброблюваних рослин або на ґрунт, або інше середовище для вирощування до того або

60 після того, як сільськогосподарську культуру посадили.

Один варіант здійснення способу приведення в контакт здійснюють обприскуванням. Альтернативно гранулярна композиція, що містить сполуку даного винаходу, може наноситися на листя рослини або на ґрунт. Сполуки даного винаходу також можуть ефективно доставлятися шляхом поглинання рослиною при приведенні в контакт рослини з композицією, що містить сполуку даного винаходу, нанесеної в якості просочення для ґрунту рідкої сполуки, гранулярної сполуки на ґрунт, при обробці ящика для розсади або при зануренні пересаджуваних рослин. Слід зазначити композицію даного винаходу у вигляді просочення для ґрунту рідкої сполуки. Також слід зазначити спосіб боротьби з безхребетним шкідником, що включає приведення в контакт безхребетного шкідника або його середовища проживання з біологічно ефективною кількістю сполуки даного винаходу або з композицією, що містить біологічно ефективну кількість сполуки даного винаходу. Також примітним є даний спосіб, де середовищем проживання є ґрунт і композиція вноситься в ґрунт як склад для просочення ґрунту. Також слід зазначити те, що сполуки даного винаходу також ефективні при локалізованому нанесенні на місце розташування зараження. Інші способи приведення в контакт включають нанесення сполуки або композиції даного винаходу через розчини для безпосереднього обприскування та розчини з післядією для обприскування, розчини для авіаобприскування, гелі, покриття насіння, мікроінкапсулювання, систематичне поглинання, приманки, вушні бирки, болюси, аерозольні обприскувачі, фуміганти, аерозолі, пилоподібні препарати та багато інших. Одним варіантом здійснення способу приведення в контакт є розмірно стійка гранула для добрива, паличка або таблетка, що містять сполуку або композицію даного винаходу. Сполуками даного винаходу можуть також бути просочені матеріали для виготовлення обладнань для боротьби з безхребетними (наприклад протимоскітна сітка).

Сполуки даного винаходу також придатні для протравлення насіння для захисту насіння від безхребетних шкідників. У контексті даного опису та формули винаходу протравлення насіння означає приведення в контакт насіння з біологічно ефективною кількістю сполуки даного винаходу, яку звичайно складають у вигляді композиції даного винаходу. Дане протравлення насіння захищає насіння від безхребетних ґрунтових шкідників і в основному може також захищати коріння та інші частини рослини, які контактують із ґрунтом проростка, що розвивається з насіння, що проростає. Протравлення насіння може також забезпечувати захист листя за допомогою перенесення сполуки даного винаходу або другого активного інгредієнта на рослину, що розвивається. Протравлення насіння може бути застосоване до всіх типів насіння, включаючи тих, з яких проростають рослини, генетично трансформовані для експресії спеціалізованих ознак. Характерні приклади включають такі, що експресують білки, токсичні для безхребетних шкідників, такі як токсин *Bacillus thuringiensis*, або такі, що виявляють стійкість до гербіцидів, такі як гліфосатацетилтрансфераза, яка забезпечує стійкість до гліфосату. Протравлення насіння сполуками даного винаходу також може підвищити силу росту рослин, що виростають із насіння.

Один спосіб протравлення насіння здійснюють обприскуванням або обпилюванням насіння сполукою даного винаходу (тобто у вигляді складеної композиції) перед посівом насіння. Композиції, складені для протравлення насіння, в основному містять плівкоутворювачі або адгезійний засіб. Отже, зазвичай композиція даного винаходу для нанесення покриття на насіння містить біологічно ефективну кількість сполуки формули 1 і плівкоутворювач або адгезійний засіб. Насіння може бути покрите за допомогою обприскування рідкоплинним концентратом суспензії безпосередньо у галтувальному барабані для насіння і наступного сушіння насіння. Альтернативно інші типи сполук, такі як змочувані порошки, розчини, суспензії, концентрати та емульсії у воді, котрі емульгують, можуть наноситися обприскуванням на насіння. Даний спосіб, зокрема, придатний для нанесення плівкових покриттів на насіння. Різні машини для нанесення покриттів і способи доступні для фахівця в даній галузі. Підходящі способи включають перераховані в P. Kusters et al., *Seed Treatment: Progress and Prospects*, 1994 BCPC Monograph No. 57, і довідкові матеріали, котрі перераховані там.

Сполуки формули 1 та їх композиції, як окремо, так і в комбінації з іншими інсектицидами та фунгіцидами, зокрема, придатні при протравленні насіння для сільськогосподарських культур включаючи, у тому числі, маїс або кукурудзу, соєві боби, бавовну, зернові культури (наприклад пшеницю, овес, ячмінь, жито та рис), види картоплі, овочів та олійний рапс.

Інші інсектициди, з якими сполуки формули 1 можуть бути складені для забезпечення сумішей, придатних при протравленні насіння, включають абамектин, ацетаміпрід, акринатрин, амітраз, авермектин, азадирахтин, бенсултап, біфентрин, бупрофезин, кадусафос, карбарил, карбофуран, картап, хлорантраніліпрол, хлорфенапір, хлорпірифос, клотіанідин, ціантраніліпрол, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, гамма-цигалотрин, лямбда-

цигалотрин, циперметрин, альфа-циперметрин, зета-циперметрин, циромазин, дельтаметрин, діелдрин, динотефуран, діофенолан, емабектин, ендосульфат, есфенвалерат, етипрол, етофенпрокс, етоксазол, фенотіокарб, феноксикарб, фенвалерат, фіпроніл, флонікамід, флубендіамід, флуфеноксурон, флювалінат, форметанат, фосфіазат, гексафлумурон, гідраметилнон, імідаклоприд, індоксакарб, люфенурон, метафлумізон, метіодикарб, метоміл, метопрен, метоксифенозид, нітенпірам, нітіазин, новалурон, оксаміл, піметрозин, піретрин, піридабен, піридаліл, пірипроксифен, ріанодин, спінеторам, спіносад, спіродиклофен, спіромезифен, спіротетрамат, сульфоксафлор, тебуфенозид, тетраметрин, тіаклоприд, тіаметоксам, тіодикарб, тіосултап-натрій, тралометрин, триазамат, трифлумурон, дельта-ендотоксини *Bacillus thuringiensis*, усі штами *Bacillus thuringiensis* і всі штами вірусів *Nucleo polyhydrosis*.

Фунгіциди, з якими сполуки формули 1 можуть бути складені для забезпечення сумішей, придатних при протравлянні насіння, включають амісулбром, азоксистробін, боскалід, карбендазим, карбоксин, цимоксаніл, ципроконазол, дифеноконазол, диметоморф, флуазинам, флудіоксоніл, флуквінконазол, флуопіколід, флуоксистробін, флутриафол, флуксапіроксад, іпконазол, іпродіон, металаксил, металаксил-м, метконазол, міклобутаніл, паклобутразол, пенфлуфен, піоксистробін, протіокконазол, піраклостробін, седаксан, силтіофам, тебуконазол, тіабендазол, тіофанат-метил, тирам, трифлуксистробін та тритиконазол.

Композиції, що містять сполуки формули 1, придатні для протравляння насіння та можуть додатково містити бактерії, такі як *Bacillus pumilus* (наприклад штам GB34) і *Bacillus firmus* (наприклад ізолят 1582), бактеріальні розчини/розріджувачі із бульбочною бактерією роду *Rhizobium*, ізофлавоноїди та ліпохітоолігосахариди.

Протравлене насіння зазвичай містить сполуку даного винаходу в кількості від приблизно 0,1 г до 1 кг на 100 кг насіння (тобто від приблизно 0,0001 % до 1 % по вазі насіння перед протравлянням). Рідкоплинна суспензія, складена для протравляння насіння, зазвичай містить від приблизно 0,5 % до приблизно 70 % активного інгредієнта, від приблизно 0,5 % до приблизно 30 % плівкоутворювального адгезійної речовини, від приблизно 0,5 % до приблизно 20 % диспергувального засобу, від 0 % до приблизно 5 % загусника, від 0 % до приблизно 5 % пігменту та/або барвника, від 0 % до приблизно 2 % протиспінюючого засобу, від 0 % до приблизно 1 % консервувального засобу та від 0 % до приблизно 75 % летучого рідкого розріджувача.

Сполуки даного винаходу можуть бути включені в композицію-приманку, яка з'їдається безхребетним шкідником, або застосовані в обладнанні, такому як уловлювач, пристосування із приманкою та т.п. Така композиція-приманка може бути у вигляді гранул, які містять (а) активні інгредієнти, а саме біологічно ефективну кількість сполуки формули 1, її N-оксиду або солі; (b) один або кілька харчових матеріалів; необов'язково (c) атрактант і необов'язково (d) один або декілька зволожувачів. Слід зазначити гранули або композиції-приманки, які містять приблизно 0,001 % - 5 % активних інгредієнтів, приблизно 40 % - 99 % харчового матеріалу та/або атрактант, і необов'язково приблизно 0,05 % -10 % зволожувачів, які ефективні при боротьбі із ґрунтовими безхребетними шкідниками при дуже низьких нормах внесення, зокрема, при дозах активного інгредієнта, які є смертельними скоріше при заковтуванні, ніж при безпосередньому контакті. Деякі харчові матеріали можуть відігравати роль, як джерела їжі, так і атрактанту. Харчові матеріали включають вуглеводи, білки та ліпіди. Прикладами харчових матеріалів є овочеве борошно, цукор, крохмалі, тваринний жир, рослинна олія, дріжджові екстракти та сухий молочний залишок. Прикладами атрактантів є речовини, що пахнуть, і ароматизатори, такі як плодово-ягідні екстракти або екстракти з рослин, запашна речовина або інший компонент тваринного або рослинного походження, феромони або інші засоби, відомі для залучення цільового безхребетного шкідника. Прикладами зволожувачів, тобто засобів, що зберігають вологу, є гліколі та інші поліоли, гліцерин та сорбіт. Слід зазначити композицію-приманку (і спосіб, при якому застосовується така композиція-приманка), застосовувана для боротьби із щонайменше одним безхребетним шкідником, обраним із групи, що включає мурах, термітів і тарганів. Обладнання для боротьби з безхребетним шкідником може містити дану композицію-приманку та корпус, пристосований для вміщення композиції-приманки, де корпус має щонайменше один отвір, розрахований на те, щоб допускати проникнення безхребетного шкідника через отвір, внаслідок чого безхребетний шкідник може одержати доступ до зазначеної композиції-приманки з місця поза корпусом, і де корпус також пристосований для розміщення на території або поблизу місця потенційної або відомої активності безхребетного шкідника.

Сполуки даного винаходу можуть вноситися без інших добавок, але найбільш часте внесення буде у сполуці, що містить один або кілька активних інгредієнтів з підходящими

носіями, розріджувачами та поверхнево-активними речовинами та можливо в комбінації з їжею залежно від передбачуваного кінцевого застосування. Один спосіб внесення включає обприскування водною дисперсією або розчином сполуки даного винаходу на основі рафінованого масла. Комбінації з інсектицидними маслами, концентратами інсектицидних масел, адгезивними агентами, добавками, іншими розчинниками та синергістами такими як піперонілбутоксид, часто підсилюють ефективність сполуки. Для відмінних від агрономічних застосувань такі розчини для обприскування можуть вноситися з контейнерів для обприскування, таких як балон, пляшка або іншого роду контейнера або за допомогою відкачування, або вивільнення з контейнера, що перебуває під тиском, наприклад, аерозольного балона для обприскування під тиском. Такі композиції можуть приймати різні вигляди, наприклад, розчинів для обприскування, легких туманів, пін, пару або туману. Такі композиції для обприскування, таким чином, можуть додатково містити розпилюючі речовини, спінючі засоби та т.п., за потребою для внесення. Слід зазначити композицію для обприскування, що містить біологічно ефективну кількість сполуки або композицію даного винаходу та носій. Один варіант здійснення такої композиції для обприскування містить біологічно ефективну кількість сполуки або композицію даного винаходу та розпилюючу речовину. Характерні розпилюючі речовини включають, у тому числі, метан, етан, пропан, бутан, ізобутан, бутен, пентан, ізопентан, неопентан, пентен, гідрофторвуглеводи, хлорфторвуглеводи, диметилловий ефір та суміші вищезгаданих. Слід зазначити композицію для обприскування (і спосіб використання такої композиції для обприскування, розподіленої з контейнера для обприскування), застосовувану для боротьби із щонайменше одним безхребетним шкідником, обраним із групи, що складається із справжніх комарів, попелиць чорних, жигалок звичайних, оленячих гедзів, гедзів, °C, справжніх ос, шершнів, іксодових кліщів, павуків, мурах, комарів і т.п., включаючи їх окремо або в комбінаціях.

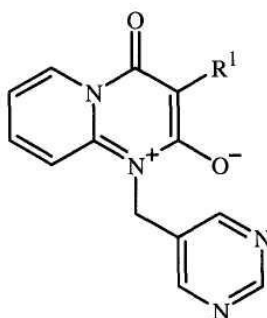
Відмінні від агрономічних застосування відносяться до боротьби з безхребетним шкідником на ділянках, крім полів оброблюваних рослин. Відмінні від агрономічних застосування даних сполук і композицій включають боротьбу з безхребетними шкідниками в зернах, що зберігаються, бобах та інших продуктах харчування, і в текстильних виробках, таких як одяг і килими. Відмінні від агрономічних застосування даних сполук і композицій також включають боротьбу з безхребетним шкідником у декоративних рослин, у лісах, у садах, уздовж узбіччя та зони проїзду залізничного транспорту, і на ґрунті, такому як газони, поля для гольфа та пасовищні угіддя. Відмінні від агрономічних застосування даних сполук і композицій також включають боротьбу з безхребетним шкідником у будинках та інших спорудженнях, які можуть бути заселеними людьми та/або свійськими тваринами, сільськогосподарськими тваринами, тваринами великого фермерського господарства, зоопарку або іншими тваринами. Відмінні від агрономічних застосування даних сполук і композицій також включають боротьбу зі шкідниками, такими як терміти, які можуть завдавати шкоди лісоматеріалу або іншим конструкційним матеріалам, застосовуваним у будинках.

Для агрономічних застосувань необхідна норма внесення для ефективної боротьби (тобто "біологічно ефективна кількість") буде залежати від таких факторів, як види безхребетних, з якими необхідно боротися, життєвий цикл шкідників, життєва стадія, їх розмір, місце розташування, пора року, сільськогосподарська культура-хазяїн або тварина-хазяїн, харчова поведінка, шлюбна поведінка, вологість навколишнього середовища, температура та т.п. При звичайних умовах норми внесення від приблизно 0,01 до 2 кг активних інгредієнтів на гектар достатні для боротьби зі шкідниками в агрономічних екосистемах, але може бути досить усього 0,0001 кг/гектар або може бути необхідно не менш 8 кг/гектар. Для відмінних від агрономічних застосувань ефективні норми внесення будуть перебувати в діапазоні від приблизно 1,0 до 50 мг/квадратний метр, але може бути досить усього 0,1 мг/квадратний метр або може бути необхідно не менше 150 мг/квадратний метр. Фахівець у даній галузі може легко визначити біологічно ефективну кількість, необхідну для необхідного рівня боротьби з безхребетним шкідником. Біологічно ефективні кількості для збільшення сили росту рослини в основному схожі з біологічно ефективними кількостями для боротьби з безхребетним шкідником, і оптимальні кількості для досягнення конкретних аспектів поліпшення сили росту рослини можна визначити за допомогою простого проведення дослідів.

Характерні сполуки даного винаходу, отримані способами, описаними в даному документі, показані в таблиці А індексів. Дивися таблицю В індексів для даних 1Н ЯМР. Для мас-спектрометричних даних (AP+ (M+1)) наведене чисельне значення є молекулярною вагою іонів молекул газу-носія (M), утворені додаванням H+ (молекулярна вага 1) до молекул для одержання піка M+1, спостережуваного за допомогою мас-спектрометрії із застосуванням хімічної іонізації при атмосферному тиску (AP+). Інші піки молекулярного іона (наприклад M+2

або M+4), які зустрічаються у випадку сполук, що містять кілька галогенів, не приводяться.

ТАБЛИЦЯ ІНДЕКСІВ А



Спол.	R ¹	Т.п. (°C)	AP ⁺ (M+1)
1	феніл	211-212	
2	4-фторфеніл		349
3	3-(трифторметил)феніл	183-185	
4	2-метоксифеніл		361
5	3-метоксифеніл		361
6	2,4-дифторфеніл	*	
7	3-(трифторметокси)феніл		415
8	3-бромфеніл	*	
9	2-фторфеніл		349
10	2-фтор-5-(трифторметил)феніл	*	
11	3-метилфеніл	*	
12	4-фтор-3-(трифторметил)феніл		417
13	4-хлор-2-фторфеніл		459
14	2-хлорфеніл		365
15	3-хлор-5-(трифторметил)феніл		433
16	3,5-дихлорфеніл		399
17	3,5-дихлор-4-фторфеніл		417
18	4'-ціано-5,2'-диметил[1,1'-біфеніл]-3-іл		460
19	3-хлорфеніл	*	

* Див. таблицю індексів В для даних 1H ЯМР.

ТАБЛИЦЯ ІНДЕКСІВ В

Спол.	Дані 1H ЯМР а
6	(ацетон-d ₆) δ 9,41 (d, 1H), 9,07 (s, 1H), 8,89 (s, 2H), 8,36 (t, 1H), 7,96 (d, 1H), 7,56-7,58 (m, 2H), 6,96-7,00 (m, 2H), 5,74 (s, 2H).

Наступні тести демонструють ефективність боротьби сполук даного винаходу проти конкретних шкідників. "Ефективність боротьби" являє собою інгібування розвитку безхребетного шкідника (включаючи смертність), яке викликає значне зниження харчування. Захист при боротьбі зі шкідником, надаваний сполуками, однак, не обмежується даними видами. Номера сполук відносяться до сполук у таблиці А індексів.

Біологічні приклади даного винаходу

10 Тест А

Тестова установка для оцінки боротьби з міллю капустяною (*Plutella xylostella*) складалася з

маленького відкритого контейнера з 12-14-денною рослиною редису усередині. Останнє попередньо заражали ~50 новонародженими личинками, розподіленими на тестовій установці за допомогою помеленої серцевини качана кукурудзи із застосуванням інокулятора із симетризуючим обладнанням. Личинки переміщали на тестову рослину після розподілу на

тестовій установці.

Тестові сполуки складали із застосуванням розчину, що містить 10 % ацетону, 90 % води та 300 частин на мільйон неіонної поверхнево-активної речовини X-77® Spreader Lo-Foam Formula, що містить алкіларилполіоксіетилен, вільні жирні кислоти, гліколі та ізопропанол (Loveland Industries, Inc. Greeley, Colorado, USA). Складені сполуки наносили в 1 мл рідині за допомогою форсунки SUJ2 зі спеціальним корпусом 1/8 JJ (Spraying Systems Co., Wheaton, Illinois, USA), розміщеної на відстані 1,27 см (0,5 дюйма) над верхньою частиною кожної тестової установки. Тестові сполуки наносили обприскуванням у кількості 250, 50 та/або 10 частин на мільйон і повторювали три рази. Після розпилення тестової складеної сполуки кожній тестовій установці дозволяли висохнути протягом 1 години та потім розміщали на верхню частину чорну екранову кришку. Тестові установки тримали протягом 6 днів у ростовій камері при 25 °C і відносній вологості 70 %. Шкоду для рослин від харчування візуально оцінювали на основі з'їденого листя.

Зі сполук формули 1, протестованих у кількості 250 частин на мільйон, наступні забезпечували від дуже гарних до прекрасних рівнів ефективності боротьби (40 % або менше шкоди від харчування та/або 100 % смертності): 1, 3, 4, 7, 8, 13 і 15.

Зі сполук формули 1, протестованих у кількості 50 частин на мільйон, наступні забезпечували від дуже гарних до прекрасних рівнів ефективності боротьби (40 % або менше шкоди від харчування та/або 100 % смертності): 1, 3, 4, 5, 8 і 19.

Зі сполук формули 1, протестованих у кількості 10 частин на мільйон, наступні забезпечували від дуже гарних до прекрасних рівнів ефективності боротьби (40 % або менше шкоди від харчування та/або 100 % смертності): 7, 15, 16 і 17.

Тест В

Для оцінки боротьби з попелицею персиковою зеленою (*Myzus persicae*) шляхом приведення в контакт та/або загальних способів, тестова установка складалася з маленького відкритого контейнера з 12-15-денною рослиною редису усередині. Останнє попередньо заражали при розміщенні на листку тестової рослини 30-40 попелиць на частині листка, відділеного від культурної рослини (спосіб розсіченого листа). Попелиць переносили на тестову рослину, коли частина листа висихала. Після попереднього зараження ґрунт тестової установки накривали шаром піску.

Тестові сполуки складали та наносили обприскуванням у кількості 250, 50 і/або 10 частин на мільйон, як описано для тесту А. Нанесення повторювали три рази. Після нанесення складеної тестової сполуки кожній тестовій установці дозволяли висохнути протягом 1 години та потім розміщали на верхню частину чорну екранову кришку. Тестові установки тримали протягом 6 днів у ростовій камері при 19-21 °C і відносній вологості 50 % - 70 %. Кожну тестову установку потім візуально оцінювали на смертність комах.

Зі сполук формули 1, протестованих у кількості 250 частин на мільйон, наступні приводили до щонайменше 80 % смертності: 1 і 3.

Зі сполук формули 1, протестованих у кількості 50 частин на мільйон, наступні приводили до щонайменше 80 % смертності: 1, 3, 15, 16 і 19.

Зі сполук формули 1, протестованих у кількості 10 частин на мільйон, наступні приводили до щонайменше 80 % смертності: 15.

Тест С

Для оцінки боротьби з бавовняною попелицею (*Aphis gossypii*) шляхом приведення в контакт та/або загальних способів, тестова установка складалася з маленького відкритого контейнера з 6-7-денною рослиною бавовни усередині. Останнє попередньо заражали 30-40 комахами на частині листа згідно зі способом розсіченого листа, описаного в тесті В, і ґрунт тестової установки накривали шаром піску.

Тестові сполуки складали та наносили розпиленням у кількості 250 та/або 50 частин на мільйон, як описано для тесту В. Нанесення повторювали три рази. Після обприскування тестові установки тримали в ростовій камері та потім візуально оцінювали, як описано для тесту С.

Зі сполук формули 1, протестованих у кількості 250 частин на мільйон, наступні приводили до щонайменше 80 % смертності: 1 і 3.

Зі сполук формули 1, протестованих у кількості 50 частин на мільйон, наступні приводили до щонайменше 80 % смертності: 3, 7 і 12.

Тест D

Для оцінки боротьби з кукурудзяною цикадкою (*Peregrinus maidis*) шляхом приведення в контакт та/або загальних способів, тестова установка складалася з маленького відкритого контейнера з 3-4-денною рослиною маїсу (качан) усередині. Перед внесенням додавали білий пісок на верхню частину ґрунту. Тестові сполуки складали та наносили обприскуванням у кількості 250, 50, 10 та/або 2 частин на мільйон, і повторювали три рази, як описано для тесту А. Після обприскування тестовим установкам дозволяли висохнути протягом 1 години перед тем, як їх попередньо заражали ~15-20 німфами (18-21-денними) насипанням їх на пісок сільничкою. Чорну, екрановану кришку поміщали на верхню частину кожної тестової установки, і тестові установки тримали протягом 6 днів у ростовій камері при 22-24 °C і відносній вологості 50 % - 70 %. Кожну тестову установку потім оцінювали на смертність комах.

Зі сполук формули 1, протестованих у кількості 250 частин на мільйон, наступні забезпечували від дуже гарних до прекрасних рівнів ефективності боротьби (80 % або більше смертності): 1, 2, 3 і 10.

Зі сполук формули 1, протестованих у кількості 50 частин на мільйон, наступні забезпечували від дуже гарних до прекрасних рівнів ефективності боротьби (80 % або більше смертності): 1, 2, 3, 4, 5, 9, 10, 11, 12, 15, 16, 17, 18 і 19.

Зі сполук формули 1, протестованих у кількості 10 частин на мільйон, наступні забезпечували від дуже гарних до прекрасних рівнів ефективності боротьби (80 % або більше смертності): 1, 2, 3, 5, 10, 11, 12, 15, 16, 17 і 19.

Зі сполук формули 1, протестованих у кількості 2 частин на мільйон, наступні забезпечували від дуже гарних до прекрасних рівнів ефективності боротьби (80 % або більше смертності): 2, 3 і 15.

Тест E

Для оцінки боротьби з картопляною цикадкою (*Empoasca fabae*) шляхом приведення в контакт та/або загальних способів, тестова установка складалася з маленького відкритого контейнера з 5-6-денною рослиною сої Soleil (з первинними листками, що з'явилися) усередині. Білий пісок додавали на верхню частину ґрунту та один з первинних листів відокремлювали перед внесенням.

Тестові сполуки складали та наносили обприскуванням у кількості 250, 50, 10 та/або 2 частини на мільйон і тести повторювали три рази, як описано для тесту А. Після обприскування тестовим установкам дозволяли висохнути протягом 1 години перед тим, як їх попередньо заражали 5 картопляними цикадками (18 – 21-денні дорослі особини). Чорну, екрановану кришку поміщали на верхню частину кожної тестової установки та тестові установки тримали протягом 6 днів у ростовій камері при 24 °C і відносній вологості 70 %. Кожну тестову установку потім оцінювали на смертність комах.

Зі сполук формули 1, протестованих у кількості 250 частин на мільйон, наступні забезпечували від дуже гарних до прекрасних рівнів ефективності боротьби (80 % або більше смертності): 1 і 3.

Зі сполук формули 1, протестованих у кількості 50 частин на мільйон, наступні забезпечували від дуже гарних до прекрасних рівнів ефективності боротьби (80 % або більше смертності): 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 15, 18 і 19.

Зі сполук формули 1, протестованих у кількості 10 частин на мільйон, наступні забезпечували від дуже гарних до прекрасних рівнів ефективності боротьби (80 % або більше смертності): 1, 2, 3, 5, 6, 7, 9, 11, 12, 15 і 19.

Зі сполук формули 1, протестованих у кількості 2 частини на мільйон, наступні забезпечували від дуже гарних до прекрасних рівнів ефективності боротьби (80 % або більше смертності): 1, 7 і 15.

Тест F

Для оцінки боротьби із західним квітковим трипсом (*Frankliniella occidentalis*) шляхом приведення в контакт та/або загальних способів, тестова установка складалася з маленького відкритого контейнера з 5-7-денною рослиною сої Soleil усередині.

Тестові сполуки складали та наносили обприскуванням у кількості 250 частин на мільйон, і тести повторювали три рази, як описано для тесту А. Після обприскування тестовій установці дозволяли висохнути протягом 1 години та потім 22-27 дорослих особин трипсів підкладали в установку. Чорну, екрановану кришку поміщали на верхню частину кожної тестової установки та тестові установки тримали протягом 7 днів при 25 °C і відносній вологості 45-55 %.

Зі сполук формули 1, протестованих у кількості 250 частин на мільйон, наступні забезпечували від дуже гарних до прекрасних рівнів ефективності боротьби (30 % або менше шкоди для рослин та/або 100 % смертності): 1 і 4.

Тест G

Для оцінки боротьби з цикадкою зеленою рисовою (*Nephotettix virescens*) шляхом приведення в контакт та/або загальних способів, тестова установка складалася із пластикового горщика, що містить рослину рису висотою 13 см, покритого сталеву дротяною сіткою (50 меш), підтримувану дротовим каркасом. Невелику кількість піску додавали для формування 5 ґрунтового ущільнення між днищем і дротяною сіткою, поверхнею ґрунту та верхнім краєм пластикового горщика.

Тестові сполуки складали та наносили обприскуванням у кількості 50, 10 та/або 2 частини на мільйон і тести повторювали три рази способом, подібним описаному для тесту А. Після обприскування тестовим установкам дозволяли висохнути протягом 2 годин перед тем, як їх після заражали 10 цикадками зеленими (німфами 3-ї вікової стадії, через 7-9 днів після вилуплення). Через 5 днів кожну тестову установку візуально оцінювали на смертність комах.

Зі сполук формули 1, протестованих у кількості 50 частин на мільйон, наступні забезпечували від дуже гарних до прекрасних рівнів ефективності боротьби (80 % або більше смертності): 2, 3, 7, 10, 11 і 12.

Зі сполук формули 1, протестованих у кількості 10 частин на мільйон, наступні забезпечували від дуже гарних до прекрасних рівнів ефективності боротьби (80 % або більше смертності): 2, 3, 7, 10 і 11.

Зі сполук формули 1, протестованих у кількості 2 частини на мільйон, наступні забезпечували від дуже гарних до прекрасних рівнів ефективності боротьби (80 % або більше смертності): 3 і 7.

Тест H

Для оцінки боротьби з бурою рисовою цикадкою (*Nilaparvata lugens*) шляхом приведення в контакт та/або загальних способів, тестова установка складалася із пластикового горщика, що містить рослину рису висотою 13 см, покритого сталеву дротяною сіткою (50 меш), підтримувану дротовим каркасом. Невелику кількість піску додавали для формування 25 ґрунтового ущільнення між днищем і дротяною сіткою, поверхнею ґрунту та верхнім краєм пластикового горщика.

Тестові сполуки складали та наносили обприскуванням у кількості 10, 2 і/або 0,4 частини на мільйон, і тести повторювали три рази способом, подібним описаному для тесту А. Після обприскування тестовій установці дозволяли висохнути протягом 2 годин перед тем, як їх після заражали 10 бурими рисовими цикадками (німфами 3-ї вікової стадії, через 7-9 днів після вилуплення). Через 5 днів кожну тестову установку візуально оцінювали на смертність комах.

Зі сполук формули 1, протестованих у кількості 10 частин на мільйон, наступні забезпечували від дуже гарних до прекрасних рівнів ефективності боротьби (80 % або більше смертності): 2, 3, 7, 9, 10, 11, 12 і 15.

Зі сполук формули 1, протестованих у кількості 2 частини на мільйон, наступні забезпечували від дуже гарних до прекрасних рівнів ефективності боротьби (80 % або більше смертності): 2, 3, 7 і 10.

Зі сполук формули 1, протестованих у кількості 0,4 частини на мільйон, наступні забезпечували від дуже гарних до прекрасних рівнів ефективності боротьби (80 % або більше смертності): 7.

Для оцінки ефекту від внесення сполуки даного винаходу на силу росту рисових культур, вирощених на відкритому повітрі, проводили тести I-O. "A.i." відноситься до кількості внесенного 45 активного інгредієнта.

Тест I

Рослини рису (індійський сорт культурної рослини "MTU1010") пересаджували в затоплені 5 м × 3 м тестові ділянки суглинного ґрунту області дельти округу Західного Годаварі, Андхра-Прадеш, Індія, під час сезону дощів і вирощували з використанням місцевих агрономічних способів. Через 47 днів водні суміші сполуки 3 наносили на листя рослин рису в кількості 12,5, 25 або 50 г а.і./га в об'ємі розчину для обприскування 387 л/га із застосуванням ранцевого обприскувача. Ділянки необприсканих рослин рису використовували у якості контролю. Кожну обробку та контроль повторювали три рази та ділянки розташовували у випадковому повноблочному плані. Під час внесення сполуки 3 рівень шкідника бурої рисової цикадки (*Nilaparvata lugens*) був високим, тобто набагато вище рівня, що вважається економічно 55 значним.

Силу росту рослини рослин рису на кожній ділянці оцінювали візуально по загальному зовнішньому вигляду (наприклад, висоті рослини) через 20 днів після застосування по шкалі від 0 % до 200 %, де рослини на необроблених контрольних ділянках розглядають, які 60 відображають 100 %, і усереднювали результати для трьох повторностей для кожної обробки.

Більше 100 % означає, що рослини на обробленій ділянці мали більшу силу росту, ніж такі на необроблених контрольних ділянках, у той час як менше 100 % означає, що рослини на обробленій ділянці мали меншу силу росту. Рослини рису, оброблені 12,5, 25 і 50 г а.і./га сполуки 3 демонструють 140 %, 143 % і 143 % сили росту рослини, відповідно, у порівнянні з 100 % необроблених контролів.

Тест J

Рослини рису (індійський сорт культурної рослини "MTU1010") пересаджували в затоплені 5 м × 3 м тестові ділянки суглинного ґрунту області дельти округу Західного Годаварі, Андхра-Прадеш, Індія, під час сезону дощів і вирощували з використанням місцевих агрономічних способів. Через 52 дня водні суміші сполуки 3 наносили на листя рослин рису в кількості 12,5, 25 або 50 г а.і./га в об'ємі розчину для обприскування 387 л/га із застосуванням ранцевого обприскувача. Ділянки необприсканих рослин рису використовували у якості контролю. Кожну обробку та контроль повторювали три рази, і ділянки розташовували у випадковому повноблочному плані. Під час внесення сполуки 3 рівень шкідника бурої рисової цикадки (*Nilaparvata lugens*) був високим, тобто набагато вище рівня, що вважається економічно значним. Через 20 днів після першої обробки позакореневі внесення водних сумішей сполуки 3 повторювали при таких же нормах внесення в об'ємі розчину для обприскування 467 л/га.

Силу росту рослини рослин рису на кожній ділянці оцінювали візуально через 48 днів після першого внесення по шкалі від 0 % до 200 %, як описано для тесту I. Рослини рису, оброблені 12,5, 25 і 50 г а.і./га сполуки 3 демонструють 148 %, 148 % і 148 % сили росту рослини, відповідно, у порівнянні з 100 % необроблених контролів.

Тест K

Рослини рису (індійський сорт культурної рослини "JAYA") пересаджували в затоплені 6 м × 5 м тестові ділянки суглинного ґрунту під сіткою, що затінює, в штаті Гуджарат, Індія, під час жаркого сезону перед настанням сезону дощів, і вирощували з використанням місцевих агрономічних способів. Відповідно, через 44 дня від пересаджування, усі рослини рису в цьому тесті обприскували водною сумішшю, що містить 30 г а.і./га циперметрину та 100 г а.і./га пікоксистробіну. Через 53 дня від пересаджування водні суміші сполуки 3 наносили на листя рослин рису в кількості 6,25, 12,5, 25 або 50 г а.і./га в об'ємі розчину для обприскування 500 л/га із застосуванням ранцевого обприскувача. Ділянки необприсканих рослин рису використовували у якості контролю. Кожну обробку та контроль повторювали три рази, і ділянки розташовували у випадковому повноблочному плані. Під час внесення сполуки 3 рівень шкідника бурої рисової цикадки (*Nilaparvata lugens*) був високим, тобто усе ще вище рівня, що вважається економічно значним.

Силу росту рослини рослин рису на кожній ділянці оцінювали візуально через 32 дня після внесення по шкалі від 0 % до 200 %, як описано для тесту I. Рослини рису, оброблені 6,25, 12,5, 25 і 50 г а.і./га сполуки 3 демонструють 115 %, 113 %, 122 % і 115 % сили росту рослини, відповідно, у порівнянні з 100 % необроблених контролів.

На 45 день після внесення вимірювали висоту та довжину волоті рослин рису. Висоту рослини визначали за допомогою виміру довжини від самої довгої вертикально протягнутої верхівки листа до поверхні ґрунту. Довжину волоті вимірювали подібним чином. Середня висота рослин рису, оброблених 6,25, 12,5, 25 і 50 г а.і./га сполуки 3, становила 0,94, 0,92, 0,92 і 0,99 м, відповідно, у порівнянні з 0,78 м для необроблених контрольних рослин. Середня довжина волоті рослин рису, оброблених 6,25, 12,5, 25 і 50 г а.і./га сполуки 3, становила 23,8, 23,7, 24,9 і 24,6 см, відповідно, у порівнянні з 22,4 см для необроблених контрольних рослин. У той час як обробки тільки сполукою 3 у кількості 25 і 50 г а.і./га значно збільшують довжину волоті, усі обробки значно збільшують висоту рослини.

Тест L

Рослини рису (індійський сорт культурної рослини "IR 64") пересаджували в затоплені 6 м × 5 м тестові ділянки суглинного ґрунту в окрузі Дхаттари, штат Чхаттісгарх, Індія, у період початку весни, і вирощували з використанням місцевих агрономічних способів. Через 79 днів під час жаркого сезону перед настанням сезону дощів водні суміші, що містять 30 г а.і./га індоксакарбу у вигляді інсектициду STEWARD®, 20 г а.і./га хлорантраніліпролу та 6,25, 12,5, 25 або 50 г а.і./га сполуки 3 наносили на листя рослин рису в об'ємі розчину для обприскування 500 л/га із застосуванням ранцевого обприскувача. Ділянки контрольних рослин рису обприскували водною сумішшю, що містить 30 г а.і./га індоксакарбу у вигляді інсектициду STEWARD® і 20 г а.і./га хлорантраніліпролу (тобто без сполуки 3). Кожну обробку та контроль повторювали три рази, і ділянки розташовували у випадковому повноблочному плані. Під час внесення сполуки 3 рівень шкідника бурої рисової цикадки (*Nilaparvata lugens*) був високим, тобто вище рівня, що вважається економічно значним.

Силу росту рослини рослин рису на кожній ділянці оцінювали візуально через 21 день після внесення по шкалі від 0 % до 200 %, як описано для тесту І. При всіх нормах внесення оброблені рослини рису показали такий же рівень сили росту рослини (тобто 100 %), як і необроблені контрольні рослини. Незважаючи на те, що рівень шкідників був високим, під час обробки рослини вже досягли повної висоти та породили волоті, так що обробка сполукою 3 була занадто пізньою, щоб помітно збільшити силу росту рослини, оцінену загальним зовнішнім виглядом (наприклад висота рослини, кількість волотей). Проте, обробки значно допомогли силі росту рослини, як обмірювано збором урожаю. Збори врожаїв від посівів, оброблених 6,25, 12,5, 25 і 50 г а.і./га сполуки 3, складали 4630, 4830, 4730 і 4930 кг/га, відповідно, у порівнянні з 2630 кг/га від необроблених контролів. Отже навіть пізні обробки значно збільшували врожайність запобіганням шкоди від комахи надродина *Fulgoroidea*, який буде у протилежному випадку зупиняти процес наливу зерна, приводячи до порожніх волотей.

Тест М

Рослини рису (індійський сорт культурної рослини) сіяли насіннями в затоплені 6 м × 5 м тестові ділянки суглинного ґрунту в провінції Анзянг В'єтнаму, незадовго до сезону дощів, і вирощували з використанням місцевих агрономічних способів. Через 42 дні на початку періоду дощів водні суміші, що містять 30 г а.і./га індоксакарбу у вигляді інсектициду STEWARD®, 20 г а.і./га хлорантраніліпролу та 6,25, 12,5, 25 або 50 г а.і./га сполуки 3 наносили на листя рослин рису в об'ємі розчину для обприскування 400 л/га із застосуванням механізованого обприскувача. Ділянки контрольних рослин рису обприскували водною сумішшю, що містить 30 г а.і./га індоксакарбу у вигляді інсектициду STEWARD® і 20 г а.і./га хлорантраніліпролу (тобто без сполуки 3). Кожну обробку та контроль повторювали три рази, і ділянки розташовували у випадковому повноблочному плані. Під час внесення сполуки 3 рівень шкідника бурої рисової цикадки (*Nilaparvata lugens*) був дуже низьким.

Силу росту рослини рослин рису на кожній ділянці оцінювали візуально через 18 днів після внесення по шкалі від 0 % до 200 %, як описано для тесту І. При всіх нормах внесення оброблені рослини рису показали такий же рівень сили росту рослини (тобто 100 %), як і необроблені контрольні рослини. Через те, що рівень шкідників був дуже низьким, і умови вирощування були ідеальними, внесення сполуки 3 помітно не збільшили силу росту рослини.

Тест N

Рослини рису (індійський сорт культурної рослини "Swarna") пересаджували в затоплені 4 м × 3 м тестові ділянки суглинного ґрунту округу Баргарх, Орїсса, Індія, під час сезону дощів і вирощували з використанням місцевих агрономічних способів. Через 70 днів водні суміші сполуки 3 наносили на листя рослин рису в кількості 12,5, 25 або 50 г а.і./га в об'ємі розчину для обприскування 400 л/га із застосуванням ранцевого обприскувача. Ділянки необприсканих рослин рису використовували у якості контролю. Кожну обробку та контроль повторювали три рази, і ділянки розташовували у випадковому повноблочному плані. Під час внесення сполуки 3 рівень шкідника бурої рисової цикадки (*Nilaparvata lugens*) був високим, тобто набагато вище рівня, що вважається економічно значимим. Через 14 днів після першої обробки, позакореневі внесення водних сумішей сполуки 3 повторювали при таких же нормах внесення в об'ємі розчину для обприскування 400 л/га.

Збори врожаїв від посівів, оброблених 12,5, 25 і 50 г а.і./га сполуки 3, становили 3190, 3660 і 4220 кг/га, відповідно, у порівнянні з 620 кг/га від необроблених контролів.

Тест О

Рослини рису (індійський сорт культурної рослини "IR-64") пересаджували в затоплені 5 м × 5 м тестові ділянки суглинного ґрунту округу Баргарх, Орїсса, Індія, наприкінці зимового періоду, і вирощували з використанням місцевих агрономічних способів. Через 79 днів водні суміші, що містять 30 г а.і./га індоксакарбу у вигляді інсектициду STEWARD®, 20 г а.і./га хлорантраніліпролу та 6,25, 12,5, 25 або 50 г а.і./га сполуки 3 наносили на листя рослин рису в об'ємі розчину для обприскування 500 л/га із застосуванням ранцевого обприскувача. Ділянки контрольних рослин рису обприскували водною сумішшю, що містить 30 г а.і./га індоксакарбу у вигляді інсектициду STEWARD® і 20 г а.і./га хлорантраніліпролу (тобто без сполуки 3). Кожну обробку та контроль повторювали три рази, і ділянки розташовували у випадковому повноблочному плані. Під час внесення сполуки 3 рівень шкідника бурої рисової цикадки (*Nilaparvata lugens*) був високим, тобто набагато вище рівня, що вважається економічно значимим.

Збори врожаїв від посівів, оброблених 12,5, 25 і 50 г а.і./га сполуки 3, становили 2470, 3430, 3470 і 4600 кг/га, відповідно, у порівнянні з 1370 кг/га від необроблених контролів.

Тест Р

У даному тесті, вимірювали ефект сполуки даного винаходу на силу росту рослин маїсу,

вирощених у теплиці у відсутності впливу шкідників.

Одиночні насіння маїсу (органічної польової кукурудзи Prairie Hybrid 2431) саджали на глибину від 2,0 до 2,5 см у пластикових горщиках 10 см × 10 см × 8 см, що містять або середовище на основі сфангового моху Redi-Earth для висадження в горщики (Sun Gro Horticulture Canada Ltd., Vancouver, British Columbia), або суміш 50/50 ґрунту Matapeake та піску. Горщики з насіннями спочатку заливали водою до 5 см глибиною та поміщали в ростову камеру, підтримувану при 25 °С протягом фотоперіоду 16 годин світла / 8 годин темряви. Горщики заливали водою щораз, як поверхня ґрунту висихала.

Через 8 днів від першого поливу вирощувані в горщику рослини обробляли внесенням у якості просочення поверхні 40 мл водної суміші для обробки, що містить або 0,2, або 2,5 мг сполуки 3. У горщики необроблених контрольних рослин подібним чином вносили 40 мл водопровідної води. Обробки та необроблені контролю повторювали 10 раз.

Оброблені та необроблені рослини потім розташовували в повній схемі рандомізованих блоків у теплиці, підтримуваної при 25,6-27,8 °С протягом дня та 23,0-25,0 °С уночі. Додаткове освітлення додавали, якщо рівень зовнішнього світла опускався нижче 200 ват м–2 протягом 16-годинного періоду вирощування, крім випадків, коли додаткове висвітлення не активували, якщо енергія зовнішнього світла вже накопичувалося до більше 5000 Вт година м–2 під час періоду вирощування. Підсвічування теплиці завершували, якщо рівень зовнішнього світла піднімався вище 600 ват м–2 протягом більше 20 хвилин.

Не робили ніяких модифікацій відносно відносної вологості. Зрошення водопровідною водою забезпечували двічі в день у міру необхідності для підтримки ґрунтової вологості. Кожний другий або третій день рослини вдобрювали зрошенням водою, що містить 100 частин на мільйон N-P-K від Peters® розчинного 20-20-20 багатоцільового добрива (The Scotts Company, Marysville, Ohio, U.S.A.). Рівні застосованих поживних речовин уважали менш ніж ідеальними для оптимального росту рослин маїсу.

Висоту рослини визначали на 0, 7, 14, 21 і 28 дні після обробки за допомогою виміру довжини від самої довгої вертикально протяжної верхівки листка до поверхні ґрунту. Висоти усереднювали серед 10 реплікатів, перерахованих у тестових таблицях 1 і 2 для росту рослин ґрунту Redi-Earth і ґрунту Matapeake/пісок, відповідно.

ТЕСТОВА ТАБЛИЦЯ 1

Ефект обробок сполукою 3 на висоту росту рослин маїсу на ґрунті Redi-Earth.

Норма внесення (мг а.і./горщик)	Висота (см) на день після обробки				
	0 день	7 день	14 день	21 день	28 день
0	21	52	84	109	133
0,2	22	53	85	111	131
2,5	21	53	85	111	137

ТЕСТОВА ТАБЛИЦЯ 2

Ефект обробок сполукою 3 на висоту росту рослин маїсу на ґрунті Matapeake/пісок.

Норма внесення (мг а.і./горщик)	Висота (см) на день після обробки				
	0 день	7 день	14 день	21 день	28 день
0	22	49	66	78	89
0,2	22	49	66	76	87
2,5	22	46	65	78	88

Результати в тестових таблицях 1 і 2 показують, що малий ефект збільшення росту був помітним у результаті застосувань сполуки 3 до рослин маїсу, вирощених у вільному від шкідників середовищі проживання при умовах вирощування, які були близькими до ідеальних, за винятком обмеження в поживних речовинах.

ФОРМУЛА ВИНАХОДУ

1. Сполука N-[(5-піримідиніл)метил]-2-піридинамін.
2. Сполука N-(5-піримідинілметил)-2-піридинамін.

Комп'ютерна верстка А. Крижанівський

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

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