



УКРАЇНА

(19) UA (11) 82083 (13) C2

(51) МПК (2006)

A01N 43/90

C07D 491/10 (2007.01)

C07D 493/10 (2007.01)

A01P 13/00

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ
І НАУКИ УКРАЇНИДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІОПИС
ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД

(54) 3-ФЕНІЛЗАМІЩЕНІ-3-ЗАМІЩЕНІ-4-КЕТОЛАКТАМИ ТА -КЕТОЛАКТОНИ

1

2

(21) a200508169

(22) 07.01.2004

(24) 11.03.2008

(86) РСТ/ЕР2004/000037, 07.01.2004

(31) 103 01 805.0

(32) 20.01.2003

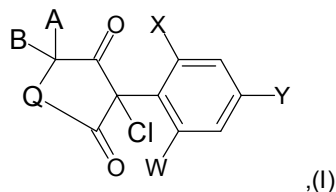
(33) DE

(72) ФІШЕР РАЙНЕР, ЛЕР ШТЕФАН,
БРЕТШНАЙДЕР ТОМАС, ДРЕВЕС МАРК
ВІЛЬХЕЛЬМ, ФОЙХТ ДІТЕР, КОНЦЕ ЙОРГ,
МАЛЬЗАМ ОЛЬГА, КУКК КАРЛ-ХАЙНЦ, БОЯК
ГУЙДО, АУЛЕР ТОМАС, ХІЛЛЬС МАРТІН, КЕНЕ
ХАЙНЦ

(73) БАЕР КРОПСАЄНС АКЦІЕНГЕЗЕЛЬШАФТ

(56) JP 10258555, A, 31.12.1998

WO 9825928, A, 18.06.1998

(57) 3-Фенілзаміщені-3-заміщені-4-кетолактами та
-кетолактони формули (I)

, (I)

в якій

у випадку Q = NH,

W означає етил або н-пропіл,

X означає метил, етил, хлор або бром,

Y означає хлор, бром, метил або етил,

із застереженням, що щонайменше один із
залишків X або Y означає галоген,A означає метил, етил, н-пропіл, ізо-пропіл, ізо-
бутил, циклопропіл або бензил,

B означає водень, метил або етил,

A, B та атом вуглецю, до якого вони приєднані,
означають насичений C₆-циклоалкіл, який, в разі
необхідності, заміщений метилом,

або

W означає метил або етил,

X означає водень,

Y означає хлор або бром,

A означає метил,

B означає метил,

A, B та атом вуглецю, до якого вони приєднані,
означають насичений C₆-циклоалкіл, який, в разі
необхідності, один раз заміщений метилом,

а у випадку Q = O,

W означає метил або етил,

X означає метил, хлор або бром,

(13) C2

(11) 82083

(19) UA

Y означає метил, бром або хлор,

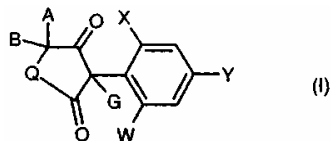
із застереженням, що щонайменше один із залишків X або Y означає галоген,

Даний винахід стосується нових 3-фенілзаміщений-3-заміщених-4-кетолактамів та кетолактонів, способу і проміжних продуктів для їх одержання та їх застосування як засобів для боротьби зі шкідниками та гербіцидів.

Відомо, що певні фенілзаміщений 3-галоген-4-кетолактами [JP-A-10-258555] та фенілзаміщений 3-галоген-4-кетолактони [JP-A-10-258555] проявляють активність акарицидів або інсектицидів та/або гербіцидів.

Але активність та спектр дії цих сполук зокрема при низьких витратних кількостях та концентраціях не завжди є задовільним. Крім того сумісність цих сполук з культурами корисних рослин не завжди є достатньою.

Нещодавно були одержані нові сполуки формули (I),



в якій

Q означає кисень або N-H,

W означає алкіл,

X означає водень, галоген або алкіл,

Y означає галоген або алкіл,

із вказівкою, що щонайменше один із залишків X або Y означає галоген,

A означає алкіл, галогеналкіл, алкоксиалкіл, бензил або, в разі необхідності, замінений циклоалкіл,

B означає водень або алкіл,

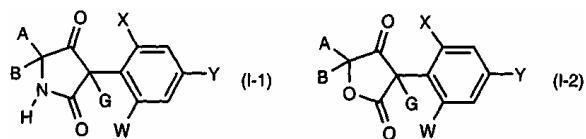
A та B разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, означають насичений, в разі необхідності, замінений алкілом або галогеналкілом цикл,

G означає галоген або нітро.

Сполуки формули (I), залежно від виду замісників, можуть бути представлені в різних комбінаціях як геометричні та/або оптичні ізомери або суміші ізомерів, які, в разі необхідності, можуть бути розділені звичайним способом. Чисті ізомери та їх суміші, їх одержання та застосування, а також засоби, що їх містять, є об'єктом даного винаходу. Надалі для спрощення мова йтиме про сполуки формули (I), хоча під ними слід розуміти як чисті сполуки, так і, в разі необхідності, суміші з різним вмістом ізомерних сполук.

A, B та атом вуглецю, до якого вони приєднані, означають насичений C₅-циклоалкіл, який, в разі необхідності, один раз замінений метилом.

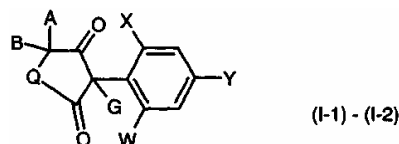
Враховуючи значення Q, одержують такі основні структури (I-1) - (I-2):



в яких

A, B, G, W, X та Y мають вказані вище значення.

A) Крім того з'ясували, що сполуки формул (I-1) - (I-2)

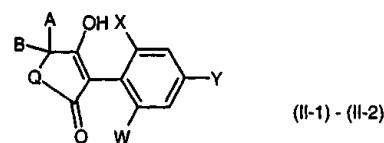


в яких

A, B, Q, W, X та Y мають вказані вище значення

та

G означає галоген, переважно хлор та бром, одержують шляхом взаємодії сполук формул (I-1) - (I-2)

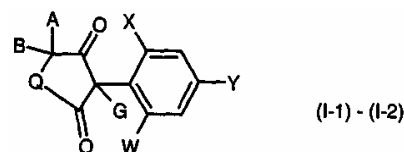


в яких

A, B, Q, W, X та Y мають вказані вище значення,

з агентами галогенування в присутності розчинника та, в разі необхідності, в присутності джерела радикалу.

B) Крім того сполуки формул (I-1) - (I-2)

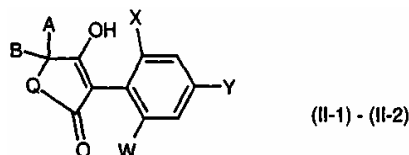


в яких

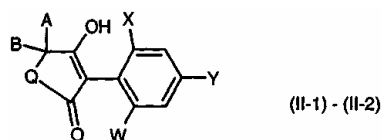
A, B, Q, W, X та Y мають вказані вище значення

та

G означає нітро,
одержують шляхом взаємодії сполук формул
(II-1) - (II-2)



в яких
А, В, Q, W, X та Y мають вказані вище
значення,
з агентами нітрування, такими як, наприклад,
азотна кислота, що димить, в присутності
розчинника.
Необхідні для здійснення способів А та В
сполуки формул (II-1) - (II-2)



в яких
А, В, Q, W, X та Y мають вказані вище
значення,
є частково відомими сполуками [наприклад, з
EP-A 668 267, WO 96/35 664, WO 97/02 243] або
можуть бути синтезовані описаними там
способами.

Як агенти галогенування для здійснення
способу А застосовують, наприклад,
сульфурилхлорид, сульфурильбромід,
тіонілхлорид, тіонілбромід, іміди, такі як,
наприклад, N-бромсукцинімід або N-
хлорсукцинімід, хлорсульфонова кислота, а також
гіпохлорити, такі як, наприклад, трет-
бутилгіпохлорит.

Як агенти нітрування для здійснення способу
В застосовують азотну кислоту, що димить, а
також "нітрувальну суміш".

Крім того з'ясували, що нові сполуки формули
(I) проявляють дуже високу активність як засоби
для боротьби зі шкідниками, переважно як
інсектициди та/або акарициди та/або гербіциди.

Сполуки згідно з винаходом загалом
визначаються формулою (I). Нижче наведені
переважні замісники та області значень, вказані у
зазначених вище на нижче формулах:

Q означає переважно кисень або N-H,

W означає переважно C₁-C₄-алкіл,

X означає переважно водень, галоген або C₁-
C₄-алкіл,

Y означає переважно галоген або C₁-C₂-алкіл,
із вказівкою, що щонайменше один із залишків
X або Y означає галоген,

А означає переважно C₁-C₈-алкіл, C₁-C₄-
галогеналкіл, C₁-C₄-алкокси-C₁-C₂-алкіл, бензил
або, в разі необхідності, один або два рази
заміщений C₁-C₄-алкілом, C₁-C₄-алкокси або
галогеном C₃-C₆-циклоалкіл,

В означає переважно водень або C₁-C₄-алкіл,

А, В та атом вуглецю, до якого вони приєднані,
означають переважно насичений C₃-C₈-

циклоалкіл, який, в разі необхідності, один або два
рази заміщений C₁-C₄-алкілом або C₁-C₂-
галогеналкілом,

G означає переважно хлор, бром або нітро.

У переважних визначення залишків галоген
означає фтор, хлор, бром та йод, зокрема фтор,
хлор та бром.

Q означає особливо переважно кисень або N-
H,

W означає особливо переважно метил, етил
або n-пропіл,

X означає особливо переважно водень, хлор,
бром, метил, етил або n-пропіл,

Y означає особливо переважно хлор, бром,
метил або етил,

із вказівкою, що щонайменше один із залишків
X або Y означає галоген,

А означає особливо переважно C₁-C₆-алкіл,
трифторметил, C₁-C₂-алкокси-C₁-C₂-алкіл, бензил,
або, в разі необхідності, один раз заміщений C₁-
C₂-алкілом, C₁-C₂-алкокси, фтором або хлором C₃-
C₆-циклоалкіл,

В означає особливо переважно водень або C₁-
C₂-алкіл,

А, В та атом вуглецю, до якого вони приєднані,
означають особливо переважно насичений C₅-C₆-
циклоалкіл, який, в разі необхідності, один раз
заміщений C₁-C₂-алкілом або трифторметилом,

G означає особливо переважно хлор, бром
або нітро.

Q означає найбільш переважно кисень або N-
H,

W означає найбільш переважно метил, етил
або n-пропіл,

X означає найбільш переважно водень, хлор,
бром, метил або етил,

Y означає найбільш переважно хлор, бром,
метил або етил,

із вказівкою, що щонайменше один із залишків
X або Y означає галоген,

А означає найбільш переважно метил, етил, n-
пропіл, i-пропіл, n-бутил, втор-бутил, i-бутил, трет-
бутил, трифторметил, бензил, циклопропіл,
циклопентил або циклогексил,

В означає найбільш переважно водень, метил
або етил,

А, В та атом вуглецю, до якого вони приєднані,
означають найбільш переважно насичений C₆-
циклоалкіл, який, в разі необхідності, один раз
заміщений метилом,

G означає найбільш переважно хлор або
нітро.

Q означає абсолютно переважно NH,

W означає абсолютно переважно етил або n-
пропіл,

X означає абсолютно переважно метил, етил,
хлор або бром,

Y означає абсолютно переважно хлор, бром,
метил або етил,

із вказівкою, що щонайменше один із залишків
X або Y означає галоген,

А означає абсолютно переважно метил, етил,
n-пропіл, i-пропіл, i-бутил, циклопропіл або
бензил,

В означає абсолютно переважно водень,
метил або етил,

А, В та атом вуглецю, до якого вони приєднані, означають абсолютно переважно насичений С₆-циклоалкіл, який, в разі необхідності, заміщений метилом,

Г означає абсолютно переважно хлор.

Q означає зокрема NH,

W означає зокрема метил або етил,

X означає зокрема водень,

Y означає зокрема хлор або бром,

А означає зокрема метил,

В означає зокрема метил,

А, В та атом вуглецю, до якого вони приєднані, означають зокрема насичений С₆-циклоалкіл, який, в разі необхідності, один раз заміщений метилом,

Г означає зокрема хлор.

Крім того Q означає також зокрема кисень,

W означає також зокрема метил або етил,

X означає також зокрема метил, хлор або бром,

Y означає також зокрема метил, бром або хлор,

із вказівкою, що щонайменше один із залишків Х або Y означає галоген,

А, В та атом вуглецю, до якого вони приєднані, означають також зокрема насичений С₆-циклоалкіл, який, в разі необхідності, один раз заміщений метилом,

Г означає також зокрема хлор.

Наведені вище загальні та переважні визначення залишків або їх пояснення можуть бути скомбіновані як між собою, так і з залишками, визначеними як переважні, в будь-якій послідовності. Вони стосуються як кінцевих, так і вихідних та проміжних продуктів.

Згідно з винаходом перевагу надають сполукам формули (I), в яких представлена комбінація описаних вище значень, визначених як переважні.

Згідно з винаходом особливу перевагу надають сполукам формули (I), в яких представлена комбінація описаних вище значень, визначених як особливо переважні.

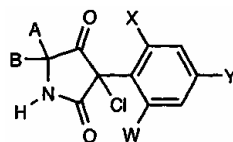
Згідно з винаходом найбільшу перевагу надають сполукам формули (I), в яких представлена комбінація описаних вище значень, визначених як найбільш переважні.

Згідно з винаходом абсолютну перевагу надають сполукам формули (I), в яких представлена комбінація описаних вище значень, визначених як абсолютно переважні.

Насичені або ненасичені вуглеводневі залишки, такі як алкіл або алкеніл, також разом із гетероатомами, як, наприклад, в алкокси, наскільки це можливо, можуть бути нерозгалуженими або розгалуженими.

В разі необхідності, заміщені залишки, якщо не зазначено нічого іншого, можуть бути заміщені один або кілька разів, причому при багаторазовому заміщенні замісники можуть бути однаковими або різними.

Нижче окрім зазначених у прикладах одержання сполук наведені такі сполуки формули (I-1):



Таблиця 1: W = C₂H₅; X = CH₃; Y = Cl;

A	B
CH ₃	CH ₃
C ₂ H ₅	CH ₃
C ₃ H ₇	CH ₃
i-C ₃ H ₇	CH ₃
C ₄ H ₉	CH ₃
i-C ₄ H ₉	CH ₃
втор-C ₄ H ₉	CH ₃
трет-C ₄ H ₉	CH ₃
	CH ₃
	CH ₃
	CH ₃
-(CH ₂) ₄ -	
-(CH ₂) ₅ -	
-CH ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₃ -	
-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	
-(CH ₂) ₂ -CHC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -	
-(CH ₂) ₂ -C(CH ₃) ₂ -(CH ₂) ₂ -	
-CH ₂ -(CHCH ₃) ₂ -(CH ₂) ₂ -	

Таблиця 2: А та В мають вказані в таблиці 1 значення, W=C₂H₅; X=C₂H₅; Y=Cl.

Таблиця 3: А та В мають вказані в таблиці 1 значення, W=C₂H₅; X=CH₃; Y=Br.

Таблиця 4: А та В мають вказані в таблиці 1 значення, W=C₂H₅; X=C₂H₅; Y=Br.

Таблиця 5: А та В мають вказані в таблиці 1 значення, W=C₂H₅; X=Br; Y=C₂H₅.

Таблиця 6: А та В мають вказані в таблиці 1 значення, W=C₂H₅; X=Cl; Y=Cl.

Таблиця 7: А та В мають вказані в таблиці 1 значення, W=C₂H₅; X=Cl; Y=Br.

Таблиця 8: А та В мають вказані в таблиці 1 значення, W=C₂H₅; X=Br; Y=Cl.

Таблиця 9: А та В мають вказані в таблиці 1 значення, W=C₂H₅; X=Br; Y=Br.

Таблиця 10: А та В мають вказані в таблиці 1 значення, W=C₂H₅; X=Cl; Y=CH₃.

Таблиця 11: А та В мають вказані в таблиці 1 значення, W=C₂H₅; X=Br; Y=CH₃.

Таблиця 12: А та В мають вказані в таблиці 1 значення, W=C₂H₅; X=H; Y=Cl.

Таблиця 13: А та В мають вказані в таблиці 1 значення, W=C₂H₅; X=H; Y=Br.

Таблиця 14: А та В мають вказані в таблиці 1 значення, $W=CH_3$; $X=CH_3$; $Y=Cl$.

Таблиця 15: А та В мають вказані в таблиці 1 значення, $W=CH_3$; $X=CH_3$; $Y=Br$.

Таблиця 16: А та В мають вказані в таблиці 1 значення, $W=CH_3$; $X=Cl$; $Y=CH_3$.

Таблиця 17: А та В мають вказані в таблиці 1 значення, $W=CH_3$; $X=Br$; $Y=CH_3$.

Таблиця 18: А та В мають вказані в таблиці 1 значення, $W=CH_3$; $X=Cl$; $Y=Cl$.

Таблиця 19: А та В мають вказані в таблиці 1 значення, $W=CH_3$; $X=Cl$; $Y=Br$.

Таблиця 20: А та В мають вказані в таблиці 1 значення, $W=CH_3$; $X=Br$; $Y=Cl$.

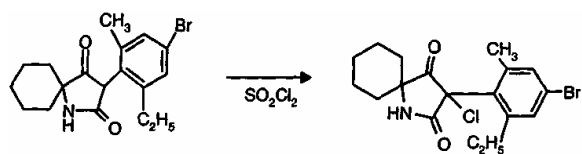
Таблиця 21: А та В мають вказані в таблиці 1 значення, $W=CH_3$; $X=Br$; $Y=Br$.

Таблиця 22: А та В мають вказані в таблиці 1 значення, $W=CH_3$; $X=H$; $Y=Cl$.

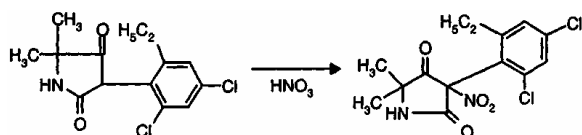
Таблиця 23: А та В мають вказані в таблиці 1 значення, $W=CH_3$; $X=H$; $Y=Br$.

Таблиця 24: А та В мають вказані в таблиці 1 значення, $W=C_3H_7$; $X=Br$; $Y=Br$.

Якщо як вихідну речовину за способом (А) застосовують, наприклад, 3-[(2-етил-4-бром-6-метил)феніл]-5,5-пентаметилепіролідін-2,4-діон, то здійснення способу згідно з винаходом демонструє наведена нижче схема:



Якщо як вихідну речовину за способом (В) застосовують 3-[(2,4-дихлор-6-етил)-феніл]-5,5-диметилпіролідін-2,4-діон, то здійснення способу згідно з винаходом демонструє наведена нижче схема:



Спосіб (А) відрізняється тим, що сполуки формули (II), в якій А, В, Q, W, X та Y мають вказані вище значення, піддають взаємодії в присутності розріджувача та в присутності агента галогенування, а також, в разі необхідності, в присутності джерела радикалу. Як джерело радикалу може, наприклад, бути застосований бензоїлпероксид або азобісізообутиронітрил.

Як розріджувачі при здійсненні способу (А) згідно з винаходом можуть бути застосовані всі інертні органічні розчинники. Перевагу надають вуглеводням, таким як бензол, толуол та ксилол, а також етерам, таким як дибутиловий етер, тетрагідрофуран, діоксан, глікольдиметилловий етер та диглікольдиметилловий етер, та галогенованим вуглеводням, таким як дихлорметан, хлороформ, тетрахлорвуглець, дихлоретан, хлорбензол, дихлорбензол, а також естерам, таким як етилацетат.

Як агенти галогенування при здійсненні способу (А) застосовують, наприклад, сульфурилхлорид, сульфурилбромід, тіонілхлорид, тіонілбромід, іміди, такі як, наприклад, N-бромсукцинімід, N-хлорсукцинімід, хлорсульфонову кислоту, а також гіпохлорити, такі як, наприклад, трет-бутилгіпохлорит.

При здійсненні способу (А) згідно з винаходом реакційні температури можуть коливатися у широкому діапазоні. Загалом робоча температура становить від $-40^{\circ}C$ до $150^{\circ}C$, переважно від $0^{\circ}C$ до $100^{\circ}C$.

Спосіб (А) згідно з винаходом загалом здійснюють при нормальному тиску.

При здійсненні способу (А) згідно з винаходом реакційні компоненти формули (II) та агенти галогенування загалом застосовують у приблизних еквімолярних кількостях. Хоча можливо також один або іншим компонент застосовувати у надлишковій кількості (до 3 моль).

Спосіб (В) відрізняється тим, що сполуки формули (II), в якій А, В, Q, W, X та Y мають вказані вище значення, піддають взаємодії в присутності розріджувача та в присутності агента нітрування.

Як розріджувачі при здійсненні способу (В) згідно з винаходом можуть бути застосовані всі інертні органічні розчинники. Перевагу надають галогенованим вуглеводням, таким як метиленхлорид, хлороформ, дихлорбензол, дихлоретан.

Як агенти нітрування застосовують "нітрувальну суміш", переважно азотну кислоту, що димить.

При здійсненні способу (В) згідно з винаходом реакційні температури можуть коливатися у широкому діапазоні. Загалом робоча температура становить від $-50^{\circ}C$ до $150^{\circ}C$, переважно від $0^{\circ}C$ до $80^{\circ}C$.

Спосіб (В) згідно з винаходом загалом здійснюють при нормальному тиску.

При здійсненні способу (В) згідно з винаходом реакційні компоненти формули (II) та агенти нітрування загалом застосовують у приблизних еквімолярних кількостях. Хоча можливо також один або іншим компонент застосовувати у надлишковій кількості (до 5 моль).

Активні речовини при гарній сумісності з рослинами та сприятливій побічній токсичності по відношенню до теплокровних тварин є придатними для боротьби зі шкідливими тваринами, зокрема комахами, павуками та нематодами, які зустрічаються у сільському господарстві, лісах, при збереженні запасів та захисті матеріалів, а також у побутовому секторі. Дані активні речовини переважно застосовують як засоби захисту рослин. Вони є ефективними по відношенню до звичайних чутливих та стійких видів, а також на всіх або окремих стадіях розвитку. До зазначених вище шкідників належать:

З ряду рівноногі, наприклад, *Oniscus asellus*, *Armadillidium vulgare*, *Porcellio scaber*.

З ряду двопарноногі, наприклад, *Blaniulus guttulatus*.

З ряду губоногі, наприклад, *Geophilus carphagus*, *Scutigera* spp.

3 ряду симфіли, наприклад, *Scutigerella immaculate*.

3 ряду щетинохвостки, наприклад, *Lepisma saccharina*.

3 ряду ногохвостки, наприклад, *Onychiurus armatus*.

3 ряду прямокрилі, наприклад, *Acheta domesticus*, *Gryllotalpa* spp., *Locusta migratoria migratorioides*, *Melanoplus* spp., *Schistocerca gregaria*.

3 ряду таргани, наприклад, *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Leucophaea maderae*, *Blattella germanica*.

3 ряду шкірокрилі, наприклад, *Forficula auricularia*.

3 ряду терміти, наприклад, *Reticulitermes* spp.

3 ряду воші, наприклад, *Pediculus humanus corporis*, *Haematomys* spp., *Linognathus* spp., *Trichodectes* spp., *Damalinia* spp.

3 ряду пuzиреногі, наприклад, *Hercinothrips femoralis*, *Thrips tabaci*, *Thrips palmi*, *Frankliniella occidentalis*.

3 ряду напівжосткокрилі, наприклад, *Eurygaster* spp., *Dysdercus intermedius*, *Piesma quadrata*, *Cimex lectularius*, *Rhodnius prolixus*, *Triatoma* spp.

3 ряду рівнокрилі, наприклад, *Aleurodes brassicae*, *Bemisia tabaci*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Aphis gossypii*, *Brevicoryne brassicae*, *Cryptomyzus ribis*, *Aphis fabae*, *Aphis pomi*, *Eriosoma lanigerum*, *Hyalopterus arundinis*, *Phylloxera vastatrix*, *Pemphigus* spp., *Macrosiphum avenae*, *Myzus* spp., *Phorodon humuli*, *Rhopalosiphum padi*, *Empoasca* spp., *Euscelis bilobatus*, *Nephotettix cincticeps*, *Lecanium corni*, *Saissetia oleae*, *Laodelphax striatellus*, *Nilaparvata lugens*, *Aonidiella aurantii*, *Aspidiotus hederiae*, *Pseudococcus* spp., *Psylla* spp.

3 ряду лузкокрилі, наприклад, *Pectinophora gossypiella*, *Bupalus piniarius*, *Cheimatobia brumata*, *Lithocolletis blancardella*, *Hyponomeuta padella*, *Plutella xylostella*, *Malacosoma neustria*, *Euproctis chrysorrhoea*, *Lymantria* spp., *Bucculatrix thurberiella*, *Phyllocnistis citrella*, *Agrotis* spp., *Euxoa* spp., *Feltia* spp., *Earias insulana*, *Heliothis* spp., *Mamestra brassicae*, *Panolis flammea*, *Spodoptera* spp., *Trichoplusia ni*, *Carpocapsa pomonella*, *Pieris* spp., *Chilo* spp., *Pyrausta nubilalis*, *Ephestia kuehniella*, *Galleria mellonella*, *Tineola bisselliella*, *Tinea pellionella*, *Hofmannophila pseudospretella*, *Cacoecia podana*, *Capua reticulana*, *Choristoneura fumiferana*, *Clysis ambiguella*, *Homona magnanima*, *Tortrix viridana*, *Cnaphalocerus* spp., *Oulema oryzae*.

3 ряду жорсткокрилі, наприклад, *Anobium punctatum*, *Rhizopertha dominica*, *Bruchidius obtectus*, *Acanthoscelides obtectus*, *Hylotrupes bajulus*, *Agelastica alni*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Phaedon cochleariae*, *Oiabrotica* spp., *Psylliodes chrysocephala*, *Epilachna varivestis*, *Atomaria* spp., *Oryzaephilus surinamensis*, *Anthonomus* spp., *Sitophilus* spp., *Otiorrhynchus sulcatus*, *Cosmopolites sordidus*, *Ceuthorrhynchus assimilis*, *Hypera postica*, *Dermestes* spp., *Trogoderma* spp., *Anthrenus* spp., *Attagenus* spp., *Lyctus* spp., *Meligethes aeneus*, *Ptinus* spp., *Niptus hololeucus*, *Gibbium psyllioides*, *Tribolium* spp., *Tenebrio molitor*, *Agriotes* spp., *Conoderus* spp., *Melolontha melolontha*,

Amphimallon solstitialis, *Costelytra zealandica*, *Lissorhoptrus oryzophilus*.

3 ряду перетинчатокрилі, наприклад, *Diprion* spp., *Hoplocampa* spp., *Lasius* spp., *Monomorium pharaonis*, *Vespa* spp.

3 ряду двокрилі, наприклад, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Drosophila melanogaster*, *Musca* spp., *Fannia* spp., *Calliphora erythrocephala*, *Lucilia* spp., *Chrysomya* spp., *Cuterebra* spp., *Gastrophilus* spp., *Hyppobosca* spp., *Stomoxys* spp., *Oestrus* spp., *Hypodermia* spp., *Tabanus* spp., *Tannia* spp., *Bibio hortulanus*, *Oscinella frit*, *Phorbia* spp., *Pegomya hyoscyami*, *Ceratitis capitata*, *Dacus oleae*, *Tipula paludosa*, *Hylemya* spp., *Liriomyza* spp.

3 ряду блохи, наприклад, *Xenopsylla cheopis*, *Ceratophyllus* spp.

3 класу паукоподібні, наприклад, *Scorpio manurus*, *Latrodectus mactans*, *Acarus siro*, *Agras* spp., *Ornithodoros* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Eriophyes ribis*, *Phyllocoptura oleivora*, *Boophilus* spp., *Rhipicephalus* spp., *Amblyomma* spp., *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Sarcoptes* spp., *Tarsonemus* spp., *Bryobia praetiosa*, *Panonychus* spp., *Tetranychus* spp., *Hemitarsonemus* spp., *Brevipalpus* spp.

До фітопаразитарних нематодів належать, наприклад, *Pratylenchus* spp., *Radopholus similis*, *Ditylenchus dipsaci*, *Tylenchulus semipenetrans*, *Heterodera* spp., *Globodera* spp., *Meloidogyne* spp., *Aphelenchoides* spp., *Longidorus* spp., *Xiphinema* spp., *Trichodorus* spp., *Bursaphelenchus* spp.

Спожуки згідно з винаходом, в разі необхідності, у визначеній концентрації або нормі витрати також можуть бути використані як гербіциди та мікробіциди, наприклад, як фунгіциди, протигрибкові агенти та бактерициди. Вони, в разі необхідності, також можуть бути застосовані як проміжні або первинні продукти для синтезу інших активних речовин.

Згідно до винаходом можна обробляти всі рослини та частини рослин. Під рослинами при цьому розуміють всі рослини та популяції рослин, такі як бажані та небажані дикоростучі рослини або культурні рослини (включаючи культурні рослини природного походження). Культурними рослинами можуть бути рослини, які можна одержати звичайними методами культивування та оптимізації або біотехнологічними методами та методами генної інженерії або комбінаціями цих методів, включаючи трансгенні рослини та сорти рослин, що захищаються або не захищаються законом про охорону нових сортів рослин. Під частинами рослин потрібно розуміти всі надземні та підземні частини та органи рослин, як парость, лист, квітка та корінь, причому слід назвати, наприклад, листя, голки, стебла, стовбури, квіти, плоді тіла, плоди та насіння, а також корені, бульби та ризоми. До частин рослин належить зібраний врожай, а також вегетативний та генеративний матеріал для розмноження, наприклад, черешки, бульби, ризоми, відводки та насіння.

Згідно з винаходом обробку рослин та їх частин активними речовинами здійснюють безпосередньо або шляхом впливу на їх оточення,

середовище їх росту або закриті сховище відповідно до звичайних методів обробки, наприклад, шляхом занурення, мілкокрапельного обприскування, випару, створення штучного тумана, розкидання, намазування, а у випадку матеріалу для розмноження, особливо у випадку насіння, шляхом одношарового або багатшарового покриття.

Активні речовини можуть бути перетворені у звичайні препаративні форми, такі як розчини, емульсії, порошки, що змочуються, суспензії, порошки, дуети для запилення, пасти, розчинні порошки, грануляти, концентрати емульсій та суспензій, природні та синтетичні речовини, просочені активною речовиною, а також мікрокапсульовані в полімерні речовини.

Зазначені препаративні форми одержують відомим способом, наприклад, змішуванням активних речовин з розріджувачами, наприклад, рідкими розчинниками, та/або твердими носіями, в разі необхідності, з використанням поверхнево-активних речовин, наприклад, емульгаторів та/або диспергаторів та/або піноутворювачів.

У випадку використання води як розріджувача можуть, наприклад, використовуватися і органічні розчинники як допоміжні засоби, що поліпшують розчинення. Як рідкі розчинники застосовують: ароматичні сполуки, такі як ксилол, толуол, або алкілнафталіни, хлоровані ароматичні сполуки та хлоровані аліфатичні вуглеводні, такі як хлорбензоли, хлоретилени або метиленхлорид, аліфатичні вуглеводні, такі як циклогексан, або парафіни, наприклад, фракції нафти, мінеральні масла та рослинні олії, спирти, такі як бутанол або гліколь, а також їх етери та естери, кетони, такі як ацетон, метилетилкетон, метилізобутилкетон або циклогексанон, сильнополярні розчинники, такі як диметилформамід та диметилсульфоксид, а також воду.

Як тверді носії застосовують:

наприклад, солі амонію та помели природних каменів, такі як каоліни, глиноземи, тальк, крейда, кварц, атапульгіт, монтморилоніт або діатомова земля, та помели синтетичних каменів, такі як вискодисперсна кремнієва кислота, оксид алюмінію та силікати, як тверді носії для гранулятів застосовують: подрібнені та фракціоновані природні кам'яні породи, такі як кальцит, мармур, пемза, сепіоліт, доломіт, а також синтетичні грануляти із неорганічного або органічного борошна, а також грануляти з органічного матеріалу, такого як тирса, шкарлупа кокосових горіхів, кукурудзяні качани та стебла тютюну; як емульгатори та/або піноутворюючі засоби застосовують: наприклад, неіоногенні та аніонні емульгатори, такі як поліоксиетиленовий естер жирної кислоти, поліоксиетиленовий етер жирного спирту, наприклад, алкіларилполігліколевий етер, алкілсульфонати, алкілсульфати, арилсульфонати, а також гідролізати білку; як диспергуючі засоби застосовують: наприклад, відпрацьовані лігнісульфітні луги та метилцеллюлозу.

У перепаративних формах можуть бути застосовані речовини, що поліпшують адгезію, такі як карбоксиметилцелюлоза, природні та

синтетичні порошкоподібні, зернисті або латексоподібні полімери, такі як гуміарабік, полівініловий спирт, полівінілацетат, а також природні фосфоліпіди, такі як кефаліни та лецитини, та синтетичні фосфоліпіди. Іншими добавками можуть бути мінеральні масла та рослинні олії.

Тут також можуть бути застосовувані барвники, такі як неорганічні пігменти, наприклад, оксид заліза, оксид титану, фероціан синій, та органічні барвники, такі як алізарин-, азо- та металфталоціанінові барвники та слідові кількості живильних мікроелементів, такі як солі заліза, марганцю, бору, міді, кобальту, молібдену та цинку.

Рецептури містять, як правило, від 0,1 до 95ваг.% активної речовини, переважно, від 0,5 до 90ваг.% активної речовини.

Активні речовини згідно з винаходом можуть бути застосовані як такі або у своїй препаративній формі змішані з відомими фунгіцидами, бактерицидами, акарицидами, нематоцидами або інсектицидами для розширення спектру дії або запобігання розвитку резистентності. У багатьох випадках при цьому одержують синергічні ефекти, тобто активність суміші є вищою, ніж активність окремих компонентів.

Для змішування застосовують, наприклад, такі сполуки:

Фунгіциди:

Алдиморф, ампропілфос, ампропілфос-калій, андоприм, анілазин, азаконазол, азоксистробін,

беналаксил, беноданіл, беноміл, бензамакріл, бензамакріл-ізобутил, біалафос, бінапакрил, біфеніл, бітертанол, бластицидин-S, бромконазол, бупіримат, бутіобат,

кальцій-полісульфід, капсимицин, каптафол, каптан, карбендазин, карбоксин, карвон, хінометіонат, хлорбензтіазон, хлорфеназол, хлоронекс, хлоропікрин, хлороталоніл, хлоролінат, хлорілакон, куфранекс, цимоксаніл, ципроконазол, ципродиніл, ципрофурам,

дебакарб, дихлорофен, диклбутразол, диклофлуанід, дикломецин, диклоран, діетофенкарб, дифеноконазол, диметиримол, диметоморф, диниконазол, диниконазол-М, динокап, дифеніламін, дипіритіоні, диталіміфос, дитіанон, додеморф, додіні, дразоксолон,

едифенфос, епоксиконазол, етаконазол, етиримол, етридіазол,

фамоксадон, фенапаніл, фенаримол, фенбуконазол, фенфурам, фенітропан, фенпіклоніл, фенпропидин, фенпропіморф, фентинацетат, фентингідроксид, фербам, феримзон, флуазинам, флуметовер, фторомід, флухіноконазол, флурпримідол, флузілазол, флусульфамід, флутоланіл, флутріафол, фолпет, фозетил-алюміній, фозетил-натрій, фталід, фуберидазол, фураксил, фураметпір, фуркарбоніл, фурконазол, фурконазол-цис, фурмецилокс,

гуазатин, гексахлорбензол, гексаконазол, гімексазол, імазаліл, імібенконазол, іміноктадин, іміноктадинеалбесилат,

іміноктадинетриацетат, йодокарб, іпконазол, іпробенфос (ІВР), іпродіон, ірумаміцин, ізопротіолон, ізоваледіон,

касугаміцин, крезоксим-метил, сполуки міді, такі як гідроксид міді, нафтенат міді, оксихлорид міді, сульфат міді, оксид міді, оксин-мідь та бордоска суміш,

манкоппер, манкозеб, манеб, меферимзони, меланіпирим, мепроніл, металаксил, метконазол, метасульфокарб, метфуроксам, метирам, метомеклам, метсульфовакс, мілдіоміцин, миклобутаніл, миклозолін,

диметилдитіокарбамат нікелю, нітротал-ізопропіл, нуаримол,

офурак, оксидиксил, оксамокарб, оксолінікацид, оксикарбоксим, оксифентиін,

паклобутразол, пефуразоат, пенконазол, пенцикурон, фосдифен, пікоксистробін, пімарицин, піпералін, поліоксин, поліоксорим, пробеназол, прохлораз, процимідон, пропамокарб, пропанозин-натрій, пропіконазол, пропінеб, піраклостробін, піразофос, пірифенокс, піриметаніл, пірохілон, піроксифур,

хінконазол, хінтоцен (PCNB),

сірка та сполуки сірки,

тебуконазол, теклофталам, текназен,

тетциклацис, тетраконазол, тіабендазол,

тиціофен, тифлузаміди, тіофанат-метил, тирам,

тіоксимід, толклофос-метил, толілфлуанід,

триадимефон, триадименол, триазбутил,

триазоксид, трихламід, трициклазол, тридеморф,

трифлуксистробін, трифлумізол, трифорин,

тритіконазол,

уніконазол,

валідаміцин А, вінклозолін, вініконазол,

зариламід, зинеб, зирам, а також

Даггер G,

ОК-8705,

ОК-8801,

α -(1,1-диметилетил)- β -(2-феноксietил)-1Н-

1,2,4-триазол-1-етанол,

α -(2,4-дихлорфеніл)- β -фтор-*b*-пропіл-1Н-1,2,4-

триазол-1-етанол,

α -(2,4-дихлорфеніл)- β -метокси-*a*-метил-1Н-

1,2,4-триазол-1-етанол,

α -(5-метил-1,3-діоксан-5-іл)- β -[[4-

(трифторметил)феніл]метилең]-1Н-1,2,4-триазол-

1-етанол,

(5RS,6RS)-6-гідрокси-2,2,7,7-тетраметил-5-

(1Н-1,2,4-триазол-1-іл)-3-октанон,

(Е)-*a*-(метоксиіміно)-N-метил-2-

феноксифенілацетамід,

1-ізопріловийестер{2-метил-1-[[[1-(4-

метилфеніл)етил]аміно]карбоніл]пропіл]-

карбамінової кислоти,

1-(2,4-дихлорфеніл)-2-(1Н-1,2,4-триазол-1-

іл)етанол-О-(фенілметил)оксим,

1-(2-метил-1-нафталеніл)-1Н-пірол-2,5-діон,

1-(3,5-дихлорфеніл)-3-(2-пропеніл)-2,5-

піролідиндіон,

1-[(дийодметил)сульфоніл]-4-метилбензол,

1-[[2-(2,4-дихлорфеніл)-1,3-діоксолан-2-

іл]метил]-1Н-імідазол,

1-[[2-(4-хлорфеніл)-3-фенілоксираніл]метил]-

1Н-1,2,4-триазол,

1-[1-[2-[(2,4-

дихлорфеніл)метокси]феніл]етеніл]-1Н-імідазол,

1-метил-5-ноніл-2-(фенілметил)-3-піролідінол,

2',6'-дибром-2-метил-4'-трифторметокси-4'-

трифторметил-1,3-тіазол-5-карбоксанілід,

2,2-дихлор-N-[1-(4-хлорфеніл)етил]-1-етил-3-

метилциклопропанкарбоксамід,

2,6-дихлор-5-(метилтіо)-4-піримідинілтіоціанат,

2,6-дихлор-N-(4-

трифторметилбензил)бензамід,

2,6-дихлор-N-[[4-

(трифторметил)феніл]метил]бензамід,

2-(2,3,3-трийод-2-пропеніл)-2Н-тетразол,

2-[(1-метилетил)сульфоніл]-5-(трихлорметил)-

1,3,4-тіадіазол,

2-[[6-деокси-4-О-(4-О-метил- β -D-

глікопіраносил)-*a*-D-глюкопіраносил]аміно]-4-

метокси-1Н-піроло[2,3-*с*]піримідин-5-карбонітрил,

2-амінобутан,

2-бром-2-(бромметил)пентендинітрил,

2-хлор-N-(2,3-дигідро-1,1,3-триметил-1Н-інден-

4-іл)-3-піридинкарбоксамід,

2-хлор-N-(2,6-диметилфеніл)-N-

(ізотіоціанатометил)ацетамід,

2-фенілфенол (ОРР),

3,4-дихлор-1-[4-(дифторметокси)феніл]-1Н-

пірол-2,5-діон,

3,5-дихлор-N-[ціано-[(1-метил-2-

пропініл)окси]метил]бензамід,

3-(1,1-диметилпропіл-1-оксо-1Н-інден-2-

карбонітрил,

3-[2-(4-хлорфеніл)-5-етокси-3-

ізоксазолідиніл]піридин,

4-хлор-2-ціано-N,N-диметил-5-(4-метилфеніл)-

1Н-імідазол-1-сульфонамід,

4-метилтетразоло[1,5-*a*]хіназоліх-5(4Н)-он,

8-(1,1-диметилетил)-N-етил-N-пропіл-1,4-

діоксаспіро[4.5]декан-2-метанамін,

8-гідроксихінолінсульфат,

2-[(феніламіно)карбоніл]гідразид 9Н-ксантен-

9-карбоновоїкислоти,

біс-(1-метилетил)-3-метил-4-[(3-

метилбензоіл)окси]-2,5-тіофендикарбоксилат,

цис-1-(4-хлорфеніл)-2-(1Н-1,2,4-триазол-1-

іл)циклогептанол,

цис-4-[3-[4-(1,1-диметилпропіл)феніл-2-

метилпропіл]-2,6-диметилморфолін-гідрохлорид,

етил-[(4-хлорфеніл)азо]ціаноацетат,

гідрокарбонат калію,

натрієва сіль метантетратіолу,

метил 1-(2,3-дигідро-2,2-диметил-1Н-інден-1-

іл)-1Н-імідазол-5-карбоксилат,

метил N-(2,6-диметилфеніл)-N-(5-

ізоксазолілкарбоніл)-DL-аланінат,

метил N-(хлорацетил)-N-(2,6-диметилфеніл)-

DL-аланінат,

N-(2,3-дихлор-4-гідроксифеніл)-1-

метилциклогексанкарбоксамід,

N-(2,6-диметилфеніл)-2-метокси-N-

(тетрагідро-2-оксо-3-фураніл)ацетамід,

N-(2,6-диметилфеніл)-2-метокси-N-

(тетрагідро-2-оксо-3-тієнілу)ацетамід,

N-(2-хлор-4-нітрофеніл)-4-метил-3-

нітробензолсульфонамід,

N-(4-циклогексилфеніл)-1,4,5,6-тетрагідро-2-

піримідинамін,

N-(4-гексил феніл)-1,4,5,6-тетрагідро-2-пиримідинамін,

N-(5-хлор-2-метилфеніл)-2-метокси-N-(2-оксо-3-оксазолідинілу)ацетамід,

N-(6-метокси)-3-піридиніл)циклопропанкарбоксамід,

N-[2,2,2-трихлор-1-[(хлорацетил)аміно]етилу]бензамід, амід N-[3-хлор-4,5-біс-(2-пропінілокси)феніл]-N'-метоксиметаніміду,

натрієва сіль N-форміл-N-гідрокси-DL-аланіну, O,O-діетил-[2-(дипропіламіно)-2-оксоетил]етилфосфорамідодіат,

O-метил-S-феніл-фенілпропілфосфорамідодіат, S-метил-1,2,3-бензотіадізол-7-карботіоат, спіро[2H]-1-бензопіран-2,1'(3'H)-ізобензофуран]-3'-он,

4-[3,4-диметоксифеніл-3-(4-фторфеніл)акрилоїл]морфолін

Бактерициди

бронопол, дихлорофен, нітрапірин, нікель-диметилдитіокарбамат, касугаміцин, октилінон, фуранкарбонова кислота, окситетрациклін, пробеназол, стрептоміцин, теклофталам, сульфат міді та інші сполуки, що містять мідь.

Інсектициди/акарициди/нематоциди

Абамектин, ацефати, ацетаміприд, ацехіноцил, акринатрин, аланікарб, алдікарб, алдоксикарб, альфа-циперметрин, альфаметрин, амітраз, авермектин, AZ 60541, азадирахтин, азаметифос, азинфос А, азинфос М, азоциклотин,

Bacillus popilliae, Bacillus sphaericus, Bacillus subtilis, Bacillus thuringiensis, Baculo віруси, Beauveria bassiana, Beauveria tenella, бендіокарб, бенфуракарб, бенсултап, бензоксимати, бетацифлутрин, біфеназати, біфентрин, біоетанометрин, біоперметрин, бістрифлурон, ВРМС, бромфос А, буфенкарб, бупрофецин, бутатіофос, бутокарбоксим, бутилпіридабен,

кадусафос, карбарил, карбофуран, карбофенотіон, карбосульфат, картап, хлоетокарб, хлоретоксифос, хлорфенапір, хлорфенвінфос, хлофлазулон, хлормефос, хлорпірифос, хлорпірифос М, хловапортрин, хромафенозида, цис-резметрин, цисперметрин, клоцитрин, хлоетокарб, клофентезини, клотіанідини, ціанофос, циклопрени, циклопротрин, цифлутрин, цигалотрин, цигексатин, циперметрин, циромацизи,

дельтаметрин, деметон-М, деметон S, деметон-S-метил, діафентіурон, діазинон, дихлорвос, дикофол, дифлубензулон, диметоат, диметилвінфос, динетофуран, діофенолан, дисульфотон, докзат-натрій, дофенапін, ефлузіланати, емаектин, емпертрин, ендосульфат, Entomophthora spp., есфенвалерати, етіофенкарб, етіон, етопрофос, етофенпрокс, етоксазоли, етримфос,

фенаміфос, феназахін, фенбутатин оксиди, фенітротіон, фенотіокарб, феноксакрим, феноксикарб, фенпропатрин, фенпірад, фенгіритрин, фенгіпроксимати, фенвалерати, фіпроніл, флуазинам, флуазурон, флуброцитринати, флуциклоксурон, флуцитринати, флуфеноксурон, флуметрин,

флутензини, флувалінати, фонофос, фосметилан, фостіазати, фубфенпрокс, фураціокарб,

гранулоподібі віруси, галофенозида, HCH, гептенофос, гексафлумурон, гексилтіазокс, гідропрени, імідаклопрід, індоксикарб, ізазофос, ізофенфос, ізоксатіон, івермектин, віруси поліедроза,

ламбда-цигатурин, луфенурон, малатіон, мекарбам, металдегід, метамідофос, Metharhizium anisopliae, Metharhizium flavoviride, метидатіон, метіокарб, метопрени, метоміл, метоксифенозида, метолкарб, метоксидіазони, мевінфос, мілбемектин, мілбеміцин, монокротофос,

налед, нитенпірам, нитіазини, новалурон, ометоат, оксаміл, оксидеметон М,

Raecilomyces fumosoroseus, паратіон А, паратіон М, перметрин, фентоат, форат, фозалони, фозмет, фосфамідон, фоксим, піримікарб, піриміфос А, піриміфос М, профенофос, промекарб, пропаргіти, пропексур, протіофос, протоат, піметрозини, піраклофос, пірезметрин, піретрум, піридабен, піридатіон, піримідифен, пірипроксифен,

хіналфос, рибавірин, салітін, себуфос, силафлуофен, спіносад, спіродиклофен, сульфотеп, сулпрофос,

тау-флувалінати, тебуфенозида, тебуфенпірад, тебупіриміфос, тефлубензулон, тефлутрин, темефос, темівінфос, тербуфос, тетрахлорвінфос, тетрадифон, тета-циперметрин, тіаклопрід, тіаметоксам, тіапроніл, тіатрифос, тіоциклам гідрооксалати, тіодикарб, тіофанокс, турінгієнсин, тралоцитрин, тралометрин, триаратени, триазамати, триазофос, триазурон, трихлорфенідини, трихлорфон, трифлумурон, триметакарб,

вамідотіон, ваніліпроли, Verticillium lecanii, YI 5302,

зета-циперметрин, золапрофос, (1R-цис)-[5-(фенілметил)-3-фураніл]-метил-3-

[(дигідро-2-оксо-3(2H)-фураніліден)метил]-2,2-диметилциклопропанкарбоксилат,

(3-феноксифеніл)-метил-2,2,3,3-тетраметилциклопропанкарбоксилат,

1-[(2-хлор-5-тіазоліл)метил]тетрагідро-3,5-диметил-N-нітро-1,3,5-триазин-2(1H)-імін,

2-(2-хлор-6-фторфеніл)-4-[4-(1,1-диметилетил)феніл]-4,4-дигідрооксазол,

2-(ацетилокси)-3-додецил-1,4-нафталіндіон, 2-хлор-N-[[[4-(1-

фенілетокси)феніл]аміно]карбонілу]бензамід, 2-хлор-N-[[[4-(2,2-дихлор-1,1-

дифторетокси)феніл]аміно]карбонілу]бензамід, 3-метилфенілпропілкарбамат,

4-[4-(4-етоксифеніл)-4-метилпентил]-1-фтор-2-феноксibenзол,

4-хлор-2-(1,1-диметилетил)-5-[[2-(2,6-диметил-4-феноксифенокс)етил]тіо]-3(2H)піридазинон,

4-хлор-2-(2-хлор-2-метилпропіл)-5-[(6-йод-3-піридиніл)метокси]-3(2H)піридазинон,

4-хлор-5-[(6-хлор-3-піридиніл)метокси]-2-(3,4-дихлорфеніл)-3(2H)піридазинон,

Bacillus thuringiensis лінія EG-2348,

[2-бензоїл-1-(1,1-диметилетил)]гідразид
бензойної кислоти,
2,2-диметил-3-(2,4-дихлорфеніл)-2-оксо-1-
оксаспіро[4,5]дец-3-ен-4-іловий естер бутанової
кислоти,
[3-[(6-хлор-3-піридиніл)метил]-2-
тіазолидиніліден]ціанамід,
дигідро-2-(нітрометилен)-2Н-1,3-тіазин-3(4Н)-
карбоксальдегід,
етил [2-[[1,6-дигідро-6-оксо-1-(фенілметил)-4-
піридазиніл]окси]етил]карбамат,
N-(3,4,4-трифтор-1-оксо-3-бутеніл)гліцин,
N-(4-хлорфеніл)-3-[4-(дифторметокси)феніл]-
4,5-дигідро-4-феніл-1Н-піразол-1-карбоксамід,
N-[(2-хлор-5-тіазоліл)метил]-N'-метил-N"-
нітрогуанідин,
N-метил-N'-(1-метил-2-пропеніл)-
1,2-гідразиндикарботіоамід,
N-метил-N'-2-пропеніл-1,2-
гідразиндикарботіоамід,
О,О-діетил-[2-(дипропіламіно)-2-
оксоетил]етилфосфорамідотіоат,
N-ціанометил-4-трифторметилнікотинамід,
3,5-дихлор-1-(3,3-дихлор-2-пропенілокси)-4-[3-
(5-трифторметилпіридин-2-ілокси)-
пропокси]бензол.

Можливо також є суміш з іншими відомими активними речовинами, такими як гербіциди, або з добривами та регуляторами росту рослин.

Крім того активні речовини при використанні як інсектициди можуть бути представлені у своїх комерційно доступних препаративних формах, а також формах, одержаних з таких препаративних форм у суміші із синергічними агентами. Синергічними агентами є сполуки, завдяки яким підвищується ефективність активних речовин, причому сам застосовуваний синергічний агент не проявляє активність.

Вміст активних речовин у формах, отриманих з комерційно доступних препаративних форм, можна варіювати в широких межах. Концентрація активних речовин в препаративних формах може становити від 0,0000001 до 95ваг.% активної речовини, переважно від 0,0001 до 1ваг.%.

Застосування відбувається звичайним способом, що підходить для таких форм.

При застосуванні проти побутових шкідників та шкідників запасів активна речовина відрізняється сильною залишковою дією на деревах та глині, а також високою стабільністю по відношенню до лугів на вапнованих основах.

Як вже було зазначене вище, згідно з винаходом можливо обробляти всі рослини або їх частини. У переважному варіанті виконання винаходу обробляють дикоростучі види та сорти рослин або види та сорти рослин, а також їх частини, одержані за умов біологічного розведення, наприклад, схрещування або злиття протопластів. В іншому переважному варіанті виконання обробляють трансгенні рослини та сорти рослин, одержані методами генної інженерії, в разі необхідності, у комбінації зі звичайними методами (генетично модифіковані організми) та їх частини. Поняття "частини" або "частини рослин" або "органи рослин" було пояснене вище.

Найбільш переважно згідно з винаходом обробляють рослини комерційно доступних або звичайно використовуваних сортів. Під сортами рослин розуміють рослини з новими властивостями (ознаками), що одержують розведенням, мутагенезом або рекомбінантними методиками ДНК. Це можуть бути сорти, біотиби та генотипи.

Залежно від виду або сорту рослин, їх місцезнаходження та умов росту (фунт, клімат, період вегетації, харчування) в результаті обробки згідно з винаходом можуть спостерігатися нададитивні («синергічні») ефекти. Так, наприклад, можливе зниження кількості застосовуваних речовин та/або розширення спектру дії, та/або посилення дії речовин та засобів, застосовуваних згідно з винаходом, покращення росту рослин, підвищення толерантності по відношенню до високих або низьких температур, підвищення толерантності по відношенню до браку вологи або до вмісту солей у воді або у ґрунті, підвищення продуктивності при цвітінні, полегшення збору врожаю, прискорення дозрівання, більш високий врожай, більш висока якість та/або більш висока поживність продуктів врожаю, краще збереження та/або краща перероблюваність продуктів врожаю, що виходять за межі власне очікуваних ефектів.

До переважних трансгенних (отриманих з використанням генних технологій) рослин або сортів рослин, які підлягають обробці, згідно з винаходом належать всі рослини, що одержали генетичний матеріал при модифікації за генною технологією, який додав цим рослинам особливо вигідних властивостей. Прикладами таких властивостей є кращий ріст рослин, підвищена толерантність по відношенню до високих або низьких температур, підвищена толерантність до браку вологи або до вмісту солей у воді або у ґрунті, підвищена продуктивність при цвітінні, полегшення збору врожаю, прискорення дозрівання, більш високий врожай, більш висока якість та/або більш висока поживність продуктів врожаю, краще збереження та/або краща перероблюваність продуктів врожаю. Іншими та особливо вигідними прикладами таких властивостей є підвищена стійкість рослин до тваринних шкідників та мікробів, таким як комахи, кліщі, патогенні для рослин грибки, бактерії та/або віруси, а також підвищена толерантність рослин до певних гербіцидних активних речовин. Прикладами трансгенних рослин особливо переважно є важливі культурні рослини, такі як зернові (пшениця, рис), кукурудза, соя, картопля, бавовна, рапс, а також фруктові рослини (з плодами яблук, груш, плодами цитрусових та винограду), причому особливу перевагу надають кукурудзі, сої, картоплі, бавовні та рапсу. Як властивостям особливу перевагу надають підвищеній стійкості рослин до комах у зв'язку з токсинами, що утворюються в рослинах, особливо таким, які створюються за допомогою генетичного матеріалу з *Bacillus Thuringiensis* (наприклад, за допомогою ген *CryIA(a)*, *CryIA(b)*, *CryIA(c)*, *CryIIA*, *CryIIIa*, *CryIIIb2*, *Cry9c*, *Cry2Ab*, *Cry3Bb* та *CryIF*, а також їх комбінацій) у рослинах (надалі "Бт.

рослини"). Як властивостям особливу перевагу надають також підвищеній стійкості рослин по відношенню до грибків, бактерій та вірусів завдяки набутій системній стійкості (SAR), системіну, фітоалексину, еліціторам, а також генам резистентності та відповідно експериментованим протеїнам та токсинам. Крім того до особливо переважних властивостей належать також підвищена толерантність рослин по відношенню до певних гербіцидно активних речовин, наприклад, імідазолінів, сульфонілкарбамідів, гліфозатів або фосфінотрицину (наприклад, "PAT"-ген). Гени, що забезпечують бажані властивості, можуть зустрічатися в трансгених рослинах та в комбінаціях між собою. Як приклади "Бт. рослин" можна назвати сорти кукурудзи, бавовни, сої та картоплі, що наявні у продажу під торговельними марками YIELD GARD® (наприклад, кукурудза, бавовна, соя), KnockOut® (наприклад, кукурудза), StarLink® (наприклад, кукурудза), Bollgard® (бавовна), Nucotn® (бавовна) та NewLeaf® (картопля). Прикладами толерантних до гербіцидів рослин є сорти кукурудзи, сорти бавовни та сорти сої, що наявні у продажу під торговельними марками Roundup Ready® (толрантність по відношенню до гліфозату, наприклад, кукурудза, бавовна, соя), Liberty Link® (толрантність по відношенню до фосфінотрицину, наприклад, рапс), IMI® (толрантність по відношенню до імідазолінонів) та STS® (толрантність по відношенню до сульфонілкарбамідів, наприклад, кукурудза). Стійкими до гербіцидів (традиційно вирощуваними як толрантні до гербіцидів) рослинами є сорти, наявні у продажу під назвою Clearfield® (наприклад, кукурудза). Зрозуміло, що ці висловлювання справедливі і для сортів рослин, що будуть створені в майбутньому, або які в майбутньому потраплять на ринок, з цими або в майбутньому створеними генетичними властивостями.

Особливо переважно рослини згідно з винаходом можуть бути оброблені сполуками загальної формули (I) або сумішами активних речовин згідно з винаходом. Вищевказані області переважних значень активних речовин або їх сумішей також використовують для обробки таких рослин. Найбільш переважно обробку рослин проводять спеціально зазначеними в запропонованому тексті сумішами.

Активні речовини згідно з винаходом є ефективними не тільки у боротьбі зі шкідниками рослин, побутовими шкідниками та шкідниками запасів, а також у ветеринарному секторі проти тваринних паразитів (ектопаразитів), таких як пасовищні кліщі, шкірні кліщі, коростяві кліщі, краснотілки, мухи (які жалять та які лижуть), паразитуючі личинки мух, воші, власодіди, пухоїди та блохи. До таких паразитів належать:

З ряду воші, наприклад, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phtirus* spp., *Solenopotes* spp.

З ряду пухоїди та підряду *Amblycerina*, а також *Ischnocera*, наприклад, *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp.,

Wemeckiella spp., *Lepikentron* spp., *Damalina* spp., *Trichodectes* spp., *Felicola* spp.

З ряду двокрилі та підряду довговусі, а також коротковусі, наприклад, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Simulium* spp., *Eusimulium* spp., *Phlebotomus* spp., *Lutzomyia* spp., *Culicoides* spp., *Chrysops* spp., *Hybomitra* spp., *Atylotus* spp., *Tabanus* spp., *Haematopota* spp., *Philipomyia* spp., *Braula* spp., *Musca* spp., *Hydrotaea* spp., *Stomoxys* spp., *Haematobia* spp., *Morellia* spp., *Fannia* spp., *Glossina* spp., *Calliphora* spp., *Lucilia* spp., *Chrysomyia* spp., *Wohlfahrtia* spp., *Sarcophaga* spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Gasterophilus* spp., *Hippobosca* spp., *Lipoptena* spp., *Melophagus* spp.

З ряду блохи, наприклад, *Pulex* spp., *Ctenocephalides* spp., *Xenopsylla* spp., *Ceratophyllus* spp.

З ряду напівжорсткокрилі, наприклад, *Cimex* spp., *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus* spp.

З ряду таргани, наприклад, *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blattella germanica*, *Supella* spp.

З підкласу акариформні (акароїдні) та ряду мета-, а також мезостигматичних кліщів, наприклад, *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Otobius* spp., *Ixodes* spp., *Amblyomma* spp., *Boophilus* spp., *Dermacentor* spp., *Haemophysalis* spp., *Hyalomma* spp., *Rhipicephalus* spp., *Dermanyssus* spp., *Raillietia* spp., *Pneumonyssus* spp., *Stenostoma* spp., *Varroa* spp.

З ряду тромбідіформних кліщів *Actiniedida* (*Prostigmata*) та *Acaridida* (*Astigmata*), наприклад, *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Omithocheyletia* spp., *Myobia* spp., *Psorergates* spp., *Demodex* spp., *Trombicula* spp., *Listrophorus* spp., *Acarus* spp., *Tyrophagus* spp., *Caloglyphus* spp., *Hypodectes* spp., *Pterolichus* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Otodectes* spp., *Sarcoptes* spp., *Notoedres* spp., *Knemidocoptes* spp., *Cytodites* spp., *Laminosioptes* spp.

Запропоновані згідно з даним винаходом активні речовини формули (I) є придатними для боротьби з членистоногими, що вражають сільськогосподарську худобу, наприклад, велику рогату худобу, овець, кіз, коней, свиней, віслуків, верблюдів, буйволів, кроликів, курей, індичок, качок, гусей, бджіл, та інших домашніх тварин, наприклад, таких як собаки, кішки, кімнатні птахи, акваріумні риби, а також так званих піддослідних тварин, таких як, наприклад, хом'ячки, морські свинки, пацюки та миші. Боротьба з такими членистоногими приводить до скорочення летальних випадків та підвищення продуктивності (по риби, молоку, вовні, шкірі, яйцях, меду і т.д.), таким чином, завдяки застосуванню запропонованих згідно з даним винаходом активних речовин можливе більш економне та просте утримання тварин.

Застосування активних речовин згідно з винаходом відбувається у ветеринарній практиці відомими способами ентерально, наприклад, у формі таблеток, капсул, напоїв, просочень, гранулятів, паст, пігулок, з їжею, пелюсток, парентерально, наприклад, при ін'єкціях (внутрішньом'язових, з катетором,

внутрішньовенно, внутрішньоперитонально та ін.), у вигляді імплантатів, при введенні в ніс, при дермальному застосуванні, наприклад, зануренням або купанням, обприскуванням, обливанням зверху, миттям, напудрюванням, а також за допомогою формованих засобів, що містять активні речовини, таких як нашійники, вушні марки, хвостові марки, стрічки на різних частинах тіла, пов'язки, пристрої для маркування і т.д.

При застосуванні для худоби, птахів, домашніх тварин і т.д. можна використовувати активні речовини формули (I) у вигляді препаративних форм (наприклад, порошків, емульсій, засобів, що течуть), які містять активні речовини в кількості від 1 до 80ваг.%, безпосередньо або після 100- - 10000-кратного розведення або використовувати у вигляді хімічної лазні.

Крім того з'ясували, що сполуки згідно з винаходом мають високу інсектицидну активність проти комах, що руйнують технічні матеріали.

Як приклад та переважно, але при цьому не обмежуючи винаходу, слід назвати такі комахи:

жуки, такі як

Hylotrupes bajulus, *Chlorophorus pilosis*, *Anobium punctatum*, *Xestobium rufovillosum*, *Ptilinus pecticornis*, *Dendrobium pertinex*, *Emobius mollis*, *Priobium carpini*, *Lyctus brunneus*, *Lyctus africanus*, *Lyctus planicollis*, *Lyctus linearis*, *Lyctus pubescens*, *Trogoxylon aequale*, *Minthes rugicollis*, *Xyleborus spec.*, *Tryptodendron spec.*, *Apate monachus*, *Bostrychus capucinus*, *Heterobostrychus brunneus*, *Sinoxylon spec.*, *Dinoderus minutus*,

перетинчастокрилі, такі як

Sirex juvencus, *Urocerus gigas*, *Urocerus gigas taignus*, *Urocerus augur*,

терміти, такі як

Kaloterms flavicollis, *Cryptotermes brevis*, *Heterotermes indicola*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes santonensis*, *Reticulitermes lucifugus*, *Mastotermes darwiniensis*, *Zootermopsis nevadensis*, *Coptotermes formosanus*,

щетинохвости, такі як *Lepisma saccharina*.

Під технічними матеріалами у даному контексті слід розуміти неживі матеріали, такі як переважно пластмаси, клейкі речовини, глини, папір та картон, шкіра, деревина, продукти переробки деревини та лакофарбові матеріали.

Особливо переважно мова йде про захисні матеріали від нападу комах для захисту деревини та продуктів переробки деревини.

Під деревиною та продуктами переробки деревини, що можуть бути захищені засобами згідно з винаходом або сумішами, що містять ці засоби, слід, наприклад, розуміти:

будівельний ліс, дерев'яні балки, залізничні шпали, деталі мостів, корабельні перегородки, дерев'яні вози, ящики, піддони, контейнери, телефонні стовпи, дерев'яне облицювання, дерев'яні вікна та двері, фанеру, кріпильні плити, столярні вироби або продукти з дерева, що, як правило, знаходять застосування в житловому будівництві та у будівельних столярних роботах.

Активні речовини можуть бути використані як самостійно, у вигляді концентратів або звичайно застосовуваних препаративних форм, таких як

порошки, грануляти, розчини, суспензії, емульсії або пасту.

Названі препаративні форми можуть бути виготовлені відомими способами, наприклад, при змішуванні активних речовин із щонайменше одним розчинником або розріджувачем, емульгатором, диспергатором та/або зв'язуючим або фіксуючим засобом, водовідштовхувальним засобом, в разі необхідності, сикативами та УФ-стабілізаторами та, в разі необхідності, барвниками та пігментами, а також іншими допоміжними засобами для обробки.

Інсектицидні засоби або концентрати, застосовувані для захисту деревини та виробів з деревини, містять активну речовину згідно з винаходом у концентрації від 0,0001 до 95ваг.%, переважно, від 0,001 до 60ваг.%.

Кількість застосовуваних засобів або концентратів залежить від виду та походження комах та від середовища їх розповсюдження. Оптимальна витратна кількість при застосуванні може бути визначена за допомогою ряду тестувань. Як правило, достатньо застосовувати від 0,0001 до 20ваг.%, переважно, від 0,001 до 10ваг.% активної речовини, в залежності від матеріалу, що підлягає захисту.

Як розчинник та/або розріджувач застосовують органічний хімічний розчинник або суміш розчинників та/або масляний або олієподібний поганолеткий органічний хімічний розчинник або суміш розчинників, та/або полярний органічний хімічний розчинник або суміш розчинників, та/або воду та, а разі необхідності, емульгатор та/або змочувальну речовину.

Як органічні хімічні розчинники застосовують переважно масляні або олієподібні розчинники з коефіцієнтом летючості вище 35 та температурою спалаху понад 30°C, переважно, понад 45°C. Як поганолеткі нерозчинні у воді масляні та олієподібні розчинники застосовують відповідні нафти або їх фракції, що містять ароматичні сполуки, або суміші розчинників, що містять нафти, переважно, тестбензин, керосин та/або алкілбензол.

Перевагу при застосуванні надають нафтам з температурою кипіння в межах від 170 до 220°C, тестбензину з температурою кипіння від 170 до 220°C, веретенному маслу з температурою кипіння від 250 до 350°C, керосину або ароматичним сполукам з температурою кипіння від 160 до 280 °C, терпентинолу і т.п.

В одній із переважних форм виконання винаходу використовують рідкі аліфатичні вуглеводні з температурою кипіння в межах від 180 до 210°C або висококиплячі суміші ароматичних та аліфатичних вуглеводнів з температурою кипіння від 180 до 220°C та/або веретенну олію, та/або монохлорнафталін, переважно, α -монохлорнафталін.

Органічні поганолеткі масляні або олієподібні розчинники з коефіцієнтом летючості понад 35 та температурою спалаху вище 30°C, переважно вище 45°C, можуть бути частково замінені легко- або середньолеткими органічними хімічними розчинниками за умови, що суміш розчинників також буде мати коефіцієнт летючості понад 35 та

температуру спалаху вище 30°C, переважно вище 45°C, та що суміш інсектицид-фунгіцид може бути розчинена або емульгована у цій суміші розчинників.

В одній з переважних форм виконання частину органічного хімічного розчинника або суміші розчинників заміняють на аліфатичний полярний органічний хімічний розчинник або суміш розчинників. Переважно застосовують аліфатичні органічні хімічні розчинники, що містять гідроксильні та/або естерні, та/або етерні групи, як, наприклад, гліколевий етер, естер або тому подібні.

Як органічні хімічні зв'язувальні речовини в рамках даного винаходу застосовують відомі здатні до розведення водою та/або розчинення у використовуваних органічних хімічних розчинниках або диспергування або емульгування штучні смоли та/або олії, що висихають, зокрема зв'язувальні речовини, що складаються з або містять акрилову смолу, вінілову смолу, наприклад, полівінілацетат, поліестерну смолу, поліконденсаційну смолу або смолу, отримана при поліприєднанні, поліуретанову смолу, алкідну смолу або модифіковану алкідну смолу, фенольну смолу, вуглеводну смолу, таку як інденокумаронова смола, силіконову смолу, рослинні олії, що висихають, та/або масла, що висихають, та/або зв'язувальні речовини, що фізично висихають, на основі природних та/або штучних смол.

Як зв'язувальну речовину застосовують штучні смоли у вигляді емульсії, дисперсії або розчину. Як зв'язувальні речовини застосовують також бітуми або бітумінозні речовини до 10ваг.%. Додатково використовують відомі барвники, пігменти, водовідштовхувальні матеріали, речовини, що коригують запах, та інгібітори або засоби захисту від корозії і т.п.

Як органічні хімічні зв'язувальні речовини засіб або концентрат згідно з винаходом містить переважно щонайменше одну алкідну смолу або модифіковану алкідну смолу та/або рослинну олію, що висихає. Переважно згідно з винаходом застосовують алкідні смоли із вмістом олії більше 45ваг.%, переважно від 50 до 68ваг.%.

Згадана зв'язувальна речовина може бути повністю або частково замінена фіксуючим засобом (сумішшю) або пластифікатором (сумішшю). Ці добавки повинні запобігати випаровуванню активних речовин, а також кристалізації або осадженню. Вони переважно замінюють від 0,01 до 30% зв'язувальної речовини (у перерахуванні на 100% використаної зв'язувальної речовини).

Пластифікатори вибирають з хімічних класів естерів фталевих кислот, таких як дибутил-, діоктил- або бензилбутилфталат, естерів фосфорних кислот, таких як трибутилфосфат, естерів адипінової кислоти, таких як ді-(2-етилгексил)адипінат, стеаратів, таких як бутилстеарат або амілстеарат, олеатів, таких як бутилолеат, гліцеринових етерів або високомолекулярних гліколевих етерів, гліцеринових естерів, а також естерів п-толуолсульфонової кислоти.

Фіксуючі засоби містять полівінілалкілові етери, як, наприклад, полівінілметилловий етер, або кетони, такі як бензофенон, етиленбензофенон.

Як розчинники або розріджувачі мають на увазі зокрема воду, в разі необхідності, у суміші з одним або кількома згаданими вище органічними хімічними розчинниками або розріджувачами, емульгаторами та диспергаторами.

Особливо ефективний захист деревини досягається промисловим просочуванням, наприклад, за допомогою вакууму, подвійного вакууму або під тиском.

Готові до застосування засоби можуть, в разі необхідності, містити ще й інші інсектициди та, в разі необхідності, ще один або кілька фунгіцидів.

Як додаткові добавки можуть бути використані інсектициди та фунгіциди, описані у міжнародній заявці на [патент WO 94/29268]. Сполуки, зазначені в даній заявці, є визначеними складовими запропонованого винаходи.

Найбільш переважними добавками можуть бути інсектициди, такі як хлорпірифос, фоксим, силафлуофін, альфаметрин, цифлутрин, циперметрин, дельтаметрин, перметрин, імідаклопрід, NI-25, флуфеноксурон, гексафлумурон, трансфлутрин, тіаколорид, метоксифеноксид та трифлумурон,

а також фунгіциди, такі як епоксиконазоли, гексаконазоли, азаконазоли, пропіконазоли, тебуконазоли, ципроконазоли, метконазоли, імазаліл, дихлорфлуанід, толілфлуанід, 3-йод-2-пропілбутилкарбамат, N-октилізотіазолін-3-он та 4,5-дихлор-N-октилізотіазолін-3-он.

Одночасно комбінації активних речовин згідно з винаходом можуть бути застосовані для захисту від обростання предметів, особливо таких, як корпуси кораблів, фільтри, мережі, будівельні споруди, пірси та сигнальні пристрої, що торкаються морської або баластової води.

Обростання осілими *Oligochaete*, такими як вапняні трубачики, а також черепашками та видами групи *Ledamorph* (утокові черепашки), такими як різні види *Lepas* та *Scalpellum*, або видами групи *Balanomorph* (морська віспа), такими як *Balanus*-або *Pollicipes-Species*, підвищує опір тертя кораблів та в результаті призводить до підвищених витрат енергії та, крім того, внаслідок тривалого перебування в сухих доках до зростання експлуатаційних витрат.

Поряд із обростанням водоростями, наприклад, *Ectocarpus* sp. та *Ceramium* sp., набуває особливого значення обростання осілими ентомостраковими групами, що об'єднані під назвою *Cirripedia* (вусикові річкові раки).

Несподівано виявили, що самі сполуки згідно з винаходом або у комбінації з іншими активними речовинами проявляють дуже високу активність проти обростання.

При застосуванні сполук згідно з винаходом або їх комбінацій з іншими активними речовинами можна відмовитись від використання сполук, що містять важкі метали, таких як, наприклад, біс(триалкілово)сульфіди, три-н-бутилоловолаурат, три-н-бутилоловохлорид, оксид міді (I), триетилоловохлорид, три-н-бутил(2-

феніл-4-хлорфенокси)олово, оксид трибутилолова, молібдендисульфід, оксид миш'яку, полімерний бутилтитанат, феніл-(біспіридин)вісмутхлорид, три-н-бутиловофторид, марганецьетилен-біс-тіокарбамат, цинкдиметилдитіокарбамат, цинкетилен-біс-тіокарбамат, цинкові та мідні солі 2-піридинтіол-1-оксиду, біс-диметилдитіокарбамоїл-цинкетилен-біс-тіокарбамат, оксид цинку, етилен-біс-дитіокарбамат міді (I), тіоціанат міді, нафтенат міді та галогеніди трибутил-олова, або значно зменшити концентрації цих сполук.

Готові до застосування фарби при обростання можуть, в разі необхідності, містити ще й інші активні речовини, переважно, альгіциди, фунгіциди, гербіциди, моллюскоциди або інші активні речовини проти обростання.

Придатними складовими в комбінації засобів проти обростання згідно з винаходом є:

альгіциди, такі як

2-трет-бутиламіно-4-циклопропіламіно-6-

метилтіо-1,3,5-триазин, дихлорофен, діурон, ендотал, фентіацетат, ізопротурон, метабензтіазурон, оксифторфен, хінокламін та тербутрин;

фунгіциди, такі як

SS-діоксид циклогексиламід

бензо[*b*]тіофенкарбонової кислоти, дихлофлуанід, фторфольпет, 3-йод-2-пропінілбутилкарбамат, толілфлуанід, та азоли, такі як

азаконазоли, ципроконазоли, епоксиконазоли, гексаконазоли, метконазоли, пропіконазоли та тебуконазоли;

моллюскоциди, такі як

фентіацетат, метальдегід, метіокарб,

ніклозамід, тіодикарб та триметакарб;

або звичайні активні речовини проти обростання, такі як

4,5-дихлор-2-октил-4-ізотіазолін-3-он,

дийодметилпаратрилсульфон, 2-(*N,N*-диметилтіокарбамоїлтіо)-5-нітротіазил, калієві, мідні, натрієві та цинкові солі 2-піридинтіол-1-оксиду, піридинтрифенілборан, тетрабутилдиетанноксан, 2,3,5,6-тетрахлор-4-(метилсульфоніл)піридин, 2,4,5,6-тетрахлорізофталонітрил, тетраметилтіурам-дисульфід та 2,4,6-трихлорфенілмалеїнімід.

Застосовувані засоби проти обростання містять активну речовину у сполуках згідно з винаходом у концентрації від 0,001 до 50 ваг.%, переважно, від 0,01 до 20 ваг.%.

Крім того засоби проти обростання згідно з винаходом містять звичайні компоненти, які описані, наприклад, у [Ungerer, Chem. Ind., 1985, 37, 730-732 та Williams, Antifouling Marine Coatings, Noyes, Park Ridge, 1973].

Лакофарбові матеріали проти обростання поряд з альгіцидними, фунгіцидними, моллюскоцидними та інсектицидними активними речовинами згідно з винаходом містять також зв'язувальні речовини.

Прикладами часто застосовуваних зв'язувальних речовин є полівінілхлорид у системі розчинників, хлорований каучук у системі розчинників, акрилові смоли в системі розчинників,

особливо у водній системі, вінілхлорид/вінілацетат співполімерні системи у формі водних дисперсій або у формі систем органічних розчинників, бутадієн/стирол/акрилонітрилові каучуки, олії, що висихають, такі як олія льону, естери смол або модифіковані тверді смоли в комбінації з дьогтем або з бітумом, асфальт, а також епоксисполуки, невеликі кількості хлоркаучука, хлорований поліпропілен та вінілові смоли.

В разі необхідності, лакофарбові матеріали містять також неорганічні пігменти, органічні пігменти або барвники, що є переважно нерозчинними в морській воді. Крім того лакофарбові матеріали можуть містити колофоніум для створення можливості керованого вивільнення активних речовин. Лакофарбові матеріали можуть також містити пом'якшувачі, що модифікують засоби, які впливають на реологічні властивості, а також інші звичайні компоненти. У самополірувальній системі проти обростання можуть також бути використані сполуки згідно з винаходом або вказані вище суміші.

Активні речовини придатні також для боротьби з тваринними шкідниками, особливо з комахами, павукоподібними та кліщами, що живуть у замкнутому просторі, наприклад, квартирах, фабричних цехах, бюро, кабінах автомобілів та інших. Вони можуть бути застосовані для боротьби з цими шкідниками окремо або в комбінації з іншими активними та допоміжними речовинами, які використовують у інсектицидних продуктах для домашнього господарства. Вони є ефективними проти чутливих та стійких видів, а також проти всіх стадій розвитку. До цих шкідників належать:

3 ряду скорпіони, наприклад, *Buthus occitanus*.

3 ряду кліщі, наприклад, *Argas persicus*, *Argas reflexus*, *Bryobia* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Glyciphagus domesticus*, *Ornithodoros moubat*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Trombicula alfreddugesi*, *Neutrombicula autumnalis*, *Dermatophagoides pteronissimus*, *Dermatophagoides farinae*.

3 ряду павуки, наприклад, *Aviculariidae*, *Araneidae*.

3 ряду сінококси, наприклад, *Pseudoscorpiones chelifer*, *Pseudoscorpiones cheiridium*, *Opiliones phalangium*.

3 ряду рівноногі, наприклад, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*.

3 ряду двопарноногі, наприклад, *Blanius guttulatus*, *Polydesmus* spp.

3 ряду губоногі, наприклад, *Geophilus* spp.

3 ряду щетинохвости, наприклад, *Ctenolepisma* spp., *Lepisma saccharina*, *Lepismodes inquilinus*.

3 ряду таргани, наприклад, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Blattella ashinae*, *Leucophaea maderae*, *Panchlora* spp., *Parcoblatta* spp., *Periplaneta australasiae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Supella longipalpa*.

3 ряду прямокрилі, наприклад, *Acheta domesticus*.

3 ряду шкірнокрилі, наприклад, *Forficula auricularia*.

3 ряду терміти, наприклад, *Kaloterms* spp., *Reticulites* spp.

3 ряду сіноїди, наприклад, *Lepinatus* spp., *Liposcelis* spp.

3 ряду жорсткокрилі, наприклад, *Anthrenus* spp., *Attagenus* spp., *Dermeestes* spp., *Latheticus oryzae*, *Necrobia* spp., *Ptinus* spp., *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus granaries*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Stegobium paniceum*.

3 ряду двокрилі, наприклад, *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes taeniorhynchus*, *Anopheles* spp., *Calliphora erythrocephala*, *Chrysosona pluvialis*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex pipiens*, *Culex tarsalis*, *Drosophila* spp., *Fannia canicularis*, *Musca domestica*, *Phlebotomus* spp., *Sarcophaga camaria*, *Simulium* spp., *Stomoxys calcitrans*, *Tipula paludosa*.

3 ряду лускокрилі, наприклад, *Achroia grisella*, *Galleria mellonella*, *Plodia interpunctella*, *Tinea cloacella*, *Tinea Pellionella*, *Tineola bisselliella*.

3 ряду блохи, наприклад, *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, *Xenopsylla cheopis*.

3 ряду перетинчастокрилі, наприклад, *Camponotus herculeanus*, *Lasius fuliginosus*, *Lasius niger*, *Lasius umbratus*, *Monomorium pharaonis*, *Paravespula* spp., *Tetramorium caespitum*.

3 ряду воші, наприклад, *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Phthirus pubis*.

3 ряду напівжорсткокрилі, наприклад, *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Rhodnius prolixus*, *Triatoma infestans*.

Застосування в межах інсектицидів домашнього господарства здійснюють окремо або у комбінації з іншими придатними активними речовинами, такими як естери фосфорної кислоти, карбамати, піретроїди, регулятори росту або активні речовини з інших відомих класів інсектицидів.

Застосування здійснюють у вигляді аерозолей, засобів для розбризкування, що не знаходяться під тиском, наприклад, спреїв для розбризкування за допомогою насосів та для обприскування, автоматів для створення туману, зволожувачів, у вигляді піни, гелів, продуктів випару з пластинами для випару із целюлози або пластмаси, у вигляді випарників рідин, гелевих та мембранних випарників, випарників із пропелером, систем випару, що не потребують енергії, або у вигляді пасивних систем випару, паперу для молі, мішечків для молі та гелів для молі, у вигляді гранулятів або дуетів, принади, що розсипається, або станції з принадою.

Активні речовини згідно з винаходом можуть бути використані як дефоліанти, десиканти, агенти придушення росту трав та зокрема як агенти для знищення бур'янів. Під бур'янами в широкому сенсі розуміють усі рослини, що виростають у тих місцях, де вони є небажаними. Тотальна або селективна гербіцидна дія речовин згідно з винаходом звичайно залежить від кількості їх застосування.

Активні речовини згідно з винаходом можуть бути використані, наприклад, для таких рослин:

Дводольні бур'яни родів: *Abutilon* (абутилон), *Amaranthus* (амарант), *Ambrosia* (амброзія), *Anoda*, *Anthemis* (пухляк), *Aphanes*, *Atriplex* (лобода), *Bellis* (маргаритка), *Bidens* (черепа), *Capsella* (вівчарська сумка), *Carduus* (будяк), *Cassia* (касія),

Centaurea (волошка), *Chenopodium* (марь), *Cirsium* (бодяк), *Convolvulus* (в'юник), *Datura* (дурман), *Desmodium*, *Emex*, *Erysimum* (жовтушник), *Euphorbia* (молочай), *Galeopsis*, *Galinsoga* (гапінзоба), *Galium* (підмаренник), *Hibiscus* (гібіскус), *Ipomoea* (іпомея), *Kochia* (кохія), *Lamium* (яснотка), *Lepidium* (блошечник), *Lindernia*, *Matricaria* (матрикарія), *Mentha* (м'ята), *Mercurialis* (пролісок), *Mullugo*, *Myosotis* (незабудка), *Paraver* (мак), *Pharbitis*, *Plantago* (подорожник), *Polygonum* (горець), *Portulaca* (портулак), *Ranunculus* (жовтець), *Raphanus* (редька), *Rorippa*, *Rotala*, *Rumex* (щавель), *Salsola* (солянка), *Senecio* (крестовник), *Sesbania* (сесбанія), *Sida* (сида), *Sinapis* (гірчиця), *Solanum* (паслен), *Sonchus* (осот), *Spenoclea*, *Stellaria* (звездчатка), *Taraxacum* (кульбаба), *Thlaspi*, *Trifolium* (конюшина), *Urtica* (кропива), *Veronica* (вероніка), *Viola* (фіалка), *Xanthium* (дурнишник).

Дводольні культурні рослини родів: *Arachis* (арахіс), *Beta* (буряк), *Brassica* (капуста), *Cucumis* (огірок), *Cucurbita* (гарбуз), *Helianthus* (соняшник), *Daucus* (морква), *Glycine* (соя), *Gossypium* (бавовник), *Ipomoea* (іпомея), *Lactuca* (латук), *Linum* (льон), *Lycopersicon* (томат), *Nicotiana* (тютюн), *Phaseolus* (квасоля), *Pisum* (горох), *Solanum* (паслен), *Vicia* (віка).

Однодольні бур'яни родів: *Aegilops* (єгілопс), *Agropyron* (житняк), *Agrostis* (мітлиця), *Alopecurus* (лисохвіст), *Apera*, *Avena* (овес), *Brachiaria*, *Bromus* (багаття), *Cenchrus*, *Commelina* (комеліна), *Cynodon* (свинорий), *Cyperus* (сіль), *Dactyloctenium*, *Digitaria* (росичка), *Echinochloa* (ежовник), *Eleocharis* (болотниця), *Eleusine* (єлевсина), *Eragrostis* (полевичка), *Eriochloa*, *Festuca* (овсяниця), *Fimbristylis*, *Heteranthera*, *Imperata*, *Ischaemum*, *Leptochloa*, *Lolium* (плевел), *Monochoria*, *Panicum* (просо), *Paspalum* (гречка), *Phalaris* (канареечник), *Phleum* (timoфіївка), *Poa* (мятлик), *Rottboellia*, *Sagittaria* (стрілолист), *Scirpus* (очерет), *Setaria* (щетинник), *Sorghum* (сорго).

Однодольні культурні рослини родів: *Allium* (цибуля), *Ananas* (ананас), *Asparagus* (спаржа), *Avena* (овес), *Hordeum* (ячмінь), *Oryza* (рис), *Panicum* (просо), *Saccharum* (цукровий очерет), *Secale* (жито), *Sorghum* (сорго), *Triticale* (тритикале), *Triticum* (пшениця), *Zea* (кукурудза).

Застосування активних речовин згідно з винаходом в жодному разі не обмежується зазначеними видами, а так само поширюється на інші рослини.

Запропоновані згідно з даним винаходом активні речовини в залежності від концентрації є придатними для повного знищення бур'янів, наприклад, на промисловому устаткуванні та рейкових шляхах, на дорогах та площах з ростом або без росту дерев. Також можливе застосування запропонованих згідно з винаходом активних речовин для боротьби з бур'янами в багаторічних культурах, наприклад, при посадці деревних, декоративних, плодових, винних, цитрусових, горіхових, бананових, кавових, чайних, каучукових, оліє-пальмових, какао, фруктових-ягідних та хмелевих культур, на декоративних газонах та спортивних майданчиках, на пасовищах, а також

для селективної боротьби з бур'янами в однолітніх культурах.

Згідно з винаходом сполуки формули (I) проявляють сильну гербіцидну активність та широкий спектр дії при обробці ґрунту та зелених частин рослин над поверхнею землі. У певному обсязі вони також є придатними для селективної боротьби з однодольними та дводольними бур'янами в однодольних та дводольних культурах, а також при обробці рослин як перед сходженням, так і після сходження.

Запропоновані згідно з винаходом активні речовини у визначеній концентрації або витратній кількості також можуть бути використані для боротьби з тваринними шкідниками та грибовими або бактеріальними захворюваннями рослин. Вони, в разі необхідності, також можуть бути використані як проміжні або вихідні продукти для синтезу інших активних речовин.

Активні речовини можуть бути перетворені в звичайні препаративні форми, такі як розчини, емульсії, порошки, що змочуються, суспензії, порошки, дуети для запилення, пасту, розчинні порошки, грануляти, концентрати емульсій та суспензій, природні та синтетичні речовини, просочені активною речовиною, а також мікрокапсульовані в полімерні речовини.

Зазначені препаративні форми одержують відомим способом, наприклад, змішуванням активних речовин з розріджувачами, наприклад, рідкими розчинниками та/або твердими носіями, в разі необхідності, з використанням поверхнево-активних речовин, наприклад, емульгаторів та/або диспергаторів та/або піноутворювачів.

У випадку використання води як розріджувача можуть, наприклад, використовуватися і органічні розчинники як допоміжні засоби, що поліпшують розчинення. Як рідкі розчинники мають на увазі: ароматичні сполуки, такі як ксилол, толуол, або алкілнафталіни, хлоровані ароматичні сполуки та хлоровані аліфатичні вуглеводні, такі як хлорбензоли, хлоретилени або метилхлорид, аліфатичні вуглеводні, такі як циклогексан або парафіни, наприклад, фракції нафти, мінеральні масла та рослинні олії, спирти, такі як бутанол або гліколь, а також їх етери та естери, кетони, такі як ацетон, метилетилкетон, метилізобутилкетон або циклогексанон, сильнополярні розчинники, такі як диметилформамід та диметилсульфоксид, а також воду.

Як тверді носії мають на увазі: наприклад: солі амонію та помели природних каменів, таких як каоліни, глиноземи, тальк, крейда, кварц, атапульгіт, монтморилоніт або діатомова земля, та помели синтетичних каменів, такі як високодисперсна кремнієва кислота, оксид алюмінію та силікати, як тверді носії для гранулятів мають на увазі: подрібнені та фракціоновані природні кам'яні породи, такі як кальцит, мармур, пемза, сепіоліт, доломіт, а також синтетичні грануляти з неорганічного або органічного борошна, а також грануляти з органічного матеріалу, такого як тирса, шкарлупа кокосових горіхів, кукурудзяні качани та стебла тютюну; як емульгатори та/або піноутворюючі засоби мають на увазі: наприклад, неіоногенні та

аніонні емульгатори, такі як поліоксиетиленовий естер жирної кислоти, поліоксиетиленовий етер жирного спирту, наприклад, алкіларилполігліколевий етер, алкілсульфонати, алкілсульфати, арилсульфонати, а також гідролізати білку; як диспергатори мають на увазі: наприклад, відпрацьовані лігнінсульфітні луги та метилцеллюлозу.

У препаративних формах можуть бути застосовані речовини, що поліпшують адгезію, такі як карбоксиметилцелюлоза, природні та синтетичні порошкоподібні, зернисті або латексоподібні полімери, такі як гуміарабік, полівініловий спирт, полівінілацетат, а також природні фосфоліпіди, такі як кефаліни та лецитини, та синтетичні фосфоліпіди. Іншими добавками можуть бути мінеральні масла та рослинні олії.

Тут також можуть бути застосовані барвники, такі як неорганічні пігменти, наприклад, оксид заліза, оксид титану, фероціан синій, та органічні барвники, такі як алізарин-, азо- та металфталоціанінові барвники та слідові кількості живильних мікроелементів, такі як солі заліза, марганцю, бору, міді, кобальту, молібдену та цинку.

Препаративні форми містять загалом від 0,1 до 95ваг.% активної речовини, переважно, від 0,5 до 90ваг.% активної речовини.

Активні речовини згідно з винаходом можуть бути використані як такі або у своїй препаративній формі змішані з відомими гербіцидами та/або речовинами, які застосовують для боротьби з бур'янами та покращують сумісність з культурними рослинами ("сафенери"), причому можливими є як готові композиції, так і суміші у резервуарах. Можливі також суміші із засобами боротьби з бур'янами, які містять один або кілька відомих гербіцидів та один сафенер.

Для змішування використовують, наприклад, такі відомі гербіциди:

ацетохлор, ацифторфен(-натрій), аклоніфен, алахлор, алоксидим(-натрій), аметрини, амікарбазони, амідохлор, амідосульфурон, анілофос, асулам, атразини, азафенідин, азимсульфурон, бефлубетамід, беназолін(-етил), бенфурезати, бенсульфурон(-метил), бентазон, бензфендізони, бензобіциклон, бензофенап, бензоілпроп(-етил), біалафос, біфенокс, біспірибак(-натрій), бромобутиди, бромофеноксим, бромоксиніл, бутахлор, бутафенацил(-аліл), бутроксидим, бути лати, кафенстроли, калоксидим, карбетаміди, карфентразон(-етил), хлометоксифен, хлорамбен, хлорідазон, хлорімурон(-етил), хлорнітрофен, хлорсульфурон, хлортолурон, цинідон(-етил), цинметилін, ціносульфурон, клефоксидим, клетодим, клодинафоп(-пропаргіл), кломазони, клеопроп, клопіралід, клопірасульфурон(-метил), клорансулам(-метил), кумілурун, ціаназини, цибутрини, циклоати, циклосульфамурон, циклоксидим, цигалофоп(-бутил), 2,4-D, 2,4-DB, десмедифам, діаллати, дикамба, дихлорпроп(-P), диклофоп(-метил), диклосулам, діетатил(-етил), дифензокват, дифлуфенікан, дифлуфензопір, димефурон, димепіперати, диметаклор,

диметаметрин, диметенамід, димексифлам, динітраміни, дифенамід, дикват, дитіопір, діурон, димрон, епроподан, ЕРТС, еспрокарб, еталфлуралін, етаметсульфурон(-метил), етофумезати, етоксифен, етоксисульфурон, етобензанід, феноксапроп(-Р-етил), фентразаміди, флампроп(-ізопропіл, -ізопропіл-L, -метил), флазасульфурон, флорасулам, флуазифоп(-Р-бутил), флуазолати, флукарбазони(-натрій), флуфенацет, флуметсулам, флуміклорак(-пентил), флуміоксазин, флуміпропін, флуметсулам, флуометурон, фторохлоридони, фтороглікофен(-етил), флупоксам, флупропацил, флупірсульфурон(-метил, -натрій), флуренол(-бутил), флуридоні, флуороксіпир(-бутоксіпропіл, -метил), флурпримідол, флуртамони, флутіацет(-метил), флутіаміди, фомесафен, форамсульфурон, глауфозинат(-амоній), гліфозат(-ізопропіламоній), галосафен, галоксифоп(-етоксіетил, -Р-метил), гексазинони, імазаметабенз(-метил), імазаметапір, імазамокс, імазапик, імазапір, імазаквін, імазетапір, імазосульфурон, йодосульфурон(-метил, -натрій), іоксиніл, ізопропалін, ізопротурон, ізоурон, ізоксабен, ізоксахлортоли, ізоксафлутоли, ізоксапірифоп, лактофен, ленацил, лінурон, МСРА, мекопроп, мефенацет, мезотриони, метамітри, метазахлор, метабензтіазурон, метобензулон, метобромурон, (альфа-)метолахлор, метосулам, метоксурон, метрибузин, метсульфурон(-метил), молінати, монолінулон, напроаніліди, напропаміди, небурон, нікосульфурон, норфлуразон, орбенкарб, оризалін, оксадіаргил, оксадіазон, оксасульфурон, оксацикломефони, оксифторфен, паракват, пеларгонова кислота, пендиметалін, пендралін, пентоксазони, фенмедифам, піколінафен, піперофос, претілахлор, примісульфурон(-метил), профлуразол, прометрин, пропахлор, пропаніл, пропаквізафоп, пропізохлор, пропоксикарбазон(-натрій), пропізіаміди, просульфоккарб, просульфурон, пірафлуфен(-етил), піразогіл, піразолати, піразосульфурон(-етил), піразоксифен, пірибензоксим, пірибутикарб, піридати, піридатол, пірифталід, піримінобак(-метил), піритіобак(-натрій), квінхлорак, квінмерак, квіннокламіни, квінзалофоп(-Р-етил, -Р-тефурил), римсульфурон, сетоксидим, симазини, симетрин, сулькотріони, сульфентразони, сульфометурон(-метил), сульфозати, сульфосульфурон, тебутам, тебутіурон, тепралоксидим, тербутилазини, тербутрин, тенілхлор, тіафлуаміди, тіазопір, тидіазиміни, тифенсульфурон(-метил), тіобенкарб, тіокарбазил, тралкоксидим, триалати, триасульфурон, трибенурон(-метил), триклопір, тридифани, трифлуралін, трифлорисульфурон, трифлусульфурон(-метил), тритосульфурон.

Для змішування застосовують також відомі сафенери, такі як, наприклад,:

AD-67, BAS-145138, беноксакор, клокви́нтоцет (-мексил), ціометриніл, 2,4-D, DKA-24, дихлормід, димрон, фенклорим, фенхлоразол (-етил), флуразоли, флуксофенім, фурилазоли, ізоксацифен (-етил), МСРА, мекопроп (-Р), мефенпір (-діетил), MG- 191, оксабетриніл, PPG-1292, R-29148.

Можливою є також суміш з іншими відомими активними речовинами, такими як фунгіциди, інсектициди, акарициди, нематодици, речовини для захисту від птахів, речовини для підживлення рослин та засоби для поліпшення структури ґрунту.

Активні речовини можуть бути застосовані як такі, у вигляді звичайних препаративних форм або у вигляді одержаних шляхом подальшого розрідження готових до застосування форм, таких як розчини, суспензії, емульсії, порошки, пасти та грануляти. Застосування відбувається звичайними способами, наприклад, шляхом поливання, обприскування, мілкокрапельного обприскування, розкидання.

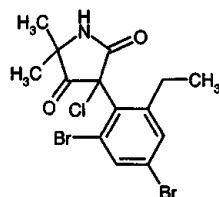
Активні речовини згідно з винаходом можуть бути нанесені як до, так і після сходження рослин. Вони також можуть бути нанесені на ґрунт перед посівом.

Витратну кількість активних речовин можна варіювати у широкому діапазоні. Вона в основному залежить від виду бажаного ефекту. Загалом витратна кількість становить від 1г до 10кг активної речовини на гектар поверхні ґрунту, переважно від 5г до 5кг на га.

Одержання та застосування активних речовин згідно з винаходом демонструють наведені нижче приклади.

Приклади одержання

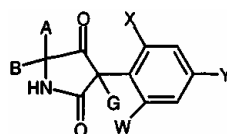
Приклад №1-1



До 0,78г сполуки за прикладом I-1-a-53 із [EP-A-825982] (0,002моль) у 20мл безводного хлороформу по краплях при температурі від 0 до 5°C в атмосфері аргону додають 0,16мл сульфурилхлориду (0,002моль) в 3мл хлороформу. Реакційну суміш протягом 4 годин кип'яють із зворотнім холодильником. Після цього двічі промивають відповідно 10мл розчину NaHCO_3 , фільтрат сушать, розчинник відганяють. Потім продукт очищують колонковою хроматографією на силікагелі (дихлорметан : етиловий естер оцтової кислоти 10:1).


Вихід: 0,6г (71 % від теор.). Т.п.: 165°C.

Аналогічно прикладу I-1-1 та згідно із загальною інформацією про одержання одержують такі сполуки формули (I-1)

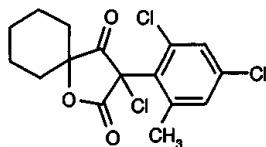


(I-1)

Прикл. №	W	X	Y	A	B	G	Т.п. °C
I-1-2	C ₂ H ₅	H	Br	CH ₃	CH ₃	Cl	160
I-1-3	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	Br	CH ₃	CH ₃	Cl	164
I-1-4	C ₂ H ₅	Cl	Cl	CH ₃	CH ₃	Cl	120
I-1-5	C ₂ H ₅	CH ₃	Br	i-C ₃ H ₇	CH ₃	Cl	масло
I-1-6	C ₂ H ₅	CH ₃	Cl	CH ₃	CH ₃	Cl	130
I-1-7	C ₃ H ₇	Br	Br	CH ₃	CH ₃	Cl	172
I-1-8	C ₂ H ₅	Cl	Br	CH ₃	CH ₃	Cl	132

Прикл. №	W	X	Y	A	B	G	Т.п. °C
I-1-9	C ₂ H ₅	Br	Cl	CH ₃	CH ₃	Cl	145
I-1-10	C ₂ H ₅	Br	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl	масло
I-1-11	C ₂ H ₅	Br	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		Cl	212
I-1-12	C ₂ H ₅	Br	Br	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		Cl	209
I-1-13	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	Cl	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		Cl	210
I-1-14	C ₂ H ₅	Br	Cl	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		Cl	220
I-1-15	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	Br	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		Cl	214
I-1-16	C ₂ H ₅	CH ₃	Cl	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		Cl	206
I-1-17	C ₃ H ₇	Br	Br	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		Cl	217
I-1-18	C ₂ H ₅	H	Br	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		Cl	182
I-1-19	C ₂ H ₅	CH ₃	Br	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		Cl	225
I-1-20	C ₂ H ₅	Cl	Cl	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		Cl	230
I-1-21	C ₂ H ₅	Br	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		Cl	154
I-1-22	C ₂ H ₅	Br	CH ₃		CH ₃	Cl	ліна
I-1-23	C ₂ H ₅	Br	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	Cl	158-164
I-1-24	C ₂ H ₅	Br	CH ₃	C ₃ H ₇	CH ₃	Cl	масло
I-1-25	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	Br	i-C ₃ H ₇	CH ₃	Cl	масло
I-1-26	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	Br	-(CH ₂) ₅ -		Cl	211
I-1-27	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	Br	CH ₃	H	Cl	віск
I-1-28	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	Br	C ₆ H ₅ -CH ₂	H	Cl	139
I-1-29	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	Br	i-C ₃ H ₇	H	Cl	135
I-1-30	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	Br	i-C ₄ H ₉	H	Cl	144
I-1-31	C ₂ H ₅	CH ₃	Br	CH ₃	CH ₃	Cl	91
I-1-32	C ₂ H ₅	CH ₃	Br	CH ₃	H	Cl	масло
I-1-33	C ₂ H ₅	CH ₃	Br	C ₆ H ₅ CH ₂	H	Cl	масло
I-1-34	C ₂ H ₅	CH ₃	Br	i-C ₄ H ₉	H	Cl	117
I-1-35	C ₂ H ₅	CH ₃	Br	-(CH ₂) ₅ -		Cl	188
I-1-36	C ₂ H ₅	Br	Br	-(CH ₂) ₅ -		Cl	масло
I-1-37	C ₂ H ₅	Br	Br	i-C ₃ H ₇	H	Cl	масло
I-1-38	C ₂ H ₅	Cl	Cl	-(CH ₂) ₅ -		Cl	181
I-1-39	C ₂ H ₅	Cl	Br	-(CH ₂) ₅ -		Cl	192
I-1-40	C ₂ H ₅	Cl	Br	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		Cl	226
I-1-41	C ₂ H ₅	Br	Cl	-(CH ₂) ₅ -		Cl	155

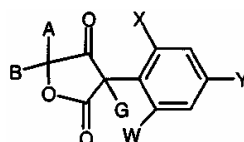
Приклад I-2-1



0,982г (3,0ммоль) сполуки за прикладом №I-2-а-1 [WO 96/35664] розчиняють в 30мл тетрагідрофурану, по краплях додають 0,358г (3,30ммоль) трет-бутилгіпохлориту, протягом 6 годин перемішують при кімнатній температурі та випарюють на роторному випарнику. Сировину очищують колонковою хроматографією на силікагелі (розчинник дихлорметан).

Вихід: 0,90г (75% від теор.), т. п. 108-110°C.

Аналогічно прикладу I-2-1 та згідно із загальною інформацією про одержання одержують такі сполуки формули (I-2)



(I-2)

Прикл. №	W	X	Y	A	B	G	Т.п. °C
I-2-2	CH ₃	CH ₃	Br	-(CH ₂) ₅ -		Cl	123-125
I-2-3	CH ₃	Br	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		Cl	98-100
I-2-4	CH ₃	Cl	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		Cl	120-122
I-2-5	C ₂ H ₅	CH ₃	Br	-(CH ₂) ₅ -		Cl	*1,25 (r, 3H, CH ₂ CH ₃) 2,40 (c, 3H, Ar-CH ₃)
I-2-6	CH ₃	Br	Br	-(CH ₂) ₅ -		Cl	118-120
I-2-7	CH ₃	CH ₃	Cl	-(CH ₂) ₅ -		Cl	95
I-2-8	CH ₃	Cl	Br	-(CH ₂) ₅ -		Cl	88-90
I-2-9	C ₂ H ₅	Br	CH ₃	-(CH ₂) ₅ -		Cl	*1,35 (r, 3H, CH ₂ CH ₃) 2,35 (c, 3H, Ar-CH ₃)

* ¹H-ЯМР (400 МГц, CDCl₃): зсув δ в м.ч.

Приклади застосування

Приклад А

Дослідження після сходження

Розчинник: 5ваг. частин ацетону

Емульгатор: 1ваг. частини алкіларилгліколевого етеру

Для одержання необхідної композиції активних речовин 1 вагову частину активної речовини перемішують із вказаною кількістю розчинника, додають вказану кількість емульгатора, та концентрат розріджують до необхідної концентрації водою.

Рослини довжиною від 5 до 15см обприскують комбінацією активних речовин, так щоб необхідна кількість активних речовин потрапляла по одиницю площі поверхні. Концентрацію розчину для обприскування обирають такою, щоб 1000л води на га містили необхідну кількість активних речовин.

Через 3 тижні визначають ступінь пошкодження рослин в % у порівнянні із необробленою контрольною групою.

При цьому:

0% = ніякого ефекту (як у необробленій контрольній групі)

100% = повне знищення

Приклад В

Дослідження перед сходженням

Розчинник: 5ваг. частин ацетону

Емульгатор: 1ваг. частини алкіларилгліколевого етеру

Для одержання необхідної композиції активних речовин 1 вагову частину активної речовини перемішують із вказаною кількістю розчинника, додають вказану кількість емульгатора, та концентрат розріджують до необхідної концентрації водою.

Насіння досліджуваних рослин висівають у нормальний ґрунт. Через приблизно 24 години ґрунт обприскують композицією активних речовин, так щоб необхідна кількість активних речовин потрапляла по одиницю площі поверхні. Концентрацію розчину для обприскування обирають такою, щоб 1000л води на га містили необхідну кількість активних речовин.

Через 3 тижні визначають ступінь пошкодження рослин в % у порівнянні із необробленою контрольною групою.

При цьому:
0% = ніякого ефекту (як у необробленій контрольній групі)
100% = повне знищення

Після сходження	г а.р./га	Цукровий буряк	Alopecurus	активна речовина	Ефект відмирання	Приклад
Прикл. I-1-2	250	0	95	100	100	100
Прикл. I-1-3	250	0	95	100	100	95

Таблиця D

До сходження	г а.р./га	Alopecurus
Прикл. I-1-3	250	100

Приклад С Дослідження *Meloidogyne*
Розчинник: 78ваг. частин ацетону
1,5ваг. частин диметилформамід
Емульгатор: 0,5ваг. частин алкіларилполігліколевого етеру
Для одержання необхідної композиції активних речовин 1 вагову частину активної речовини перемішують із вказаною кількістю розчинника та емульгатора, концентрат розріджують до необхідної концентрації водою.

Посудини наповнюють піском, розчином активної речовини, суспензією личинок *Meloidogyne incognita* та насінням салату. Насіння салату проростають, з'являються парості. На коренях розвиваються гали.

Через певний проміжок часу, оцінюючи розвиток гал, визначають нематодцидну дію в %. При цьому 100% означає, що гали не були виявлені; 0% означає, що кількість гал на оброблених рослинах відповідає кількості гал рослин необробленої контрольної групи.

Відповідно до результатів даного дослідження високу активність проявляють, наприклад, такі сполуки з прикладів одержання:

Таблиця С

Фітотоксичні нематоди
Дослідження *Meloidogyne*

Активна речовина	Концентрація активи, реч. в м.ч.	Активність в % через 14 днів
Приклад I-1-3	20	100
Приклад I-1-1	20	100

Приклад D
Дослідження *Tetranychus* (ОР-стійкий/обработка обприскуванням)

Розчинник: 78ваг. частин ацетону
1,6ваг. частин диметилформамід
Емульгатор: 0,5ваг. частин алкіларилполігліколевого етеру

Для одержання необхідної композиції активних речовин 1 вагову частину активної речовини перемішують із вказаною кількістю розчинника та емульгатора, концентрат розріджують до необхідної концентрації водою.

Бобові рослини (*Phaseolus vulgaris*), сильно вражені всіма стадіями розвитку кліща павутинного (*Tetranychus urticae*), обприскують комбінацією активних речовин необхідної концентрації.

Через певний проміжок часу визначають дію в %. При цьому 100% означає, що всі кліщі були знищені; 0% свідчить про відсутність ефекту відмирання.

Відповідно до результатів даного дослідження

Фітопатогенні кліщі
Дослідження *Tetranychus* (ОР-стійкий/обработка обприскуванням)

Активна речовина	Концентрація активи, реч. в м.ч.	Ефект відмирання в % через 4 дні
Приклад I-1-2	100	80
Приклад I-1-3	100	80
Приклад I-1-1	100	80

Приклад E

Дослідження *in vitro* для визначення ED₅₀ у мікроорганізмів

В порожнини мікротитрувальних пластин по краплях додають метанольний розчин активної речовини з емульгатором PS16. Після цього розчинник випаровують, в кожну порожнину додають по 200мкл середовища картопляної декстрази.

Попередньо середовище насичують відповідною концентрацією спор або міцелієм досліджуваного гриба.

Кінцеві концентрації активної речовини становлять 0,1, 1, 10 та 100м.ч. Кінцеві концентрації емульгатора становлять 300м.ч.

Після цього пластини інкубують протягом 3-5 днів в апараті для струшування при температурі 22°C, доки на необроблених зразках не спостерігатиметься достатній ріст.

Оцінювання відбувається фотометричним способом при довжині хвилі 620нм. На основі застосування різних концентрацій підраховують дозу активної речовини, яка приводить до 50%-ного інгібування росту грибів по відношенню до необроблених контрольних зразків (ED₅₀).

Таблиця E

Дослідження *in vitro*
для визначення ED₅₀ у мікроорганізмів

Активна речовина	Мікроорганізми	Показник ED ₅₀
Приклад I-1-2	<i>Rhizoctonia solani</i>	2,04
Приклад I-1-3	<i>Rhizoctonia solani</i>	1,37
Приклад I-1-1	<i>Rhizoctonia solani</i>	1,66

Приклад F

Дослідження *Plasmopara* (виноград) / захисна дія

Розчинник: 49ваг. частин N,N-диметилформамід
Емульгатор: 1ваг. частина алкіларилполігліколевого етеру

Для одержання необхідної композиції активних речовин 1 вагову частину активної речовини перемішують із вказаною кількістю розчинника та емульгатора, концентрат розріджують до необхідної концентрації водою.

Для визначення захисної дії молоді рослини обприскують вказаною витратною кількістю композиції активної речовини. Після висихання розчину для обприскування рослини заражають водною суспензією спор *Plasmopara viticola* та залишають на 1 день у інкубаційній камері при температурі приблизно 20°C та відносній вологості 100%. Після цього рослини на 4 дні поміщають в теплицю при температурі приблизно 21°C та вологості приблизно 90%. Потім рослини зволожують та на 1 день поміщають у інкубаційну камеру.

Через 6 днів після зараження здійснюють оцінювання. При цьому 0% означає, що активність відповідає активності речовин контрольної групи, в той час як 100% означає, що ураження не спостерігається.

Таблиця F

Дослідження *Plasmopara* (виноград)/захисна дія

Активна речовина	Витратна кількість активн. реч. в г/га	Ступінь дія в %
Bsp. I-1-2	750	87
Bsp. I-1-3	750	75

Приклад G

Дослідження при граничній концентрації/ґрунті комах - обробка трансгенних рослин

Піддослідні комахі: личинки *Diabrotica balteata* у ґрунті

Розчинник: 7ваг. частин ацетону

Емульгатор: 1ваг. частини алкіларилгліколевого етеру

Для одержання необхідної композиції активних речовин 1 вагову частину активної речовини перемішують із вказаною кількістю розчинника та емульгатора, концентрат розріджують до необхідної концентрації водою.

Комбінацію активних речовин виливають на поверхню ґрунту. При цьому концентрація активних речовин в комбінації не грає практично ніякої ролі, вирішальне значення має лише виражена у м.ч. (мг/л) вагова кількість активних речовин на одиницю об'єму ґрунту. Цим ґрунтом заповнюють горщики ємністю 0,25л та залишають при температурі 20°C.

Безпосередньо після появи паростків у кожен горщик поміщають по 5 попередньо пророщених зерен кукурудзи сорту YIELD GUARD (товарний знак Monsanto Comp., США). Через 2 дні в оброблений ґрунт поміщають піддослідні комахі. Через 7 днів визначають ефективність комбінації за кількістю сходів кукурудзи (1 рослина = ефективність 20%).

Приклад H

Дослідження *Heliothis virescens* - обробка трансгенних рослин

Розчинник: 7ваг. частин ацетону

Емульгатор: 1ваг.

частини

алкіларилгліколевого етеру

Для одержання необхідної композиції активних речовин 1 вагову частину активної речовини перемішують із вказаною кількістю розчинника та емульгатора, концентрат розріджують до необхідної концентрації водою.

Паростки сої (*Glycine max*) сорту Roundup Ready (товарний знак Monsanto Corp., США) обробляють шляхом занурення у комбінацію активних речовин бажаної концентрації та доки листи залишаються вологими, насаджують *Heliothis virescens*.

Через певний проміжок часу визначають ступінь відмирання комах.