



УКРАЇНА

(19) UA (11) 76749 (13) C2

(51) МПК

A01N 43/78 (2006.01)

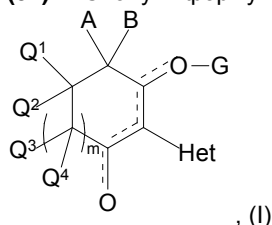
C07D 277/24 (2006.01)

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

(54) ТІАЗОЛІЛЗАМІЩЕНІ КАРБОЦИКЛІЧНІ 1,3-ДІОНИ

1

(21) 20031110185  
(22) 02.04.2002  
(24) 15.09.2006  
(86) PCT/EP02/03620, 02.04.2002  
(31) 101 18 310.0  
(32) 12.04.2001  
(33) DE  
(46) 15.09.2006, Бюл. № 9, 2006 р.  
(72) Фішер Райнер, DE, Ульманн Астрід, DE, Траутвайн Аксель, DE, Древес Марк Вільгельм, DE, Ерделен Крістоф, DE, Дамен Петер, DE, Фойхт Дітер, DE, Понтцен Рольф, DE, Кукк Карл-Хайнц, DE, Вахендорфф-Нойманн Ульріке, DE  
(73) БАЕР КРОПСАСНС АГ, DE  
(56) EP 0368592, A, 16.05.1990  
US 4659372, A, 21.04.1987  
GB 1567300, A, 14.05.1980  
(57) 1. Сполуки формули (I)



в якій

Het означає тiazоліл, необов'язково заміщений галогеном, алкілом, алкокси, алкенілокси, галогеналкілом, галогеналкокси, галогеналкенілокси, ціано, нітро, алкілтію, алкілсульфінілом, алкілсульфонілом, в разі необхідності, заміщеним фенілом або фенокси,

m означає число 0 або 1,

A означає водень, необов'язково заміщений галогеном алкіл, алкеніл, алкоксіалкіл, поліалкоксіалкіл, алкілтіоалкіл, насичений або ненасичений, необов'язково заміщений циклоалкіл, в якому щонайменше один кільцевий атом необов'язково замінений гетероатомом, або відповідно арил, арилалкіл або гетарил, необов'язково заміщений галогеном, алкілом, галогеналкілом, алкокси, галогеналкокси, ціано або нітро,

B означає водень або алкіл,

A та B разом з атомом вуглецю, з яким вони зв'язані, означають насичений або ненасичений, не-

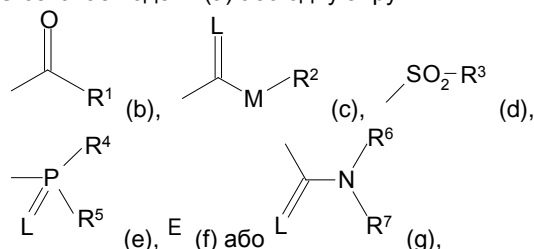
2

заміщений або заміщений цикл, який необов'язково містить щонайменше один гетероатом, A та Q<sup>1</sup> разом означають необов'язково заміщений алканділ, в якому два не сусідні атоми вуглецю, в разі необхідності, утворюють наступний необов'язково заміщений цикл,

Q<sup>1</sup> означає водень, алкіл, алкоксіалкіл, необов'язково заміщений циклоалкіл (в якому одна група метилу, в разі необхідності, замінена киснем або сіркою) або відповідно необов'язково заміщений феніл, гетарил, фенілалкіл або гетарилалкіл, Q<sup>2</sup>, Q<sup>3</sup>, Q<sup>4</sup> незалежно один від одного означають водень або алкіл,

Q<sup>1</sup> та Q<sup>2</sup> разом з атомом вуглецю, з яким вони зв'язані, означають насичений або ненасичений, незаміщений або заміщений цикл, який необов'язково містить один гетероатом,

G означає водень (a) або одну з груп



в якій

E означає іон металу або іон амонію,

L означає кисень або сірку,

M означає кисень або сірку,

R<sup>1</sup> означає відповідно необов'язково заміщений галогеном алкіл, алкеніл, алкоксіалкіл, алкілтіоалкіл, поліалкоксіалкіл або, необов'язково заміщений галогеном, алкілом або алкокси циклоалкіл, який може бути перерваний щонайменше одним гетероатомом, відповідно необов'язково заміщений феніл, фенілалкіл, гетарил, феноксіалкіл або гетарилкоксіалкіл,

R<sup>2</sup> означає відповідно необов'язково заміщений галогеном алкіл, алкеніл, алкоксіалкіл, поліалкоксіалкіл або відповідно необов'язково заміщений циклоалкіл, феніл або бензил,

R<sup>3</sup> означає відповідно необов'язково заміщений алкіл, галогеналкіл, феніл або бензил,

R<sup>4</sup> та R<sup>5</sup> незалежно один від одного означають відповідно необов'язково заміщений галогеном

(13) C2

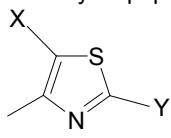
(11) 76749

(19) UA

алкіл, алкокси, алкіламіно, діалкіламіно, алкілтіо, алкенілтіо, циклоалкілтіо або відповідно необов'язково заміщений феніл, бензил, фенокси або фенілтіо,

$R^6$  та  $R^7$  незалежно один від одного означають водень, необов'язково заміщений галогеном алкіл, циклоалкіл, алкеніл, алкокси, алкоксіалкіл, необов'язково заміщений феніл, необов'язково заміщений бензил, або разом з атомом азоту, з яким вони зв'язані, означають цикл, який необов'язково переривається киснем або сіркою.

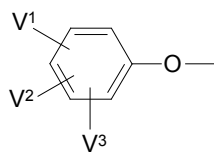
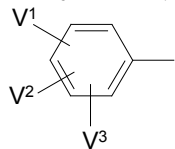
2. Сполуки формули (I) за п.1, в якій Het означає



m означає число 0 або 1,

X означає водень, галоген,  $C_1$ - $C_6$ -алкіл,  $C_1$ - $C_6$ -алкокси,  $C_3$ - $C_6$ -алкенілокси, нітро або ціано,

Y означає галоген,  $C_1$ - $C_6$ -алкіл,  $C_1$ - $C_6$ -галогеналкіл,  $C_1$ - $C_6$ -алкокси,  $C_1$ - $C_6$ -галогеналкокси або групи



$V^1$  означає водень, галоген,  $C_1$ - $C_{12}$ -алкіл,  $C_1$ - $C_6$ -алкокси,  $C_1$ - $C_6$ -алкілтіо,  $C_1$ - $C_6$ -алкілсульфініл,  $C_1$ - $C_6$ -алкілсульфоніл,  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкіл,  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкокси, нітро, ціано або відповідно феніл, фенокси, фенокси- $C_1$ - $C_4$ -алкіл, феніл- $C_1$ - $C_4$ -алкокси, фенілтіо- $C_1$ - $C_4$ -алкіл або феніл- $C_1$ - $C_4$ -алкілтіо, необов'язково один або кілька разів заміщений галогеном,  $C_1$ - $C_6$ -алкілом,  $C_1$ - $C_6$ -алкокси,  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкілом,  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкокси, нітро або ціано,

$V^2$  та  $V^3$  незалежно один від одного означають водень, галоген,  $C_1$ - $C_6$ -алкіл,  $C_1$ - $C_6$ -алкокси,  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкіл або  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкокси,  $V^1$  та  $V^2$  разом з атомами вуглецю, з якими вони зв'язані, означають необов'язково заміщений  $C_1$ - $C_4$ -алкілом або галогеном 5- або 6-членний цикл, в якому 1-4 атоми вуглецю необов'язково можуть бути замінені киснем, сіркою або азотом,

A означає водень відповідно необов'язково заміщений галогеном  $C_1$ - $C_{12}$ -алкіл,  $C_3$ - $C_8$ -алкеніл,  $C_1$ - $C_6$ -алкокси- $C_1$ - $C_4$ -алкіл, необов'язково заміщений галогеном,  $C_1$ - $C_4$ -алкілом або  $C_1$ - $C_4$ -алкокси  $C_3$ - $C_8$ -циклоалкіл або  $C_3$ - $C_6$ -циклоалкіл- $C_1$ - $C_4$ -алкіл, в якому один або два несусідніх кільцевих члени необов'язково заміщені киснем та/або сіркою, або відповідно необов'язково заміщений галогеном,  $C_1$ - $C_6$ -алкілом,  $C_1$ - $C_6$ -галогеналкілом,  $C_1$ - $C_6$ -алкокси,  $C_1$ - $C_6$ -галогеналкокси, ціано або нітрофеніл, бензил, гетарил, що містить 5 - 6 кільцевих атомів (наприклад, фураніл, піридил, імідазоліл, триазоліл, піразоліл, піримідил, тіазоліл або тієніл) або гетарил- $C_1$ - $C_4$ -алкіл, що містить 5-6 кільцевих

атомів (наприклад, піридил, піримідил або тіазоліл),

В переважно водень або  $C_1$ - $C_6$ -алкіл,

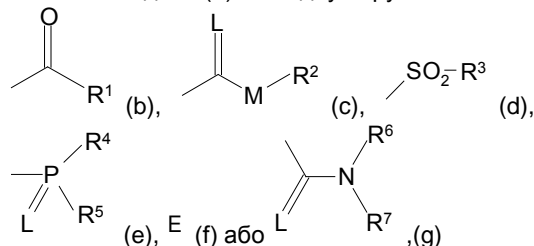
A, B та атом вуглецю, з яким вони зв'язані, означають насичений  $C_3$ - $C_{10}$ -циклоалкіл або ненасичений  $C_5$ - $C_{10}$ -циклоалкіл, в яких один кільцевий член необов'язково замінений киснем або сіркою та які необов'язково моно- або дизаміщені  $C_1$ - $C_6$ -алкілом,  $C_3$ - $C_8$ -циклоалкілом,  $C_1$ - $C_6$ -галогеналкілом,  $C_1$ - $C_6$ -алкокси,  $C_1$ - $C_6$ -алкілтіо, галогеном або фенілом,

A та  $Q^1$  разом означають необов'язково однаково або по-різному моно- або дизаміщений  $C_1$ - $C_4$ -алкілом,  $C_1$ - $C_4$ -алкокси  $C_3$ - $C_6$ -алкандіол,

$Q^1$  означає водень,  $C_1$ - $C_6$ -алкіл,  $C_1$ - $C_6$ -алкокси- $C_1$ - $C_2$ -алкіл, необов'язково заміщений фтором, хлором,  $C_1$ - $C_4$ -алкілом,  $C_1$ - $C_2$ -галогеналкілом або  $C_1$ - $C_4$ -алкокси  $C_3$ - $C_8$ -циклоалкіл, в якому метиленгрупа необов'язково замінена киснем або сіркою, або відповідно необов'язково заміщений галогеном,  $C_1$ - $C_4$ -алкілом,  $C_1$ - $C_4$ -алкокси,  $C_1$ - $C_2$ -галогеналкілом,  $C_1$ - $C_2$ -галогеналкокси, ціано або нітрофеніл, піридил, тієніл, тіазоліл, феніл- $C_1$ - $C_4$ -алкіл, піридил- $C_1$ - $C_2$ -алкіл або тіазоліл- $C_1$ - $C_2$ -алкіл,  $Q^2$ ,  $Q^3$ ,  $Q^4$  незалежно один від одного означають водень або  $C_1$ - $C_4$ -алкіл,

$Q^1$  та  $Q^2$  разом з атомом вуглецю, з яким вони зв'язані, означають необов'язково заміщений  $C_1$ - $C_6$ -алкілом,  $C_1$ - $C_6$ -алкокси або  $C_1$ - $C_2$ -галогеналкілом  $C_3$ - $C_7$ -циклоалкіл, в якому один кільцевий член необов'язково замінений киснем або сіркою,

G означає водень (a) або одну з груп



в яких

E означає іон металу або іон амонію,

L означає кисень або сірку та

M означає кисень або сірку,

$R^1$  означає необов'язково заміщений галогеном  $C_1$ - $C_{20}$ -алкіл,  $C_2$ - $C_{20}$ -алкеніл,  $C_1$ - $C_8$ -алкокси- $C_1$ - $C_8$ -алкіл,  $C_1$ - $C_8$ -алкілтіо- $C_1$ - $C_8$ -алкіл, полі- $C_1$ - $C_8$ -алкокси- $C_1$ - $C_8$ -алкіл або необов'язково заміщений галогеном,  $C_1$ - $C_6$ -алкілом або  $C_1$ - $C_6$ -алкокси  $C_3$ - $C_8$ -циклоалкіл, в якому один або кілька (переважно один або два) несусідніх кільцевих членів необов'язково замінені киснем та/або сіркою, феніл, необов'язково заміщений галогеном, ціано, нітро,  $C_1$ - $C_6$ -алкілом,  $C_1$ - $C_6$ -алкокси,  $C_1$ - $C_6$ -галогеналкілом,  $C_1$ - $C_6$ -галогеналкокси,  $C_1$ - $C_6$ -алкілтіо або  $C_1$ - $C_6$ -алкілсульфонілом, феніл- $C_1$ - $C_6$ -алкіл, необов'язково заміщений галогеном, нітро, ціано,  $C_1$ - $C_6$ -алкілом,  $C_1$ - $C_6$ -алкокси,  $C_1$ - $C_6$ -галогеналкілом або  $C_1$ - $C_6$ -галогеналкокси, 5- або 6-членний гетарил, необов'язково заміщений галогеном,  $C_1$ - $C_6$ -алкілом або трифторметилом (наприклад, піразоліл, тіазоліл, піридил, піримідил, фураніл або тієніл),

фенокси-С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкіл, необов'язково заміщений галогеном або С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкілом або

5- або 6-членний гетарилокси-С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкіл, необов'язково заміщений галогеном, аміно або С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкілом (наприклад, піридилокси-С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкіл, піримідилокси-С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкіл або тіазолілокси-С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкіл),

R<sup>2</sup> означає необов'язково заміщений галогеном С<sub>1</sub>-С<sub>20</sub>-алкіл, С<sub>2</sub>-С<sub>20</sub>-алкеніл, С<sub>1</sub>-С<sub>8</sub>-алкокси-С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>-алкіл, полі-С<sub>1</sub>-С<sub>8</sub>-алкокси-С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>-алкіл, С<sub>3</sub>-С<sub>8</sub>-циклоалкіл, необов'язково заміщений галогеном, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкілом або С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкокси або феніл або бензил, відповідно необов'язково заміщений галогеном, ціано, нітро, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкілом, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкокси, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-галогеналкілом або С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-галогеналкокси,

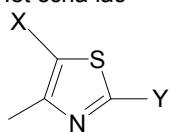
R<sup>3</sup> означає необов'язково заміщений галогеном С<sub>1</sub>-С<sub>8</sub>-алкіл або відповідно необов'язково заміщений галогеном, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкілом, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкокси, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-галогеналкілом, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-галогеналкокси, ціано або нітрофеніл або бензил,

R<sup>4</sup> та R<sup>5</sup> незалежно один від одного означають необов'язково заміщений галогеном С<sub>1</sub>-С<sub>8</sub>-алкіл, С<sub>1</sub>-С<sub>8</sub>-алкокси, С<sub>1</sub>-С<sub>8</sub>-алкіламіно, ді-(С<sub>1</sub>-С<sub>8</sub>-алкіл)аміно, С<sub>1</sub>-С<sub>8</sub>-алкілтіо, С<sub>2</sub>-С<sub>8</sub>-алкенілтіо, С<sub>3</sub>-С<sub>7</sub>-циклоалкілтіо або відповідно необов'язково заміщений галогеном, нітро, ціано, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкокси, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-галогеналкокси, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкілтіо, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-галогеналкілтіо, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкілом або С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-галогеналкілом феніл, бензил, фенокси або фенілтіо,

R<sup>6</sup> та R<sup>7</sup> незалежно один від одного означають водень, відповідно необов'язково заміщений галогеном С<sub>1</sub>-С<sub>8</sub>-алкіл, С<sub>3</sub>-С<sub>8</sub>-циклоалкіл, С<sub>1</sub>-С<sub>8</sub>-алкокси, С<sub>3</sub>-С<sub>8</sub>-алкеніл, С<sub>1</sub>-С<sub>8</sub>-алкокси-С<sub>1</sub>-С<sub>8</sub>-алкіл, необов'язково заміщений галогеном, С<sub>1</sub>-С<sub>8</sub>-галогеналкілом, С<sub>1</sub>-С<sub>8</sub>-алкілом або С<sub>1</sub>-С<sub>8</sub>-алкокси феніл, необов'язково заміщений галогеном, С<sub>1</sub>-С<sub>8</sub>-алкілом, С<sub>1</sub>-С<sub>8</sub>-галогеналкілом або С<sub>1</sub>-С<sub>8</sub>-алкоксибензил або разом з азотом, з яким вони зв'язані, означають необов'язково заміщений С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкілом С<sub>3</sub>-С<sub>6</sub>-алкіленовий залишок, в якому один атом вуглецю необов'язково замінений киснем або сіркою.

3. Сполуки формули (I) за п. 1, в якій

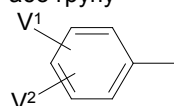
Het означає



m означає число 0 або 1,

X означає водень, хлор, бром або С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкіл,

Y означає хлор, бром, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкіл, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-галогеналкіл, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкокси, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-галогеналкокси або групу



, де

V<sup>1</sup> означає водень, фтор, хлор, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкіл, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкокси, С<sub>1</sub>-С<sub>2</sub>-галогеналкіл, С<sub>1</sub>-С<sub>2</sub>-галогеналкокси, нітро, ціано або фенокси, необов'язково моно- або дизаміщений фтором, хлором, бромом, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкілом, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкокси, С<sub>1</sub>-С<sub>2</sub>-галогеналкілом, С<sub>1</sub>-С<sub>2</sub>-галогеналкокси, нітро або ціано,

V<sup>2</sup> означає водень, фтор, хлор, бром, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкіл, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкокси, С<sub>1</sub>-С<sub>2</sub>-галогеналкіл або С<sub>1</sub>-С<sub>2</sub>-галогеналкокси,

V<sup>1</sup> та V<sup>2</sup> разом з атомами вуглецю, з якими вони зв'язані, означають необов'язково заміщений фтором або метилом 5- або 6-членний цикл, в якому один - два атоми вуглецю можуть бути необов'язково замінені киснем,

A означає водень, відповідно необов'язково моно- - тризаміщений фтором С<sub>1</sub>-С<sub>8</sub>-алкіл або С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкокси-С<sub>1</sub>-С<sub>2</sub>-алкіл, відповідно необов'язково моно- - дизаміщений фтором, хлором, метилом, етилом або метокси С<sub>5</sub>-С<sub>6</sub>-циклоалкіл або С<sub>3</sub>-С<sub>6</sub>-циклоалкіл-С<sub>1</sub>-С<sub>2</sub>-алкіл, в якому один кільцевий член необов'язково замінений киснем або сіркою, або відповідно необов'язково моно- або дизаміщений фтором, хлором, бромом, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкілом, С<sub>1</sub>-С<sub>2</sub>-галогеналкілом, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкокси або С<sub>1</sub>-С<sub>2</sub>-галогеналкокси феніл або бензил,

B означає водень або С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкіл,

A, B та атом вуглецю, з яким вони зв'язані, означають насичений С<sub>5</sub>-С<sub>6</sub>-циклоалкіл, в якому один кільцевий член необов'язково замінений киснем, необов'язково монозаміщеним С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкілом, трифторметилом або С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкокси,

з вказівкою, що Q<sup>1</sup> означає лише водень або С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкіл,

A та Q<sup>1</sup> разом означають необов'язково моно- або дизаміщений метилом, етилом, метокси або етоксис С<sub>3</sub>-С<sub>4</sub>-алкандііл,

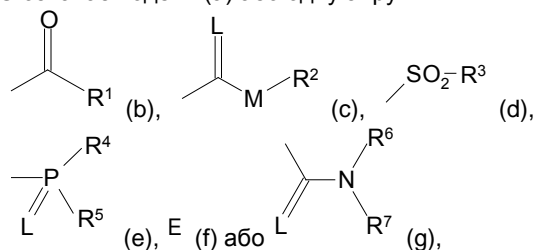
Q<sup>1</sup> означає водень, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкіл, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкокси-С<sub>1</sub>-С<sub>2</sub>-алкіл, або необов'язково заміщений метилом або метокси С<sub>3</sub>-С<sub>6</sub>-циклоалкіл, в якому метиленова група необов'язково замінена киснем, або відповідно необов'язково моно- або дизаміщений фтором, хлором, бромом, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкілом, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкокси, трифторметилом або трифторметоксифеніл або бензил,

Q<sup>2</sup>, Q<sup>3</sup>, Q<sup>4</sup> незалежно один від одного означають водень, метил або етил,

Q<sup>1</sup> та Q<sup>2</sup> разом з вуглецем, з яким вони зв'язані, означають необов'язково заміщений С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкілом або С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкокси насичений С<sub>5</sub>-С<sub>6</sub>-циклоалкіл, в якому один кільцевий член необов'язково замінений киснем,

з вказівкою, що A в такому випадку означає лише водень або С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкіл

G означає водень (a) або одну з груп



в яких

E означає іон металу або іон амонію,

L означає кисень або сірку та

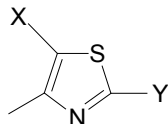
M означає кисень або сірку,

R<sup>1</sup> означають необов'язково одно- або п'ятикратно заміщений фтором або хлором С<sub>1</sub>-С<sub>16</sub>-алкіл, С<sub>2</sub>-С<sub>16</sub>-алкеніл, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкокси-С<sub>1</sub>-С<sub>2</sub>-алкіл, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкілтіо-С<sub>1</sub>-С<sub>2</sub>-алкіл, або необов'язково моно- або дизаміщений фтором, хлором, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкілом або

C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-алкокси C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-циклоалкіл, в якому один або два несусідніх кільцевих атоми необов'язково замінені киснем та/або сіркою, феніл, необов'язково моно- або дизаміщений фтором, хлором, бромом, ціано, нітро, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілом, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси, трифторметилом або трифторметокси, піридил або тієніл, відповідно необов'язково монозаміщений фтором, хлором, бромом, метилом, етилом або трифторметилом, R<sup>2</sup> означає C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>-алкіл, C<sub>2</sub>-C<sub>16</sub>-алкеніл або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси-C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-алкіл, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-циклоалкіл, необов'язково моно- або дизаміщений метилом, етилом або метокси, феніл або бензил, відповідно необов'язково моно- або дизаміщений фтором, хлором, бромом, ціано, нітро, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілом, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси, трифторметилом або трифторметокси, R<sup>3</sup> означає необов'язково одно- або п'ятикратно заміщений фтором C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкіл або необов'язково моно- або дизаміщений фтором, хлором, бромом, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілом, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси, трифторметилом, трифторметокси, ціано або нітрофеніл, R<sup>4</sup> означає C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіламіно, ді-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіл)аміно, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкілтіо, або відповідно необов'язково моно- або дизаміщений фтором, хлором, бромом, нітро, ціано, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-алкокси, трифторметокси, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-алкілом або трифторметилом феніл, бензил, фенокси або фенілтіо, R<sup>5</sup> означає C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілтіо, R<sup>6</sup> означає водень, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіл, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-циклоалкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-алкеніл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіл, необов'язково моно- або дизаміщений фтором, хлором, бромом, трифторметилом, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілом або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси феніл, необов'язково заміщений фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, трифторметилом або метоксибензил, R<sup>7</sup> означає водень, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіл або C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-алкеніл, R<sup>6</sup> та R<sup>7</sup> разом з атомом азоту, з яким вони зв'язані, означають необов'язково заміщений метилом або етилом C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>-алкіленовий залишок, в якому метиленгрупа необов'язково замінена киснем або сіркою.

4. Сполуки формули (I) за п. 1, в якій

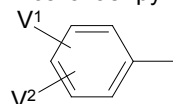
Het означає



m означає число 0 або 1,

X означає водень, хлор, бром, метил, етил, н-пропіл або ізопропіл,

Y означає групу



, де

V<sup>1</sup> означає водень, фтор, хлор, бром, метил, етил, н-пропіл, ізопропіл, н-бутил, ізобутил, трет.-бутил, метокси, етокси, н-пропокси, ізопропокси, трифторметил, трифторметокси або 4-хлорпентокси, V<sup>2</sup> означає водень, фтор, хлор, бром, метил, метокси або трифторметил,

A означає водень, метил, етил, н-пропіл, ізопропіл, н-бутил, ізобутил, трет.-бутил, метоксиметил, етоксиметил, феніл або циклогексил,

B означає водень, метил або етил,

A, B та атом вуглецю, з яким вони зв'язані, означають насичений C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>-циклоалкіл, необов'язково монозаміщений метилом, етилом, н-пропілом, ізопропіл, н-бутилом, ізобутилом, трет.-бутилом, трифторметилом, метокси, етокси, н-пропокси, н-бутокси або ізобутокси, в якому один кільцевий член необов'язково замінений киснем,

із вказівкою, що Q<sup>1</sup> в такому випадку означає лише водень,

A та Q<sup>1</sup> разом означають C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-алкандііл,

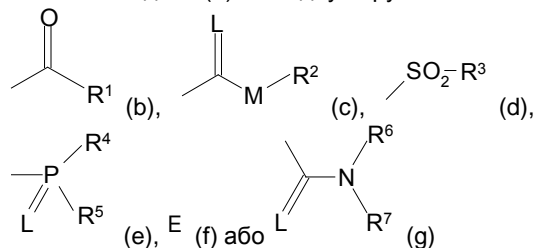
Q<sup>1</sup> означає водень, метил, етил, н-пропіл, ізопропіл, циклопропіл, циклопентил, циклогексил або 4-хлорфеніл,

Q<sup>2</sup>, Q<sup>3</sup>, Q<sup>4</sup> незалежно один від одного означають водень, метил або етил,

Q<sup>1</sup> та Q<sup>2</sup> разом з атомом азоту, з яким вони зв'язані, означають необов'язково заміщений метилом, етилом, метокси, етокси, н-пропокси або н-бутокси насичений C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>-циклоалкіл, в якому один кільцевий член необов'язково замінений киснем,

із вказівкою, що A в такому випадку означає лише водень,

G означає водень (a) або одну з груп



в яких

E означає іон металу або іон амонію,

L означає кисень або сірку та

M означає кисень або сірку,

R<sup>1</sup> означає відповідно необов'язково заміщений фтором або хлором C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкіл, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-алкеніл, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-алкокси-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-алкілтіо-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-алкіл або відповідно необов'язково монозаміщений фтором, хлором, метилом, етилом або метокси циклопропіл або циклогексил, феніл, необов'язково монозаміщений фтором, хлором, бромом, ціано, нітро, метилом, етилом, ізопропілом, трет.-бутилом, метокси, трифторметилом або трифторметокси,

тієніл або піридил, відповідно необов'язково монозаміщений фтором, хлором, бромом або метилом, R<sup>2</sup> означає C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкіл, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-алкеніл або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси-C<sub>2</sub>-алкіл,

C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-циклоалкіл, необов'язково монозаміщений метилом, етилом або метокси,

феніл або бензил, відповідно необов'язково монозаміщений фтором, хлором, ціано, нітро, метилом, етилом, ізопропілом, трет.-бутилом, метокси, трифторметилом або трифторметокси,

R<sup>3</sup> означає відповідно необов'язково тризаміщений фтором метил або етил або необов'язково монозаміщений фтором, хлором, бромом, метилом, трет.-бутилом, метокси, трифторметилом, трифторметокси, ціано або нітрофеніл,

$R^4$  означає  $C_1$ - $C_4$ -алкіл,  $C_1$ - $C_4$ -алкокси,  $C_1$ - $C_4$ -алкіламіно, ді- $(C_1$ - $C_4$ -алкіл)аміно,  $C_1$ - $C_4$ -алкілтіо або відповідно необов'язково монозаміщений фтором, хлором, бромом, нітро, ціано,  $C_1$ - $C_2$ -алкокси, трифторметокси або  $C_1$ - $C_3$ -алкілом феніл, фенокси або фенілтіо,

$R^5$  означає метил, етил, метокси, етокси, метилтіо або етилтіо,

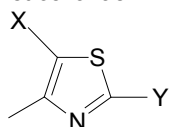
$R^6$  означає водень,  $C_1$ - $C_4$ -алкіл,  $C_3$ - $C_6$ -циклоалкіл,  $C_1$ - $C_4$ -алкокси,  $C_3$ - $C_4$ -алкеніл або  $C_1$ - $C_4$ -алкокси- $C_1$ - $C_4$ -алкіл,

$R^7$  означає водень,  $C_1$ - $C_4$ -алкіл або  $C_3$ - $C_4$ -алкеніл,

$R^6$  та  $R^7$  разом з атомом азоту, з яким вони зв'язані, означають  $C_5$ -алкіленовий залишок, в якому метиленова група необов'язково замінена киснем.

5. Сполука формули (I) за п. 1, в якій

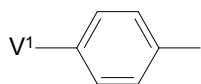
Het означає



m означає число 0 або 1,

X означає водень, метил або етил,

Y означає групу



, де

$V^1$  означає водень, хлор, метил, етил, н-пропіл, ізопропіл, н-бутил, ізобутил, трет.-бутил, трифторметил або 4-хлорпентокси,

A означає водень, метил, етил, н-пропіл, ізопропіл, н-бутил, ізобутил, феніл або циклогексил,

B означає водень, метил або етил,

A, B та атом вуглецю, з яким вони зв'язані, означають насичений  $C_5$ - $C_6$ -циклоалкіл, необов'язково монозаміщений метилом, етилом, н-пропілом, ізопропіл, н-бутилом, ізобутилом, трет.-бутилом, ме-

токси, етокси, н-пропокси, н-бутокси або ізобутокси, в якому один кільцевий член необов'язково замінений киснем,

із вказівкою, що  $Q^1$  в такому випадку означає лише водень,

A та  $Q^1$  разом означають  $C_3$ - $C_4$ -алкандиїл,

$Q^1$  означає водень, метил, етил, н-пропіл, ізопропіл або 4-хлорфеніл,

$Q^2$  означає водень, метил або етил,

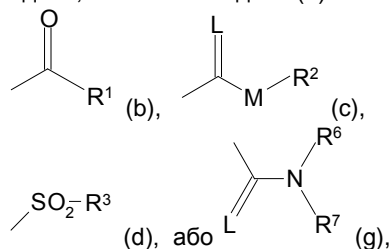
$Q^3$  означає водень,

$Q^4$  означає водень,

$Q^1$  та  $Q^2$  разом з атомом азоту, з яким вони зв'язані,

означають насичений  $C_5$ - $C_6$ -циклоалкіл,

із вказівкою, що A в такому випадку означає лише водень, G означає водень (a) або одну з груп



в яких

L означає кисень та

M означає кисень або сірку,

$R^1$  означає  $C_1$ - $C_8$ -алкіл,  $C_1$ - $C_2$ -алкокси- $C_1$ - $C_2$ -алкіл або необов'язково монозаміщений хлором циклопропіл, феніл, необов'язково монозаміщений хлором, піридил, необов'язково монозаміщений хлором,

$R^2$  означає  $C_1$ - $C_8$ -алкіл, феніл або бензил,

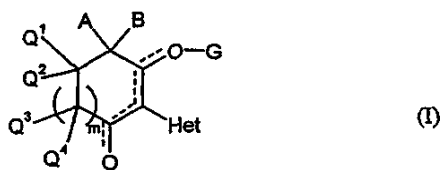
$R^3$  означає метил або етил,

$R^6$  та  $R^7$  разом з атомом азоту, з яким вони зв'язані, означають  $C_5$ -алкіленовий залишок, в якому метиленова група необов'язково замінена киснем.

Даний винахід стосується нових гетарилзаміщених похідних циклопентан- та циклогексан-1,3-діону, декількох способів їх одержання та їх застосування як біоактивних речовин у сільському господарстві.

Відомий 2-(2-амінотіазол-4-іл)-3-гідрокси-5,5-диметилциклогексен-2-енон, [Pshenichnyi, V. N. та інш.; CNCLi; Chem. Heterocycl. Compd. (англ. перекл.) EN; 26, 1175-1178 (1990)].

Знайдені нові сполуки формули (I),



в якій

Het означає 5-кільцевий гетероцикл переважно з ряду тіазолів, необов'язково замінений галогеном, алкілом, алкокси, алкенілокси, галогеналкі-

лом, галогеналкокси, галогеналкенілокси, ціано, нітро, алкілтіо, алкілсульфінілом, алкілсульфонілом, в разі необхідності, заміненим фенілом або феноксом,

m означає число 0 або 1,

A означає водень, необов'язково замінений галогеном алкіл, алкеніл, алкоксиалкіл, поліалкоксиалкіл, алкілтіоалкіл, насичений або ненасичений, необов'язково замінений циклоалкіл, в якому щонайменше один кільцевий атом необов'язково замінений гетероатомом, або відповідно арил, арилалкіл або гетарил, необов'язково замінений галогеном, алкілом, галогеналкілом, алкокси, галогеналкокси, ціано або нітро,

B означає водень або алкіл,

A та B разом з атомом вуглецю, з яким вони зв'язані, означають насичений або ненасичений, незаміщений або замінений цикл, який необов'язково містить щонайменше один гетероатом,

A та  $Q^1$  разом означають необов'язково замінений алкандиїл, в якому два не сусідні атоми вуглецю, в разі необхідності, утворюють наступний

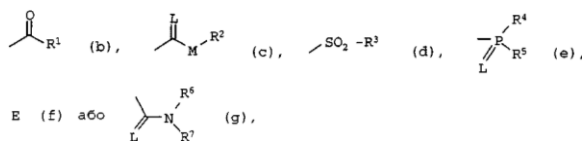
необов'язково заміщений цикл,

$Q^1$  означає водень, алкіл, алкоксиалкіл, необов'язково заміщений циклоалкіл (в якому одна група метилену, в разі необхідності, замінена киснем або сіркою) або відповідно необов'язково заміщений феніл, гетарил, фенілакіл або гетарилакіл,

$Q^2$ ,  $Q^3$ ,  $Q^4$  незалежно один від одного означають водень або алкіл,

$Q^1$  та  $Q^2$  разом з атомом вуглецю, з яким вони зв'язані, означають насичений або ненасичений, незаміщений або заміщений цикл, який необов'язково містить один гетероатом,

G означає водень (a) або одну з груп



в якій

E означає іон металу або іон амонію,

L означає кисень або сірку,

M означає кисень або сірку,

$R^1$  означає відповідно необов'язково заміщений галогеном алкіл, алкеніл, алкоксиалкіл, алкілтіоалкіл, поліалкоксиалкіл або, необов'язково заміщений галогеном, алкілом або алкоксициклоалкіл, який може бути перерваний щонайменше одним гетероатомом, відповідно необов'язково заміщений феніл, фенілакіл, гетарил, феноксиалкіл або гетарилоксиалкіл,

$R^2$  означає відповідно необов'язково заміщений галогеном алкіл, алкеніл, алкоксиалкіл, поліалкоксиалкіл або відповідно необов'язково заміщений циклоалкіл, феніл або бензил,

$R^3$  означає відповідно необов'язково заміщений алкіл, галогеналкіл, феніл або бензил,

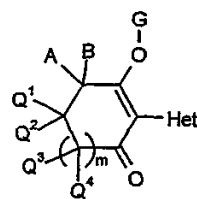
$R^4$  та  $R^5$  незалежно один від одного означають відповідно необов'язково заміщений галогеном алкіл, алкокси, алкіламіно, діалкіламіно, алкілтіо, алкенілітіо, циклоалкілтіо або відповідно необов'язково заміщений феніл, бензил, фенокси або фенілітіо,

$R^6$  та  $R^7$  незалежно один від одного означають водень, необов'язково заміщений галогеном алкіл, циклоалкіл, алкеніл, алкокси, алкоксиалкіл, необов'язково заміщений феніл, необов'язково заміщений бензил, або разом з атомом азоту, з яким вони зв'язані, означають цикл, який необов'язково переривається киснем або сіркою.

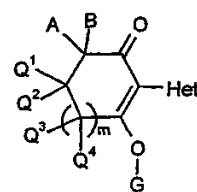
Сполуки формули (I), залежно від виду замісників, в різних композиціях можуть також бути представлені у вигляді геометричних та/або оптичних ізомерів або сумішей ізомерів, які необов'язково можуть бути розділені звичайним способом. Тому об'єктом даного винаходу є чисті ізомери, а також суміші ізомерів, їх одержання та застосування, а також агенти, які їх містять. Проте, надалі для спрощення завжди йдеться про сполуки формули (I), хоча можуть мати на увазі як чисті сполуки, так і, в разі необхідності, суміші з різним вмістом ізомерних сполук.

Сполуки формули (I) в залежності від положення замісника G можуть бути представлені дво-

ма ізомерними формами формул (I- $\alpha$ ) та (I- $\beta$ ),



(I- $\alpha$ )



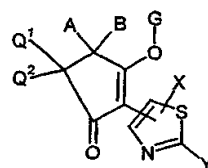
(I- $\beta$ )

що позначено у формулі (I) пунктирною лінією.

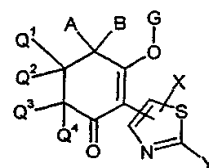
Сполуки формул (I- $\alpha$ ) та (I- $\beta$ ) можуть бути представлені як у вигляді сумішей, так і у вигляді їх чистих ізомерів. Суміші сполук формул (I- $\alpha$ ) та (I- $\beta$ ) можна, в разі необхідності, розділяти відомими фізичними способами, наприклад, хроматографічно.

Надалі для спрощення вказують відповідно лише один з можливих ізомерів. Але це не виключає той факт, що сполуки, в разі необхідності, можуть бути представлені у формі сумішей ізомерів або в іншій ізомерній формі.

Якщо Het означає тiazоліл, а m означає число 0 та 1, в результаті утворюються такі основні структури (I-1) та (I-2)

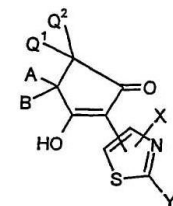


(I-1)

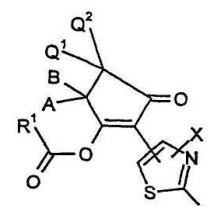


(I-2)

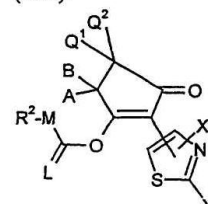
При використанні різних значень (a), (b), (c), (d), (e), (f) та (g) групи G одержують такі основні структури (I-1-a) до (I-1-е), якщо m означає 0 (I-1),



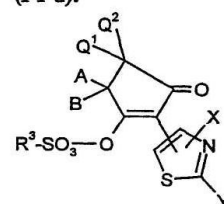
(I-1-c):



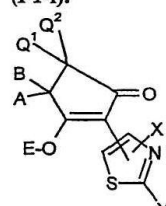
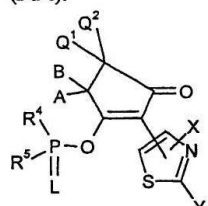
(I-1-d):



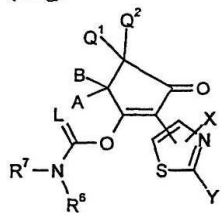
(I-1-e):



(I-1-f):



(I-1-g):



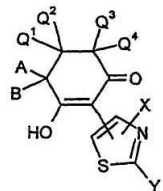
в яких

A, B, E, L, M, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> та R<sup>7</sup> мають наведені вище значення, X означає водень, галоген, алкіл, алкокси, алкенілокси, нітро, ціано або необов'язково заміщений феніл та

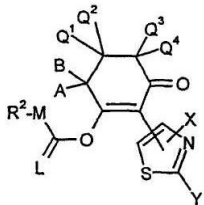
Y означає галоген, алкіл, галогеналкіл, алкокси, галогеналкокси або відповідно необов'язково заміщений феніл або фенокси.

При використанні різних значень (a), (b), (c), (d), (e), (f) та (g) групи G одержують такі основні структури (I-2-a) до (I-2-g), якщо m означає 1 (I-2),

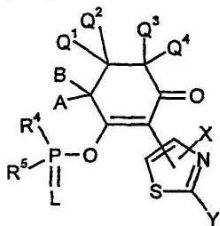
(I-2-a):



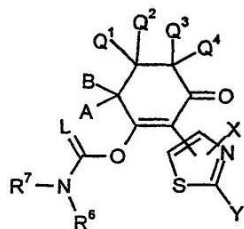
(I-2-c):



(I-2-e):

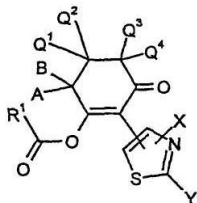


(I-1-g):

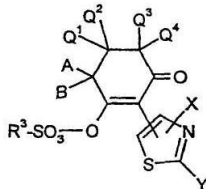


в яких

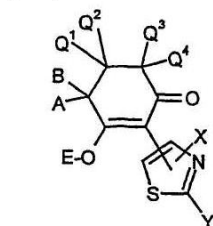
(I-2-b):



(I-2-d):



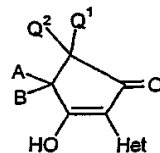
(I-2-f):



A, B, E, L, M, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, Q<sup>3</sup>, Q<sup>4</sup>, X, Y, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> та R<sup>7</sup> мають наведені вище значення.

Крім того, встановлено, що нові сполуки формули (I) одержують одним з описаних нижче способів:

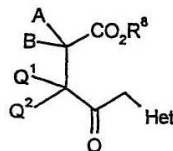
A) заміщені циклопентан-1,3-діони або їх еноли формули (I-1-a)



(I-1-a)

в якій

A, B, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup> та Het мають наведені вище значення, одержують внутрішньомолекулярною конденсацією естеру кетокарбонової кислоти формули (II)



(II)

в якій

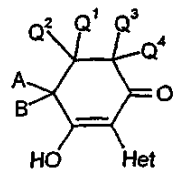
A, B, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup> та Het мають наведені вище значення,

а

R<sup>8</sup> означає алкіл (переважно C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіл), необов'язково в присутності розріджувача та в присутності основи.

Крім того встановлено, що

Б) заміщені циклогексан-1,3-діони формули (I-2-a),

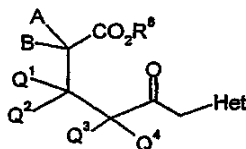


(I-2-a)

в якій

A, B, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, Q<sup>3</sup>, Q<sup>4</sup> та Het мають наведені вище значення,

одержують внутрішньомолекулярною конденсацією естеру кетокарбонової кислоти формули (III)



(III)

в якій

A, B, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, Q<sup>3</sup>, Q<sup>4</sup> та Het мають наведені вище значення,

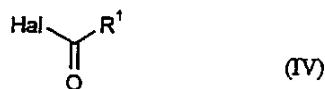
а

R<sup>8</sup> означає алкіл (переважно C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіл), в присутності розріджувача та в присутності основи.

Крім того встановлено, що,

В) сполуки зазначених вище формул (I-1-b) - (I-2-b), в яких A, B, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, Q<sup>3</sup>, Q<sup>4</sup>, m, R<sup>1</sup> та Het мають наведені вище значення, одержують шляхом взаємодії сполук зазначених вище формул (I-1-a) - (I-2-a), в яких A, B, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, Q<sup>3</sup>, Q<sup>4</sup>, m та Het мають наведені вище значення,

(а) з галоїдангідридом кислоти формули (IV)

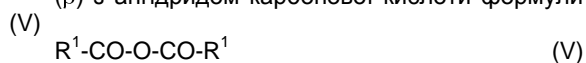


в якій

R<sup>1</sup> має наведене вище значення, а

Hal означає галоген (зокрема хлор або бром), або

(β) з ангідридом карбонової кислоти формули



в якій

R<sup>1</sup> має наведене вище значення,

необов'язково в присутності розріджувача та необов'язково в присутності агента, що зв'язує кислоту;

Г) сполуки зазначених вище формул (I-1-c) - (I-2-c), в яких A, B, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, Q<sup>3</sup>, Q<sup>4</sup>, m, R<sup>2</sup>, M та Het мають наведені вище значення, а L означає кисень, одержують шляхом взаємодії сполук зазначених вище формул (I-1-a) - (I-2-a), в яких A, B, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, Q<sup>3</sup>, Q<sup>4</sup>, m та Het мають наведені вище значення, відповідно з естером хлормурашиної кислоти або з тіоестером хлормурашиної кислоти формули (VI)



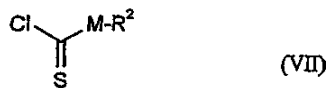
в якій

R<sup>2</sup> та M мають наведені вище значення,

необов'язково в присутності розріджувача та необов'язково в присутності агента, що зв'язує кислоту;

Д) сполуки зазначених вище формул (I-1-c) - (I-2-c), в яких A, B, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, Q<sup>3</sup>, Q<sup>4</sup>, m, R<sup>2</sup>, M та Het мають наведені вище значення, а L означає сірку, одержують шляхом взаємодії сполук зазначених вище формул (I-1-a) - (I-2-a), в яких A, B, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, Q<sup>3</sup>, Q<sup>4</sup>, m та Het мають наведені вище значення, відповідно

з естером хлормонотіомурашиної кислоти та з естером хлордитіомурашиної кислоти формули (VII)



в якій

M та R<sup>2</sup> мають наведені вище значення,

необов'язково в присутності розріджувача та необов'язково в присутності агента, що зв'язує кислоту,

а також

Е) сполуки зазначених вище формул (I-1-d) - (I-2-d), в яких A, B, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, Q<sup>3</sup>, Q<sup>4</sup>, m, R<sup>3</sup> та Het мають наведені вище значення, одержують шляхом взаємодії сполук зазначених вище формул (I-1-a) - (I-2-a), в яких A, B, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, Q<sup>3</sup>, Q<sup>4</sup>, m та Het мають

наведені вище значення, відповідно

з хлоридом сульфоновної кислоти формули (VIII)



в якій

R<sup>3</sup> має наведене вище значення,

необов'язково в присутності розріджувача та необов'язково в присутності агента, що зв'язує кислоту,

Є) сполуки зазначених вище формул (I-1-e) - (I-2-e), в яких A, B, L, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, Q<sup>3</sup>, Q<sup>4</sup>, m, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup> та Het мають наведені вище значення, одержують шляхом взаємодії сполук зазначених вище формул (I-1-a) - (I-2-a), в яких A, B, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, Q<sup>3</sup>, Q<sup>4</sup>, m та Het мають наведені вище значення, відповідно зі сполуками фосфору формули (IX)



в якій

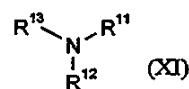
L, R<sup>4</sup> та R<sup>5</sup> мають наведені вище значення, а

Hal означає галоген (зокрема хлор або бром),

необов'язково в присутності розріджувача та необов'язково в присутності агента, що зв'язує кислоту,

Ж) сполуки зазначених вище формул (I-1-f) - (I-2-f), в яких A, B, E, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, Q<sup>3</sup>, Q<sup>4</sup>, m та Het мають наведені вище значення, одержують шляхом взаємодії сполук зазначених вище формул (I-1-a) - (I-2-a), в яких A, B, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, Q<sup>3</sup>, Q<sup>4</sup>, m та Het мають наведені вище значення, відповідно

зі сполуками металу або амінами формули (X) або (XI)



в яких

Me означає одно- або двовалентний метал (переважно лужний або лужноземельний метал, такий як літій, натрій, калій, магній або кальцій),

t означає число 1 або 2 та

R<sup>11</sup>, R<sup>12</sup>, R<sup>13</sup> залежно один від одного означають водень або алкіл (переважно C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкіл), необов'язково в присутності розріджувача,

З) сполуки зазначених вище формул (I-1-g) - (I-2-g), в яких A, B, L, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, Q<sup>3</sup>, Q<sup>4</sup>, m, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> та Het мають наведені вище значення, одержують шляхом взаємодії сполук зазначених вище формул (I-1-a) - (I-2-a), в яких A, B, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, Q<sup>3</sup>, Q<sup>4</sup>, m та Het мають наведені вище значення, відповідно

(α) з ізоціанатами або ізотіоціанатами формули (XII)



в якій

R<sup>6</sup> та L мають наведені вище значення,

необов'язково в присутності розріджувача та необов'язково в присутності каталізатора або

(β) з хлоридом карбамінової кислоти або з хлоридом тіокарбамінової кислоти формули (XIII)

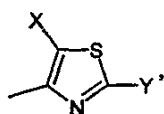


в якій

L, R<sup>6</sup> та R<sup>7</sup> мають наведені вище значення, необов'язково в присутності розріджувача та необов'язково в присутності агента, що зв'язує кислоту.

Крім того встановлено, що нові сполуки формули (I) є високоефективними як засоби для боротьби зі шкідниками, переважно як інсектициди, акарициди та як гербіциди і фунгіциди.

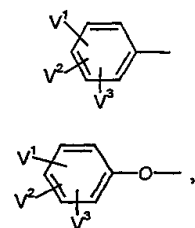
Сполуки згідно з винаходом загалом визначені у формули (I). Далі наводять кращі замісники або області замісників радикалів, приведених у вищета нижчеказаних формулах:



m переважно означає число 0 або 1,

X переважно означає водень, галоген, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-алкенілокси, нітро або ціано,

Y переважно означає галоген, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкокси або групи



V<sup>1</sup> переважно означає водень, галоген, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкілтіо, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкілсульфініл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкілсульфоніл, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкокси, нітро, ціано або відповідно феніл, фенокси, фенокси-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкіл, феніл-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси, фенілтіо-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкіл або феніл-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілтіо, необов'язково один або кілька разів заміщений галогеном, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкілом, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкілом, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкокси, нітро або ціано,

V<sup>2</sup> та V<sup>3</sup> незалежно один від одного переважно означають водень, галоген, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкіл або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкокси,

V<sup>1</sup> та V<sup>2</sup> разом з атомами вуглецю, з якими вони зв'язані, переважно означають необов'язково заміщений C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілом або галогеном 5- або 6-членний цикл, в якому 1-4 атоми вуглецю необов'язково можуть бути замінені киснем, сіркою або азотом,

А переважно означає водень відповідно необов'язково заміщений галогеном C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>-алкіл, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-алкеніл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкіл, необов'язково заміщений галогеном, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілом або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-циклоалкіл або C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-циклоалкіл-

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкіл, в якому один або два несусідніх кільцевих члени необов'язково замінені киснем та/або сіркою, або відповідно необов'язково заміщений галогеном, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкілом, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкілом, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкокси, ціано або нітро феніл, бензил, гетарил, що містить 5-6 кільцевих атомів (наприклад, фураніл, піридил, імідазоліл, триазоліл, піразоліл, піримідил, тіазоліл або тіеніл) або гетарил-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкіл, що містить 5-6 кільцевих атомів (наприклад, піридил, піримідил або тіазоліл),

В означає переважно водень або C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіл,

А, В та атом вуглецю, з яким вони зв'язані, переважно означають насичений C<sub>3</sub>-C<sub>10</sub>-циклоалкіл або ненасичений C<sub>5</sub>-C<sub>10</sub>-циклоалкіл, в яких один кільцевий член необов'язково замінений киснем або сіркою та які необов'язково моно- або дизаміщені C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкілом, C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-циклоалкілом, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-галогеналкілом, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкілтіо, галогеном або фенілом,

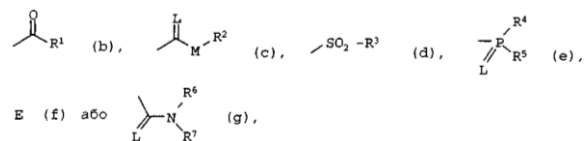
А та Q<sup>1</sup> разом переважно означають необов'язково однаково або по-різному моно- або дизаміщений C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілом, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-алкандиїл,

Q<sup>1</sup> переважно означає водень, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-алкіл, необов'язково заміщений фтором, хлором, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілом, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-галогеналкілом або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-циклоалкіл, в якому метиленгрупа необов'язково замінена киснем або сіркою, або відповідно необов'язково заміщений галогеном, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкілом, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-галогеналкілом, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-галогеналкокси, ціано або нітро феніл, піридил, тіеніл, тіазоліл, феніл-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкіл, піридил-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-алкіл або тіазоліл-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-алкіл,

Q<sup>2</sup>, Q<sup>3</sup>, Q<sup>4</sup> незалежно один від одного переважно означають водень або C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкіл,

Q<sup>1</sup> та Q<sup>2</sup> разом з атомом вуглецю, з яким вони зв'язані, переважно означають необов'язково заміщений C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкілом, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси або C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-галогеналкілом C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-циклоалкіл, в якому один кільцевий член необов'язково замінений киснем або сіркою,

G переважно означає водень (а) або одну з груп



зокрема (а), (b), (c) або (d),

в яких

E означає іон металу або іон амонію,

L означає кисень або сірку та

M означає кисень або сірку,

R<sup>1</sup> переважно означає необов'язково заміщений галогеном C<sub>1</sub>-C<sub>20</sub>-алкіл, C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>-алкеніл, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкокси-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкіл, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкілтіо-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкіл, полі-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкокси-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкіл або необов'язково заміщений галогеном, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкілом або C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкокси C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-циклоалкіл, в якому один або кілька (переважно один або два) несусідніх кільцевих членів необов'язково замінені киснем та/або сіркою,

феніл, необов'язково заміщений галогеном, ціано, нітро,  $C_1$ - $C_6$ -алкілом,  $C_1$ - $C_6$ -алкокси,  $C_1$ - $C_6$ -галогеналкілом,  $C_1$ - $C_6$ -галогеналкокси,  $C_1$ - $C_6$ -алкілтіо або  $C_1$ - $C_6$ -алкілсульфонілом,

феніл- $C_1$ - $C_6$ -алкіл, необов'язково заміщений галогеном, нітро, ціано,  $C_1$ - $C_6$ -алкілом,  $C_1$ - $C_6$ -алкокси,  $C_1$ - $C_6$ -галогеналкілом або  $C_1$ - $C_6$ -галогеналкокси,

5- або 6-членний гетарил, необов'язково заміщений галогеном,  $C_1$ - $C_6$ -алкілом або трифторметилом (наприклад, піразоліл, тiazоліл, піридил, піримідил, фураніл або тіеніл),

фенокси- $C_1$ - $C_6$ -алкіл, необов'язково заміщений галогеном або  $C_1$ - $C_6$ -алкілом або

5- або 6-членний гетарилокси- $C_1$ - $C_6$ -алкіл, необов'язково заміщений галогеном, аміно або  $C_1$ - $C_6$ -алкілом (наприклад, піридилокси- $C_1$ - $C_6$ -алкіл, піримідилокси- $C_1$ - $C_6$ -алкіл або тiazолілокси- $C_1$ - $C_6$ -алкіл),

$R^2$  переважно означає необов'язково заміщений галогеном  $C_1$ - $C_{20}$ -алкіл,  $C_2$ - $C_{20}$ -алкеніл,  $C_1$ - $C_8$ -алкокси- $C_2$ - $C_8$ -алкіл, полі- $C_1$ - $C_8$ -алкокси- $C_2$ - $C_8$ -алкіл,

$C_3$ - $C_8$ -циклоалкіл, необов'язково заміщений галогеном,  $C_1$ - $C_6$ -алкілом або  $C_1$ - $C_6$ -алкокси або

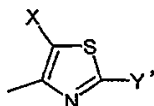
феніл або бензил, відповідно необов'язково заміщений галогеном, ціано, нітро,  $C_1$ - $C_6$ -алкілом,  $C_1$ - $C_6$ -алкокси,  $C_1$ - $C_6$ -галогеналкілом або  $C_1$ - $C_6$ -галогеналкокси,

$R^3$  переважно означає необов'язково заміщений галогеном  $C_1$ - $C_8$ -алкіл або відповідно необов'язково заміщений галогеном,  $C_1$ - $C_6$ -алкілом,  $C_1$ - $C_6$ -алкокси,  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкілом,  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкокси, ціано або нітро феніл або бензил,

$R^4$  та  $R^5$  незалежно один від одного переважно означають необов'язково заміщений галогеном  $C_1$ - $C_8$ -алкіл,  $C_1$ - $C_8$ -алкокси,  $C_1$ - $C_8$ -алкіламіно, ді-( $C_1$ - $C_8$ -алкіл)аміно,  $C_1$ - $C_8$ -алкілтіо,  $C_2$ - $C_8$ -алкенілтіо,  $C_3$ - $C_7$ -циклоалкілтіо або відповідно необов'язково заміщений галогеном, нітро, ціано,  $C_1$ - $C_4$ -алкокси,  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкокси,  $C_1$ - $C_4$ -алкілтіо,  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкілтіо,  $C_1$ - $C_4$ -алкілом або  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкілом феніл, бензил, фенокси або фенілтіо,

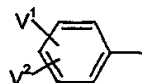
$R^6$  та  $R^7$  незалежно один від одного переважно означають водень, відповідно необов'язково заміщений галогеном  $C_1$ - $C_8$ -алкіл,  $C_3$ - $C_8$ -циклоалкіл,  $C_1$ - $C_8$ -алкокси,  $C_3$ - $C_8$ -алкеніл,  $C_1$ - $C_8$ -алкокси- $C_1$ - $C_8$ -алкіл, необов'язково заміщений галогеном,  $C_1$ - $C_8$ -галогеналкілом,  $C_1$ - $C_8$ -алкілом або  $C_1$ - $C_8$ -алкокси феніл, необов'язково заміщений галогеном,  $C_1$ - $C_8$ -алкілом,  $C_1$ - $C_8$ -галогеналкілом або  $C_1$ - $C_8$ -алкокси бензил або разом з азотом, з яким вони зв'язані, означають необов'язково заміщений  $C_1$ - $C_4$ -алкілом  $C_3$ - $C_6$ -алкіленовий залишок, в якому один атом вуглецю необов'язково замінений киснем або сіркою.

Галоген, зазначений у переважних визначеннях радикалів, також є замісником у галогеналкілі, таким як, наприклад, фтор, бром та йод, зокрема фтор та хлор. Нет найбільш переважно означає



т найбільш переважно означає число 0 або 1, X найбільш переважно означає водень, хлор, бром або  $C_1$ - $C_4$ -алкіл,

Y найбільш переважно означає хлор, бром,  $C_1$ - $C_4$ -алкіл,  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкіл,  $C_1$ - $C_4$ -алкокси,  $C_1$ - $C_4$ -галогеналкокси або групу



$V^1$  найбільш переважно означає водень, фтор, хлор,  $C_1$ - $C_6$ -алкіл,  $C_1$ - $C_4$ -алкокси,  $C_1$ - $C_2$ -галогеналкіл,  $C_1$ - $C_2$ -галогеналкокси, нітро, ціано або фенокси, необов'язково моно- або дизаміщений фтором, хлором, бромом,  $C_1$ - $C_4$ -алкілом,  $C_1$ - $C_4$ -алкокси,  $C_1$ - $C_2$ -галогеналкілом,  $C_1$ - $C_2$ -галогеналкокси, нітро або ціано,

$V^2$  найбільш переважно означає водень, фтор, хлор, бром,  $C_1$ - $C_4$ -алкіл,  $C_1$ - $C_4$ -алкокси,  $C_1$ - $C_2$ -галогеналкіл або  $C_1$ - $C_2$ -галогеналкокси,

$V^1$  та  $V^2$  разом з атомами вуглецю, з якими вони зв'язані, найбільш переважно означають необов'язково заміщений фтором або метилом 5- або 6-членний цикл, в якому один - два атоми вуглецю можуть бути необов'язково замінені киснем,

A найбільш переважно означає водень, відповідно необов'язково моно- - тризаміщений фтором  $C_1$ - $C_8$ -алкіл або  $C_1$ - $C_4$ -алкокси- $C_1$ - $C_2$ -алкіл, відповідно необов'язково моно- - дизаміщений фтором, хлором, метилом, етилом або метокси  $C_5$ - $C_6$ -циклоалкіл або  $C_3$ - $C_6$ -циклоалкіл- $C_1$ - $C_2$ -алкіл, в якому один кільцевий член необов'язково замінений киснем або сіркою, або відповідно необов'язково моно- - дизаміщений фтором, хлором, бромом,  $C_1$ - $C_4$ -алкілом,  $C_1$ - $C_2$ -галогеналкілом,  $C_1$ - $C_4$ -алкокси або  $C_1$ - $C_2$ -галогеналкокси феніл або бензил,

B найбільш переважно означає водень або  $C_1$ - $C_4$ -алкіл,

A, B та атом вуглецю, з яким вони зв'язані, найбільш переважно означають насичений  $C_5$ - $C_6$ -циклоалкіл, в якому один кільцевий член необов'язково замінений киснем, необов'язково монозаміщеним  $C_1$ - $C_4$ -алкілом, трифторметилом або  $C_1$ - $C_4$ -алкокси,

з вказівкою, що  $Q^1$  означає лише водень або  $C_1$ - $C_4$ -алкіл,

A та  $Q^1$  разом найбільш переважно означають необов'язково моно- або дизаміщений метилом, етилом, метокси або етокси  $C_3$ - $C_4$ -алкандиїл,

$Q^1$  найбільш переважно означає водень,  $C_1$ - $C_4$ -алкіл,  $C_1$ - $C_4$ -алкокси- $C_1$ - $C_2$ -алкіл, або необов'язково заміщений метилом або метокси  $C_3$ - $C_6$ -циклоалкіл, в якому метиленова група необов'язково замінена киснем, або відповідно необов'язково моно- або дизаміщений фтором, хлором, бромом,  $C_1$ - $C_4$ -алкілом,  $C_1$ - $C_4$ -алкокси, трифторметилом або трифторметокси феніл або бензил,

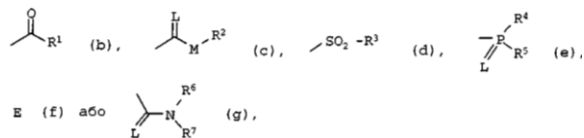
$Q^2$ ,  $Q^3$ ,  $Q^4$  найбільш переважно незалежно один від одного означають водень, метил або етил,

$Q^1$  та  $Q^2$  найбільш переважно разом з вуглецем, з яким вони зв'язані, означають необов'язко-

во заміщений С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкілом або С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкокси насичений С<sub>5</sub>-С<sub>6</sub>-циклоалкіл, в якому один кільцевий член необов'язково замінений киснем,

з вказівкою, що А в такому випадку означає лише водень або С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкіл

G найбільш переважно означає водень (а) або одну з груп



зокрема (а), (b) або (с),  
в яких

E означає іон металу або іон амонію,

L означає кисень або сірку та

M означає кисень або сірку,

R<sup>1</sup> найбільш переважно означають необов'язково одно- - п'ятикратно заміщений фтором або хлором С<sub>1</sub>-С<sub>16</sub>-алкіл, С<sub>2</sub>-С<sub>16</sub>-алкеніл, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкокси-С<sub>1</sub>-С<sub>2</sub>-алкіл, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкілтіо-С<sub>1</sub>-С<sub>2</sub>-алкіл, або необов'язково моно- або дизаміщений фтором, хлором, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкілом або С<sub>1</sub>-С<sub>5</sub>-алкокси С<sub>3</sub>-С<sub>6</sub>-циклоалкіл, в якому один або два несусідніх кільцевих атоми необов'язково замінені киснем та/або сіркою,

феніл, необов'язково моно- або дизаміщений фтором, хлором, бромом, ціано, нітро, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкілом, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкокси, трифторметилом або трифторметокси,

піридил або тіеніл, відповідно необов'язково монозаміщений фтором, хлором, бромом, метилом, етилом або трифторметилом,

R<sup>2</sup> найбільш переважно означає С<sub>1</sub>-С<sub>16</sub>-алкіл, С<sub>2</sub>-С<sub>16</sub>-алкеніл або С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкокси-С<sub>2</sub>-С<sub>4</sub>-алкіл,

С<sub>3</sub>-С<sub>6</sub>-циклоалкіл, необов'язково моно- або дизаміщений метилом, етилом або метокси,

феніл або бензил, відповідно необов'язково моно- або дизаміщений фтором, хлором, бромом, ціано, нітро, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкілом, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкокси, трифторметилом або трифторметокси,

R<sup>3</sup> найбільш переважно означає необов'язково одно- - п'ятикратно заміщений фтором С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкіл або необов'язково моно- або дизаміщений фтором, хлором, бромом, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкілом, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкокси, трифторметилом, трифторметокси, ціано або нітро феніл,

R<sup>4</sup> найбільш переважно означає С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкіл, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкокси, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкіламіно, ді-(С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкіл)аміно, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкілтіо, або відповідно необов'язково моно- або дизаміщений фтором, хлором, бромом, нітро, ціано, С<sub>1</sub>-С<sub>3</sub>-алкокси, трифторметокси, С<sub>1</sub>-С<sub>3</sub>-алкілом або трифторметилом феніл, бензил, фенокси або фенілтіо,

R<sup>5</sup> найбільш переважно означає С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкіл, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкокси або С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкілтіо,

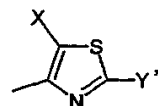
R<sup>6</sup> найбільш переважно означає водень, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкіл, С<sub>3</sub>-С<sub>6</sub>-циклоалкіл, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкокси, С<sub>3</sub>-С<sub>6</sub>-алкеніл, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкокси-С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкіл, необов'язково моно- або дизаміщений фтором, хлором, бромом, трифторметилом, С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкілом або С<sub>1</sub>-С<sub>4</sub>-алкокси феніл, необов'язково заміщений фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, трифторметилом або метокси бензил,

R<sup>7</sup> найбільш переважно означає водень, С<sub>1</sub>-С<sub>6</sub>-алкіл або С<sub>3</sub>-С<sub>6</sub>-алкеніл,

R<sup>6</sup> та R<sup>7</sup> разом з атомом азоту, з яким вони зв'язані, найбільш переважно означають необов'язково заміщений метилом або етилом С<sub>5</sub>-С<sub>6</sub>-алкіленовий залишок, в якому метиленгрупа необов'язково замінена киснем або сіркою.

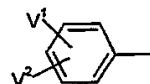
Галоген, зазначений у найбільш переважних визначеннях радикалів, також є замісником у галогеналкілі, таким як, наприклад, фтор, бром та йод, зокрема фтор.

Het особливо переважно означає



m особливо переважно означає число 0 або 1,  
X особливо переважно означає водень, хлор, бром, метил, етил, н-пропіл або ізопропіл,

Y особливо переважно означає групу



V<sup>1</sup> особливо переважно означає водень, фтор, хлор, бром, метил, етил, н-пропіл, ізопропіл, н-бутил, ізобутил, трет.-бутил, метокси, етокси, н-пропокси, ізопропокси, трифторметил, трифторметокси або 4-хлорпентокси,

V<sup>2</sup> особливо переважно означає водень, фтор, хлор, бром, метил, метокси або трифторметил,

А особливо переважно означає водень, метил, етил, н-пропіл, ізопропіл, н-бутил, ізобутил, трет.-бутил, метоксиметил, етоксиметил, феніл або циклогексил,

В особливо переважно означає водень, метил або етил,

А, В та атом вуглецю, з яким вони зв'язані, особливо переважно означають насичений С<sub>5</sub>-С<sub>6</sub>-циклоалкіл, необов'язково монозаміщений метилом, етилом, н-пропілом, ізопропіл, н-бутилом, ізобутилом, трет.-бутилом, трифторметилом, метокси, етокси, н-пропокси, н-бутокси або ізобутокси, в якому один кільцевий член необов'язково замінений киснем,

із вказівкою, що Q<sup>1</sup> в такому випадку означає лише водень,

А та Q<sup>1</sup> разом особливо переважно означають С<sub>3</sub>-С<sub>4</sub>-алкандиїл,

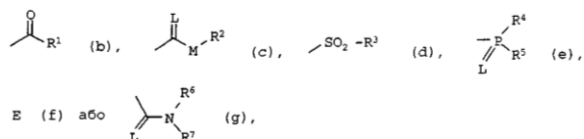
Q<sup>1</sup> особливо переважно означає водень, метил, етил, н-пропіл, ізопропіл, циклопропіл, циклопентил, циклогексил або 4-хлорфеніл,

Q<sup>2</sup>, Q<sup>3</sup>, Q<sup>4</sup> особливо переважно незалежно один від одного означають водень, метил або етил,

Q<sup>1</sup> та Q<sup>2</sup> разом з атомом азоту, з яким вони зв'язані, особливо переважно означають необов'язково заміщений метилом, етилом, метокси, етокси, н-пропокси або н-бутокси насичений С<sub>5</sub>-С<sub>6</sub>-циклоалкіл, в якому один кільцевий член необов'язково замінений киснем,

із вказівкою, що А в такому випадку означає лише водень,

G особливо переважно означає водень (а) або одну з груп



зокрема (а), (b) або (с), в яких

E означає іон металу або іон амонію, L означає кисень або сірку та M означає кисень або сірку,

$\text{R}^1$  особливо переважно означає відповідно неонов'язково заміщений фтором або хлором  $\text{C}_1$ - $\text{C}_8$ -алкіл,  $\text{C}_2$ - $\text{C}_8$ -алкеніл,  $\text{C}_1$ - $\text{C}_2$ -алкокси- $\text{C}_1$ - $\text{C}_2$ -алкіл,  $\text{C}_1$ - $\text{C}_2$ -алкілтіо- $\text{C}_1$ - $\text{C}_2$ -алкіл або відповідно неонов'язково монозаміщений фтором, хлором, метилом, етилом або метокси циклопропіл або циклогексил,

феніл, неонов'язково монозаміщений фтором, хлором, бромом, ціано, нітро, метилом, етилом, ізопропілом, трет.-бутилом, метокси, трифторметилом або трифторметокси,

тієніл або піридил, відповідно неонов'язково монозаміщений фтором, хлором, бромом або метилом,

$\text{R}^2$  особливо переважно означає  $\text{C}_1$ - $\text{C}_8$ -алкіл,  $\text{C}_2$ - $\text{C}_8$ -алкеніл або  $\text{C}_1$ - $\text{C}_{64}$ -алкокси- $\text{C}_2$ -алкіл,

$\text{C}_3$ - $\text{C}_6$ -циклоалкіл, неонов'язково монозаміщений метилом, етилом або метокси, феніл або бензил, відповідно неонов'язково монозаміщений фтором, хлором, ціано, нітро, метилом, етилом, ізопропілом, трет.-бутилом, метокси, трифторметилом або трифторметокси,

$\text{R}^3$  особливо переважно означає відповідно неонов'язково тризаміщений фтором метил або етил або неонов'язково монозаміщений фтором, хлором, бромом, метилом, трет.-бутилом, метокси, трифторметилом, трифторметокси, ціано або нітро феніл,

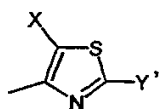
$\text{R}^4$  особливо переважно означає  $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -алкіл,  $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -алкокси,  $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -алкіламіно, ді-( $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -алкіл)аміно,  $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -алкілтіо або відповідно неонов'язково монозаміщений фтором, хлором, бромом, нітро, ціано,  $\text{C}_1$ - $\text{C}_2$ -алкокси, трифторметокси або  $\text{C}_1$ - $\text{C}_3$ -алкілом феніл, фенокси або фенілтіо,

$\text{R}^5$  особливо переважно означає метил, етил, метокси, етокси, метилтіо або етилтіо,

$\text{R}^6$  особливо переважно означає водень,  $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -алкіл,  $\text{C}_3$ - $\text{C}_6$ -циклоалкіл,  $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -алкокси,  $\text{C}_3$ - $\text{C}_4$ -алкеніл або  $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -алкокси- $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -алкіл,

$\text{R}^7$  особливо переважно означає водень,  $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ -алкіл або  $\text{C}_3$ - $\text{C}_4$ -алкеніл,  $\text{R}^6$  та  $\text{R}^7$  разом з атомом азоту, з яким вони зв'язані, особливо переважно означають  $\text{C}_5$ -алкіленовий залишок, в якому метиленова група неонов'язково замінена киснем.

Net особливо переважно означає

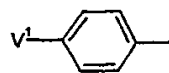


m абсолютно переважно означає число 0 або

1,

X абсолютно переважно означає водень, метил або етил,

Y абсолютно переважно означає групу



$\text{V}^1$  абсолютно переважно означає водень, хлор, метил, етил, н-пропіл, ізопропіл, н-бутил, ізобутил, трет.-бутил, трифторметил або 4-хлорпентокси,

A абсолютно переважно означає водень, метил, етил, н-пропіл, ізопропіл, н-бутил, ізобутил, феніл або циклогексил,

B абсолютно переважно означає водень, метил або етил,

A, B та атом вуглецю, з яким вони зв'язані, абсолютно переважно означають насичений  $\text{C}_5$ - $\text{C}_6$ -циклоалкіл, неонов'язково монозаміщений метилом, етилом, н-пропілом, ізопропіл, н-бутилом, ізобутилом, трет.-бутилом, метокси, етокси, н-пропокси, н-бутокси або ізобутокси, в якому один кільцевий член неонов'язково замінений киснем,

із вказівкою, що  $\text{Q}^1$  в такому випадку означає лише водень,

A та  $\text{Q}^1$  разом абсолютно переважно означають  $\text{C}_3$ - $\text{C}_4$ -алкандиїл,

$\text{Q}^1$  абсолютно переважно означає водень, метил, етил, н-пропіл, ізопропіл або 4-хлорфеніл,

$\text{Q}^2$  абсолютно переважно означає водень, метил або етил,

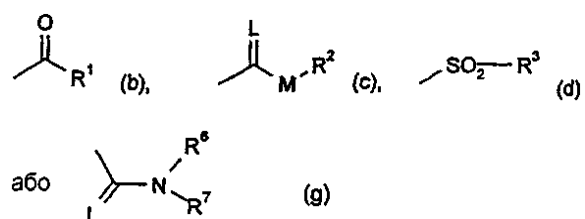
$\text{Q}^3$  абсолютно переважно означає водень,

$\text{Q}^4$  абсолютно переважно означає водень,

$\text{Q}^1$  та  $\text{Q}^2$  разом з атомом азоту, з яким вони зв'язані, абсолютно переважно означають насичений  $\text{C}_5$ - $\text{C}_6$ -циклоалкіл,

із вказівкою, що A в такому випадку означає лише водень,

G абсолютно переважно означає водень (а) або одну з груп



в яких

L означає кисень та

M означає кисень або сірку,

$\text{R}^1$  абсолютно переважно означає  $\text{C}_1$ - $\text{C}_8$ -алкіл,  $\text{C}_1$ - $\text{C}_2$ -алкокси- $\text{C}_1$ - $\text{C}_2$ -алкіл або неонов'язково монозаміщений хлором циклопропіл,

феніл, неонов'язково монозаміщений хлором, піридил, неонов'язково монозаміщений хлором,

$\text{R}^2$  абсолютно переважно означає  $\text{C}_1$ - $\text{C}_8$ -алкіл, феніл або бензил,

$\text{R}^3$  абсолютно переважно означає метил або етил,

$\text{R}^6$  та  $\text{R}^7$  разом з атомом азоту, з яким вони зв'язані, абсолютно переважно означають  $\text{C}_5$ -алкіленовий залишок, в якому метиленова група

необов'язково замінена киснем.

Можливим є будь-яке взаємне комбінування зазначених загальних або переважних визначень радикалів або пояснень, а також відповідних областей і переважних областей. Вони відповідно є кінцевими продуктами, а також вихідними і проміжними продуктами.

Згідно з винаходом переважними є сполуки формули (I), в якій представлена комбінація вищевказаних переважних значень.

Згідно з винаходом найбільш переважними є сполуки формули (I), в якій представлена комбінація вищевказаних найбільш переважних значень.

Згідно з винаходом особливо переважними є сполуки формули (I), в якій представлена комбінація вищевказаних особливо переважних значень.

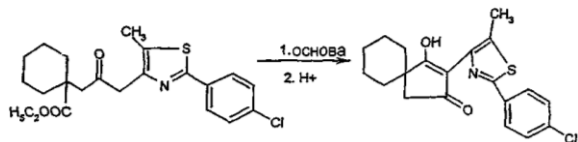
Згідно з винаходом абсолютно переважними є сполуки формули (I), в якій представлена комбінація вищевказаних абсолютно переважних значень.

Зокрема перевагу надають сполукам формули (I), в яких G означає водень.

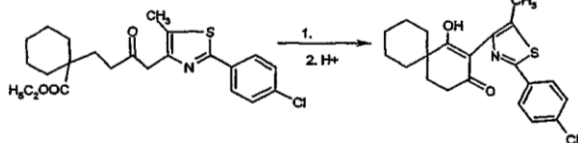
Насичені або ненасичені радикали вуглецю, такі як алкіл або алкеніл, у поєднанні з гетероатомами, наприклад, алкокси, наскільки це можливо, можуть також відповідно бути нерозгалуженими або розгалуженими.

Необов'язково заміщені радикали, якщо не зазначено нічого іншого, можуть бути заміщені один або кілька разів, причому при багаторазовому заміщенні замісники можуть бути однаковими або різними.

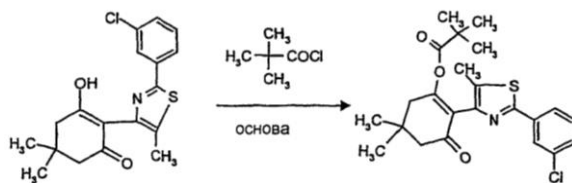
Якщо, наприклад, відповідно до способу (А) як вихідну речовину використовують 1-[4-(5-метил-2-(4-хлорфеніл)тіазоліл)-3-(1-етоксикарбонілциклогексил)пропанон, то згідно з винаходом спосіб здійснюється за такою схемою реакції:



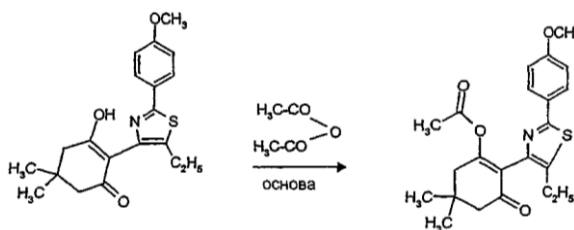
Якщо, наприклад, відповідно до способу (Б) як вихідну речовину використовують 1-[4-(5-метил-2-(4-хлорфеніл)тіазоліл)-4-(1-етоксикарбонілциклогексил)-бутан-2-он, то згідно з винаходом спосіб здійснюється за такою схемою реакції:



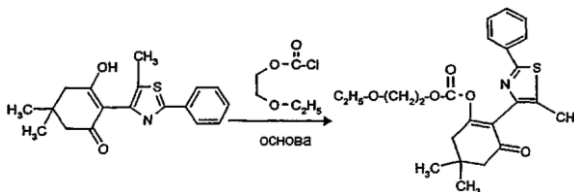
Якщо, наприклад, відповідно до способу (Г $\alpha$ ) як вихідні речовини використовують 2-[4-(5-метил-2-(3-хлорфеніл)тіазоліл)-5,5-диметилциклогексан-1,3-діон та півалоїлхлорид, то згідно з винаходом спосіб здійснюється за такою схемою реакції:



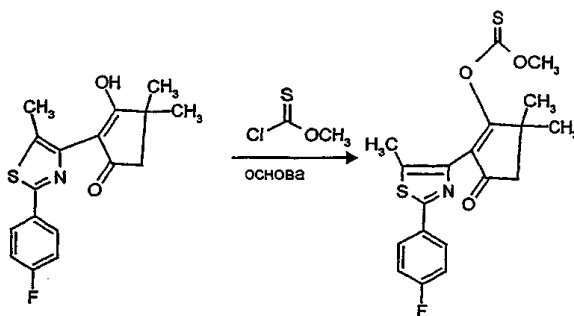
Якщо, наприклад, відповідно до способу (Г $\beta$ ) як вихідні сполуки використовують 2-[4-(5-етил-2-(4-метоксифеніл)тіазоліл)-5,5-диметилциклогексан-1,3-діон та ацетангідрид, то згідно з винаходом спосіб здійснюється за такою схемою реакції:



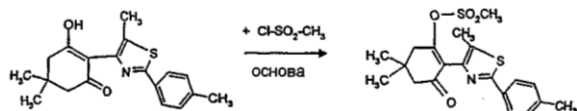
Якщо, наприклад, відповідно до способу (Д) як вихідні сполуки використовують 2-[4-(5-метил-2-феніл)тіазоліл]-5,5-диметил-циклогексан-1,3-діон та етоксиетиловий естер хлормурашиної кислоти, то згідно з винаходом спосіб здійснюється за такою схемою реакції:



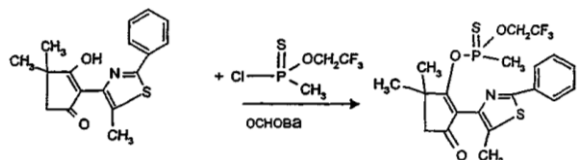
Якщо, наприклад, відповідно до способу (Е) як вихідні речовини використовують 2-[4-(5-метил-2-(4-фторфеніл)тіазоліл)-4,4-диметил-циклопентан-1,3-діон та метиловий естер хлормонотіомурашиної кислоти, то згідно з винаходом спосіб здійснюється за такою схемою реакції:



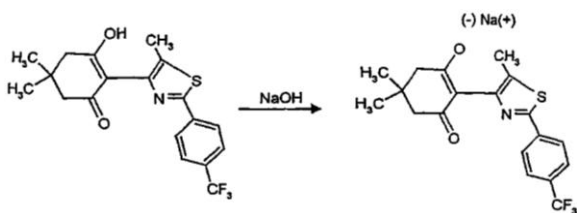
Якщо, наприклад, відповідно до способу (Є) як вихідні речовини використовують 2-[4-(5-метил-3-(4-метилфеніл)тіазоліл)-5,5-диметилциклогексан-1,3-діон та хлорид метансульфонової кислоти, то згідно з винаходом спосіб здійснюється за такою схемою реакції:



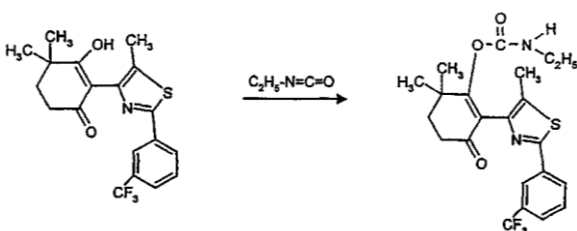
Якщо, наприклад, відповідно до способу (Ж) як вихідні речовини використовують 2-[4-(5-метил-2-феніл)тіазоліл]-4,4-диметилциклопентан-1,3-діон та 2,2,2-трифторетилового естеру хлориду метантіофосфорної кислоти, то згідно з винаходом спосіб здійснюється за такою схемою реакції:



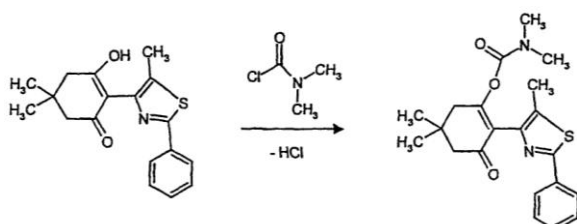
Якщо, наприклад, відповідно до способу (З) як компоненти використовують 2-[4-(5-метил-2-(4-трифторметилфеніл)тіазоліл)-5,5-диметилциклогексан-1,3-діон та NaOH, то згідно з винаходом спосіб здійснюється за такою схемою реакції:



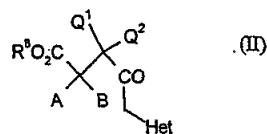
Якщо, наприклад, відповідно до способу (Іа) як вихідні речовини використовують 2-[4-(5-метил-2-(3-трифторметилфеніл)тіазоліл)-4,4-диметилциклогексан-1,3-діон та етил-ізоціанат, то згідно з винаходом спосіб здійснюється за такою схемою:



Якщо, наприклад, відповідно до способу (Іб) як вихідні речовини використовують 2-[4-(5-метил-2-феніл)тіазоліл]-5,5-диметилциклогексан-1,3-діон та хлорид диметил-карбамінової кислоти, то згідно з винаходом спосіб здійснюється за такою схемою:



Новими сполуками, які як вихідні речовини використовуються у способі (А), є естери кетокарбонової кислоти формули (II)

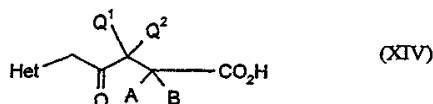


в якій

A, B, Het, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup> та R<sup>8</sup> мають наведені вище значення

їх одержують відомими способами.

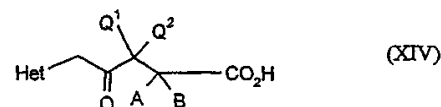
Естер 5-гетарил-4-кетокарбонової кислоти формули (II) одержують, наприклад, шляхом етерифікації [див., напр., Organikum, 15 видання, Берлін, 1977, стор.499] або алкілюванню (див. приклад одержання) 5-гетарил-4-кетокарбонової кислоти формули (XIV)



в якій

A, B, Het, Q<sup>1</sup> та Q<sup>2</sup> мають наведені вище значення.

5-гетарил-4-кетокарбонові кислоти формули (XIV)

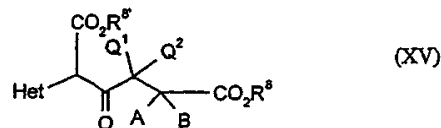


в якій

A, B, Het, Q<sup>1</sup> та Q<sup>2</sup> мають наведені вище значення,

є новими, але їх одержують вже відомими способами (див. спосіб одержання).

5-гетарил-4-кетокарбонові кислоти формули (XIV) одержують, наприклад, шляхом декарбоксилювання [див., напр., Organikum, 15 видання, Берлін, 1977, стор.519-521] естеру 2-гетарил-3-оксоадипінової кислоти формули (XV)



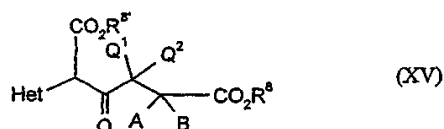
в якій

A, B, Het, Q<sup>1</sup> та Q<sup>2</sup> мають наведені вище значення, а

R<sup>8</sup> та R<sup>8'</sup> означають алкіл (зокрема C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкіл),

необов'язково в присутності розріджувача та необов'язково в присутності основи або кислоти.

Сполуки формули (XV)

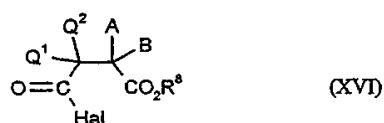


в якій

A, B, Het, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, R<sup>8</sup> та R<sup>8i</sup> мають наведені вище значення,

є новими, якщо сполука формули (XVII) використовується як вихідна речовина, а R<sup>8</sup> в такому випадку означає водень.

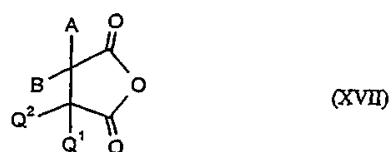
Сполуки формули (XV) одержують, наприклад, шляхом ацилювання хлоридів моноестерів дикарбонової кислоти формули (XVI),



в якій

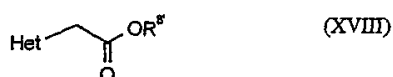
A, B, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup> та R<sup>8</sup> мають наведені вище значення, а

Hal означає хлор або бром, або ангідриди карбонової кислоти формули (XVII)



в якій

A, B, Q<sup>1</sup> та Q<sup>2</sup> мають наведені вище значення, з естером гетарилоцтової кислоти формули (XVIII)

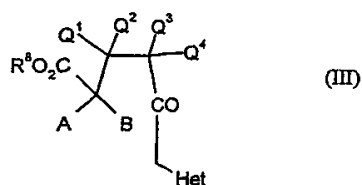


в якій

Het та R<sup>8i</sup> мають наведені вище значення, в присутності розріджувача та в присутності основи [див., напр., M. S. Chambers, E. J. Thomas, D. J. Williams, J. Chem. Soc. Chem. Commun., (1987), 1228, див. також способи одержання].

Сполуки формул (XVI) та (XVII) є, наприклад, частково відомими сполуками в органічній хімії та/або їх одержують відомими способами.

Новими сполуками, які як вихідні речовини використовуються у способі (Б), є естери кетокарбонової кислоти формули (III)

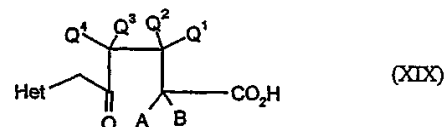


в якій

A, B, Het, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, Q<sup>3</sup>, Q<sup>4</sup> та R<sup>8</sup> мають наведені вище значення.

їх одержують відомими способами.

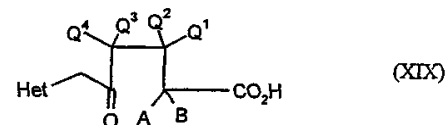
Естер 6-гетарил-5-кетокарбонової кислоти формули (III), наприклад, одержують шляхом етерифікації [див., напр., Organikum, 15 видання, Берлін, 1977, стор.499] або алкілювання (див. приклад одержання) 6-гетарил-5-кетокарбонової кислоти формули (XIX)



в якій

A, B, Het, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, Q<sup>3</sup> та Q<sup>4</sup> мають наведені вище значення.

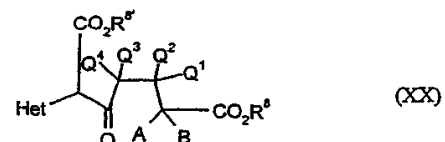
6-арил-5-кетокарбонової кислоти формули (XIX)



в якій

A, B, Het, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, Q<sup>3</sup> та Q<sup>4</sup> мають наведені вище значення,

є новими. їх одержують відомими способами, наприклад, шляхом гідролізу та декарбоксилювання [див., напр., Organikum, 15 видання, Берлін, 1977, стор.519-521] заміщеного естеру 2-гетарил-3-оксептандіонової кислоти формули (XX)



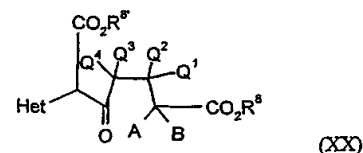
в якій

A, B, Het, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, Q<sup>3</sup> та Q<sup>4</sup> мають наведені вище значення, а

R<sup>8</sup> та R<sup>8i</sup> означають алкіл (переважно C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-алкіл),

необов'язково в присутності розріджувача та необов'язково в присутності основи або кислоти.

Новими є сполуки формули (XX)

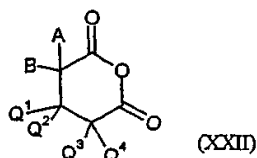
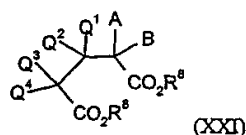


в якій

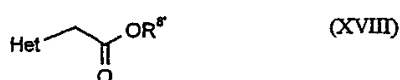
A, B, Het, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, Q<sup>3</sup>, Q<sup>4</sup>, R<sup>8</sup> та R<sup>8i</sup> мають наведені вище значення,

або якщо як вихідна речовина використовується сполука формули (XXII), то R<sup>8</sup> означає водень.

Сполуки формули (XX) одержують, наприклад, шляхом конденсації естеру дикарбонової кислоти формули (XXI), або ангідриду дикарбонової кислоти формули (XXII)



в якій  
A, B, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, Q<sup>3</sup>, Q<sup>4</sup> та R<sup>8</sup> мають наведені вище  
значення,  
із заміщеним естером фенілоцтової кислоти  
формули (XVIII)



в якій  
Het та R<sup>8</sup> мають наведені вище значення,  
в присутності розріджувача та в присутності  
основи.

Сполуки формул (XXI) та (XXII) частково мож-  
на придбати, частково є відомими та/або їх одер-  
жують відомими способами.

Сполуки формули (XVIII) є частково новими,  
але їх одержують відомими способами:

1. C S. Rooney та інш. J. Med. Chem. 1983, 26, 700-714.
2. M. S. Malamas та інш. J. Med. Chem. 1996, 39, 237-245.
3. J. L. Collins та інш. J. Med. Chem. 1998, 41, 5037-5054.
4. EP-A-O 177 353.
5. EP-A-O 368 592.
6. NL-A-6614130.

Галогеніди кислоти формули (IV), ангідриди карбонової кислоти формули (V), естери хлормурашиної кислоти або тіоестери хлормурашиної кислоти формули (VI), естери хлормонотіомурашиної кислоти або естери хлордитіомурашиної кислоти формули (VII), хлориди сульфенової кислоти формули (VIII), фосфорні сполуки формули (IX) та гідроксиди металу, алкоксиди металу або аміни формули (X) та (XI), а також ізоціанати формули (XII) та хлориди карбамінової кислоти або хлориди тіокарбамінової кислоти формули (XIII), необхідні згідно з винаходом для здійснення способів (B), (Г), (Д), (Е), (Є), (Ж) та (З) які використовуються як вихідні речовини, є загально відомими сполуками в органічній та неорганічній хімії.

Сполуки формул (XVI), (XVII) та (XXI) частково комерційно доступні, частково відомі та/або їх одержують відомими способами.

Спосіб (A) відрізняється тим, що сполуки формули (II), в якій A, B, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, Het та R<sup>8</sup> мають наведені вище значення, піддають внутрішньомолекулярній конденсації в присутності основи.

Як розріджувачі у способі (A) згідно з винаходом можуть використовуватися всі інертні органічні розчинники. Перевагу надають вуглеводням, таким як толуол та ксилол, етерам, таким як дибу-

тиловий етер, тетрагідрофуран, діоксан, глікольдиметиловий етер та диглікольдиметиловий етер, полярним розчинникам, таким як диметилсульфоксид, сульfolан, диметилформамід, диметилацетамід та N-метилпіролідон, а також спиртам, таким як метанол, етанол, пропанол, ізопропанол, бутанол, ізобутанол та трет.-бутанол.

Як основи (агенти депротонування) при здійсненні способу (A) згідно з винаходом можуть використовуватися звичайні акцептори протонів. Перевагу надають оксидам, гідроксидам та карбонатам лужних та лужноземельних металів, таким як гідроксид натрію, гідроксид калію, оксид магнію, оксид кальцію, карбонат натрію, карбонат калію та карбонат кальцію, які можуть використовуватися також в присутності міжфазних каталізаторів, таких як, наприклад, хлорид триетилбензиламонію, бромід тетрабутиламонію, Адоген 464 (=хлорид метилтриалкіл(C<sub>8</sub>-C<sub>10</sub>)амонію) або ТДА 1 (= трис-(метоксиетоксиетил)амін). Тут можуть також використовуватися лужні метали, такі як натрій або калій. Крім того в даному способі використовуються також амідні та гідриди лужних та лужноземельних металів, такі як амід натрію, гідрид натрію та гідрид кальцію, а також алкогляти лужних металів, такі як метилат натрію, етилат натрію та трет.-бутилалат калію.

При здійсненні способу (A) згідно з винаходом температуру реакції можна варіювати в широкому діапазоні. Загалом робоча температура реакції становить від -80°C до 180°C, переважно від -50°C та 120°C.

Спосіб (A) згідно з винаходом зазвичай здійснюється при нормальному тиску. При здійсненні способу (A) згідно з винаходом реакційні компоненти формули (II) та депротонуючі основи використовують зазвичай у подвійній еквімолярній кількості. Але можливим є також використання того або іншого компонента у більшому надлишку (до 3моль).

Спосіб (B) відрізняється тим, що сполуки формули (III), в якій A, B, Q<sup>1</sup>, Q<sup>2</sup>, Q<sup>3</sup>, Q<sup>4</sup>, Het та R<sup>8</sup> мають наведені вище значення, піддають внутрішньомолекулярній конденсації в присутності основи.

Як розріджувачі у способі (B) згідно з винаходом можуть використовуватися всі звичайні інертні органічні розчинники. Перевагу надають вуглеводням, таким як толуол та ксилол, етерам, таким як дибутиловий етер, тетрагідрофуран, діоксан, глікольдиметиловий етер та диглікольдиметиловий етер, полярним розчинникам, таким як диметилсульфоксид, сульfolан, диметилформамід та N-метилпіролідон, а також спиртам, таким як метанол, етанол, пропанол, ізопропанол, бутанол, ізобутанол und трет.-бутанол.

Як основи (агенти депротонування) при здійсненні способу (B) згідно з винаходом можуть використовуватися будь-які акцептори протонів. Перевагу надають оксидам, гідроксидам та карбонатам лужних та лужноземельних металів, таким як гідроксид натрію, гідроксид калію, оксид магнію, оксид кальцію, карбонат натрію, карбонат калію та карбонат кальцію, які можуть використовуватися також в присутності міжфазних каталізаторів, таких як, наприклад, хлорид триетилбензиламонію, бромід тетрабутиламонію, Адоген 464 (=хлорид

метилтриалкіл( $C_8-C_{10}$ )амонію) або ТДА 1 (= трис-(метоксиетоксметил)амін). Тут можуть також використовуватися лужні метали, такі як натрій або калій. Крім того в даному способі використовуються також амідні та гідриди лужних та лужноземельних металів, такі як амід натрію, гідрид натрію та гідрид кальцію, а також алкоголяти лужних металів, такі як метилат натрію, етилат натрію та трет.-бутилат калію.

При здійсненні способу (В) згідно з винаходом температуру реакції можна варіювати в широкому діапазоні. Загалом робоча температура реакції становить від  $-80^{\circ}C$  до  $180^{\circ}C$ , переважно від  $-50^{\circ}C$  та  $120^{\circ}C$ .

Спосіб (В) згідно з винаходом здійснюється зазвичай при нормальному тиску. При здійсненні способу (В) згідно з винаходом реакційні компоненти формули (III) та депротонуючі основи використовують у еквімолярній кількості. Але можливим є також використання того або іншого компоненту у більшому надлишку (до 3моль).

Спосіб (С- $\alpha$ ) відрізняється тим, що сполуки формули (I-1-а) - (I-2-а) піддають взаємодії з галогенідами карбонової кислоти формули (IV) необов'язково в присутності розріджувача та необов'язково в присутності агента, зв'язує кислоту.

Як розріджувач у способі (С- $\alpha$ ) згідно з винаходом можуть використовуватися всі розчинники, інертні по відношенню до галогенідів кислоти. Перевагу надають вуглеводням, таким як бензин, бензол, толуол, ксилол та тетралін, галогенвуглеводням, таким як метилхлорид, хлороформ, тетрахлорвуглевод, хлорбензол та одихлорбензол, кетонам, таким як ацетон und метилізопропіловий кетон, етерам, таким як діетиловий етер, тетрагідрофуран та діоксан, естерам карбонової кислоти, наприклад, етилацетату, нітрилам, наприклад, ацетонітрилу, а також сильно полярним розчинникам, таким як диметилформамід, диметилацетамід, диметилсульфоксид та сульфолан. Якщо стабільність гідролізу галогеніду кислоти дозволяє, взаємодія може відбуватися також в присутності води.

Як агенти, що зв'язують кислоту, у способі (С- $\alpha$ ) згідно з винаходом використовуються всі звичайні кислотні акцептори. Перевагу надають третинним амінам, таким як триетиламін, піридин, діазабіциклооктан (DABCO), діазабіциклоундецен (DBU), діазабіциклонон (DBN), основа Хюніга und N,N-диметиланілін, оксидам лужноземельних металів, таким як оксид магнію та кальцію, карбонатам лужних та лужноземельних металів, таким як карбонат натрію, карбонат калію та карбонат кальцію, а також гідроксидам лужних металів, таким як гідроксид натрію та гідроксид калію.

При здійсненні способу (С- $\alpha$ ) температуру реакції можна варіювати в широкому діапазоні. Загалом робоча температура реакції становить від  $-20^{\circ}C$  до  $+150^{\circ}C$ , переважно від  $0^{\circ}C$  до  $100^{\circ}C$ .

При здійсненні способу (С- $\alpha$ ) згідно з винаходом вихідні речовини формул (I-1-а) - (I-2-а) та галогенід карбонової кислоти формули (IV) використовуються відповідно у кількості, наближеній до еквівалентної, хоча існує можливість використовувати галогенід карбонової кислоти у більшому надлишку (до 5моль). Взаємодію зазвичай здійс-

нюють звичайними способами.

Спосіб (С- $\beta$ ) відрізняється тим, що сполуки формул (I-1-а) - (I-2-а) піддають взаємодії з галогенідами карбонової кислоти формули (V) необов'язково в присутності розріджувача та необов'язково в присутності агента, що зв'язує кислоту.

Як розріджувач у способі (С- $\beta$ ) згідно з винаходом переважно використовують такі розріджувачі, використання яких також можливо у випадку використання галогенів дів кислот. Крім того розріджувачем може також бути ангідрид карбонової кислоти, використовуваний у надлишку.

Як агент, що зв'язує кислоту, у способі (С- $\beta$ ) згідно з винаходом переважно використовують такі агенти, використання яких також можливо у випадку галогенідів кислот.

При здійсненні способу (С- $\beta$ ) згідно з винаходом температуру можна варіювати в широких межах. Зазвичай робоча температура становить від  $-20^{\circ}C$  до  $+150^{\circ}C$ , переважно від  $0^{\circ}C$  до  $100^{\circ}C$ .

При здійсненні способу (С- $\beta$ ) згідно з винаходом вихідні речовини формул (I-1-а) - (I-2-а) та галогенід карбонової кислоти формули (V) використовуються відповідно у кількості, наближеній до еквівалентної, хоча існує можливість використовувати ангідрид карбонової кислоти у більшому надлишку (до 5моль). Взаємодію зазвичай здійснюють звичайними способами.

Розріджувач, ангідрид карбонової кислоти, наявний у надлишку, а також карбонову кислоту, яка утворюється, видаляють шляхом дистилювання або промивання органічним розчинником або водою.

Спосіб (D) відрізняється тим, що сполуки формул (I-1-а) - (I-2-а) відповідно піддають взаємодії з естерами або тіоловими естерами хлормурашиної кислоти формули (VI) необов'язково в присутності розріджувача та необов'язково в присутності агента, що зв'язує кислоту.

Як агент, що зв'язує кислоту, при здійсненні способу (D) згідно з винаходом використовуються всі звичайні кислотні акцептори. Перевагу надають третинним амінам, таким як триетиламін, піридин, DABCO, DBU, DBA, основа Хюніга та N,N-диметиланілін, оксидам лужноземельних металів, таким як оксид магнію та кальцію, карбонатам лужних та лужноземельних металів, таким як карбонат натрію, карбонат калію та карбонат кальцію, а також гідроксидам лужних металів, наприклад, гідроксиду натрію та калію.

Як розріджувачі у способі (D) згідно з винаходом можуть використовуватися всі розчинники, інертні по відношенню до естерів або тіоестерів хлормурашиної кислоти. Перевагу надають вуглеводням, таким як бензин, бензол, толуол, ксилол та тетралін, галогенвуглеводням, таким як метилхлорид, хлороформ, тетрахлорвуглеводень, хлорбензол та одихлорбензол, кетонам, таким як ацетон та метилізопропіловий кетон, етерам, наприклад, діетиловому етеру, тетрагідрофурану та діоксану, естерам карбонової кислоти, наприклад, етилацетату, нітрилам, наприклад, ацетонітрилу, а також сильно полярним розчинникам, таким як диметилформамід, диметилацетамід, диметилсульфоксид та сульфолан.

При здійсненні способу (D) згідно з винаходом

температуру реакції можна варіювати у широкому діапазоні. Якщо реакція здійснюється в присутності розріджувача та агента, що зв'язує кислоту, температура реакції загалом становить від  $-20^{\circ}\text{C}$  до  $+100^{\circ}\text{C}$ , переважно від  $0^{\circ}\text{C}$  до  $50^{\circ}\text{C}$ .

Спосіб (D) згідно з винаходом здійснюється зазвичай при нормальному тиску. При здійсненні способу (D) згідно з винаходом вихідні речовини формул (I-1-a) - (I-2-a) та естери або тіоестери хлормурашиної кислоти формули (VI), які утворюються внаслідок цього, використовуються відповідно у кількості, наближеній до еквівалентної. Але можливим є також використання того або іншого компоненту у більшому надлишку (до 2 моль). Взаємодію здійснюють звичайними способами. Загалом солі, які випадають в осад, видаляють, а реакційну суміш, яка залишається, концентрують шляхом видалення розчинника.

Спосіб (E) згідно з винаходом відрізняється тим, що сполуки формул (I-1-a) - (I-2-a) відповідно піддають взаємодії зі сполуки формули (VII) в присутності розріджувача та необов'язково в присутності агента, що зв'язує кислоту.

При здійсненні способу (E) на моль вихідної сполуки формул (I-1-a) - (I-2-a) використовують приблизно 1 моль естеру хлормонотіомирашиної кислоти або естеру хлордитіомирашиної кислоти формули (VII) при температурі від  $0$  до  $120^{\circ}\text{C}$ , переважно від  $20$  до  $60^{\circ}\text{C}$ .

Як розріджувачі використовуються всі інертні полярні органічні розчинники, такі як нітрили, етери, етери, аміді, сульфони, сульфоксиди, а також галогеналкани.

Перевагу надають ацетонітрилу, етиловому естеру оцтової кислоти, диметилсульфоксиду, тетрагідрофурану, диметилформаміду або метилхлориду.

Якщо в переважній формі виконання додавання сильних агентів депротонування (таких як, наприклад, гідрид натрію або трет-бутилат калію) обумовлює утворення енольної солі сполуки (I-a)), то можна відмовитися від подальшого додавання агента, що зв'язує кислоту.

У випадку використання агента, що зв'язує кислоту, можливе використання звичайних неорганічних або органічних основ, наприклад, наприклад, гідроксиду натрію, карбонату натрію, карбонату калію, піридину, триетиламіну.

Реакція здійснюється зазвичай при нормальному або підвищеному тиску, переважно при нормальному тиску. Взаємодію здійснюють звичайними способами.

Спосіб (F) згідно з винаходом відрізняється тим, що сполуки формул (I-1-a) - (I-2-a) відповідно піддають взаємодії з хлоридами сульфонової кислоти формули (VIII) необов'язково в присутності розріджувача та необов'язково в присутності агента, що зв'язує кислоту.

При здійсненні способу (F) на моль вихідної сполуки формул (I-1-a) - (I-2-a) використовують приблизно 1 моль хлориду сульфонової кислоти формули (VIII) при температурі від  $-20$  до  $150^{\circ}\text{C}$ , переважно від  $20$  до  $70^{\circ}\text{C}$ .

Як розріджувачі використовуються всі інертні полярні органічні розчинники, такі як нітрили, етери, етери, аміді, сульфони, сульфоксиди, а та-

кож галогеновані вуглеводні, такі як метилхлориди.

Перевагу надають ацетонітрилу, етиловому естеру оцтової кислоти, диметилсульфоксиду, тетрагідрофурану, диметилформаміду або метилхлориду.

Якщо в переважній формі виконання додавання сильних агентів депротонування (наприклад, гідриду натрію або третинного бутилату калію) обумовлює утворення енольної солі сполук (I-1-a) - (I-2-a), то можна відмовитися від подальшого додавання агента, що зв'язує кислоту.

У випадку використання агента, що зв'язує кислоту, можливе використання звичайних неорганічних або органічних основ, наприклад, гідроксиду натрію, карбонату натрію, карбонату калію, піридину, триетиламіну.

Реакція здійснюється при нормальному або підвищеному тиску, переважно при нормальному тиску. Взаємодію здійснюють звичайними способами.

Спосіб (G) згідно з винаходом відрізняється тим, що сполуки формул (I-1-a) - (I-2-a) відповідно піддають взаємодії зі сполуками фосфору формули (IX) необов'язково в присутності розріджувача та необов'язково в присутності агента, що зв'язує кислоту.

При здійсненні способу (G) для одержання сполук формул (I-1-e) - (I-2-e) на 1 моль сполук (I-1-a) - (I-2-a) використовують 1-2, переважно 1-1,3 моль сполук фосфору формули (IX) при температурі від  $-40^{\circ}\text{C}$  до  $150^{\circ}\text{C}$ , переважно від  $-10$  до  $110^{\circ}\text{C}$ .

Як розріджувачі використовуються всі інертні полярні органічні розчинники, такі як етери, аміді, нітрили, спирти, сульфіді, сульфони, сульфоксиди і т.д.

Перевагу надають ацетонітрилу, диметилсульфоксиду, тетрагідрофурану, диметилформаміду або метилхлориду.

Як агент, що зв'язує кислоту, використовуються неорганічні або органічні основи, такі як гідроксиди, карбонати або аміни, наприклад, гідроксид натрію, карбонат натрію, карбонат калію, піридин, триетиламін.

Взаємодія здійснюється при нормальному або підвищеному тиску, переважно при нормальному тиску. Взаємодію здійснюють відомими в органічній хімії способами. Очищення кінцевих продуктів, які випали в осад, відбувається переважно шляхом кристалізації, хроматографічного очищення або шляхом так званої "вакуумної дистиляції", тобто видаленням летких складових у вакуумі.

Спосіб (H) згідно з винаходом відрізняється тим, що сполуки формул (I-1-a) - (I-2-a) піддають взаємодії з гідроксидами або алкоксидами металів формули (X) або амінами формули (XI), необов'язково в присутності розріджувача.

Як розріджувач у способі (H) згідно з винаходом можуть використовуватися переважно етери, такі як тетрагідрофуран, діоксан, діетиловий етер, спирти, такі як метанол, етанол, ізопропанол, а також вода.

Спосіб (H) згідно з винаходом здійснюється зазвичай при нормальному тиску. Температура реакції становить від  $-20^{\circ}\text{C}$  до  $100^{\circ}\text{C}$ , переважно

від 0°C до 50°C. Спосіб (I) згідно з винаходом відрізняється тим, що сполуки формул (I-1-a) - (I-2-a) відповідно піддають взаємодії зі сполуками формули (XII) (I-α) необов'язково в присутності розріджувача та необов'язково в присутності каталізатора або (I-β) зі сполуками формули (XIII) необов'язково в присутності розріджувача та необов'язково в присутності агента, що зв'язує кислоту.

При здійсненні способу (I-α) на моль вихідної сполуки формул (I-1-a) - (I-2-a) використовують приблизно 1моль ізоціанату формули (XII) при температурі від 0°C до 100°C, переважно від 20 до 50°C.

Як розріджувач використовуються всі інертні неорганічні розчинники, такі як етери, амідни, нітрили, сульфони, сульфоксиди.

Для прискорення реакції, в разі необхідності, можливе додавання каталізаторів. Як каталізатори переважно використовують оловоорганічні сполуки, такі як, наприклад, дибутилловодилаурат. Взаємодію здійснюють при нормальному тиску.

При здійсненні способу (I-β) на моль вихідної сполуки формул (I-1-a) - (I-2-a) використовують приблизно 1моль хлориду карбамінової кислоти формули (XIII) при температурі від -20 до 150°C, переважно від 0 до 70°C.

Як розріджувачі використовуються всі інертні полярні неорганічні розчинники, такі як нітрили, етери, амідни, сульфони, сульфоксиди або галогеновані вуглеводні.

Перевагу надають ацетонітрилу, етиловому естеру оцтової кислоти, диметилсульфоксиду, тетрагідрофурану, диметилформаміду або метиленхлориду.

Якщо в переважному варіанті здійснення додавання сильних агентів депротонування (таких як, наприклад, гідрид натрію або трет-бутилат калію) обумовлює утворення енольної солі сполук (I-1-a) - (I-2-a), то можна відмовитися від подальшого додавання агента, що зв'язує кислоту.

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

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

3 ряду двопарноногі, наприклад, *Blaniulus guttulatus*.

3 ряду губоногі, наприклад, *Geophilus carpophagus*, *Scutigera* spp.

3 ряду симфіли, наприклад, *Scutigerella immaculata*.

3 ряду щетинохвостки, наприклад, *Lepisma saccharina*.

3 ряду ногохвостки, наприклад, *Onychiurus armatus*.

3 ряду прямокрилі, наприклад, *Acheta domesticus*, *Grylotalpa* 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*, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Trichodectes* spp., *Damalinia* spp..

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

3 ряду напівжосткокрилі, наприклад, *Eurygaster* spp., *Dysdercus intermedius*, *Piesma quadrate*, *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 hederae*, *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*, *Clysia 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*, *Diabrotica* 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*, *Lissorhoptus oryzophilus*.

3 ряду перетинчастокрилі, 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., Hypoboscidae spp., Stomoxys spp., Oestrus spp., Hypoderma spp., Tabanus spp., Tannia spp., Bibio hortulanus, Oscinella frit, Phorbia spp., Pegomyia hyoscyami, Ceratitis capitata, Dacus oleae, Tipula paludosa, Hylemyia spp., Liriomyza spp.

З ряду блохи, наприклад, Xenopsylla cheopis, Ceratophyllus spp.

З класу паукоподібні, наприклад, Scorpio maurus, Latrodectus mactans, Acarus siro, Argas spp., Ornithodoros spp., Dermanyssus gallinae, Eriophyes ribis, Phyllocoptera 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 відносяться, 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.

Запропоновані згідно з винаходом сполуки у визначеній концентрації або нормі витрати також можуть бути використані як гербіциди та мікробіциди, наприклад, як фунгіциди, антигрибкові агенти та бактерициди. Дані активні речовини, в разі необхідності, також можуть бути використані в якості проміжних або первинних продуктів для синтезу інших активних речовин.

Згідно з винаходом можна обробляти всі рослини або частини рослин. Під рослинами при цьому розуміють усі рослини і 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 та генно-інженерними методами або комбінаціями цих методів, включаючи трансгенні рослини та включаючи сорти рослин, що захищаються або не захищаються законом про охорону нових сортів рослин. Під частинами рослин потрібно розуміти всі надземні і підземні частини та органи рослин, як парост, лист, квітка та корінь, причому як прикладі слід назвати листи, голки, стебла, стовбури, квіти, плодові тіла, плоди та насіння, а також корені, бульби та ризоми. До частин рослин належать також зібраний врожай, вегетативний та генеративний матеріал для розмноження, наприклад, черешки, бульби, ризоми, відводки та насіння.

Згідно з винаходом обробку рослин та частин рослин за допомогою біологічно активних речовин здійснюють безпосередньо або шляхом впливу на середовище їх росту або закриті сховище відповідно до звичайних методів обробки, наприклад, шляхом занурення, мілкокрапельного обприскування, випару, створення штучного туману, розкидання, намазування, а у випадку матеріалу для розмноження, особливо у випадку насіння, шляхом одношарового або багатшарового покриття.

Активні речовини можуть бути перетворені в 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 речовини, мікрокапсульовані в полімерні.

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 також органічні розчинники як допоміжні засоби, що поліпшують розчинення. Рідкими розчинниками є 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 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 вода.

Як тверді носії, наприклад, мають на увазі солі амонію або помели природних каменів, таких як каоліни, глиноземи, тальк, крейда, кварц, атапульгіт, монтморилоніт або діатомова земля, та помели синтетичних каменів, такі як високодисперсна кремнієва кислота, окис алюмінію та силікати; як тверді носії для гранулятів мають на увазі подрібнені та фракціоновані природні кам'яні породи, такі як кальцит, мармур, пемза, сепіоліс, доломіт та 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 ціноутворюючі засоби мають на увазі, наприклад, неіоногенні і 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 мають на увазі, наприклад, відпрацьовані лігнінсульфітні луги та метилцеллюлозу.

У рецептурах можуть застосовуватися речовини, що поліпшують адгезію, такі як карбоксиметилцелюлоза, природні або 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 та рослинні олії.

В даному винаході можуть застосовуватися барвники, такі як неорганічні пігменти, наприклад, оксид заліза, оксид титану, фероціан синій, та органічні барвники, такі як алізарин-, азо- та металфталоціанінові барвники, а також слідові кількості живильних мікроелементів, такі як солі заліза, мар-

ганцю, 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.

Запропоновані згідно з даним винаходом активні речовини можуть бути використані у своїй препаративній формі або змішані з відомими фунгіцидами, бактерицидами, акарицидами, нематицидами або інсектицидами з метою розширення спектру впливу або припинення розвитку опору. У багатьох випадках при цьому виникає синергістичний ефект, тобто ефективність суміші є більшою, ніж ефективність окремих компонентів. Для змішування використовуються, наприклад, такі сполуки:

Фунгіциди:

Алдиморф, ампропілфос, ампропілфос-калій, андоприм, анілазин, азаконазол, азоксистробін, беналаксил, беноданіл, беноміл, бензамакрил, бензамакрил-ізобутил, біалафос, бінапакрил, бі-феніл, бітертанол, бластицидин-S, бромуконазол, бупіримат, бутіобат,

полісульфід кальцію, капсимицин, каптафол, каптан, карбендазин, карбоксин, карвон, хінометіонат (квінометіонат), хлобензтіазон, хлорфеназол, хлоронеб, хлоропикрин, хлороталоніл, хлозолинат, хлзилакзон, куфранеб, цимоксаніл, ципроконазол, ципродиніл, ципрофурам,

дебакарб, дихлорофен, диклбутразол, диклофлуанід, дикломецин, диклоран, діетофенкарб, дифеноконазол, диметиримол, диметоморф, диниконазол, диниконазол-м, динокап, дифеніламін, дипіритон, диталіміфос, дитіанон, додеморф, додіне, дразоксолон, едифенфос, епоксиконазол, етаконазол, етиримол, етридіазол, фамоксадон, фенапаніл, фенаримол, фенбуконазол, фенфурам, фенітропан, фенпіклоніл, фенпропидин, фенпропіморф, фенілінацетат, фенілінгідроксид, фербам, феримзон, флуазинам, флуметовер, флуоромід, флухінконазол, флурпримідол, флузилазол, флусульфамід, флутолаліл, флутриазол, фолпет, фозетил-алюміній, фозетил-натрій, фталід, фуберидазол, фуралаксил, фураметпір, фуркарбоніл, фурконазол, фурконазол-цис, фурмецилокс,

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

іміноктадинетриацетат, йодокарб, іпконазол, іпробенфос (IBP), 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, меферимзон, мепаніпирим, мепроніл, металаксил, метконазол, метасульфокарб, метфуроксам, метирам, метомеклам, метсульфовакс, мілдіоміцин, миклобутаніл, миклозолін,

диметилдитіокарбамат нікелю, нітроталізопропіл, нуаримол,

офурак, оксаксидил, оксамокарб, оксолінікацид, оксикарбоксим, оксифеніліін, паклобутразол, пефуразоат, пенконазол, пенцикурон, фосдифен,

пімарицин, піпералін, поліоксин, поліоксорим, пробеназол, прохлораз, процимідон, пропамокарб, пропанозин-натрій, пропіконазол, пропінеб, піразофос, пірифенокс, піриметаніл, пірохілон, піроксифур,

хінконазол, хінтоцен (PCNB),

сірка та сполуки сірки,

тебуконазол, теклофталам, текназен, тетциклацис, тетраконазол, тіабендазол, тициофен, тифлузаміди, тіофанате-метил, тирам, тіоксимід, толклофос-метил, толілфлуанід, триадимефон, триадименол, триазбутил, триазоксид, трихлорамід, трициклазол, тридеморф, трифлумізол, трифорин, тритриконазол,

уніконазол,

валідаміцин А, вінклозолін, вініконазол,

зариламід, зинеб, зирам, а також

Даггер G,

ОК-8705,

ОК-8801,

$\alpha$ -(1,1-диметилетил)- $\beta$ -(2-феноксietил)-1H-

1,2,4-триазол-1-етанол,

$\alpha$ -(2,4-дихлорфеніл)- $\beta$ -фтор-*b*-пропіл-1H-1,2,4-триазол-1-етанол,

$\alpha$ -(2,4-дихлорфеніл)- $\beta$ -метокси-*a*-метил-1H-

1,2,4-триазол-1-етанол,

$\alpha$ -(5-метил-1,3-діоксан-5-yl)-3-[[4-(трифторметил)феніл]метиле-н]-1H-1,2,4-триазол-1-етанол,

(5RS,6RS)-6-гідрокси-2,2,7,7-тетраметил-5-(1H-1,2,4-триазол-1-іл)-3-октанон,

(E)- $\alpha$ -(метоксиіміно)-N-метил-2-

феноксифенілацетамід,

1-ізопропіловий естер {2-метил-1-[[[1-(4-метилфеніл)етил]аміно]карбоніл]пропіл}-карбамінової кислоти,

1-(2,4-дихлорфеніл)-2-(1H-1,2,4-триазол-1-іл)-етанон-О-(фенілметил)оксим,

1-(2-метил-1-нафталеніл)-1H-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]-1H-імідазол,

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

1H-1,2,4-триазол,

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

дихлорфеніл)метокси]феніл]етенил]-1H-імідазол,

1-метил-5-нонил-2-(фенілметил)-3-

піролідинол,

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

трифторметил-1,3-тіазол-5-карбоксанлід,

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

метилциклопропанкарбоксамід,

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

2,6-дихлор-N-(4-

трифторметилбензил)бензамід,

2,6-дихлор-N-[[4-

(трифторметил)феніл]метил]бензамід,

2-(2,3,3-триод-2-пропеніл)-2H-тетразол,

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

1,3,4-тіадіазол,

2-[[6-деокси-4-О-(4-О-метил- $\beta$ -D-

глікопіранозил)-*a*-D-глюкопіранозил]аміно]-4-

метокси-1H-піроло[2,3-*d*]піримідин-5-карбоніл,

2-амінобутан,

2-бром-2-(бромметил)пентандинітрил,  
 2-хлор-N-(2,2-дигідро-1,1,3-триметил-1H-інден-4-іл)-3-піридинкарбоксамід,  
 2-хлор-N-(2,6-диметилфеніл)-N-(ізотіоціанатометил)ацетамід,  
 2-фенілфенол (OPP),  
 3,4-дихлор-1-[4-(дифторметокси)феніл]-1H-пірол-2,5-діон,  
 3,5-дихлор-N-[ціан[(1-метил-2-пропініл)окси]метил]бензамід,  
 3-(1,1-диметилпропіл-1-оксо)-1H-інден-2-карбонітрил,  
 3-[2-(4-хлорфеніл)-5-етокси-3-ізоксазолідиніл]піридин,  
 4-хлор-2-ціано-N,N-диметил-5-(4-метилфеніл)-1H-імідазол-1-сульфонамід,  
 4-метилтетразоло[1,5-a]хіназолін-5(4H)-он,  
 8-(1,1-диметилетил-N-етил-N-пропіл-1,4-діоксаспіро[4,5]декан-2-метанамін,  
 8-гідроксигінолілсульфат,  
 9H-ксантен-9-карбонової кислоти 2-[(феніламіно)карбоніл]гідразид,  
 біс-(1-метилетил)-3-метил-4-[(3-метилбензоїл)окси]-2,5-тіофендикарбоксилат,  
 цис-1-(4-хлорфеніл)-2-(1H-1,2,4-триазол-1-іл)циклопентанол,  
 гідрохлорид цис-4-[3-[4-(1,1-диметилпропіл)-феніл-2-метил-пропіл]-2,6-диметил]-морфоліну етил [(4-хлорфеніл)азо]ціаноацетат,  
 гідрокарбонат калію,  
 натрієва сіль метантетратіолу,  
 метил 1-(2,3-дигідро-2,2-диметил-1H-інден-1-іл)-1H-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-(тетрагидро-2-оксо-3-фуран)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-тетрагидро-2-піримідинамін,  
 N-(4-гексилфеніл)-1,4,5,6-тетрагідро-2-піримідинамін,  
 N-(5-хлор-2-метилфеніл)-2-метокси-N-(2-оксо-3-оксазолідинілу)ацетамід,  
 N-(6-метокси)-3-піридиніл)циклопропанукарбоксамід,  
 N-[2,2,2-трихлор-1-[(хлорацетил)аміно]етилу]бензамід,  
 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)акрилокси]-морфолін

Бактерициди:

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

Інсектициди/акарициди/нематоциди

Абамектин, ацефати, ацетаміприд, акринатрин, аланікарб, алдикарб, 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, біфенілрин, біоетанометрин, біперметрин, ВРМС, бромфос А, буфенкарб, бупрофецин, бутатіофос, бутокарбоксим, бутилпіридабен,

кадусафос, карбарил, карбофуран, карбофенотіон, карбосульфат, картап, хлоетоккарб, хлоретоксифос, хлорфенапір, хлорфенвінфос, хлофлуазурон, хлормефос, хлорпірифос, хлорпірифос М, хловапартрин, цис-резметрин, цисперметрин, клоцитрин, клоетоккарб, клофенілезини, ціанофос, циклопрени, циклопротрин, цифлутрин, цигалотрин, цигексатин, циперметрин, циромацизи,

дельтаметрин, деметон-м, деметон S, деметон-S-метил, діафеніліурон, діацинон, дихлорвос, дифлубензурон, диметоат, диметилвінфос, діофенолан, дисульфотон, докузат-натрій, дофенапін,

ефлузіланат, емаектин, емпентрин, ендосульфат, *Entomophthora* spp., есфенвалерати, етіофенкарб, етіон, етопрофос, етофенпрокс, етоксазоли, етримфос,

фенаміфос, феназахіін, фенбутатин оксид, фенітротіон, фенотіокарб, феноксакрим, феноксикарб, фенпропатрин, фенпірад, фенпіритрин, фенпіроксимати, фенваперати, фіпроніл, флуацинам, флуазурон, флуброцитринат, флуциклоксурон, флуцитринати, флуфеноксурон, флутензини, флувалінати, фонофос, фосметилан, фостіазати, фубфенпрокс, фураціокарб,

гранулоподібні віруси, галофенозиди, HCH, гептенофос, гексафлу-мурон, гексилтіазокс, гідропрени,

імідаклопрід, ізазофос, ізофенфос, ізоксатіон, івермектин,

віруси полієдрога,

ламбда-цигатрин, луфенурон,

малатіон, мекарбам, метальдегід, метамідофос, *Metharhizium anisopliae*, *Metharhizium flavoviride*, метидатіон, метіокарб, метоміл, метоксифенозиди, метолкарб, метоксидіазони, мевінфос, мілбемектин, монокротофос,

налед, нитенпірам, нитіазини, новалурон,

ометоат, оксаміл, оксидеметон М,

*Raecilomyces fumosoroseus*, паратіон А, паратіон М, перметрин, фенілоат, форат, фозалони, фозмет, фосфамідон, фоксим, піримікарб, піриміфос А, піриміфос М, профенофос, промеккарб, пропоксур, протіофос, протоат, піметрозини, піраклофос, пірезметрин, піретрум, піридабен, пірида-тіон, піримідифен, пірипроксифен,

хіналфос,  
рибавірин,  
салітрон, себуфос, силафлуофен, спіносад,  
сульфотеп, сулпрофос,  
тау-флувалінати, тебуфенозида, тебуфенпі-  
рад, тебупіриміфос, тефлубензулон, тефлутрин,  
темефос, темівінфос, тербуфос, тетрахлорвін-  
фос, тета-циперметрин, тіаметоксам, тіапроніл,  
тіатрифос, тіоциклам гідрооксалати, тіодикарб,  
тіофанокс, турингієнсин, тралоцитрин, траломет-  
рин, триаратени, триазамати, триазофос, триазу-  
рон, трихлорфенідини, трихлорфон, трифлумурон,  
триметакрб,  
вамідотіон, ваніліпроли, *Verticillium lecanii*,  
YI 5302,  
зета-циперметрин, золапрофос,  
(1R-цис)-[5-(фенілметил)-3-фураніл]-метил-3-  
[(дигідро-2-оксо-3(2H)-фуранілден)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-бензоіл-1-(1,1-диметилетил)]гідразид бен-  
зойної кислоти,  
2,2-диметил-3-(2,4-дихлорфеніл)-2-оксо-1-  
оксапіро[4,5]дец-3-ен-4-іловий естер бутанової  
кислоти,  
[3-[(6-хлор-3-піридиніл)метил]-2-  
тіазолідинілден]ціанамід,  
дигідро-2-(нітрометил)-2H-1,3-тіазин-3(4H)-  
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-1H-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,  
O,O-діетил-[2-(дипропіламіно)-2-  
оксоетил]етилфосфорамідотіат,  
N-ціанометил-4-трифторметилнікотинамід,  
3,5-дихлор-1-(3,3-дихлор-2-пропенілокси)-4-[3-  
(5-трифторметилпіридин-2-ілокси)-  
пропокси]бензол.

Крім того, запропоновані активні речовини при використанні як інсектициди можуть бути представлені своїми комерційно доступними препаративними формами, а також формами, отриманими з таких препаративних форм у суміші із синергічними агентами. Синергічними агентами є сполуки, завдяки яким підвищується ефективність активних речовин без самостійної активності синергічного агенту.

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

Використання проводять 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 гарною стабільністю до лугів на вапнованих основах.

Як було вже зазначено вище, відповідно до даного винаходу можлива обробка всіх рослин або їх частин. У переважному варіанті здійснення обробляють види та сорти рослин, а також їх частини, вирощені або одержані за умов біологічного розведення, наприклад, схрещуванням або злиттям протопластів. В іншому переважному варіанті здійснення обробляють трансгенні рослини та сорти рослин, одержані за генотехнологічними методами, в разі необхідності, у комбінації з умовними методами (генетично модифіковані організми) та їх частини. Поняття «частини» або «частини рослин» або «орган рослин» пояснено 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 умовним розведенням, мутагенезом або рекомбінантними методиками ДНК. Це можуть бути сорти, біотики та генотипи.

Залежно від виду або сорту рослин, їх місцезнаходження і умов росту (фунт, клімат, період вегетації, харчування) у результаті обробки відповідно до винаходу 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, поліпшення росту рослин, підвищена толерантність по відношенню до високих або низьких температур, підвищена толерантність до нестачі води або до вмісту солей у воді або у фунті, 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, що виходять за межі власне очікуваних ефектів.

До переважних трансгенних (отриманих з використанням генних технологій) рослин, відповідно, сортам рослин, які варто обробляти, відповідно до винаходу, відносяться всі рослини, що одержали генетичний матеріал при модифікації за генною технологією, що додав цим рослинам особливо

кращі цінні властивості. Прикладами таких властивостей є кращий ріст рослин, підвищена толерантність стосовно високих або низьких температур, підвищена толерантність до недостатку вологи або до змісту солей у воді, відповідно, у ґрунті, підвищена продуктивність при цвітінні, полегшення збору врожаю, прискорення дозрівання, більш високий врожай, більш висока якість та/або більш висока поживність продуктів врожаю, краща збереження та/або краща перероблюваність продуктів врожаю. Інші і особливо кращі приклади таких властивостей - це підвищена стійкість рослин до тваринних шкідників та до мікробів, таким як комахи, кліщі, патогенні для рослин грибки, бактерії та/або віруси, а також підвищена толерантність рослин до визначених гербіцидних активних речовин. Як приклади трансгенних рослин особливо переважно згадати важливі культурні рослини, такі як зернові (пшениця, рис), кукурудза, рис, соя, картопля, бавовна, рапс, а також фруктові рослини (із плодами яблук, груш, плодами цитрусових та винограду), причому кукурудза, соя, картопля, бавовна та рапс особливо переважні. Як властивості особливо віддають перевагу підвищеній стійкості рослин до комах у зв'язку з токсинами, що утворюються в рослинах, особливо такими, котрі створюються за допомогою генетичного матеріалу з *Bacillus Thuringiensis* (наприклад, за допомогою генів CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb та CryIF, а також їх комбінацій) у рослинах (надалі "Бт. рослини"). Як властивості далі особливо цінується підвищена толерантність рослин стосовно визначених гербіцидно активних речовин, наприклад, імідазолів, сульфонілсечовин, гліфозатів або фосфінотрицину (наприклад, "PAT"-ген). Гени, що забезпечують бажані властивості, можуть зустрічатися в трансгенних рослинах та в комбінаціях між собою. Як приклади "Бт. рослин" можна назвати сорти кукурудзи, сорти бавовни, сорти сої та сорти картоплі, що поставляються під торговельними марками YIELD GARD® (наприклад, кукурудза, бавовна, соя), KnockOut® (наприклад, кукурудза), StarLink® (наприклад, кукурудза), Bollgard® (бавовна), Nucotn® (бавовна) і NewLeaf® (картопля). Як приклади толерантних до гербіцидів рослин варто назвати сорти кукурудзи, сорти бавовни та сорти сої, що поставляються під торговельними марками Roundup Ready® (толрантність до гліфозату, наприклад, кукурудза, бавовна, соя), Liberty Link® (толрантність до фосфінотрицину, наприклад, рапс), IMI® (толрантність до імідазолінів) та STS® (толрантність до сульфонілсечовин, кукурудза). У якості стійких до гербіцидів (традиційно вирощуваних, як толерантні до гербіцидів) рослин варто згадати та поставляються під назвою Clearfield® сорти (наприклад, кукурудза). Зрозуміло, що ці висловлення справедливі та для сортів рослин, що будуть створені в майбутньому, відповідно, які в майбутньому потраплять на ринок, з цими або в майбутньому створеними генетичними властивостями.

Найбільш переважно згідно з винаходом зазначені рослини можуть бути оброблені сполуками формули (I) або сумішами активних речовин. Ви-

щевказані області переважних значень активних речовин або сумішей також використовують для обробки таких рослин. Найбільш переважно обробку рослин проводять спеціально описаними в даному тексті сполуками або сумішами.

Запропоновані згідно з даним винаходом активні речовини ефективні не тільки у боротьбі проти шкідників рослин, побутових шкідників та шкідників запасів, а також у ветеринарії проти паразитів тварин (ектопаразитів), таких як пасовищні кліщі, шкірні кліщі, коростяві кліщі, краснотілки, мухи (що жалять і що лижуть), личинки мух, що паразитують, власоді, пухоїди і блохи. До таких паразитів відносяться:

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

З ряду пухоїди і підзагону *Amblycerina*, а також *Ischnocera*, наприклад, *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Damalina* spp., *Trichodectes* spp., *Felicola* spp.

З ряду двокрили і 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) і ряду метастигматичних кліщів, а також мезостигматичних кліщів, наприклад, *Argas* spp., *Omithodorus* 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* і *Acaridida*, 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., *Notodres* spp., *Knemidocoptes* spp., *Cytodites* spp., *Laminosioptes* spp.

Згідно з даним винаходом активні речовини формули (I) придатні для боротьби з членистоногими, що вражають сільськогосподарську промислову худобу, наприклад, велику рогату худобу, овець, кіз, коней, свиней, віслуків, верблюдів, буйволів, кроликів, курей, індичок, вутки, гусаків,

бджіл, інших домашніх тварин, таких як, наприклад, собаки, коти, кімнатні птахи, акваріумні рибки, 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 (м'ясо, молоко, вовна, шкіра, яйця, мед і т.д.), отже завдяки застосуванню запропонованих згідно з даним винаходом активних речовин можливо економічне та просте утримання тварин. Застосування активних речовин згідно з винаходом відбувається у ветеринарній практиці звичайними способами при введенні в кишечник, наприклад, у формі таблеток, капсул, напоїв, просочень, гранулятів, паст, пігулок, з їжею, пелюстків, при парентеральному введенні, наприклад, при ін'єкціях (внутрішньом'язових, з катетором, внутрішньовенним, внутрішньоперитоніальним та іншим шляхом), у виді імплантатів, при введенні в ніс, при шкірному застосуванні, наприклад, зануренням або купанням, обприскуванням, обливанням зверху, миттям, напудрюванням, а також за допомогою засобів, що утримують активні речовини, визначеної форми, таких як нашійники, вушні марки, хвостові марки, стрічки на різних частинах тіла, пов'язки, пристрої для маркірування і т.д.

При застосуванні для худоби, птахів, домашніх тварин і т.п. можна використовувати активні речовини формули (I) у вигляді рецептур (наприклад, порошок, емульсія, текучих засобів), що містять активні речовини в кількості від 1 до 80 ваг.%, безпосередньо або після від 100 до 10000 кратного розведення або використовувати у вигляді хімічної лазні.

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

Як приклад, який проте не обмежує винахід, слід переважно згадати такі комахи:

жуки, такі як

*Hylotrupes bajulus*, *Chlorophorus pilosis*, *Anobium punctatum*, *Xestobium rufovillosum*, *Ptilinus pecticornis*, *Dendrobium pertinex*, *Ernobius 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*,

щетинохвостки, такі як *Lepisma saccharina*.

Під технічними матеріалами у зв'язку зі сказаним вище слід розуміти матеріали, такі як, переважно, пластмаси, клеючі речовини, глини, папір та картон, шкіра, деревина, продукти переробки деревини та лакофарбові матеріали.

Особливо переважно тут йдеться 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, шухляди, піддони, контейнери, телефонні стовпи, дерев'яне облицювання, дерев'яні вікна та двері, фанеру, кріпильні плити, столярні вироби та продукти з дерева, що, як правило, застосовуються в житловому будівництві та у будівельних столярних роботах.

Комбінації активних речовин можуть використовуватися як самостійно, так і у вигляді концентратів або звичайно застосовуваних рецептур, таких як порошки, грануляти, розчини, суспензії, емульсії або паст.

Названі рецептури можуть бути виготовлені відомими способами, наприклад, при змішуванні активних речовин з щонайменше одним розчинником або розріджувачем, емульгатором, диспергуючим та/або зв'язуючим або фіксуючим засобом, водовідштовхувальним засобом, в разі необхідності, сикативом або УФ-стабілізатором та, в разі необхідності, барвниками та пігментами, а також іншими допоміжними засобами для обробки.

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

Кількість застосовуваного засобу або концентрату залежить від виду та поширення комах та від середовища розповсюдження. Оптимальна застосовувана кількість може визначатися за допомогою ряду тестувань. Як правило, досить застосовувати від 0,0001 до 20 ваг.%, переважно, від 0,001 до 10 ваг.% активної речовини, у перерахуванні на матеріал, що захищається.

Як розчинник та/або розріджувач застосовується органічний хімічний розчинник або суміш розчинників, та/або масляний або олієподібний паганолеткий органічний хімічний розчинник або суміш розчинників, та/або полярний органічний хімічний розчинник або суміш розчинників, та/або вода та, в разі необхідності, емульгатор, та/або змочувальна речовина.

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 відповідно нафту або її фракції, що містять ароматичні сполуки, або суміші розчинників, що містять нафту, переважно, тестбензин, керосин та/або алкілбензол.

Переважаючими для застосування є нафти з температурою кипіння в межах від 170 до 220°C, тестбензин з температурою кипіння в межах від 170 до 220°C, веретенне масло з температурою кипіння в межах від 250 до 350°C, керосин або ароматичні сполуки з температурою кипіння в межах від 160 до 280°C, терпентинол і т.п.

В одній із переважних форм виконання засто-

совують рідкі аліфатичні вуглеводні з температурою кипіння в межах від 180 до 210°C або висококиплячі суміші ароматичних та аліфатичних вуглеводнів з температурою кипіння в межах від 180 до 220°C та/або веретенну олію, та/або монохлорнафталін, переважно,  $\alpha$ -монохлорнафталін.

Органічні поганолеткі масляні або олієподібні розчинники з коефіцієнтом летючості понад 35 та з температурою спалаху вище 30°C, переважно, вище 45°C, можуть бути частково замінені легко-середньоюлеткими 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 частини 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 етерні, та/або естерні групи, як, наприклад, гліколевий етер, естер або т.п.

Як органічні хімічні зв'язуючі засоби у рамках даного винаходу застосовують відомі самі по собі штучні смоли та/або висихаючі олії, що розбавляються водою та/або розчиняються, диспергуються або емульгуються використовуваними органічними хімічними розчинниками. Особливо придатним є зв'язувальні речовини, що складаються з або містять акрилову смолу, вінілову смолу, наприклад, полівінілацетат, поліетерну смолу, поліконденсаційну смолу або смолу, отриману при поліприсаднанні, поліуретанову смолу, алкідну смолу або модифіковану алкідну смолу, фенольну смолу, вуглеводну смолу, таку як інден-кумаронову смолу, 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 можуть застосовуватись також бітуми або бітумінозні речовини у кількості до 10ваг.%. Додатково застосовують відомі барвники, пігменти, водовідштовхувальні матеріали, речовини що коригують запах, та інгібітори або засоби захисту від корозії і т.п.

Згідно з винаходом до складу засобу або концентрату як органічні, хімічні зв'язувальні матеріали переважно входять щонайменше одна алкідна смола або модифікована алкідна смола та/або рослинна олія, що висихає. Переважно згідно з винаходом застосовують алкідні смоли із вмістом олії більше 45ваг.%, переважно, від 50 до 68ваг.%. Згаданий зв'язувальний матеріал може бути цілком або частково замінений фіксуючим засобом (сумішшю) або пластифікатором (сумішшю). Ці добавки повинні перешкоджати зникненню активних речовин, а також кристалізації або їх осадженню. Переважно вони заміняють від 0,01 до 30% зв'язувального матеріалу (у перерахуванні на 100% використаного зв'язувального матеріалу).

Пластифікатори вибирають з 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 амилстеарат, олеатів, таких як бутилолеат, гліцеринових етерів або високомолекулярних гліколевих етерів, гліцеринових естерів, а також естерів п-толуолсульфоновой кислоти.

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

Розчинники та розріджувачі може бути також вода, в разі необхідності, у суміші з одним або декількома згаданими вище органічними, хімічними розчинниками або розріджувачами, емульсифікаторами та диспергуючими засобами.

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

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

Як додаткові добавки можна використовувати інсектициди та фунгіциди, зазначені переважно в міжнародній заявці на патент WO 94/29 268. Сполуки, наведені в даній заявці, є визначеними складовими запропонованого винаходу.

Найбільш переважними добавками можуть бути інсектициди, такі як хлорпірифос, фоксим, силлафлюофін, альфаметрин, цифлутрин, циперметрин, дельтаметрин, перметрин, імідаклоприд, NI-25, флюфеноксурон, гексафлюмурон, трансфлютрин, тіахлорид, метоксифеноксид та трифлюмурон, а також фунгіциди, такі як епоксиконазоли, гексаконазол, азаконазол, пропіконазол, тебуконазол, кіпроконазол, метконазол, імазаліл, дихлорфлюанід, толілфлюанід, 3-йод-2-пропінілбутилкарбамат, N-октил-ізотіазолін-3-он та 4,5-дихлор-N-октилізотіазолін-3-он.

Одночасно сполуки згідно з винаходом можуть застосовуватись для захисту від обростання предметів, зокрема корпусів кораблів, сит, мереж, будівельних споруд, портових причалів та сигнальних пристроїв, що торкаються до морської або баластової води.

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

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

Неочікувано було виявлено, що сполуки згідно з винаходом або їх комбінації з іншими активними речовинами проявляють дуже гарний ефект 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-хлорфеноксид)олово, оксид трибутилолово, молібдендисульфід, оксид миш'яку, полімерний бутилтитанат, феніл-(біс-піридин)вісмутхлорид, три-н-бутилоловофторид, марганецетилен-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 трибутилолова, або значно зменшити концентрацію цих сполук.

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

Придатними партнерами у комбінації протиобростаючих засобів згідно з винаходом, є переважно:

Альгіциди, такі як

2-трет.-бутиламіно-4-циклопропіламіно-6-метилтіо-1,3,5-триазин, дихлорофен, діурон, ендотал, феніліацетат, ізопротурон, метабензтиазурон, оксифлуорфен, хінокламін або тербутрин;

фунгіциди, такі як

SS-діоксид циклогексиламіду бензо[b]тіофенкарбонової кислоти, дихлофлуанід, флуорфолпет, 3-йод-2-пропініл-бутилкарбамат, толіфлуанід та азоли, такі як азаконазоли, ципроконазоли, епоксиконазоли, гексаконазоли, метконазоли, пропіконазоли та тебуконазоли;

моллюскоциди, такі як

феніліацетат, метальдегід, метіокарб, никлозамід, тіодикарб та триметакарб; або звичайні протиобростаючі активні речовини, такі як

4,5-дихлор-2-октил-4-ізотіазолін-3-он, дийод-метилпаратрилсульфон, 2-(N,N-диметилтіокарбамоїлтіо)-5-нітротіазил, калієві, мідні, натрієві та цинкові солі 2-піридинтіол-1-оксиду, піридинтрифенілборан, тетрабутилдистанноксан, 2,3,5,6-тетрахлор-4-(метилсульфоніл)піридин, 2,4,5,6-тетрахлорізофталонітрил, тетраметилтіурамдисульфід та 2,4,6-трихлорфенілмалеїнімід.

Застосовувані протиобростаючі засоби містять згідно з винаходом активну речовину в концентрації від 0,001 до 50 ваг.%, переважно, від 0,01 до 20 ваг.%.

Протиобростаючі засоби містять, крім того, звичайні складові частини, як описано, наприклад, у [Ungerer, Chem. Ind., 1985, 37, 730-732 або в Williams, Antifouling Marine Coatings, Noyes, Park Ridge, 1973].

Протиобростаючі лакофарбові матеріали містять поряд з альгіцидними, фунгіцидними, моллюскоцидними та інсектицидними активними речовинами зокрема 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 масло 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, переважно нерозчинні в морській воді. Крім того, лакофарбові матеріали можуть містити колофоніум, для створення можливості керуваного вивільнення активних речовин. Крім того, лакофарбові матеріали можуть містити пом'якшувачі, що модифікують засоби, які впливають на реологічні властивості, а також інші звичайні компоненти. В самополірувальній протиобростаючій системі можуть також бути використані сполуки щільно з винаходом або зазначені вище суміші.

Активні речовини придатні також для боротьби зі шкідниками тварин, особливо з комахами, паукopodobними та кліщами, що живуть у замкнутих просторах, наприклад, квартирах, фабричних цехах, установах, кабінах автомобілів та інших. Вони застосовуються для боротьби з цими шкідниками окремо або в комбінації з іншими активними або допоміжними речовинами, що використовуються в інсектицидних продуктах для домашнього господарства. Вони ефективні проти чутливих та стійких видів, а також на всіх стадіях розвитку. До цих шкідників належать:

3 ряду скорпіони, наприклад, *Buthus occitanus*.

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

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

3 ряду сінококси, наприклад, *Pseudoscorpiones cheiifer*, *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 asahinai*, *Leucophaea maderae*, *Panchlora spp.*, *Parcoblatta spp.*, *Periplaneta australasiae*, *Periplaneta Americana*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Supella longipalpa*.

3 ряду прямокрилі, наприклад, *Acheta domesticus*.

3 ряду шкірокрилі, 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., *Dermestes* 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*, *Chrysozona pluvialis*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex pipiens*, *Culex tarsalis*, *Drosophila* spp., *Fannia canicularis*, *Musca domestica*, *Phlebotomus* spp., *Sarcophaga carnaria*, *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 для домашнього господарства здійснюють в такій формі або в 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 аерозолів, засобів для розбризкування, що не знаходяться під тиском, наприклад, спреїв для розбризкування за допомогою насосів та спреїв для обприскування, автоматів для утворення туману, зволожувачів, у вигляді піни, у вигляді гелів, у вигляді продуктів випару з пластинами для випару з целюлози або пластмаси, у вигляді випарників рідин, гелевих та мембранних випарників, у вигляді 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 та пилу, у вигляді принади, що розсипається, та станції з принадою.

Запропоновані активні речовини можуть бути використані як дефоліанти, десиканти, агенти придушення росту трав та абсолютно переважно як агенти для знищення бур'янів. Під бур'янами розуміють всі рослини, що виростають у тих місцях, де вони є небажаними. Тотальна або селективна гербіцидна дія запропонованих згідно з даним винаходом речовин звичайно залежить від норми їх витрати.

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

Дводольні бур'яни родів: *Abutilon* (абутилон),

*Amaranthus* (амарант), *Ambrosia* (амброзія), *Anoda*, *Anthemis* (пупавка), *Aphanes*, *Atriplex* (лобода), *Bellis* (маргаритка), *Bidens* (чепра), *Capsella* (вівчарська сумка), *Carduus* (будяк), *Cassia* (касія), *Centaurea* (волошка), *Chenopodium* (марь), *Cirsium* (бодяк), *Convolvulus* (в'юнок), *Datura* (дурман), *Desmodium*, *Emex*, *Erysimum* (жовтушник), *Euphorbia* (молочай), *Galeopsis*, *Galinsoga* (галинзога), *Galium* (подмареник), *Hibiscus* (гібіскус), *Ipomoea* (іпомея), *Kochia* (кохія), *Lamium* (яснотка), *Lepidium* (блосичник), *Lindernia*, *Matricaria* (матрикарія), *Mentha* (м'ята), *Mercurialis* (пролесник), *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* (сесбания), *Sida* (сида), *Sinapis* (гірчиця), *Solanum* (паслен), *Sonchus* (осот), *Spernoclea*, *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* (вика).

Однодольні бур'яни родів: *Aegilops* (егілопс), *Agropyron* (житняк), *Agrostis* (мітлиця), *Alopecurus* (лисохвіст), *Apera*, *Avena* (овес), *Brachiaria*, *Bromus* (багаття), *Cenchrus*, *Commelina* (комеліна), *Cynodon* (свинорій), *Cyperus* (сить), *Dactyloctenium*, *Digitaria* (росичка), *Echinochloa* (ежовник), *Eleocharis* (болотниця), *Eleusine* (елевсіна), *Eragrostis* (полеви́чка), *Eriochloa*, *Festuca* (овсяниця), *Fimbristylis*, *Heteranthera*, *Imperata*, *Ischaemum*, *Leptochloa*, *Lolium* (плевел), *Monochoria*, *Panicum* (просо), *Paspalum* (гречка), *Phalaris* (канареєчник), *Phleum* (тимофіївка), *Poa* (мятлик), *Rottboellia*, *Sagittaria* (стрелолист), *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 запропонованих згідно з винаходом активних речовин ніяким чином не обмежується зазначеними видами, а поширюється також на інші рослини.

Запропоновані згідно з 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 та хмелевих культур, на декоративних газонах та спортивних майданчиках, на пасовищах, а також для селективної боротьби з бур'янами в однолітніх культурах.

Запропоновані згідно з винаходом сполуки формули (I) демонструють сильну гербіцидну ефективність та широкий спектр дії при обробці ґрунту та зелених частин рослин над поверхнею землі. Вони також є найбільш придатним для селективної боротьби з однодольними та дводольними бур'янами в однодольних та дводольних культурах, при обробці як перед сходженням, так і після сходження рослин.

Запропоновані згідно з винаходом активні речовини у визначеній концентрації або нормі витрати 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 первинні 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, 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, також використовуватися органічні розчинники як допоміжні засоби, що поліпшують розчинення. Рідкими розчинниками є: 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 та рослинні олії, спирти, такі як бутанол або гліколь, а також їх естери та етери, кетони, такі як ацетон, метилетилкетон, метилізобутилкетон або циклогексанон, сильнополярні розчинники, такі як диметилформамід та диметилсульфоксид, а також вода.

Твердими носіями є, наприклад, солі амонію або помели природних каменів, таких як каоліни, глиноземи, тальк, крейда, кварц, атапульгіт, монтморилоніт або діатомова земля та помели синтетичних каменів, такі як високодисперсна кремнієва кислота, окис алюмінію та силікати; твердими носіями для гранулятів є: подрібнені та фракціоновані природні кам'яні породи, такі як кальцит, мармур, пемза, сепіоліс, 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; емульгаторами та/або піноутворюючими засобами є, наприклад,

неіоногенні та аніонні емульгатори, такі як поліоксисетиленовий естер жирної кислоти, поліоксисетиленовий етер жирного спирту, наприклад, алкіларилполігліколевий етер, алкілсульфонати, алкілсульфати, арилсульфонати, а також гідролізати білку; диспергуючими засобами є, наприклад, відпрацьовані лігнінсульфітні луги та метилцелюлозу.

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

Можуть застосовуватися 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, молибдену та цинку.

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

Запропоновані згідно з винаходом активні речовини можуть бути використані у своїй препаративній формі або бути змішані з відомими гербіцидами та/або речовинами, що застосовують при боротьбі з бур'янами для поліпшення сумісності з культурними рослинами (захисні речовини), причому можливим є використання готової препаративної форми або сумішей у резервуарі. Також можливим є використання сумішей з агентами для боротьби з бур'янами, що містять один або кілька відомих гербіцидів та одну захисну речовину.

Для змішування використовують відомі гербіциди, наприклад,

ацетохлор, ацифторфен(-натрій), аклоніфен, алахлор, алоксидим(-натрій), аметрин, амікарбазон, амідохлор, амідосульфурон, анілофос, асулам, атразин, азафенідин, азимсульфурон, бенфлутамід, беназолін(-етил), бенфурезат, бенсульфурон(-метил), бентазон, бензфендізон, бензобіциклон, бензофенап, бензоілпроп(-етил), біалафос, біфенокс, біспірибак(-натрій), бромобутид, бромофеноксим, бромоксиніл, бутахлор, бутафенацил(-аліл), бутроксидим, бутилат, кафенстрол, калоксидим, карбетамід, карфенілразон(-етил), хлометоксифен, хлорамбен, хлоридазон, хлоримурон(-етил), хлорнітрофен, хлорсульфурон, хлортолурун, цинідон(-етил), цинметилін, циносульфурон, клефоксидим, клетодим, клодинафоп(-пропаргіл), кломазон, клометроп, клопіралід, клопірасульфурон(-метил), клорансулам(-метил), кумілурун, ціаназин, цибутрин, циклоат, циклосульфамурон, циклоксидим, цигалофоп(-бутил), 2,4-D, 2,4-DB, десмедифам, диаллат, дикамба, дихлорпроп(-P), диклофоп(-метил), диклосулам, діетатил(-етил), дифензокват, дифлуфенікан, дифлуфензокпір, димефурон, димепиперат, диметахлор, диметаметрин, диметенамід, димексифлам, динітрамін, дифенамід, дикват, дитіопір, діурон, димрон, епроподан, ЕРТС, еспрокарб, еталфлураліін, етаме-

тсульфурон(-метил), етофумезат, етоксифен, етоксисульфурон, етобензанід, феноксапроп(-Р-етил), фенілпразамід, флампроп(-ізопропіл, -ізопропіл-L, -метил), флазасульфурон, флорасулам, флазифоп(-Р-бутил), флазолат, флакарбазон(-натрій), флуфенацет, флуметсулам, флуміклопак(-пентил), флуміоксазин, флуміпропін, флуметсуліам, флуометурон, флуорохлоридон, флуороглікофен(-етил), флуоксам, флупропацил, флупірсульфурон(-метил, -натрій), флуренол(-бутил), флуридон, флуороксибір(-бутоксипропіл, -метил), флурпримідол, флуртамон, флутіацет(-метил), флутіамід, фомесафен, форамсульфурон, глүфозинат(-амоній), гліфозат(-ізопропіламоній), галосафен, галоксифоп(-етоксиетил, -Р-метил), гексазинон, імазаметабенз(-метил), імазаметабір, імазамокс, імазабір, імазабір, імазахін, імазетабір, імазосульфурон, йодосульфурон(-метил, -натрій), іоксиніл, ізопропалін, ізопротурон, ізоурон, ізоксабен, ізоксафлортол, ізоксафлутол, ізоксабірфоп, лактофен, ленаціл, лінурон, МСРА, мекопроп, мефенацет, мезотрион, метамітрон, метазаклор, метабензтіазурон, метобензурон, метобромурон, (альфа-)метолахлор, метосулам, метоксурон, метрибузин, метсульфурон(-метил), молінат, монолінурон, напроанілід, напропамід, небурон, нікосульфурон, норфлуразон, орбенкарб, оризалін, оксадіаргил, оксадіазон, оксасульфурон, оксацикломефон, оксифлуорфен, паракват, пеларгонова кислота, пендиметалін, пендралін, пентоксазон, фенмедифам, піколінафен, піперофос, претілахлор, примісульфурон(-метил), профлуразол, прометрин, пропахлор, пропаніл, пропаквізафоп, пропізохлор, пропоксикарбазон(-натрій), пропізамід, просульфокарб, просульфурон, пірафлуфен(-етил), піразогіл, піразолат, піразосульфурон(-етил), піразоксифен, пірибензоксим, пірибутикарб, піридат, піридатол, пірифталід, піримінобак(-метил), піритіобак(-натрій), хінхлорак, хінмерак, хінокламін, хінзалофоп(-Р-етил, -Р-тефурил), римсульфурон, сетоксидим, симазин, симетрин, сулькотріон, сульфенілразон, сульфометурон(-метил), сульфозат, сульфосульфурон, тебутам, тебутіурон, тепралоксидим, тербутилазин, тербутрин, тенілхлор, тіафлуамід, тіазопір, тидіазимін, тифенсульфурон(-метил), тіобенкарб, тіокарбазил, трапноксидим, триалат, триасульфурон, трибенурон(-метил), триклопир, тридифан, трифлуралін, трифлуксисульфурон, трифлусульфурон(-метил), тритосульфурон.

Для змішування використовують також відомі захисні речовини, такі як, наприклад: AD-67, BAS-145138, беноксакор, клоквінтоцет(-мексил), ціометриніл, 2,4-D, DKA-24, дихлормід, димрон, фенклорим, фенхлоразол(-етил), флуразол, флуксофенім, фурилазол, ізоксадіфен(-етил), МСРА, мекопроп(-Р), мефенпир(-діетил), MG-191, оксабетриніл, PPG-1292, R-29148.

Також можлива 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 можна застосовувати індивідуально, у вигляді їх препаративних форм або приготованих з них форм застосування шляхом

подальшого розведення, таких як готові до вживання розчини, суспензії, емульсії, порошки, пасти та грануляти. Застосування здійснюють звичайним чином, наприклад, шляхом поливання, обприскування, мілкокрапельного обприскування, розкидання.

Згідно з винаходом активні речовини можна наносити як до, так і після появи сходів рослин. Їх можна також вносити в ґрунт перед посівом.

Використовувана кількість активної речовини може коливатися в широких межах. Воно залежить від роду бажаного ефекту. Загалом, норми витрати становлять від 1г до 10кг, переважно від 5г до 5кг, біологічно активної речовини на гектар поверхні ґрунту.

Згідно з винаходом речовини проявляють сильну ефективність проти мікроорганізмів та можуть використовуватися для боротьби з небажаними мікроорганізмами, такими як грибки та бактерії, а також для захисту рослин та матеріалів. Фунгіциди використовують для захисту рослин від *Plasmodiophoromycetes*, *Oomycetes*, *Chytridiomycetes*, *Zygomycetes*, *Ascomycetes*, *Basidiomycetes* та *Deuteromycetes*.

Бактерициди використовують для захисту рослин від *Pseudomonadaceae*, *Rhizobiaceae*, *Enterobacteriaceae*, *Corynebacteriaceae* та *Streptomycetaceae*.

Прикладами, які проте не обмежують винахід, можуть бути також деякі збудники грибкових та бактеріальних захворювань, які належать до наведених вище основних груп:

Види роду *Xanthomonas*, наприклад, *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*;

Види роду *Pseudomonas*, наприклад, *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*;

Види роду *Erwinia*, наприклад, *Erwinia amylovora*;

Види роду *Pythium*, наприклад, *Pythium ultimum*;

Види роду *Phytophthora*, наприклад, *Phytophthora infestans*;

Види роду *Pseudoperonospora*, наприклад, *Pseudoperonospora humuli* або *Pseudoperonospora cubensis*;

Види роду *Plasmopara*, наприклад, *Plasmopara viticola*;

Види роду *Bremia*, наприклад, *Bremia lactucae*;

Види роду *Peronospora*, наприклад, *Peronospora pisi* або *P. brassicae*;

Види роду *Erysiphe*, наприклад, *Erysiphe graminis*;

Види роду *Sphaerotheca*, наприклад, *Sphaerotheca fuliginea*;

Види роду *Podosphaera*, наприклад, *Podosphaera leucotricha*;

Види роду *Venturia*, наприклад, *Venturia inaequalis*;

Види роду *Pyrenophora*, наприклад, *Pyrenophora teres* або *P. graminea* (*Drechslera*, синонім: *Helminthosporium*);

Види роду *Cochliobolus*, наприклад, *Cochliobolus sativus* (*Drechslera*, синонім: *Helminthosporium*);

Види роду *Uromyces*, наприклад, *Uromyces appendiculatus*;

Види роду *Puccinia*, наприклад, *Puccinia recondita*;

Види роду *Sclerotinia*, наприклад, *Sclerotinia sclerotiorum*;

Види роду *Tilletia*, наприклад, *Tilletia caries*;

Види роду *Ustilago*, наприклад, *Ustilago nuda* або *Ustilago avenae*;

Види роду *Pellicularia*, наприклад, *Pellicularia sasakii*;

Види роду *Pyricularia*, наприклад, *Pyricularia oryzae*;

Види роду *Fusarium*, наприклад, *Fusarium culmorum*;

Види роду *Botrytis*, наприклад, *Botrytis cinerea*;

Види роду *Septoria*, наприклад, *Septoria nodorum*;

Види роду *Leptosphaeria*, наприклад, *Leptosphaeria nodorum*;

Види роду *Cercospora*, наприклад, *Cercospora canescens*;

Види роду *Alternaria*, наприклад, *Alternaria brassicae*;

Види роду *Pseudocercospora*, наприклад, *Pseudocercospora herpotrichoides*.

Згідно з винаходом активні речовини проявляють також сильний вплив на рослини. Вони здатні мобілізувати захисні властивості рослин у боротьбі з небажаними мікроорганізмами.

Під речовинами, що збільшують захисні властивості рослин (що зменшують опір) в даному контексті слід розуміти такі речовини, які здатні настільки стимулювати оборонну систему рослин, що оброблені рослини при подальшому зараженні небажаними мікроорганізмами проявлятимуть значний опір проти цих мікроорганізмів.

До небажаних мікроорганізмів в даному випадку належать фітопатогенні грибки, бактерії та віруси. Згідно з винаходом речовини можуть також бути використані з метою захисту рослин від нападу названих шкідливих організмів протягом певного проміжку часу після обробки. Цей проміжок часу загалом складає від 1 до 10 днів, переважно від 1 до 7 днів після обробки рослин активними речовинами.

Гарна сумісність рослин з активними речовинами, застосовуваними у концентраціях, необхідних для боротьби з хворобами рослин, дозволяє обробляти частини рослин, що знаходяться над поверхнею ґрунту, насіння та самого ґрунту.

Активні речовини згідно з винаходом придатні також для збільшення кількості врожаю. Крім того вони є майже нетоксичними та демонструють гарну сумісність з рослинами.

Активні речовини згідно з винаходом, в разі необхідності, в певних концентраціях та нормах витрат можуть також бути використані як гербіциди, як регулятори росту рослин, а також для боротьби з тваринними шкідниками. В разі необхідності, вони також використовуються як проміжні або первинні продукти для синтезу інших активних речовин. У захисті матеріалів речовини згідно з винаходом можуть використовуватися для захисту технічних матеріалів від нападу небажаних мікроорганізмів та завданого ними руйнування.

Під технічними матеріалами в цьому контексті слід розуміти неживі матеріали, виготовлені для

використання у техніці. Прикладами можуть бути технічні матеріали, які за допомогою активних речовин згідно з винаходом необхідно захищати від змін та руйнувань, спричинених мікроорганізмами, клеючі речовини, глини, папір та картон, текстильні вироби, шкіра, деревина, лакофарбові матеріали та пластмаса, змазувально-охолоджувальні речовини та інші матеріали, які можуть постраждати від нападу мікроорганізмів. Серед матеріалів, що підлягають захисту, слід також назвати частини виробничих пристроїв, наприклад, циркуляція охолоджувальної води, яким розмноження мікроорганізмів може завдати значної шкоди. В рамках даного винаходу як технічні матеріали слід назвати переважно клей, клеючі речовини, папір та картон, шкіру, деревину, лакофарбові матеріали, змазки та рідини, що переносять тепло, особливо переважно деревину.

Прикладами мікроорганізмів, що можуть зруйнувати або змінювати технічні матеріали, є бактерії, гриби, дріжджі, водорості та слизовики. Активні речовини згідно з винаходом переважно діють проти грибів, зокрема плісені, грибів, що змінюють колір деревини та руйнують її (*Basidiomyceten*), а також проти слизовиків та водорістей.

Слід назвати, наприклад, мікроорганізми таких видів:

Види роду *Alternaria*, наприклад, *Alternaria tenuis*,

Види роду *Aspergillus*, наприклад, *Aspergillus niger*,

Види роду *Chaetomium*, наприклад, *Chaetomium globosum*,

Види роду *Coniophora*, наприклад, *Coniophora puetana*,

Види роду *Lentinus*, наприклад, *Lentinus tigrinus*,

Види роду *Penicillium*, наприклад, *Penicillium glaucum*,

Види роду *Polyporus*, наприклад, *Polyporus versicolor*,

Види роду *Aureobasidium*, наприклад, *Aureobasidium pullulans*,

Види роду *Sclerophoma*, наприклад, *Sclerophoma pityophila*,

Види роду *Trichoderma*, наприклад, *Trichoderma viride*,

Види роду *Escherichia*, наприклад, *Escherichia coli*,

Види роду *Pseudomonas*, наприклад, *Pseudomonas aeruginosa*,

Види роду *Staphylococcus*, наприклад, *Staphylococcus aureus*.

Активні речовини в залежності від їх фізичних та/або хімічних властивостей можуть бути перетворені в звичайні препаративні форми, такі як розчини, емульсії, суспензії, порошки, піни, пасти, грануляти, аерозолі, мікрокапсульовані в полімерні речовини та оболонки для насіння, а також УФ-автоматів для утворення туману.

Зазначені препаративні форми одержують відомим способом, наприклад, змішуванням активних речовин з розріджувачами, наприклад, рідкими розчинниками, газами під тиском та/або твердими носіями, в разі необхідності, з використанням поверхнево-активних речовин, наприклад, емульга-

торів та/або диспергаторів та/або піноутворювачів. У випадку використання води як розріджувача можуть, наприклад, використовуватися також органічні розчинники як допоміжні засоби, що поліпшують розчинення. Як розчинники використовують ароматичні сполуки, такі як ксилол, толуол або алкілнафталіни, хлоровані ароматичні сполуки або хлоровані аліфатичні вуглеводні, такі як хлорбензоли, хлоретилени або метилхлорид, аліфатичні вуглеводні, такі як циклогексан або парафіни, наприклад, фракції нафти, мінеральні та рослинні олії, спирти, такі як бутанол або гліколь, а також їх етери та етери, кетони, такі як ацетон, метилетилкетон, метилізобутилкетон або циклогексанон, сильнополярні розчинники, такі як диметилформамід та диметилсульфоксид, а також вода. Газоподібними розріджувачами або носіями є такі рідини, які при нормальній температурі та нормальному тиску представлені у вигляді газу, такі як, аерозолі, газоподібне пальне, наприклад, галогенвуглеводні, такі як бутан, пропан, азот та діоксид вуглецю. Як тверді носії мають на увазі: наприклад, солі амонію або помели природних каменів, таких як каоліни, глиноземи, тальк, крейда, кварц, атапульгіт, монтморилоніт або діатомова земля та помели синтетичних каменів, такі як високодисперсна кремнієва кислота, окис алюмінію та силікати, як тверді носії для гранулятів мають на увазі: здрібнені та фракціоновані природні кам'яні породи, такі як кальцит, мармур, пемза, сепіоліс, 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 диспергуючі засоби мають на увазі: наприклад, відпрацьовані лігнінсульфітні луги та метилцеллюлозу.

У рецептурах можуть застосовуватися речовини, що поліпшують адгезію, такі як карбоксиметилцелюлоза, природні або синтетичні порошокподібні, 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 та рослинні олії.

Можуть застосовуватися 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 95 ваг.% активної речовини, переважно, від 0,5 до 90 ваг.% активної речовини.

Активні речовини згідно з винаходом можуть використовуватися як такі або у своїй препаративній формі та в суміші з відомими фунгіцидами, бактерицидами, акарицидами, нематоцидами або інсек-

тицидами з метою розширення спектру впливу або припинення розвитку опору. У багатьох випадках при цьому виникає синергістичний ефект, тобто ефективність суміші є більшою, ніж ефективність окремих компонентів. Для змішування використовуються, наприклад, такі сполуки:

Фунгіциди:

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

беналаксил, беноданіл, беноміл, бензамакрил, бензамакрил-ізобутил, біалафос, бінапакрил, бі-феніл, бітертанол, бластицидин-S, бромуконазол, бупіримат, бутіобат,

полісульфід кальцію, капсимицин, каптафол, каптан, карбендазин, карбоксин, карвон, хінометіонат (квінометіонат), хлобензтіазон, хлорфеназол, хлоронеб, хлоропікрин, хлороталоніл, хлзолинат, хлзилакзон, куфранеб, цимоксаніл, ципроконазол, ципродиніл, ципрофурам,

дебакарб, дихлорофен, диклбутразол, диклофлуанід, дикломецин, диклоран, діетофенкарб, дифеноконазол, диметиримол, диметоморф, диниконазол, диниконазол-м, динокап, дифеніламін, дипіритіон, диталімфос, дитіанон, додеморф, додіне, дразоксолон,

едифенфос, епоксиконазол, етаконазол, етиримол, етридіазол,

фамоксадон, фенапаніл, фенаримол, фенбуконазол, фенфурам, фенітропан, фенпіклоніл, фенпропидин, фенпропіморф, фенілінацетат, фенілінгідроксид, фербам, феримзон, флуазинам, флуметовер, флуоромід, флухінконазол, флурп-рими́дол, флузилазол, флусулфамід, флутолани́л, флутріафол, фолпет, фозетил-алюміній, фозетил-натрій, фталід, фуберидазол, фуралаксил, фураметпір, фуркарбоніл, фурконазол, фурконазол-цис, фу́рмецилокс,

гуазатин,

гексахлорбензол, гексаконазол, гімексазол,

імазаліл, імібенконазол, іміноктадин, іміноктадинеалбесилат, іміноктадинетриацетат, йодокарб, іпконазол, іпробенфос (IBP), 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, манкозеп, манеб, меферимзон, мепаніпирим, мепроніл, металаксил, метконазол, метасульфоккарб, метфуроксам, метирам, метомеклам, метсульфовакс, мілдіоміцин, миклбутаніл, миклозолін,

диметилдитіокарбамат нікелю, нітроталізопропіл, нуаримол,

офурак, оксаксидил, оксамокарб, оксолінікацид, оксикарбоксим, оксифеніліїн,

паклбутразол, пефуразоат, пенконазол, пенцикурон, фосдифен, пімарицин, піпералін, поліоксин, поліоксорим, пробеназол, прохлораз, процимідон, пропамоккарб, пропанозин-натрій, пропіконазол, пропінеб, піразофос, пірифенокс, піриметаніл, пірохілон, піроксифур,

хінканазол, хінтоцен (PCNB),

сірка та сполуки сірки,

тебуконазол, теклофталам, текназен, тетциклацис, тетраконазол, тіабендазол, тиціофен, ти-

флузаміди, тіофанате-метил, тирам, тіоксимід, толклофос-метил, толіфлуанід, триадимефон, триадименол, триазбутил, триазоксид, трихламід, трициклазол, тридеморф, трифлумізол, трифорин, тритиконазол, уніконазол, валідаміцин А, вінклозолін, вініконазол, зариламід, зинеб, зирам, а також Даггер G, ОК-8705, ОК-8801,  $\alpha$ -(1,1-диметилетил)- $\beta$ -(2-феноксietил)-1H-1,2,4-триазол-1-етанол,  $\alpha$ -(2,4-дихлорфеніл)- $\beta$ -фтор-*b*-пропіл-1H-1,2,4-триазол-1-етанол,  $\alpha$ -(2,4-дихлорфеніл)- $\beta$ -метокси-*a*-метил-1H-1,2,4-триазол-1-етанол,  $\alpha$ -(5-метил-1,3-діоксан-5-yl)- $\beta$ -[[4-(трифторметил)феніл]метиле]н-1H-1,2,4-триазол-1-етанол, (5RS,6RS)-6-гідрокси-2,2,7,7-тетраметил-5-(1H-1,2,4-триазол-1-іл)-3-октанон, (E)- $\alpha$ -(метоксиіміно)-N-метил-2-феноксифенілацетамід, 1-ізопропіловий естер{2-метил-і-[[[1-(4-метилфеніл)етил]аміно]карбоніл]пропіл]-карбаїнової кислоти, 1-(2,4-дихлорфеніл)-2-(1H-1,2,4-триазол-1-іл)-етанон-О-(фенілметил)оксим, 1-(2-метил-1-нафталеніл)-1H-пірол-2,5-діон, 1-(3,5-дихлорфеніл)-3-(2-пропеніл)-2,5-піролідіндіон, 1-[(дийодметил)сульфоніл]-4-метилбензол, 1-[[2-(2,4-дихлорфеніл)-1,3-діоксолан-2-іл]метил]-1H-імідазол, 1-[[2-(4-хлорфеніл)-3-фенілоксираніл]метил]-1H-1,2,4-триазол, 1-[1-[2-(2,4-дихлорфеніл)метокси]феніл]етенил]-1H-імідазол, 1-метил-5-нонил-2-(фенілметил)-3-піролідинол, 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-піридинілтіоціанат, 2,6-дихлор-N-(4-трифторметилбензил)бензамід, 2,6-дихлор-N-[[4-(трифторметил)феніл]метил]бензамід, 2-(2,3,3-трийод-2-пропеніл)-2H-тетразол, 2-[(1-метилетил)сульфоніл]-5-(трихлорметил)-1,3,4-тіадіазол, 2-[[6-деокси-4-О-(4-О-метил- $\beta$ -D-глікопіранозил)- $\alpha$ -D-глюкопіранозил]аміно]-4-метокси-1H-піроло[2,3-*d*]піримідин-5-карбоніл, 2-амінобутан, 2-бром-2-(бромметил)пентандинітрил, 2-хлор-N-(2,2-дипро-1,1,3-триметил-1H-інден-4-іл)-3-піридинкарбоксамід, 2-хлор-N-(2,6-диметилфеніл)-N-(ізотіоціанатометил)ацетамід, 2-фенілфенол (OPP), 3,4-дихлор-1-[4-(дифторметокси)феніл]-1H-пірол-2,5-діон, 3,5-дихлор-N-[ціан[(1-метил-2-

пропініл)окси]метил]бензамід, 3-(1,1-диметилпропіл-1-оксо)-1H-інден-2-карбонітрил, 3-[2-(4-хлорфеніл)-5-етокси-3-ізоксазолідиніл]піридин, 4-хлор-2-ціано-N,N-диметил-5-(4-метилфеніл)-1H-1-мидазол-1-сульфонамід, 4-метилтетразоло[1,5-*a*]хіназолін-5(4H)-он, 8-(1,1-диметилетил-N-етил-N-пропіл-1,4-діоксаспіро[4,5]декан-2-метанамін, 8-гідроксигінолінусульфат, 9H-ксантен-9-карбонової кислоти 2-[(феніламіно)карбоніл]гідразид, біс-(1-метилетил)-3-метил-4-[(3-метилбензоіл)окси]-2,5-тіофендикарбоксилат, цис-1-(4-хлорфеніл)-2-(1H-1,2,4-триазол-1-іл)циклопентанол, гідрохлорид цис-4-[3-[4-(1,1-диметилпропіл)-феніл-2-метил-пропіл]-2,6-диметил]-морфоліну етил [(4-хлорфеніл)азо]ціаноацетат, гідрокарбонат калію, натрієва сіль метантетратіолу, метил 1-(2,3-дигідро-2,2-диметил-1H-інден-1-іл)-1H-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-гексилфеніл)-1,4,5,6-тетрагідро-2-піримідинамін, N-(5-хлор-2-метилфеніл)-2-метокси-N-(2-оксо-3-оксазолідинілу)ацетамід, N-(6-метокси)-3-піридинілциклопропанукарбоксамід, N-[2,2,2-трихлор-1-[(хлорацетил)аміно]етилу]бензамід, N-[3-хлор-4,5-біс-(2-пропінілокси)феніл]-N'-метоксиметаніміду, натрієва сіль N-форміл-N-гідрокси-DL-аланіну, О,О-діетил-[2-(дипропіламіно)-2-оксоетил]-етилфосфорамідодіат, О-метил-S-феніл-фенілпропілфосфорамідотіат, 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)акрилокси]-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, акринат-

рин, 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, біфенілрин, біоетанометрин, біоперметрин, ВРМС, бромфос А, буфенкарб, бупрофенцин, бутатіофос, бутокарбоксим, бутилпіридабен,

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

дельтаметрин, деметон-м, деметон S, деметон-S-метил, діафеніліурон, діацинон, дихлорвос, дифлубензурон, диметоат, диметилвінфос, діофенолан, дисульфотон, докузат-натрій, дофенапір,

ефлузіланат, емаметин, емпентрин, ендосульфат, *Entomophthora* spp., есфенвалерати, етіофенкарб, етіон, етопрофос, етофенпрокс, етоксазоли, етримфос,

фенаміфос, феназахіін, фенбутатин оксид, фенітротіон, фенотіокарб, феноксакрим, феноксикарб, фенпропатрин, фенпірад, фенпіритрин, фенпіроксимати, фенвалерати, фіпроніл, флуацінам, флуазурон, флуброцитринат, флуциклоксурон, флудитринати, флуфеноксурон, флутензини, флувалінати, фонофос, фосметилан, фостіазати, фубфенпрокс, фураціокарб,

гранулоподібі віруси, галофенозиди, НСН, гептенофос, гексафлу-мурон, гексилтіазокс, гідропрени,

імідаклопрід, ізазофос, ізофенфос, ізоксатіон, івермектин,

віруси поліедроза, лямбда-цигатрин, луфенурон, малатіон, мекарбам, метальдегід, метамідофос, *Metharhizium anisopliae*, *Metharhizium flavoviride*, метидатіон, метіокарб, метоміл, метоксифенозиди, метолкарб, метоксидіазони, мевінфос, мілбемектин, монокротофос,

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

*Raesciomyces fumosoroseus*, паратіон А, паратіон М, перметрин, фенілоат, форат, фозалони, фозмет, фосфамідон, фоксим, піримікарб, піриміфос А, піриміфос М, профенофос, промеккарб, пропоксур, протіофос, протоат, піметрозини, піраклофос, пірезметрин, піретрум, піридабен, піридатіон, піримідифен, пірипроксифен,

хіналфос, рибавірин, салітіон, себуфос, силафлуофен, спіносад, сульфотеп, сулпрофос,

тау-флувалінати, тебуфенозиди, тебуфенпірад, тебупіриміфос, тефлубензурон, тефлутрин, темефос, темівінфос, тербуфос, тетрахлорвінфос, тета-циперметрин, тіаметоксам, тіапроніл, тіатрифос, тіоциклам гідрооксалати, тіодикарб,

тіофанокс, турингієнсин, 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-бензоіл-1-(1,1-диметилетил)]гідразид бен-

зойної 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-тіазолідиніліден]ціанамід,

дигідро-2-(нітрометилен)-2H-1,3-тіазин-3(4H)-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-1H-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, O,O-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.

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

Крім того сполуки формули (I) згідно з винаходом проявляють також високу фунгіцидну ефективність. Вони демонструють широкий спектр проти-грибкової активності, зокрема проти дерматофітів та пророслих грибів, плісені та двофазних грибів (наприклад, проти видів *Candida*, таких як *Candida*

albicans, *Candida glabrata*), а також проти *Epidermophyton floccosum*, проти видів *Aspergillus*, таких як *Aspergillus niger* та *Aspergillus fumigatus*, видів *Trichophyton*, таких як *Trichophyton mentagrophytes*, видів *Microsporon*, таких як *Microsporon canis* та *audouinii*. Перерахування цих грибків в жодному разі не обмежує спектр впливу, а лише пояснює його.

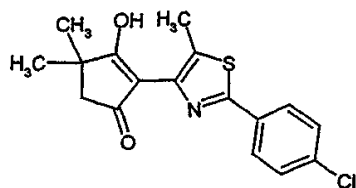
Активні речовини можуть використовуватися як такі, у своїй препаративній формі або одержаної таким чином форми застосування, наприклад, у вигляді готових до застосування розчинів, суспензій, порошків, що змочують, паст, розчинних порошків, дуетів для запилення та гранулятів. Застосування відбувається звичайним способом, наприклад, шляхом поливання, обприскування, мілкокрапельного обприскування, розкидання, розбризкування, спінювання, обмазування і т.д. Крім того можливим є наносити активні речовини способом Ultra-Low-Volume або впорскувати активні речовини або їх композиції просто в ґрунт. Ними можна також обробляти насіння рослин.

При використанні активних речовин згідно з винаходом як фунгіцидів в залежності від виду нанесення кількість їх використання може варіюватися у широких межах. При обробці частин рослин кількість використання активної речовини загалом складає від 0,1 до 10.000г/га, переважно від 10 до 1.000г/га. При обробці насіння кількість використання активної речовини загалом складає від 0,001 до 50г на кілограм насіння, переважно від 0,01 до 10г на кілограм насіння. При обробці ґрунту кількість використання активної речовини загалом становить від 0,1 до 10.000г/га, переважно від 1 до 5.000г/га.

Одержання та застосування активних речовин згідно з винаходом описане в наведених нижче прикладах.

#### Приклади одержання

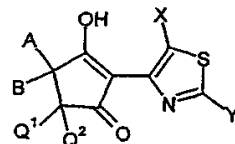
##### Приклад I-1-a-1



1,65г (14,4ммоль) трет.-бутилату калію поміщують у 30мл абсолютного ДМФА та змішують з 3,5г (9,6ммоль) сполуки згідно з прикладом (II-1) у 10мл абсолютного ДМФА. Суміш перемішують протягом 3 годин при температурі 50°C. Потім у реакційну суміш додають 100мл крижаної води. Суміш поміщують у 600мл холодного розчину 1N HCl. Осад відсмоктують та висушують.

Вихід: 2,9г (90% від теоретичного), Тпл. 139-141°C.

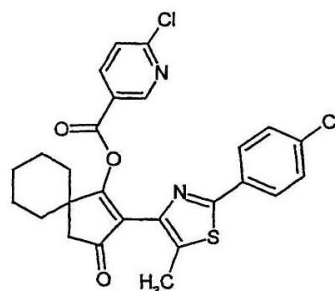
Аналогічно до прикладу (I-1-a-1) та згідно із загальною інформацією про способи одержання одержують такі сполуки формули (I-1-a):



(I-1-a)

Прікл. №	X	Y	B	A	Q <sup>1</sup>	Q <sup>2</sup>	Тпл. °C
I-1-a-2	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		H	H	105-107°C
I-1-a-3	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		H	H	121-123°C
I-1-a-4	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		H	H	130
I-1-a-5	CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		H	H	Масло
I-1-a-6	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -		H	145-148
I-1-a-7	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		H	H	85
I-1-a-8	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		H	H	75-77
I-1-a-9	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CHCH <sub>3</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		H	H	142-144
I-1-a-10	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CHOCH <sub>3</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		H	H	127
I-1-a-11	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> -		H	130
I-1-a-12	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		H	H	210
I-1-a-13	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	C <sub>6</sub> H <sub>11</sub> -		H	105
I-1-a-14	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		H	H	Масло
I-1-a-15	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		H	H	Масло
I-1-a-16	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		H	H	Масло
I-1-a-17	H	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		H	H	185

##### Приклад I-1-b-1



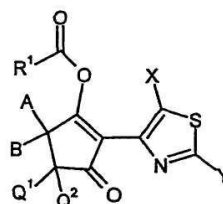
500мг (1,33ммоль) сполуки згідно з прикладом I-1-a-2 поміщують у 5мл абсолютного ДМФА та змішують з 0,27мл (2,0ммоль) триетиламіну. При температурі 0°C додають 0,30г (1,74ммоль) 6-хлорнікотинілхлориду та при кімнатній температурі перемішують протягом 2 годин. Потім додають 0,15г хлорнікотинілхлориду та 0,13 триетиламіну.


Реакційну суміш промивають 10%-ним розчином лимонної кислоти, водну фазу екстрагують дихлорметаном, органічну фазу промивають розчином 1 N гідроксиду натрію, а водну фазу екстрагують дихлорметаном.

Органічну фазу висушують, а розчинник відганяють. Залишок перемішують з петролейним етером, фільтрують та висушують.

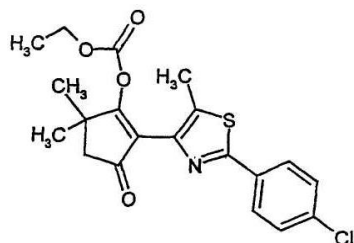
Вихід: 0,7г (100% від теоретичного), Тпл. 133-134°C.

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



Прикл. №	X	Y	B	A	Q <sup>1</sup>	Q <sup>2</sup>	R <sup>1</sup>	Тпл. °C
I-1-b-2	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	H	H	H	H <sub>3</sub> C <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> -	135
I-1-b-3	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	H	H	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -	Масло
I-1-b-4	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	H	H	H	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -	129-130
I-1-b-5	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	H	H	H		Масло

Приклад I-1-c-1

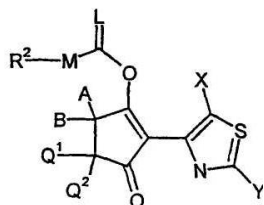


500мг (1,5ммоль) сполуки згідно з прикладом (I-1-a-1) поміщають в 5мл абсолютного дихлорметану та змішують з 0,3мл (2,25ммоль) триетиламіну. При температурі 0°C додають 0,225г (1,95ммоль) етилового естеру хлормурашиної кислоти та при кімнатній температурі перемішують протягом 2 годин.

Реакційний розчин промивають 10%-ним розчином лимонної кислоти, а водну фазу екстрагують дихлорметаном (CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>). Органічну фазу промивають розчином 1N гідроксиду натрію, висушують та випаровують.

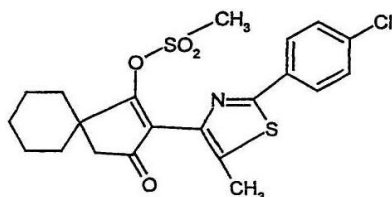
Вихід: 0,45г (75% від теоретичного), 132-134°C.

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



Прикл. №	X	Y	A	B	Q <sup>1</sup>	Q <sup>2</sup>	L	M	R <sup>2</sup>	Тпл. °C
I-1-c-2	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	H	H	H	O	O	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
I-1-c-3	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	H	H	H	O	O	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
I-1-c-4	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	H	H	H	O	O	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	139-140
I-1-c-5	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	H	H	H	O	S	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> -CH <sub>2</sub>	144
I-1-c-6	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -	H	H	H	O	O	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> -CH <sub>2</sub>	137

Приклад I-1-d-1



0,5г (1,33ммоль) сполуки згідно з прикладом (I-1-a-2) поміщають в 5мл абсолютного дихлорметану та змішують з 0,27мл (2,0ммоль) триетиламіну.

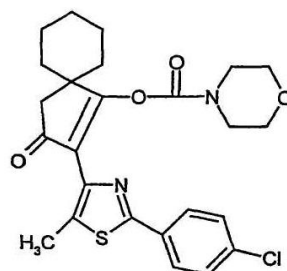
При крижаному охолодженні додають 0,135мл (1,74ммоль) хлориду метансульфонової кислоти. Суміш перемішують при кімнатній температурі протягом 2 годин.

Реакційну суміш промивають 10%-ним розчином лимонної кислоти, а водну фазу промивають дихлорметаном, органічну фазу екстрагують розчином 1N гідроксиду натрію, а водну фазу промивають дихлорметаном, висушують та випаровують.

Вихід: 0,6г (100% від теоретичного), Тпл. 134°C.

<sup>1</sup>H-ЯМР (d<sub>6</sub>-ДМСО, 400МГц): δ=1,02 (д, 10Н, цик-гексил-CH<sub>2</sub>); 2,30 (с, 3Н, триазоліл-CH<sub>3</sub>), 3,05 (с, 2Н, CH<sub>2</sub>-CO), 3,61 (с, 3Н, SO<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>), 7,54 (д, 2Н, Ar-H), 7,86 (д, 2Н, Ar-H) м.ч.

Приклад I-1-g-1



Приклад II-1

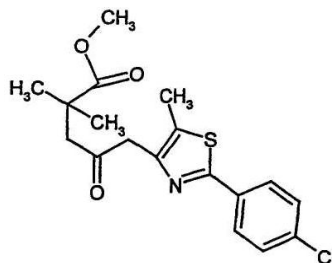
0,5г (1,33ммоль) сполуки згідно з прикладом I-1-a-2 та 0,27мл (2,0ммоль) триетиламіну розчиняють в 5мл абсолютного дихлорметану та при крижаному охолодженні додають 0,26мл (1,73ммоль) хлориду морфолін-N-карбонової кислоти. Суміш перемішують при кімнатній температурі протягом доби.

Реакційну суміш екстрагують 10%-ним розчином лимонної кислоти, водну фазу промивають дихлорметаном, органічну фазу екстрагують розчином 1N гідроксиду натрію, а водну фазу промивають дихлорметаном, висушують та випаровують.

Вихід: 0,69г (93% від теоретичного), віск.

<sup>1</sup>H-ЯМР (d<sub>6</sub>-ДМСО, 400МГц): δ=1,02 (м, 10Н, цик-гексил-CH<sub>2</sub>); 2,30 (с, 3Н, триазоліл-CH<sub>3</sub>), 3,01 (с, 2Н, CH<sub>2</sub>-CO), 3,05-3,79 (м, 8Н, морфолін -CH<sub>2</sub>), 7,54 (д, 2Н, Ar-H), 7,85 (д, 2Н, Ar-H) м.ч..

Приклад II-1



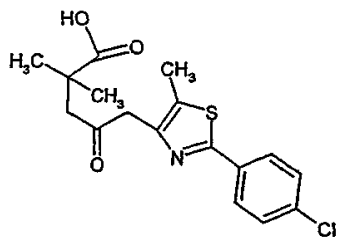
17,3г (30ммоль) сполуки згідно з прикладом XIV-1 поміщають у 200мл абсолютного ацетону та додають 6,8г (49ммоль) карбонату калію та 20,5г (147ммоль) метилйодиду. Суміш перемішують протягом 16 годин у зворотньому потоці.

Розчин фільтрують, розчинник відганяють та очищують колоночною хроматографією на силікагелі (дихлорметан:петролейний етер, 4:1→дихлорметан→дихлорметан:етиловий естер оцтової кислоти, 30:1→10:1).

Вихід: 3,5г (31 % від теоретичного), масло.

<sup>1</sup>H-ЯМР (d<sub>6</sub>-DMCO, 400МГц): δ=1,11 (с, 6H, 2-CH<sub>3</sub>-C-аліф.), 2,31 (с, 3H, CH<sub>3</sub>-C-гетероаром.) 3,50 (с, 3H, CH<sub>3</sub>-O), 7,50 (д, 2H, 2-CH-аром.), 7,84 (д, 2H, 2-CH-аром.) м.ч.

Приклад XIV-1



До розчину 25мл LDA\*-розчину (2молярн.) в 50мл абсолютного тетрагідрофурану (THF) по краплях додають розчин 12,7г (45ммоль) метилового естеру 4-[2-(4-хлорфеніл)-5-метил]тіазоліл-оцтової кислоти у 15мл THF при температурі -15°C та протягом 60хв. перемішують при температурі 0°C.

Потім при температурі -15°C по краплях додають розчин 3,8г (30ммоль) ангідриду 2,2-диметилбурштинової кислоти у 10мл абсолютного THF.

Розчин перемішують при кімнатній температурі протягом 2 годи, потім додають 75мл води та 20г хлориду амонію та концентрованою соляною кислотою перетворюють на кислий розчин.

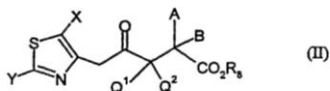
Проміжний продукт екстрагують етером, розчинник відганяють. Протягом дня залишок кип'ятять з 25г KOH у 170мл води в зворотньому потоці.

Охолоджують, підкислюють концентр. HCl та екстрагують етером. Сировину безпосередньо перетворюють на сполуку II-1.

Вихід: 17,5г (100% від теоретичного), масло.

\*LDA = діізопропіламід літію

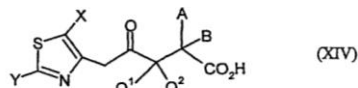
Аналогічно до прикладу (II-1) та згідно із загальною інформацією про способи одержання одержують такі сполуки формули (II):



Прикл. №	X	Y	B	A	Q <sup>1</sup>	Q <sup>2</sup>	R <sup>8</sup>	Тпл. °C
II-2	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		H	H	CH <sub>3</sub>	Масло
II-3	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		H	H	CH <sub>3</sub>	Масло
II-4	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		H	H	CH <sub>3</sub>	Масло
II-5	CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		H	H	CH <sub>3</sub>	Масло
II-6	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -		H	CH <sub>3</sub>	Масло
II-7	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		H	H	CH <sub>3</sub>	Масло
II-8	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		H	H	CH <sub>3</sub>	Масло
II-9	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CHCH <sub>3</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		H	H	CH <sub>3</sub>	Масло
II-10	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CHOCH <sub>3</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		H	H	CH <sub>3</sub>	Масло
II-11	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> -		H	CH <sub>3</sub>	Масло
II-12	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		H	H	CH <sub>3</sub>	Масло

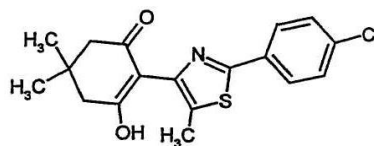
II-13	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	Масло
II-14	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		H	H	CH <sub>3</sub>	Масло
II-15	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		H	H	CH <sub>3</sub>	Масло
II-16	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		H	H	CH <sub>3</sub>	Масло
II-17	H	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		H	H	CH <sub>3</sub>	Масло

Аналогічно до прикладу (XIV-1) та згідно із загальною інформацією про способи одержання одержують такі сполуки формули (XIV):



Прикл. №	X	Y	B	A	Q <sup>1</sup>	Q <sup>2</sup>	Тпл. °C
XIV-2	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		H	H	Віск
XIV-3	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		H	H	Віск
XIV-4	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		H	H	Масло
XIV-5	CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		H	H	Масло
XIV-6	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -		H	Масло
XIV-7	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		H	H	Масло
XIV-8	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		H	H	Масло
XIV-9	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CHCH <sub>3</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		H	H	Масло
XIV-10	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CHOCH <sub>3</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		H	H	Масло
XIV-11	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> -		H	Масло
XIV-12	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		H	H	Масло
XIV-13	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	C <sub>6</sub> H <sub>11</sub> -		H	Масло
XIV-14	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		H	H	Масло
XIV-15	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		H	H	Масло
XIV-16	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -CH-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -		H	H	Масло
XIV-17	H	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	-(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> -		H	H	Масло

Приклад I-2-3-1



2,16г (18,1ммоль) трет.-бутилату калію поміщають у 20мл абсолютного ДМФА та по краплях додають 4,6г (12,1ммоль) сполуки згідно з прикладом III-1 у 2мл абсолютного ДМФА.

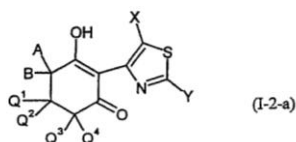
Суміш перемішують протягом 2 годин при температурі 50°C.

Реакційний розчин поміщають у 100мл крижаної води та перемішують з 500мл холодного розчину 1N HCl. Осад відсмоктують та додають дихлорметан. Після відгонки розчинника залишок очищують колоночною хроматографією на силікагелі (циклогексан/етиловий естер оцтової кислоти, 5:1).

Вихід: 1,4г (13% від теоретичного), Тпл. 165-167°C.

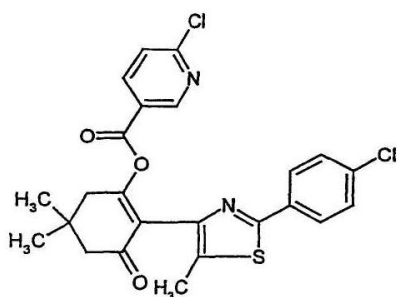
Аналогічно до прикладу (I-2-a-1) та згідно із загальною інформацією про способи одержання одержують такі сполуки формули (I-2-a):

75



Прикл. №	X	Y	A	B	Q <sup>1</sup>	Q <sup>2</sup>	Q <sup>3</sup>	Q <sup>4</sup>	Тпл. °C
I-2-a-2	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	H	H	H	H	H	106
I-2-a-3	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	
I-2-a-4	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub>	H	H	H	122
I-2-a-5	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	H	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	H	H	195-197

Приклад I-2-b-1

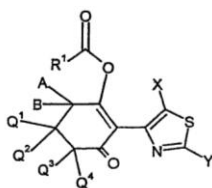


500мг (1,44ммоль) сполуки згідно з прикладом I-2-a-1 поміщають в 5мл абсолютного дихлорметану та змішують з 0,29мл (2,16ммоль) триетиламіну. При температурі 0°C додають 0,33г (2,16ммоль) 6-хлорнікотинілхлориду та при кімнатній температурі перемішують протягом 2 годин.

Реакційну суміш екстрагують 10%-ним розчином лимонної кислоти, водну фазу промивають дихлорметаном, органічну фазу екстрагують розчином 1N гідроксиду натрію, а водну фазу промивають дихлорметаном, висушують та випаровують.

Вихід: 0,7г (100 % від теоретичного), 127-130°C.

Аналогічно до прикладу (I-2-6-1) та згідно із загальною інформацією про способи одержання одержують такі сполуки формули (I-2-6):

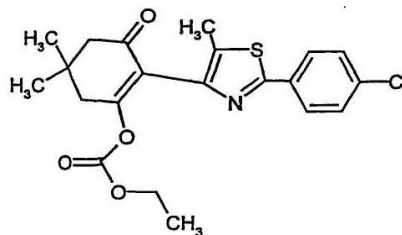


Прикл. №	X	Y	A	B	Q <sup>1</sup>	Q <sup>2</sup>	Q <sup>3</sup>	Q <sup>4</sup>	R <sup>1</sup>	Тпл. °C
I-2-b-2	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	96
I-2-b-3	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H <sub>5</sub> C <sub>2</sub> -O-CH <sub>2</sub> -	142
I-2-b-4	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	123-125
I-2-b-5	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H		128

Приклад I-2-c-1

76749

76

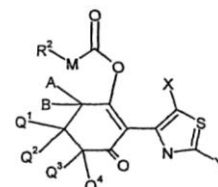


600мг (1,7ммоль) сполуки згідно з прикладом I-2-a-1 поміщають в 5мл абсолютного дихлорметану та додають 0,35мл (2,60ммоль) триетиламіну. При температурі 0°C додають 0,255г (2,21ммоль) етилового етеру хлормурашиної кислоти та протягом 2 годин перемішують при кімнатній температурі.

Розчин промивають 10%-ним розчином лимонної кислоти, а водну фазу екстрагують дихлорметаном. Органічну фазу промивають розчином 1N гідроксиду натрію, висушують та випарюють.

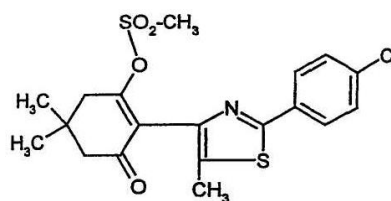
Вихід: 0,62г (87% від теоретичного) Тпл. 82-86°C.

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



Прикл. №	X	Y	A	B	Q <sup>1</sup>	Q <sup>2</sup>	Q <sup>3</sup>	Q <sup>4</sup>	M	R <sup>2</sup>	Тпл. °C
I-2-c-2	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	O	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> -	123-125
I-2-c-3	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	O	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> -CH <sub>2</sub> -	129-131
I-2-c-4	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	S	C <sub>6</sub> H <sub>5</sub> -CH <sub>2</sub> -	94

Приклад I-2-d-1



500мг (1,44ммоль) сполуки згідно з прикладом I-2-a-1 поміщають в 5мл абсолютного дихлорметану та додають 0,29мл (2,16ммоль) триетиламіну. При температурі 0°C додають 0,22г (1,87ммоль) хлориду метилсульфонової кислоти та протягом 2 годин перемішують при кімнатній температурі.

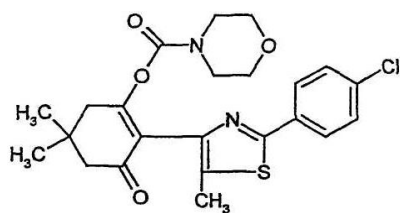
Реакційну суміш екстрагують 10%-ним розчином лимонної кислоти, водну фазу промивають дихлорметаном, органічну фазу екстрагують 1N NaOH, водну фазу промивають дихлорметаном, висушують та випарюють.

Вихід: 0,65г (100% від теоретичного), віск.

<sup>1</sup>H-ЯМР (d<sub>6</sub>-DMCO, 400МГц):

δ=1,17 (с, 6H, цик-гексил-CH<sub>3</sub>); 2,25 (с, 3H, триазоліл-CH<sub>3</sub>), 2,48 (с, 2H, цик-гексил-CH<sub>2</sub>), 2,86 (с, 2H, цик-гексил-CH<sub>2</sub>), 3,21 (с, 3H, SO<sub>2</sub>-CH<sub>3</sub>), 7,52 (д, 2H, Ar-H), 7,83 (д, 2H, Ar-H) м.ч.

## Приклад I-2-g-1



500мг (1,44ммоль) сполуки згідно з прикладом I-2-a-1 поміщують в 5мл абсолютного дихлорметану та додають 0,29мл (2,16ммоль) триетиламіну. При температурі 0°C додають 0,27г (1,87ммоль) хлориду метилсульфонові кислоти та протягом 2 годин перемішують при кімнатній температурі.

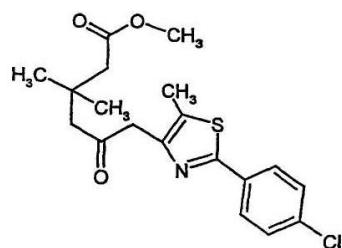
Реакційну суміш екстрагують 10%-ним розчином лимонної кислоти, водну фазу промивають дихлорметаном, органічну фазу екстрагують розчином 1N гідроксиду натрію, водну фазу промивають дихлорметаном, висушують та випарюють.

Вихід: 0,65г (100% від теоретичного), Тпл. 128°C.

<sup>1</sup>H-ЯМР (d<sub>6</sub>-DMCO, 400МГц):

δ=1,13 (с, 6H, цик-гексил-CH<sub>3</sub>); 2,21 (с, 3H, триазоліл-CH<sub>3</sub>), 2,46 (с, 2H, цик-гексил-CH<sub>2</sub>), 2,71 (с, 2H, цик-гексил-CH<sub>2</sub>), 3,06-3,80 (м, 8H, морфолін-CH<sub>2</sub>), 7,53 (д, 2H, Ar-H), 7,84 (д, 2H, Ar-H) м.ч.

## Приклад III-1



17,0г (30ммоль) сировини сполуки згідно з прикладом XIX-1 поміщують у 200мл абсолютного ацетону та додають 6,42г (46,5ммоль) карбонату калію та 19,5г (139,5ммоль) метилйодиду. Суміш перемішують протягом 16 годин у зворотньому потоці.

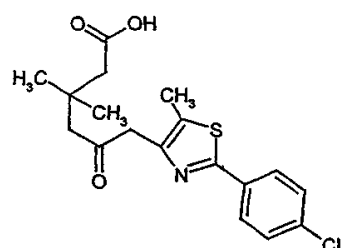
Фільтрують та випаровують. Залишок очищують колоночною хроматографією на силікагелі (дихлорметан:петролейний етер, 4:1→дихлорметан→дихлорметан:етилівий етер оцтової кислоти, 30:1→10:1).

Вихід: 4,6г (16% від теоретичного), масло.

<sup>1</sup>H-ЯМР (400МГц, d<sub>6</sub>-DMCO):

δ=1,03 (с, 6H, 2-CH<sub>3</sub>-C-аліф.); 2,32 (с, 3H, CH<sub>3</sub>-C-аром.), 7,50 (д, 2H, Ar-H), 7,81 (д, 2H, Ar-H) м.ч.

## Приклад XIX-1



До розчину 25мл LDA-розчину (2моляр.) в 50мл абсолютного тетрагідрофурану (THF) по краплях додають розчин 12,7г (45ммоль) метилового естеру 4-[2-(4-хлорфеніл)-5-метил]тіазоліл-оцтової кислоти у 15мл абсолютного тетрагідрофурану при температурі -15°C та протягом 60хв. перемішують при температурі 0°C.

Потім при температурі -15°C по краплях додають розчин 4,26г (30ммоль) ангідриду 3,3-диметилглутарової кислоти у 10мл тетрагідрофурану.

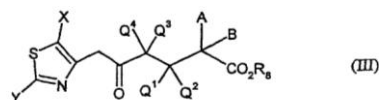
Розчин перемішують при кімнатній температурі протягом 2 годин, потім додають 75мл води та 20г хлориду амонію та концентрованою соляною кислотою перетворюють на кислий розчин.

Проміжний продукт екстрагують етером, розчинник відганяють. Протягом дня залишок кип'яють з 25г гідроксиду калію у 170мл води в зворотньому потоці.

Охолоджують, підкислюють концентрованою соляною кислотою та екстрагують етером. Сировину без очищення безпосередньо піддають взаємодії.

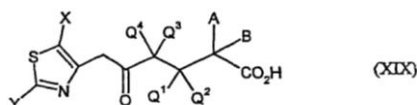
Вихід: 17г (100% від теоретичного), масло.

Аналогічно до прикладу (III-1) та згідно із загальною інформацією про способи одержання одержують такі сполуки формули (III):



Прикл. №	X	Y	A	B	Q <sup>1</sup>	Q <sup>2</sup>	Q <sup>3</sup>	Q <sup>4</sup>	R <sup>6</sup>	Тпл. °C
III-2	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	H	H	H	H	H	CH <sub>3</sub>	Масло
III-3	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	CH <sub>3</sub>	Масло
III-4	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub>	H	H	H	CH <sub>3</sub>	Масло
III-5	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	H	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	H	H	CH <sub>3</sub>	Масло

Аналогічно до прикладу (XIX-1) та згідно із загальною інформацією про способи одержання одержують такі сполуки формули (XIX):



Прикл. №	X	Y	A	B	Q <sup>1</sup>	Q <sup>2</sup>	Q <sup>3</sup>	Q <sup>4</sup>	Тпл. °C
XIX-2	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	H	H	H	H	H	Масло
XIX-3	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	Масло
XIX-4	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	H	(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub>	H	H	H	Масло
XIX-5	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	H	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	H	H	H	Масло

## Приклади застосування

## Приклад А

Дослідження нематод роду Meloidogyne

Розчинник: 30%мас. диметилфоамід

Емульгатор: 1%мас. алкіларилполігліколевого етеру

Для одержання доцільної композиції активної речовини змішують 1%мас. активної речовини із зазначеними кількостями розчинника та емульгатора, а концентрат розбавляють водою до необхідної концентрації.

Судину наповняють піском, розчином активної

речовини, суспензію личинки в першій віковій стадії *Meloidogune incognita* та насіннями салату. Насіння салату проростає і рослини розвиваються. На коренях розвиваються галли.

Після необхідного часу визначають нематодцидну дію на основі галлоутворення в %. При цьому, 100% позначає, що галли не знайдені; 0% позначає, що число галлів на оброблених рослинах відповідає необробленим контрольним зразкам.

Дане дослідження показує, що, наприклад, наступні сполуки з прикладів одержання демонструють гарну ефективність:

Активна речовина	Концентрація активної речовини в м.ч.	Ступінь знищення в % через 14 днів
Приклад I-1-с-3	20	100
Приклад I-1-а-1	20	95

#### Приклад В

Дослідження *Myzus* (систематичний ефект)

Розчинник: 7%мас. диметилфомаміду

Емульгатор: 2%мас. алкіларилполігліколевого етеру

Для одержання доцільної композиції активної речовини змішують 1%мас. активної речовини із зазначеними кількостями розчинника і емульгатора, а концентрат розбавляють водою до необхідної концентрації.

Капустяні листи (*Brassica oleracea*, капуста городня), сильно вражені персиковою попелицю (*Myzus persicae*), обробляють 10мл композиції активної речовини необхідної концентрації, не обробляючи пагонів, так що композиція активних речовин просочується в ґрунт. Активна речовина всмоктується корінням, а потім передається пагонам.

Після необхідного часу визначають ступінь знищення у %. При цьому, 100% позначає, що знищено всю попелицю; 0% позначає, що попелиця не знищена.

Дане дослідження показує, що, наприклад, такі сполуки з прикладів одержання демонструють гарну ефективність:

Активна Речовина	Концентрація активної речовини в м.ч.	Ступінь знищення в % через 10 днів
Приклад I-1-с-1	20	95

#### Приклад С

Дослідження личинок *Phaedon*

Розчинник: 7%мас. диметилфомаміду

Емульгатор: 2%мас. алкіларилполігліколевого етеру

Для одержання доцільної композиції активної речовини змішують 1%мас. активної речовини із зазначеними кількостями розчинника і емульгатора, і концентрат розбавляють водою до необхідної концентрації.

Капустяні листи (*Brassica oleracea*, капуста городня) обробляють зануренням у композицію активної речовини необхідної концентрації та розподіляють личинки листоїда хрінового (*Phaedon cochleariae*) доти, доки листя ще вологе.

Після необхідного часу визначають ступінь знищення у %. При цьому, 100% означає, що знищено усі личинки жуків; 0% означає, що личинки жуків не знищено.

Дане дослідження показує, що, наприклад, такі сполуки з прикладів одержання демонструють гарну ефективність:

Активна Речовина	Концентрація активної речовини в м.ч.	Ступінь знищення в % через 7 днів
Приклад I-1-с-1	500	100
Приклад I-2-С-1	500	100

#### Приклад D

Дослідження *Spodoptera frugiperda*

Розчинник: 7%мас. диметилфомаміду

Емульгатор: 2%мас. алкіларилполігліколевого етеру

Для одержання доцільної композиції активної речовини змішують 1%мас. активної речовини із зазначеними кількостями розчинника і емульгатора, і концентрат розбавляють водою до необхідної концентрації.

Капустяні листи (*Brassica oleracea*, капуста городня) обробляють зануренням у композицію активної речовини необхідної концентрації та розподіляють червоподібних личинок (*Spodoptera frugiperda*) доти, доки листя ще вологе.

Після необхідного часу визначають ступінь знищення у %. При цьому, 100% означає, що знищено всіх гусениць; 0% означає, що гусінь не знищено.

Дане дослідження показує, що, наприклад, такі сполуки з прикладів одержання демонструють гарну ефективність:

Активна Речовина	Концентрація активної речовини в м.ч.	Ступінь знищення в % через 7 днів
Приклад I-1-а-2	500	100
Приклад I-2-а-1	500	100
Приклад I-1-с-1	500	100
Приклад I-2-с-1	500	100

#### Приклад Е

Дослідження *Tetranychus* (стійкість до ортофосфату/обробка зануренням)

Розчинник: 30%мас. диметилфомаміду

Емульгатор: 1%мас. алкіларилполігліколевого етеру

Для одержання доцільної композиції активної речовини змішують 1%мас. активної речовини із зазначеними кількостями розчинника і емульгатора, і концентрат розбавляють водою до необхідної концентрації.

Бобові рослини (*Phaseolus vulgaris*, квасоля звичайна), на всіх стадіях сильно вражені павутинним кліщем (*Tetranychus urticae*), обробляють зануренням у композицію активної речовини необхідної концентрації.

Після необхідного часу визначають ступінь знищення у %. При цьому, 100% означає, що зни-

щено всього павутинного кліща; 0% означає, що павутинний кліщ не знищений.

Дане дослідження показує, що, наприклад, такі сполуки з прикладів одержання демонструють гарну ефективність:

Активна речовина	Концентрація активної речовини в м.ч.	Ступінь знищення в % через 7 днів
Приклад І-1-с-3	100	98
Приклад І-1-а-1	100	100
Приклад І-2-а-2	100	99
Приклад І-2-а-1	100	98
Приклад І-1-с-1	100	95
Приклад І-2-с-1	100	100

#### Приклад F1

Дослідження після появи рослин

Розчинник: 5%мас. ацетону

Емульгатор: 1%мас. алкіларилполігліколевого етеру

Для одержання доцільної композиції активної речовини змішують 1%мас. активної речовини із зазначеними кількостями розчинника і емульгатора, і концентрат розбавляють водою до необхідної концентрації.

Композицію активної речовини розбризкуванням наносять на досліджувані рослини, висотою 5-15см так, що необхідна кількість активної речовини відповідно потрапляє на одиницю поверхні. Концентрацію розчину обирають таким чином, що

в 1000л води/га міститься необхідна кількість активної речовини.

Через 3 тижні визначають ступінь пошкодження рослин у % порівняно з розвитком необроблених контрольних зразків:

0% = ніякого ефекту (як необроблені контрольні зразки)

100% = повне знищення

#### Приклад F2

Дослідження до появи рослин

Розчинник: 5%мас. ацетону

Емульгатор: 1%мас. алкіларилполігліколевого етеру

Для одержання доцільної композиції активної речовини змішують 1%мас. активної речовини із зазначеними кількостями розчинника і емульгатора, і концентрат розбавляють водою до необхідної концентрації.

Насіння досліджуваних рослин висівають у нормальний ґрунт. Через приблизно 24 години фунт розбризкуванням обробляють композицією активних речовин так, що необхідна кількість активної речовини відповідно потрапляє на одиницю поверхні. Концентрацію розчину обирають таким чином, що в 1000л води/га міститься необхідна кількість активної речовини.

Через 3 тижні визначають ступінь пошкодження рослин у % порівняно з розвитком необроблених контрольних зразків:

0% = ніякого ефекту (як необроблені контрольні зразки)

100% = повне знищення

Після появи рослин/Теплиця	г/га	Alopecurus (лисохвіст)	Avena fatua (овес)	Setaria (щетинник)	Sinapis (гірчиця)
Приклад І-1-а-2	250	90	100	100	80
Приклад І-1-а-3	250	90	100	100	80
Приклад І-1-с-3	250	100	100	100	80
Приклад І-1-а-1	250	100	100	100	70

Після появи рослин/теплиця	г/га	Цукровий буряк	Alopecurus (лисохвіст)	Avena fatua (овес)	Echinochloa (єжовник)	Setaria (щетинник)
І-2-а-1	250	0	90	95	100	100

Після появи рослин/теплиця	г/га	Цукровий буряк	Avena fatua (овес)	Echinochloa (єжовник)	Setaria (щетинник)	Sinapis (гірчиця)
І-1-с-1	250	0	90	100	100	70

Після появи рослин/теплиця	г/га	Alopecurus (лисохвіст)	Avena fatua (овес)	Setaria (щетинник)	Galium (подмаренник)
І-2-с-1	250	90	100	100	80

До появи росл./теплиця	г/га	пшениця	соя	Digitaria (посичка)	Lolium (плевел)	Setaria (щетинник)	Matricaria (матрикарія)
І-1-а-2	60	0	0	100	100	100	95

До появи рослин/теплиця	г/га	Цукровий буряк	Alopecurus (лисохвіст)	Avena fatua (овес)	Digitaria (посичка)	Polygonum (горець)
І-1-а-3	125	0	95	100	100	100

До появи рослин/теплиця	г/га	Raps (пнас)	Alopecurus (лисохвіст)	Digitaria (посичка)	Lolium (плевел)	Stellaria (звездчатка)
І-1-с-2	125	0	95	100	100	100

До появи росл./теплиця	г/га	Пшениця	соя	Alopecurus (пи-сохвіст)	Lolium (плевел)	Setaria (щетин-ник)	Stellaria (звезд-чатка)
I-1-c-3	125	10	0	95	100	100	70

До появи рос-лин/теплиця	г/га	соя	Lolium (пле-вел)	Setaria (щетин-ник)	Matricaria (матри-карія)	Stellaria (звезд-чатка)
I-1-a-1	125	0	100	100	100	100

До появи рос-лин/теплиця	г/га	соя	Bromus (ба-гаття)	Lolium (плевел)	Setaria (щетинник)	Abutilon (абути-лон)
I-2-a-1	125	0	95	100	100	70

#### Приклад G

Дослідження in vitro для визначення ED<sub>50</sub> у мікроорганізмів

На пластини мікротитрів додають по краплях розчин досліджуваної активної речовини разом з емульгатором PS16. Після того, як розчинник випарується, на 200μl мікротитрів додають Potatoe-Dextrose-Medium.

Перед цим у середовище додають необхідну концентрацію спор або грибниць досліджуваного грибка.

Концентрація активної речовини складає 0,1, 1, 10 та 100м.ч. Концентрація емульгатора становить 300м.ч.

Пластини протягом 3-5 днів інкубують у вібраційному апараті при температурі 22°C, доки не з'явиться можливість встановити ступінь росту в необроблених контрольних зразках.

Оцінювання відбувається фотометрично при довжині хвилі 620нм. Згідно з показниками дослідження при різній концентрації встановлюють необхідну дозу активної речовини, яка приводить до 50%-ного гальмування росту грибків по відношенню до необроблених контрольних зразків (ED<sub>50</sub>).

Активна Речовина	Мікроорганізм	Значення ED <sub>50</sub>
Приклад I-1-a-2	Pyricularia oryzae	<0,1
	Septoria tritici	<0,1
	Ustilago avenae	<0,1
Приклад I-2-a-2	Pyricularia oryzae	1,96
	Septoria tritici	<0,1
	Ustilago avenae	<0,1
Приклад I-2-a-3	Pyricularia oryzae	<0,1
	Septoria tritici	<0,1
	Ustilago avenae	0,1

#### Приклад H

Дослідження Sphaerotheca (на огірках)/захист

Розчинник: 24,5%мас.Ацетону

24,5%мас.диметилацетаміду

Емульгатор:1%мас. алкіларилполігліколевого етеру

Для одержання доцільної композиції активної речовини змішують 1%мас. активної речовини із зазначеними кількостями розчинника і емульгатора, і концентрат розбавляють водою до необхідної концентрації.

Для дослідження захисної дії молоді парості огірків обприскують композицією активної речовини з зазначеною нормою витрати. Після висихання рослини заражають водною суспензією спор Sphaerotheca filiginea. Потім рослини поміщають в

оранжерею при відносній вологості повітря 70% і температурі 23°C.

Через 7 днів після зараження проводять дослідження. При цьому, 0% означає ступінь дії, що відповідає контрольним зразкам, у той час як ступінь дії 100% означає, що зараження шкідниками не спостерігалось.

Активна Речовина	Норма витрат активної речовини в г/га	Ступінь дії в %
Приклад I-1-a-2	100	100

#### Приклад I

Дослідження Venturia (на яблуках)/захист

Розчинник: 24,5%мас.Ацетону

24,5%мас.диметилацетаміду

Емульгатор:1%мас. алкіларилполігліколевого етеру

Для одержання доцільної композиції активної речовини змішують 1%мас. активної речовини із зазначеними кількостями розчинника і емульгатора, і концентрат розбавляють водою до необхідної концентрації.

Для дослідження захисної дії молоді парості обприскують композицією активної речовини з зазначеною нормою витрати. Після висихання рослини заражають водною суспензією збудувачів яблучних струпів Venturia inaequalis. Рослини протягом одного дня поміщають в інкубаційну камеру при відносній вологості повітря 100% та температурі приблизно 20°C.

Потім рослини поміщають у теплицю при температурі приблизно 21°C та відносній вологості повітря 90%.

Через 10 днів після зараження проводять дослідження. При цьому, 0% означає ступінь дії, що відповідає контрольним зразкам, у той час як ступінь дії 100% означає, що зараження шкідниками не спостерігалось.

Активна Речовина	Норма витрат активної речовини в г/га	Ступінь дії в %
Приклад I-1-a-2	100	91

#### Приклад J

Дослідження Alternaria (на помідорах)/захист

Розчинник: 24,5%мас.Ацетону

24,5%мас.диметилацетаміду

Емульгатор:1%мас. алкіларилполігліколевого етеру

Для одержання доцільної композиції активної речовини змішують 1%мас. активної речовини із зазначеними кількостями розчинника і емульгатора, і концентрат розбавляють водою до необхідної

концентрації.

Для дослідження захисної дії молоді парости обприскують композицією активної речовини з зазначеною нормою витрати. Після висихання рослини заражають водною суспензією спор *Alternaria solani*. Потім рослини поміщають у теплицю при температурі приблизно 20°C та відносній вологості повітря 100%.

Через 3 дні після зараження проводять дослідження. При цьому, 0% означає ступінь дії, що відповідає контрольним зразкам, у той час як ступінь дії 100% означає, що зараження шкідниками не спостерігалось.

Активна Речовина	Норма витрат активної речовини в г/га	Ступінь дії в %
Приклад I-1-a-2	100	93

Приклад К

Дослідження *Botrytis* (на бобах)/захист

Розчинник: 24,5%мас.Ацетону

24,5%мас.диметилацетаміду

Емульгатор:1%мас. алкіларилполігліколевого етеру

Для одержання доцільної композиції активної речовини змішують 1%мас. активної речовини із зазначеними кількостями розчинника і емульгатора, і концентрат розбавляють водою до необхідної концентрації.

Для дослідження захисної дії молоді парости обприскують композицією активної речовини з зазначеною нормою витрати. Після висихання на кожен листок накладають 2 невеликих екземпляри *Botrytis cinerea*. Заражені рослини поміщають у затемнену камеру при температурі приблизно 20°C та відносній вологості повітря 100%.

Через 2 дні після зараження проводять дослідження. При цьому, 0% означає ступінь дії, що відповідає контрольним зразкам, у той час як ступінь дії 100% означає, що зараження шкідниками не спостерігалось.

Активна Речовина	Норма витрат активної речовини в г/га	Ступінь дії в %
Приклад I-1-a-2	500	92

Приклад L

Дослідження граничної концентрації/ґрунтови комах-обробка трансгенних рослин

Досліджувана комаха: *Diabrotica balteata* - личинки в ґрунті

Розчинник: 7%мас. Ацетону

Емульгатор:1%мас. алкіларилполігліколевого етеру

Для одержання доцільної композиції активної речовини змішують 1%мас. активної речовини із зазначеними кількостями розчинника і емульгатора, і концентрат розбавляють водою до необхідної концентрації.

Композицію активної речовини наносять на ґрунт. При цьому, концентрація активної речовини в композиції не грає практично ніякої ролі, істотним є тільки кількість активної речовини на одиниця об'єму ґрунту, що зазначений у м.ч. (мг/л). ґрунтом наповняють горщики об'ємом 0,25л та залишають при температурі 20°C.

Потім відразу після приготування в кожен горщик поміщають 5 попередньо пророщених кукурудзяних зерен сорту YIELD GUARD (торговельна назва Monsanto Сотр., США). Через 2 дні на оброблений фунт висаджують відповідних досліджуваних комах. Через 7 днів визначають ступінь дії активної речовини підрахунком сходу рослин кукурудзи (1 рослина = 20% дія).

Приклад М

*Heliothis virescens* - дослідження - обробка трансгенних рослин

Розчинник: 7%мас. Ацетону

Емульгатор:1%мас. алкіларилполігліколевого етеру

Для одержання доцільної композиції активної речовини змішують 1%мас. активної речовини із зазначеними кількостями розчинника і емульгатора, і концентрат розбавляють водою до необхідної концентрації.

Паростки сої (гліцин макс.) сорту Roundup Ready (торговельна назва Monsanto Сотр., США) обробляють зануренням у композицію активної речовини необхідної концентрації і висаджують гусениць нічного метелика-совки *Heliothis virescens* доти, поки листя ще вологе.

Через необхідний час визначають ступінь знищення комах.