



УКРАЇНА

(19) UA (11) 86942 (13) C2

(51) МПК (2009)

C07D 403/10 (2006.01)

A01N 43/56 (2006.01)

A01P 3/00

A01P 7/04

A01P 13/00

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

(54) N-ГЕТЕРОЦИКЛІЛФЕНІЛЗАМІЩЕНІ ЦИКЛІЧНІ КЕТОЕНОЛИ ТА СПОСІБ ЇХ ОДЕРЖАННЯ

1

(21) a200600305

(22) 07.06.2004

(24) 10.06.2009

(86) PCT/EP2004/006127, 07.06.2004

(31) 103 26 386.1

(32) 12.06.2003

(33) DE

(46) 10.06.2009, Бюл. № 11, 2009 р.

(72) ФІШЕР РАЙНЕР, DE, УЛЛЬМАНН АСТРІД, DE, БРЕТШНАЙДЕР ТОМАС, DE, ЛЕР ШТЕФАН, DE, КУНЦ КЛАУС, DE, КОНЦЕ ЙОРГ, DE, МАЛЬЗАМ ОЛЬГА, DE, ДРЕВЕС МАРК ВІЛЬХЕЛЬМ, DE, ФОЙХТ ДІТЕР, DE, КУКК КАРЛ-ХАЙНЦ, DE, ВАХЕНДОРФ-НОЙМАНН УЛЬРІКЕ, DE, МОРАДІ ВАХЕД АХМЕД, DE, БОЯКК ГВІДО, DE, АУЛЕР ТОМАС, DE, ХІЛЛЬС МАРТІН, GB/DE, КЕНЕ ХАЙНЦ, DE

(73) БАЕР КРОПСАСНС АКЦІЕНГЕЗЕЛЛЬШАФТ, DE

(56) UA 2002118712, A, 15.01.2003

UA 2004031730, A, 15.04.2004

WO 0117973, A, 15.03.2001

WO 9943649, A, 02.09.1999

US 6 642 180, D1, 04.11.2003

DE 10139465, A, 20.02.2003

WO 9955673, A, 04.11.1999

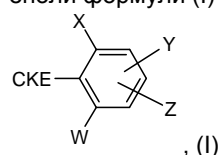
US 6 458 965, B1, 01.10.2002

US 3 644 409, A, 22.02.1972

WILLIAMS P. D. et. al. BIOORGANIC & MEDICINAL CHEMISTRY LETTERS, OXFORD, GB, Vol. 9, No. 9, 3 May 1999 (1999-05-03), pp 1311-1316

NANNINI G. et. al. ARZNEIMITTEL FORSCHUNG. DRUG RESEARCH, EDITIO CANTOR. AULENDORF, DE, Vol. 23, No. 8, 1973, pp. 1090-1100

(57) 1. N-гетероциклілфенілзаміщені циклічні кетоеноли формули (I)



в якій

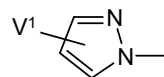
2

W означає водень, метил або етил,

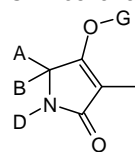
X означає хлор, метил або етил,

Y означає водень,

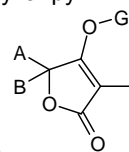
Z означає залишок в положенні 4 або 5 формули,

в якій V¹ означає хлор або метокси,

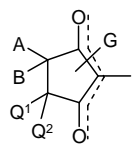
СКЕ означає одну із груп



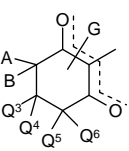
, (1)



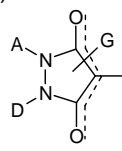
, (2)



, (6)



, (7),



, (8)

в яких

A означає водень, C₁-C₄-алкіл або циклопропіл,

B означає водень або метил, або

A, B та атом вуглецю, до якого вони приєднані, означають насичений C₅-C₆-циклоалкіл, в якому, в разі необхідності, один член кільця замінений киснем та, в разі необхідності, один раз замінений метилом або метокси, із вказівкою, що у цьому випадку Q³ означає водень,

D означає водень

або

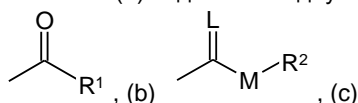
A та D разом означають C₃-C₅-алкандііл, в якому, в разі необхідності, один атом вуглецю замінений киснем,Q¹ означає водень,Q² означає водень,Q³ означає метил,Q⁴ означає метил абоQ³ та Q⁴ разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, означають насичене C₅-C₆-кільце, із вказівкою, що у цьому випадку A означає водень,Q⁵ означає водень,

(13) C2

(11) 86942

(19) UA

Q⁶ означає водень,
G означає (а) водень або одну із груп



в яких

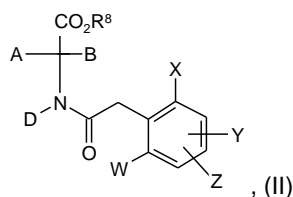
L означає кисень та

M означає кисень або сірку,

R¹ означає C₁-C₆-алкіл або C₁-C₂-алкокси-C₁-алкіл,

R² означає C₁-C₈-алкіл або бензил.

2. Спосіб одержання сполук формули (I) за п. 1, в якій СКЕ означає групу формули (1), в якій G означає водень, який **відрізняється** тим, що сполуку формули (II)



в якій

A, B, D, W, X, Y та Z мають вказані в п. 1 значення, та

R⁸ означає алкіл,

піддають внутрішньомолекулярному конденсуванню в присутності розріджувача та в присутності основи.

Даний винахід стосується нових N-гетероциклілфенілзаміщених циклічних кетенолів, кількох способів їх одержання та їх застосування як засобів боротьби зі шкідниками та/або гербіцидів та/або мікробіцидів.

Крім того винахід стосується нових селективно-гербіцидних комбінацій активних речовин, які, з одного боку, містять N-гетероциклілфенілзаміщені циклічні кетеноли та, з іншого боку, щонайменше одну сполуку, яка покращує сумісність із культурними рослинами та може бути дуже успішно застосована для селективної боротьби з бур'янами в різних культурах корисних рослин.

Фармацевтичні властивості 3-ацилпіролідін-2,4-діонів були описані раніше (S. Suzuki et al. Chem. Pharm. Bull., 15 1120 (1967)). Крім того були синтезовані N-фенілпіролідін-2,4-діони (R. Schmieder та H. Mildenberger, Liebigs Ann. Chem. 1985, 1095). Однак біологічна ефективність цих сполук не була описана.

В EP-A-0 262 399 та GB-A-2 266 888 були описані структурно подібні сполуки (3-арилпіролідін-2,4-діони), однак їх гербіцидна, інсектицидна або акарицидна дія не відома. Відомими сполуками, що проявляють гербіцидну, інсектицидну або акарицидну активність, є незаміщені, біциклічні похідні 3-арилпіролідін-2,4-діону (EP-A-355 599, EP-A-415 211 та JP-A-12-053670), а також заміщені моноциклічні похідні 3-арилпіролідін-2,4-діону (EP-A-377 893 та EP-A-442 077).

Крім того відомі поліциклічні похідні 3-арилпіролідін-2,4-діону (EP-A-442 073), а також похідні 1H-арилпіролідіндіону (EP-A-456 063, EP-A-521 334, EP-A-596 298, EP-A-613 884, EP-A-613 885, WO 94/01 997, WO 95/26 954, WO 95/20 572, EP-A-0 668 267, WO 96/25 395, WO 96/35 664, WO 97/01 535, WO 97/02 243, WO 97/36 868, WO 97/43275, WO 98/05638, WO 98/06721, WO 98/25928, WO 99/16748, WO 99/24437, WO 99/43649, WO 99/48869, WO 99/55673, WO 01/17972, WO 01/23354, WO 01/74770, WO 03/062244, DE-A-10 231 333 та DE-A-10 239 479).

Відомо, що певні заміщені похідні Δ³-дигідрофуран-2-ону мають гербіцидні властивості (див. DE-A-4 014 420). Синтез похідних тетраонові

кислоти, які застосовують як вихідні сполуки (такі як, наприклад, 3-(2-метилфеніл)-4-гідрокси-5-(4-фторфеніл)-Δ³-дигідрофуранон-(2)), також описаний в DE-A-4 014 420. Структурно подібні сполуки без вказівки на їх інсектицидну та/або акарицидну ефективність, відомі також із публікації Campbell et al, J. Chem. Soc, Perkin Trans. 1, 1985, (8) 1567-76. Крім того похідні 3-арил-Δ³-дигідрофуранону, які мають гербіцидні, акарицидні та інсектицидні властивості, відомі із EP-A-528 156, EP-A-0 647 637, WO 95/26 345, WO 96/20 196, WO 96/25 395, WO 96/35 664, WO 97/01 535, WO 97/02 243, WO 97/36 868, WO 98/05638, WO 98/25928, WO 99/16748, WO 99/43649, WO 99/48869, WO 99/55673, WO 01/17972, WO 01/23354, WO 01/74770, WO 03/062244 та DE-A-10 239 479. Крім того відомі також похідні 3-арил-Δ³-дигідротифенону (WO 95/26 345, 96/25 395, WO 97/01535, WO 97/02 243, WO 97/36 868, WO 98/05638, WO 98/25928, WO 99/16748, WO 99/43649, WO 99/48869, WO 99/55673, WO 01/17972, WO 01/23354, WO 01/74770, та WO 03/062244).

Певні незаміщені у фенільному кільці похідні фенілпіронів вже відомі (див. A.M. Chirazi, T. Kappe і E. Ziegler, Arch. Pharm. 309, 558 (1976) та K.-H. Boltze і K. Heidenbluth, Chem. Ber. 91, 2849), причому ці сполуки можуть бути застосовані як засоби боротьби зі шкідниками. Заміщені у фенільному кільці похідні фенілпірону, що мають гербіцидні, інсектицидні та акарицидні властивості, описані в EP-A-588 137, WO 96/25 395, WO 96/35 664, WO 97/01 535, WO 97/02 243, WO 97/16 436, WO 97/19 941, WO 97/36 868, WO 98/05638, WO 99/43649, WO 99/48869, WO 99/55673, WO 01/17972, WO 01/74770 та WO 03/062244.

Певні незаміщені у фенільному кільці похідні 5-феніл-1,3-тіазину вже відомі (див. E. Ziegler і E. Steiner, Monatsh. 95, 147 (1964), R. Ketcham, T. Kappe і E. Ziegler, J. Heterocycl. Chem. 10, 223 (1973)), причому ці сполуки можуть бути застосовані як засоби боротьби зі шкідниками. Заміщені у фенільному кільці похідні 5-феніл-й,3-тіазину, що проявляють гербіцидну, акарицидну та інсектицидну дію, описані в WO 94/14 785, WO 96/02 539, WO 96/35 664, WO 97/01 535, WO 97/02 243, WO

97/02 243, WO 97/36 868, WO 99/05638, WO 99/43649, WO 99/48869, WO 99/55673, WO 01/17972, WO 01/74770 та WO 03/062244.

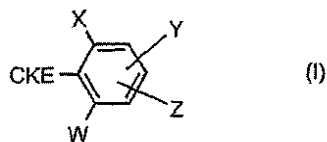
Відомо, що певні заміщені 2-арилциклопентандіони мають гербіцидні та акарицидні властивості (див., наприклад, US-4 283 348; 4 338 122; 4 436 666; 4 526 723; 4 551547; 4 632 698; WO 96/01 798; WO 96/03 366, WO 97/14 667, а також WO 98/39281, WO 99/43649, WO 99/48869, WO 99/55673, WO 01/17972, WO 01/74770 та WO 03/062244). Крім того відомі подібні заміщені сполуки; 3-гідрокси-5,5-диметил-2-фенілциклопент-2-ен-1-он із публікації Micklefield et al., Tetrahedron, (1992), 7519-26, а також природна речовина інволютин (-)-цис-5-(3,4-дигідроксифеніл)-3,4-дигідрокси-2-(4-гідроксифеніл)циклопент-2-енон із публікації Edwards et al., J. Chem. Soc. S, (1967), 405-9. Інсектицидна або акарицидна активність не описані. Крім того із публікації J. Economic Entomology, 66, (1973), 584 та викладеного опису DE-A 2 361 084 відомий 2-(2,4,6-триметилфеніл)-1,3-інданіон, який проявляє гербіцидну та акарицидну активність.

Відомо, що певні заміщені 2-арилциклогександіони мають гербіцидні та акарицидні властивості (US-4 175 135, 4 209 432, 4 256 657, 4 256 658, 4 256 659, 4 257 858, 4 283 348, 4 303 669, 4 351 666, 4 409 153, 4 436 666, 4 526 723, 4 613 617, 4 659 372, DE-A 2 813 341, а також Wheeler, T.N., J. Org. Chem. 44, 4906 (1979)), WO 99/43649, WO 99/48869, WO 99/55673, WO 01/17972, WO 01/74770 та WO 03/062244).

Відомо, що певні заміщені 4-арилпіразолідин-3,5-діони проявляють акарицидні, інсектицидні та гербіцидні властивості (див., наприклад, WO 92/16 510, EP-A-508 126, WO 96/11 574, WO 96/21652, WO 99/43649, WO 99/47525, WO 99/48869, WO 99/55673 WO 01/17 351, WO 01/17 352, WO 01/17 353, WO 01/17 972, WO 01/17 973, WO 03/028446 та WO 03/062244).

Однак ефективність та/або спектр дії цих сполук особливо при незначних витратних кількостях та концентраціях не завжди є задовільними. Крім того сумісність цих сполук із культурними рослинами є недостатньою.

Нещодавно були одержані сполуки формули (I)



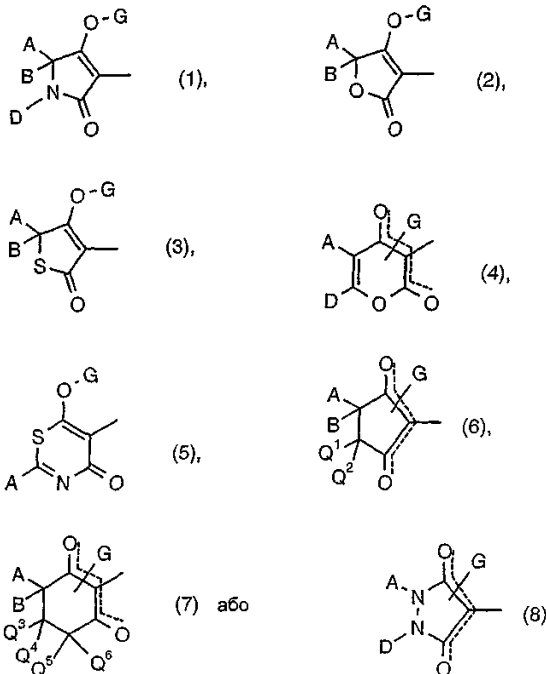
в якій

X означає галоген, алкіл, алкеніл, алкініл, алкокси, алкенілокси, алкілтіо, алкілсульфініл, алкілсульфоніл, галогеналкіл, галогеналкокси, галогеналкенілокси, нітро, ціано або відповідно, в разі необхідності, заміщені феніл, фенокси, фенілтіо, фенілалкокси або фенілалкілтіо,

W та Y незалежно один від одного означають водень, галоген, алкіл, алкеніл, алкініл, алкокси, алкенілокси, галогеналкіл, галогеналкокси, галогеналкенілокси, нітро або ціано,

Z означає відповідно, в разі необхідності, насичений або ненасичений, в разі необхідності, заміщений атомом азоту приєднаний до фенільного кільця гетероцикл, який може бути перерваний одним або двома карбонільними групами,

СКЕ означає одну із груп



в якій

A означає водень, відповідно, в разі необхідності, заміщені галогеном алкіл, алкеніл, алкоксиалкіл, алкілтіоалкіл, насичений або ненасичений, в разі необхідності, заміщений циклоалкіл, в якому, в разі необхідності, щонайменше один атом кільця замінений гетероатомом, або відповідно, в разі необхідності, заміщені галогеном, алкілом, галогеналкілом, алкокси, галогеналкокси, ціано або нітро арил, арилалкіл або гетарил,

B означає водень, алкіл або алкоксиалкіл або

A та B разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, означають насичений або ненасичений незаміщений або заміщений цикл, що, в разі необхідності, містить щонайменше один гетероатом,

D означає водень або, в разі необхідності, заміщений залишок із ряду алкіл, алкеніл, алкініл, алкоксиалкіл, насичений або ненасичений циклоалкіл, в якому, в разі необхідності, один або кілька членів кільця замінені гетероатомом, арилалкіл, арил, гетарилалкіл або гетарил або

A та D разом з атомами, до яких вони приєднані, означають насичений або ненасичений, незаміщений або заміщений в A,D-частині цикл, який, в разі необхідності, містить щонайменше один (у випадку, якщо СКЕ=8, ще один) гетероатом, або

A та Q¹ разом означають, в разі необхідності, заміщений галогеном або гідрокси алкенділ або відповідно, в разі необхідності, заміщені алкілом, алкокси, алкілтіо, циклоалкілом, бензилокси або арилом алканділ або алкенділ або

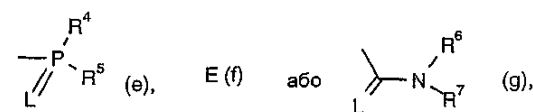
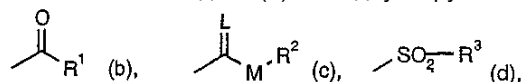
Q¹ означає водень або алкіл,

Q^2 , Q^4 , Q^5 та Q^6 незалежно один від одного означають водень або алкіл,

Q^3 означає водень, відповідно, в разі необхідності, заміщений алкіл, алкоксиалкіл, алкілтіоалкіл, в разі необхідності, заміщений циклоалкіл (в якому, в разі необхідності, одна метиленова група замінена киснем або сіркою) або, в разі необхідності, заміщений феніл або

Q^3 та Q^4 разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, означають насичений або ненасичений, незаміщений або заміщений цикл, що, в разі необхідності, містить гетероатом,

G означає водень (a) або одну із груп



в якій

E означає еквівалент іону металу або іон амонію,

L означає кисень або сірку,

M означає кисень або сірку,

R^1 означає відповідно, в разі необхідності, заміщений галогеном алкіл, алкеніл, алкоксиалкіл, алкілтіоалкіл, поліалкоксиалкіл або, в разі необхідності, заміщений галогеном, алкілом або алкокси циклоалкіл, який може бути перерваний щонайменше одним гетероатомом, відповідно, в разі необхідності, заміщені феніл, фенілалкіл, гетарил, феноксисалкіл або гетарилоксисалкіл,

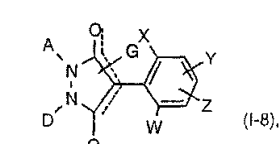
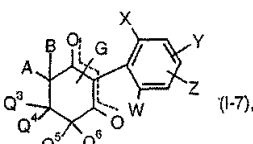
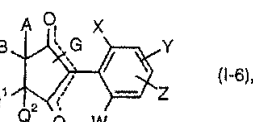
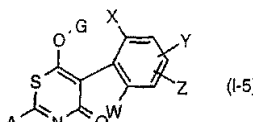
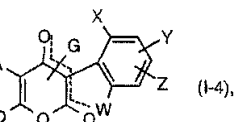
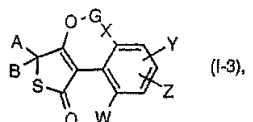
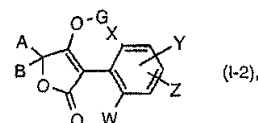
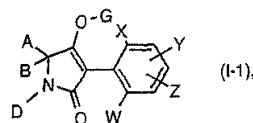
R^2 означає відповідно, в разі необхідності, заміщений галогеном алкіл, алкеніл, алкоксиалкіл, поліалкоксиалкіл або відповідно, в разі необхідності, заміщені циклоалкіл, феніл або бензил,

R^3 , R^4 та R^5 незалежно один від одного означають відповідно, в разі необхідності, заміщені галогеном алкіл, алкокси, алкіламіно, діалкіламіно, алкілтіо, алкеніліто, циклоалкілтіо або відповідно, в разі необхідності, заміщені феніл, бензил, фенокси або феніліто,

R^6 та R^7 незалежно один від одного означають водень, відповідно, в разі необхідності, заміщені галогеном алкіл, циклоалкіл, алкеніл, алкокси, алкоксиалкіл, в разі необхідності, заміщений феніл, в разі необхідності, заміщений бензил або разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, означають, в разі необхідності, перерваний киснем або сіркою цикл.

Сполуки формули (I), залежно від виду замісників, можуть існувати у формі геометричних та/або оптичних ізомерів або сумішей ізомерів у різних комбінаціях, які, в разі необхідності, можуть бути розділені відомими способами. Об'єктом даного винаходу є як чисті ізомери, так і суміші ізомерів, їх одержання та застосування, а також засоби, що їх містять. Нижче для спрощення йдеться лише про сполуки формули (I), однак під ними розуміють як чисті сполуки, так і, в разі необхідності, суміші з різним вмістом ізомерних сполук.

Враховуючи значення (1)-(8) групи СКЕ, одержують основні структури (1-1)-(1-8):

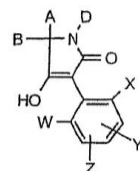


в якій

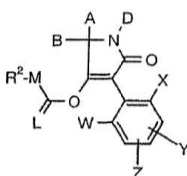
A, B, D, G, Q^1 , Q^2 , Q^3 , Q^4 , Q^5 , Q^6 , W, X, Y та Z мають вказані вище значення.

Враховуючи різні значення (a), (b), (c), (d), (e), (f) та (g) групи G, одержують такі основні структури (I-1-a) - (I-1-g), якщо СКЕ означає групу (1),

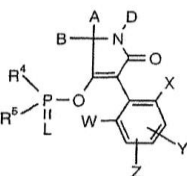
(I-1-a):



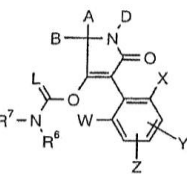
(I-1-c):



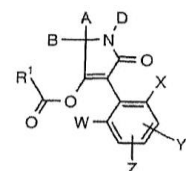
(I-1-e):



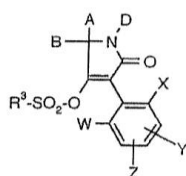
(I-1-g):



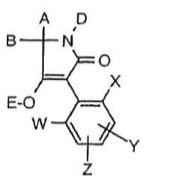
(I-1-b):



(I-1-d):



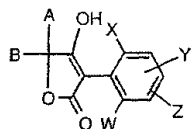
(I-1-f):



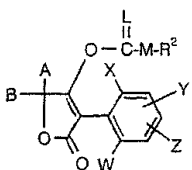
в якій

A, B, D, E, L, M, W, X, Y, Z, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ та R⁷ мають вказані вище значення. Враховуючи різні значення (a), (b), (c), (d), (e), (f) та (g) групи G, одержують такі основні структури (I-2-a) - (I-2-g), якщо СКЕ означає групу (2),

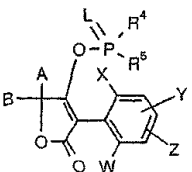
(I-2-a):



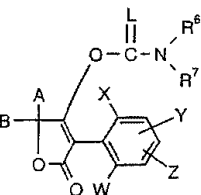
(I-2-c):



(I-2-e):



(I-2-g):

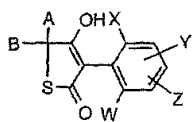


в якій

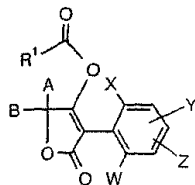
A, B, E, L, M, W, X, Y, Z, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ та R⁷ мають вказані вище значення.

Враховуючи різні значення (a), (b), (c), (d), (e), (f) та (g) групи G, одержують такі основні структури (I-3-a) - (I-3-g), якщо СКЕ означає групу (3),

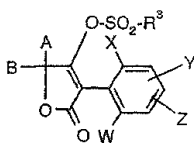
(I-3-a):



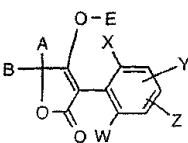
(I-2-b):



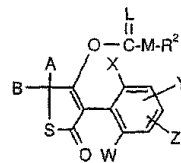
(I-2-d):



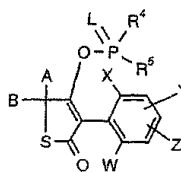
(I-2-f):



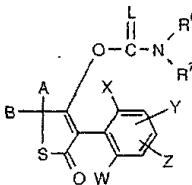
(I-3-c):



(I-3-e):



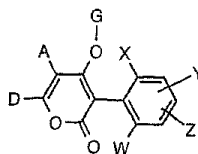
(I-3-g):



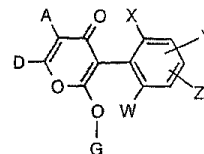
в якій

A, B, E, L, M, W, X, Y, Z, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ та R⁷ мають вказані вище значення. Сполуки формул (1-4) залежно від положення замісників G можуть існувати у двох ізомерних формах формул (I-4-A) та (I-4-B),

(I-4-A)



(I-4-B)



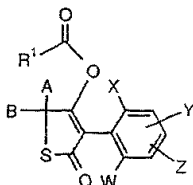
що показано пунктирною лінією у формулі (1-4).

Сполуки формул (I-4-A) та (I-4-B) можуть існувати як у сумішах, так і у формі їх чистих ізомерів. Суміші сполук формул (I-4-A) та (I-4-B), в разі необхідності, можуть бути розділені відомими фізичними методами, наприклад, хроматографічними методами.

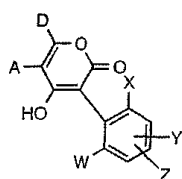
З метою унаочнення нижче вказаний лише один із можливих ізомерів. Але це не виключає того, що сполуки, в разі необхідності, можуть існувати у формі сумішей ізомерів або у інших відповідних ізомерних формах.

Враховуючи різні значення (a), (b), (c), (d), (e), (f) та (g) групи G, одержують такі основні структури (I-4-a) - (I-4-g), якщо СКЕ означає групу (4),

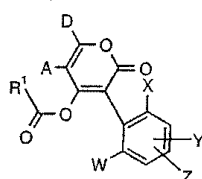
(I-3-b):



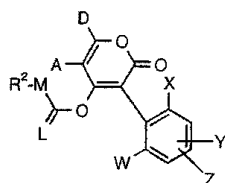
(I-4-a):



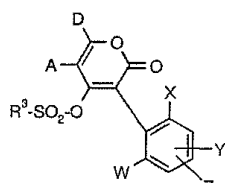
(I-4-b):



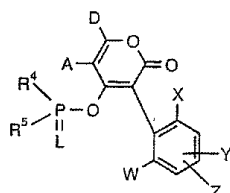
(I-4-c):



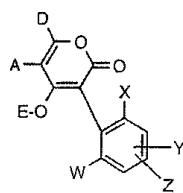
(I-4-d):



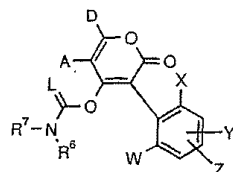
(I-4-e):



(I-4-f):



(I-4-g):

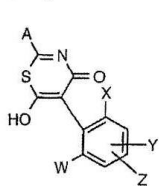


в якій

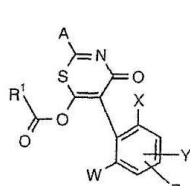
A, D, E, L, M, W, X, Y, Z, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ та R⁷ мають вказані вище значення.

Враховуючи різні значення (a), (b), (c), (d), (e), (f) та (g) групи G, одержують такі основні структури (I-5-a) - (I-5-g), якщо СКЕ означає групу (5),

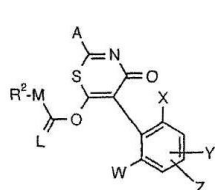
(I-5-a):



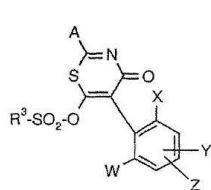
(I-5-b):



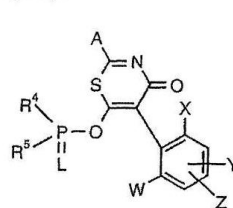
(I-5-c):



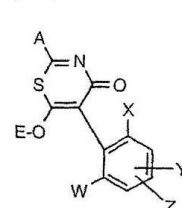
(I-5-d):



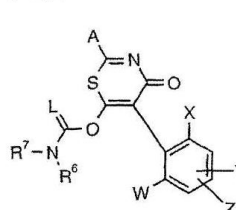
(I-5-e):



(I-5-f):



(I-5-g):

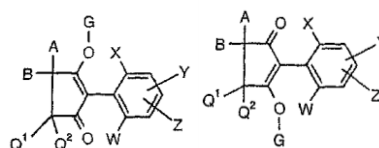


в якій

A, E, L, M, W, X, Y, Z, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ та R⁷ мають вказані вище значення. Сполуки формул (I-6) залежно від положення замісника G можуть існувати у двох ізомерних формах формул (I-6-A) та (I-6-B),

(I-6-A)

(I-6-B)



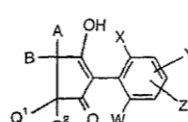
що показано пунктирною лінією у формулі (I).

Сполуки формул (I-6-A) та (I-6-B) можуть існувати як у сумішах, так і у формі їх чистих ізомерів. Суміші сполук формул (I-6-A) та (I-6-B), в разі необхідності, можуть бути розділені відомими фізичними методами, наприклад, хроматографічними методами.

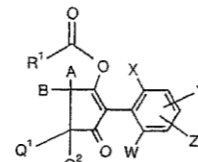
З метою унаочнення нижче вказаний лише один із можливих ізомерів. Але це не виключає того, що сполуки, в разі необхідності, можуть існувати у формі сумішей ізомерів або у інших відповідних ізомерних формах.

Враховуючи різні значення (a), (b), (c), (d), (e), (f) та (g) групи G, одержують такі основні структури (I-6-a) - (I-6-g):

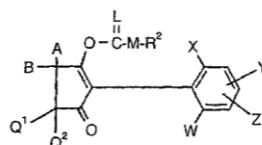
(I-6-a):



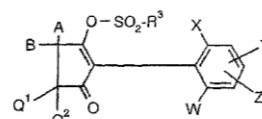
(I-6-b):



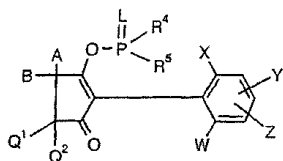
(I-6-c):



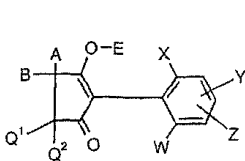
(I-6-d):



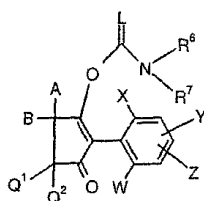
(I-6-e):



(I-6-f):



(I-6-g):



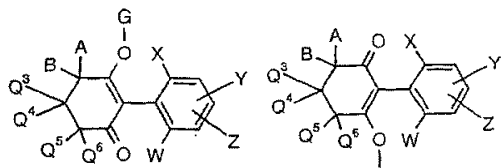
в якій

A, B, Q¹, Q², E, L, M, W, X, Y, Z, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ та R⁷ мають вказані вище значення.

Сполуки формули (1-7) залежно від положення замісника G можуть існувати у двох ізомерних формах формул (I-7-A) або (I-7-B), що показано пунктирною лінією у формулі (1-7):

(I-7-A)

(I-7-B)

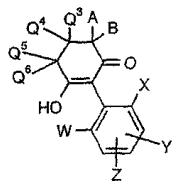


Сполуки формул (I-7-A) або (I-7-B) можуть існувати як у сумішах, так і у формі їх чистих ізомерів. Суміші сполук формул (I-7-A) та (I-7-B), в разі необхідності, можуть бути розділені відомими фізичними методами, наприклад, хроматографічними методами.

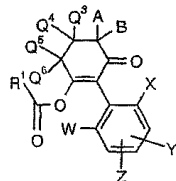
З метою унаочнення нижче вказаний лише один із можливих ізомерів. Але це не виключає того, що сполуки, в разі необхідності, можуть існувати у формі сумішей ізомерів або у інших відповідних ізомерних формах.

Враховуючи різні значення (a), (b), (c), (d), (e), (f) та (g) групи G, одержують такі основні структури (I-7-a) - (I-7-g):

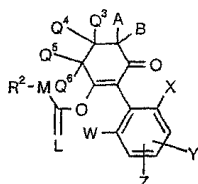
(I-7-a):



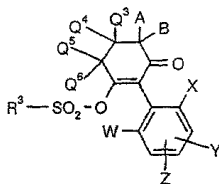
(I-7-b):



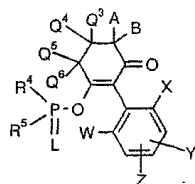
(I-7-c):



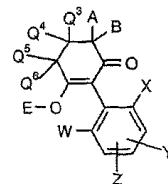
(I-7-d):



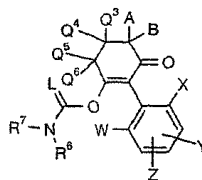
(I-7-e):



(I-7-f):



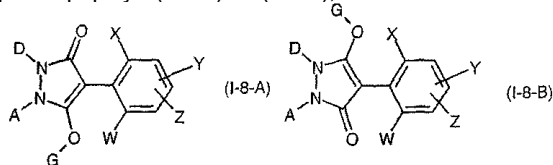
(I-7-g):



в якій

A, B, E, L, M, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y, Z, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ та R⁷ мають вказані вище значення.

Сполуки формули (1-8) залежно від положення замісника G можуть існувати у двох ізомерних формах формул (I-8-A) та (I-8-B),



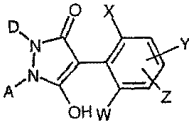
що показано пунктирною лінією у формулі (1-8).

Сполуки формул (I-8-A) або (I-8-B) можуть існувати як у сумішах, так і у формі їх чистих ізомерів. Суміші сполук формул (I-8-A) та (I-8-B), в разі необхідності, можуть бути розділені відомими фізичними методами, наприклад, хроматографічними методами.

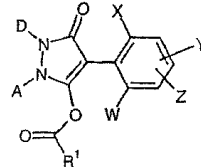
З метою унаочнення нижче вказаний лише один із можливих ізомерів. Але це не виключає того, що сполуки, в разі необхідності, можуть існувати у формі сумішей ізомерів або у інших відповідних ізомерних формах.

Враховуючи різні значення (a), (b), (c), (d), (e), (f) та (g) групи G, одержують такі основні структури (I-8-a) - (I-8-g), якщо Het означає групу (8),

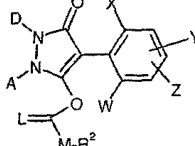
(I-8-a):



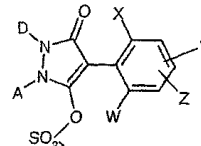
(I-8-b):



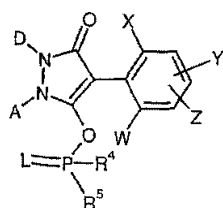
(I-8-c):



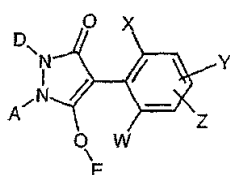
(I-8-d):



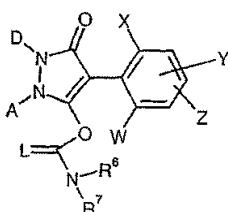
(I-8-e):



(I-8-f):



(I-8-g):

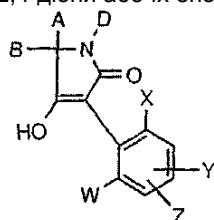


в якій

A, D, E, L, M, W, X, Y, Z, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ та R⁷ мають вказані вище значення.

Крім того з'ясували, що нові сполуки формули (I) одержують одним із описаних нижче способів

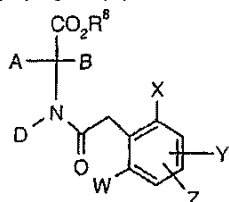
(A) заміщені 3-(N-гетероциклі)фенілпіролідин-2,4-діони або їх еноли формули (I-1-a)



(I-1-a)

в якій

A, B, D, W, X, Y та Z мають вказані вище значення, одержують шляхом внутрішньомолекулярного конденсування естерів N-ациламінокислоти формули (II)



(II)

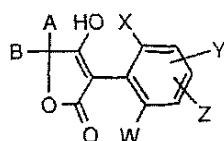
в якій

A, B, D, W, X, Y та Z мають вказані вище значення,

та

R⁸ означає алкіл (переважно C₁-C₆-алкіл), в присутності розріджувача та в присутності основи.

(B) Крім того з'ясували, що заміщені похідні 3-(N-гетероциклі)феніл-4-гідрокси-Δ³-дигідрофуранону формули (I-2-a)



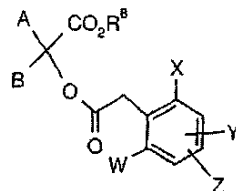
(I-2-a)

в якій

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

одержують шляхом внутрішньомолекулярного конденсування

естерів карбоноврої кислоти формули (III)

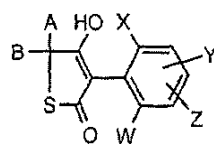


(III)

в якій

A, B, W, X, Y, Z та R⁸ мають вказані вище значення, в присутності розріджувача та в присутності основи.

(C) Крім того з'ясували, що заміщені похідні 3-(N-гетероциклі)феніл-4-гідрокси-Δ³-дигідротіофенону формули (I-3-a)



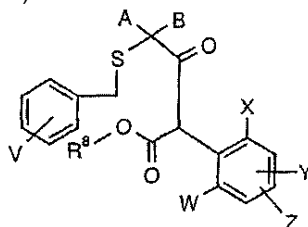
(I-3-a)

в якій

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

одержують шляхом внутрішньомолекулярного циклізування

естерів β-кетокислоти формули (IV)



(IV)

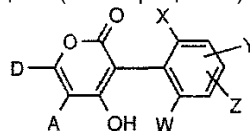
в якій

A, B, W, X, Y, Z та R⁸ мають вказані вище значення та

V означає водень, галоген, алкіл (переважно C₁-C₆-алкіл) або алкокси (переважно C₁-C₆-алкокси),

в разі необхідності, в присутності розріджувача та в присутності кислоти.

(D) Крім того з'ясували, що нові заміщені похідні 3-(N-гетероциклі)фенілпірону формули (I-4-a)

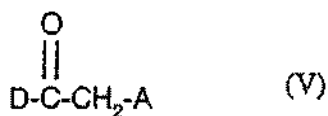


(I-4-a)

в якій

A, D, W, X, Y та Z мають вказані вище значення,

одержують шляхом взаємодії карбонільних сполук формули (V)



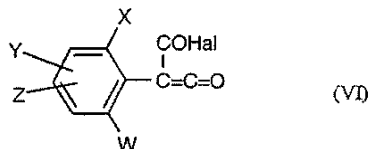
в якій

A та D мають вказані вище значення, або їх силіленольних етерів формули (Va)



в якій

A, D та R^8 мають вказані вище значення, з галогенідами кетенової кислоти формули (VI)

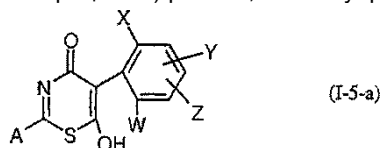


в якій

W, X, Y та Z мають вказані вище значення та Hal означає галоген (переважно хлор або бром),

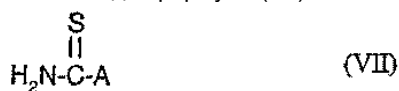
в разі необхідності, в присутності розріджувача та, в разі необхідності, в присутності акцептора кислоти. Крім того з'ясували, що

(E) нові заміщені похідні 2-(N-гетероцикліл)феніл-1,3-тіазину формули (I-5-a)



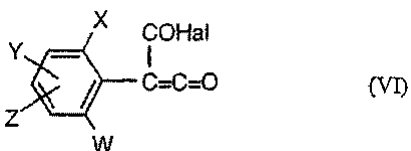
в якій

A, W, X, Y та Z мають вказані вище значення, одержують шляхом взаємодії тіоамідів формули (VII)



в якій

A має вказані вище значення, з галогенідами кетенової кислоти формули (VI)

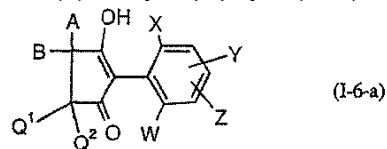


в якій

Hal, W, X, Y та Z мають вказані вище значення,

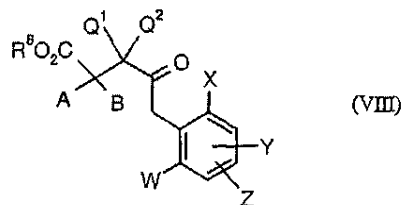
в разі необхідності, в присутності розріджувача та, в разі необхідності, в присутності акцептора кислоти Крім того з'ясували, що

(F) сполуки формули (I-6-a)



в якій

A, B, Q^1 , Q^2 , W, X, Y та Z мають вказані вище значення, одержують шляхом внутрішньомолекулярного циклізування естерів кетокарбонової кислоти формули (VIII)



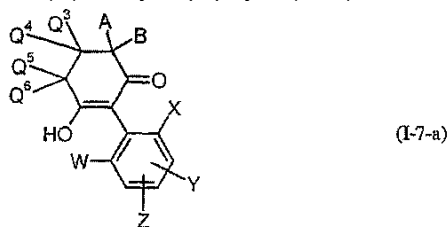
в якій

A, B, Q^1 , Q^2 , W, X, Y та Z мають вказані вище значення та

R^8 означає алкіл (зокрема C_1 - C_8 -алкіл), в разі необхідності, в присутності розріджувача та в присутності основи

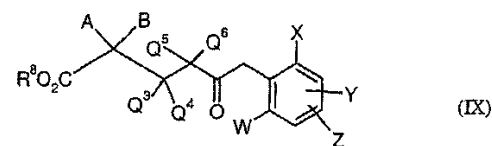
Крім того з'ясували, що

(G) сполуки формули (I-7-a)



в якій

A, B, Q^3 , Q^4 , Q^5 , Q^6 , W, X, Y та Z мають вказані вище значення, одержують шляхом внутрішньомолекулярного конденсування естерів 6-арил-5-кетогексанової кислоти формули (IX)



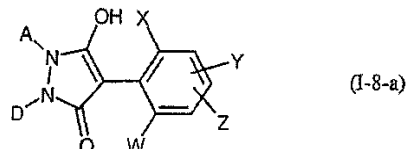
в якій

A, B, Q^3 , Q^4 , Q^5 , Q^6 , W, X, Y та Z мають вказані вище значення

та

R^8 означає алкіл (переважно C_1 - C_6 -алкіл), в присутності розріджувача та в присутності основи.

(H) Крім того з'ясували, що сполуки формули (I-8-a)

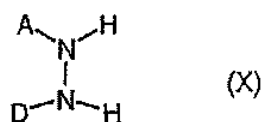


в якій

A, D, W, X, Y та Z мають вказані вище значення,

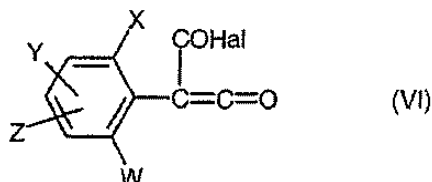
одержують шляхом взаємодії сполук формули (X)

в якій



(X)

A та D мають вказані вище значення,
α) зі сполуками формули (VI)

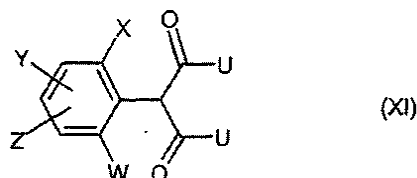


(VI)

в якій
Hal, W, X, Y та Z мають вказані вище значення,

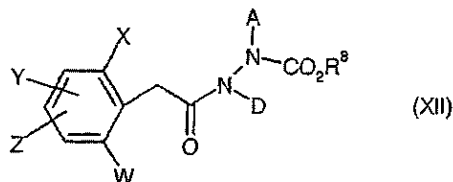
в разі необхідності, в присутності розріджувача та, в разі необхідності, в присутності акцептора кислоти або шляхом взаємодії

β) зі сполуками формули (XI)



(XI)

в якій
W, X, Y та Z мають вказані вище значення, та U означає NH₂ або O-R⁸, причому R⁸ має вказані вище значення, в разі необхідності, в присутності розріджувача та, в разі необхідності, в присутності основи, або γ) зі сполуками формули (XII)



(XII)

в якій
A, D, W, X, Y, Z та R⁸ мають вказані вище значення,

в разі необхідності, в присутності розріджувача та, в разі необхідності, в присутності основи.

Крім того з'ясували, що

(I) сполуки зазначених вище формул (I-1-b) - (I-8-b), в яких A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, R¹, W, X, Y та Z мають вказані вище значення, одержують шляхом взаємодії сполук зазначених вище формул (I-1-a) - (I-8-a), в яких A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y та Z мають вказані вище значення,

(a) із галогенідами кислоти формули (XIII)



(XIII)

в якій
R¹ має вказані вище значення та Hal означає галоген (зокрема хлор або бром) або

(β) з ангідридами карбонової кислоти формули (XIV)



(XIV)

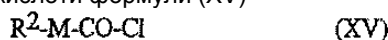
в якій

R¹ має вказані вище значення,

в разі необхідності, в присутності розріджувача та, в разі необхідності, в присутності акцептора кислоти;

(J) сполуки зазначених вище формул (1-1-c) - (I-8-c), в яких A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, R², M, W, X, Y та Z мають вказані вище значення та L означає кисень, одержують шляхом взаємодії сполук зазначених вище формул (I-1-a) - (I-8-a), в яких A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y та Z мають вказані вище значення,

з естерами або тіоестерами хлормурашиної кислоти формули (XV)



(XV)

в якій

R² та M мають вказані вище значення,

в разі необхідності в присутності розріджувача та, в разі необхідності, в присутності агента, що зв'язує кислоту;

(K) сполуки зазначених вище формул (I-1 -c) - (I-8-c), в яких A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, R², M, W, X, Y та Z мають вказані вище значення та L означає сірку, одержують шляхом взаємодії сполук зазначених вище формул (I-1-a) - (I-8-a), в яких A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y та Z мають вказані вище значення,

з естерами хлормонотіомурашиної або хлордітіомурашиної кислоти формули (XVI)



(XVI)

в якій

M та R² мають вказані вище значення,

в разі необхідності, в присутності розріджувача та, в разі необхідності, в присутності агента, що зв'язує кислоту, та

(L) сполуки зазначених вище формул (1-1-d) - (I-8-d), в яких A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, R³, W, X, Y та Z мають вказані вище значення, одержують шляхом взаємодії сполук зазначених вище формул (I-1-a) - (I-8-a), в яких A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y та Z мають вказані вище значення,

із хлоридами сульфонові кислоти формули (XVII)



(XVII)

в якій

R³ має вказані вище значення,

в разі необхідності, в присутності розріджувача та, в разі необхідності, в присутності агента, що зв'язує кислоту,

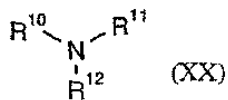
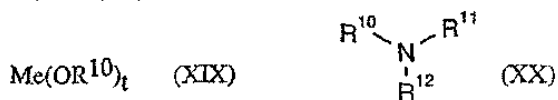
(M) сполуки зазначених вище формул (I-1-e) - (I-8-e), в яких A, B, D, L, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, R⁴, R⁵, W, X, Y та Z мають вказані вище значення, одержують шляхом взаємодії сполук формул (I-1-a) - (I-8-a), в яких A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y та Z мають вказані вище значення,

зі сполуками фосфору формули (XVIII)



в якій
L, R⁴ та R⁵ мають вказані вище значення та
Hal означає галоген (зокрема хлор або бром),
в разі необхідності, в присутності розріджувача
та, в разі необхідності, в присутності агента, що
зв'язує кислоту,

(N) сполуки зазначених вище формул (I-1-f) -
(I-8-f), в яких A, B, D, E, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X,
Y та Z мають вказані вище значення, одержують
шляхом взаємодії сполук зазначених вище фор-
мул (I-1-a) - (I-8-a), в яких A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵,
Q⁶, W, X, Y та Z мають вказані вище значення,
зі сполуками металу або амінами формул
(XIX) або (XX)



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

R¹⁰, R¹¹, R¹² незалежно один від одного озна-
чають водень або алкіл (переважно C₁-C₈-алкіл),
в разі необхідності, в присутності розріджува-
ча,

(O) сполуки зазначених вище формул (I-1 -d) -
(I-8-g), в яких A, B, D, L, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, R⁶,
R⁷, W, X, Y та Z мають вказані вище значення,
одержують шляхом взаємодії сполук зазначених
вище формул (I-1-a) - (I-8-a), в яких A, B, D, Q¹, Q²,
Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y та Z мають вказані вище
значення,

(α) з ізоціанатами або ізотіоціанатами форму-
ли (XXI)



в якій
R⁶ та L мають вказані вище значення,
в разі необхідності, в присутності розріджувача
та, в разі необхідності, в присутності каталізатора
або

(β) з хлоридами карбамідної або тіокарбамід-
ної кислоти формули (XXII)

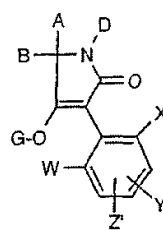
в якій



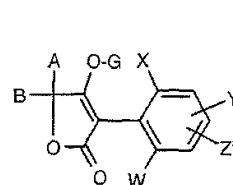
L, R⁶ та R⁷ мають вказані вище значення,
в разі необхідності, в присутності розріджувача
та, в разі необхідності, в присутності агента, що
зв'язує кислоту,

(P) сполуки зазначених вище формул (1-1) -
(1-8), в яких A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y
та Z мають вказані вище значення, одержують
шляхом взаємодії сполук формул (I-1')-(I-8')

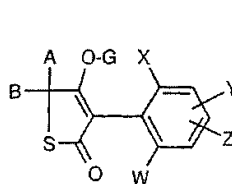
(I-1'):



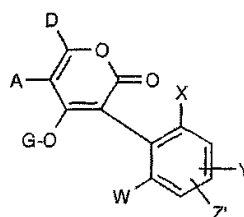
(I-2'):



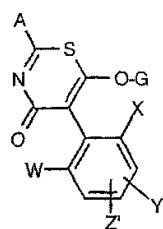
(I-3'):



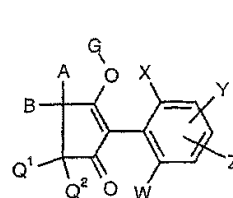
(I-4'):



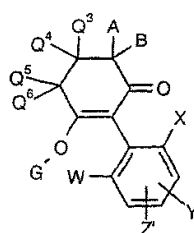
(I-5'):



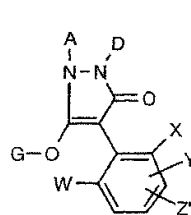
(I-6'):



(I-7'):



(I-8'):



в яких
A, B, D, G, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X та Y ма-
ють вказані вище значення та

Z' означає хлор, бром, йод, переважно бром,
з NH-гетероциклами формули (XXIII)

H-Z (XXEI)

в якій

Z має вказані вище значення,

в присутності розріджувача, основи та каталі-
затора, причому як каталізатор застосовують зок-
рема солі міді (I).

Крім того з'ясували, що нові сполуки формули
(I) проявляють дуже високу ефективність як засо-
би боротьби із бур'янами, переважно як інсектици-
ди та/або акарициди та/або гербіциди та/або фун-
гіциди.

Несподівано з'ясували також, що певні замі-
щені циклічні кетоеноли при спільному застосу-
ванні з описаними нижче сполуками, що покращу-
ють сумісність із культурними рослинами,
(сафенерами/антидотами) дуже ефективно запобі-
гають пошкодженню культурних рослин особливо
вигідно можуть бути застосовані як дуже ефектив-
ні комбінаційні препарати для селективної бороть-
би з небажаними рослинами в культурах корисних

рослин, таких як, наприклад, зернові, а також кукурудза, соя та рис.

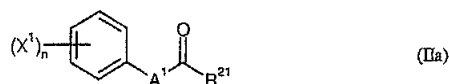
Об'єктом даного винаходу є також селективно-гербіцидні засоби, що містять ефективну кількість комбінації активних речовин, яка як складові включає:

(а') щонайменше один заміщений циклічний кетонол формули (I), в якій SKE, W, X, Y та Z мають вказані вище значення, та

(б') щонайменше одну сполуку, яка покращує сумісність із культурними рослинами, із такої групи сполук:

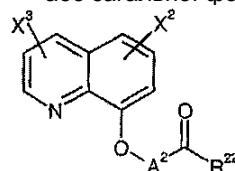
4-дихлорацетил-1-окса-4-азаспіро[4.5]-декан (AD-67, MON-4660), 1-дихлорацетил-гексагідро-3,3,8а-триметилпіроло[1,2-а]-піримідин-6(2H)-он (дициклонон, BAS-145138), 4-дихлорацетил-3,4-дигідро-3-метил-2H-1,4-бензоксазин (беноксакор), 1-метилгексильовий естер 5-хлорхінолін-8-оксиоцтової кислоти (клоквінтоцет-мексил - див. також споріднені сполуки в EP-A-86750, EP-A-94349, EP-A-191736, EP-A-492366), 3-(2-хлорбензил)-1-(1-метил-1-фенілетил)карбамід (кумілурон), α -(ціанометоксіміно)фенілацетонітрил (ціометриніл), 2,4-дихлорфеноксиоцтова кислота (2,4-D), 4-(2,4-дихлорфенокси)-масляна кислота (2,4-DB), 1-(1-метил-1-фенілетил)-3-(4-метилфеніл)карбамід (даімурон, димрон), 3,6-дихлор-2-метоксибензойна кислота (дикамба), S-1-метил-1-фенілетильовий естер піперидин-1-тіокарбонової кислоти (димепіперат), 2,2-дихлор-N-(2-оксо-2-(2-пропеніламіно)етил)-N-(2-пропеніл)ацетамід (DKA-24), 2,2-дихлор-N,N-ди-2-пропеніл-ацетамід (дихлормід), 4,6-дихлор-2-фенілпіримідин (фенклорим), етиловий естер 1-(2,4-дихлорфеніл)-5-трихлорметил-1H-1,2,4-триазол-3-карбонової кислоти (фенхлоразол-етил - див. також споріднені сполуки в EP-A-174562 та EP-A-346620), феніл метильовий естер 2-хлор-4-трифторметилтіазол-5-карбонової кислоти (флуразол), 4-хлор-N-(1,3-діоксолан-2-ілметоксид)- α -трифторацетофеноноксим (флуксофенім), 3-дихлорацетил-5-(2-фураніл)-2,2-диметиллоксазолідин (фурилазол, MON-13900), етил-4,5-дигідро-5,5-дифеніл-3-ізоксазолкарбоксилат (ізоксацифен-етил - див. також споріднені сполуки в WO-A-95/07897), 1-(етоксикарбоніл)етил-3,6-дихлор-2-метоксибензоат (лактидихлор), (4-хлор-отолілокси)оцтова кислота (MCPA), 2-(4-хлор-отолілокси)пропіонова кислота (мекопроп), діетил-1-(2,4-дихлорфеніл)-4,5-дигідро-5-метил-1H-піразол-3,5-дикарбоксилат (мефенпір-діетил - див. також споріднені сполуки в WO-A-91/07874) 2-дихлорметил-2-метил-1,3-діоксолан (MG-191), 2-пропеніл-1-окса-4-азаспіро[4.5]декан-4-карбодитіоати (MG-838), ангідрид 1,8-нафталенової кислоти, α -(1,3-діоксолан-2-ілметоксіміно)фенілацетонітрил (оксабетриніл), 2,2-дихлор-N-(1,3-діоксолан-2-ілметил)-N-(2-пропеніл)ацетамід (PPG-1292), 3-дихлорацетил-2,2-диметиллоксазолідин (R-28725), 3-дихлорацетил-2,2,5-триметиллоксазолідин (R-29148), 4-(4-хлор-отоліл)масляна кислота, 4-(4-хлорфенокси)-масляна кислота, дифенілметоксиоцтова кислота, метильовий естер дифенілметок-

сиоцтової кислоти, етиловий естер дифенілметоксиоцтової кислоти, метильовий естер 1-(2-хлорфеніл)-5-феніл-1H-піразол-3-карбонової кислоти, етиловий естер 1-(2,4-дихлорфеніл)-5-метил-1H-піразол-3-карбонової кислоти, етиловий естер 1-(2,4-дихлорфеніл)-5-ізопропіл-1H-піразол-3-карбонової кислоти, етиловий естер 1-(2,4-дихлорфеніл)-5-(1,1-диметилетил)-1H-піразол-3-карбонової кислоти, етиловий естер 1-(2,4-дихлорфеніл)-5-феніл-1H-піразол-3-карбонової кислоти (див. також споріднені сполуки в EP-A-269806 та EP-A-333131), етиловий естер 5-(2,4-дихлорбензил)-2-ізоксазолін-3-карбонової кислоти, етиловий естер 5-феніл-2-ізоксазолін-3-карбонової кислоти, етиловий естер 5-(4-фторфеніл)-5-феніл-2-ізоксазолін-3-карбонової кислоти (див. також споріднені сполуки в WO-A-91/08202), 1,3-диметилбут-1-ильовий естер 5-хлорхінолін-8-оксиоцтової кислоти, 4-алілоксибутиловий естер 5-хлорхінолін-8-оксиоцтової кислоти, 1-алілоксипроп-2-ильовий естер 5-хлорхінолін-8-оксиоцтової кислоти, метильовий естер 5-хлорхіноксалін-8-оксиоцтової кислоти, етиловий естер 5-хлорхінолін-8-окси-оцтової кислоти, аліловий естер 5-хлорхіноксалін-8-оксиоцтової кислоти, 2-оксопроп-1-ильовий естер 5-хлорхінолін-8-оксиоцтової кислоти, діетильовий естер 5-хлорхінолін-8-окси-малонової кислоти, діаліловий естер 5-хлорхіноксалін-8-оксималонової кислоти, діетильовий естер 5-хлорхінолін-8-оксималонової кислоти (див. також споріднені сполуки в EP-A-582198), 4-карбоксихроман-4-ілоцтова кислота (AC-304415, див. EP-A-613618), 4-хлорфеноксиоцтова кислота, 3,3'-диметил-4-метоксибензофенон, 1-бром-4-хлорметилсульфонілбензоїл, 1-[4-(N-2-метоксибензоїлсульфамойл)феніл]-3-метилкарбамід (також N-(2-метоксибензоїл)-4-[(метиламінокарбоніл)аміно]бензолсульфонамід), 1-[4-(N-2-метоксибензоїлсульфамойл)феніл]-3,3-диметилкарбамід, 1-[4-(N-4,5-диметилбензолсульфамойл)феніл]-3-метилкарбамід, 1-[4-(N-нафтилсульфамойл)феніл]-3,3-диметил-карбамід, N-(2-метокси-5-метилбензоїл)-4-(циклопропіламінокарбоніл)бензолсульфонамід, та/або одну із таких сполук загальної формули (IIa)



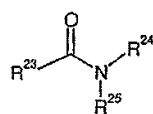
(IIa)

або загальної формули (IIb)



(IIb)

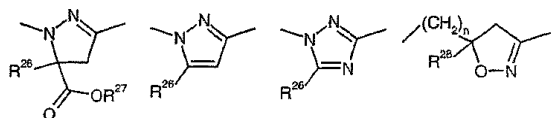
або загальної формули (IIc)



(IIc)

причому
n означає число від 0 до 5,

A¹ означає одну із зображених двовалентних гетероциклічних груп,



в яких

n означає число від 0 до 5,

A² означає, в разі необхідності, заміщений C₁-C₄-алкілом та/або C₁-C₄-алкокси-карбонілом алканділ, що містить 1 або 2 атоми вуглецю,

R²¹ означає гідрокси, меркапто, аміно, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-алкілтіо, C₁-C₆-алкіламіно або ді-(C₁-C₄-алкіл)аміно,

R²² означає гідрокси, меркапто, аміно, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-алкілтіо, C₁-C₆-алкіламіно або ді-(C₁-C₄-алкіл)аміно,

R²³ означає відповідно, в разі необхідності, заміщений фтором, хлором та/або бромом C₁-C₄-алкіл,

R²⁴ означає водень, відповідно, в разі необхідності, заміщені фтором, хлором та/або бромом C₁-C₆-алкіл, C₂-C₆-алкеніл або C₂-C₆-алкініл, C₁-C₄-алкокси-C₁-C₄-алкіл, діоксоланіл-C₁-C₄-алкіл, фурил, фурил-C₁-C₄-алкіл, тієніл, тіазоліл, піперидиніл або, в разі необхідності, заміщений фтором, хлором та/або бромом або C₁-C₄-алкілом феніл,

R²⁵ означає водень, відповідно, в разі необхідності, заміщені фтором, хлором та/або бромом C₁-C₆-алкіл, C₂-C₆-алкеніл або C₂-C₆-алкініл, C₁-C₄-алкокси-C₁-C₄-алкіл, діоксоланіл-C₁-C₄-алкіл, фурил, фурил-C₁-C₄-алкіл, тієніл, тіазоліл, піперидиніл, або, в разі необхідності, заміщений фтором, хлором та/або бромом або C₁-C₄-алкілом феніл, або разом з R²⁴ означає C₃-C₆-алкандііл або C₂-C₅-оксаалкандііл, відповідно, в разі необхідності, заміщені C₁-C₄-алкілом, фенілом, фурилом, анельованим бензолним кільцем або двома замісниками, які разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, утворюють 5- або 6-членний карбоксикцикл,

R²⁶ означає водень, ціано, галоген, або відповідно, в разі необхідності, заміщені фтором, хлором та/або бромом C₁-C₄-алкіл, C₃-C₆-циклоалкіл або феніл,

R²⁷ означає водень, в разі необхідності, заміщені гідрокси, ціано, галогеном або C₁-C₄-алкокси C₁-C₆-алкіл, C₃-C₆-циклоалкіл або три-(C₁-C₄-алкіл)силіл,

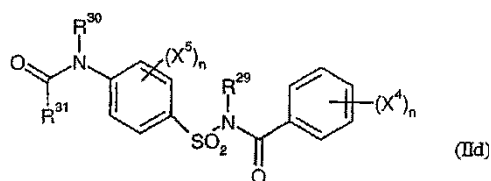
R²⁸ означає водень, ціано, галоген, або відповідно, в разі необхідності, заміщені фтором, хлором та/або бромом C₁-C₄-алкіл, C₃-C₆-циклоалкіл або феніл,

X¹ означає нітро, ціано, галоген, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-алкокси або C₁-C₄-галогеналкокси,

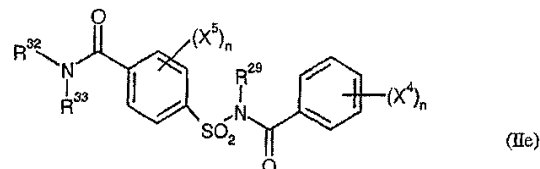
X² означає водень, ціано, нітро, галоген, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-алкокси або C₁-C₄-галогеналкокси,

X³ означає водень, ціано, нітро, галоген, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-алкокси або C₁-C₄-галогеналкокси,

та/або такі сполуки загальної формули (IId)



або загальної формули (Ile)



причому

n означає число від 0 до 5,

R²⁹ означає водень або C₁-C₄-алкіл,

R³⁰ означає водень або C₁-C₄-алкіл,

R³¹ означає водень, відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, галогеном або C₁-C₄-алкокси C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-алкілтіо, C₁-C₆-алкіламіно або ді-(C₁-C₄-алкіл)аміно, або відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, галогеном або C₁-C₄-алкілом C₃-C₆-циклоалкіл, C₃-C₆-циклоалкілокси, C₃-C₆-циклоалкілтіо або C₃-C₆-циклоалкіламіно,

R³² означає водень, в разі необхідності, заміщений ціано, гідрокси, галогеном або C₁-C₄-алкокси C₁-C₆-алкіл, відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано або галогеном C₃-C₆-алкеніл або C₃-C₆-алкініл або, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном або C₁-C₄-алкілом C₃-C₆-циклоалкіл,

R³³ означає водень, в разі необхідності, заміщений ціано, гідрокси, галогеном або C₁-C₄-алкокси C₁-C₆-алкіл, відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано або галогеном C₃-C₆-алкеніл або C₃-C₆-алкініл, в разі необхідності, заміщений ціано, галогеном або C₁-C₄-алкілом C₃-C₆-циклоалкіл або, в разі необхідності, заміщений нітро, ціано, галогеном, C₁-C₄-алкілом, C₁-C₄-галогеналкілом, C₁-C₄-алкокси або C₁-C₄-галогеналкокси феніл або разом з R³² означає відповідно, в разі необхідності, заміщені C₁-C₄-алкілом C₂-C₆-алкандііл або C₂-C₅-оксаалкандііл,

X⁴ означає нітро, ціано, карбоксил, карбамоїл, форміл, сульфамойл, гідрокси, аміно, галоген, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-алкокси або C₁-C₄-галогеналкокси та

X⁵ означає нітро, ціано, карбоксил, карбамоїл, форміл, сульфамойл, гідрокси, аміно, галоген, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-галогеналкіл, C₁-C₄-алкокси або C₁-C₄-галогеналкокси.

Сполуки згідно з винаходом загалом визначаються формулою (I). Нижче вказані переважні замісники або області переважних значень залишків вказаних вище та нижче формул:

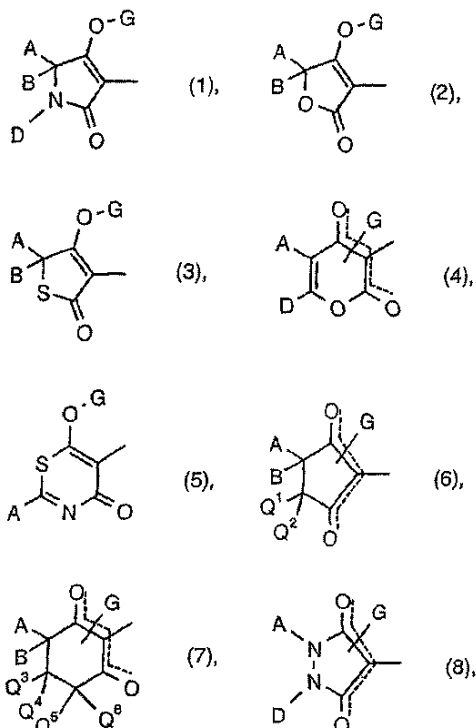
X означає переважно галоген, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-алкеніл, C₁-C₆-алкініл, C₁-C₆-галогеналкіл, C₁-C₆-алкокси, C₃-C₆-алкенілокси, C₁-C₆-алкілтіо, C₁-C₆-алкілсульфініл, C₁-C₆-алкілсульфоніл, C₁-C₆-галогеналкокси, C₃-C₆-галогеналкентокси, нітро, ціано або відповідно, в разі необхідності, 1-2 рази заміщені галогеном, C₁-C₆-алкілом, C₁-C₆-алкокси,

C₁-C₄-галогеналкілом, C₁-C₄-галогеналкокси, нітро або ціано феніл, фенокси, фенілітіо, бензилокси або бензилтіо,

W та Y означають переважно незалежно один від одного водень, галоген, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-алкеніл, C₁-C₆-алкініл, C₁-C₆-галогеналкіл, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-галогеналкокси, нітро або ціано,

Z означає переважно, в разі необхідності, заміщені піразоліл, триазоліл, тетразоліл, піроліл, індоліл, бензімідазоліл, бензпіразоліл, бензтриазоліл, піролідиніл, піперидиніл, піперазидиніл, морфолініл або тіоморфолініл, приєднані атомом азоту до фенільного кільця,

СКЕ означає переважно одну із груп



A означає переважно водень або відповідно, в разі необхідності, 1-5 разів заміщені галогеном C₁-C₁₂-алкіл, C₃-C₈-алкеніл, C₁-C₁₀-алкокси-C₁-C₈-алкіл, C₁-C₁₀-алкілтіо- C₁-C₆-алкіл, в разі необхідності, 1-3 рази заміщений галогеном, C₁-C₆-алкілом, C₁-C₂-галогеналкілом або C₁-C₆-алкокси C₃-C₈-циклоалкіл, в якому, в разі необхідності, один або два несусідні члени кільця замінені киснем та/або сіркою, або відповідно, в разі необхідності, 1-3 рази заміщені галогеном, C₁-C₆-алкілом, C₁-C₆-галогеналкілом, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-галогеналкокси, ціано або нітро феніл або нафтил, гетарил, що містить 5 або 6 атомів кільця (наприклад, фураніл, піридил, імідазоліл, триазоліл, піразоліл, піримідиніл, тіазоліл або тіеніл), феніл- C₁-C₆-алкіл або нафтил- C₁-C₆-алкіл,

B означає переважно водень, C₁-C₁₂-алкіл або C₁-C₈-алкокси- C₁-C₆-алкіл або A, B та атом вуглецю, до якого вони приєднані, означають переважно насичений C₃-C₁₀-циклоалкіл або ненасичений C₅-C₁₀-циклоалкіл, в яких, в разі необхідності, один член кільця замінений киснем або сіркою та які, в разі необхідності, один або два рази заміщені C₁-

C₈-алкілом, C₃-C₁₀-циклоалкілом, C₁-C₈-галогеналкілом, C₁-C₈-алкокси, C₁-C₈-алкілтіо, галогеном або фенілом, або

A, B та атом вуглецю, до якого вони приєднані, означають переважно C₃-C₆-циклоалкіл, який заміщений однією алкілендіїльною, алкілендіоксильною або алкілендитіоїльною групою, яка, в разі необхідності, містить один або два несусідні атоми кисню та/або сірки та, в разі необхідності, 1-4 рази заміщена C₁-C₄-алкілом, або яка разом з атомом кисню, до якого вона приєднана, утворює 5- - 8-членне кільце або

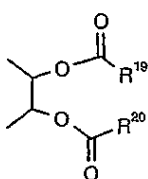
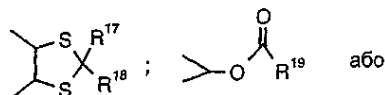
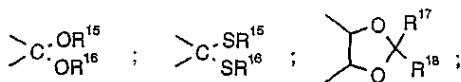
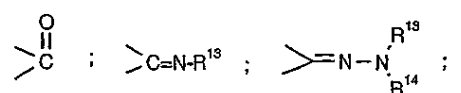
A, B та атом вуглецю, до якого вони приєднані, означають переважно C₃-C₁₀-циклоалкіл або C₅-C₈-циклоалкеніл, в яких два замісники разом з атомами вуглецю, до яких вони приєднані, означають відповідно, в разі необхідності, 1-2 рази заміщені C₁-C₆-алкілом, C₁-C₆-алкокси або галогеном C₂-C₆-алкандіїл, C₂-C₆-алкендіїл або C₂-C₆-алкандієндіїл, в яких, в разі необхідності, одна метиленова група замінена киснем або сіркою,

D означає переважно водень, відповідно, в разі необхідності, 1-5 разів заміщені галогеном C₁-C₁₂-алкіл, C₃-C₈-алкеніл, C₃-C₈-алкініл, C₁-C₁₀-алкокси-C₁-C₈-алкіл, в разі необхідності, 1-3 рази заміщений галогеном, C₁-C₄-алкілом, C₁-C₄-алкокси або C₁-C₄-галогеналкілом C₃-C₈-циклоалкіл, в якому, в разі необхідності, один член кільця замінений киснем або сіркою, або відповідно, в разі необхідності, 1-3 рази заміщені галогеном, C₁-C₆-алкілом, C₁-C₆-галогеналкілом, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-галогеналкокси, ціано або нітро феніл, гетарил, що містить 5 або 6 атомів кільця (наприклад, фураніл, імідазоліл, піридил, тіазоліл, піразоліл, піримідиніл, піроліл, тіеніл або триазоліл), феніл- C₁-C₆-алкіл або гетарил- C₁-C₆-алкіл, що містить 5 або 6 атомів кільця (наприклад, фураніл, імідазоліл, піридил, тіазоліл, піразоліл, піримідил, піроліл, тіеніл або триазоліл) або

A та D разом означають переважно відповідно, в разі необхідності, 1 або 2 рази заміщені C₃-C₆-алкандіїл або C₃-C₆-алкендіїл, в яких, в разі необхідності, одна метиленова група замінена карбонільною групою, киснем або сіркою та

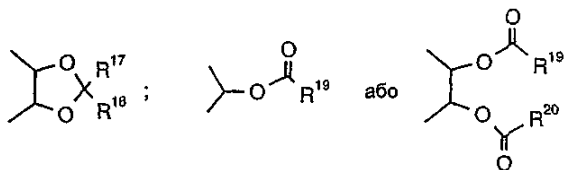
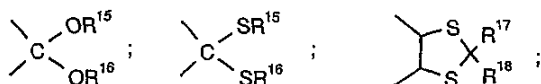
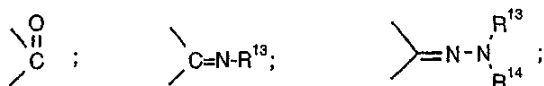
причому як замісники відповідно застосовують такі сполуки:

галоген, гідрокси, меркапто або відповідно, в разі необхідності, 1-3 рази заміщені галогеном C₁-C₁₀-алкіл, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-алкілтіо, C₃-C₇-циклоалкіл, феніл або бензилокси, або C₃-C₆-алкандіїлну, C₃-C₆-алкендіїлну або бутадієнілну групу, яка, в разі необхідності, заміщена C₁-C₆-алкілом або в якій, в разі необхідності, два сусідні замісники разом з атомами вуглецю, до яких вони приєднані, утворюють насичений або ненасичений цикл, що містить 5 або 6 атомів кільця (у випадку сполук формули (I-1) A та D разом з атомами, до яких вони приєднані, означають, наприклад, вказані нижче групи (AD-1 - AD-10)), який може містити кисень або сірку або, в разі необхідності, одну із таких груп



або

A та Q¹ разом означають переважно C₃-C₆-алкандііл або C₃-C₆-алкендііл, відповідно, в разі необхідності, один або два рази однаково або по-різному заміщені галоген, гідрокси, або C₁-C₁₀-алкілом, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-алкілтіо, C₃-C₇-циклоалкілос, які в свою чергу, в разі необхідності, 1-3 рази однаково або по-різному заміщені галогеном, або бензилокси чи фенілом, які в свою чергу, в разі необхідності, 1-3 рази однаково або по-різному заміщені галогеном, C₁-C₆-алкілом або C₁-C₆-алкокси, які крім того, в разі необхідності, містять одну із таких груп



або перекриті C₁-C₂-алкандіільною групою або атомом кисню або

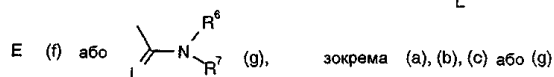
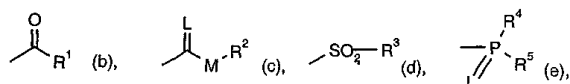
Q¹ означає переважно водень або C₁-C₄-алкіл, Q², Q⁴, Q⁵ та Q⁶ незалежно один від одного означають переважно водень або C₁-C₄-алкіл,

Q³ означає переважно водень, відповідно, в разі необхідності, 1-5 разів заміщені галогеном C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-алкокси- C₁-C₂-алкіл, C₁-C₆-алкілтіо- C₁-C₂-алкіл, в разі необхідності, заміщений C₁-C₄-алкілом або C₁-C₄-алкокси C₃-C₈-циклоалкіл, в якому, в разі необхідності, одна метиленова група замінена киснем або сіркою, або, в разі необхідності, 1-2 рази заміщений галогеном, C₁-C₄-алкілом, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₂-

галогеналкілом, C₁-C₂-галогеналкокси, ціано або нітро феніл або

Q³ та Q⁴ разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, означають переважно, в разі необхідності, 1-3 рази заміщене C₁-C₄-алкілом, C₁-C₄-алкокси або C₁-C₂-галогеналкілом C₃-C₇-кільце, в якому, в разі необхідності, один член кільця замінений киснем або сіркою,

G означає переважно водень (a) або одну із груп



в яких

E означає еквівалент іону металу або іон амонію,

L означає кисень або сірку та

M означає кисень або сірку,

R¹ означає переважно відповідно, в разі необхідності, 1-5 разів заміщені галогеном C₁-C₂₀-алкіл, C₂-C₂₀-алкеніл, C₁-C₈-алкокси- C₁-C₈-алкіл, C₁-C₈-алкілтіо- C₁-C₈-алкіл, полі- C₁-C₈-алкокси- C₁-C₈-алкіл або, в разі необхідності, 1-3 рази заміщений галогеном, C₁-C₆-алкілом або C₁-C₆-алкокси C₃-C₈-циклоалкіл, в якому

в разі необхідності, один або кілька (переважно не більше, ніж два) несусідні члени кільця замінений киснем та/або сіркою, який означає також

в разі необхідності, 1-3 рази заміщений галогеном, ціано, нітро, C₁-C₆-алкілом, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-галогеналкілом, C₁-C₆-галогеналкокси, C₁-C₆-алкілтіо або C₁-C₆-алкілсульфонілом феніл,

в разі необхідності, 1-3 рази заміщений галогеном, нітро, ціано, C₁-C₆-алкілом, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-галогеналкілом або C₁-C₆-галогеналкокси феніл- C₁-C₆-алкіл,

в разі необхідності, 1-2 рази заміщений галогеном або C₁-C₆-алкілом 5- або 6-членний гетарил (наприклад, піразоліл, тіазоліл, піридил, піримідил, фураніл або тієніл),

в разі необхідності, 1-2 рази заміщений галогеном або C₁-C₆-алкілом фенокси- C₁-C₆-алкіл або

в разі необхідності, 1-2 рази заміщений галогеном, аміно або C₁-C₆-алкілом 5- або 6-членний гетарилокси- C₁-C₆-алкіл (наприклад, піридилокси- C₁-C₆-алкіл, піримідилокси- C₁-C₆-алкіл або тіазолокси- C₁-C₆-алкіл),

R² означає переважно відповідно, в разі необхідності, 1-5 разів заміщені галогеном C₁-C₂₀-алкіл, C₂-C₂₀-алкеніл, C₁-C₈-алкокси- C₂-C₈-алкіл, полі- C₁-C₈-алкокси- C₂-C₈-алкіл,

в разі необхідності, 1-2 рази заміщений галогеном, C₁-C₆-алкілом або C₁-C₆-алкокси C₃-C₈-циклоалкіл або

відповідно, в разі необхідності, 1-3 рази заміщені галогеном, ціано, нітро, C₁-C₆-алкілом, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-галогеналкілом або C₁-C₆-галогеналкокси феніл або бензил,

R³ означає переважно, в разі необхідності, 1-9 разів заміщений галогеном C₁-C₈-алкіл або відповідно, в разі необхідності, 1-3 рази заміщені гало-

геном, 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 означають переважно відповідно, в разі необхідності, 1-5 разів заміщені 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, в разі необхідності, 1-3 рази заміщені 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, фенокси або фенілтіо,

R^6 та R^7 незалежно один від одного означають переважно водень, відповідно, в разі необхідності, 1-5 разів заміщені 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, в разі необхідності, 1-3 рази заміщений галогеном, C_1 - C_8 -галогеналкілом, C_1 - C_8 -алкілом або C_1 - C_8 -алкокси феніл, в разі необхідності, 1-3 рази заміщений галогеном, C_1 - C_8 -алкілом, C_1 - C_8 -галогеналкілом або C_1 - C_8 -алкокси бензил або разом означають, в разі необхідності, 1-2 рази заміщений C_1 - C_4 -алкілом C_3 - C_6 -алкіленовий залишок, в якому, в разі необхідності, один атом вуглецю замінений киснем або сіркою,

R^{13} означає переважно водень, відповідно, в разі необхідності, 1-3 рази заміщені галогеном C_1 - C_8 -алкіл або C_1 - C_8 -алкокси, в разі необхідності, 1-3 рази заміщений галогеном, C_1 - C_4 -алкілом або C_1 - C_4 -алкокси C_3 - C_8 -циклоалкіл, в якому, в разі необхідності, одна метиленова група замінена киснем або сіркою, або відповідно, в разі необхідності, 1-2 рази заміщені галогеном, C_1 - C_6 -алкілом, C_1 - C_6 -алкокси, C_1 - C_4 -галогеналкілом, C_1 - C_4 -галогеналкокси, нітро або ціано феніл, феніл- C_1 - C_4 -алкіл або феніл- C_1 - C_4 -алкокси,

R^{14} означає переважно водень або C_1 - C_8 -алкіл або

R^{13} та R^{14} разом переважно означають C_4 - C_6 -алкандііл,

R^{15} та R^{16} є однаковими або різними та означають переважно C_1 - C_6 -алкіл або

R^{15} та R^{16} разом означають переважно C_2 - C_4 -алкандіільний залишок, який, в разі необхідності, 1-2 рази заміщений C_1 - C_6 -алкілом, C_1 - C_6 -галогеналкілом або фенілом, який в свою чергу, в разі необхідності, 1-2 рази заміщений галогеном, C_1 - C_6 -алкілом, C_1 - C_4 -галогеналкілом, C_1 - C_6 -алкокси, C_1 - C_4 -галогеналкокси, нітро або ціано,

R^{17} та R^{18} незалежно один від одного означають переважно водень, в разі необхідності, заміщений галогеном C_1 - C_8 -алкіл або, в разі необхідності, 1-2 рази заміщений галогеном, C_1 - C_6 -алкілом, C_1 - C_4 -галогеналкілом, C_1 - C_4 -галогеналкокси, нітро або ціано феніл або

R^{17} та R^{18} разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, означають переважно карбонільну групу або, в разі необхідності, 1-2 рази заміщений галогеном, C_1 - C_4 -алкілом або C_1 - C_4 -алкокси C_5 - C_7 -циклоалкіл, в якому, в разі необхідності, одна метиленова група замінена киснем або сіркою,

R^{19} та R^{20} незалежно один від одного означають переважно C_1 - C_{10} -алкіл, C_2 - C_{10} -алкеніл, C_1 - C_{10} -алкокси, C_1 - C_{10} -алкіламіно, C_3 - C_{10} -

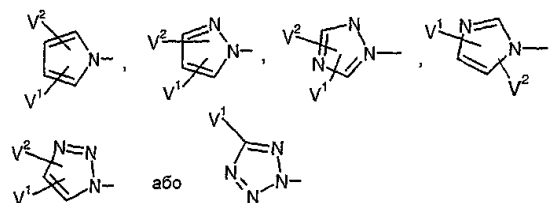
алкеніламіно, ді-(C_1 - C_{10} -алкіл)аміно або ді-(C_3 - C_{10} -алкеніл)аміно.

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

X означає особливо переважно фтор, хлор, бром, C_1 - C_4 -алкіл, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галогеналкіл, C_1 - C_4 -галогеналкокси, нітро або ціано,

W та Y незалежно один від одного особливо переважно означають водень, фтор, хлор, бром, C_1 - C_4 -алкіл, C_1 - C_4 -галогеналкіл, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галогеналкокси,

Z означає особливо переважно один із залишків

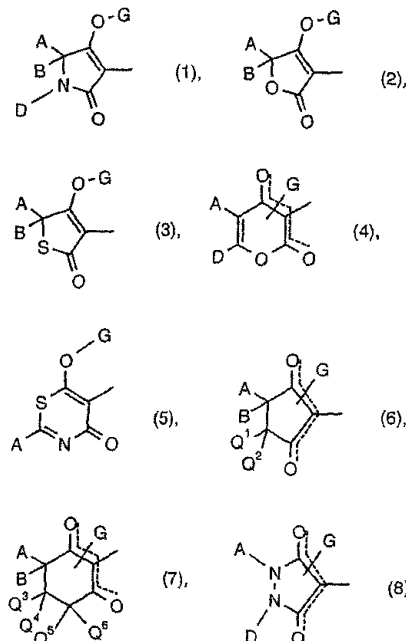


V^1 означає особливо переважно водень, фтор, хлор, бром, йод, C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галогеналкіл, C_1 - C_4 -галогеналкокси, ціано або нітро,

V^2 означає особливо переважно водень, фтор, хлор, бром, C_1 - C_4 -алкіл або C_1 - C_2 -галогеналкіл,

V^1 та V^2 разом означають особливо переважно, в разі необхідності, 1-4 рази заміщений фтором C_3 - C_4 -алкандііл, який, в разі необхідності, 1-2 рази може бути перерваний киснем, або, в разі необхідності, 1-2 рази заміщений фтором, хлором, бромом, C_1 - C_4 -алкілом, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_2 -галогеналкілом, C_1 - C_2 -галогеналкокси, ціано або нітро бутадієніл,

СКЕ означає особливо переважно одну із груп



A означає особливо переважно водень, відповідно, в разі необхідності, 1-3 рази заміщені фтором або хлором C_1 - C_6 -алкіл, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_2 -

алкіл, в разі необхідності, 1-2 рази заміщений фтором, хлором, C_1 - C_2 -алкілом, трифторметилом або C_1 - C_2 -алкокси C_3 - C_6 -циклоалкіл або (однак лише у випадку сполук формул (1-3), (1-4), (1-6) та (1-7)) відповідно 1-2 рази, в разі необхідності, заміщені фтором, хлором, бромом, C_1 - C_4 -алкілом, C_1 - C_6 -галогеналкілом, C_1 - C_4 -алкокси або C_1 - C_2 -галогеналкокси, ціано або нітро феніл або бензил,

В означає особливо переважно водень, C_1 - C_4 -алкіл або C_1 - C_2 -алкоксил- C_1 - C_2 -алкіл або

А, В та атом вуглецю, до якого вони приєднані, означають особливо переважно насичений C_3 - C_7 -циклоалкіл або ненасичений C_5 - C_7 -циклоалкіл, в якому, в разі необхідності, один член кільця замінений киснем або сіркою та який, в разі необхідності, 1-2 рази заміщений C_1 - C_6 -алкілом, трифторметилом або C_1 - C_6 -алкокси, із вказівкою, що у цьому випадку Q^3 означає особливо переважно водень або метил, або

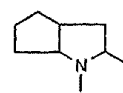
А, В та атом вуглецю, до якого вони приєднані, означають особливо переважно C_5 - C_6 -циклоалкіл, який заміщений алкілендіїльною, алкілендіоксильною або алкілендітіоїльною групою, яка, в разі необхідності, містить один або два несусідні атоми кисню або сірки та, в разі необхідності, 1-2 рази заміщена метилом або етилом, або яка разом з атомом кисню, до якого вона приєднана, утворює 5- - 8-членне кільце, із вказівкою, що в цьому випадку Q^3 означає особливо переважно водень або метил,

А, В та атом вуглецю, до якого вони приєднані, означають особливо переважно C_3 - C_6 -циклоалкіл або C_5 - C_6 -циклоалкеніл, в яких два замісники разом з атомами вуглецю, до яких вони приєднані, означають відповідно, в разі необхідності, заміщені C_1 - C_2 -алкілом або C_1 - C_2 -алкокси C_2 - C_4 -алкандііл, C_2 - C_4 -алкендііл або бутадієндііл, із вказівкою, що в цьому випадку Q^3 означає особливо переважно водень або метил,

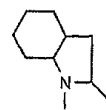
Д означає особливо переважно водень, відповідно, в разі необхідності, 1-3 рази заміщені фтором C_1 - C_6 -алкіл, C_3 - C_6 -алкеніл, C_1 - C_4 -алкокси- C_2 - C_3 -алкіл, в разі необхідності, 1-2 рази заміщений C_1 - C_4 -алкілом, C_1 - C_4 -алкокси або C_1 - C_2 -галогеналкілом C_3 - C_6 -циклоалкіл, в якому, в разі необхідності, одна метиленова група замінена киснем або (однак не у випадку сполук формул (1-1)) відповідно, в разі необхідності, 1-2 рази заміщені фтором, хлором, бромом, C_1 - C_4 -алкілом, C_1 - C_4 -галогеналкілом, C_1 - C_4 -алкокси або C_1 - C_4 -галогеналкокси феніл або піридил або

А та D разом означають особливо переважно, в разі необхідності, 1-2 рази заміщений C_3 - C_5 -алкандііл, в якому одна метиленова група може бути замінена киснем або сіркою, причому як замісники застосовують C_1 - C_2 -алкіл або C_1 - C_2 -алкокси або

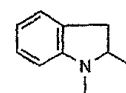
А та D (у випадку сполук формули (1-1)) разом з атомами, до яких вони приєднані, означають одну із груп AD-1 - AD-10:



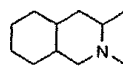
AD-1



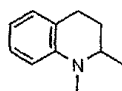
AD-2



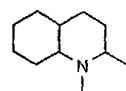
AD-3



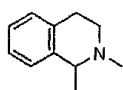
AD-4



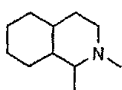
AD-5



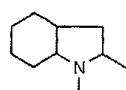
AD-6



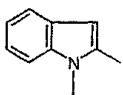
AD-7



AD-8



AD-9



AD-10

або

А та Q^1 разом означають особливо переважно C_3 - C_4 -алканділ або C_4 -алкендііл, відповідно, в разі необхідності, один або два рази однаково або по-різному заміщені фтором, хлором, гідрокси або C_1 - C_8 -алкілом чи C_1 - C_4 -алкокси, які в свою чергу відповідно, в разі необхідності, 1-3 рази заміщені фтором, або

Q^1 означає особливо переважно водень,

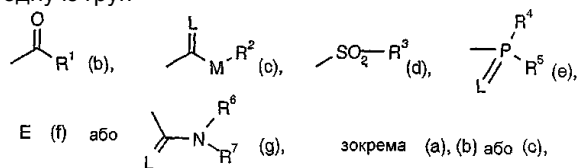
Q^2 означає особливо переважно водень,

Q^4 , Q^5 та Q^6 незалежно один від одного означають особливо переважно водень або C_1 - C_3 -алкіл,

Q^3 означає особливо переважно водень, C_1 - C_4 -алкіл, трифторметил або, в разі необхідності, 1-2 рази заміщений метилом або метокси C_3 - C_6 -циклоалкіл або

Q^3 та Q^4 разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, означають особливо переважно, в разі необхідності, 1-2 рази заміщене C_1 - C_2 -алкілом або C_1 - C_2 -алкокси насичений C_5 - C_6 -кільце, в якому, в разі необхідності, один член кільця замінений киснем або сіркою, із вказівкою, що у цьому випадку А означає особливо переважно водень або метил, або

Г означає особливо переважно водень (а) або одну із груп



в яких

Е означає еквівалент іону металу або іон амонію,

Л означає кисень або сірку та

M означає кисень або сірку,

R¹ означає особливо переважно відповідно, в разі необхідності, 1-3 рази заміщені фтором або хлором C₁-C₈-алкіл, C₂-C₈-алкеніл, C₁-C₄-алкокси-C₁-C₂-алкіл, C₁-C₄-алкілтіо- C₁-C₂-алкіл або, в разі необхідності, 1-2 рази заміщений фтором, хлором, C₁-C₂-алкілом або C₁-C₂-алкокси C₃-C₆-циклоалкіл, в якому, в разі необхідності, один або два несусідні члени кільця замінені киснем,

в разі необхідності, 1-2 рази заміщений фтором, хлором, бромом, ціано, нітро, C₁-C₄-алкілом, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₂-галогеналкілом або C₁-C₂-галогеналкокси феніл,

R² означає особливо переважно відповідно, в разі необхідності, 1-3 рази заміщені фтором C₁-C₈-алкіл, C₂-C₈-алкеніл або C₁-C₄-алкокси- C₂-C₄-алкіл,

в разі необхідності, один раз заміщений C₁-C₂-алкілом або C₁-C₂-алкокси C₃-C₆-циклоалкіл або

відповідно, в разі необхідності, 1-2 рази заміщені фтором, хлором, бромом, ціано, нітро, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₃-алкокси, трифторметилом або трифторметокси феніл або бензил,

R³ означає особливо переважно, в разі необхідності, 1-3 рази заміщений фтором C₁-C₆-алкіл або відповідно, в разі необхідності, один раз заміщені фтором, хлором, бромом, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-алкокси, трифторметил, трифторметокси, ціано або нітро феніл або бензил,

R⁴ означає особливо переважно відповідно, в разі необхідності, 1-3 рази заміщені фтором C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-алкокси, C₁-C₆-алкіламіно, ді-(C₁-C₆-алкіл)аміно, C₁-C₆-алкілтіо, C₃-C₄-алкенілтіо, C₃-C₆-циклоалкілтіо або відповідно, в разі необхідності, 1-2 рази заміщені фтором, хлором, бромом, нітро, ціано, C₁-C₃-алкокси, C₁-C₃-галогеналкокси, C₁-C₃-алкілтіо, C₁-C₃-галогеналкілтіо, C₁-C₃-алкілом або трифторметилом феніл, фенокси або фенілтіо,

R⁵ означає особливо переважно C₁-C₆-алкокси або C₁-C₆-алкілтіо,

R⁶ означає особливо переважно водень, відповідно, в разі необхідності, 1-3 рази заміщені фтором C₁-C₆-алкіл, C₃-C₆-циклоалкіл, C₁-C₆-алкокси, C₃-C₆-алкеніл, C₁-C₆-алкокси-C₁-C₄-алкіл, в разі необхідності, 1-2 рази заміщений фтором, хлором, бромом, трифторметилом, C₁-C₄-алкілом або C₁-C₄-алкокси феніл, в разі необхідності, один раз заміщений фтором, хлором, бромом, C₁-C₄-алкілом, трифторметилом або C₁-C₄-алкокси бензил,

R⁷ означає особливо переважно C₁-C₆-алкіл, C₃-C₆-алкеніл або C₁-C₆-алкокси- C₁-C₄-алкіл,

R⁶ та R⁷ разом означають особливо переважно, в разі необхідності, 1-2 рази заміщений метилом або етилом C₄-C₅-алкіленовий залишок, в якому, в разі необхідності, одна метиленова група замінена киснем або сіркою.

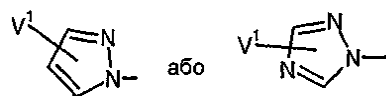
У особливо переважних визначення залишків галоген означає фтор, хлор, бром та йод, зокрема фтор, хлор та бром.

W означає найбільш переважно водень, метил, етил або хлор,

X означає найбільш переважно хлор, метил, етил, пропіл, метокси, етокси, пропокси, трифторметил, дифторметокси або трифторметокси,

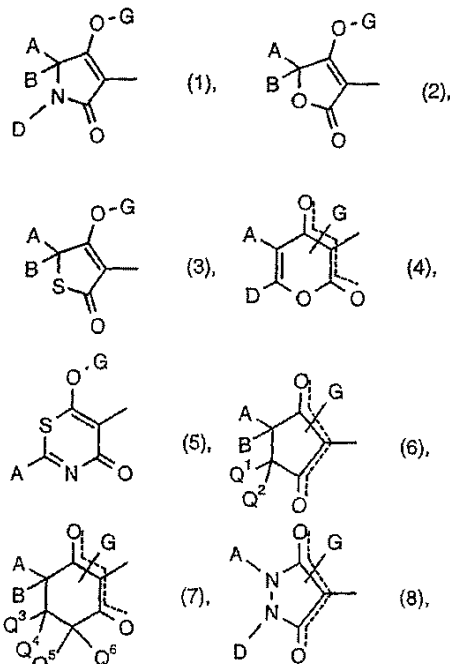
Y означає найбільш переважно водень або метил,

Z означає найбільш переважно один із залишків



V¹ означає найбільш переважно водень, фтор, хлор, бром, метил, етил, метокси, етокси, трифторметил або ціано,

СКЕ означає найбільш переважно одну із груп



A означає найбільш переважно водень, відповідно, в разі необхідності, 1-3 рази заміщені фтором C₁-C₄-алкіл або C₁-C₂-алкокси- C₁-C₂-алкіл, або циклопропіл, цикlopентил або циклогексил та лише у випадку сполук формули (1-5) означає, в разі необхідності, 1-2 рази заміщений фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, н-пропілом, ізопропілом, метокси, етокси, трифторметилом, трифторметокси, ціано або нітро феніл,

B означає найбільш переважно водень, метил або етил або

A, B та атом вуглецю, до якого вони приєднані, означають найбільш переважно насичений C₅-C₆-циклоалкіл, в якому, в разі необхідності, один член кільця замінений киснем або сіркою та який, в разі необхідності, один раз заміщений метилом, етилом, пропілом, ізопропілом, трифторметилом, метокси, етокси, пропокси, бутокси або ізобутокси, із вказівкою, що у цьому випадку Q³ означає найбільш переважно водень, або

A, B та атом вуглецю, до якого вони приєднані, означають найбільш переважно C₆-циклоалкіл, який заміщений алкілендіоксильною групою, що містить два несусідні атоми кисню, із вказівкою, що у цьому випадку Q³ означає найбільш переважно водень, або

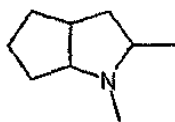
A, B та атом вуглецю, до якого вони приєднані, означає найбільш переважно C₅-C₆-циклоалкіл або

C₅-C₆-циклоалкеніл, в якій два замісники разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, означають C₂-C₄-алкандііл або C₂-C₄-алкендііл або бутадієндііл, із вказівкою, що у цьому випадку Q³ означає найбільш переважно водень,

D означає найбільш переважно водень, відповідно, в разі необхідності, 1-3 рази заміщений фтором C₁-C₄-алкіл, C₃-C₄-алкеніл, C₁-C₄-алкокси-C₁-C₃-алкіл, або циклопропіл, цикlopентил або циклогексил або (однак не у випадку сполук формул (1-1)) означає, в разі необхідності, один раз заміщений фтором, хлором, метилом, етилом, н-пропілом, ізопропілом, метокси, етоксис або трифторметилом феніл або піридил,

або

A та D разом означають найбільш переважно, в разі необхідності, 1-2 рази заміщений метилом або метокси C₃-C₅-алкандііл, в якому, в разі необхідності, один атом вуглецю замінений киснем або сіркою, або групу AD-1



A та Q¹ разом означають найбільш переважно, в разі необхідності, один або два рази заміщений метилом або метокси C₃-C₄-алкандііл або

Q¹ означає найбільш переважно водень,

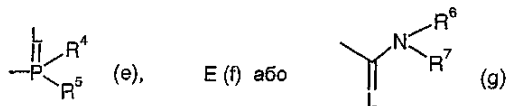
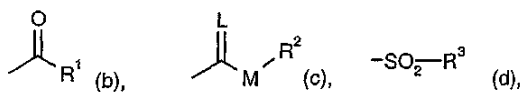
Q² означає найбільш переважно водень,

Q⁴, Q⁵ та Q⁶ означають найбільш переважно незалежно один від одного водень або метил,

Q³ означає найбільш переважно водень, метил, етил, пропіл або ізопропіл або

Q³ та Q⁴ разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, означають найбільш переважно, в разі необхідності, один раз заміщене метилом або метокси насичене C₅-C₆-кільце, із вказівкою, що у цьому випадку A означає найбільш переважно водень,

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



зокрема (а), (b) або (с)

в яких

E означає еквівалент іону металу або іон амонію,

L означає кисень або сірку та

M означає кисень або сірку.

R¹ означає найбільш переважно відповідно, в разі необхідності, 1-3 рази заміщені фтором C₁-C₆-алкіл, C₂-C₆-алкеніл, C₁-C₂-алкокси-C₁-алкіл, C₁-C₂-алкілтіо-C₁-алкіл або відповідно, в разі необхідності, один раз заміщені фтором, хлором, метилом або метокси циклопропіл або циклогексил,

в разі необхідності, один раз заміщений фтором, хлором, бромом, ціано, нітро, метилом, метокси, трифторметилом або трифторметокси феніл,

R² означає найбільш переважно відповідно, в разі необхідності, один раз заміщені фтором C₁-C₈-алкіл, C₂-C₆-алкеніл або C₁-C₄-алкокси-C₂-C₃-алкіл,

або відповідно, в разі необхідності, один раз заміщені фтором, хлором, ціано, нітро, метилом, етилом, н-пропілом, ізопропілом, метокси, етоксис, трифторметилом або трифторметокси феніл або бензил,

R³ означає найбільш переважно відповідно, в разі необхідності, 1-3 рази заміщені фтором метил, етил, н-пропіл, ізопропіл або відповідно, в разі необхідності, один раз заміщені фтором, хлором, бромом, метилом, трет-бутилом, метокси, трифторметилом, трифторметокси, ціано або нітро феніл або бензил,

R⁴ означає найбільш переважно відповідно, в разі необхідності, 1-3 рази заміщені фтором C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-алкіламіно, ді-(C₁-C₄-алкіл)аміно, C₁-C₄-алкілтіо або відповідно, в разі необхідності, один раз заміщені фтором, хлором, бромом, нітро, ціано, C₁-C₂-алкокси, C₁-C₂-фторалкокси, C₁-C₂-алкілтіо, C₁-C₂-фторалкілтіо або C₁-C₃-алкілом феніл, фенокси або фенілтіо,

R⁵ означає найбільш переважно метокси, етоксис, пропоксис, бутоксис, метилтіо, етилтіо, пропілтіо або бутилтіо,

R⁶ означає найбільш переважно водень, відповідно, в разі необхідності, 1-3 рази заміщені фтором C₁-C₄-алкіл, C₃-C₆-циклоалкіл, C₁-C₄-алкокси, C₃-C₄-алкеніл, C₁-C₄-алкокси-C₁-C₄-алкіл, в разі необхідності, один раз заміщений фтором, хлором, бромом, трифторметилом, метилом або метокси феніл, в разі необхідності, один раз заміщений фтором, хлором, бромом, метилом, трифторметилом або метокси бензил,

R⁷ означає найбільш переважно метил, етил, пропіл, ізопропіл, бутил, ізобутил або аліл,

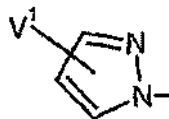
R⁶ та R⁷ означають найбільш переважно C₄-C₅-алкіленовий залишок, в якому, в разі необхідності, одна метиленова група замінена киснем або сіркою.

W означає абсолютно переважно водень, метил або етил,

X означає абсолютно переважно хлор, метил або етил,

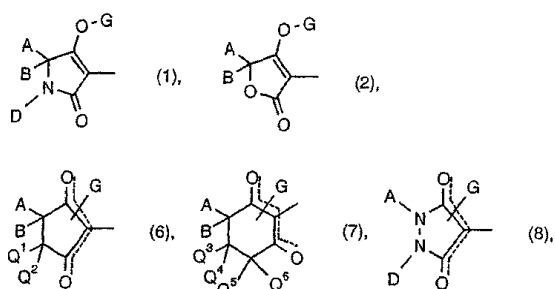
Y означає абсолютно переважно водень,

Z означає абсолютно переважно залишок в положення 4 або 5,



V¹ означає абсолютно переважно хлор або метокси,

СКЕ означає абсолютно переважно одну із груп



A означає абсолютно переважно водень, C₁-C₄-алкіл або циклопропіл,

B означає абсолютно переважно водень або метил або

A, B та атом вуглецю, до якого вони приєднані, означають абсолютно переважно насичений C₅-C₆-циклоалкіл, в якому, в разі необхідності, один член кільця замінений киснем та, в разі необхідності, один раз заміщений метилом або метокси, із вказівкою, що у цьому випадку Q³ означає абсолютно переважно водень,

D означає абсолютно переважно водень або

A та D разом означають абсолютно переважно C₃-C₅-алкандііл, в якому, в разі необхідності, один атом вуглецю замінений киснем,

Q¹ означає абсолютно переважно водень,

Q² означає абсолютно переважно водень,

Q³ означає абсолютно переважно метил,

Q⁴ означає абсолютно переважно метил або

Q³ та Q⁴ разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, означають абсолютно переважно насичене C₅-C₆-кільце, із вказівкою, що у цьому випадку A означає абсолютно переважно водень,

Q⁵ означає абсолютно переважно водень,

Q⁶ означає абсолютно переважно водень,

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



в яких

L означає кисень та

M означає кисень або сірку.

R¹ означає абсолютно переважно C₁-C₆-алкіл або C₁-C₂-алкокси-C₁-алкіл,

R² означає абсолютно переважно C₁-C₈-алкіл або бензил.

Зазначені вище загальні або переважні визначення залишків можуть бути комбіновані між собою, а також з іншими областями загальних або переважно значень. Вони стосуються як кінцевих, так і вихідних та проміжних продуктів.

Згідно з винаходом перевагу надають сполукам формули (I), які включають комбінацію сполук, визначених як переважні.

Згідно з винаходом особливу перевагу надають сполукам формули (I), які включають комбінацію сполук, визначених як особливо переважні.

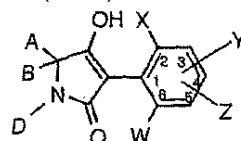
Згідно з винаходом найбільшу перевагу надають сполукам формули (I), які включають комбінацію сполук, визначених як найбільш переважні.

Згідно з винаходом абсолютну перевагу надають сполукам формули (I), які включають комбінацію сполук, визначених як абсолютно переважні.

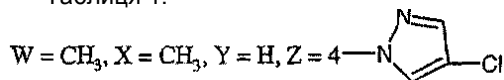
Насичені або ненасичені вуглеводневі залишки, такі як алкіл або алкеніл, можуть, також у комбінації із гетероатомами, як, наприклад, в алкокси, якщо це можливо, є відповідно нерозгалуженими або розгалуженими.

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

Зокрема окрім вказаних у прикладах одержання сполук слід назвати також такі сполуки формули (1-1-a):



Таблиця 1:



причому s-C₄H₉ означає в-C₄H₉,

t-C₄H₉ означає трет-C₄H₉

A	B	D
CH ₃	H	H
C ₂ H ₅	H	H
C ₃ H ₇	H	H
i-C ₃ H ₇	H	H
C ₄ H ₉	H	H
i-C ₄ H ₉	H	H
s-C ₄ H ₉	H	H
t-C ₄ H ₉	H	H
CH ₃	CH ₃	H
C ₂ H ₅	CH ₃	H
C ₃ H ₇	CH ₃	H
i-C ₃ H ₇	CH ₃	H
C ₄ H ₉	CH ₃	H
i-C ₄ H ₉	CH ₃	H
s-C ₄ H ₉	CH ₃	H
t-C ₄ H ₉	CH ₃	H
C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H
C ₃ H ₇	C ₃ H ₇	H
Δ	CH ₃	H

Продовження таблиці 1:

A	B	D
	CH ₃	H
	CH ₃	H
	-(CH ₂) ₂ -	H
	-(CH ₂) ₄ -	H
	-(CH ₂) ₅ -	H
	-(CH ₂) ₆ -	H
	-(CH ₂) ₇ -	H
	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -	H
	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -	H
	-(CH ₂) ₂ -S-(CH ₂) ₂ -	H
	-CH ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ -	H
	-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -	H
	-(CH ₂) ₂ -CH(C ₂ H ₅)-(CH ₂) ₂ -	H
	-(CH ₂) ₂ -CH(C ₃ H ₇)-(CH ₂) ₂ -	H
	-(CH ₂) ₂ -CH(C ₃ H ₇)-(CH ₂) ₂ -	H
	-(CH ₂) ₂ -CHOC(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -	H
	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -	H
	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₃ H ₇ -(CH ₂) ₂ -	H
	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₄ H ₉ -(CH ₂) ₂ -	H
	-(CH ₂) ₂ -C(CH ₃) ₂ -(CH ₂) ₂ -	H
	-CH ₂ -(CH(CH ₃)) ₂ -(CH ₂) ₂ -	H
	-CH ₂ -CH-(CH ₂) ₂ -CH-	H
	-CH ₂ -CH-(CH ₂) ₄ -CH-	H

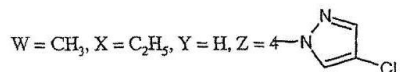
Продовження таблиці 1:

A	B	D
-CH ₂ -CH-(CH ₂) ₃ -CH-(CH ₂) ₂ -		H
		H
		H

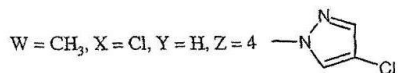
A	D	B
	-(CH ₂) ₃ -	H
	-(CH ₂) ₄ -	H
	-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -	H
	-CH ₂ -CH ₂ -CH(CH ₃)-	H
	-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH(CH ₃)-	H
	-CH ₂ -S-CH ₂ -	H
	-CH ₂ -S-(CH ₂) ₂ -	H
	-(CH ₂) ₂ -S-CH ₂ -	H
	-CH ₂ -CH-(CH ₂) ₃ -CH-	H
H	CH ₃	H
H	C ₂ H ₅	H
H	C ₃ H ₇	H
H	i-C ₃ H ₇	H
H		H
H		H
H		H

A	D	B
CH ₃	CH ₃	H
CH ₃	C ₂ H ₅	H
CH ₃	C ₃ H ₇	H
CH ₃	i-C ₃ H ₇	H
CH ₃		H
CH ₃		H
CH ₃		H
C ₂ H ₅	CH ₃	H
C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H

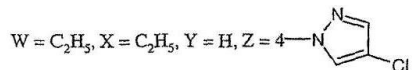
Таблиця 2: A, B та D мають вказані в таблиці 1 значення



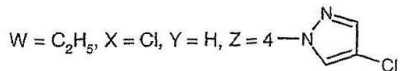
Таблиця 3: A, B та D мають вказані в таблиці 1 значення



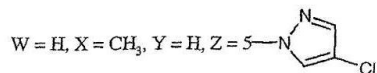
Таблиця 4: A, B та D мають вказані в таблиці 1 значення



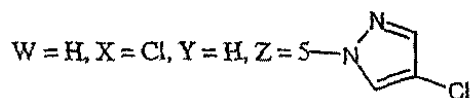
Таблиця 5: A, B та D мають вказані в таблиці 1 значення



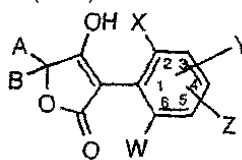
Таблиця 6: A, B та D мають вказані в таблиці 1 значення



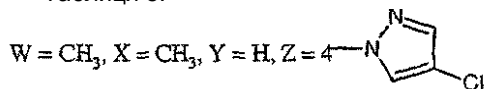
Таблиця 7: A, B та D мають вказані в таблиці 1 значення



Зокрема окрім вказаних у прикладах одержання сполук слід назвати також такі сполуки формули (I-2-a):






Таблиця 8:




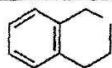
причому s-C₄H₉ означає в-C₄H₉,
t-C₄H₉ означає трет-C₄H₉

A	B
CH ₃	H
C ₂ H ₅	H
C ₃ H ₇	H
i-C ₃ H ₇	H
C ₄ H ₉	H
i-C ₄ H ₉	H
s-C ₄ H ₉	H
t-C ₄ H ₉	H
CH ₃	CH ₃
C ₂ H ₅	CH ₃
C ₃ H ₇	CH ₃

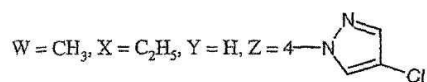
Продовження таблиці 8:

A	B
i-C ₃ H ₇	CH ₃
C ₄ H ₉	CH ₃
i-C ₄ H ₉	CH ₃
s-C ₄ H ₉	CH ₃
t-C ₄ H ₉	CH ₃
C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
C ₃ H ₇	C ₃ H ₇
	CH ₃
	CH ₃
	CH ₃
-(CH ₂) ₂ -	
-(CH ₂) ₄ -	
-(CH ₂) ₅ -	
-(CH ₂) ₆ -	
-(CH ₂) ₇ -	
-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -	
-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -	
-(CH ₂) ₂ -S-(CH ₂) ₂ -	
-CH ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₃ -	
-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	
(CH ₂) ₂ -CHC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -	
-(CH ₂) ₂ -CHC ₃ H ₇ -(CH ₂) ₂ -	
-(CH ₂) ₂ -CH-C ₃ H ₇ -(CH ₂) ₂ -	
-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -	
-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -	
-(CH ₂) ₂ -CHOC ₃ H ₇ -(CH ₂) ₂ -	
-(CH ₂) ₂ -CHOC ₄ H ₉ -(CH ₂) ₂ -	

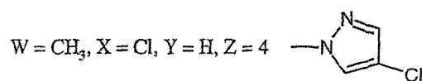
Продовження таблиці 8:

A	B
-(CH ₂) ₂ -C(CH ₃) ₂ -(CH ₂) ₂ -	
-CH ₂ -(CHCH ₃) ₂ -(CH ₂) ₂ -	
$\begin{array}{c} -CH_2-CH-(CH_2)_2-CH- \\ \qquad \qquad \\ CH_2 \end{array}$	
$\begin{array}{c} -CH_2-CH-CH-CH_2- \\ \qquad \qquad \\ (CH_2)_4 \end{array}$	
$\begin{array}{c} -CH_2-CH-CH-(CH_2)_2- \\ \qquad \qquad \\ (CH_2)_3 \end{array}$	
	
	

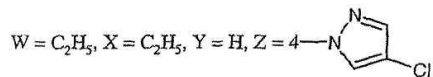
Таблиця 9: А та В мають вказані в таблиці 8 значення



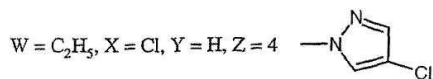
Таблиця 10: А та В мають вказані в таблиці 8 значення



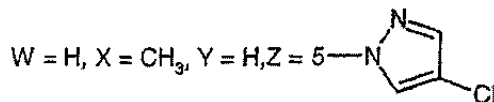
Таблиця 11: А та В мають вказані в таблиці 8 значення



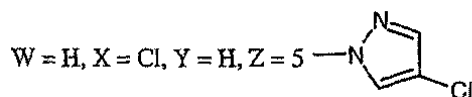
Таблиця 12: А та В мають вказані в таблиці 8 значення



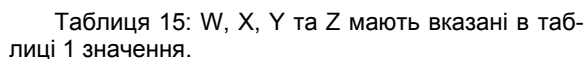
Таблиця 13: А та В мають вказані в таблиці 8 значення



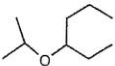
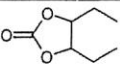



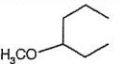
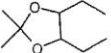
Таблиця 14: А та В мають вказані в таблиці 8 значення

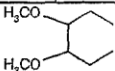

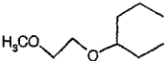


Зокрема окрім вказаних у прикладах одержання сполук слід назвати також такі сполуки формули (I-8-a):



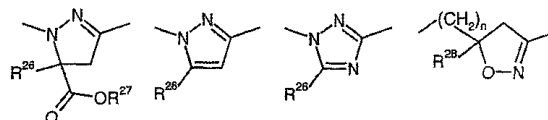
A	D
CH ₃	CH ₃
CH ₃	-(CH ₂) ₂ OH-
CH ₃	-(CH ₂) ₂ OCH ₃ -
CH ₃	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -OCH ₃ -

A	D
$-(CH_2)_7-O-CH_3-$	$-(CH_2)_7-O-CH_3-$
$-(CH_2)_7-O-(CH_2)_7-OCH_3-$	$-(CH_2)_7-O-(CH_2)_7-OCH_3-$
	$-(CH_2)_7-$
	$-(CH_2)_4-$
	$-(CH_2)_7-O-(CH_2)_7-$
	
	
	
	
	
	
	

A	D
	
	
	

Таблиця 16: A та D мають вказані в таблиці 15 значення W, X, Y та Z мають вказані в таблиці 2 значення

A¹ означає переважно одну із зображених нижче двовалентних гетероциклічних груп



R^{25} означає переважно водень, відповідно, в разі необхідності, заміщені фтором та/або хлором метил, етил, *n*- або *i*-пропіл, *n*-, *i*-, *v*- або трет-бутил, пропеніл, бутеніл, пропініл або бутиніл, метоксиметил, етоксиметил, метоксметил, етоксметил, діоксоланілметил, фурил, фурилметил, тієніл, тіазоліл, піперидиніл або, в разі необхідності, заміщений фтором, хлором, метилом, етилом, *n*- або *i*-пропілом, *n*-, *i*-, *v*- або трет-бутилом феніл, або разом з R^{24} означає один із залишків $-CH_2-O-CH_2-$

CH_2 - та $-\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-O-CH}_2\text{-CH}_2-$, які, в разі необхідності, заміщені метилом, етилом, фурилом, фенілом, анелюваним бензольним кільцем або двома замісниками, які разом з атомом вуглецю, до якого вони приєднані, утворюють 5- або 6-членний карбоцикл.

R^{26} означає переважно водень, ціано, фтор, хлор, бром, або відповідно, в разі необхідності, заміщені фтором, хлором та/або бромом метил, етил, н- або і-пропіл, циклопропіл, циклобутил, циклопентил, циклогексил або феніл.

R^{27} означає переважно водень, в разі необхідності, заміщені гідрокси, ціано, фтором, хлором, метокси, етокси, н- або і-пропокси метил, етил, н- або і-пропіл, н-, і-, в- або трет-бутил.

R^{28} означає переважно водень, ціано, фтор, хлор, бром, або відповідно, в разі необхідності, заміщені фтором, хлором та/або бромом метил, етил, н- або і-пропіл, н-, і-, в- або трет-бутил, циклопропіл, циклобутил, циклопентил, циклогексил або феніл.

X^1 означає переважно нітро, ціано, фтор, хлор, бром, метил, етил, н- або і-пропіл, н-, і-, в- або трет-бутил, дифторметил, дихлорметил, трифторметил, трихлорметил, хлордифторметил, фтордихлорметил, метокси, етокси, н- або і-пропокси, дифторметокси або трифторметокси.

X^2 означає переважно водень, нітро, ціано, фтор, хлор, бром, метил, етил, н- або і-пропіл, н-, і-, в- або трет-бутил, дифторметил, дихлорметил, трифторметил, трихлорметил, хлордифторметил, фтордихлорметил, метокси, етокси, н- або і-пропокси, дифторметокси або трифторметокси.

X^3 означає переважно водень, нітро, ціано, фтор, хлор, бром, метил, етил, н- або і-пропіл, н-, і-, в- або трет-бутил, дифторметил, дихлорметил, трифторметил, трихлорметил, хлордифторметил, фтордихлорметил, метокси, етокси, н- або і-пропокси, дифторметокси або трифторметокси.

R^{29} означає переважно водень, метил, етил, н- або і-пропіл.

R^{30} означає переважно водень, метил, етил, н- або і-пропіл.

R^{31} означає переважно водень, відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, фтором, хлором, метокси, етокси, н- або і-пропокси метил, етил, н- або і-пропіл, н-, і-, в- або трет-бутил, метокси, етокси, н- або і-пропокси, н-, і-, в- або трет-бутоксид, метилтіо, етилтіо, н- або і-пропілтіо, н-, і-, в- або трет-бутилтіо, метиламіно, етиламіно, н- або і-пропіламіно, н-, і-, в- або трет-бутиламіно, диметиламіно або діетиламіно, або відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, н- або і-пропілом циклопропіл, циклобутил, циклопентил, циклогексил,

циклопропілокси, циклобутилокси, циклопентилокси, циклогексилокси, циклопропілтіо, циклобутилтіо, циклопентилтіо, циклогексилтіо, циклопропіламіно, циклобутиламіно, циклопентиламіно або циклогексиламіно.

R^{32} означає переважно водень, відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, гідрокси, фтором, хлором, метокси, етокси, н- або і-пропокси метил, етил, н- або і-пропіл, н-, і- або в-бутил, відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, фтором, хлором або бромом пропеніл, бутеніл, пропініл або бутиніл, або відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, н- або і-пропілом циклопропіл, циклобутил, циклопентил або циклогексил.

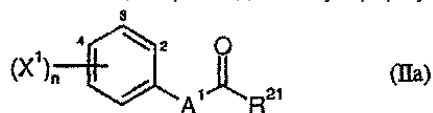
R^{33} означає переважно водень, відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, гідрокси, фтором, хлором, метокси, етокси, н- або і-пропокси метил, етил, н- або і-пропіл, н-, і- або в-бутил, відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, фтором, хлором або бромом пропеніл, бутеніл, пропініл або бутиніл, відповідно, в разі необхідності, заміщені ціано, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, н- або і-пропілом циклопропіл, циклобутил, циклопентил або циклогексил, або, в разі необхідності, заміщений нітро, ціано, фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, н- або і-пропілом, н-, і-, в- або трет-бутилом, трифторметилом, метокси, етокси, н- або і-пропокси, дифторметокси або трифторметокси феніл, або разом з R^{32} означає відповідно, в разі необхідності, заміщені метилом або етилом бутан-1,4-дііл (триметилен), пентан-1,5-дііл, 1-оксабутан-1,4-дііл або 3-оксапентан-1,5-дііл.

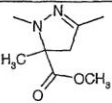
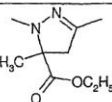
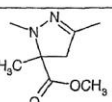
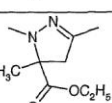
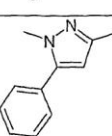
X^4 означає переважно нітро, ціано, карбокси, карбамоїл, форміл, сульфамойл, гідрокси, аміно, фтор, хлор, бром, метил, етил, н- або і-пропіл, н-, і-, в- або трет-бутил, трифторметил, метокси, етокси, н- або і-пропокси, дифторметокси або трифторметокси.

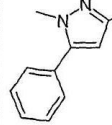
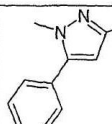
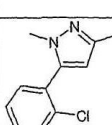
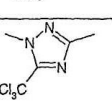
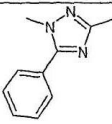
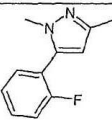
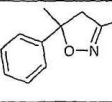
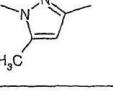
X^5 означає переважно нітро, ціано, карбокси, карбамоїл, форміл, сульфамойл, гідрокси, аміно, фтор, хлор, бром, метил, етил, н- або і-пропіл, н-, і-, в- або трет-бутил, трифторметил, метокси, етокси, н- або і-пропокси, дифторметокси або трифторметокси.

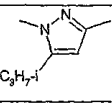
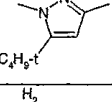
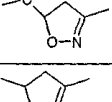
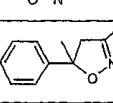
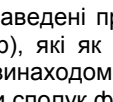
Нижче в таблиці наведені приклади найбільш переважних сполук (IIa), які як гербіцид-сафенер застосовують згідно з винаходом.

Таблиця: Приклади сполук формули (IIa)



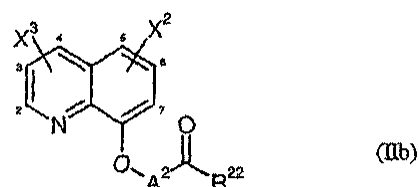
Приклад №	(Положення) (X ¹) _a	A ¹	R ²¹
Па-1	(2) Cl, (4) Cl		OCH ₃
Па-2	(2) Cl, (4) Cl		OCH ₃
Па-3	(2) Cl, (4) Cl		OC ₂ H ₅
Па-4	(2) Cl, (4) Cl		OC ₂ H ₅
Па-5	(2) Cl		OCH ₃

Приклад №	(Положення) (X ¹) _a	A ¹	R ²¹
Па-6	(2) Cl, (4) Cl		OCH ₃
Па-7	(2) F		OCH ₃
Па-8	(2) F		OCH ₃
Па-9	(2) Cl, (4) Cl		OC ₂ H ₅
Па-10	(2) Cl, (4) CF ₃		OCH ₃
Па-11	(2) Cl		OCH ₃
Па-12	-		OC ₂ H ₅
Па-13	(2) Cl, (4) Cl		OC ₂ H ₅

Приклад №	(Положення) (X ¹) _a	A ¹	R ²¹
Па-14	(2) Cl, (4) Cl		OC ₂ H ₅
Па-15	(2) Cl, (4) Cl		OC ₂ H ₅
Па-16	(2) Cl, (4) Cl		OC ₂ H ₅
Па-17	(2) Cl, (4) Cl		OC ₂ H ₅
Па-18	-		OH

Нижче в таблиці наведені приклади найбільш переважних сполук (IIb), які як гербіцид-сафенер застосовують згідно з винаходом

Таблиця: Приклади сполук формули (IIb).



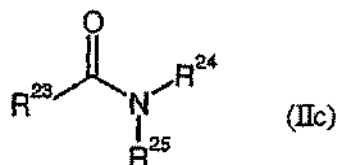
Приклад №	(Положення) X ²	(Положення) X ³	A ²	R ²²
Пб-1	(5) Cl	-	CH ₂	OH
Пб-2	(5) Cl	-	CH ₂	OCH ₃

Приклад №	(Положення) X ²	(Положення) X ³	A ²	R ²²
Пб-3	(5) Cl	-	CH ₂	OC ₂ H ₅
Пб-4	(5) Cl	-	CH ₂	OC ₃ H _{7-n}
Пб-5	(5) Cl	-	CH ₂	OC ₃ H ₇₋₁
Пб-6	(5) Cl	-	CH ₂	OC ₄ H _{9-n}
Пб-7	(5) Cl	-	CH ₂	OCH(CH ₃)C ₃ H _{11-n}
Пб-8	(5) Cl	(2) F	CH ₂	OH
Пб-9	(5) Cl	(2) Cl	CH ₂	OH
Пб-10	(5) Cl	-	CH ₂	OCH ₂ CH=CH ₂

Пб-11	(5) Cl	-	CH ₂	OC ₄ H ₉ -i
Пб-12	(5) Cl	-	CH ₂	
Пб-13	(5) Cl	-		OCH ₂ CH=CH ₂
Пб-14	(5) Cl	-		OC ₂ H ₅

Приклад №	(Положення) X ²	(Положення) X ³	A ²	R ²²
Пб-15	(5) Cl	-		OCH ₃

Нижче в таблиці наведені приклади найбільш переважних сполук (IIc), які як гербіцид-сафенер застосовують згідно з винаходом.

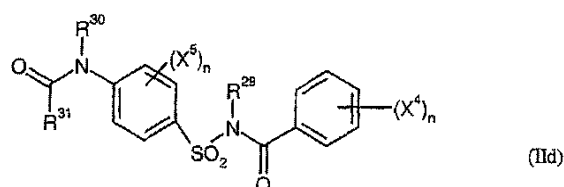


Таблиця: Приклади сполук формули (IIc)

Приклад №	R ²³	N(R ²⁴ , R ²⁵)
Пс-1	CHCl ₂	N(CH ₂ CH=CH ₂) ₂
Пс-2	CHCl ₂	
Пс-3	CHCl ₂	
Пс-4	CHCl ₂	
Пс-5	CHCl ₂	

	R ²³	N(R ²⁴ , R ²⁵)
Пс-6	CHCl ₂	
Пс-7	CHCl ₂	


Нижче в таблиці наведені приклади найбільш переважних сполук (IId), які як гербіцид-сафенер застосовують згідно з винаходом.



Таблиця: Приклади сполук формули (IId)

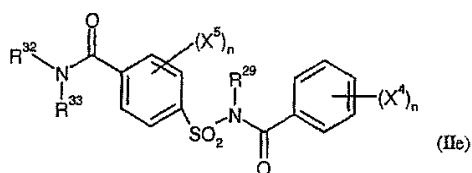
Приклад №	R ²⁹	R ³⁰	R ³¹	(Положення) (X ⁴) _n	(Положення) (X ⁵) _n
Пд-1	H	H	CH ₃	(2) OCH ₃	-
Пд-2	H	H	C ₂ H ₅	(2) OCH ₃	-
Пд-3	H	H	C ₃ H _{7-n}	(2) OCH ₃	-
Пд-4	H	H	C ₃ H _{7-i}	(2) OCH ₃	-
Пд-5	H	H		(2) OCH ₃	-

Приклад №	R ²⁹	R ³⁰	R ³¹	(Положення) (X ⁴) _n	(Положення) (X ⁵) _n
Пд-6	H	H	CH ₃	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
Пд-7	H	H	C ₂ H ₅	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
Пд-8	H	H	C ₃ H _{7-n}	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
Пд-9	H	H	C ₃ H _{7-i}	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
Пд-10	H	H		(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
Пд-11	H	H	OCH ₃	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
Пд-12	H	H	OC ₂ H ₅	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
Пд-13	H	H	OC ₃ H _{7-i}	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
Пд-14	H	H	SCH ₃	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
Пд-15	H	H	SC ₂ H ₅	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-


Пд-16	H	H	SC ₂ H ₅ -i	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
Пд-17	H	H	NHCH ₃	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
Пд-18	H	H	NHC ₂ H ₅	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
Пд-19	H	H	NHC ₂ H ₅ -i	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
Пд-20	H	H		(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
Пд-21	H	H	NHCH ₃	(2) OCH ₃	-


Приклад №	R ²⁹	R ³⁰	R ³¹	(Положення) (X ⁴) _n	(Положення) (X ⁵) _n
Пд-22	H	H	NHC ₂ H ₅ -i	(2) OCH ₃	-
Пд-23	H	H	N(CH ₃) ₂	(2) OCH ₃	-
Пд-24	H	H	N(CH ₃) ₂	(3) CH ₃ (4) CH ₃	-
Пд-25	H	H	CH ₂ -O-CH ₃	(2) OCH ₃	-

Нижче в таблиці наведені приклади найбільш переважних сполук (Ile), які як гербіцид-сафенер застосовують згідно з винаходом.



Таблиця: Приклади сполук формули (Ile)

Приклад №	R ²⁹	R ³⁰	R ³¹	(Положення) (X ⁴) _n	(Положення) (X ⁵) _n
Ile-1	H	H	CH ₃	(2) OCH ₃	-
Ile-2	H	H	C ₂ H ₅	(2) OCH ₃	-
Ile-3	H	H	C ₂ H ₅ -i	(2) OCH ₃	-
Ile-4	H	H	C ₂ H ₅ -i	(2) OCH ₃	-
Ile-5	H	H		(2) OCH ₃	-
Ile-6	H	CH ₃	CH ₃	(2) OCH ₃	-
Ile-7	H	H	CH ₃	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
Ile-8	H	H	C ₂ H ₅	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
Ile-9	H	H	C ₂ H ₅ -i	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-

Приклад №	R ²⁹	R ³⁰	R ³¹	(Положення) (X ⁴) _n	(Положення) (X ⁵) _n
Ile-10	H	H	C ₂ H ₅ -i	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
Ile-11	H	H		(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-
Ile-12	H	CH ₃	CH ₃	(2) OCH ₃ (5) CH ₃	-

Особливо переважними сполуками, які покращують сумісність із культурними рослинами, [компонент (b'')] є клоквінтоцет-мексил, фенхлоразол-етил, ізоксадифен-етил, мефенпір-діетил, фурилазол, фенклорим, кумілурун, димрон, димепіперат та сполуки Ile-5 та Ile-11, причому абсолютну перевагу надають клоквінтоцет-мексилу та мефенпір-діетилу.

Сполуки загальної формули (IIa), які як сафенери застосовують згідно з винаходом, є відомими та/або можуть бути одержані відомими способами (див. WO-A-91/07874, WO-A-95/07897).

Сполуки загальної формули (IIb), які як сафенери застосовують згідно з винаходом, є відомими та/або можуть бути одержані відомими способами (див. EP-A-191736).

Сполуки загальної формули (IIc), які як сафенери застосовують згідно з винаходом, є відомими та/або можуть бути одержані відомими способами (див. DE-A-2218097, DE-A-2350547).

Сполуки загальної формули (IId), які як сафенери застосовують згідно з винаходом, є відомими та/або можуть бути одержані відомими способами (див. DE-A-19621522/US-A-6235680).

Сполуки загальної формули (IIe), які як сафенери застосовують згідно з винаходом, є відомими та/або можуть бути одержані відомими способами (див. WO-A-99/66795/US-A-6251827).

Нижче в таблиці наведені приклади селективно-гербіцидних комбінацій із відповідної активної речовини формули (I) та одного із названих вище сафенерів.

Таблиця: Приклади комбінацій згідно з винаходом

Активні речовини формули (I)	Сафенер
I-1	клоквінтоцет-мексил
I-1	фенхлоразол-етил
I-1	ізоксадифен-етил
I-1	мефенпір-діетил
I-1	фурилазол
I-1	фенклорим
I-1	кумілурун
I-1	діамурон/димрон
I-1	димепіперат
I-1	Ile-11
I-1	Ile-5
I-2	клоквінтоцет-мексил
I-2	фенхлоразол-етил
I-2	ізоксадифен-етил
I-2	мефенпір-діетил
I-2	фурилазол
I-2	фенклорим
I-2	кумілурун
I-2	діамурон/димрон
I-2	димепіперат
I-2	Ile-11
I-2	Ile-5
I-3	клоквінтоцет-мексил
I-3	фенхлоразол-етил
I-3	ізоксадифен-етил
I-3	мефенпір-діетил
I-3	фурилазол
I-3	фенклорим
I-3	кумілурун
I-3	діамурон/димрон
I-3	димепіперат
I-3	Ile-5

I-3	Ile-11
I-4	клоквінтоцет-мексил
I-4	фенхлоразол-етил
I-4	ізоксадифен-етил
I-4	мефенпір-діетил
I-4	фурилазол
I-4	фенклорим
I-4	кумілурон
I-4	діамурон/димрон
I-4	димепіперат
I-4	Ile-11
I-4	Ile-5
I-5	клоквінтоцет-мексил
I-5	фенхлоразол-етил
I-5	ізоксадифен-етил
I-5	мефенпір-діетил
I-5	фурилазол
I-5	фенклорим
I-5	кумілурон
I-5	діамурон/димрон
I-5	димепіперат
I-5	Ile-5
I-5	Ile-11
I-6	клоквінтоцет-мексил
I-6	фенхлоразол-етил
I-6	ізоксадифен-етил
I-6	мефенпір-діетил
I-6	фурилазол
I-6	фенклорим
I-6	кумілурон
I-6	діамурон/димрон
I-6	димепіперат
I-6	Ile-5
I-6	Ile-11

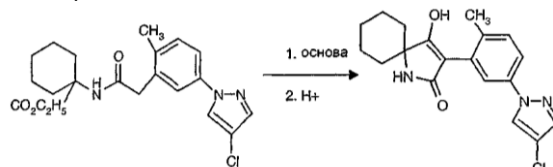
I-7	клоквінтоцет-мексил
I-7	фенхлоразол-етил
I-7	ізоксадифен-етил
I-7	мефенпір-діетил
I-7	фурилазол
I-7	фенклорим
I-7	кумілурон
I-7	діамурон/димрон
I-7	димепіперат
I-7	Ile-5
I-7	Ile-11
I-8	клоквінтоцет-мексил
I-8	фенхлоразол-етил
I-8	ізоксадифен-етил
I-8	мефенпір-діетил
I-8	фурилазол
I-8	фенклорим
I-8	кумілурон
I-8	діамурон/димрон
I-8	димепіперат
I-8	Ile-5
I-8	Ile-11

Несподівано з'ясували, що зазначені вище комбінації N-гетероциклілфенілзаміщених циклічних кетонів загальної формули (I) та сафенерів (антидотів) вказаної вище групи (b') при особливо гарній сумісності із культурними рослинами проявляють високу гербіцидну активність та можуть бути застосовані в різних культурах, таких як зернові (передусім пшениця), а також соя, картопля, кукурудза та рис, для селективної боротьби з бур'янами.

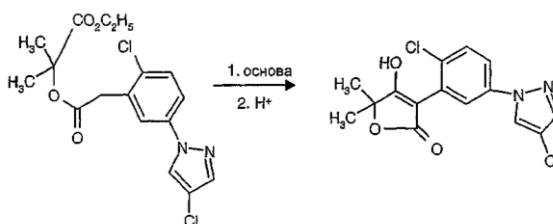
При цьому несподівано виявилось, що із великої кількості відомих сафенерів або антидотів, які здатні запобігати шкідливому впливу гербіциду на культурні рослини, саме вказані вище сполуки групи (b') є придатними майже повністю усувати шкідливий вплив N-гетероцикліл-фенілзаміщених циклічних кетонів на культурні рослини, значно не знижуючи при цьому гербіцидну активність по відношенню до бур'янів.

Абсолютну перевагу при цьому надають особливо переважній дії найбільш переважних та абсолютно переважних комбінаційних партнерів із групи (b'), зокрема з огляду на їх щадний вплив на культурні рослини, наприклад, зернові, таю як, наприклад, пшениця, ячмінь та жито, а також кукурудзу та рис.

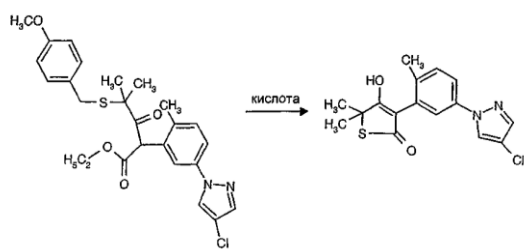
Якщо як вихідну речовину згідно зі способом (A) застосовують, наприклад, етиловий естер N-[6-метил-3-(N-4-хлорпіразоліл)фентацетил]-1-аміноциклогексан-карбонової кислоти, то здійснення способу згідно з винаходом демонструє така схема реакції:



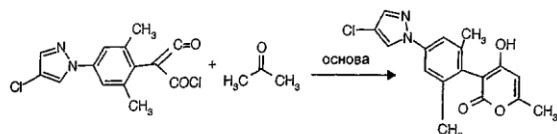
Якщо як вихідну речовину згідно зі способом (B) застосовують, наприклад, етиловий естер O-[2-хлор-5-(N-4-хлорпіразоліл)фенілацетил]-2-гідроксиізомасляної кислоти, то здійснення способу згідно з винаходом демонструє така схема реакції:



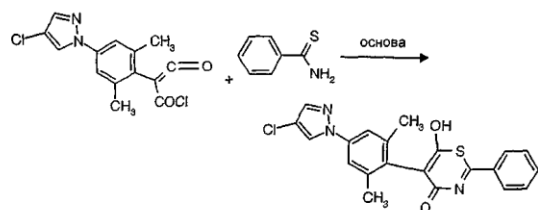
Якщо як вихідну речовину згідно зі способом (C) застосовують, наприклад, етиловий естер 2-[6-метил-3-(N-4-хлорпіразоліл)феніл]-4-(4-метокси)бензилмеркапто-4-метил-3-оксвалеріанової кислоти, то здійснення способу згідно з винаходом демонструє така схема реакції:



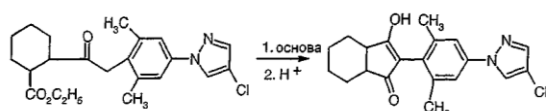
Якщо як вихідні сполуки згідно зі способом (D) застосовують, наприклад, (хлоркарбоніл)-2-[2,6-диметил-4-(N-4-хлорпіразоліл)феніл]кетен та ацетон, то здійснення способу згідно з винаходом демонструє така схема реакції:



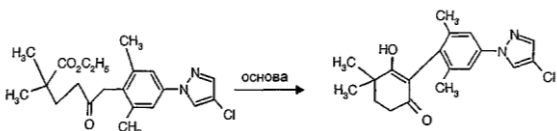
Якщо як вихідні сполуки згідно зі способом (E) застосовують, наприклад, (хлоркарбоніл)-2-[2,6-диметил-4-(N-4-хлорпіразоліл)феніл]кетен та тіобензамід, то здійснення способу згідно з винаходом демонструє така схема реакції:



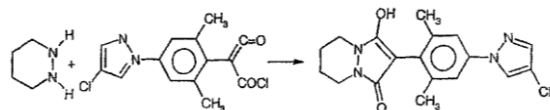
Якщо як вихідну речовину згідно зі способом (F) застосовують, наприклад, етиловий естер 5-[2,6-диметил-4-(N-4-хлорпіразоліл)феніл]-2,3-тетраметил-4-оксо-валеріанової кислоти, то здійснення способу згідно з винаходом демонструє така схема реакції:



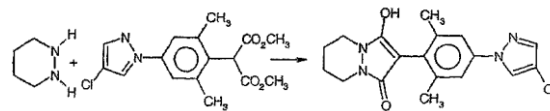
Якщо як вихідну речовину згідно зі способом (G) застосовують, наприклад, етиловий естер 5-[2,6-диметил-4-(N-4-хлорпіразоліл)феніл]-2,2-диметил-5-оксогексанової кислоти, то здійснення способу згідно з винаходом демонструє така схема реакції:



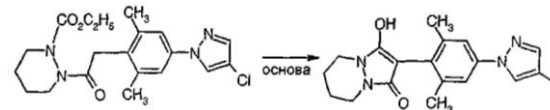
Якщо як вихідні сполуки згідно зі способом (Hα) застосовують, наприклад, гексагідропіридазин та (хлоркарбоніл)-2-[2,6-диметил-4-(N-4-хлорпіразоліл)феніл]кетен, то здійснення способу згідно з винаходом демонструє така схема реакції:



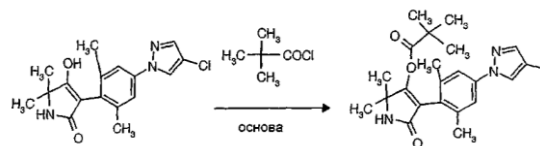
Якщо як ВИХІДНІ продукти згідно зі способом (Hβ) застосовують, наприклад, гексагідропіридазин та диметилловий естер 2,6-диметил-4-(N-4-хлорпіразоліл)фенілмалонової кислоти то здійснення способу згідно з винаходом демонструє така схема реакції:



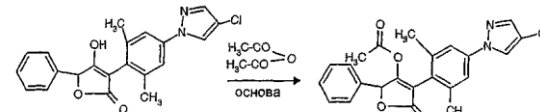
Якщо як вихідний продукт згідно зі способом (Hγ) застосовують, наприклад, 1-етоксикарбоніл-2-[2,6-диметил-4-(N-4-хлорпіразоліл)феніл]ацетил]гексагідропіридазин, то здійснення способу згідно з винаходом демонструє така схема реакції:



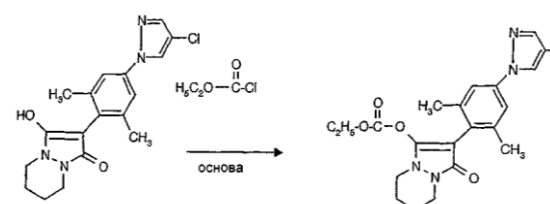
Якщо як вихідні речовини згідно зі способом (Iα) застосовують, наприклад, 3-[2,6-диметил-4-(N-4-хлорпіразоліл)феніл]-5,5-диметилпіролідин-2,4-діон та півалоїлхлорид, то здійснення способу згідно з винаходом демонструє така схема реакції:



Якщо як вихідні сполуки згідно зі способом (I) (варіант β) застосовують, наприклад, 3-[2,6-диметил-4-(N-4-хлорпіразоліл)феніл]-4-гідрокси-5-феніл-Δ³-дигідрофуран-2-он та ацетангідрид, то здійснення способу згідно з винаходом демонструє така схема реакції:

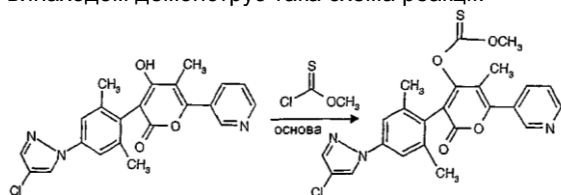


Якщо як вихідні сполуки згідно зі способом (J) застосовують, наприклад, 8-[2,6-диметил-4-(N-4-хлорпіразоліл)феніл]-1,6-діазабіцикло-(4,3,0)^{1,6}-нонан-7,9-діон та етоксипіридиновий естер хлормурашиної кислоти, то здійснення способу згідно з винаходом демонструє така схема реакції:

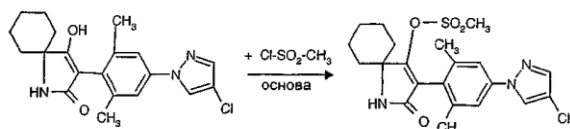


Якщо як вихідні продукти згідно зі способом (K) застосовують, наприклад, 3-[2,6-диметил-4-(N-4-

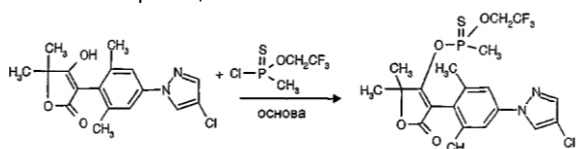
хлорпіразоліл)феніл]-4-гідрокси-5-метил-6-(3-піридил)пірон та метиловий естер хлормоніотимурашиної кислоти, то здійснення способу згідно з винаходом демонструє така схема реакції:



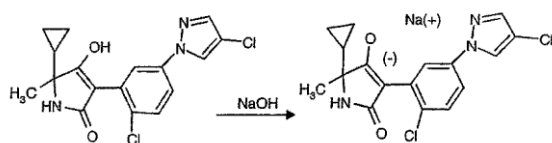
Якщо як вихідні продукти згідно зі способом (L) застосовують, наприклад, 2-[2,6-диметил-4-(N-4-хлорпіразоліл)феніл]-5,5-пентаметилепіролідін-2,4-діон та хлорид метансульфонової кислоти, то здійснення способу згідно з винаходом демонструє така схема реакції:



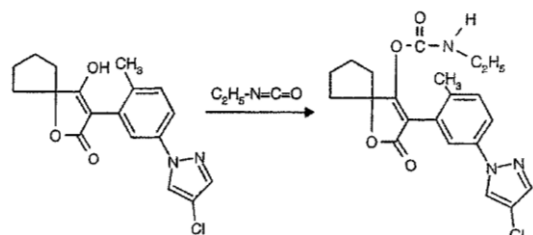
Якщо як вихідні продукти згідно зі способом (M) застосовують, наприклад, 2-[2,6-диметил-4-(N-4-хлорпіразоліл)феніл]-4-гідрокси-5,5-диметил-Δ³-дигідрофуран-2-он та (2,2,2-трифторетилловий естер хлориду метантіофосфонові кислоти, то здійснення способу згідно з винаходом демонструє така схема реакції:



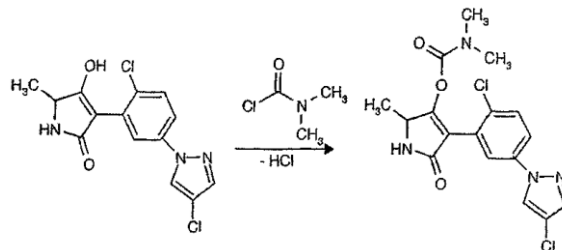
Якщо як складові згідно зі способом (N) застосовують, наприклад, 3-[2-хлор-5-(N-4-хлорпіразоліл)феніл]-5-циклопропіл-5-метилпіролідін-2,4-діон та NaOH, то здійснення способу згідно з винаходом демонструє така схема реакції:



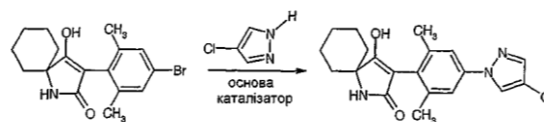
Якщо як вихідні продукти згідно зі способом (O) (варіант α) застосовують, наприклад, 3-[6-метил-3-(N-4-хлорпіразоліл)феніл]-4-гідрокси-5-тетраметил-Δ³-дигідрофуран-2-он та етилізотианат, то здійснення способу згідно з винаходом демонструє така схема реакції:



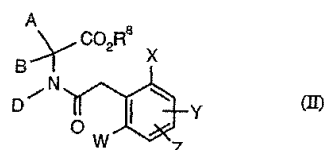
Якщо як вихідні продукти згідно зі способом (O) (варіант β) застосовують, наприклад, 3-[2-хлор-5-(N-4-хлорпіразоліл)феніл]-5-метилпіролідін-2,4-діон та хлорид диметилкарбамідної кислоти, то здійснення способу згідно з винаходом демонструє така схема реакції:



Якщо як вихідні продукти згідно зі способом (P) застосовують, наприклад, 3-[2,6-диметил-4-бромфеніл]-4,4-(пентаметилепіролідін)-2,4-діон та 4-хлорпіразол, то здійснення способу згідно з винаходом демонструє така схема реакції:



Сполуки формули (II)

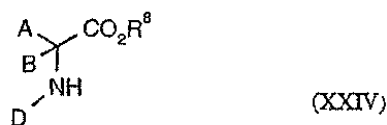


в якій

A, B, D, W, X, Y, Z та R⁸ мають вказані вище значення,

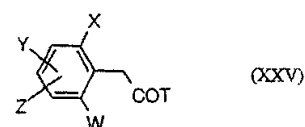
які як вихідні речовини застосовують при здійсненні способу (а) згідно з винаходом, є новими.

Естери ациламінокислоти формули (II) одержують, наприклад, шляхом ацилювання похідних амінокислоти формули (XXIV)



в якій

A, B, R⁸ та D мають вказані вище значення, заміщеними похідними фенілоцтової кислоти формули (XXV)



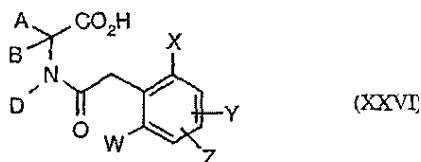
в якій

W, X, Y та Z мають вказані вище значення та T означає відхідну групу, введену агентами активування карбонової кислоти, такими як карбонілдімідозол, карбонілдіміди (наприклад, диметилкарбонілдімід), агентами фосфорилування (такими як, наприклад, POCl₃, BOP-Cl), агентами галогенування, наприклад, тіонілхлором, оксалілхлором.

лоридом, фосгеном, хлоридами сульфенової кислоти (наприклад, хлоридом толуолсульфенової кислоти) або естерами хлормурашиної кислоти,

(Chem. Reviews 52, 237-416 (1953); Bhattacharya, Indian J. Chem. 6, 341-5, 1968)

або шляхом естерифікації ациламінокислот формули (XXVI)

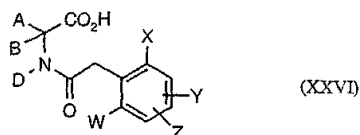


в якій

A, B, D, W, X, Y та Z мають вказані вище значення,

(Chem. Ind. (London) 1568 (1968)).

Сполуки формули (XXVI)



в якій

A, B, D, W, X, Y та Z мають вказані вище значення,

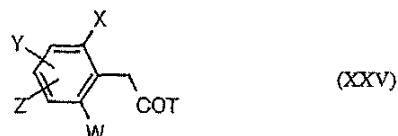
є новими

Сполуки формули (XXVI) одержують шляхом ацилювання амінокислот формули (XXVII)



в якій

A, B та D мають вказані вище значення, заміщеними похідними фенолоцтової кислоти формули (XXV)



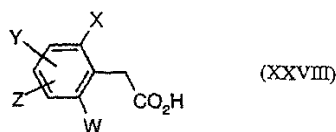
в якій

W, X, Y та Z мають вказані вище значення та T має вказані вище значення,

наприклад, згідно з Шоттен-Бауманном (Organikum, VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften, Berlin 1977, S. 505)

Сполуки формули (XXV) є новими Вони можуть бути одержані відомими способами та згідно з прикладами одержання (див., наприклад, H Henecka, Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, Bd 8, S. 467-469 (1952))

Сполуки формули (XXV) одержують, наприклад, шляхом взаємодії заміщених фенолоцтових кислот формули (XXVIII)



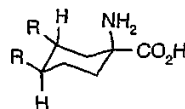
в якій

W, X, Y та Z мають вказані вище значення,

з агентами галогенування (наприклад, тіонілхлоридом, тіонілбромідом, оксалілхлоридом, фосгеном, фосфортрихлоридом, фосфортрибромідом або фосфорпентахлоридом), агентами фосфорилування (наприклад POCl_3 , BOP-Cl), карбонілдіімідазолом, карбонілдіімідами (наприклад, дициклогексилкарбонілдіімід), в разі необхідності, в присутності розріджувача (наприклад, в разі необхідності, хлорованих аліфатичних або ароматичних вуглеводнів, таких як толуол або метиленхлорид, або етерів, наприклад, тетрагідрофурану, діоксану, метил-трет-бутилового етеру) при температурі від -20°C до 150°C , переважно від -10°C до 100°C .

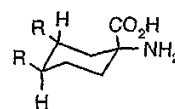
Сполуки формули (XXIV) та (XXVII) є частково відомими та/або можуть бути одержані відомими способами (див., наприклад, Compagnon, Miosque Ann. Chim. (Paris) [14] 5, S. 11-22, 23-27(1970)).

Заміщені циклічні амінокарбонові кислоти формули (XXVII), в яких A та B утворюють кільце, загалом можуть бути синтезовані за Бухерером-Бергсом або Штрекером та при цьому осаджуються відповідно у різних ізомерних формах. Так, наприклад, в умовах синтезу Бухерера-Бергса одержують переважно ізомери (нижче для спрощення позначені β), в яких залишки R та карбоксильні групи знаходяться в екваторіальному положення, в той час як в умовах синтезу Штрекера одержують переважно ізомери (нижче для спрощення позначення α), в яких аміногрупи та залишки R знаходяться в екваторіальному положення.



синтез Бухерера-Бергса

(β -ізомери)

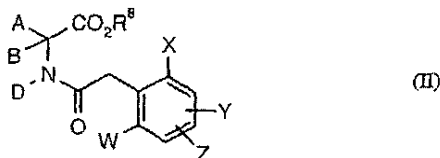


синтез Штрекера

(α -ізомери)

(L Munday, J. Chem. Soc. 4372 (1961); J.T. Eward, C. Jitrangeri, Can. J. Chem. 53, 3339 (1975)).

Крім того застосовувані у способі (A) вихідні речовини формули (II)



в якій

A, B, D, W, X, Y, Z та R^8 мають вказані вище значення,

можуть бути одержані шляхом взаємодії амініонітрів формули (XXIX)



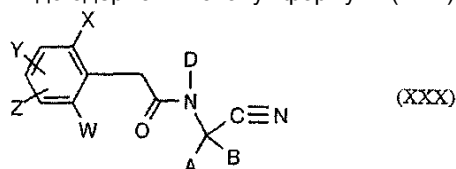
в якій

A, B та D мають вказані вище значення,

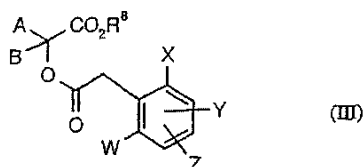
із заміщеними похідними фенілоцтової кислоти формули (XXV)



в якій
T, W, X, Y та Z мають вказані вище значення,
до одержання сполук формули (XXX)



в якій
A, B, D, W, X, Y та Z мають вказані вище значення, та ці сполуки піддають кислотному алкоголізу. Сполуки формули (XXX) є також новими. Сполуки формули (III)

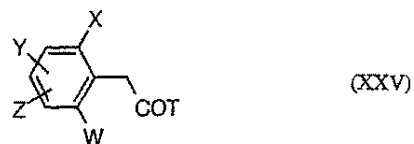


в якій
A, B, W, X, Y, Z та R⁸ мають вказані вище значення,
які як вихідні речовини застосовують у способі (B) згідно з винаходом,
є новими.
Вони можуть бути одержані відомими методами.

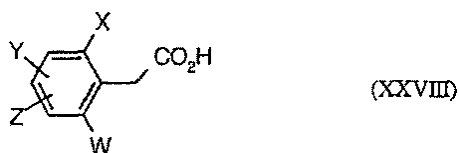
Так, наприклад, сполуки формули (III) одержують шляхом ацилювання естерів 2-гідроксикарбонової кислоти формули (XXXI-A)



в якій
A, B та R⁸ мають вказані вище значення,
заміщеними похідними фенілоцтової кислоти формули (XXV)



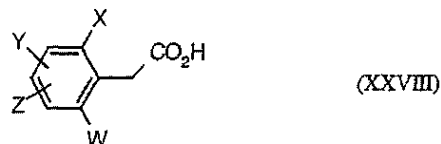
в якій
T, W, X, Y та Z мають вказані вище значення, (Chem. Reviews 52, 237-416 (1953)).
Крім того сполуки формули (III) одержують шляхом алкілювання
заміщених фенілоцтових кислот формули (XXVIII)



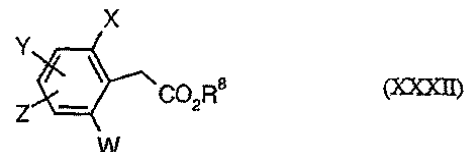
в якій
W, X, Y та Z мають вказані вище значення, естерами α-галогенкарбонових кислот формули (XXXI-B)



в якій
A, B та R⁸ мають вказані вище значення та Hal означає хлор або бром
Сполуки формули (XXVIII) є новими. Сполуки формули (XXXI-B) є комерційно доступними. Так, наприклад, сполуки формули (XXVIII)

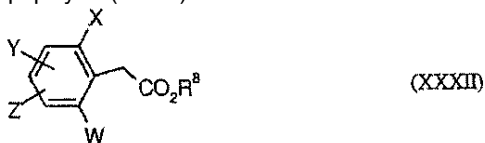


в якій
W, X, Y та Z мають вказані вище значення, одержують шляхом омилення естерів фенілоцтової кислоти формули (XXXII)



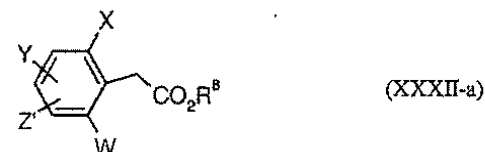
в якій
W, X, Y, Z та R⁸ мають вказані вище значення, в присутності кислот або основ, в присутності розчинника у відомих стандартних умовах

Сполуки формули (XXXII) є новими. Сполуки формули (XXXII)



в якій
W, X, Y, Z та R⁸ мають вказані вище значення, одержують, наприклад, описаним у прикладах способом (Q),

шляхом перетворення естерів фенілоцтової кислоти формули (XXXI 1-a)

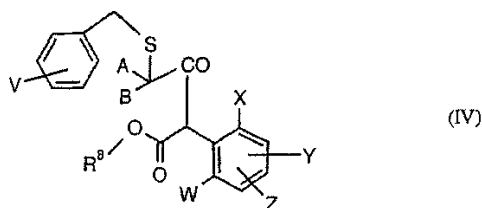


в якій
R⁸, W, X та Y мають вказані вище значення та Z' означає галоген (зокрема бром),

в присутності гетероцикла, що містить HN, формули (XXIII), в якій Z має вказані вище значення, в присутності основи та, в разі необхідності, в присутності каталізатора (переважно солей міді, таких як йодид міді(I)) (S. Buchwald et. al. JACS123, 7727, 2001).

Естери фенілоцтової кислоти формули (XXXII-a) є частково відомими із заявок WO 96/35 664 та WO 97/02 243 або можуть бути одержані описаними там способами.

Сполуки формули (IV)



в якій

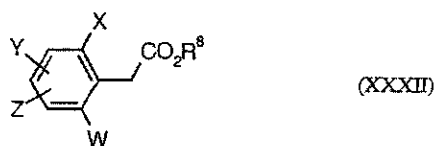
A, B, V, W, X, Y, Z та R⁸ мають вказані вище значення,

які як вихідні речовини застосовують при здійсненні способу (C) згідно з винаходом, є новими.

Вони можуть бути одержані відомими методами.

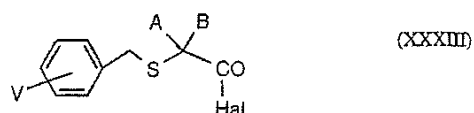
Сполуки формули (IV) одержують, наприклад, шляхом ацилювання

заміщених естерів фенілоцтової кислоти формули (XXXII)



в якій

W, X, Y, Z та R⁸ мають вказані вище значення, галогенідами 2-бензилтіокарбонової кислоти формули (XXXIII)

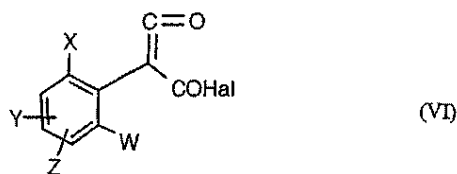


в якій

A, B та V мають вказані вище значення та Hal означає галоген (зокрема хлор або бром), в присутності сильних основ (див., наприклад, M.S. Chambers, E.J. Thomas, D.J. Williams, J. Chem. Soc. Chem. Commun., (1987), 1228).

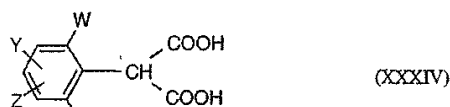
Галогеніди бензилтіокарбонової кислоти формули (XXXIII) є частково відомими та/або можуть бути одержані відомими способами (J. Antibiotics (1983), 26, 1589).

Галогенкарбонілкетени формули (VI), які як вихідні речовини застосовують для здійснення способів (D), (E) та (H-α), є новими. Вони можуть бути одержані відомими методами простим способом (див., наприклад, Org. Prep. Proced. Int., 7, (4), 155-158, 1975 und DE 1 945 703). Так, наприклад, сполуки формули (VI)



в якій

W, X, Y та Z мають вказані вище значення та Hal означає хлор або бром, одержують шляхом перетворення заміщених фенілмалонових кислот формули (XXXIV)

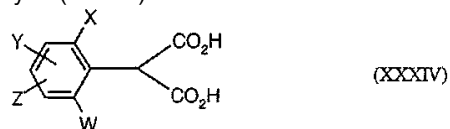


в якій

W, X, Y та Z мають вказані вище значення та галогенідами кислоти, такими як, наприклад, тіонілхлорид, хлорид фосфору (V), хлорид фосфору (III), оксалілхлорид, фосген або тіонілбромід, в разі необхідності, в присутності каталізаторів, таких як, наприклад, діетилформамід, метилстерилформамід або трифенілфосфін, та, в разі необхідності, в присутності основ, таких як, наприклад, піридин або триетиламін

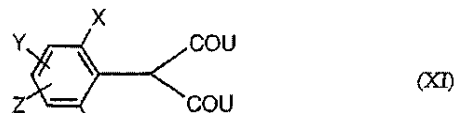
Заміщені фенілмалонові кислоти формули (XXXIV) є новими. Вони можуть бути одержані відомими способами (див., наприклад, Organikum, VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften, Berlin 1977, S. 517 ff, EP-A-528 156, WO 96/35 664, WO 97/02 243, WO 97/01535, WO 97/36868 und WO 98/05638).

Так, наприклад, фенілмалонові кислоти формули (XXXIV)



в якій

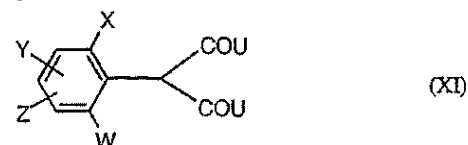
W, X, Y та Z мають вказані вище значення, одержують омиленням похідних фенілмалонової кислоти формули (XI), де U = OR⁸



в якій

U, W, X, Y та Z мають вказані вище значення, в присутності основи та розчинника, після чого сполуки обережно підкислюють (EP-A-528 156, WO 96/35 664, WO 97/02 243).

Естери малонової кислоти формули (XI), де U = OR⁸

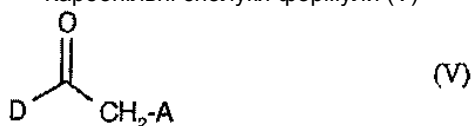


в якій

U, W, X, Y та Z мають вказані вище значення, є новими.

Вони можуть бути одержані відомими методами органічної хімії (див., наприклад, Tetrahedron Lett. 27, 2763 (1986), Organikum VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften, Berlin 1977, S. 587 ff., WO 96/35664, WO 97/02243, WO 97/01535, WO 97/36868, WO 98/05638 та WO 99/47525).

Карбонільні сполуки формули (V)



в якій

A та D мають вказані вище значення, які як вихідні речовини застосовують для здійснення способу (D) згідно з винаходом, або їх силіленольні етери формули (Va)



в якій

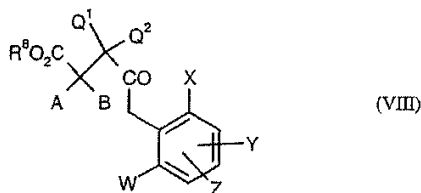
A, D та R⁸ мають вказані вище значення, є комерційно доступними, загально відомими або одержаними відомими способами.

Одержання хлоридів кетенової кислоти формули (VI), які як вихідні речовини застосовують для здійснення способу (E) згідно з винаходом, вже були описані вище. Тіоаміди формули (VII)



в якій

A має вказані вище значення, які застосовують для здійснення способу (E) згідно з винаходом, є загально відомими сполуками органічної хімії. Сполуки формули (VIII)



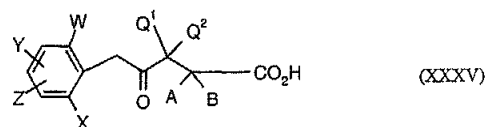
в якій

A, B, Q¹, Q², W, X, Y, Z та R⁸ мають вказані вище значення, які як ВИХІДНІ речовини застосовують для здійснення способу (F) згідно з винаходом, є новими.

Вони можуть бути одержані загально відомими методами.

Естери 5-арил-4-кетокетенової кислоти формули (VIII) одержують, наприклад, шляхом етерифікації (див., наприклад, Organikum, 15. Auflage, Berlin, 1977, Seite 499) або алкілювання (див. при-

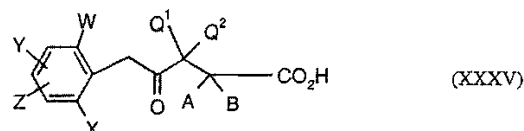
лади одержання) 5-арил-4-кетокетенових кислот формули (XXXV)



в якій

W, X, Y, Z, A, B, Q¹ та Q² мають вказані вище значення.

5-арил-4-кетокетенові кислоти формули (XXXV)

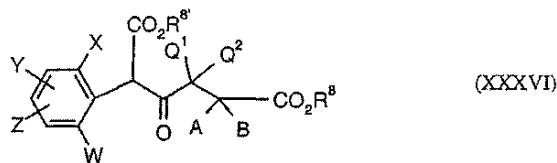


в якій

A, B, Q¹, Q², W, X, Y та Z мають вказані вище значення,

є новими, можуть бути одержані загально відомими методами (WO 96/01 798, WO 97/14667, WO 98/39281).

5-арил-4-кетокетенові кислоти формули (XXXV) одержують, наприклад, шляхом декарбоксілювання естерів 2-феніл-3-оксоадипінової кислоти формули (XXXVI)



в якій

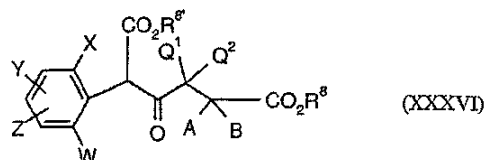
A, B, Q¹, Q², W, X, Y та Z мають вказані вище значення та

R⁸ та R^{8'} означають алкіл (зокрема C₁-C₈-алкіл), а

при застосуванні сполуки формули (XXXVIII) R⁸ означає водень,

в разі необхідності, в присутності розріджувача та, в разі необхідності, в присутності основи або кислоти (див., наприклад, Organikum, 15. Auflage, Berlin, 1977, Seite 519 - 521).

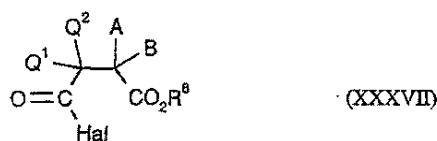
Сполуки формули (XXXVI)



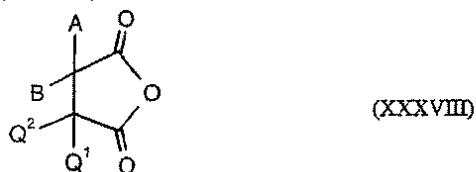
в якій

A, B, Q¹, Q², W, X, Y, Z, R⁸, R^{8'} мають вказані вище значення та в якій при застосуванні сполуки формули (XXXVIII) R⁸ означає також водень, є новими.

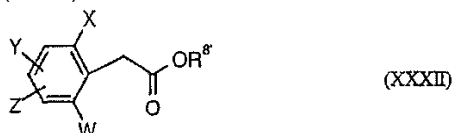
Сполуки формули (XXXVI) одержують, наприклад, шляхом ацилювання хлоридів моноестерів дикарбонової кислоти формули (XXXVII),



в якій
A, B, Q¹, Q² та R⁸ мають вказані вище значення та
Hal означає хлор або бром,
або ангідридів карбонової кислоти формули (XXXVIII)



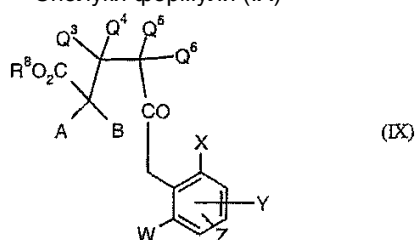
в якій
A, B, Q¹ та Q² мають вказані вище значення,
естерами фенолоцтової кислоти формули (XXXII)



в якій
W, X, Y, Z та R⁸ мають вказані вище значення,
в присутності розріджувача та в присутності основи (див, наприклад, M.S. Chambers, E. J. Thomas, D.J. Williams, J. Chem. Soc. Chem. Commun., (1987), 1228, див також приклади одержання).

Сполуки формул (XXXVII) та (XXXVIII) є частково відомими сполуками органічної хімії та/або можуть бути одержані загально відомими способами.

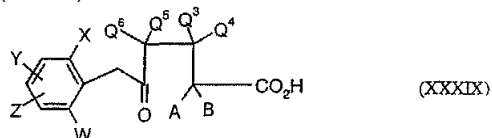
Сполуки формули (IX)



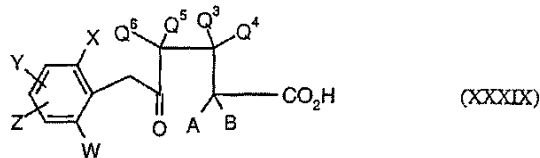
в якій
A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y, Z та R⁸ мають вказані вище значення, які як ВИХІДНІ речовини застосовують для здійснення способу (G), є новими

Вони можуть бути одержані загально відомими способами

Естери 6-арил-5-кетокарбонової кислоти формули (IX) одержують, наприклад, шляхом естерифікації 6-арил-5-кетокарбонових кислот формули (XXXIX)

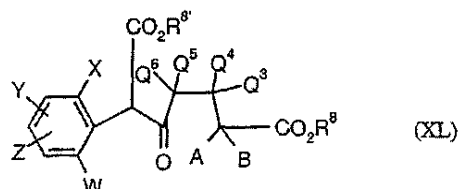


в якій
A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y та Z мають вказані вище значення (див, наприклад, Organikum, 15. Auflage, Berlin, 1977, Seite 499). 6-арил-5-кетокарбонової кислоти формули (XXXIX)



в якій
A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y та Z мають вказані вище значення, є новими. Вони можуть бути одержані загально відомими способами (WO 99/43649, WO 99/48869), наприклад, шляхом омилення та декарбоксилювання

заміщених естерів 2-феніл-3-оксогептанової дикислоти формули (XL)



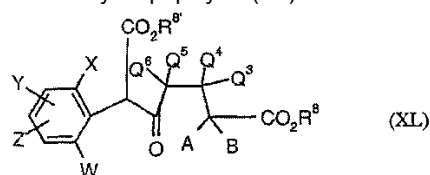
в якій
A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y та Z мають вказані вище значення та

R⁸ та R^{8'} означають алкіл (переважно C₁-C₆-алкіл), а

при застосуванні сполуки формули (XLII) R⁸ означає водень,

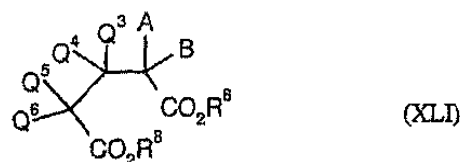
в разі необхідності, в присутності розріджувача та, в разі необхідності, в присутності основи або кислоти (див., наприклад, Organikum, 15. Auflage, Berlin, 1977, Seite 519 bis 521).

Сполуки формули (XL)

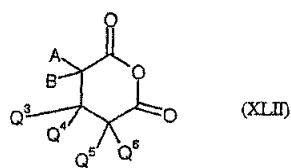


в якій
A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y, Z, R⁸ та R^{8'} мають вказані вище значення,

є новими та можуть бути одержані шляхом конденсації естерів дикарбонової кислоти формули (XLI),

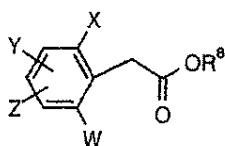


в якій
A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶ та R⁸ мають вказані вище значення,
або ангідридів карбонової кислоти формули (XLII)



(XLII)

в якій
A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶ мають вказані вище значення,
заміщеними естерами феніл оцтової кислоти
формули (XXXII)
в якій



(XXXII)

W, X, Y, Z та R⁸ мають вказані вище значення,
в присутності розріджувача та в присутності основи.

Сполуки формули (XLI) та (XLII) є частково відомими та/або можуть бути одержані відомими способами

Гідазини формули (X)

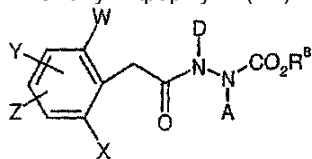
A-NH-NH-D

(X)

в якій A та D мають вказані вище значення,
які як ВИХІДНІ речовини застосовують для
здійснення способу (H-α) та (H-β) згідно з винаходом,

є частково відомими та/або можуть бути одержані відомими із літературних джерел способами (див., наприклад, Liebigs Ann. Chem. 585, 6 (1954); Reaktionen der organischen Synthese, C. Ferri, Seite 212, 513; Georg Thieme Verlag Stuttgart, 1978; Liebigs Ann. Chem. 443, 242 (1925); Chem. Ber. 98, 2551 (1965), EP-A-508 126, WO 92/16510, WO 99/47 525, WO 01/17 972).

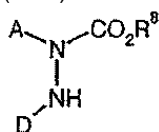
Сполуки формули (XII)



(XII)

в якій
A, D, W, X, Y, Z та R⁸ мають вказані вище значення,
які застосовують при здійсненні способу (H-γ)
згідно з винаходом,
є новими.

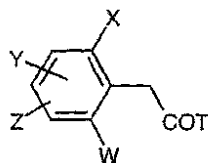
Ацилкарбазати формули (XIII) одержують, наприклад, шляхом ацилювання карбазатів формули (XLIII)



(XLIII)

в якій
A, R⁸ та D мають вказані вище значення,

заміщеними похідними фенілоцтової кислоти
формули (XXV)



(XXV)

в якій

T, W, X, Y та Z мають вказані вище значення
(Chem. Reviews 52, 237-416(1953);
Bhattacharya, Indian J. Chem. 6, 341-5, 1968). Карбазати формули (XLIII) є частково наявними у продажу та частково відомими сполуками або можуть бути одержані загалом відомими способами органічної хімії.

Сполуки формул (I-1') - (I-8), в яких A, B, D, G, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X та Y мають вказані вище значення та Z' означає хлор та бром, переважно бром, які як вихідні речовини застосовують для здійснення способу (P) згідно з винаходом, є частково відомими із цитованих на початку патентних заявок (наприклад, WO 96/35 664, WO 97/02 243) або можуть бути одержані описаними там способами.

Сполуки формули (XXIII)

в якій

H - Z

(XXIII)

Z має вказані вище значення,

є частково наявними у продажу або можуть бути одержані загалом відомими способами.

Галогеніди кислоти формули (XIII), ангідриди карбонової кислоти формули (XIV), естери або тіоестери хлормурашиної кислоти формули (XV), естери хлормонотіомурашиної або хлордитіомурашиної кислоти формули (XVI), хлориди сульфоновної кислоти формули (XVII), сполуки фосфора формули (XVIII) та гідроксиди, алкоксиди металів або аmini формули (XIX) та (XX), ізоціанати формули (XXI) та хлориди карбамідної кислоти формули (XXII), які як вихідні речовини також застосовують для здійснення способу (I), (J), (K), (L), (M), (N) та (O) згідно з винаходом, є загалом відомими сполуками органічної хімії.

Сполуки формул (V), (VII), (XIII) - (XXII), (XXIV), (XXVII), (XXIX), (XXXI-A), (XXXI-B), (XXXIII), (XXXVII), (XXXVIII), (XLI) та (XLII) є також відомими із цитованих на початку патентних заявок та/або можуть бути одержані описаними способами.

Спосіб (A) відрізняється тим, що сполуки формули (II), в якій A, B, D, W, X, Y, Z та R⁸ мають вказані вище значення, в присутності основи піддають внутрішньомолекулярному конденсауванню.

Як розріджувачі при здійсненні способу (A) згідно з винаходом можуть бути застосовані всі інертні органічні розчинники. Перевагу надають вуглеводням, таким як толуол та ксилол, а також етерам, таким як дибутиловий етер, тетрагидрофур, діоксан, глікольдиметилловий етер та диглікольдиметилловий етер, полярними розчинникам, таким як диметилсульфоксид, сульфолан, диметилформамід, диметилацетамід та N-

метилпіролідон, а також спиртам, таким як метанол, етанол, пропанол, ізопропанол, бутанол, ізобутанол та трет-бутанол.

Як основа (засіб депротонування) при здійсненні способу (A) згідно з винаходом можуть бути застосовані всі звичайні акцептори протонів. Переважно застосовують оксиди, гідроксиди та карбонати лужних та лужноземельних металів, такі як гідроксид натрію, гідроксид калію, оксид магнію, оксид кальцію, карбонат натрію, карбонат калію та карбонат кальцію, які можуть бути застосовані також в присутності каталізаторів переносу фаз, таких як, наприклад, хлорид триетилбензиламонію, бромід тетрабутиламонію, Адоген 464 (= хлорид метилтриалкіл(C₈-C₁₀)амонію) або TDA 1 (= трис-(метоксиетокси-етил)амін). Також можуть бути застосовані лужні метали, такі як натрій або калій. Крім того застосовують також амідати 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.

Реакційні температури при здійсненні способу (A) згідно з винаходом можна варіювати у широких діапазонах. Загалом працюють при температурах від 0 °C до 250 °C, переважно від 50 °C до 150 °C.

Спосіб (A) згідно з винаходом загалом здійснюють при нормальному тиску. При здійсненні способу (A) згідно з винаходом реакційні компоненти формули (II) та основи депротонування загалом застосовують у приблизно подвійних еквімолярних кількостях. Однак можливо також той чи інший компонент застосовувати у надлишку (до 3 моль)

Спосіб (B) відрізняється тим, що сполуки формули (III), в якій A, B, W, X, Y, Z та R⁸ мають вказані вище значення, в присутності розріджувача та в присутності основи піддають внутрішньомолекулярному конденсуванню.

Як розріджувачі при здійсненні способу (B) згідно з винаходом можуть бути застосовані всі інертні органічні розчинники. Перевагу надають вуглеводням, таким як толуол та ксилол, а також етерам, таким як дибутиловий етер, тетрагідрофуран, діоксан, глікольдиметиловий етер та диглікольдиметиловий етер, полярними розчинниками, таким як диметилсульфоксид, сульфолан, диметилформамід та N-метилпіролідон, а також спиртам, таким як метанол, етанол, пропанол, ізопропанол, бутанол, ізобутанол та трет-бутанол.

Як основа (засіб депротонування) при здійсненні способу (B) згідно з винаходом можуть бути застосовані всі звичайні акцептори протонів. Переважно застосовують оксиди, гідроксиди та карбонати лужних та лужноземельних металів, такі як гідроксид натрію, гідроксид калію, оксид магнію, оксид кальцію, карбонат натрію, карбонат калію та карбонат кальцію, які можуть бути застосовані також в присутності каталізаторів переносу фаз, таких як, наприклад, хлорид триетилбензиламонію, бромід тетрабутиламонію, Адоген 464 (= хлорид метилтриалкіл(C₈-C₁₀)амонію) або TDA 1 (= трис-(метоксиетокси-етил)амін). Також можуть бути застосовані лужні метали, такі як натрій або калій. Крім того застосовують також амідати та гід-

риди 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.

Реакційні температури при здійсненні способу (B) згідно з винаходом можна варіювати у широких діапазонах. Загалом працюють при температурах 0-250 °C, переважно 50-150 °C.

Спосіб (B) згідно з винаходом загалом здійснюють при нормальному тиску. При здійсненні способу (B) згідно з винаходом реакційні компоненти формули (III) та основи депротонування загалом застосовують у приблизно еквімолярних кількостях. Однак можливо також той чи інший компонент застосовувати у надлишку (до 3 моль).

Спосіб (C) відрізняється тим, що сполуки формули (IV) в якій A, B, V, W, X, Y, Z та R⁸ мають вказані вище значення, в присутності кислоти та, в разі необхідності, в присутності розріджувача піддають внутрішньомолекулярному циклізуванню.

Як розріджувачі при здійсненні способу (C) згідно з винаходом можуть бути застосовані всі інертні органічні розчинники. Перевагу надають вуглеводням, таким як толуол та ксилол, а також галогенованим вуглеводням, таким як дихлорметан, хлороформ, етиленхлорид, хлорбензол, дихлорбензол, полярні розчинники, такі як диметилсульфоксид, сульфолан, диметилформамід та N-метилпіролідон. Крім того можуть бути застосовані також спирти, такі як метанол, етанол, пропанол, ізопропанол, бутанол, ізобутанол, трет-бутанол.

В разі необхідності, як розріджувач може бути застосована кислота.

Як кислоту при здійсненні способу (C) згідно з винаходом застосовують всі звичайні неорганічні та органічні кислоти, такі як, наприклад, галогеноводнева, сірчана, алкіл-, арил- та галоалкілсульфонова кислоти, зокрема галогеновані алкілкарбонові кислоти, такі як, наприклад, трифтороцтова кислота.

Реакційні температури при здійсненні способу (C) згідно з винаходом можна варіювати у широких діапазонах. Загалом працюють при температурах від 0 °C до 250 °C, переважно від 50 °C до 150 °C.

Спосіб (C) згідно з винаходом загалом здійснюють при нормальному тиску. При здійсненні способу (C) згідно з винаходом реакційні компоненти формули (IV) та кислоти загалом застосовують у приблизно еквімолярних кількостях. Однак можливо також, в разі необхідності, застосовувати кислоту як розчинник або каталізатор.

Спосіб (D) відрізняється тим, що карбонільні сполуки формули (V) або їх енольні етери формули (V-a) піддають взаємодії з галогенідами кетенової кислоти формули (VI) в присутності розріджувача та, в разі необхідності, в присутності акцептора кислоти.

Як розріджувач при здійсненні способу (D) згідно з винаходом можуть бути застосовані всі інертні органічні розчинники. Переважно застосовують, в разі необхідності, галогеновані вуглеводні, такі як толуол, ксилол, мезитилен, хлорбензол та дихлорбензол, а також етери, такі як дибутиловий етер, глікольдиметиловий етер, диглікольдиметиловий етер та дифеніловий етер, полярні розчин-

ники, такі як диметилсульфоксид, сульфолан, диметилформамід або N-метилпіролідон.

Як акцептори кислоти при здійсненні способу (D) згідно з винаходом можуть бути застосовані всі звичайні акцептори кислоти.

Переважають застосовують третинні аміни, такі як триетиламін, піридин, діазабіциклооктан (DABCO), діазабіциклоундекан (DBU), діазабіциклононен (DBN), основа Хюніга та N,N-диметиланілін.

Реакційні температури при здійсненні способу (D) згідно з винаходом можна варіювати у широких діапазонах. Загалом працюють при температурах від 0 °C до 250 °C, переважно від 50 °C до 220 °C.

Спосіб (D) згідно з винаходом доцільно здійснювати при нормальному тиску. При здійсненні способу (D) згідно з винаходом реакційні компоненти формул (V) та (VI), в яких A, D, W, X, Y та Z мають вказані вище значення та Hal означає галоген, та, в разі необхідності, акцептори кислоти загалом застосовують у приблизно еквімолярних кількостях. Однак можливо також той чи інший компонент застосовувати у надлишку (до 5 моль).

Спосіб (E) відрізняється тим, що тіоаміди формули (VII) піддають взаємодії з галогенідами кетенової кислоти формули (VI) в присутності розріджувача та, в разі необхідності, в присутності акцептора кислоти.

Як розріджувач при здійсненні способу (E) згідно з винаходом можуть бути застосовані всі інертні органічні розчинники. Переважають застосовують вуглеводні, такі як толуол та ксилол, а також етери, такі як дибутиловий етер, глікольдиметиловий етер та диглікольдиметиловий етер, полярні розчинники, такі як диметилсульфоксид, сульфолан, диметилформамід та N-метилпіролідон.

Як акцептори кислоти при здійсненні способу (E) згідно з винаходом можуть бути застосовані всі звичайні акцептори кислоти.

Переважають застосовують третинні аміни, такі як триетиламін, піридин, діазабіциклооктан (DABCO), діазабіциклоундекан (DBU), діазабіциклононен (DBN), основа Хюніга та N,N-диметиланілін.

Реакційні температури при здійсненні способу (E) згідно з винаходом можна варіювати у широких діапазонах. Загалом працюють при температурах від 0 °C до 250 °C, переважно від 20 °C до 220 °C.

Спосіб (E) згідно з винаходом доцільно здійснювати при нормальному тиску. При здійсненні способу (E) згідно з винаходом реакційні компоненти формул (VII) та (VI), в яких A, W, X, Y та Z мають вказані вище значення та Hal означає галоген, та, в разі необхідності, акцептори кислоти загалом застосовують у приблизно еквімолярних кількостях. Однак можливо також той чи інший компонент застосовувати у надлишку (до 5 моль).

Спосіб (F) відрізняється тим, що сполуки формули (VIII), в якій A, B, Q¹, Q², W, X, Y, Z та R⁸ мають вказані вище значення, піддають внутрішньомолекулярній конденсації в присутності основи.

Як розріджувач при здійсненні способу (F) згідно з винаходом можуть бути застосовані всі інертні по відношенню до учасників реакції органічні розчинники. Переважають застосовують вуглеводні,

такі як толуол та ксилол, а також етери, такі як дибутиловий етер, тетрагідрофуран, діоксан, глікольдиметиловий етер та диглікольдиметиловий етер, полярні розчинники, такі як диметилсульфоксид, сульфолан, диметилформамід та N-метилпіролідон. Крім того можуть бути застосовані спирти, такі як метанол, етанол, пропанол, ізопропанол, бутанол, ізобутанол, трет-бутанол.

Як основа (засіб депротонування) при здійсненні способу (F) згідно з винаходом можуть бути застосовані всі звичайні акцептори протонів. Переважають застосовують оксиди, гідроксиди та карбонати лужних та лужноземельних металів, такі як гідроксид натрію, гідроксид калію, оксид магнію, оксид кальцію, карбонат натрію, карбонат калію та карбонат кальцію, які можуть бути застосовані також в присутності каталізаторів переносу фаз, таких як, наприклад, хлорид триетилбензиламонію, бромід тетрабутиламонію, Адоген 464 = (хлорид метилтриалкіл(C₈-C₁₀)амонію) або TDA 1 (трис-(метоксиетоксиетил)амін). Також можуть бути застосовані лужні метали, такі як натрій або калій. Крім того застосовують також амідри 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.

Реакційні температури при здійсненні способу (F) згідно з винаходом можна варіювати у широких діапазонах. Загалом працюють при температурах від -75 °C до 250 °C, переважно від -50 °C до 150 °C.

Спосіб (F) згідно з винаходом доцільно здійснювати при нормальному тиску.

При здійсненні способу (F) згідно з винаходом реакційні компоненти формули (VIII) та основи депротонування загалом застосовують у приблизно еквімолярних кількостях. Однак можливо також той чи інший компонент застосовувати у надлишку (до 3 моль).

Спосіб (G) відрізняється тим, що сполуки формули (IX), в якій A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y, Z та R⁸ мають вказані вище значення, піддають внутрішньомолекулярному конденсації в присутності основ.

Як розріджувач при здійсненні способу (G) згідно з винаходом можуть бути застосовані всі інертні по відношенню до учасників реакції органічні розчинники. Переважають застосовують вуглеводні, такі як толуол та ксилол, а також етери, такі як дибутиловий етер, тетрагідрофуран, діоксан, глікольдиметиловий етер та диглікольдиметиловий етер, полярні розчинники, такі як диметилсульфоксид, сульфолан, диметилформамід та N-метилпіролідон. Крім того можуть бути застосовані спирти, такі як метанол, етанол, пропанол, ізопропанол, бутанол, ізобутанол, трет-бутанол.

Як основа (засіб депротонування) при здійсненні способу (G) згідно з винаходом можуть бути застосовані всі звичайні акцептори протонів.

Переважають застосовують також оксиди, гідроксиди та карбонати лужних та лужноземельних металів, такі як гідроксид натрію, гідроксид калію, оксид магнію, оксид кальцію, карбонат натрію, карбонат калію та карбонат кальцію, які можуть бути

застосовані також в присутності каталізаторів переносу фаз, таких як, наприклад, хлорид триетилбензиламонію, бромід тетрабутиламонію, Адоген 464 (хлорид метилтриалкіл(C_8-C_{10})амонію) або TDA 1 (трис-(метоксиетоксиетил)амін). Також можуть бути застосовані лужні метали, такі як натрій або калій. Крім того застосовують також аміді 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-бутилат калію.

Реакційні температури при здійсненні способу (G) згідно з винаходом можна варіювати у широких діапазонах. Загалом працюють при температурах від $0\text{ }^{\circ}\text{C}$ до $250\text{ }^{\circ}\text{C}$, переважно від $50\text{ }^{\circ}\text{C}$ до $150\text{ }^{\circ}\text{C}$.

Спосіб (G) згідно з винаходом доцільно здійснювати при нормальному тиску. При здійсненні способу (G) згідно з винаходом реакційні компоненти формули (IX) та основи депротонування загалом застосовують у приблизно еквімолярних кількостях. Однак можливо також той чи інший компонент застосовувати у надлишку (до 3 моль).

Спосіб (H- α) згідно з винаходом відрізняється тим, що гідразини формули (X) або солі цих сполук піддають взаємодії з галогенідами кетенової кислоти формули (VI) в присутності розріджувача та, в разі необхідності, в присутності акцептора кислоти.

Як розріджувач при здійсненні способу (H- α) згідно з винаходом можуть бути застосовані всі інертні органічні розчинники. Переважно застосовують, в разі необхідності, хлоровані вуглеводні, такі як, наприклад, мезитилен, хлорбензол та дихлорбензол, толуол, ксилол, а також етери, такі як дибутиловий етер, глікольдиметиловий етер, диглікольдиметиловий етер та дифенілетан, полярні розчинники, такі як диметилсульфоксид, сульфолан, диметилформамід або N-метилпіролідон.

Як акцептори кислоти при здійсненні способу (H- α) згідно з винаходом можуть бути застосовані всі звичайні акцептори кислоти.

Переважаю застосовують третинні аміни, такі як триетиламін, піридин, діазабіциклооктан (DABCO), діазабіциклоундекан (DBU), діазабіциклононен (DBN), основа Хюніга та N,N-диметиланілін.

Реакційні температури при здійсненні способу (H- α) згідно з винаходом можна варіювати у широких діапазонах. Загалом працюють при температурах від $0\text{ }^{\circ}\text{C}$ до $250\text{ }^{\circ}\text{C}$, переважно від $50\text{ }^{\circ}\text{C}$ до $220\text{ }^{\circ}\text{C}$.

Спосіб (H- α) згідно з винаходом доцільно здійснювати при нормальному тиску. При здійсненні способу (H- α) згідно з винаходом реакційні компоненти формул (VI) та (X), в яких A, D, W, X, Y та Z мають вказані вище значення та Hal означає галоген, та, в разі необхідності, акцептори кислоти загалом застосовують у приблизно еквімолярних кількостях. Однак можливо також той чи інший компонент застосовувати у надлишку (до 5 моль).

Спосіб (H- β) відрізняється тим, що гідразини формули (X) або солі цих сполук, в яких A та D мають вказані вище значення, піддають конденсації з малоновими естерами або амідями малонової кислоти формули (XI), в якій U, W, X, Y, Z та R^8

мають вказані вище значення, в присутності основи.

Як розріджувач при здійсненні способу (H- β) згідно з винаходом можуть бути застосовані всі інертні органічні розчинники. Переважно застосовують, в разі необхідності, галогеновані вуглеводні, такі як толуол, ксилол, мезитилен, хлорбензол та дихлорбензол, а також етери, такі дибутиловий етер, тетрагідрофуран, діоксан, дифеніловий етер, глікольдиметиловий етер та диглікольдиметиловий етер, полярні розчинники, такі як диметилсульфоксид, сульфолан, диметилформамід, диметилацетамід та N-метилпіролідон, а також спирти, такі як метанол, етанол, пропанол, ізопропанол, бутанол, ізобутанол та трет-бутанол.

Як основа (засіб депротонування) при здійсненні способу (H- β) згідно з винаходом можуть бути застосовані всі звичайні акцептори протонів. Переважаю застосовують оксиди, гідроксиди та карбонати лужних та лужноземельних металів, такі як гідроксид натрію, гідроксид калію, оксид магнію, оксид кальцію, карбонат натрію, карбонат калію та карбонат кальцію, які також можуть бути застосовані в присутності каталізаторів переносу фаз, таких як, наприклад, хлорид триетилбензиламонію, бромід тетрабутиламонію, Адоген 464 (= хлорид метилтриалкіл(C_8-C_{10})амонію) або TDA 1 (= трис-(метоксиетоксиетил)амін). Також можуть бути застосовані лужні метали, такі як натрій або калій. Крім того застосовують також аміді 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-бутилат калію.

Переважаю застосовують третинні аміни, такі як триетиламін, піридин, діазабіциклооктан (DABCO), діазабіциклоундекан (DBU), діазабіциклононен (DBN), основа Хюніга та N,N-диметиланілін.

Реакційні температури при здійсненні способу (H- β) згідно з винаходом можна варіювати у широких діапазонах. Загалом працюють при температурах від $0\text{ }^{\circ}\text{C}$ до $280\text{ }^{\circ}\text{C}$, переважно від $50\text{ }^{\circ}\text{C}$ до $180\text{ }^{\circ}\text{C}$.

Спосіб (H- β) згідно з винаходом доцільно здійснювати при нормальному тиску. При здійсненні способу (H- β) згідно з винаходом реакційні компоненти формул (XI) та (X) загалом застосовують у приблизно еквімолярних кількостях. Однак можливо також той чи інший компонент застосовувати у надлишку (до 3 моль).

Спосіб (H- γ) відрізняється тим, що сполуки формули (XII), в якій A, D, W, X, Y, Z та

R^8 мають вказані вище значення, піддають внутрішньомолекулярному конденсації в присутності основи.

Як розріджувач при здійсненні способу (H- γ) згідно з винаходом можуть бути застосовані всі інертні органічні розчинники. Переважно застосовують вуглеводні, такі як толуол та ксилол, а також етери, такі дибутиловий етер, тетрагідрофуран, діоксан, глікольдиметиловий етер та диглікольдиметиловий етер, полярні розчинники, такі як диметилсульфоксид, сульфолан, диметилформамід та N-метилпіролідон, а також спирти, такі як метанол,

етанол, пропанол, ізопропанол, бутанол, ізобутанол та трет-бутанол.

Як основа (засіб депротонування) при здійсненні способу (H-γ) згідно з винаходом можуть бути застосовані всі звичайні акцептори протонів. Переважно застосовують оксиди, гідроксиди та карбонати лужних та лужноземельних металів, такі як гідроксид натрію, гідроксид калію, оксид магнію, оксид кальцію, карбонат натрію, карбонат калію та карбонат кальцію, які також можуть бути застосовані в присутності каталізаторів переносу фаз, таких як, наприклад, хлорид триетилбензиламонію, бромід тетрабутиламонію, Адоген 464 (= хлорид метилтриалкіл(C₈-C₁₀)амонію) або TDA 1 (= трис-(метоксietоксиетил)амін). Також можуть бути застосовані лужні метали, такі як натрій або калій. Крім того застосовують 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.

Реакційні температури при здійсненні способу (H-γ) згідно з винаходом можна варіювати у широких діапазонах. Загалом працюють при температурах від -20 °C до 250 °C, переважно від 50 °C до 150 °C.

Спосіб (H-γ) згідно з винаходом доцільно здійснювати при нормальному тиску.

При здійсненні способу (H-γ) згідно з винаходом реакційні компоненти формули (XII) та основу депротонування загалом застосовують у приблизно еквімолярних кількостях. Однак можливо також той чи інший компонент застосовувати у надлишку (до 3 моль).

Спосіб (I-α) відрізняється тим, що сполуки формул (I-1-a) - (I-8-a) піддають взаємодії з галогенідами карбонової кислоти формули (XIII), в разі необхідності, в присутності розріджувача та, в разі необхідності, в присутності агента, що зв'язує кислоту.

Як розріджувач у способі (I-α) згідно з винаходом застосовують всі інертні по відношенню до галогенідів кислоти розчинники. Переважно застосовують вуглеводні, такі як бензин, бензол, толуол, ксилол та тетралін, а також галогенвуглеводні, такі як метиленхлорид, хлороформ, тетрахлорвуглець, хлорбензол та о-дихлорбензол, кетони, такі як ацетон та метилізопропілкетон, етери, такі як діетиловий етер, тетрагідрофуран та діоксан, а також естери карбонових кислот, такі як етилацетат, та сильнополярні розчинники, такі як диметилсульфоксид та сульфолан. Якщо гідролітична стійкість дозволяє, то взаємодію можна здійснювати також в присутності води.

Як агенти, що зв'язують кислоту, при здійсненні взаємодії згідно зі способом (I-α) можуть бути застосовані всі звичайні акцептори кислоти. Переважно застосовують третинні аміни, такі як триетиламін, піридин, діазабіциклооктан (DABCO), діазабіциклоундецен (DBU), діазабіциклононен (DBN), основа Хюніга та N,N-диметиланілін, а також оксиди лужноземельних металів, такі як оксид магнію та оксид кальцію, карбонати лужних та лужноземельних металів, такі як карбонат натрію, карбонат калію та карбонат кальцію, а також гідро-

ксиди лужних металів, такі як гідроксид натрію та гідроксид калію.

Реакційні температури при здійсненні способу (I-α) згідно з винаходом можна варіювати у широких діапазонах. Загалом працюють при температурах від -20 °C до +150 °C, переважно від 0 °C до 100 °C.

При здійсненні способу (I-α) згідно з винаходом вихідні речовини формул (I-1-a) - (I-8-a) та галогенід карбонової кислоти формули (XIII) загалом застосовують у приблизно еквімолярних кількостях. Однак можливо також галогенід карбонової кислоти застосовувати у надлишку (до 5 моль). Обробку здійснюють звичайними методами.

Спосіб (I-β) відрізняється тим, що сполуки формул (I-1-a) - (I-8-a) піддають взаємодії з ангідридами карбонової кислоти формули (XIV), в разі необхідності, в присутності розріджувача та, в разі необхідності, в присутності агента, що зв'язує кислоту. Як розріджувач при здійсненні способу (I-β) згідно з винаходом переважно застосовують ті розріджувачі, які застосовують при використанні галогенідів кислот. Загалом застосований у надлишку ангідрид карбонової кислоти одночасно може бути розріджувачем.

В разі необхідності, застосовуваними у способі (I-β) згідно з винаходом агентами, що зв'язують кислоту, є переважно ті агенти, що зв'язують кислоту, які застосовують при використанні галогенідів кислот.

Реакційні температури при здійсненні способу (I-β) згідно з винаходом можна варіювати у широких діапазонах. Загалом працюють при температурах від -20 °C до +150 °C, переважно від 0 °C до 100 °C.

При здійсненні способу (I-β) згідно з винаходом вихідні речовини формул (I-1-a) - (I-8-a) та ангідрид карбонової кислоти формули (XIV) загалом застосовують у приблизно еквімолярних кількостях. Однак можливо також галогенід карбонової кислоти застосовувати у надлишку (до 5 моль). Обробку здійснюють звичайними методами.

Загалом виходять із того, що розріджувач та наявний у надлишку ангідрид карбонової кислоти, а також карбонову кислоту, що утворюється, видаляють шляхом дистиляції або промивання органічним розчинником або водою.

Спосіб (J) відрізняється тим, що сполуки формул (I-1-a) - (I-8-a) піддають взаємодії з естерами або тіоестерами хлормурашиної кислоти формули (XV), в разі необхідності, в присутності розріджувача та, в разі необхідності, в присутності агента, що зв'язує кислоту. Як агент, що зв'язує кислоту, при здійсненні взаємодії за способом (J) згідно з винаходом можуть бути застосовані всі звичайні акцептори кислоти. Переважно застосовують третинні аміни, такі як триетиламін, піридин, DABCO, DBU, DBA, основа Хюніга та N,N-диметиланілін, а також оксиди лужноземельних металів, такі як оксид магнію та оксид кальцію, карбонати лужних та лужноземельних металів, такі як карбонат натрію, карбонат калію та карбонат кальцію, а також гідроксиди лужних металів, такі як гідроксид натрію та гідроксид калію.

Як розріджувач при здійсненні способу (J) згідно з винаходом можуть бути застосовані всі розчинники, інертні по відношенню до естерів або тіоестерів хлормурашиної кислоти. Переважно застосовують вуглеводні, такі як бензин, бензол, толуол, ксилол та тетралін, а також галогенвуглеводні, такі як метиленхлорид, хлороформ, тетрахлорвуглець, хлорбензол та о-дихлорбензол, а також кетони, такі як ацетон та метилізопропілкетон, етери, такі як діетиловий етер, тетрагідрофуран та діоксан, естери карбонових кислот, такі як етилацетат, та сильнополярні розчинники, такі як диметилсульфоксид та сульфолан.

Реакційні температури при здійсненні способу (J) згідно з винаходом можна варіювати у широких діапазонах. Загалом працюють при температурах від -20 °C до +100 °C, переважно від 0 °C до 50 °C.

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

При здійсненні способу (J) згідно з винаходом вихідні речовини формул (I-1-a) - (I-8-a) та відповідні естери або тіоестери хлормурашиної кислоти формули (XIII) загалом застосовують у приблизно еквімолярних кількостях. Однак можливо також той чи інший компонент застосовувати у надлишку (до 2 моль). Обробку здійснюють звичайними методами. Загалом виходять із того, що сіль, яка випадає в осад, та реакційну суміш, що залишилася, концентрують відгонкою розріджувача.

Спосіб (K) згідно з винаходом відрізняється тим, що сполуки формул (I-1-a) - (I-8-a) піддають взаємодії зі сполуками формули (XVI) в присутності розріджувача та, в разі необхідності, в присутності агента, що зв'язує кислоту.

При здійсненні способу (K) на моль вихідної сполуки формул (I-1-a) - (I-8-a) застосовують приблизно 1 моль естеру хлормонотіомурашиної або хлордитіомурашиної кислоти формули (XVI) при температурі від 0 до 120 °C, переважно від 20 до 60 °C.

Як, в разі необхідності, застосовуваний розріджувач використовують всі інертні полярні органічні розчинники, такі як етери, аміді, сульфони, сульфоксиди, а також галогеналкени.

Переважаю застосовують диметилсульфоксид, тетрагідрофуран, диметилформамід або метиленхлорид.

Якщо у переважній формі виконання шляхом додавання сильного засоба депротонування, такого як, наприклад, гідрид натрію або трет-бутилат калію, одержують енольну сіль сполук формул (I-1-a) - (I-8-a), то від подальшого додавання агента, що зв'язує кислоту, можна відмовитись.

Якщо застосовують агент, що зв'язує кислоту, то як такий придатними є звичайні неорганічні або органічні основи, наприклад, гідроксид натрію, карбонат натрію, карбонат калію, піридин, триетиламін.

Реакцію можна здійснювати при нормальному або підвищеному тиску, переважно при нормальному тиску. Обробку здійснюють звичайними методами.

Спосіб (L) згідно з винаходом відрізняється тим, що сполуки формул (I-1-a) - (I-8-a) піддають взаємодії з хлоридами сульфонової кислоти фор-

мули (XVII), в разі необхідності, в присутності розріджувача та, в разі необхідності, в присутності агента, що зв'язує кислоту.

При здійсненні способу одержання (L) згідно з винаходом на моль вихідної сполуки формули (I-1-a) - (I-8-a) застосовують приблизно 1 моль хлориду сульфонової кислоти формули (XVII) при температурі від -20 до 150 °C, переважно від 20 до 70 °C.

Як, в разі необхідності, застосовуваний розріджувач придатними є всі інертні полярні органічні розчинники, такі як етери, аміді, нітрили, сульфони, сульфоксиди або галогеновані вуглеводні, такі як метиленхлорид.

Переважаю застосовують диметилсульфоксид, тетрагідрофуран, диметилформамід, метиленхлорид.

Якщо у переважній формі виконання шляхом додавання сильного засоба депротонування (наприклад, гідрид натрію або трет-бутилат калію) одержують енольну сіль сполук формул (I-1-a) - (I-8-a), то від подальшого додавання агента, що зв'язує кислоту, можна відмовитись.

Якщо застосовують агент, що зв'язує кислоту, то як такий придатними є звичайні неорганічні або органічні основи, наприклад, гідроксид натрію, карбонат натрію, карбонат калію, піридин, триетиламін.

Реакцію можна здійснювати при нормальному або підвищеному тиску, переважно при нормальному тиску. Обробку здійснюють звичайними методами.

Спосіб (M) згідно з винаходом відрізняється тим, що сполуки формул (I-1-a) - (I-8-a) піддають взаємодії зі сполуками фосфору формули (XVIII), в разі необхідності, в присутності розріджувача та, в разі необхідності, в присутності агента, що зв'язує кислоту.

При здійсненні способу (M) для одержання сполук формул (I-1-a) - (I-8-a) на 1 моль сполук формул (I-1-a) - (I-8-a) застосовують від 1 до 2, переважно від 1 до 1,3 моль сполук фосфору формули (XVIII) при температурі від -40 °C до 150 °C, переважно від -10 до 110 °C.

Як, в разі необхідності, застосовуваний розріджувач придатними є всі інертні полярні органічні розчинники, такі як етери, аміді, нітрили, спирти, сульфіді, сульфони, сульфоксиди і т.д.

Переважаю застосовують ацетонітрил, диметилсульфоксид, тетрагідрофуран, диметилформамід, метиленхлорид.

Як, в разі необхідності, застосовуваний агент, що зв'язує кислоту, придатними є звичайні неорганічні або органічні основи, такі як гідроксиди, карбонати або аміни, наприклад, гідроксид натрію, карбонат натрію, карбонат калію, піридин, триетиламін.

Взаємодію можна здійснювати при нормальному або підвищеному тиску, переважно при нормальному тиску. Обробку здійснюють звичайними методами органічної хімії. Кінцевий продукт очищують переважно шляхом кристалізації, хроматографічного очищення або так званої "відгонки", тобто видалення летких компонентів у вакуумі.

Спосіб (N) відрізняється тим, що сполуки формул (I-1-a) - (I-8-a) піддають взаємодії з гідроксида-

ми або алкоксидами металів формули (XIX) або амінами формули (XX), в разі необхідності, в присутності розріджувача.

Як розріджувач при здійсненні способу (N) згідно з винаходом можуть бути застосовані переважно етери, такі як тетрагідрофуран, діоксан, діетиловий етер, а також спирти, такі як метанол, етанол, ізопропанол, та вода.

Спосіб (N) згідно з винаходом загалом здійснюють при нормальному тиску. Реакційні температури загалом становлять від -20°C до 100°C , переважно від 0°C до 50°C .

Спосіб (O) згідно з винаходом відрізняється тим, що сполуки формул (I-1-a) - (I-8-a) піддають взаємодії (O- α) зі сполуками формули (XXI), в разі необхідності, в присутності розріджувача та, в разі необхідності, в присутності каталізатора або (O- β) зі сполуками формули (XXII), в разі необхідності, в присутності розріджувача та, в разі необхідності, в присутності агента, що зв'язує кислоти.

При здійсненні способу (O- α) на моль вихідної сполуки формул (I-1-a) - (I-8-a) застосовують приблизно 1 моль ізоціанату формули (XXI) при температурі від 0 до 100°C , переважно від 20 до 50°C .

Як, в разі необхідності, застосовуваний розріджувач придатними є всі інертні органічні розчинники, такі як етери, амідни, нітрили, сульфони, сульфоксиди.

В разі необхідності, можуть бути застосовані каталізатори для уповільнення реакції. Придатними каталізаторами є переважно оловоорганічні сполуки, такі як дибутил-оловодилаурат. Працюють переважно при нормальному тиску.

При здійсненні способу (O- β) на моль вихідної сполуки формул (I-1-a) - (I-8-a) застосовують приблизно 1 моль хлориду карбамідної кислоти формули (XXII) при температурі від -20 до 150°C , переважно від 0 до 70°C .

Як, в разі необхідності, застосовуваний розріджувач придатними є всі інертні полярні органічні розчинники, такі як етери, амідни, сульфони, сульфоксиди або галогеновані вуглеводні.

Переважно застосовують диметилсульфоксид, тетрагідрофуран, диметилформамід або метиленхлорид.

Якщо у переважній формі виконання шляхом додавання сильного засобу депротонування (наприклад, гідрид натрію або трет-бутилат калію) одержують енольну сіль сполук формул (I-1-a) - (I-8-a), то від подальшого додавання агента, що зв'язує кислоту, можна відмовитись.

Якщо застосовують агент, що зв'язує кислоту, то як такий придатними є звичайні неорганічні або органічні основи, наприклад, гідроксид натрію, карбонат натрію, карбонат калію, піридин, триетиламін.

Реакцію можна здійснювати при нормальному або підвищеному тиску, переважно при нормальному тиску. Обробку здійснюють звичайними методами.

Спосіб (P) відрізняється тим, що сполуки формули (1-1') - (I-8'), в яких A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ та R' мають вказані вище значення та Z означає галоген, особливо переважно бром, піддають реакції сполучення з

NN-гетероциклами формули (XXIII) в якій Z має вказані вище значення, в присутності солі міді та в присутності основи (J. Am. Chem. Soc. 2001, 123, 7729-29; WO 02-85 838; Synlett 2002, 3,423-30).

Як розріджувач при здійсненні способу (P) згідно з винаходом застосовують наприклад, в разі необхідності, галогеновані аліфатичні, аліциклічні або ароматичні вуглеводні, такі, наприклад, як бензин, бензол, толуол, ксилол, петролейний етер, гексан, циклогексан, хлорбензол, дихлорбензол, етери, такі як діетиловий етер, діізопропіловий етер, діоксан, тетрагідрофуран або етиленгліколь-диметиловий або -діетиловий етер; амідни, такі як, наприклад, N,N-диметилформамід, N,N-диметилацетамід, N-метилформанлід, N-метилпіролідон або триамід гексаметилфосфорної кислоти; естери, такі як метиловий або етиловий естер оцтової кислоти, або суміші цих розчинників. Перевагу надають N,N-диметилформаміду.

Як основи при здійсненні способу (P) згідно з винаходом можуть бути застосовані карбонати, алкогولاتи, фосфати, фториди та/або гідроксиди лужних та/або лужноземельних металів, причому перевагу надають карбонату калію, карбонату натрію, карбонату цезію, гідрокарбонату цезію, метилату натрію, трет-бутилату калію, амілату калію, фториду цезію, фосфату калію та гідроксиду барію. Особливу перевагу надають карбонату калію, карбонату натрію, карбонату цезію та/або гідрокарбонату цезію. Найбільшу перевагу надають карбонату калію.

Основи можуть також бути застосовані в присутності каталізаторів переносу фаз, таких як, наприклад, хлорид триетилбензиламонію, бромід тетрабутиламонію або TDA 1 (= трис-(метоксиетоксиетил)амін).

Як солі міді при здійсненні способу (P) згідно з винаходом застосовують солі міді (I), наприклад, CuJ.

Крім того спосіб (P) можна також здійснювати в присутності додаткових допоміжних основ, таких як діаміни, наприклад, етилендіамін, пропілендіамін, 1,2-діаміноциклогексан.

Реакційні температури при здійсненні способу (P) згідно з винаходом можна варіювати у широких діапазонах. Загалом працюють при температурах від 0°C до 250°C , переважно від 30 до 200°C , особливо переважно від 50 до 150°C .

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

При здійсненні способу (P) згідно з винаходом реакційні компоненти формул (I-1') - (I-8') та (XXIII) загалом застосовують у приблизно еквімолярних кількостях. Однак можливо також той чи інший компонент застосовувати у надлишку (до 3 моль). Основи застосовують загалом у молярному співвідношенні від 1:1 до 10:1, переважно від 2:1 до 5:1. Солі міді застосовують загалом у молярному співвідношенні від 0,01:1 до 1:1, переважно від 0,05:1 до 0,5:1.

Спосіб Q відрізняється тим, що сполуки формули (XXXII-a), в якій W, X, Y та R⁸ мають вказані вище значення та Z означає галоген, особливо переважно бром, піддають реакції сполучення з NN-гетероциклами формули (XXIII) в якій Z має

вказані вище значення, в присутності основи та в присутності солі міді (J. Am. Chem. Soc. 2001, 123, 7729-29; WO 02-85 838; Synlett 2002, 3,423-30).

Як розріджувач при здійсненні способу (Q) згідно з винаходом застосовують наприклад, в разі необхідності, галогеновані аліфатичні, аlicиклічні або ароматичні вуглеводні, такі, наприклад, як бензин, бензол, толуол, ксилол, петролейний етер, гексан, циклогексан, хлорбензол, дихлорбензол, етери, такі як діетиловий етер, діізопропіловий етер, діоксан, тетрагідрофуран або етиленгліколь-диметиловий або -діетиловий етер; амід, такі як, наприклад, N,N-диметилформамід, N,N-диметилацетамід, N-метилформанлід, N-метилпіролідон або триамід гексаметилфосфорної кислоти; естери, такі як метиловий або етиловий естер оцтової кислоти, або суміші цих розчинників. Перевагу надають N,N-диметилформамід.

Як основи при здійсненні способу (Q) згідно з винаходом можуть бути застосовані карбонати, алкоголяти, фосфати, фториди та/або гідроксиди лужних та/або лужноземельних металів, причому перевагу надають карбонату калію, карбонату натрію, карбонату цезію, гідрокарбонату цезію, метилату натрію, трет-бутилату калію, амілату калію, фториду цезію, фосфату калію та гідроксиду барію. Особливу перевагу надають карбонату калію, карбонату натрію, карбонату цезію та/або гідрокарбонату цезію.

Найбільшу перевагу надають карбонату калію.

Основи можуть також бути застосовані в присутності каталізаторів переносу фаз, таких як, наприклад, хлорид триетилбензиламонію, бромід тетрабутиламонію або TDA 1 (=трис-(метоксиетоксиетил)амін).

Як солі міді при здійсненні способу (Q) згідно з винаходом застосовують солі міді (I), наприклад, CuJ.

Крім того спосіб (Q) можна також здійснювати в присутності додаткових допоміжних основ, таких як діаміни, наприклад, етилендіамін, пропілендіамін, 1,2-діаміноциклогексан.

Реакційні температури при здійсненні способу (Q) згідно з винаходом можна варіювати у широких діапазонах. Загалом працюють при температурах від 0 °C до 250 °C, переважно від 30 до 200 °C, особливо переважно від 50 до 150 °C.

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

При здійсненні способу (Q) згідно з винаходом реакційні компоненти формул (XXXII-a) та (XXIII) загалом застосовують у приблизно еквімолярних кількостях. Однак можливо також той чи інший компонент застосовувати у надлишку (до 3 моль). Основи застосовують загалом у молярному співвідношенні від 1:1 до 10:1, переважно від 2:1 до 5:1. Солі міді застосовують загалом у молярному співвідношенні від 0,01:1 до 1:1, переважно від 0,05:1 до 0,5:1.

Активні речовини при гарній сумісності з рослинами та вигідній побічній токсичності по відношенню до теплокровних тварин є придатними для боротьби із тваринними шкідниками, зокрема комахами, павуками та нематодами, що наносять шкоду в сільському господарстві, лісах, при збе-

реженні запасів та захисті матеріалів, а також у побутовому секторі. Дані активні речовини переважно застосовують як засоби захисту рослин. Вони ефективні по відношенню до звичайних чутливих та стійких видів, а також на всіх або окремих стадіях розвитку. До зазначених вище 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, *Scutigera immaculate*.

3 ряду щетинохвостки, наприклад, *Lepisma saccharina*.

3 ряду ногохвостки, наприклад, *Onychiurus armatus*.

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

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

3 ряду шкірокрилі, наприклад, *Forficula auricularia*.

3 ряду терміти, наприклад, *Reticulitermes* spp.

3 ряду воші, наприклад, *Pediculus humanus corporis*, *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 quadrata*, *Cimex lectularius*, *Rhodnius prolixus*, *Triatoma* spp.

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

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

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

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

Сполуки згідно з винаходом або комбінації активних речовин, в разі необхідності, у визначеній концентрації або нормі витрати також можуть бути застосовані як гербіциди. Їх, в разі необхідності, також застосовують як проміжні або вихідні продукти для синтезу інших активних речовин.

Згідно з винаходом можна обробляти всі рослини або частини рослин. Під рослинами при цьому розуміють всі рослини та популяції рослин, як бажані і небажані дикоростучі рослини або культурні рослини (включаючи, культурні рослини природного походження). Культурними можуть бути рослини, які можна одержати звичайними методами культивування та оптимізації або біотехнологічними методами та методами генної інженерії або комбінацією цих методів, включаючи трансгенні рослини та сорти рослин, що захищаються або не захищаються законом про охорону нових сортів рослин. Під частинами рослин слід розуміти всі

надземні та підземні частини та органи рослин, такі як парость, лист, квітка та корінь, причому слід назвати, наприклад, листи, голки, стебла, стовбури, квіти, плодові тіла, плоди та насіння, а також корені, бульби та ризоми. До частин рослин належить також зібраний врожай та вегетативний і генеративний матеріал для розмноження, наприклад, черешки, бульби, ризоми, відводки та насіння.

Згідно з винаходом обробку рослин та частин рослин активними речовинами або комбінаціями активних речовин здійснюють безпосередньо або шляхом впливу на їх оточення, середовище їх росту або закрите сховище відповідно до звичайних методів обробки, наприклад, шляхом занурення, мікрокрапельного обприскування, розбризкування, випару, створення штучного туману, розкидання, намазування, а у випадку матеріалу для розмноження, особливо у випадку насіння, шляхом одношарового або багатшарового покриття.

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

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

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

Як тверді носії мають на увазі:

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

воруючі засоби мають на увазі: наприклад, неіоногенні та аніонні емульгатори, такі як поліоксietenіловий естер жирної кислоти, поліоксietenіловий 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 препаративних формах можуть бути застосовані речовини, що поліпшують адгезію, такі як карбоксиметилцеллюлоза, природні та синтетичні порошкоподібні, зернисті або латексоподібні полімери, такі як гуміарабік, полівініловий спирт, полівінілацетат, а також природні фосфоліпіди, такі як кефаліни та лецитини, та синтетичні фосфоліпіди. Іншими добавками можуть бути мінеральні масла та рослинні олії.

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

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

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

Для змішування застосовують, наприклад, такі сполуки:

Фунгіциди:

2-фенілфенол; 8-гідроксигінолінсульфат; ацибензолар-S-метил; алдиморф; амідифлумет; ампропілфос; ампропілфос-калій; андоприм; анілазини; азаконазоли; азоксистробін; беналаксил; беноданіл; беноміл; бентівалікарб-ізопропіл; бензамакрил; бензамакрил-ізобутил; біалафос; бінапакрил; біфеніл; бітертанол; бластицидин-S; бромконазоли; бупіримати; бутіобати; бутиламіни; полісульфід кальцію; капсимицин; каптафол; каптан; карбендазим; карбоксин; карпропамід; карвоні; хінометонат; хлобензтіазони; хлорфеназоли; хлоронеб; хлороталоніл; хлосолінати; клозилаконт; ціазофамід; цифлуфенамід; цимоксаніл; ципроконазоли; ципродиніл; ципрофурам; Dagger G; дебаккарб; дихлофлуанід; дихлони; дихлорофен; диклоцимет; дикломезини; диклоран; діетофенкарб; дифенокназоли; дифлуметорим; диметиримол; диметоморф; димоксистробін; диніконазоли; диніконазол-M; динокап; дифеніламіни; дипіритіони; диталімфос; дитіанони; додини; дразоксолон; едифенфос; епоксиконазоли; етабоксам; етиримол; етридіазоли; фамоксадони; фенамідони; фенапаніл; фенаримол; фенбуконазоли; фенфурам; фенгексамід; фенітропан; феноксаніл; фенпиклоліл; фенпропідин; фенпропіморф; фербам; флуа-

зинам; флубензіміни; флудіоксоніл; флуметовер; флуморф; фтороміди; флуокастробін; флухінконазоли; флурпримідол; флузілазоли; флусульфаміди; флутоланіл; флутриафол; фолпет; фозетилалюміній; фозетил-натрій; фуберидазоли; фуралаксил; фураметпір; фуркарбаніл; фурмециклокс; гуазатини; гексахлорбензоли; гексаконазоли; гімексазол; імазаліл; імібенконазоли; іміноктадинетриацетати; іміноктадин-трис(альбесилати); йодокарб; іпконазоли; іпробенфос; іпродіони; іпровалікарб; ірумаміцин; ізопротіолони; ізоваледіони; касугаміцин; крезоксим-метил; манкозеб; манеб; мефери-мзони; мепаніпирим; мепроніл; металаксил; металаксил-M; метконазоли; метасульфоккарб; метфуроксам; метирам; метоміностробін; метсульфовакс; мілдіоміцин; миклобутаніл; міклозолін; натаміцин; нікобіфен; нітротал-ізопропіл; новіфлумурон; нуаримол; офурак; оризастробін; оксациксил; оксолінова кислота; окспоконазоли; оксикарбоксин; оксифентіїн; паклобутразол; пефуразоати; пенконазоли; пенцикурон; фосдифен; фталіди; пікоксистробін; піпералін; поліоксини; поліоксорим; пробеназоли; прохлораз; процимідони; пропамоккарб; пропанозин-натрій; пропиконазоли; пропінеб; прохіназид; протіоконазоли; піраклостробін; піразофос; пірифенокс; піриметаніл; пірохілон; піроксифур; піролінітрини; хінконазоли; хіноксифен; хінтоцени; симеконазоли; спіроксаміни; сульфур; тебуконазоли; теклофталам; текназени; тетциклацис; тетраконазоли; тіабендазоли; тиціофен; тифлузаміди; тіофанат-метил; тирам; тіоксимід; толклофос-метил; толілфлуанід; триадимефон; триадименол; триазбутил; триазоксиди; трицикламіди; трициклазоли; тридеморф; трифлуксис-тробін; трифлумізоли; трифорини; тритіконазоли; уніконазоли; валідаміцин А; вінклозолін; зинеб; зирам; зоксаміди; (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-хлорофеніл)-2-пропініл]окси]-3-метоксибеніл]етил]-3-метил-2-[(метилсульфоніл)аміно]-бутанаміди; 1-(1-нафталеніл)-1Н-пірол-2,5-діоні; 2,3,5,6-тетрахлоро-4-(метилсульфоніл)-піридини; 2-аміно-4-метил-N-феніл-5-триазолкарбоксаміди; 2-хлоро-N-(2,3-дигідро-1,1,3-триметил-1Н-інден-4-іл)-3-піридинкарбоесаміди; 3,4,5-трихлоро-2,6-піридиндикарбонітрили; актиновати; цис-1-(4-хлорфеніл)-2-(1Н-1,2,4-триазол-1-іл)-циклопентанол; метил 1-(2,3-дигідро-2,2-диметил-1Н-інден-1-іл)-1Н-імідазол-5-карбоксилати; карбонат монокалію; N-(6-метокси-3-піридиніл)циклопропанкарбоксаміди; N-бутил-8-(1,1-диметилетил)-1-оксаспіро[4.5]декан-3-аміни; тетратіокарбонат натрію;

а також солі міді та сполуки із міді, такі як бордоська суміш; гідроксиди міді; нафтенати міді; оксихлориди міді; сульфати міді; куфранеб; оксиди міді; оксин-мідь.

Бактеріциди:

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, ABG-9008, ацефати, ацехіноцил, ацетаміпрід, ацетопролі, акринатрин, AKD-1022,

AKD-3059, AKD-3088, аланікарб, алдікарб, алдоксикарб, алетрин, альфа-циперметрин (альфаметрин), амідифлумет, амінокарб, амітраз, авермектин, AZ 60541, азадирахтин, азаметифос, азинфос-метил, азинфос-етил, азоциклотин,

Bacillus popilliae, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus subtilis*, *Bacillus thuringiensis*, *Bacillus thuringiensis* штам EG-2348, *Bacillus thuringiensis* штам GC-91, *Bacillus thuringiensis* штам NCTC-11821, *Baculo* віруси, *Beauveria bassiana*, *Beauveria tenella*, бенклотіаз, бендіокарб, бенфуракарб, бенсультап, бензоксимати, бетацифлутрин, бетациперметрин, біфеназати, біфентрин, бінапакрил, біоалетрин, S-циклопентиловий ізомер біоалетрину, біоетанометрин, біоперметрин, біорезметрин, бістрифлурон, BPMC, брофенпрокс, бромфос-етил, бромпропілати, бромфенвінфос (-метил), BTG-504, BTG-505, буфенкарб, бупрофецин, бутатіофос, бутоксикарбоксим, бутоксикарбоксим, бутилпіридабен, кадусафос, камфехлор, карбарил, карбофуран, карбофенотіон, карбосульфат, картап, CGA-50439, хінометонат, хлордани, хлордимеформ, хлоетокарб, хлоретоксифос, хлорфенапір, хлорфенвінфос, хлофлазулон, хлормефос, хлоробензилати, хлоропікрин, хлорпроксифен, хлорпірифос-метил, хлорпірифос-етил, хловапортрин, хромафенозиди, цис-циперметрин, цис-резметрин, цис-перметрин, клоцитрин, клоетокарб, клофентезини, клотіанідини, клотіазобен, кодлемони, кумафос, ціанофенфос, ціанофос, циклопрени, циклопротрин, *Cydia pomonella*, цифлутрин, цигалотрин, цигексатин, циперметрин, цифенотрин (1R-транс-ізомер), циромазини,

DDT, дельтаметрин, деметон-S-метил, деметон-S-метилсульфон, діафентіурон, діаліфос, діазинон, дихлофентіон, дихлорвос, дикофол, дикротифос, дицикланіл, дифлубензулон, димефлутрин, диметоати, диметилвінфос, динобутон, динокап, динотефуран, діофенолан, дисульфотон, докузатнатрій, дофенапір, DOWCO-439,

ефлузиланати, емаметрин, емаметринбензоат, емпентрин (1R-ізомер), ендосульфат, *Entomophthora* spp., EPN, есфенвалерати, етіофенкарб, етіпроли, етіон, етіпрофос, етіофенпрокс, етоксазоли, етримфос,

фамфур, фенаміфос, феназахін, фенбутатин оксиди, фенфлутрин, фенітротіон, фенобукарб, фенотіокарб, феноксакрим, феноксикарб, фенпропатрин, фенпірад, фенпіритрин, фенпіроксимати, фенсульфотіон, фентіон, фентрифланіл, фенвалерати, фіпроніл, флонікамід, флуакрипірим, флуазулон, флубензіміни, флуброцитринати, флуциклоксурон, флуцитринати, флуфенерим, флуфеноксурон, флуфенпрокс, флуметрин, флупіразофос, флутензини (флуфензини), флувалінати, фонофос, форметанати, формотіон, фосметилан, фостіазати, фубфенпрокс (флурпроксифен), фураціокарб,

гама-цигалотрин, гама-HCH, Gossypulure, Grandlure, гранулоподібні віруси, галфенпрокс, галфенозиди, HCH, HCN-801, гептенофос, гексафлумурон, гексилтіазокс, гідрометилнони, гідропрени,

ІКА-2002, імідаклопрід, іміпротрин, індоксакарб, йодофенфос, іпробенфос, ізазофос, ізофенфос, ізопрокарб, ізоксатіон, івермектин,

Japonilure,

Кадетрин, віруси поліедрозу, кінопрени, ламбда-цигалотрин, ліндани, луфенурон,

малатіон, мекарбам, месульфенфос, метальдегід, метамнатрій, метакрифос, метамідофос, *Metharhizium anisopliae*, *Metharhizium flavoviride*, метидатіон, метіокарб, метоміл, метопрени, метоксиклор, метоксифенозиди, метофлутрин, метолкарб, метоксидіазони, мевінфос, мілбемектин, мілбеціцин, MKI-245, MON-45700, монокротофос, моксидектин, MTI-800,

налед, NC-104, NC-170, NC-184, NC-194, NC-196, ніклозаміди, нікотини, нитенпірам, нітіазини, NNI-0001, NNI-0101, NNI-0250, NNI-9768, новалурон, новіфлумурон,

OK-5101, OK-5201, OK-9601, OK-9602, OK-9701, OK-9802, ометоати, оксаміл, оксидеметонметил,

Raecilomyces fumosoroseus, паратіон-метил, паратіон (-етил), перметрин (цис-, транс-), нафта, PH-6045, фенотрин (1R-транс-ізомер), фентоати, форати, фозалони, фозмет, фосфамідон, фосфокарб, фоксим, піпероніл-бутоксоксиди, піримікарб, піриміфос-метил, піриміфос-етил, олеати калію, пралетрин, профенофос, профлутрин, промеккарб, пролафос, пропаргіти, пропетафос, пропексур, протіофос, протоати, протрифенбути, піметрозини, піраклофос, пірезметрин, піретрум, піридабен, піридаліл, піридафентіон, піридатіон, піримідифен, пірипроксифен,

хіналфос,

резметрин, RH-5849, рибавірин, RU-12457, RU-15525,

S-421, S-1833, салітіон, себуфос, SI-0009, силфлуофен, спіносад, спіродиклофен, спіромезифен, сульфлурамід, сульфотеп, сулпрофос, SZI-121,

тау-флувалінати, тебуфенозиди, тебуфенпірад, тебупіриміфос, тефлубензулон, тефлутрин, темефос, темівінфос, тербам, тербуфос, тетраклорвінфос, тетрадіфон, тетраметрин, тетраметрин (1R-ізомер), тетрасул, тета-циперметрин, тіаклопрід, тіаметоксам, тіапроніл, тіатрифос, тіоциклам гідрооксалати, тіодикарб, тіофанокс, тіометон, тіосултап-натрій, турингієнсин, толфенпірад, тралоцитрин, тралометрин, трансфлутрин, триаратени, триазамати, триазофос, триазулон, трихлофенідини, трихлорфон, *Trichoderma atroviride*, трифлумурон, триметаккарб,

вамідотіон, ваніліпроли, вербутин, *Verticillium lecanii*,

WL-108477, WL-40027,

YI-5201, YI-5301, YI-5302,

XMC, ксилілкарб,

ZA-3274, зета-циперметрин, золапрофос, ZXI-8901,

сполука 3-метилфенілпропілкарбамат (тсумачид Z),

сполука 3-(5-хлор-3-піридиніл)-8-(2,2,2-трифторетил)-8-азабіцикло[3.2.1]октан-3-карбонітрил (CAS-реєстр № 185982-80-3) та відпо-

відний 3-ендо-ізомер (CAS-реєстр № 185984-60-5) (див. WO-96/37494, WO-98/25923),

а також препарати, які містять активні рослинні екстракти, нематоди, грибки або віруси.

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

Крім того активні речовини при використанні як інсектициди можуть бути представлені у своїх комерційно доступних препаративних формах, а також у формах, одержаних із таких препаративних форм у суміші із синергічними агентами. Синергічними агентами є сполуки, які підвищують ефективність активних речовин, при цьому сам застосовуваний синергічний агент не повинен бути активним.

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

Застосування здійснюють звичайним способом, що підходить для таких форм. При застосуванні проти побутових шкідників та шкідників запасів активна речовина або комбінація активних речовин відрізняється сильною залишковою дією на деревах та глині, а також високою стабільністю по відношенню до лугів на вапнованих основах.

Як вже було зазначено вище, згідно з винаходом можна обробляти всі рослини та їх частини. У переважному варіанті здійснення обробляють види та сорти рослин, а також їх частини, вирощені або одержані за умов біологічного розведення, таких як схрещування або злиття протопластів. В іншому переважному варіанті здійснення обробляють трансгенні рослини та сорти рослин, одержані методами генної інженерії, в разі необхідності, у комбінації зі звичайними методами (генетично модифіковані організми) та їх частини. Поняття «частини» або «частини рослин» або «органи рослин» було пояснено вище.

Особливо переважно згідно з винаходом обробляють рослини відповідних комерційно доступних або зазвичай використовуваних сортів. Під сортами рослин розуміють рослини з визначеними властивостями (ознаками), які одержують умовним розведенням, мутагенезом або рекомбінантними методиками ДНК. Це можуть бути сорти, біотиipi та генотиipi.

Залежно від виду або сорту рослин, їх місцезнаходження та умов росту (ґрунт, клімат, період вегетації, харчування) в результаті обробки згідно з винаходом можуть спостерігатися нададитивні («синергічні») ефекти. Так, наприклад, можливе зниження кількості застосовуваних речовин та/або розширення спектру дії та/або посилення дії речовин та засобів, застосовуваних згідно з винаходом, також у комбінації з іншими агрохімічними активними речовинами, покращення росту культурних рослин, підвищена толерантність культурних рослин по відношенню до високих або низьких температур, підвищена толерантність до браку вологи або вмісту солей у воді або ґрунті, підвищена продуктивність при цвітінні, полегшення збору вро-

жаю, прискорення дозрівання, більш високий врожай, більш висока якість та/або більш висока поживність продуктів врожаю, краще збереження та/або краща здатність до перероблювання продуктів врожаю, що виходять за межі власне очікуваних ефектів.

До переважних трансгенних (одержаних з використанням генних технологій) рослин або сортів рослин згідно з винаходом належать всі рослини, які містять генетичний матеріал, модифікований за генною технологією, що додає цим рослинам особливо вигідні цінні властивості. Прикладами таких властивостей є кращий ріст рослин, підвищена толерантність по відношенню до високих або низьких температур, підвищена толерантність до браку вологи або до вмісту солей у воді або у ґрунті, підвищена продуктивність при цвітінні, полегшення збору врожаю, прискорення дозрівання, більш високий врожай, більш висока якість та/або більш висока поживність продуктів врожаю, більша тривалість збереження та/або краща здатність до переробки продуктів врожаю. До інших та особливо переважних прикладів таких властивостей належать підвищена стійкість рослин до тваринних шкідників та до мікроорганізмів, таких як комахи, кліщі, патогенні для рослин грибки, бактерії та/або віруси, а також підвищена толерантність рослин до певних гербіцидних активних речовин. Як приклади трансгенних рослин слід згадати важливі культурні рослини, такі як зернові (пшениця, рис), кукурудза, соя, картопля, бавовна, рапс, буряк, цукрова тростина, а також фруктові рослини (із плодами яблук, груш, плодами цитрусових та винограду), причому особливу перевагу надають кукурудзі, сої, картоплі, бавовні, тютюну та рапсу. До особливо переважних властивостей належать підвищена стійкість рослин до комах у зв'язку з токсинами, що утворюються в рослинах, особливо такими, які 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"). До особливо переважних властивостей належать також підвищена стійкість рослин по відношенню до грибів, бактерій та вірусів завдяки набутій системній стійкості (SAR), системіну, фітоалексину, еліциторам, а також генам резистентності та відповідно експериментованим протеїнам та токсинам. Крім того до особливо переважних властивостей належать також підвищена толерантність рослин по відношенню до певних гербіцидно активних речовин, наприклад, імідазолінів, сульфонілкарбамідів, гліфозатів або фосфінотрицину (наприклад, "PAT"-ген). Гени, що забезпечують бажані властивості, можуть зустрічатися в трансгенних рослинах в комбінаціях між собою. Прикладами "Бт. рослин" є сорти кукурудзи, бавовни, сої та картоплі, наявні у продажу під торговельними марками YIELD GARD® (наприклад, кукурудза, бавовна, соя), KnockOut® (наприклад, кукурудза), StarLink® (наприклад, кукурудза), Bollgard® (бавовна), Nucotn® (бавовна) та NewLeaf® (картопля). Прикладами толерантних до гербіцидів рослин є сорти кукурудзи, бавовни та сої, наявні у продажу

під торговельними марками Roundup Ready® (толерантність по відношенню до гліфозату, наприклад, кукурудза, бавовна, соя), Liberty Link® (толерантність по відношенню до фосфінотрицину, наприклад, рапс), IMI® (толерантність по відношенню до імідазолінонів) та STS® (толерантність по відношенню до сульфонілкарбамідів, наприклад, кукурудза). Стійкі до гербіцидів сорти рослин (звичайно вирощені в умовах толерантності по відношенню до гербіцидів) наявні у продажу під назвою Clearfield® (наприклад, кукурудза). Зрозуміло, що ці висловлення справедливі і для сортів рослин, що будуть створені в майбутньому або які в майбутньому потраплять на ринок, з цими або в майбутньому створеними генетичними властивостями. Згадані вище рослини згідно з винаходом переважно можуть бути оброблені сполуками згідно з винаходом або сумішами активних речовин згідно з винаходом. Вказані вище у зв'язку з активними речовинами або сумішами переважні значення стосуються також обробки цих рослин. Особливо переважною є обробка рослин сполуками або сумішами, спеціально зазначеними в даному тексті.

Запропоновані згідно з винаходом активні речовини або комбінації активних речовин є ефективними не тільки проти шкідників рослин, побутових шкідників та шкідників запасів, а також у ветеринарному секторі проти тваринних паразитів (ектопаразитів), таких як пасовищні кліщі, шкірні кліщі, коростяві кліщі, краснотілки, мухи (що жалять та що лижуть), паразитуючі личинки мух, воші, власоді, пуході та блохи. До таких паразитів належать:

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

3 ряду пуході та підряду Amblycerina, а також Ischnocerina, наприклад, *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Damalina* spp., *Trichodectes* spp., *Felicola* spp.

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

3 ряду блохи, наприклад, *Pulex* spp., *Stenoccephalides* spp., *Xenopsylla* spp., *Ceratophyllus* spp.

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

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

3 підкласу акариформні (акароїдні) та ряду мета-, а також мезостигматичних кліщів, напри-

клад, *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Otobius* spp., *Ixodes* spp., *Amblyomma* spp., *Boophilus* spp., *Dermacentor* spp., *Haemophysalis* spp., *Hyalomma* spp., *Rhipicephalus* spp., *Dermanyssus* spp., *Raillietia* spp., *Pneumonyssus* spp., *Stenostoma* spp., *Varroa* spp.

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

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

Застосування активних речовин або комбінацій активних речовин згідно з винаходом відбувається у ветеринарній практиці відомими способами ентерально, наприклад, у формі таблеток, капсул, напоїв, просочень, гранулятів, паст, пігулок, з їжею, пелюсток, парентерально, наприклад, у вигляді ін'єкцій (внутрішньом'язових, з катетором, внутрішньовенно, внутрішньоперитонально та ін.), у вигляді імплантантів, при введенні в ніс, термальним способом, наприклад, зануренням або купанням, обприскуванням, обливанням зверху, миттям, напудрюванням, а також за допомогою засобів, що містять активні речовини, визначеної форми, таких як нашійники, вушні марки, хвостові марки, стрічки на різних частинах тіла, пов'язки, пристрої для маркування і т.д.

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

Крім того з'ясували, що сполуки згідно з винаходом або комбінації активних речовин проявляють високу інсектицидну активність проти комах, що руйнують технічні матеріали.

Як приклад та переважно, але при цьому не обмежуючи обсягу охорони винаходу, слід назвати 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, *Cryptoterms brevis*, *Heterotermes indicola*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes santonensis*, *Reticulitermes lucifugus*, *Mastotermes darwiniensis*, *Zootermopsis nevadensis*, *Coptotermes formosanus*,

щетинохвостки, такі як *Lepisma saccharina*.

Під технічними матеріалами в зв'язку з вищесказаним слід розуміти матеріали, такі як переважно пластмаси, клейкі речовини, глини, папір та картон, шкіра, деревина, продукти переробки деревини та лакофарбові матеріали.

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

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

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

Активні речовини або комбінації активних речовин можуть бути застосовані як самостійно, так і у вигляді концентратів або звичайно застосовуваних препаративних форм, таких як порошки, грануляти, розчини, суспензії, емульсії або пасти.

Названі препаративні форми можуть бути одержані відомими способами, наприклад, при змішуванні активних речовин із щонайменше одним розчинником або розріджувачем, емульгатором, диспергатором та/або зв'язувальним або фіксуєчим засобом, водовідштовхувальним засобом, в разі необхідності, сикативами та УФ-стабілізаторами та, в разі необхідності, барвниками та пігментами, а також іншими допоміжними засобами для обробки. Інсектицидні засоби або концентрати, застосовувані для захисту деревини та виробів з деревини, містять активну речовину згідно з винаходом у концентрації від 0,0001 до 95 ваг. %, переважно, від 0,001 до 60 ваг. %.

Кількість застосовуваного засобу або концентрату залежить від виду та походження комах та від середовища їх розповсюдження. Оптимальна витратна кількість при застосуванні може бути визначена за допомогою ряду тестувань. Як правило, достатньо застосовувати від 0,0001 до 20 ваг.

%, переважно, від 0,001 до 10 ваг. % активної речовини, в залежності від матеріалу, що підлягає захисту.

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

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

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

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

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

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

Як органічні хімічні зв'язувальні речовини в рамках даного винаходу застосовують відомі, здатні до розведення водою та/або розчинення або диспергування або емульгування використовуваними органічними хімічними розчинниками штучні смоли та/або олії, що висихають, зокрема зв'язувальні речовини, що складаються із або містять акрилову смолу, вінілову смолу, наприклад, полівінілацетат, поліестерну смолу, поліконденсаційну смолу або смолу, одержану при поліпрієднанні, поліуретанову смолу, алкідну смолу або модифіковану алкідну смолу, фенольну смолу, вуглевод-

ну смолу, таку як інден-кумаронова смола, силіконову смолу, рослинні олії, що висихають, та/або масла, що висихають, та/або зв'язувальні речовини, що фізично висихають, на основі природних та/або штучних смол.

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

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

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

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

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

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

Особливо ефективний захист деревини досягають 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 можуть бути використані інсектициди та фунгіциди, описані у міжнародній заявці на патент WO 94/29 268. Сполуки, зазначені в даній заявці, є визначеними складовими запропонованого винаходи.

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

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

Одночасно сполуки або комбінації активних речовин згідно з винаходом можуть бути застосовані для захисту від обростання предметів, особливо таких, як корпус кораблів, фільтри, мережі, будівельні споруди, пірси та сигнальні пристрої, що стикаються з морською або баластовою водою.

Обростання осілими Oligochaete, такими як вапняні трубочники, 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 призводить до підвищених витрат енергії та, крім того, внаслідок тривалого перебування в сухих доках до зростання експлуатаційних витрат.

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

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

При застосуванні сполук згідно з винаходом окремо або у комбінації 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-(біспіридин)-вісмутхлорид, три-н-бутилоловофторид, марганецьетилен-біс-тіокарбамат, цинкдиметилдитіокарбамат, цинкетилен-біс-тіокарбамат, цинкові та мідні солі 2-піридинтіол-1-оксиду, біс-диметилдитіокарбамат-цинкетилен-біс-тіокарбамат, оксид цинку, етилен-біс-дитіокарбамат міді (I), тіоціанат міді, нафтенат міді та галогеніди трибутил-олова, або значно зменшити концентрації цих сполук.

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

Придатними комбінаційними складовими для засобів проти обростання згідно з винаходом є переважно:

альгіциди, такі як 2-трет-бутиламіно-4-циклопропіламіно-6-метилтіо-1,3,5-тріазин, дихлорофен, діурон, ендотал, фентінацетат, ізопротурон, метабензтіазурон, оксифторфен, хінокламін та тербутрин; фунгіциди, такі як

SS-діоксид циклогексиламиду бензо[b]тіофенкарбонової кислоти, дихлофлуанід, фторфольпет, 3-іод-2-пропілнілбутилкарбамат, толіфлуанід, та азоли, такі як

азаконазоли, ципроконазоли, епоксиконазоли, гексаконазоли, метконазоли, пропіконазоли та тебуконазоли; молюскоциди, такі як

фентинацетат, метальдегід, метіокарб, ніклозамід, тіодикарб та триметакарб; або звичайні активні речовини проти обростання, 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 засоби проти обростання містять активну речовину сполук згідно з винаходом у концентрації від 0,001 до 50 ваг. %, переважно, від 0,01 до 20 ваг. %.

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

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

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

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

Активні речовини або суміші активних речовин є також придатними для боротьби з тваринними шкідниками, особливо з комахами, павукоподібними та кліщами, які живуть у замкненому просторі, наприклад, квартирах, фабричних цехах, бюро, кабінах автомобілів та інших. Вони можуть бути застосовані для боротьби з цими шкідниками

окремо або у комбінації з іншими активними та допоміжними речовинами, що використовуються у інсектицидних продуктах для домашнього господарства. Вони є ефективними проти чутливих та стійких видів, а також проти всіх стадій розвитку. До цих шкідників належать:

3 ряду скорпіони, наприклад, *Buthus occitanus*.

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

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

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

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

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

3 ряду губоногі, наприклад, *Geophilus* spp.

3 ряду щетинохвостки, 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 шкірнокрилі, наприклад, *Forficula auricularia*.

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

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

3 ряду жорсткокрилі, наприклад, *Anthrenus* spp., *Attagenus* spp., *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*, *Chrysosona 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*.

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

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

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

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

Активні речовини або комбінації активних речовин згідно з винаходом можуть бути використані, наприклад, для таких рослин:

Дводольні бур'яни родів: *Abutilon* (абутилон), *Amaranthus* (амарант), *Ambrosia* (амброзія), *Anoda*, *Anthemis* (пухляк), *Aphanes*, *Atriplex* (лобода), *Bellis* (маргаритка), *Bidens* (чепра), *Capsella* (вічарська сумка), *Carduus* (будяк), *Cassia* (касія), *Centaurea* (волошка), *Chenopodium* (марь), *Cirsium* (бодяк), *Convolvulus* (в'юнок), *Datura* (дурман), *Desmodium*, *Emex*, *Erysimum* (жовтушник), *Euphorbia* (молочай), *Galeopsis*, *Galinsoga* (галінзоба), *Galium* (підмаренник), *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* (сесбанія), *Sida* (сида), *Sinapis* (гірчиця), *Solanum* (паслен), *Sonchus* (осот), *Spenoclea*, *Stellaria* (звездчатка), *Taraxacum* (кульбаба), *Thlaspi*, *Trifolium* (конюшина), *Urtica* (кропива), *Veronica* (вероніка), *Viola* (фіалка), *Xanthium* (дурнишник).

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

Phaseolus (квасоля), *Pisum* (горох), *Solanum* (паслен), *Vicia* (вика).

Однодольні бур'яни родів: *Aegilops* (егілопс), *Agropyron* (житняк), *Agrostis* (мітлиця), *Alopecurus* (лисохвіст), *Apera*, *Avena* (овес), *Brachiaria*, *Bromus* (багаття), *Cenchrus*, *Commelina* (комеліна), *Cynodon* (свинорий), *Cyperus* (сіль), *Dactyloctenium*, *Digitaria* (росичка), *Echinochloa* (ежовник), *Eleocharis* (болотниця), *Eleusine* (елевсіна), *Eragrostis* (полевичка), *Eriochloa*, *Festuca* (овсяниця), *Fimbristylis*, *Heteranthera*, *Imperata*, *Ischaemum*, *Leptochloa*, *Lolium* (плевел), *Monochoria*, *Panicum* (просо), *Paspalum* (гречка), *Phalaris* (канареечник), *Phleum* (тимопівка), *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 активних речовин або комбінацій активних речовин згідно з винаходом в жодному разі не обмежується зазначеними видами, а так само поширюється на інші рослини.

Запропоновані згідно з даним винаходом активні речовини або комбінації активних речовин 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, плодкових, 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.

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

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

Активні речовини або комбінації активних речовин можуть бути перетворені у звичайні препарати, такі як розчини, емульсії, порошки, що змочуються, суспензії, порошки, дуети для за-

пилення, пасти, розчинні порошки, грануляти, концентрати емульсій та суспензій, природні та синтетичні речовини, просочені активною речовиною, а також мікрокапсульовані в полімерні речовини.

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

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

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

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

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

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

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

Для змішування використовують, наприклад, такі відомі гербіциди:

ацетохлор, ацифторфен(-натрій), аклоніфен, алахлор, алоксидим(-натрій), аметрини, амікарбазони, амідохлор, амідосульфурон, анілофос, асулам, атразини, азафенідин, азимсульфурон, бефлубетамід, беназолін(-етил), бенфурезати, бенсульфурон(-метил), бентазон, бензфендізони, бензобіциклон, бензофенап, бензоілпроп(-етил), біалафос, біфенокс, біспірибак(-натрій), бромобутиди, бромофеноксим, бромоксиніл, бутахлор, бутафенацил(-аліл), бутроксидим, бутилати, кафенстроли, калоксидим, карбетамиди, карфентразон(-етил), хлометоксифен, хлорамбен, хлорідазон, хлорімурон(-етил), хлорнітрофен, хлорсульфурон, хлортолурун, цинідон(-етил), цинметилін, ціносульфурон, клефоксидим, клетодим, клодинафоп(-пропаргіл), кломазони, кломепроп, клопіралід, клопірасульфурон(-метил), клопансулам(-метил), кумілурун, ціаназини, цибутрини, циклоати, циклосульфамурон, циклоксидим, цигалофоп(-бутил), 2,4-D, 2,4-DB, десмедифам, діалати, дикамба, дихлорпроп(-P), диклофоп(-метил), диклосулам, діетатил(-етил), дифензокват, дифлуфенікан, дифлуфензопір, димефурон, димепіперати, диметахлор, диметаметрини, диметенамід, димексифлам, динітраміни, дифенамід, дикват, дитіопір, діурон, димрон, епроподан, ЕРТС, еспрокарб, еталфлуралін, етаметсульфурон(-метил), етофумезати, етоксифен, етоксисульфурон, етобензанід, феноксапроп(-P-етил), фентразаміди, флампроп(-ізопропіл, -ізопропіл-L, -метил), флазасульфурон, флорасулам, флуазифоп(-P-бутил), флазуолати, флукарбазони(-натрій), флуфенацет, флуметсулам, флуміклорак(-пентил), флуміоксазин, флуміпропін, флуметсулам, флуометурон, фторохлоридони, фтороглікофен(-етил), флупоксам, флупропацил, флупірсульфурон(-метил, -натрій), флурунол(-бутил), флуридоні, флуороксибір(-бутоксипропіл, -метил), флуурпримідол, флууртамони, флутіацет(-метил), флутіаміди, фомезафен, форамсульфурон, глюфозинат(-амоній), гліфозат(-ізопропіламоній), галосафен, галоксифоп(-етоксиетил, -P-метил), гексазинони, імазаметабенз(-метил), імазаметатіп, імазамокс, імазапін, імазапін, імазаквін, імазетатіп, імазосульфурон, йодосульфурон(-метил, -натрій), іоксиніл, ізопропалін, ізопротурон, ізоурон, ізоксабен, ізоксахлортоли, ізоксафлутоли, ізоксапірифоп, лактофен, ленацил, лінурун, MCPA, мекопроп, мефенацет, мезосульфурон, мезотріоні, метамітрон, метазаклор, метабензтіазурон, метобензурун, метоброму-

рон, (альфа-)метолахлор, метосулам, метоксурон, метрибузин, метсульфурон(-метил), молінати, монолінурон, напроаніліди, напропаміди, небурон, нікосульфурон, норфлуразон, орбенкарб, оризалін, оксадіаргил, оксадіазон, оксасульфурон, оксацикломефони, оксифторфен, паракват, пеларгонова кислота, пендиметалін, пендралін, пентоксазони, фенмедифам, піколінафен, піноксиден, піперофос, претілахлор, примісульфурон(-метил), профлуразол, прометрин, пропахлор, пропаніл, пропаквізафол, пропізохлор, пропоксикарбазон(-натрій), пропізаміди, просульфокарб, просульфурон, пірафлуфен(-етил), піразогіл, піразолати, піразосульфурон(-етил), піразоксифен, пірибензоксим, пірибутикарб, піридати, піридатол, пірифталід, піримінобак(-метил), піритіобак(-натрій), квінхлорак, квінмерак, квінокламіни, квінзаллофол(-Р-етил, -Р-тефурил), римсульфурон, сетоксидим, симазини, симетрин, сулькотріоні, сульфентразони, сульфометурон(-метил), сульфозати, сульфосульфурон, тебутам, тебутіурон, тепралоксидим, тербутилазани, тербутрин, тенілхлор, тіафлуаміди, тіазопір, тидіазиміни, тифенсульфурон(-метил), тіобенкарб, тіокарбазил, тралкоксидим, триалати, триасульфурон, трибенурон(-метил), триклопір, тридифани, трифлуралін, трифлорисульфурон, трифлусульфурон(-метил), тритосульфурон.

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

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

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

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

Вигідний ефект сумісності комбінацій активних речовин згідно з винаходом з культурними рослинами особливо виражений при певному співвідношенні концентрацій. Однак вагові співвідношення активних речовин у комбінаціях можна варіювати у відносно широких межах. Загалом на 1 вагову частину активної речовини формули (I) або її солей припадає від 0,001 до 1000 ваг. частин, переважно від 0,01 до 100 ваг. частин, особливо переважно від 0,05 до 20 ваг частин однієї із зазначених вище під літерою (b') сполук, що покращують сумісність із культурними рослинами (антидот/сафенер).

Комбінації активних речовин згідно з винаходом загалом застосовують у формі готових композицій. Активні речовини комбінацій можуть також бути використані окремо та змішані перед застосуванням, тобто застосовані у формі сумішей у резервуарах.

Для певних цілей застосування, зокрема при обробці після сходження, вигідним може виявитися додавання до препаративної форми інших добавок, наприклад, сумісних із рослинами мінеральних масел або рослинних олій (наприклад, торговий препарат "Rako Binol") або солей амонію, таких як, наприклад, сульфат амонію або роданід амонію.

Нові комбінації активних речовин можуть бути застосовані як такі, у вигляді їх препаративних форм або одержаних із них подальшим розрідженням готових до застосування форм, таких як готові до застосування розчини, суспензії, емульсії, порошки, пасти та грануляти. Застосування відбувається звичайними способами, наприклад, шляхом поливання, обприскування, мілкокрупельного обприскування, розкидання або розсіювання.

Витратні кількості композиції активних речовин згідно з винаходом можуть коливатися у певному діапазоні; вони залежать передусім від погодних умов та факторів ґрунту. Загалом витратні кількості становлять від 0,001 до 5 кг на га, переважно від 0,005 до 2 кг на га, особливо переважно від 0,01 до 0,5 кг на га.

Комбінації активних речовин згідно з винаходом можуть бути застосовані до або після сходження рослин, тобто нанесені до сходження або після сходження способом.

Застосовувані згідно з винаходом сафенери залежно від їх властивостей можуть бути використані для попередньої обробки насіння (протравка насіння), нанесені на борозну перед сівбою, застосовані окремо перед застосуванням гербіциду або разом із гербіцидом нанесені перед або після сходження рослин.

Прикладами рослин є важливі культурні рослини, такі як зернові (пшениця, рис), кукурудза, соя, картопля, бавовна, рапс, буряк, цукрова тростина, а також фруктові дерева (із плодами яблук, груш, цитрусові та виногради), причому найбільшу перевагу надають кукурудзі, сої, картоплі, бавовні та рапсу.

Речовини згідно з винаходом проявляють високу мікробіцидну активність та можуть бути застосовані для боротьби з небажаними мікроорганізмами, такими як грибки та бактерії, у захисті рослин та матеріалів.

Фунгіциди можуть бути застосовані у захисті рослин для боротьби з *Plasmodiophoromycetes*, *Oomycetes*, *Chytridiomycetes*, *Zygomycetes*, *Ascomycetes*, *Basidiomycetes* та *Deuteromycetes*.

Бактерициди можуть бути застосовані у захисті рослин для боротьби з *Pseudomonadaceae*, *Rhizobiaceae*, *Enterobacteriaceae*, *Corynebacteriaceae* та *Streptomycetaceae*.

Нижче наведені приклади деяких збудників грибкових та бактеріальних захворювань, які належать до вказаних вище родів та в жодному разі не обмежують обсягу охорони винаходу.

види *Xanthomonas*, наприклад, *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*;
види *Pseudomonas*, наприклад, *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*;

види *Erwinia*, наприклад, *Erwinia amylovora*;
види *Pythium*, наприклад, *Pythium ultimum*;
види *Phytophthora*, наприклад, *Phytophthora infestans*;

види *Pseudoperonospora*, наприклад, *Pseudoperonospora humuli* або *Pseudoperonospora cubensis*;

види *Plasmopara*, наприклад, *Plasmopara viticola*,

види *Bremia*, наприклад *Bremia lactucae*;
види *Peronospora*, наприклад, *Peronospora pisi* або *P. brassicae*;

види *Erysiphe*, наприклад, *Erysiphe graminis*;
види *Sphaerotheca*, наприклад, *Sphaerotheca fuliginea*;

види *Podosphaera*, наприклад, *Podosphaera leucotricha*;

види *Venturia*, наприклад, *Venturia inaequalis*;

види *Pyrenophora*, наприклад, *Pyrenophora teres* або *P. graminea* (форма конідії *Drechslera*, син.: *Helminthosporium*);

види *Cochliobolus*, наприклад, *Cochliobolus sativus* (форма конідії: *Drechslera*, син *Helminthosporium*);

види *Uromyces*, наприклад, *Uromyces appendiculatus*;

види *Puccinia*, наприклад, *Puccinia recondita*;

види *Sclerotinia*, наприклад, *Sclerotinia sclerotiorum*;

види *Tilletia*, наприклад, *Tilletia caries*;

види *Ustilago*, наприклад, *Ustilago nuda* або *Ustilago avenae*;

види *Pellicularia*, наприклад, *Pellicularia sasakii*;

види *Pyricularia*, наприклад, *Pyricularia oryzae*;

види *Fusarium*, наприклад, *Fusarium culmorum*;

види *Botrytis*, наприклад, *Botrytis cinerea*;

види *Septoria*, наприклад, *Septoria nodorum*;

види *Leptosphaeria*, наприклад, *Leptosphaeria nodorum*;

види *Cercospora*, наприклад, *Cercospora canescens*;

види *Alternaria*, наприклад, *Alternaria brassicae*;

види *Pseudocercospora*, наприклад, *Pseudocercospora herpotrichoides*.

Активні речовини згідно з винаходом проявляють також сильний зміцнювальний вплив на рослини. Тому вони є придатними для мобілізації захисних сил рослин, спрямованих проти враження небажаними мікроорганізмами.

В даному контексті під речовинами, що зміцнюють рослини (індукують резистентність) слід розуміти такі речовини, які здатні так стимулювати захисну систему рослин, щоб оброблені рослини при подальшому зараженні небажаними мікроорганізмами проявляли високу резистентність по відношенню до цих мікроорганізмів.

Під небажаними мікроорганізмами в даному випадку слід розуміти фітопатогенні грибки, бактерії та віруси. Отже, речовини згідно з винаходом можуть бути застосовані для захисту рослин від враження вказаними збудниками хвороб протягом

певного проміжку часу після обробки. Час, протягом якого діє даний захист, становить загалом від 1 до 10, переважно 1 - 7 днів після обробки рослин активними речовинами.

Висока сумісність рослин з активними речовинами при їх використанні в концентраціях, необхідних для боротьби із хворобами, дозволяє обробляти пригрунтові частини рослин, посадковий матеріал, насіння та ґрунт.

Активні речовини згідно з винаходом придатні також для підвищення продуктивності врожаю. Крім того вони є менш токсичними та проявляють високу сумісність з рослинами.

Активні речовини згідно з винаходом, в разі необхідності, в певних концентраціях та витратних кількостях, можуть бути застосовані також як гербіциди, для впливу на ріст рослин, а також для боротьби з тваринними шкідниками. Вони, в разі необхідності, можуть також бути застосовані як проміжні та вихідні продукти для синтезу інших активних речовин.

У захисті матеріалів речовини згідно з винаходом застосовують для захисту технічних матеріалів від ураження та руйнування небажаними мікроорганізмами.

Під технічними матеріалами у даному контексті слід розуміти матеріали, виготовлені для застосування у техніці. Прикладами таких технічних матеріалів, які повинні бути захищені активними речовинами згідно з винаходом від зміни або руйнування мікроорганізмами, є клейкі речовини, глини, папір та картон, тканини, шкіра, деревина, лакофарбові матеріали та вироби з пластмаси, змазки та інші матеріали, які можуть бути вражені або зруйновані мікроорганізмами. В рамках матеріалів, що підлягають захисту, слід також назвати частини виробничого устаткування, наприклад, замкнені цикли охолодження, які можуть бути пошкоджені внаслідок розмноження мікроорганізмів. В рамках даного винаходу як технічним матеріалом перевагу надають клейким речовинам, глинам, паперу та картону, шкірі, деревині, лакофарбовим матеріалам, змазкам та рідким теплоносіям, особливо деревині.

Серед мікроорганізмів, які можуть впливати на руйнування або зміну технічних матеріалів, слід, наприклад, назвати бактерії, грибки, дріжджі, водорості та слизові організми. Активні речовини згідно з винаходом переважно впливають на грибки, зокрема плісняву, на грибки, що псують та руйнують деревину (*Basidiomyceten*), а також на слизові організми та водорості.

Необхідно, наприклад, назвати мікроорганізми таких родів:

Alternaria, такі як *Alternaria tenuis*,
Aspergillus, такі як *Aspergillus niger*,
Chaetomium, такі як *Chaetomium globosum*,
Coniophora, такі як *Coniophora puetana*,
Lentinus, такі як *Lentinus tigrinus*,
Penicillium, такі як *Penicillium glaucum*,
Polyporus, такі як *Polyporus versicolor*,
Aureobasidium, такі як *Aureobasidium pullulans*,
Sclerophoma, такі як *Sclerophoma pityophila*,
Trichoderma, такі як *Trichoderma viride*,
Escherichia, такі як *Escherichia coli*,

Pseudomonas, такі як *Pseudomonas aeruginosa*,

Staphylococcus, такі як *Staphylococcus aureus*.

Активні речовини згідно з винаходом залежно від їх відповідних фізичних та/або хімічних властивостей можуть бути перетворені на звичайні препаративні форми, такі як розчини, емульсії, суспензії, порошки, піни, пасти, грануляти, аерозолі, мікрокапсульовані в полімерні речовини для насіння, а також УФ-композиції з утворенням туману холодним та гарячим способом.

Ці композиції одержують відомими способами, наприклад, змішуванням активних речовин з розріджувачами, тобто рідкими розчинниками, розрідженими газами під тиском та/або твердими носіями, в разі необхідності, при застосуванні поверхнево-активних речовин, тобто емульгаторів та/або диспергаторів та/або піноутворюючих речовин. У випадку використання води як розріджувача можуть також бути застосовані, наприклад, органічні розчинники як допоміжні засоби, що поліпшують розчинення. Як рідкі органічні розчинники в основному застосовують: ароматичні сполуки, такі як ксилол, толуол, або алкілнафталіни, хлоровані ароматичні сполуки або хлоровані аліфатичні вуглеводні, такі як хлорбензоли, хлоретилени або метиленхлорид, аліфатичні вуглеводні, такі як циклогексан або парафіни, наприклад, фракції нафти, спирти, такі як бутанол або гліколь, а також їх етери та естери, кетони, такі як ацетон, метилетилкетон, метилізобутилкетон або циклогексанон, сильнополярні розчинники, такі як диметилформамід та диметилсульфоксид, а також воду. Під газоподібними розріджувачами або носіями розуміють такі рідини, які при нормальній температурі та нормальному тиску існують у формі газу, наприклад, аерозолі, такі як галогенвуглеводні, а також бутан, пропан, азот та діоксид вуглецю. Як тверді носії мають на увазі: наприклад, помели природних каменів, таких як каоліни, глиноземи, тальк, крейда, кварц, атапульгіт, монтморилоніт або діатомова земля, та помели синтетичних каменів, такі як вискодисперсна кремнієва кислота, оксид алюмінію та силікати. Як тверді носії для гранулятів мають на увазі: наприклад, подрібнені та фракціоновані природні кам'яні породи, такі як кальцит, мармур, пемза, сепіоліт, доломіт, а також синтетичні грануляти з неорганічного та 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 композиціях можуть бути застосовані речовини, що поліпшують адгезію, такі як карбоксиметилцеллюлоза, природні та синтетичні порошкоподібні, зернисті або латексоподібні полімери, такі як гуміарабік, полівініловий спирт, полівінілацетат, а

також природні фосфоліпіди, такі як кефаліни та лецитини, та синтетичні фосфоліпіди. Іншими добавками можуть бути мінеральні масла та рослинні олії.

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

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

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

Для змішування застосовують, наприклад, такі сполуки:

Фунгіциди:

2-фенілфенол; 8-гідроксихінолінсульфат; ацибензолар-S-метил; алдиморф; амідифлумет; ампропілфос; ампропілфос-калій; андоприм; анілазини; азаконазоли; азоксистробін; беналаксил; беноданіл; беноміл; бентівалікарб-ізопропіл; бензамакрил; бензамакрил-ізобутил; біалафос; бінапакрил; біфеніл; бітертанол; бластицидин-S; бромконазоли; бупіримати; бутіобати; бутиламіни; полісульфід кальцію; капсимицин; каптафол; каптан; карбендазим; карбоксин; карпропамід; карвони; хінометіонат; хлорбензтіазони; хлорфеназоли; хлоронеб; хлороталоніл; хлоролініати; клозілакон; ціазофамід; цифлупфенамід; цимоксаніл; ципроконазоли; ципродиніл; ципрофуррам; Dagger G; дебаккарб; дихлофлуанід; дихлони; дихлорофен; диклоцимет; дикломезини; диклоран; діетофенкарб; дифеноконазоли; дифлуметорим; диметиримол; диметоморф; димоксистробін; диніконазоли; диніконазол-M; динокап; дифеніламіни; дипіритіони; диталіфос; дитіаніони; додини; дразоксолон; едифенфос; епоксиконазоли; етабоксам; етиримол; етридіазолі; фамоксадони; фенамідони; фенапаніл; фенаримол; фенбуконазоли; фенфурам; фенгексамід; фенітропан; феноксаніл; фенпікло-ніл; фенпропідин; фенпропіморф; фербам; флуазинам; флурбензіміни; флудіоксоніл; флуметовер; флуморф; фтороміди; флуоксастробін; флухінка-назоли; флурпримідол; флузилазоли; флусульфа-міди; флутоланіл; флутріафол; фолпет; фозетил-алюміній; фозетил-натрій; фуберідазоли; фура-лаксил; фураметпір; фуркарбаніл; фурмециклос; гуазатини; гексахлорбензоли; гексаконазоли; гіме-ксазол; імазаліл; імібенконазоли; іміноктадинетри-ацетати; іміноктадин-трис(альбесилати); йодокарб; іпконазоли; іпробенфос; іпродіони; іпротіокарб; ірумаміцин; ізопротіоліони; ізоваледіони; касугамі-цин; крезоксим-метил; манкозеб; манеб; мефери-мзони; мепаніпирим; мепроніл; металаксил; мета-лаксил-M; метконазоли; метасульфоккарб;

метфутоксам; метирам; метоміностробін; метсульфовакс; мілдіоміцин; миклобутаніл; міклозолін; натаміцин; нікобіфен; нітротал-ізопропіл; новіфлумурон; нуаримол; офурак; оризастробін; оксацил; оксолінова кислота; окспоконазолі; оксикарбоксин; оксифентіін; паклобутразол; пефуразоати; пенконазоли; пенцикурон; фосдифен; фталіди; пікоксистробін; піпералін; поліоксини; поліоксорим; пробеназоли; прохлораз; процимідони; пропамкарб; пропанозин-натрій; пропіконазоли; пропінеб; прохіназид; протіоконазолі; піраклостробін; піразофос; піріфенокс; піриметаніл; пірохілон; піроксифур; піролінтрини; хінконазоли; хіноксифен; хінтоцени; симеконазолі; спіроксаміни; сульфур; тебуконазоли; теклофталам; текназени; тетциклацис; тетраконазоли; тіабендазоли; тиціофен; тифлузаміди; тіофанат-метил; тирам; тіоксимід; толклофос-метил; толілфлуанід; триадимефон; триадименол; триазбутил; триазоксиди, трицикламіди; трициклазоли; тридеморф; трифлуксистробін; трифлумізоли, трифорини; тритіконазоли; уніконазоли; валідаміцин А; вінклозолін; зинеб; зирам; зоксаміди; (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-хлорофеніл)-2-пропініл]окси]-3-метоксифеніл]етил]-3-метил-2-[(метилсульфоніл)аміно]-бутанаміди; 1-(1-нафталеніл)-1Н-пірол-2,5-діони; 2,3,5,6-тетрахлоро-4-(метилсульфоніл)-піридини; 2-аміно-4-метил-N-феніл-5-триазолкарбоксаміди; 2-хлоро-N-(2,3-дигідро-1,1,3-триметил-1Н-інден-4-іл)-3-піридинкарбоксаміди; 3,4,5-трихлоро-2,6-піридиндикарбонітрили; актиновати; цис-1-(4-хлорофеніл)-2-(1Н-1,2,4-триазол-1-іл)-циклогептанол; метил 1-(2,3-дигідро-2,2-диметил-1Н-інден-1-іл)-1Н-імідазол-5-карбоксилати; карбонат монокалію; N-(6-метокси-3-піридиніл)циклопропанкарбоксаміди; N-бутил-8-(1,1-диметилетил)-1-оксаспіро[4.5]декан-3-аміни; тетратіокарбонат натрію;

а також солі міді та сполуки із міді, такі як бордська суміш; гідроксиди міді; нафтенати міді; оксихлориди міді; сульфати міді; куфранеб; оксиди міді; оксин-мідь.

Бактерициди:

бронопол, дихлорофен, нітрапирин, нікельдиметилдитіокарбамат, касугаміцин, октілінон, фуранкарбонова кислота, окситетрациклін, пробеназол, стрептоміцин, теклофталам, сульфат міді та інші сполуки, що містять мідь.

Інсектициди/акарициди/нематодици

Абамектин, ABG-9008, ацефати, ацехіноцил, ацетаміприд, ацетопроли, акринатрин, AKD-1022, AKD-3059, AKD-3088, аланікарб, алдикарб, алдоксикарб, алетрин, алетрин 1R-ізомери, альфа-циперметрин (альфаметрин), амідофлумет, амінокарб, амітраз, авермектин, AZ 60541, азадирахтин, азаметифос, азинфос-метил, азинфос-етил, азоциклотин,

Bacillus popilliae, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus subtilis*, *Bacillus thuringiensis*, *Bacillus thuringiensis* штам EG-2348, *Bacillus thuringiensis* штам GC-91, *Bacillus thuringiensis* штам NCTC-11821, *Baculo* віруси, *Beauveria bassiana*, *Beauveria tenella*, бенклотіаз, бендіокарб, бенфуракарб, бенсультап, бензоксимати, бетацифлутрин, бетациперметрин, біфеназати, біфентрин, бінапакрил, біоалетрин, S-

циклопентиловий ізомер біоалетрину, біоетанометрин, біоперметрин, біорезметрин, бістрифлурон, ВРМС, брофенпрокс, бромофос-етил, бромопропілати, бромфенвінфос (-метил), BTG-504, BTG-505, буфенкарб, бупрофецин, бутатіофос, бутокарбоксим, бутоксикарбоксим, бутилпіридабен,

кадусафос, камфехлор, карбарил, карбофуран, карбофенотіон, карбосульфат, картап, CGA-50439, хінометіонат, хлордани, хлордимеформ, хлоретоксифос, хлорфенапір, хлорфенвінфос, хлорфлуазурон, хлормефос, хлоробензилати, хлоропікрин, хлорпроксифен, хлорпірифос-метил, хлорпірифос-(етил), хловапортрин, хромафенозиди, цис-циперметрин, цис-резметрин, цис-перметрин, клоцитрин, клоетокарб, клофентезини, клотіанідини, клотіазобен, кодлемони, кумафос, ціанофенфос, ціанофос, циклопенти, циклопроптрин, *Cydia romonella*, цифлутрин, цигалотрин, цигексатин, циперметрин, цифенотрин (1R-транс-ізомер), циромазини,

DDT, дельтаметрин, деметон-S-метил, деметон-S-метилсульфон, діафентіурон, діаліфос, діазинон, дихлофентіон, дихлорвос, дикофол, дикротос, дицикланіл, дифлубензурон, димефлутрин, диметоати, диметилвінфос, динобутон, динокап, динотефуран, діофенолан, дисульфотон, докватнатрій, дофенапір, DOWCO-439,

ефлузиланати, емаектин, емаектинбензоат, емпентрин (1R-ізомер), ендосульфат, *Entomophthora* spp., EPN, есфенвалерати, етіофенкарб, етіпроли, етіон, етопрофос, етофенпрокс, етоксазоли, етримфос,

фамфур, фенаміфос, феназахін, фенбутатин оксиди, фенфлутрин, фенітротіон, фенобукарб, фенотіокарб, феноксакрим, феноксикарб, фенпропатрин, фенпірад, фенпіритрин, фенпіроксимати, фенсульфотіон, фентіон, фентрифланіл, фенвалерати, фіпроніл, флонікамід, флуакрипірим, флуазурон, флубензіміні, флуброцитринати, флуциклоксурон, флуцитринати, флуфенерим, флуфеноксурон, флуфенпрокс, флуметрин, флупіразофос, флутензини (флуфензини), флувалінати, фонофос, форметанати, формотіон, фосметилан, фостіазати, фубфенпрокс (флурпроксифен), фуратіокарб,

гама-цигалотрин, гама-HCH, Gossypure, Grandlure, гранулоподібі віруси, галфенпрокс, галофенозиди, HCH, HCN-801, гептенофос, гексафлумурон, гексилтіазокс, гідрометилнони, гідропрепи,

ІКА-2002, імідаклопрід, іміпротрин, індоксикарб, йодофенфос, іпробенфос, ізазофос, ізофенфос, ізопрокарб, ізоксатіон, івермектин, Japonilure,

Кадетрин, віруси поліедрозу, кінопрени, ламбда-цигалотрин, ліндани, луфенурон,

малатіон, мекарбам, месульфенфос, металдегід, метам-натрій, метакифос, метамідофос, *Metharhizium anisopliae*, *Metharhizium flavoviride*, метидатіон, метіокарб, метоміл, метопрени, метоксиклор, метоксифенозиди, метофлутрин, метолкарб, метоксидіазони, мевінфос, мілбемектин, мілбеміцин, MKI-245, MON-45700, монокротофос, моксидектин, MTI-800,

налед, NC-104, NC-170, NC-184, NC-194, NC-196, ніклозаміди, нікотини, нитенпірам, нитіазини, NNI-0001, NNI-0101, NNI-0250, NNI-9768, новалурон, новіфлумурон,

ОК-5101, ОК-5201, ОК-9601, ОК-9602, ОК-9701, ОК-9802, ометоати, оксаміл, оксидеметон-метил,

Раесилomyces fumosoroseus, паратіон-метил, паратіон (-етил), перметрин (цис-, транс-), нафта, RH-6045, фенотрин (1R-транс-ізомер), фентоати, форати, фозалони, фозмет, фосфамідон, фосфокарб, фоксим, піпероніл-бутоксокси, піримікарб, піриміфос-метил, піриміфос-етил, олеати калію, пралетрин, профенофос, профлутрин, промеккарб, пропафос, пропаргіти, пропетамфос, пропоксур, протіофос, протоати, протрифенбути, піметрозини, піраклофос, пірезметрин, піретрум, піридабен, піридаліл, піридафентіон, піридатіон, піримідифен, пірипроксифен,

хіналфос,

резметрин, RH-5849, рибавірин, RU-12457, RU-15525,

S-421, S-1833, салитіон, себуфос, SI-0009, силлафлуофен, спіносад, спіродиклофен, спіромезифен, сульфлурамід, сульфотеп, сулпрофос, SZI-121,

тау-флувалінати, тебуфенозиди, тебуфенпірад, тебупіриміфос, тефлубензурон, тефлутрин, темефос, темівінфос, тербам, тербуфос, тетралорвінфос, тетрадифон, тетраметрин, тетраметрин (1R-ізомер), тетрасул, тета-циперметрин, тіаклопрід, тіаметоксам, тіапроніл, тіатрифос, тіоциклам гідрооксалати, тіодикарб, тіофанокс, тіометон, тіосултап-натрій, турінгієнсин, толфенпірад, тралоцитрин, тралометрин, трансфлутрин, триаратени, триазамати, триазофос, триазурон, трихлорфенідини, трихлорфон, Trichoderma atroviride, трифлумурон, триметаккарб,

вамідотіон, ваніліпроли, вербутин, Verticillium lecanii,

WL-108477, WL-40027,

YI-5201, YI-5301, YI-5302,

XMC, ксилілкарб,

ZA-3274, зета-циперметрин, золапрофос, ZXI-8901,

сполука 3-метилфенілпропілкарбамат (тсумацид Z),

сполука 3-(5-хлор-3-піридиніл)-8-(2,2,2-трифторетил)-8-азабіцикло[3.2.1]октан-3-карбонітрил (CAS-реєстр № 185982-80-3) та відновний 3-ендо-ізомер (CAS-реєстр № 185984-60-5) (див. WO-96/37494, WO-98/25923),

а також препарати, які містять активні рослинні екстракти, нематоди, грибки або віруси.

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

Крім того сполуки формули (I) згідно з винаходом також проявляють сильну протигрибкову активність. У них досить широкий спектр протигрибкової дії, сюди зокрема належать дерматофіти та грибки, пліснява та двафазові грибки (наприклад,

вид *Candida*, як, наприклад, *Candida albicans*, *Candida glabrata*), а також *Epidermophyton floccosum*, вид *Aspergillus*, як, наприклад, *Aspergillus niger* та *Aspergillus fumigatus*, вид *Trichophyton*, як, наприклад, *Trichophyton mentagrophytes*, вид *Microsporon*, як, наприклад, *Microsporon canis* та *audouinii*. Перелік цих грибів в жодному разі не обмежує спектр дії, він має лише пояснювальний характер.

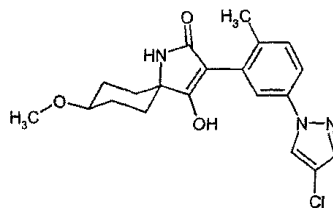
Активні речовини можуть бути застосовані як такі, у вигляді їх препаративних форм або у вигляді одержаних з них форм, готових до застосування, таких як розчини, суспензії, порошки, що змочуються, пасти, розчинні порошки, дуети та грануляти. Застосування відбувається звичайними способами, наприклад, шляхом лиття, розбрикування, розпилення, розкидання, запилення, обробки піною, намазування і т.д. Крім того можливим є також нанесення активних речовин способом Ultra-Low-Volume (наднизького об'єму) або шляхом вприскування композиції активних речовин або самої активної речовини в ґрунт. Можливо також обробляти насіння рослин перед посівом.

При застосуванні активних речовин згідно з винаходом як фунгіцидів витратні кількості в залежності від виду нанесення можуть варіюватися в широкому діапазоні. При обробці частин рослин витратна кількість активної речовини загалом становить від 0,1 до 10 000 г/га, переважно від 10 до 1000 г/га. При обробці насіння витратна кількість активної речовини загалом становить від 0,001 до 50 г на кілограм насіння, переважно від 0,01 до 10 г на кілограм насіння. При обробці ґрунту витратна кількість активної речовини загалом становить від 0,1 до 10 000 г/га, переважно від 1 до 5000 г/га.

Нижче наведені приклади одержання та застосування активних речовин згідно з винаходом.

Приклади одержання

Приклад I-1-a-1

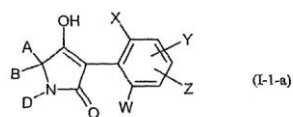


До 1,95 г (0,042 моль) трет-бутилату калію в 6 мл безводного диметилформаміду (ДМФА) при температурі від 40 до 50 °C додають 3,15 г сполуки згідно з прикладом 11-1 в 7 мл безводного ДМФА та перемішують протягом 1 години при 60 °C

Реакційну суміш змішують з крижаною водою та при температурі від 0 до 10 °C підкислюють концентрованою соляною кислотою до рівня pH 4. Осад промивають крижаною водою та сушать. Потім очищують колонковою хроматографією на силікагелі (дихлорметан . метанол 20:1).

Вихід: 190 мг (6 % від теор.). Т. сп: 265 °C.

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



Прикл. №	W	X	Y	Z	D	A	B	Т.сп.°C	Ізомер
I-1-a-2	CH ₃	CH ₃	H		H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		277	Б
I-1-a-3	H	CH ₃	H		H	-(CH ₂) ₅ -		286	-
I-1-a-4	CH ₃	CH ₃	H		H	CH ₃	CH ₃	308	-
I-1-a-5	CH ₃	CH ₃	H		H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		291	Б
I-1-a-6	CH ₃	C ₂ H ₅	H		H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		284	Б
I-1-a-7	CH ₃	C ₂ H ₅	H		H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		318	Б

Таблиця I-1-a (продовження)

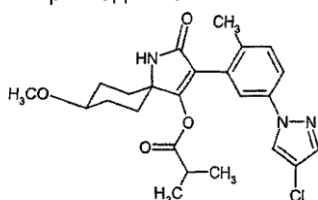
Прикл. №	W	X	Y	Z	D	A	B	Т.сп.°C	Ізомер
I-1-a-8	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H		H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		278	Б
I-1-a-9	CH ₃	CH ₃	Cl		H	CH ₃	CH ₃	305	-
I-1-a-10	H	C ₂ H ₅	H		H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		167	Б
I-1-a-11	C ₂ H ₅	Cl	H		H	CH ₃	CH ₃	294	-
I-1-a-12	C ₂ H ₅	Cl	H		H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		272	Б
I-1-a-13	CH ₃	C ₂ H ₅	H		H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		269	-
I-1-a-14	CH ₃	C ₂ H ₅	H		H	CH ₃	CH ₃	306	-

Таблиця I-1-a (продовження)

Прикл. №	W	X	Y	Z	D	A	B	Т.сп.°C	Ізомер
I-1-a-15	H	Cl	H		H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		*7.57-7.77 (м, 3H, Ar-H), 7.87, 8.18 (2с, 2H nір-Н)	Б
I-1-a-16	CH ₃	C ₂ H ₅	H		H		CH ₃	171-172	-

* ¹H-ЯМР (400 МГц, d₆-DMCO). зсув δ в м.м.

Приклад I-1-b-1

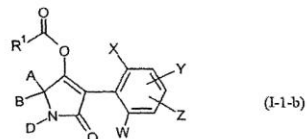


В атмосфері аргону змішують 0,6 г сполуки згідно з прикладом I-1-a-1 в 30 мл безводного етилацетату та 0,15 г триетиламіну (1,5 ммоль) = 0,21 мл. Кристалізують 10 мг основи Штегліха та при кип'ятінні зі зворотнім холодильником додають 0,16 г (0,0015 моль) хлориду ізомасляної кислоти в 2 мл безводного дихлорметану. Реакцію контролюють тонкошаровою хроматографією. Розчинник

випаровують, а залишок хроматографують на силікагелі розчинником дихлорметан/етилацетат 3:1.

Вихід: 0,25 г (34 % від теор.), Т.сп. 217 °С.

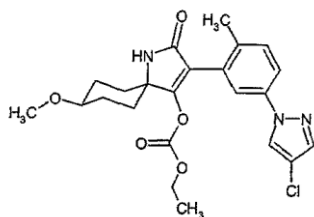
Аналогічно прикладу (I-1-b-1) та згідно із загальною інформацією про одержання одержують такі сполуки формули (I-1-b)



Прикл. №	W	X	Y	Z	D	A	B	R ¹	Т.сп.°С	Ізомер
I-1-b-2	CH ₃	CH ₃	H	4-N-піридил-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		i-C ₃ H ₇	247	β
I-1-b-3	CH ₃	CH ₃	H	4-N-піридил-OCH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		H ₃ C-O-CH ₂ -	237	β
I-1-b-4	CH ₃	C ₂ H ₅	H	4-N-піридил-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		i-C ₃ H ₇	221	β
I-1-b-5	H	C ₂ H ₅	H	4-N-піридил-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		i-C ₃ H ₇	*3,21 (м, 1H, CH OCH ₃), 1,05 (а, 6H, CH(CH ₃) ₂)	β
I-1-b-6	CH ₃	C ₂ H ₅	H	4-N-піридил-Cl	H	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇	140-141	-

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

Приклад I-1c-1



До 0,48 г сполуки згідно з прикладом I-1-a-1 в 10 мл безводного дихлорметану при температурі від 10 до 20 °С додають 0,14 мл (1 ммоль) триети-

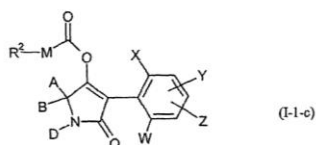
ламіну та 0,1 мл (1 ммоль) етилового естеру хлормурашиної кислоти в 5 мл безводного дихлорметану.

При кімнатній температурі перемішують, контролюючи тонкошаровою хроматографією.

Розчинник відганяють, залишок поміщають у дихлорметан, двічі промивають 5 мл 0,5 N розчину NaOH та сушать. Розчинник відганяють. Після цього очищують колонковою хроматографією на силікагелі (дихлорметан : етилацетат 3:1).









Вихід: 0,3 г (65 % від теор.), Т.сп. 240 °С.

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



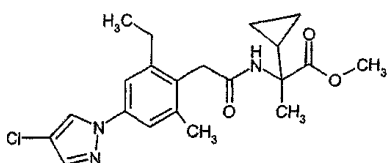
Прикл. №	W	X	Y	Z	D	A	B	M	R ²	Т.сп.°С	Ізомер
I-1-c-2	CH ₃	CH ₃	H	4-N-піридил-Cl	H	CH ₃	CH ₃	O	C ₂ H ₅	159	-
I-1-c-3	CH ₃	CH ₃	H	4-N-піридил-OCH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		O	C ₂ H ₅	209-212	β
I-1-c-4	H	C ₂ H ₅	H	4-N-піридил-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		O	C ₂ H ₅	192-197	β
I-1-c-5	CH ₃	CH ₃	H	4-N-піридил-Cl	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		O	C ₂ H ₅	*1,13 (γ, 3H, CH ₂ -CH ₃) 2,28 (ε, 6H, Ar-CH ₃) 7,62, 7,88 (2с, 2H, mр-H)	β

Таблиця І-1-с (продовження)

I-1-c-6	CH ₃	C ₂ H ₅	H		H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	O	C ₂ H ₅	220	B	
I-1-c-7	CH ₃	C ₂ H ₅	H		H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	O	C ₂ H ₅	197	B	
I-1-c-8	C ₂ H ₅	Cl	H		H	CH ₃	CH ₃	O	C ₂ H ₅	178	-
I-1-c-9	C ₂ H ₅	Cl	H		H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	O	C ₂ H ₅	196	B	
I-1-c-10	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H		H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	O	C ₂ H ₅	190	B	
I-1-c-11	CH ₃	C ₂ H ₅	H		H	CH ₃	CH ₃	O	C ₂ H ₅	149-151	-
I-1-c-12	CH ₃	C ₂ H ₅	H		H		CH ₃	O	C ₂ H ₅	-	-

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

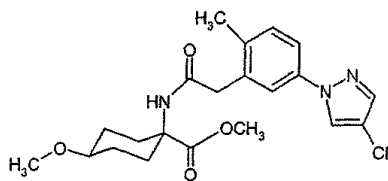
Приклад II-16



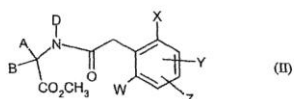
До 1 мл сірчаної кислоти додають 1,29 г сполуки згідно з прикладом ХХХ-1 в 10 мл дихлорметану. Суміш протягом 2 годин перемішують при 35 °С. Додають 6 мл метанолу. Перемішують протягом наступних 6 годин при 60 °С. Екстрагують дихлорметаном, сушать над сульфатом магнію, розчинник відганяють. Очищують колонковою хроматографією на силікагелі (етилацетат → н-гептан : 1/4 → 1/1).

Вихід: 1 г (69 % від теор.), Т.сп. 136-137 °С.

Приклад II-І



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



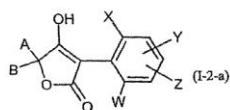
Прикл. №	W	X	Y	Z	D	A	B	Т.сп.°С	Ізомер
II-2	CH ₃	CH ₃	H		H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		176	В
II-3	H	CH ₃	H		H	-(CH ₂) ₅ -		146	-
II-4	CH ₃	CH ₃	H		H	CH ₃	CH ₃	194	-

До 3,04 г метилового естеру і-аміно-4-метоксициклогексанкарбонової кислоти х НСІ в 40 мл безводного тетрагідрофурану (ТГФ) додають 4 мл триетиламіну та перемішують протягом 5 хвилин. Після цього додають 2,51 г 2-метил-5-[1-(4-хлор)-піразоліл]феніл оцтової кислоти та протягом 15 хвилин перемішують при кімнатній температурі. Потім додають 2,2 мл триетиламіну та відразу після цього по краплях додають 0,56 мл оксихлориду фосфору, таким чином, що розчин помірно кипить. Потім протягом 30 хвилин перемішують при кип'ятіння зі зворотнім холодильником.

Реакційний розчин виливають у 200 мл крижаної води, підлучують 3,5 мл триетиламіну, екстрагують дихлорметаном та сушать. Після цього розчинник відганяють, а залишок очищують колонковою хроматографією на силікагелі (дихлорметан : етилацетат 3:1).

Вихід: 3,15 г (75 % від теор.). Т.сп.: 153 °С.

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



Прикл. №	W	X	Y	Z	A	B	T, °C
I-2-а-2	H	Cl	H		-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		*3,3-3,5 (2 м, 1H, CHOCH ₃) 3,3 (с, 3H, OCH ₃) 7,73, 7,88 (2с, 2H, Ar-H) 7,90, 8,76 (2 с, 2H, пір-H)
I-2-а-3	C ₂ H ₅	Cl	H		CH ₃	CH ₃	*7,72, 7,82 (2 с, 2H, Ar-H) 7,90, 8,87 (2 с, 2H, пір-H)

Таблиця I-2-а (продовження)

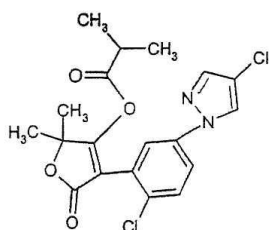
Прикл. №	W	X	Y	Z	A	B	T, °C
I-2-а-4	C ₂ H ₅	Cl	H		-(CH ₂) ₄		*7,58, 7,67 (2 с, 2H, Ar-H) 7,68, 8,23 (2 с, 2H, пір-H)
I-2-а-5	C ₂ H ₅	Cl	H		-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		транс-ізомер 1) *3,27 (с, 3H, O-CH ₃) 7,71, 7,82 (2 с, 2H, Ar-H) 7,90, 8,86 (2 с, 2H, пір-H)
I-2-а-6	C ₂ H ₅	Cl	H		-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		цис-ізомер 1) *3,29 (с, 3H, O-CH ₃) 7,72, 7,82 (2 с, 2H, Ar-H) 7,90, 8,87 (2 с, 2H, пір-H)

Таблиця I-2-а (продовження)

Прикл. №	W	X	Y	Z	A	B	T, °C
I-2-а-7	CH ₃	C ₂ H ₅	H		-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		*7,48, 7,54 (2 с, 2H, Ar-H) 7,84, 7,95 (2 с, 2H, пір-H)
I-2-а-8	CH ₃	C ₂ H ₅	H		-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		*7,53, 7,55 (2 с, 2H, Ar-H) 7,84, 7,95 (2 с, 2H, пір-H)
I-2-а-9	CH ₃	C ₂ H ₅	H		-(CH ₂) ₅ -		*7,53, 7,55 (2 с, 2H, Ar-H) 7,83, 7,95 (2 с, 2H, пір-H)
I-2-а-10	CH ₃	C ₂ H ₅	H		CH ₃	CH ₃	*7,53, 7,55 (2 с, 2H, Ar-H) 7,84, 7,95 (2 с, 2H, пір-H)

*¹H-ЯМР (400 МГц, d₆-ДМСО): δ в м.ч. ¹) розділення колонковою хроматографією на силікагелі в присутності метилхлориду як розчинника

Приклад I-2-b-1

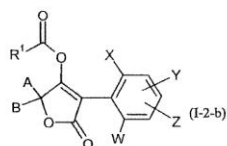


0,12 г сполуки згідно з прикладом I-2-a-1 помі-
щають в 10 мл дихлорметану та 0,05 мл триети-

ламіну та при охолодженні льодом додають 0,04 г
хлориду ізомасляної кислоти. Протягом 8 годин
перемішують при кімнатній температурі. Потім
промивають 10% лимонною кислотою, фази роз-
діляють. Органічну фазу сушать, а розчинник від-
ганяють.

Вихід 0,04 г (28 % від теор.) Т. сп. 150-152 °С
¹H-ЯМР (CD₃CN) δ = 1,1 (д, 6H), 1,5 (с, 6H), 2,8
(м, 1H), 7,5 - 8,2 (м, 5H) м.ч.

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

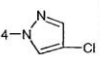
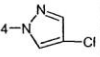
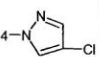
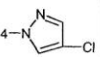


Прикл. №	W	X	Y	Z	A	B	R ¹	T, °C
I-2-b-2	C ₂ H ₅	Cl	H		CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇	*7,64, 7,70 (2с, 2H, Ar-H) 7,71, 8,27 (2с, 2H, Pyr-H)
I-2-b-3	C ₂ H ₅	Cl	H		-(CH ₂) ₄ -		i-C ₃ H ₇	*7,63, 7,70 (2с, 2H, Ar-H) 7,71, 8,27 (2с, 2H, Pyr-H)

Таблиця I-2-b (продовження)

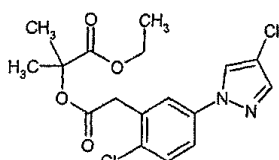
Прикл. №	W	X	Y	Z	A	B	R ¹	T, °C
I-2-b-4	C ₂ H ₅	Cl	H		-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		i-C ₃ H ₇	транс-ізомер 1) *3,31 (с, 3H, O-CH ₃) 7,63, 7,70 (2с, 2H, Ar-H) 7,71, 8,27 (2с, 2H, nPr-H)
I-2-b-5	C ₂ H ₅	Cl	H		-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		i-C ₃ H ₇	цис-ізомер 1) *3,34 (с, 3H, O-CH ₃) 7,63, 7,70 (2с, 2H, Ar-H) 7,21, 8,27 (2с, 2H, nPr-H)
I-2-b-6	CH ₃	C ₂ H ₅	H		CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇	*7,48, 7,49 (2с, 2H, Ar-H) 7,67, 8,23 (2с, 2H, nPr-H)

Таблиця І-2-в (продовження)

Прикл. №	W	X	Y	Z	A	B	R ¹	T, °C
I-2-b-7	CH ₃	C ₂ H ₅	H		-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		i-C ₃ H ₇	*7,48, 7,50 (2 c, 2H, Ar-H) 7,67, 8,23 (2 c, 2H, nPr-H)
I-2-b-8	CH ₃	C ₂ H ₅	H		-(CH ₂) ₅ -		i-C ₃ H ₇	*7,47, 7,48 (2 c, 2H, Ar-H) 7,67, 8,22 (2 c, 2H, nPr-H)
I-2-b-9	CH ₃	C ₂ H ₅	H		-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		i-C ₃ H ₇	транс-ізомер ¹⁾ *3,30 (с, 3H, O-CH ₃) 7,48, 7,50 (2 c, 2H, Ar-H) 7,67, 8,23 (2 c, 2H, nPr-H)
I-2-b-10	CH ₃	C ₂ H ₅	H		-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		-C ₃ H ₇	цис-ізомер ¹⁾ *7,48, 7,49 (2 c, 2H, Ar-H) 7,67, 8,22 (2 c, 2H, nPr-H)

¹H-ЯМР (400 МГц, d₆-ДМСО): δ в м.ч. ¹⁾ розділення колонковою хроматографією на силікагелі в присутності метиленхлориду як розчинника

Приклад III-1



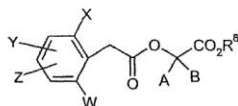
0,9 г етилового естеру гідроксиізомасляної кислоти та 2 г хлориду 2-хлор-5-N-(4-

хлорпіразоліл)фенілоцтової кислоти при кип'ятінні зі зворотнім холодильником протягом 8 годин змішують з 20 мл толуолу. Розчинник відганяють, а залишок сушать.

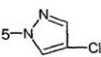
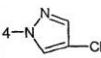
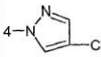
Вихід: 2,2 г (83 % від теор.)

¹H-ЯМР (400 МГц, d₆ ДМСО): δ = 1,15 (т, 3H, CH₂-CH₃), 1,50 (с, 6H, C(CH₃)₂), 4,05 (кв, 2H, O-CH₂-CH₃), 7,3 - 8,8 (м, 5H) м.ч.

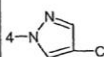
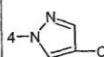
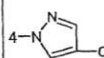
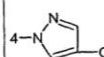
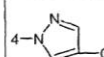
Аналогічно прикладу (III-1) та згідно із загальною інформацією про одержання одержують такі сполуки формули (III)



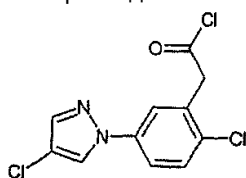
(III)

Прикл. №	W	X	Y	Z	A	B	R ⁸	T, °C
III-2	H	Cl	H		-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		C ₂ H ₅	*7,18, 7,25 (2 c, 2H, Ar-H) 7,88, 8,75 (2 c, 2H, Pyr-H)
III-3	C ₂ H ₅	Cl	H		CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	*7,57, 7,67 (2 c, 2H, Ar-H) 7,69, 8,23 (2 c, 2H, Pyr-H)
III-4	C ₂ H ₅	Cl	H		-(CH ₂) ₄ -		C ₂ H ₅	*7,58, 7,67 (2 c, 2H, Ar-H) 7,69, 8,24 (2 c, 2H, Pyr-H)

Таблиця III (продовження)

Прикл. №	W	X	Y	Z	A	B	R ⁸	Т.сп. °C
III-5	C ₂ H ₅	Cl	H		-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		C ₂ H ₅	*7,58, 7,67 (2с, 2H, Ar-H) 7,69, 8,24 (2с, 2H, nрp-H)
III-6	CH ₃	C ₂ H ₅	H		-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		C ₂ H ₅	*7,44, 7,45 (2с, 2H, Ar-H) 7,66, 8,19 (2с, 2H, nрp-H)
III-7	CH ₃	C ₂ H ₅	H		-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		C ₂ H ₅	*7,43, 7,44 (2с, 2H, Ar-H) 7,65, 8,19 (2с, 2H, nрp-H)
III-8	CH ₃	C ₂ H ₅	H		-(CH ₂) ₅ -		C ₂ H ₅	*7,43, 7,45 (2с, 2H, Ar-H) 7,65, 8,19 (2с, 2H, nрp-H)
III-9	CH ₃	C ₂ H ₅	H		CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	*7,42, 7,43 (2с, 2H, Ar-H) 7,65, 8,19 (2с, 2H, nрp-H)

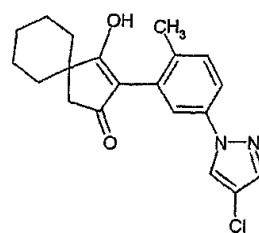
Приклад XXV-1



До 4 г 2-хлор-5-N-(4-хлорпіразоліл)фенілоцтової кислоти в 100 мл дихлорметану при кімнатній температурі по краплях додають 2,3 г дихлорида оксалевої кислоти. Протягом 8 годин перемішують при кімнатній температурі. Потім до завершення газовиділення кип'ятять зі зворотнім холодильником. Розчинник відганяють, а залишок дегазують.

Вихід: 4,25 г (99 % від теор.), ГХ/МС: М⁺ 285 м/е.

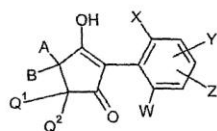
Приклад I-6-a-1



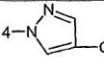
1,73 г (15,4 ммоль) трет-бутилату калію поміщають в 20 мл ДМФА та додають 3,0 г (7,7 ммоль) сполуки згідно з прикладом VIII-1 в 10 мл ДМФА. Протягом 3 годин перемішують при 50 °C Реакційний розчин охолоджують, додають 600 мл холодного 1 N HCl, осад відсмоктують та сушать.

Вихід: 2,4 г (87 % від теор.). Т.сп.: > 250 °C

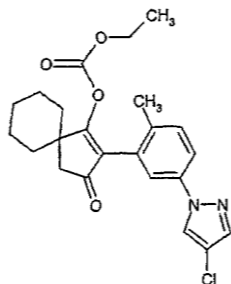
Аналогічно прикладу (I-6-a-1) та згідно із загальною інформацією про одержання одержують такі сполуки формули (I-6-a)'



(I-6-a)

Прикл. №	W	X	Y	Z	A	B	Q ¹	Q ²	Т.сп. °C
I-6-a-2	CH ₃	CH ₃	H		-(CH ₂) ₅ -		H	H	223-230

Приклад I-6-с-1

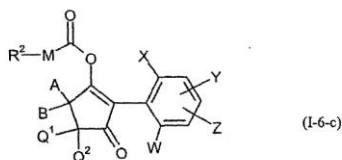


300 мг сполуки згідно з прикладом I-6-а-1 поміщають 5 мл безводного ацетону, додають 0,174 г карбонату калію. Потім додають 0,119 г етилового естеру хлор мурашиної кислоти. Протягом 3 годин перемішують при температурі 50 °С.

Реакційний розчин концентрують, поміщають в 10 мл CH_2Cl_2 та промивають 10 мл H_2O . Органічну фазу ВІДДІЛЯЮТЬ, а розчинник відганяють.

Вихід: 0,36 г (96 % від теор.). Т.сп.: 132 °С.

Аналогічно прикладу (I-6-с-1) та згідно із загальною інформацією про одержання одержують такі сполуки формули (I-6-с)

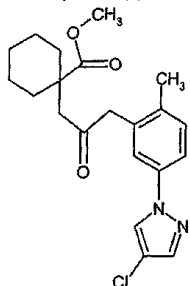


(I-6-с)

Прикл. №	W	X	Y	Z	A	B	Q ¹	Q ²	M	R ²	T, °C
I-6-с-2	H	CH ₃	H	5-N-Cl	-(CH ₂) ₅ -		H	H	O	i-C ₃ H ₇	Віск *1,19, (д, 6H, CH(CH ₃) ₂), 4,77 (м, 1H, O-CH)
I-6-с-3	H	CH ₃	H	5-N-Cl	-(CH ₂) ₅ -		H	H	S	i-C ₄ H ₉	Віск *2,09, (с, 3H, Ar-CH ₃) 8,75 (с, 1H, Py-H)
I-6-с-4	H	CH ₃	H	5-N-Cl	-(CH ₂) ₅ -		H	H	O	C ₆ H ₅ -CH ₂	Віск *2,05, (с, 3H, Ar-CH ₃) 5,10 (с, 2H, O-CH ₂) 7,29-7,37 (м, 6H, Ar-H)

* ¹H-ЯМР (400 МГц, CDCl₃): δ в м.ч.

Приклад VIII-1



До 8,6 г (22,9 ммоль) сировини згідно з прикладом XXXV-1 в 100 мл безводного ацетону додають 3,2 г (22,9 ммоль) карбонату калію та 8,1 г (57,3 ммоль) = 3,6 мл метилйодиду. Протягом 16

годин перемішують при кип'ятінні зі зворотнім холодильником.

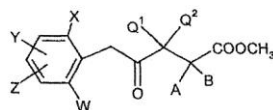
Реакційний розчин охолоджують, осад відсмоктують та промивають ацетоном.

Очищують колонковою хроматографією на силікагелі (дихлорметан : петролейний етер 2:1 → 4:1 → 8:1 → дихлорметан).

Вихід: 3 г (34 % від теор.).

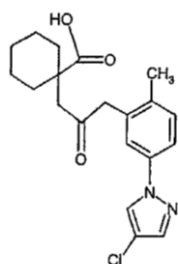
¹H-ЯМР (400 МГц, d₆-ДМСО): δ = 1,30-1,78 (м, 10H, циклогексил-Н), 2,10 (с, 3H, CH₃-арил), 3,51 (с, 3H, CO₂Me), 7,28 (д, 1H, арил-Н), 7,54-7,60 (м, 2H, арил-Н), 7,82, 8,72 (2с, по 1H, 2 піразоліл-Н) м.ч.

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



Прикл. №	W	X	Y	Z	A	B	Q ¹	Q ²	T.сн. °C
VIII-2	CH ₃	CH ₃	H		-(CH ₂) ₅ -		H	H	

Приклад XXXV-1



До розчину 9,44 мл ЛДА-розчину (2 молярного) в 30 мл безводного ТГФ по краплях при -15 °С додають розчин 5,0 г (18,9 ммоль) метилового естеру 2-метил-5-[1-(4-хлорпіразоліл)феніл]оцтової кислоти в 10 мл ТГФ та протягом 60 хвилин перемішують при 0 °С.

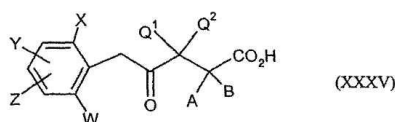
Потім при -15 °С по краплях додають розчин 4,13 г (18,9 ммоль) хлориду метилового естеру 3,3-пентаметиленбурштинової кислоти в 10 мл безводного ТГФ та одночасно 14,2 мл ЛДА-розчину (2,0 молярного; 1,5 екв.). Суміш протягом 2 годин перемішують при кімнатній температурі та потім додають 150 мл крижаного 10 %-ного розчину хлориду амонію.

Проміжний продукт екстрагують метил-трет-бутиловим етером, розчинник відганяють. Залишок протягом 3 годин кип'яють зі зворотнім холодильником з 10 г КОН та 100 мл води.

Реакційний розчин охолоджують, підкислюють концентрованою НСІ та екстрагують 200 мл CH₂Cl₂, сушать, а розчинник відганяють.

Вихід: 8,6 г (66,8 % від теор.).

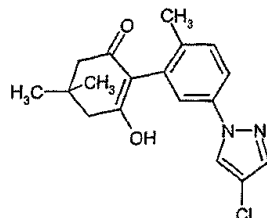
Аналогічно прикладу (XXXV-1) та згідно із загальною інформацією про одержання одержують такі сполуки формули (XXXV)



Прикл. №	W	X	Y	Z	A	B	Q ¹	Q ²	T.сн. °C
XXXV-2	CH ₃	CH ₃	H		-(CH ₂) ₅ -		H	H	*

* як сировину піддають перетворенню до одержання сполуки формули (VIII-2)

Приклад I-7-a-1



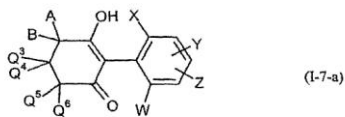
До 0,49 г (4,4 ммоль, 2,0 екв.) трет-бутилату калію в 5 мл ДМФА додають 0,80 г (2,2 ммоль) сполуки з прикладу IX-1 в 2 мл ДМФА.

Протягом 3 годин перемішують при 50 °С. Додають 20 мл крижаної води та наповнюють холодним 1 N розчином НСІ до 250 мл, потім екстрагують дихлорметаном. Органічну фазу сушать та концентрують.

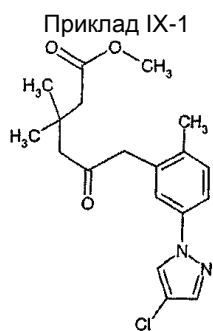
Залишок очищують колонковою хроматографією на силікагелі (петролейний етер : етилацетат 2:1).

Вихід: 0,15 г (21 % від теор.). Т.сп.: 172 °С

Аналогічно прикладу (I-7-a-1) та згідно із загальною інформацією про одержання одержують такі сполуки формул (I-7-a)



Прикл. №	W	X	Y	Z	A	B	Q ³	Q ⁴	Q ⁵	Q ⁶	Т.сп. °C
I-7-a-2	H	CH ₃	H		H	H	-(CH ₂) ₄ -		H	H	241



До 4,0 г сировини згідно з прикладом XXXIX-1 в 50 мл безводного ацетону додають 1,58 г карбонату калію та 4,07 г (2,5 екв.) = 1,79 мл метило-

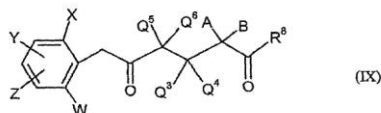
диду. Протягом 16 годин перемішують при кип'ятінні зі зворотнім холодильником. Реакційну суміш охолоджують, осад відсмоктують та промивають ацетоном.

Очищують колонковою хроматографією на silicaгелі градієнтом (метиленхлорид : етилацетат 50:1 → 5:1).

Вихід: 0,8 г (15 % від теор.).

¹H-ЯМР (400 МГц, d₆-ДМСО): δ = 1,03 (с, 6H, CH₃), 2,18 (с, 3H, CH₃-арил), 3,57 (с, 3H, CO₂Me) 7,30 (д, 1H, арил-H), 7,57-7,61 (м, 2H, арил-H), 7,83, 8,72 (2с, по 1H, 2 піразоліл-H) м.ч.

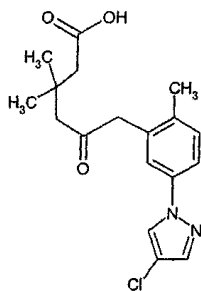
Аналогічно прикладу (IX-1) та згідно із загальною інформацією про одержання одержують такі сполуки формули (IX)



Прикл. №	W	X	Y	Z	A	B	Q ³	Q ⁴	Q ⁵	Q ⁶	R ⁸	Т.сп. °C
IX-2	H	CH ₃	H		H	H	-(CH ₂) ₄ -		H	H	CH ₃	*

*¹H-ЯМР (δ₆-400 МГц ДМСО): δ = 1,05-1,50 (м, 8H, циклопентил-H), 2,13 (с, 3H, CH₃-арил), 3,52 (с, 3H, CO₂Me), 7,28 (д, 1H, арил-H), 7,82, 8,70 (2с, по 1H, 2 піразоліл-H) м.ч.

Приклад XXXIX-1



До розчину 5,7 мл ЛДА-розчину (2 молярного; 10 екв.) в 20 мл безводного ТГФ по краплях при -15 °C додають розчин 3,0 г (11,3 ммоль) метилового естеру 2-метил-5-[1-(4-

хлорпіразоліл)феніл]оцтової кислоти в 50 мл ТГФ та протягом 60 хвилин перемішують при 0 °C.

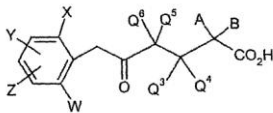
Потім при -15 °C по краплях додають розчин 1,61 г (11,3 ммоль; 1,0 екв.) ангідриду диметилглутарової кислоти в 10 мл безводного ТГФ та одночасно 8,52 мл ЛДА-розчину (2,0 молярного; 1,5 екв.). Суміш протягом 2 годин перемішують при кімнатній температурі та потім додають 150 мл крижаного 10 %-ного розчину хлориду амонію. Підкислюють концентрованою HCl.

Проміжний продукт екстрагують метил-трет-бутиловим етером, розчинник відганяють. Залишок протягом 4 годин кип'ятять зі зворотнім холодильником з 7 г КОН та 70 мл води.

Реакційний розчин охолоджують, підкислюють концентрованою HCl та екстрагують 200 мл

CH₂Cl₂, сушать, а розчинник відганяють.
Вихід: 4 г.

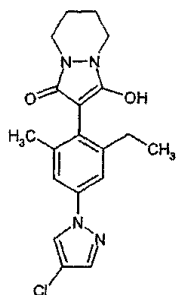
Аналогічно прикладу (XXXIX-1) та згідно із загальною інформацією про одержання одержують такі сполуки формули (XXXIX)



Прикл. №	W	X	Y	Z	A	B	Q ³	Q ⁴	Q ⁵	Q ⁶	T.сп.°C
XXXIX-2	H	CH ₃	H		H	H	-(CH ₂) ₄ -		H	H	*

* Сполуку як сировину застосовують для одержання сполук із прикладу IX-2

Приклад I-8-a-1

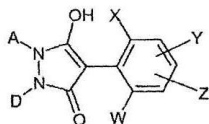


дають у крижану соляну кислоту, а осад відсмокчують.

Вихід: 1,1 г (81 % від теор.). Т.сп. 258 °C

0,85 г трет-бутилату калію змішують з 36 мл N,N-диметилацетаміду, в N,N-диметилацетамід повільно по краплях додають 1,6 г сполуки з прикладу (XII-1) при 60 °C та перемішують протягом 1 години. Після охолодження розчин по краплях до-

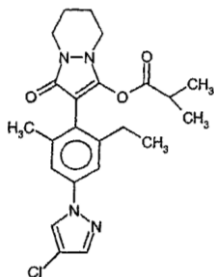
Аналогічно прикладу (I-8-a-1) та згідно із загальною інформацією про одержання одержують такі сполуки формули (I-8-a)



(I-8-a)

Прикл. №	W	X	Y	Z	A	D	T.сп.°C
I-8-a-2	CH ₃	C ₂ H ₅	H		-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		>300

Приклад I-8-b-7

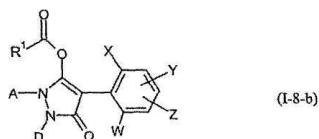


0,2 г сполуки з прикладу I-8-a-1 поміщують в 30 мл дихлорметану та додають 0,067 г триетиламіну та 0,054 г 2-метилпропіонілхлориду та перемішують протягом 3 годин.

Суміш розріджують водою та екстрагують. Органічну фазу сушать, розчинник відганяють. До залишку додають н-гептан та незначну кількість дихлорметану. Продукт кристалізується, після чого його відсмокчують.

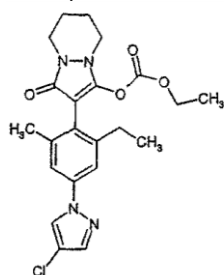
Вихід: 0,19 г (81 % від теор.). Т.сп.: 161,4 °C

Аналогічно прикладу (I-8-b-1) та згідно із загальною інформацією про одержання одержують такі сполуки формули (I-8-b)



Прикл. №	W	X	Y	Z	A	D	R ¹	T, °C
I-8-b-2	CH ₃	C ₂ H ₅	H		-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		i-C ₃ H ₇	138,4
I-8-b-3	CH ₃	C ₂ H ₅	H		-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂		CH ₂ -OCH ₃	252,6
I-8-b-4	CH ₃	C ₂ H ₅	H		-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂		t-C ₄ H ₉	119,1
I-8-b-5	CH ₃	C ₂ H ₅	H		-(CH ₂) ₄ -		CH ₂ -OCH ₃	259
I-8-b-6	CH ₃	C ₂ H ₅	H		-(CH ₂) ₄ -		t-Bu	204,8

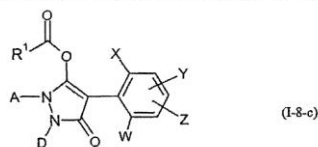
Приклад I-8-c-1



0,25 г сполуки з прикладу (I-8-a-1) поміщають в 36 мл дихлорметану, додають 0,12 мл триетила-

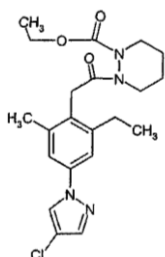
міну, при кімнатній температурі по краплях додають 0,06 мл етилового естру хлормурашиної кислоти, розчиненого в дихлорметані, та перемішують протягом 1 години. Після ЦЬОГО розріджують водою та екстрагують. Органічну фазу сушать, розчинник відганяють. До залишку додають н-гептан та незначну кількість дихлорметану. Продукт кристалізується, після чого його відсмоктують. Вихід: 0,2 г (81 % від теор.). Т.сп.: 161,4 °C

Аналогічно прикладу (I-8-b-1) та згідно із загальною інформацією про одержання одержують такі сполуки формули (I-8-c)



Прикл. №	W	X	Y	Z	A	D	M	R ²	T, °C
I-8-c-2	CH ₃	C ₂ H ₅	H		-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		O	C ₂ H ₅	230

Приклад (XII-1)

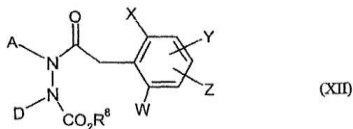


4-((4-хлорпіразоліл)-2-етил-6-метилфенілоцтової кислоти поміщають в 35 мл дихлорметану та додають 1,28 г дихлориду щавлевої кислоти. Перемішують при кип'ятінні зі зворотнім холодильником та додають 1 мл диметилформаміду, коли газовиділення зменшиться. Ще раз перемішують при кип'ятінні зі зворотнім холодильником, після чого охолоджують в атмосфері захисного газу. Розчинник відганяють. Залишок поміщають в дихлорметан та по краплях додають до розчину 1,2 г 1-етоксикарбоніл-

гексагідропіридазину в 35 мл дихлорметану та 1,6 мл триетиламіну. Протягом 3 годин перемішують при кімнатній температурі, потім екстрагують водою та дихлорметаном. Органічну фазу відділяють, сушать, а розчинник відганяють.

Вихід: 2 г (63 % від теор.).
¹H-ЯМР (300 МГц, CDCl₃): δ = 2,6 (кв, 2H, Ar-CH₂CH₃), 4,3 (кв, 2H, O-CH₂CH₃), 7,3, 7,35 (2с, 2H, ArH), 7,6, 7,9 (2с, 2H, пір-H) м.ч.

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

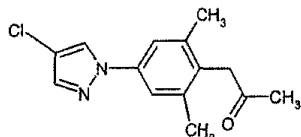


Прикл. №	W	X	Y	Z	A	D	R ⁸	T, °C
XII-2	CH ₃	C ₂ H ₅	H		-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		C ₂ H ₅	87

Приклади згідно зі способом Q

Приклад XXXII-1

Метилловий естер (4-N-[4-хлорпіразоліл]-2,6-диметил)феніл оцтової кислоти



16,6 г (162 ммоль) 4-хлорпіразолу, 10,3 г (54 ммоль) йодиду міді (I) та 56 г (405 ммоль) карбонату калію (сухого) в атмосфері аргону поміщають в 350 мл абсолютного ДМФА та перемішують протягом 5 хвилин. Потім повільно по краплях додають 34,7 г (135 ммоль) метилового естеру (4-бром-2,6-диметил)фенілоцтової кислоти. Реакційну суміш протягом 4 днів перемішують при 105 °С. При цьому перебіг реакції контролюють ГХ та відповідно через 24 години (загалом тричі) додають 2,6 г (13,5 ммоль) йодиду міді (I) та 4,15 г (40,5 ммоль) 4-хлорпіразолу. Після охолодження реакційної суміші розчинник відганяють у вакуумі, залишок фільтрують коротким пористим скляним фільтром із силікагелем, після чого очищують хроматографією.

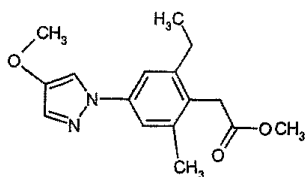
Вихід: 17,2 г (46%).

¹H-ЯМР {400 МГц, CDCl₃}: 2,38 (с, 6H, CH₃); 3,70 (с, 3H, OCH₃); 3,71 (с, 2H, CH₂); 7,31 (с, 2H, Ph-H); 7,61 (с, 1H, піразоліл-H); 7,88 (с, 1H, піразоліл-H).

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

Приклад XXXII-2

Метилловий естер (2-етил-4-N-[4-метоксипіразоліл]-6-метил)фенілоцтової кислоти

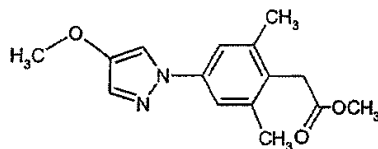


¹H-ЯМР {400 МГц, ДМСО-d₆}: 1.15 (t, ³J_{HH} = 7 Гц, 3H, CH₃); 2,28 (с, 3H, CH₃); 2,64 (кв, ³J_{HH} = 7 Гц, 2H, CH₂); 3,62 (с, 3H, OCH₃); 3,73 (с, 2H, CH₂); 3,76 (с, 3H, OCH₃); 7,46 (м, 2H, Ph-H); 7,50 (с, 1H, піразоліл-H); 8,24 (с, 1H, піразоліл-H).

МС/СІ:289(М+1).

Приклад XXXII-3

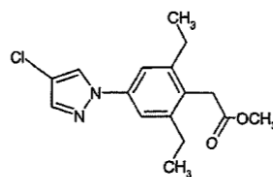
Метилловий естер (2,6-диметил-4-N-[4-метоксипіразоліл])фенілоцтової кислоти



¹H-ЯМР {400 МГц, ДМСО-d₆}: 2,30 (с, 6H, CH₃); 3,62 (с, 3H, OCH₃); 3,71 (с, 2H, CH₂); 3,76 (с, 3H, OCH₃); 7,46 (с, 2H, Ph-H); 7,50 (с, 1H, піразоліл-H); 8,22 (с, 1H, піразоліл-H).

Приклад XXXII-4

Метилловий естер (2,6-діетил-4-N-[4-хлорпіразоліл])фенілоцтової кислоти

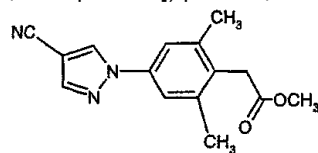


¹H-ЯМР {400 МГц, ДМСО-d₆}: 1.18 (t, ³J_{HH} = 7 Гц, 6H, CH₃); 2,61 (кв, ³J_{HH} = 7 Гц, 4H, CH₂); 3,57 (с, 3H, OCH₃); 3,79 (с, 2H, CH₂); 7,50 (м, 2H, Ph-H); 7,84 (с, 1H, піразоліл-H); 8,79 (с, 1H, піразоліл-H).

МС/СІ:307(М+1).

Приклад XXXII-5

Метилловий естер (2,6-диметил-4-N-[4-ціанопіразоліл])фенілоцтової кислоти

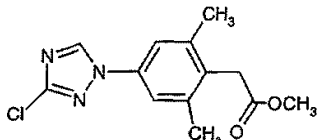


^1H -ЯМР {400 МГц, ДМСО- d_6 }: 2,31 (с, 6H, CH_3); 3,62 (с, 2H, CH_2); 3,74 (с, 3H, OCH_3); 7,52 (с, 2H, Ph-H); 8,05 (с, 1H, піразоліл-H); 8,82 (с, 1H, піразоліл-H).

МС/СІ: 270(M+1).

Приклад XXXII-6

Метильний естер (2,6-диметил-4-N-[3-хлортриазоліл])фенілоцтової кислоти

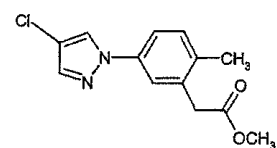


^1H -ЯМР {400 МГц, ДМСО- d_6 }: 2,26 (с, 6H, CH_3); 3,55 (с, 2H, CH_2); 3,79 (с, 3H, OCH_3); 7,44 (с, 2H, Ph-H); 9,22 (с, 1H, триазоліл-H).

МС/СІ: 280(M+1).

Приклад XXXII-7

Метильний естер (3-N-[4-хлорпіразоліл]-6-метил]фенілоцтової кислоти

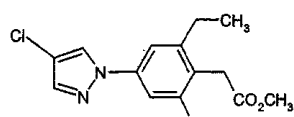


^1H -ЯМР {400 МГц, CDCl_3 }: 2,32 (с, 3H, CH_3); 3,67 (с, 2H, CH_2); 3,70 (с, 3H, OCH_3); 7,22 (м, 1H, Ph-H); 7,40 (м, 1H, Ph-H); 7,50 (м, 1H, Ph-H); 7,60 (с, 1H, піразоліл-H); 7,95 (с, 1H, піразоліл-H).

ГХМС/СІ 265 (M+1)

Приклад XXXII-8

Метильний естер (2-хлор-6-етил-4-[4-хлорпіразоліл])фенілоцтової кислоти

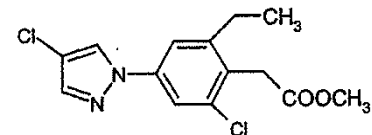


^1H -ЯМР {400 МГц, ДМСО- d_6 }: 1,18 (т, $^3J_{\text{HH}} = 7$ Гц, 3H, CH_3); 2,72 (кв, $^3J_{\text{HH}} = 7$ Гц, 2H, CH_2); 3,64 (с, 3H, OCH_3); 3,89 (с, 2H, CH_2); 7,69 (м, 1H, Ph-H); 7,81 (м, 1H, Ph-H); 7,89 (с, 1H, піразоліл-H); 8,88 (с, 1H, піразоліл-H).

МС/СІ: 313(M+1).

Приклад XXXII-9

Метильний естер (2-хлор-6-етил-4-[4-хлорпіразоліл])фенілоцтової кислоти

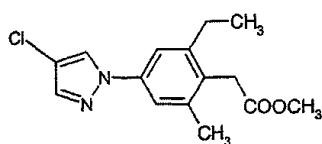


^1H -ЯМР {400 МГц, ДМСО- d_6 }: 1,18 (т, $^3J_{\text{HH}} = 7$ Гц, 3H, CH_3); 2,72 (кв, $^3J_{\text{HH}} = 7$ Гц, 2H, CH_2); 3,64 (с, 3H, OCH_3); 3,89 (с, 2H, CH_2); 7,69 (м, 1H, Ph-H); 7,81 (м, 1H, Ph-H); 7,89 (с, 1H, піразоліл-H); 8,88 (с, 1H, піразоліл-H).

МС/СІ: 313(M+1).

Приклад XXXII-10

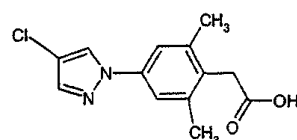
Метильний естер (2-етил-6-метил-4-[4-хлорпіразоліл])фенілоцтової кислоти



^1H -ЯМР {400 МГц, ДМСО- d_6 }: 1,18 (т, $^3J_{\text{HH}} = 7$ Гц, 3H, CH_3); 2,59 (кв, $^3J_{\text{HH}} = 7$ Гц, 2H, CH_2); 3,59 (с, 3H, OCH_3); 3,72 (с, 2H, CH_2); 7,51 (м, 2H, Ph-H); 7,89 (с, 1H, піразоліл-H); 8,78 (с, 1H, піразоліл-H).

МС/СІ: 313(M+1).

Приклад XXVIII-1 (4-N-[4-хлорпіразоліл]-2,6-диметил)фенілоцтова кислота



17,2 г (61,7 ммоль) (4-[4-хлорпіразоліл]-2,6-диметил)фенілоцтової кислоти розчиняють в 160 мл метанолу, додають 4,2 г (74 ммоль) гідроксиду калію в 160 мл води та протягом 12 годин нагрівають до 80 °С. Метанол відганяють на роторному випарнику, у залишку встановлюють значення рН 3, продукт, що випав у осад, відфільтровують та сушать.

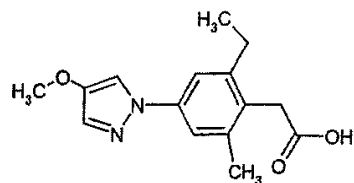
Вихід: 16,2 г (99%).

^1H -ЯМР {400 МГц, CDCl_3 }: 2,38 (с, 6H, CH_3); 3,73 (с, 2H, CH_2); 7,32 (с, 2H, Ph-H); 7,61 (с, 1H, піразоліл-H); 7,86 (с, 1H, піразоліл-H); кислота-ОН не виявлені.

Аналогічно прикладу (XXVIII-1) одержують такі сполуки формули (XXVIII).

Приклад XXVIII-2

(2-етил-4-N-[4-метоксипіразоліл]-6-метил)фенілоцтова кислота

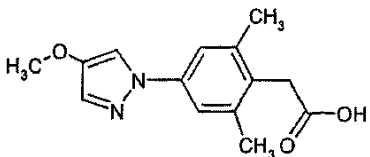


^1H -ЯМР {400 МГц, ДМСО- d_6 }: 1,17 (т, $^3J_{\text{HH}} = 1$ Гц, 3H, CH_3); 2,30 (с, 3H, CH_3); 2,65 (кв, $^3J_{\text{HH}} = 7$ Гц, 2H, CH_2); 3,63 (с, 2H, CH_2); 3,77 (с, 3H, OCH_3); 7,45 (м, 2H, Ph-H); 7,50 (с, 1H, піразоліл-H); 8,23 (с, 1H, піразоліл-H); 12,5 (с, 1H, OH).

МС/СІ: 275(M+1).

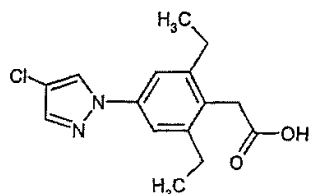
Приклад XXVIII-3

(2,6-диметил-4-N-[4-метоксипіразоліл])фенілоцтова кислота



^1H -ЯМР {400 МГц, ДМСО- d_6 }: 2,30 (с, 6H, CH_3); 3,61 (с, 2H, CH_2); 3,82 (с, 3H, OCH_3); 7,44 (с, 2H, Ph-H); 7,50 (с, 1H, піразоліл-H); 8,21 (с, 1H, піразоліл-H); 12,4 (с, 1H, OH).

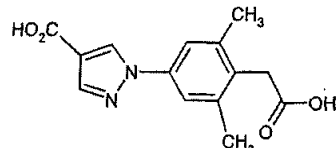
Приклад XXVIII-4
(2,6-діетил-4-N-[4-хлорпіразоліл])фенілоцтова кислота



^1H -ЯМР {400 МГц, ДМСО- d_6 }: 1,18 (т, $^3J_{\text{HH}} = 8$ Гц, 6H, CH_3); 2,63 (кв, $^3J_{\text{HH}} = 8$ Гц, 4H, CH_2); 3,67 (с, 2H, CH_2); 7,50 (с, 2H, Ph-H); 7,85 (с, 1H, піразоліл-Н); 8,79 (с, 1H, піразоліл-Н); 12,5 (с, 1H, OH).

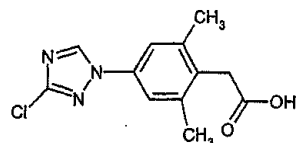
МС/СІ: 293(M+1).

Приклад XXVIII-5
(2,6-диметил-4-N-[4-карбоксилатопіразоліл])фенілоцтова кислота



^1H -ЯМР {400 МГц, ДМСО- d_6 }: 2,32 (с, 6H, CH_3); 3,64 (с, 2H, CH_2); 7,52 (с, 2H, Ph-H); 8,09 (с, 1H, піразоліл-Н); 8,87 (с, 1H, піразоліл-Н); 12,3 (с, 2H, OH).

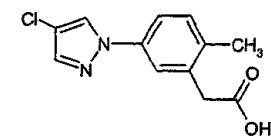
Приклад XXVIII-6
(2,6-диметил-4-N-[3-хлортриазоліл])фенілоцтова кислота



^1H -ЯМР {400 МГц, ДМСО- d_6 }: 2,26 (с, 6H, CH_3); 3,56 (с, 2H, CH_2); 7,44 (с, 2H, Ph-H); 9,22 (с, 1H, триазоліл-Н); 12,2 (с, 1H, OH).

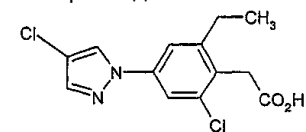
МС/СІ: 266 (M+1).

Приклад XXVIII-7
(3-N-[4-хлорпіразоліл]-6-метил)фенілоцтова кислота



^1H -ЯМР {400 МГц, CDCl_3 }: 2,34 (с, 3H, CH_3); 3,71 (с, 2H, CH_2); 7,26 (м, 1H, Ph-H); 7,40 (м, 1H, Ph-H); 7,52 (м, 1H, Ph-H); 7,62 (с, 1H, піразоліл-Н); 7,85 (с, 1H, піразоліл-Н); кислота-ОН не виявлені.

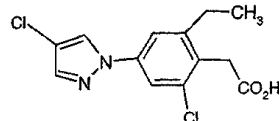
Приклад XXVIII-8



^1H -ЯМР {400 МГц, ДМСО- d_6 }: 1,17 (т, $^3J_{\text{HH}} = 7$ Гц, 3H, CH_3); 2,71 (кв, $^3J_{\text{HH}} = 7$ Гц, 2H, CH_2); 3,79 (с, 2H, CH_2); 7,69 (м, 1H, Ph-H); 7,79 (м, 1H, Ph-H); 7,91 (с, 1H, піразоліл-Н); 8,88 (с, 1H, піразоліл-Н); 12,6 (с, 1H, OH).

МС/СІ: 299 (M+1).

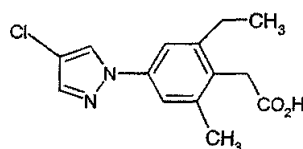
Приклад XXVIII-9
(2-хлор-6-етил-4-[4-хлорпіразоліл])фенілоцтова кислота



^1H -ЯМР {400 МГц, ДМСО- d_6 }: 1,17 (т, $^3J_{\text{HH}} = 7$ Гц, 3H, CH_3); 2,71 (кв, $^3J_{\text{HH}} = 7$ Гц, 2H, CH_2); 3,79 (с, 2H, CH_2); 7,69 (м, 1H, Ph-H); 7,79 (м, 1H, Ph-H); 7,91 (с, 1H, піразоліл-Н); 8,88 (с, 1H, піразоліл-Н); 12,6 (с, 1H, OH).

МС/СІ: 299(M+1).

Приклад XXVIII-10
(2-етил-6-метил-4-[4-хлорпіразоліл])фенілоцтова кислота



^1H -ЯМР {400 МГц, ДМСО- d_6 }: 1,19 (т, $^3J_{\text{HH}} = 7$ Гц, 3H, CH_3); 2,60 (кв, $^3J_{\text{HH}} = 7$ Гц, 2H, CH_2); 3,81 (с, 2H, CH_2); 7,52 (м, 2H, Ph-H); 7,83 (с, 1H, піразоліл-Н); 8,62 (с, 1H, піразоліл-Н); ОН не виявлено.

Приклади застосування

Приклад А

Дослідження Meloidogyne

Розчинник: 7 ваг. частин диметилформаміду

Емульгатор: 2 ваг. частини алкіларилполігліколевого етеру

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

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

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

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

Таблиця А
Фітотоксичні нематоди
Дослідження *Meloidogyne*

Активна речовина	Концентрація активн. реч. в м.ч.	Ступінь відмирання в % через 14 днів
Приклад І-1-а-2	20	100
Приклад І-6-а-2	20	100

Приклад В

Дослідження *Myzus* (обробка обприскуванням)

Розчинник: 78 ваг. частин ацетону, 1,5 ваг. частин диметилформаміду

Емульгатор: 0,5 ваг. частин алкіларилгліколевого етеру

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

Листи капусти (*Brassica oleracea*), сильно вражені персиковою попелицею (*Myzus persicae*), обробляють обприскуванням композицією активних речовин бажаної концентрації.

Через необхідний проміжок часу визначають ступінь відмирання у %. При цьому 100% означає, що відбулося повне відмирання попелиці, 0 % свідчить про відсутність ефекту відмирання.

Відповідно до результатів даного дослідження високу активність проявляє, наприклад, така сполука з прикладів одержання:

Таблиця В
Фітотоксичні комахи
Дослідження *Myzus*

Активна речовина	Концентрація активн. реч. в г/га.	Ступінь відмирання в % через 4 дні
Приклад І-1-а-3	100	80

Приклад С

Дослідження личинок *Phaedon*

Розчинник: 7 ваг. частин диметилформаміду

Емульгатор: 2 ваг. частини алкіларилгліколевого етеру

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

Листи капусти (*Brassica oleracea*) обробляють шляхом занурення в композицію активних речовин необхідної концентрації, і доки листи залишаються вологими, насаджують личинки листоїда хрінового (*Phaedon cochleariae*).

Через необхідний проміжок часу визначають ступінь відмирання личинок у %. При цьому 100 % означає, що відбулося повне відмирання личинок, 0 % свідчить про відсутність ефекту відмирання.

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

Таблиця С
Фітотоксичні комахи
Дослідження личинок *Phaedon*

Активна речовина	Концентрація активн. реч. в м.ч.	Ступінь відмирання в % через 7 днів
Приклад І-6-а-1	500	90
Приклад І-7-а-1	500	100
Приклад І-7-а-2	500	100

Приклад D

Дослідження *Spodoptera frugiperda*

Розчинник: 7 ваг. частин диметилформаміду

Емульгатор: 2 ваг. частини алкіларилгліколевого етеру

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

Листи капусти (*Brassica oleracea*) обробляють шляхом занурення в композицію активних речовин необхідної концентрації, і доки листи залишаються вологими, насаджують гусениці «похідних хробаків» (*Spodoptera frugiperda*).

Через необхідний проміжок часу визначають ступінь відмирання личинок у %. При цьому 100 % означає, що відбулося повне відмирання гусениць, 0 % свідчить про відсутність ефекту відмирання.

Відповідно до результатів даного дослідження високою активністю проявляють, наприклад, такі сполуки з прикладів одержання:

Таблиця D
Фітотоксичні комахи
Дослідження *Spodoptera frugiperda*

Активні речовини	Концентрація актив. реч. в м.ч.	Ступінь відмирання в % через 7 днів
Прикл. І-1-а-1	100	85

Приклад E

Дослідження кліщів *Tetranychus* (ОР-стійкість при обробці зануренням)

Розчинник: 78 ваг. частин ацетону, 1,5 ваг. частин диметилформаміду,

Емульгатор: 0,5 ваг. частин алкіларилгліколевого етеру

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

Бобові рослини (*Phaseolus vulgaris*), сильно вражені кліщем павутинним (*Tetranychus urticae*), обробляють шляхом занурення в композицію активних речовин необхідної концентрації.

Через необхідний проміжок часу визначають ступінь відмирання личинок у %. При цьому 100 % означає, що відбулося повне відмирання кліщів, 0 % свідчить про відсутність ефекту відмирання.

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

Таблиця Е
Фітотоксичні кліщі
Дослідження *Tetranychus* (ОР-стійкість при обробка зануренням)

Активні речовини	Концентрація актив. реч. в м.ч.	Ступінь відмирання в % через 7 днів
Прикл. I-1-a-2	20	90

Приклад F Дослідження *Sphaerotheca* (на оріпках) / захисна дія

Розчинник: 24,5 ваг. частин ацетону, 24,5 ваг. частин диметилформаміду,

Емульгатор: 1 ваг. частина алкіларилгліколевого етеру

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

Для дослідження захисної дії молоді рослини обприскують композицією активної вказаної витратної кількості. Після висихання розчину для обприскування рослини заражають водною суспензією спор *Sphaerotheca fuliginea*. Після цього їх при температурі приблизно 23 °C та відносній вологості повітря приблизно 70 % поміщають в теплицю.

Через 7 днів після зараження здійснюють оцінку. При цьому 0 % означає, що ефективність відповідає необробленій контрольній групі, а 100 % свідчить про те, що зараження не спостерігається.

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

Таблиця F
Дослідження *Sphaerotheca* (на оріпках) / захисна дія

Активні речовини	Витратна кількість актив. реч. в г/га	Ступінь активності в %
Прикл. I-6-a-2	100	97

Приклад G

Дослідження *in vitro* для визначення ED₅₀ у мікроорганізмів

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

Попередньо середовище насичують відповідною концентрацією спор або міцелієм досліджуваного гриба.

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

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

Оцінювання відбувається фотометричним способом при довжині хвилі 620 нм На основі за-

стосування різних концентрацій підраховують дозу активної речовини, яка приводить до 50%-ного інгібування росту грибів по відношенню до необроблених контрольних зразків (ED₅₀).

Таблиця G

Дослідження *in vitro* для визначення ED₅₀ у мікроорганізмів

Активна речовина	Мікроорганізми	Показник ED ₅₀
Приклад I-6-a-2	<i>Botrytis cinerea</i>	< 0,1
Приклад I-6-c-1	<i>Botrytis cinerea</i>	< 0,1

Приклад H

Дослідження після сходження

Розчинник: 5 ваг. частин ацетону

Емульгатор: 1 ваг. частини алкіларилгліколевого етеру

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

Рослини довжиною від 5 до 15 см обприскують комбінацією активних речовин, так щоб необхідна кількість активних речовин потрапляла по одиначу площі поверхні. Концентрацію розчину для обприскування обирають такою, щоб 1 000 л води на га містили необхідну кількість активних речовин.

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

При цьому:

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

100 % = повне знищення

Приклад I

Дослідження перед сходженням

Розчинник: 5 ваг. частин ацетону

Емульгатор: 1 ваг. частини алкіларилгліколевого етеру

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

Насіння досліджуваних рослин висівають у нормальний ґрунт. Через приблизно 24 години ґрунт обприскують композицією активних речовин, так щоб необхідна кількість активних речовин потрапляла по одиницю площі поверхні. Концентрацію розчину для обприскування обирають такою, щоб 1 000 л води на га містили необхідну кількість активних речовин.

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

При цьому:

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

100 % = повне знищення

До сходження	теплиця	г а.р./га	Alopecurus	Avena fatua	Echinochloa	Setaria	Amaranthus	Sinapis
Прикл I-1-a-3		250	100	100	100	100	100	80

Ж. Гербіцидна дія до сходження

Насіння одно- або дводольних бур'янів або культурних рослин висівають у дерев'яні горщики, заповнені піщаним суглинком, та покривають землею. Після цього досліджувану сполуку у вигляді змочуваного порошку (WP) або здатного до емульгування концентрату (EC) як водну суспензію або емульсію у різних дозуваннях при витратній кількості води 600 л/га при додаванні 0,2 % зв'язувального агента наносять на поверхню ґрунту.

Після обробки горщики поміщають у теплиці та тримають у сприятливих для росту умовах. Через 3 тижні після обробки рослин візуально визначають дію препаратів у порівнянні із необробленими контрольними групами (гербіцидна дія в %: 100% дії = рослини відмирають, 0 % дії = ніякого ефекту, як в контрольній групі).

К. Гербіцидна дія після сходження

Насіння одно- або дводольних бур'янів або культурних рослин висівають у дерев'яні горщики, заповнені піщаним суглинком, покривають землею та поміщають у теплицю за сприятливих для вегетації умов. Через 2-3 тижні після висівання піддослідні рослини обробляють на стадії 1 листка. Досліджувану сполуку у вигляді порошку для розпилення (WP) або рідини (EC) у різних дозуваннях при витратній кількості води 600 л/га при додаванні 0,2 % зв'язувального агента розбризкують на частини рослин. Через приблизно 3 тижні після обробки рослин візуально визначають дію препаратів у порівнянні із необробленими контрольними групами (гербіцидна дія в %: 100% дії = рослини відмирають, 0 % дії = ніякого ефекту, як в контрольній групі).

Після сходження	теплиця	г а.р./га	Цукровий буряк	Echinochloa	Setaria	Sorghum
Прикл I-1-a-1 (EC)		320	0	100	100	90

Опис дослідження для профілюючих тестів

Л. Гербіцидна дія після сходження

Насіння одно- або дводольних бур'янів або культурних рослин висівають у дерев'яні або пластмасові горщики, заповнені піщаним суглинком, покривають землею та поміщають у теплицю, протягом періоду вегетації також на відкрите повітря за межами теплиці, за сприятливих для вегетації умов. Через 2-3 тижні після висівання піддослідні рослини обробляють на стадії 1-3 листків. Досліджувану сполуку у вигляді порошку для розпилення (WP) або рідини (EC) у різних дозуваннях при витратній кількості води 300 л/га при додаванні зв'язувального агента (від 0,2 до 0,3 %) розбризкують на рослини та поверхню фунту. Через 3-4 тижні після обробки рослин візуально визначають дію препаратів у порівнянні із необробленими контрольними групами (гербіцидна дія в %: 100 % дії = рослини відмирають, 0 % дії = ніякого ефекту, як в контрольній групі).

Застосування сафенерів

Культурні рослини перед застосуванням досліджуваних речовин обприскують сафенером при певній витратній кількості на гектар

(зазвичай за 1 день до застосування досліджуваних речовин),

Порівнюючи дію досліджуваних речовин на культурні рослини, які не обробляють сафенером, можна оцінити дію сафенеру у порівнянні із необробленими рослинами контрольної групи.

Дослідження зернових в посудинах в теплиці

Таблиця

	Витратна кількість г а.р./га	Ярова пшениця помічено (%)
I-1-a-2	25	50
I-1-a-2 + мефенпір	25 + 100	10

Таблиця

	Витратна кількість г а.р./га	Яровий ячмінь помічено (%)
I-1-a-6	100	20
I-1-a-6 + мефенпір	100 + 100	0

Таблиця

	Витратна кількість г а.р./га	Яровий ячмінь помічено (%)	Ярова пшениця помічено (%)
I-1-a-7	25	95	60
I-1-a-7 + мефенпір	25 + 100	50	15

Таблиця

	Витратна кількість г а.р./га	Яровий ячмінь помічено (%)	Ярова пшениця помічено (%)
Прикл. I-2-a-6	100	20	15
	50	10	15
Прикл I-2-a-6 + мефенпір	100 + 100	5	10
	50 + 100	0	10

Таблиця

	Витратна кількість г а.р./га	Яровий ячмінь помічено (%)	Ярова пшениця помічено (%)
Прикл. I-2-a-5	100	20	40
	50	15	20
Прикл. I-2-a-5	100 + 100	0	10
+ мефенпір	50 + 100	0	10

Таблиця

	Витратна кількість г а.р./га	Яровий ячмінь помічено (%)	Ярова пшениця помічено (%)
Прикл. I-2-b-5	100	20	40
	50	15	40

Приклад L

Дослідження при граничній концентрації/

ґрунтові комахи - обробка трансгенних рослин

Піддослідні комахи: личинки *Diabrotica*
balteata у ґрунті

Розчинник: 7 ваг. частин ацетону

Емульгатор: 1 ваг. частини алкіларил-
гліколевого етеру

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

Комбінацію активних речовин виливають на поверхню ґрунту. При цьому концентрація активних речовин в комбінації не грає практично ніякої ролі, вирішальне значення має лише виражена у

м.ч. (мг/л) вагова кількість активних речовин на одиницю об'єму ґрунту. Цим ґрунтом заповнюють горщики ємністю 0,25 л та залишають при 20 °С.

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

Приклад M

Дослідження *Heliothis virescens* - обробка трансгенних рослин

Розчинник: 7 ваг. частин ацетону

Емульгатор: 1 ваг. частини алкіларилгліколевого етеру

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

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

Через певний проміжок часу визначають ступінь відмирання комах.