



УКРАЇНА

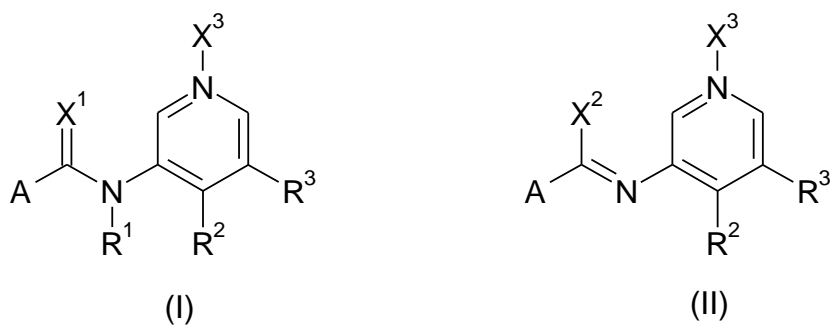
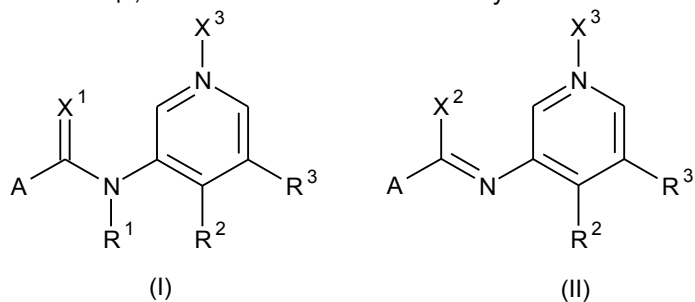
(19) **UA** (11) **103006** (13) **C2**
(51) МПК (2013.01)**C07D 419/00****A01N 43/56** (2006.01)**A01N 43/707** (2006.01)**A01N 43/74** (2006.01)**A01N 47/18** (2006.01)**A01P 7/04** (2006.01)ДЕРЖАВНА СЛУЖБА
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
УКРАЇНИ**(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВІНАХІД**

(21) Номер заявки:	а 2010 03321	(73) Власник(и):	БАСФ СЕ, 67056 Ludwigshafen, Germany (DE)
(22) Дата подання заявки:	26.08.2008	(74) Представник:	Петров Андрій Володимирович, реєстр. №139
(24) Дата, з якої є чинними права на винахід:	10.09.2013	(56) Перелік документів, взятих до уваги експертизою:	WO 2006015860, A, 16.02.2006 WO 2004080999, A, 23.09.2004 WO 2007046550, A, 26.04.2007 WO 9948868, A, 30.09.1999 WO 2006133926, A, 21.12.2006 WO 2004046129, A, 03.06.2004 JP 2007077106, A, 29.03.2007 EP 0 891 975, A, 20.01.1999 WO 2006045522, A, 04.05.2006 WO 2007121687, A, 01.11.2007 CN 101062916, A, 31.10.2007 MILYUTIN A. V., AMIROVA L. R., KRYLOVA I. V. et al. SYNTHESIS, PROPERTIES, AND BIOLOGICAL ACTIVITY OF 3-PYRIDYLAMIDES OF 4-ARYL-2-HYDROXY-4-OXO-2-BUTENIC (AROYLPIRUVIC) ACIDS// PHARMACEUTICAL CHEMISTRY JOURNAL, vol. 31, no. 1, 1997, pp. 30-33 TOBIAS PERSSON, CHRISTINA W. YDE, JAKOB E. RASMUSSEN et al. Pyrazole carboxamides and carboxylic acids as protein kinase inhibitors in aberrant eukaryotic signal transduction: induction of growth arrest in MCF-7 cancer cells// ORGANIC & BIOMOLECULAR CHEMISTRY, vol. 5, 25.10.2007, pp. 3963-3970
(31) Номер попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції:	60/968,109		
(32) Дата подання попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції:	27.08.2007		
(33) Код держави-учасниці Паризької конвенції, до якої подано попередню заявку:	US		
(41) Публікація відомостей про заявку:	26.04.2010, Бюл.№ 8		
(46) Публікація відомостей про видачу патенту:	10.09.2013, Бюл.№ 17		
(86) Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору РСТ	PCT/EP2008/061136, 26.08.2008		
(72) Винахідник(и):	Гросс Штеффен (DE), Бройнінгер Делфін (FR/DE), Бастіаанс Хенрікус Маріа Мартінус (NL/DE), фон Дейн Вольфганг (DE), Пуль Міхаель (DE), Кьорбер Карстен (DE), Анспо Дуглас Д. (US), Калбертсон Дебора Л. (US), Олоумі-Садегі Хассан (US)		

(54) ПІРАЗОЛЬНІ СПОЛУКИ ДЛЯ БОРОТЬБИ З БЕЗХРЕБЕТНИМИ ШКІДНИКАМИ**(57)** Реферат:

UA 103006 C2

Піразольні сполуки формул I та II, їх солей та їх N-оксидів, які застосовують для пригнічення або боротьби з безхребетними шкідниками, зокрема з комахами, павукоподібними і нематодами, також спосіб боротьби з безхребетними шкідниками шляхом застосування цих сполук. Даний винахід також належить до насіння та до сільськогосподарської та ветеринарної композиції, яка включає зазначені сполуки.



Даний винахід відноситься до нових піразольних сполук, які можна застосовувати для пригнічення або боротьби з безхребетними шкідниками, зокрема членистоногими шкідниками. Винахід також відноситься до способу боротьби з безхребетними шкідниками шляхом застосування цих сполук. Даний винахід також відноситься до насіння та до сільськогосподарської та ветеринарної композиції, яка включає зазначені сполуки.

Передумови створення винаходу

Безхребетні шкідники й, зокрема, членистоногі та нематоди, вражають зростаючі та зібрані сільськогосподарські культури та нападають на дерев'яні будинки та торговельні приміщення та споруди, викликаючи, таким чином, великий економічний збиток відносно харчових ресурсів та майна. У той час як відома велика кількість пестицидних агентів, внаслідок здатності цільових шкідників розвивати стійкість до зазначених агентів, існує постійна потреба у нових агентах для боротьби з безхребетними шкідниками, такими як комахи, павукоподібні та нематоди. Отже, ціль даного винаходу полягає в забезпеченні сполук, які мають гарну пестицидну активність та показують широкий спектр активності щодо великого числа різноманітних безхребетних шкідників, особливо щодо комах, павукоподібних та нематод, ведення боротьби з якими викликає труднощі.

В WO 2003/106427 описуються N-ариламіді піразолкарбонових кислот, де піразольне кільце несе 2-піридинільний радикал у орто-положенні до карбоксамідної групи. Ці сполуки згадуються як придатні для боротьби з безхребетними шкідниками.

В WO 2004/046129 описуються 2-((1-арилпіразол-5-іл)карбоніламіно-заміщені бензамідні сполуки, які згадуються як придатні для боротьби з безхребетними шкідниками.

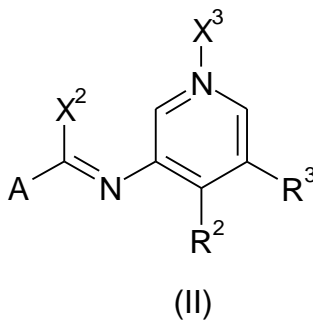
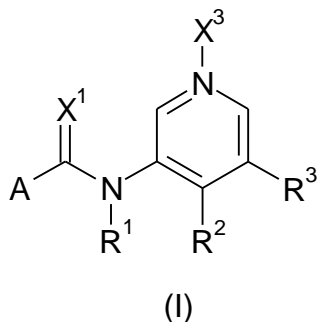
В JP 2007-77106 описуються N-ариламіді 1-(3-хлоропіридин-2-іл)-піразол-5-ілкарбонової кислоти, які згадуються як придатні для боротьби з безхребетними шкідниками.

В CN 1927838 описуються ароматичні та гетероароматичні N-піридинілкарбоксаміді, придатні як агрохімічні бактерициди та фунгіциди.

Мета даного винаходу полягає в забезпеченні сполук, які мають гарну пестицидну активність, зокрема інсектицидну активність, та показують широкий спектр активності щодо великої кількості різноманітних безхребетних шкідників, особливо щодо комах, ведення боротьби з якими викликає труднощі.

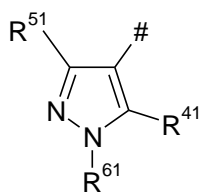
Виявлено, що цю мету можна досягти за допомогою сполук формул I та II, наведених нижче, та за допомогою їх солей, зокрема їх сільськогосподарсько- або ветеринарно-прийнятних солей.

У першому аспекті даний винахід стосується способу боротьби з безхребетними шкідниками, який включає обробку шкідників, їх харчових ресурсів, їх місця поширення або їх місця розмноження, або рослини, насіння, ґрунту, ділянки, матеріалу або навколишнього середовища, у якому шкідники ростуть або можуть рости, або матеріалів, рослин, насіння, ґрунтів, поверхонь або просторів, які підлягають захисту від нападу або інвазії шкідниками, пестицидно ефективною кількістю піразольної сполуки формул I або II або її солі або N-оксиду:

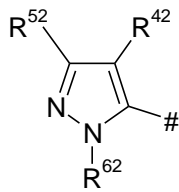


де

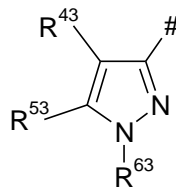
A означає піразольний радикал формул A1, A2 або A3



A1



A2



A3

означає місце приєднання до частини формул I або II, що залишилися;

5

X^1 означає S, O або NR^{1a} ;

X^2 означає OR^{2a} , $NR^{2b}R^{2c}$, $S(O)_mR^{2d}$;

10

X^3 означає неподілену пару або кисень;

R^1 означає водень, CN, C_1 - C_{10} -алкіл, C_1 - C_{10} -галоалкіл, C_3 - C_{10} -циклоалкіл, C_3 - C_{10} -галоциклоалкіл, C_3 - C_{10} -циклоалкілметил, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілметил, C_2 - C_{10} -алкеніл, C_2 - C_{10} -галоалкеніл, C_2 - C_{10} -алкініл, C_3 - C_{10} -галоалкініл, C_1 - C_4 -алкілен-CN, OR^a , C_1 - C_4 -алкілен- OR^a , $C(Y)R^b$, C_1 - C_4 -алкілен- $C(Y)R^b$, $C(Y)OR^c$, C_1 - C_4 -алкілен- $C(Y)OR^c$, $S(O)_2R^d$, NR^eR^f , C_1 - C_4 -алкілен- NR^eR^f , $C(Y)NR^gR^h$, C_1 - C_4 -алкілен- $C(Y)NR^gR^h$, $S(O)_mNR^eR^f$, $C(Y)NR^iNR^eR^f$, феніл, гетарил, феніл- C_1 - C_4 -алкіл та гетарил- C_1 - C_4 -алкіл, де ароматичне кільце чотирьох згаданих останніми радикалів може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3, 4 або 5 ідентичних або різних замісників R^x ;

15

20

R^2 означає водень, галоген, C_1 - C_4 -алкіл, C_1 - C_4 -галоалкіл, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкілтіо, C_1 - C_4 -галоалкілтіо, C_1 - C_4 -алкілсульфініл, C_1 - C_4 -галоалкілсульфініл, C_1 - C_4 -алкілсульфоніл, C_1 - C_4 -галоалкілсульфоніл, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл, C_2 - C_4 -алкеніл, C_2 - C_4 -галоалкеніл, C_2 - C_4 -алкініл або C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_4 -алкіл;

25

R^3 означає водень, галоген, C_1 - C_4 -алкіл, C_1 - C_4 -галоалкіл, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкілтіо, C_1 - C_4 -галоалкілтіо, C_1 - C_4 -алкілсульфініл, C_1 - C_4 -галоалкілсульфініл, C_1 - C_4 -алкілсульфоніл, C_1 - C_4 -галоалкілсульфоніл, C_3 - C_6 -циклоалкіл, C_3 - C_6 -галоциклоалкіл, C_2 - C_4 -алкеніл, C_2 - C_4 -галоалкеніл, C_2 - C_4 -алкініл або C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_4 -алкіл;

30

m означає 0, 1 або 2;

R^{41} , R^{42} , R^{43} вибирають із групи, що складається із водню, галогену, CN, NO_2 , C_1 - C_{10} -алкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілу, C_5 - C_{10} -циклоалкенілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілметилу, C_2 - C_{10} -алкенілу, C_2 - C_{10} -алкінілу, де аліфатичні або циклічні фрагменти в 6 згаданих останніми радикалах можуть бути незаміщеними, можуть бути частково або повністю галогенованими або можуть нести 1, 2 або 3 ідентичних або різних замісників R^y , OR^a , SR^a , $C(Y)R^b$, $C(Y)OR^c$, $S(O)_2R^d$, NR^eR^f , $C(Y)NR^gR^h$, фенілу, феніл- C_1 - C_4 -алкілу, фенокси- C_1 - C_4 -алкілу, 5-членного гетарилу та гетероцикліл- C_1 - C_4 -алкілу, де гетероцикліл та ароматичне кільце 5 згаданих останніми радикалів можуть бути незаміщеними або можуть нести 1, 2, 3, 4 або 5 ідентичних або різних замісників R^x ;

35

40

R^{51} вибирають із групи, що складається із водню, галогену, CN, NO_2 , C_1 - C_{10} -алкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілу, C_5 - C_{10} -циклоалкенілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілметилу, C_2 - C_{10} -алкенілу, C_2 - C_{10} -алкінілу, де аліфатичні або циклічні фрагменти в 6 згаданих останніми радикалах можуть бути незаміщеними, можуть бути частково або повністю галогенованими або можуть нести 1, 2 або 3 ідентичних або різних замісників R^y , OR^a , SR^a , $C(Y)R^b$, $C(Y)OR^c$, $S(O)_2R^d$, NR^eR^f , $C(Y)NR^gR^h$, фенілу, феніл- C_1 - C_4 -алкілу, фенокси- C_1 - C_4 -алкілу, 5-членного гетарилу та гетероцикліл- C_1 - C_4 -алкілу, де гетероцикліл та ароматичне кільце 5 згаданих останніми радикалів можуть бути незаміщеними або можуть нести 1, 2, 3, 4 або 5 ідентичних або різних замісників R^x ;

45

50

R^{52} , R^{53} вибирають із групи, що складається із водню, галогену, CN, NO_2 , C_1 - C_{10} -алкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілу, C_5 - C_{10} -циклоалкенілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілметилу, C_2 - C_{10} -алкенілу, C_2 - C_{10} -алкінілу, де аліфатичні або циклічні фрагменти в 6 згаданих останніми радикалах можуть бути

незаміщеними, можуть бути частково або повністю галогенованими або можуть нести 1, 2 або 3 ідентичних або різних замісників R^y , OR^a , SR^a , $C(Y)R^b$, $C(Y)OR^c$, $S(O)_2R^d$, NR^eR^f , $C(Y)NR^gR^h$, гетероциклілу, фенілу, феніл- C_1 - C_4 -алкілу, фенокси- C_1 - C_4 -алкілу та гетероцикліл- C_1 - C_4 -алкілу, де гетероцикліл та ароматичне кільце 5 згаданих останніми радикалів можуть бути

5 незаміщеними або можуть нести 1, 2, 3, 4 або 5 ідентичних або різних замісників R^x ;

R^{61} , R^{63} вибирають із групи, що складається із водню, NO_2 , C_1 - C_{10} -алкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілу, C_5 - C_{10} -циклоалкенілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілметилу, C_2 - C_{10} -алкенілу, C_2 - C_{10} -алкінілу, де аліфатичні або циклічні фрагменти в 6 згаданих останніми радикалах можуть бути незаміщеними, можуть

10 бути частково або повністю галогенованими або можуть нести 1, 2 або 3 ідентичних або різних замісників R^y , OR^a , SR^a , $C(Y)R^b$, $C(Y)OR^c$, $S(O)_2R^d$, NR^eR^f , $C(Y)NR^gR^h$, $S(O)_mNR^eR^f$, $C(Y)NR^iNR^eR^f$, гетероциклілу, фенілу, феніл- C_1 - C_4 -алкілу, фенокси- C_1 - C_4 -алкілу та гетероцикліл- C_1 - C_4 -алкілу, де гетероцикліл та ароматичне кільце 5 згаданих останніми радикалів можуть бути

15 незаміщеними або можуть нести 1, 2, 3, 4 або 5 ідентичних або різних замісників R^x ;

R^{62} вибирають із групи, що складається із водню, NO_2 , C_1 - C_{10} -алкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілу, C_5 - C_{10} -циклоалкенілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілметилу, C_2 - C_{10} -алкенілу, C_2 - C_{10} -алкінілу, де аліфатичні або циклічні фрагменти в 6 згаданих останніми радикалах можуть бути незаміщеними, можуть бути

20 частково або повністю галогенованими або можуть нести 1, 2 або 3 ідентичних або різних замісників R^y , OR^a , SR^a , $C(Y)R^b$, $C(Y)OR^c$, $S(O)_2R^d$, NR^eR^f , $C(Y)NR^gR^h$, $S(O)_mNR^eR^f$, $C(Y)NR^iNR^eR^f$, фенілу, феніл- C_1 - C_4 -алкілу, фенокси- C_1 - C_4 -алкілу, 5-членного гетарилу та гетероцикліл- C_1 - C_4 -алкілу, де гетероцикліл та ароматичне кільце 5 згаданих останніми радикалів можуть бути

25 незаміщеними або можуть нести 1, 2, 3, 4 або 5 ідентичних або різних замісників R^x ;

Y означає O або S;

R^{1a} вибирають із водню, C_1 - C_{10} -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілметилу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілу, C_2 - C_{10} -алкенілу, C_2 - C_{10} -галоалкенілу, C_2 - C_{10} -алкінілу, C_1 - C_{10} -алкокси- C_1 - C_4 -алкілу, OR^a , фенілу, гетарилу, феніл- C_1 - C_4 -алкілу та гетарил- C_1 - C_4 -алкілу, де ароматичне кільце в чотирьох згаданих останніми радикалах може бути незаміщеним або

30 може нести 1, 2, 3 або 4 замісників, які незалежно один від одного вибирають із групи, що складається із галогену, ціано, нітро, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси та C_1 - C_4 -галоалкокси;

R^{2a} вибирають із C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_3 - C_6 -циклоалкілу, C_3 - C_6 -галоциклоалкілу, C_2 - C_4 -алкенілу, C_2 - C_4 -галоалкенілу, C_2 - C_4 -алкінілу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_4 -алкілу, фенілу, гетарилу, феніл- C_1 - C_4 -алкілу та гетарил- C_1 - C_4 -алкілу, де ароматичне кільце в чотирьох згаданих останніми радикалах може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3 або 4 замісників, які

35 незалежно один від одного вибирають із групи, що складається із галогену, ціано, нітро, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси та C_1 - C_4 -галоалкокси;

40

R^{2b} , R^{2c} незалежно один від одного вибирають із водню, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_3 - C_6 -циклоалкілу, C_3 - C_6 -галоциклоалкілу, C_2 - C_4 -алкенілу, C_2 - C_4 -галоалкенілу, C_2 - C_4 -алкінілу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -алкілкарбонілу, C_1 - C_4 -галоалкілкарбонілу, C_1 - C_4 -алкілсульфонілу, C_1 - C_4 -галоалкілсульфонілу, фенілу, фенілкарбонілу, фенілсульфонілу, гетарилу, гетарилкарбонілу, гетарилсульфонілу, феніл- C_1 - C_4 -алкілу та гетарил- C_1 - C_4 -алкілу, де ароматичне кільце в восьми згаданих останніми радикалах може бути незаміщеним або може

45 нести 1, 2, 3, 4 або 5 замісників, які незалежно один від одного вибирають із групи, що складається із галогену, ціано, нітро, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси та C_1 - C_4 -галоалкокси;

50

R^{2b} та R^{2c} разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, утворюють 5- або 6-членний, насичений або ненасичений гетероцикл, який може нести додатковий гетероатом, що вибирають з O, S та N як атом - член кільця, та який може бути незаміщеним або може нести 1,

55 2, 3, 4 або 5 замісників, які незалежно один від одного вибирають із групи, що складається із галогену, ціано, нітро, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси та C_1 - C_4 -галоалкокси;

R^{2d} вибирають із C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_3 - C_6 -циклоалкілу, C_3 - C_6 -галоциклоалкілу, C_2 - C_4 -алкенілу, C_2 - C_4 -галоалкенілу, C_2 - C_4 -алкінілу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_4 -алкілу, фенілу, гетарилу, феніл- C_1 - C_4 -алкілу та гетарил- C_1 - C_4 -алкілу, де ароматичне кільце в чотирьох згаданих

60

останніми радикалах може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3, 4 або 5 замісників, які незалежно один від одного вибирають із групи, що складається із галогену, ціано, нітро, C₁-C₄-алкілу, C₁-C₄-галоалкілу, C₁-C₄-алкокси та C₁-C₄-галоалкокси;

5 R^a, R^b, R^c незалежно один від одного вибирають із водню, C₁-C₄-алкілу, C₁-C₄-галоалкілу, C₃-C₆-циклоалкілу, C₃-C₆-циклоалкілметилу, C₃-C₆-галоциклоалкілу, C₂-C₄-алкенілу, C₂-C₄-галоалкенілу, C₂-C₄-алкінілу, C₁-C₄-алкокси-C₁-C₄-алкілу, фенілу, гетарилу, феніл-C₁-C₄-алкілу та гетарил-C₁-C₄-алкілу, де ароматичне кільце в чотирьох згаданих останніми радикалах може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3 або 4 замісника, які незалежно один від одного
10 вибирають із групи, що складається із галогену, ціано, нітро, C₁-C₄-алкілу, C₁-C₄-галоалкілу, C₁-C₄-алкокси та C₁-C₄-галоалкокси;

R^d вибирають із C₁-C₄-алкілу, C₁-C₄-галоалкілу, C₃-C₆-циклоалкілу, C₃-C₆-циклоалкілметилу, C₃-C₆-галоциклоалкілу, C₂-C₄-алкенілу, C₂-C₄-галоалкенілу, C₂-C₄-алкінілу, C₁-C₄-алкокси-C₁-C₄-алкілу, фенілу, гетарилу, феніл-C₁-C₄-алкілу та гетарил-C₁-C₄-алкілу, де ароматичне кільце в чотирьох згаданих останніми радикалах може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3, 4 або 5 замісників, які незалежно один від одного вибирають із групи, що складається із галогену, ціано, нітро, C₁-C₄-алкілу, C₁-C₄-галоалкілу, C₁-C₄-алкокси та C₁-C₄-галоалкокси;

20 R^e, R^f незалежно один від одного вибирають із водню, C₁-C₄-алкілу, C₁-C₄-галоалкілу, C₃-C₆-циклоалкілу, C₃-C₆-циклоалкілметилу, C₃-C₆-галоциклоалкілу, C₂-C₄-алкенілу, C₂-C₄-галоалкенілу, C₂-C₄-алкінілу, C₁-C₄-алкокси-C₁-C₄-алкілу, C₁-C₄-алкілкарбонілу, C₁-C₄-галоалкілкарбонілу, C₁-C₄-алкілсульфонілу, C₁-C₄-галоалкілсульфонілу, фенілу, фенілкарбонілу, фенілсульфонілу, гетарилу, гетарилкарбонілу, гетарилсульфонілу, феніл-C₁-C₄-алкілу та гетарил-C₁-C₄-алкілу, де ароматичне кільце в восьми згаданих останніми радикалах може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3, 4 або 5 замісників, які незалежно один від одного вибирають із групи, що складається із галогену, ціано, нітро, C₁-C₄-алкілу, C₁-C₄-галоалкілу, C₁-C₄-алкокси та C₁-C₄-галоалкокси; або
25

30 R^e та R^f разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, утворюють 5- або 6-членний, насичений або ненасичений гетероцикл, який може нести додатковий гетероатом, що вибирають з O, S та N як атом - член кільця, та який може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3, 4 або 5 замісників, які незалежно один від одного вибирають із групи, що складається із галогену, ціано, нітро, C₁-C₄-алкілу, C₁-C₄-галоалкілу, C₁-C₄-алкокси та C₁-C₄-галоалкокси;

35 R^g, R^h незалежно один від одного вибирають із водню, C₁-C₄-алкілу, C₁-C₄-галоалкілу, C₃-C₆-циклоалкілу, C₃-C₆-галоциклоалкілу, C₂-C₄-алкенілу, C₂-C₄-галоалкенілу, C₂-C₄-алкінілу, C₁-C₄-алкокси-C₁-C₄-алкілу, фенілу, гетарилу, феніл-C₁-C₄-алкілу та гетарил-C₁-C₄-алкілу, де ароматичне кільце в чотирьох згаданих останніми радикалах може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3 або 4 замісника, які незалежно один від одного вибирають із групи, що складається із галогену, ціано, нітро, C₁-C₄-алкілу, C₁-C₄-галоалкілу, C₁-C₄-алкокси та C₁-C₄-галоалкокси;

40 Rⁱ вибирають із групи, що складається із водню, C₁-C₄-алкілу, C₁-C₄-галоалкілу, C₃-C₆-циклоалкілу, C₃-C₆-циклоалкілметилу, C₃-C₆-галоциклоалкілу, C₂-C₄-алкенілу, C₂-C₄-галоалкенілу, C₂-C₄-алкінілу, C₁-C₄-алкокси-C₁-C₄-алкілу, фенілу та феніл-C₁-C₄-алкілу, де фенільне кільце в двох згаданих останніми радикалах може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3, 4 або 5 замісників, які незалежно один від одного вибирають із групи, що складається із галогену, ціано, нітро, C₁-C₄-алкілу, C₁-C₄-галоалкілу, C₁-C₄-алкокси та C₁-C₄-галоалкокси;

50 R^x вибирають із групи, що складається із галогену, ціано, нітро, C₁-C₄-алкілу, C₁-C₄-галоалкілу, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-галоалкокси, C₁-C₄-алкілтію, C₁-C₄-галоалкілтію, C₁-C₄-алкілсульфінілу, C₁-C₄-галоалкілсульфінілу, C₁-C₄-алкілсульфонілу, C₁-C₄-галоалкілсульфонілу, C₁-C₄-алкілкарбонілу, C₁-C₄-галоалкілкарбонілу, C₃-C₆-циклоалкілу, C₃-C₆-галоциклоалкілу, C₂-C₄-алкенілу, C₂-C₄-галоалкенілу, C₂-C₄-алкінілу та C₁-C₄-алкокси-C₁-C₄-алкілу,

55 R^y незалежно один від одного вибирають із C₁-C₄-алкілу, C₁-C₄-галоалкілу, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-галоалкокси, C₁-C₄-алкілтію, C₁-C₄-галоалкілтію, C₁-C₄-алкілсульфінілу, C₁-C₄-галоалкілсульфінілу, C₁-C₄-алкілсульфонілу, C₁-C₄-галоалкілсульфонілу, C₃-C₆-циклоалкілу, C₃-C₆-галоциклоалкілу, C₂-C₄-алкенілу, C₂-C₄-галоалкенілу, C₂-C₄-алкінілу, C₁-C₄-алкокси-C₁-C₄-алкілу та C₁-C₁₀-алкілкарбонілу.
60

У другому аспекті, даний винахід забезпечує спосіб боротьби з безхребетними шкідниками, який включає обробку шкідників, їх харчових ресурсів, їх місця поширення або їх місця розмноження, або рослини, матеріалу розмноження рослини (такого як насіння), ґрунту, ділянки, матеріалу або навколишнього середовища, у якому шкідники ростуть або можуть рости, або матеріалів, рослин, матеріалів розмноження рослини (таких як насіння), ґрунтів, поверхонь або просторів, які підлягають захисту від нападу або інвазії шкідниками, пестицидно ефективною кількістю піразольної сполуки формул I або II або її солі або N-оксиду або пестицидно ефективною кількістю сільськогосподарської композиції, яка містить, принаймні, одну піразольну сполуку формул I або II або її сіль або N-оксид.

У третьому аспекті, даний винахід забезпечує спосіб захисту насіння і/або рослин, які виростають із нього, від інвазії безхребетними шкідниками, який включає обробку насіння пестицидно ефективною кількістю сполуки формул I або II або її сільськогосподарсько-прийнятної солі або N-оксиду. Додатковим об'єктом даного винаходу є насіння, яке включає, принаймні, одну сполуку формул I або II і/або її сільськогосподарсько-прийнятну сіль або N-оксид.

Винахід далі забезпечує спосіб лікування або захисту тварин від інвазії або інфікування паразитами, який включає приведення тварини у контакт з паразитоцидно ефективною кількістю сполуки формул I або II, або її ветеринарно-прийнятної солі або N-оксиду, як визначено вище. Приведення тварини у контакт зі сполукою I або II, її сіллю або ветеринарною композицією відповідно до винаходу означає нанесення або введення її тварині.

Сполуки формул I та II та їх солі до даного часу ще не були описані; виключення становлять сполуки формули I, де

- A означає формулу A2, X^1 означає O, R^1 , R^2 , R^3 , R^{42} та R^{62} кожний означає водень, та R^{53} означає 2-гідроксифеніл, 2-гідрокси-5-метилфеніл, 2-гідрокси-5-етилфеніл, 2-гідрокси-5-хлорфеніл, 2-гідрокси-4,5-диметилфеніл, 2-гідрокси-3,4-диметилфеніл або 2-гідрокси-3,5-диметилфеніл,

- A означає формулу A3, X^1 означає O, R^1 , R^2 , R^3 , R^{43} та R^{63} кожний означає водень, та R^{53} означає феніл, 4-фторфеніл, 4-метоксифеніл, 4-бромфеніл, 4-хлорфеніл, 4-метилфеніл, 4-етоксифеніл, 2,4-диметилфеніл, 2-гідроксифеніл, 2-гідрокси-5-метилфеніл, 2-гідрокси-5-етилфеніл, 2-гідрокси-5-хлорфеніл, 2-гідрокси-4,5-диметилфеніл, 2-гідрокси-3,4-диметилфеніл або 2-гідрокси-3,5-диметилфеніл,

- X^1 означає O, R^1 , R^2 та R^3 кожний означає водень та A означає 1-(фенілметил)-3-нітропіразол-5-іл, 1-метилпіразол-5-іл, 1-метил-4-хлорпіразол-5-іл, 1-етил-4-бромпіразол-3-іл, 1-етил-3-метилпіразол-4-іл, 1-метил-3-трифторметилпіразол-4-іл, 1-феніл-5-бензоїламінопіразол-4-іл, 1-(4-хлорфеніл)-3-феніламінокарбоніл-5-метилпіразол-4-іл, 1-феніл-5-[(4-метилфеніл)карбоніл]амінопіразол-4-іл, 4-йодпіразол-3-іл, 1-метилпіразол-3-іл, 5-хлор-1-метилпіразол-3-іл, 5-нітропіразол-3-іл, 1-(4-хлорфеніл)-5-трифторметилпіразол-4-іл, 1-феніл-3-тіофен-2-ілпіразол-4-іл, 1-феніл-3,5-диметилпіразол-4-іл, 4-бром-5-нітропіразол-3-іл або 5-циклопропіл-1-(1,1-діоксотетрагідротіофен-3-іл)-1H-піразол-3-іл;

а також наступні сполуки:

- піридин-3-іламід 1-(4-хлорфеніл)-5-трифторметил-1H-піразол-4-карбонової кислоти,
- піридин-3-іламід 1-феніл-3-тіофен-2-іл-1H-піразол-4-карбонової кислоти,
- піридин-3-іламід 3,5-диметил-1-феніл-1H-піразол-4-карбонової кислоти.

Отже, нові піразольні сполуки формул I та II та їх солі, зокрема їх сільськогосподарсько- або ветеринарно-прийнятні солі, та їх N-оксиди також є частиною винаходу.

Іншим об'єктом даного винаходу є сільськогосподарська композиція, яка містить, принаймні, одну нову піразольну сполуку формул I або II, як визначено вище, і/або її сільськогосподарсько-прийнятну сіль або N-оксид й, принаймні, один рідкий або твердий носій.

Іншим об'єктом даного винаходу є ветеринарна композиція, яка містить, принаймні, одну нову піразольну сполуку формул I або II, як визначено вище, і/або її ветеринарно-прийнятну сіль або N-оксид її, принаймні, один ветеринарно-прийнятний рідкий або твердий носій.

5 Даний винахід далі відноситься до матеріалу розмноження рослини, такого як насіння, яке включає, принаймні, одну сполуку формул I або II, як визначено у даному описі.

Даний винахід далі відноситься до застосування сполук формул I або II, як визначено у даному описі, для боротьби з безхребетними шкідниками.

10

У сполуках формул I або II замісники на А або піридилному кільці можуть містити один або кілька центрів хіральності. У цьому випадку сполуки формул I або II, залежно від захисників, можуть перебувати у вигляді різних енантіомерів або діастереомерів. У випадку формули II, сполука II може також існувати у вигляді цис- або транс-ізомеру щодо осі N=C. Даний винахід

15

стосується кожного можливого стереоізомеру сполук загальних формул I або II, тобто як індивідуальних енантіомерів або діастереомерів, так та їх сумішей.

Сполуки формул I або II можуть бути аморфними, або можуть існувати в одному або декількох різних кристалічних станах (поліморфи), які можуть мати різні макроскопічні

20

властивості, такі як стабільність, або можуть показувати різні біологічні властивості, такі як активність.

Даний винахід включає й аморфні, й кристалічні сполуки формул I або II, суміші різних кристалічних станів відповідної сполуки I або II, також як й їх аморфні або кристалічні солі.

25

Солі сполук формули I або II переважно є сільськогосподарсько- та ветеринарно-прийнятними солями. Вони можуть бути утворені звичайним способом, наприклад, шляхом взаємодії сполуки з кислотою, що містить відповідний аніон, якщо сполука формули I має основну функціональність, або шляхом взаємодії кислотної сполуки формул I або II з придатною

30

основою.

Сільськогосподарсько-придатні солі сполук I та II охоплюють головним чином солі тих катіонів, або кислотно-адитивні солі тих кислот, чий катіон та аніон, відповідно, не здійснюють негативної дії на пестицидну дію сполук I або II. Таким чином, придатними катіонами є, зокрема,

35

іони лужних металів, переважно натрію та калію, лужноземельних металів, переважно кальцію, магнію та барію, перехідних металів, переважно марганцю, міді, цинку та заліза, а також іон амонію, який, при необхідності, може нести від одного до чотирьох C₁-C₄-алкільних замісників і/або один фенільний або бензильний замісник, переважно іон діізопропіламонію, тетраметиламонію, тетрабутиламонію, триметилбензиламонію, крім того, іони фосфонію, іони

40

сульфонію, переважно три(C₁-C₄-алкіл)сульфонію, та іони сульфоксонію, переважно три(C₁-C₄-алкіл)сульфоксонію.

Аніони придатних кислотно-адитивних солей означають головним чином хлорид, бромід, фторид, гідросульфат, сульфат, дигідрофосфат, гідрофосфат, фосфат, нітрат, бікарбонат,

45

карбонат, гексафторсилікат, гексафторфосфат, бензоат, та аніони C₁-C₄-алканових кислот, переважно форміат, ацетат, пропіонат та бутират. Вони можуть бути утворені шляхом взаємодії сполук формул (I) та (II) з кислотою відповідного аніону, переважно соляною, бромисто-водневою кислотою, сірчаною кислотою, фосфорною кислотою або азотною кислотою.

Ветеринарно-прийнятні солі сполук формули (I) охоплюють головним чином солі тих катіонів або кислотно-адитивні солі тих кислот, які відомі та загальноприйняті в рівні техніки для утворення солей для застосування в ветеринарії. Придатні кислотно-адитивні солі, наприклад, утворені сполуками формул I або II, що містять основний атом азоту, наприклад, аміногрупу, включають солі з неорганічними кислотами, наприклад, гідрохлориди, сульфати, фосфати, та

50

55

нітрати, та солі органічних кислот, наприклад, оцтової кислоти, малеїнової кислоти, наприклад, кислі однозаміщені солі або дизаміщені солі малеїнової кислоти, дималеїнової кислоти, фумарової кислоти, наприклад, кислі однозаміщені солі або дизаміщені солі фумарової кислоти, дифумарової кислоти, метансульфенової кислоти, метансульфонової кислоти та янтарної кислоти.

60

Термін "N-оксид" включає будь-яку сполуку формул I або II, яка крім азоту піридину, який несе фрагмент X^3 , має, принаймні, один третинний атом азоту, який окиснений до N-оксидного фрагмента.

5 Термін "безхребетний шкідник", використовуваний тут, охоплює популяції тварин, таких як комахи, павукоподібні та нематоди, які можуть нападати на рослини, таким чином, викликаючи значне ушкодження уражених рослин, також як й ектопаразитів, які можуть інвазувати тварин, наприклад, ссавців, птахів або рибу, таким чином, викликаючи значне ураження інвазованих тварин.

10

Термін "матеріал розмноження рослини", використовуваний тут, включає всі генеративні частини рослини, такі як насіння, та вегетативний матеріал рослини, такий як черешки та бульби (наприклад, картопля), який можна використовувати для розведення рослини. Такі включають насіння, корені, плоди, бульби, цибулини, кореневища, ростки, паростки та інші частини рослин. Також можуть бути включені саджанці та молоді рослини, які повинні бути пересаджені після проростання або після появи на поверхні ґрунту. Цей матеріал розмноження рослини може бути оброблений профілактично сполукою для захисту рослин або при, або до висадки або пересадки.

15

20

Термін "культурні рослини", використовуваний тут, включає рослини, які модифіковані шляхом брідингу, мутагенезу або генної інженерії. Генетично модифікованими рослинами є рослини, чий генетичний матеріал шляхом застосування технології рекомбінантних ДНК був модифікований настільки, що подібна модифікація не може бути одержана без труднощів за природних умов шляхом кросбрідингу, мутацій або природної рекомбінації. Типово, один або декілька генів вбудовуються в генетичний матеріал генетично модифікованої рослини з метою покращення певних властивостей рослини. Такі генетичні модифікації також включають, але не обмежуються, цільову пост-транзитну модифікацію білку(-ів) (оліго- або поліпептидів), наприклад, за допомогою глікозилування або приєднання полімеру, такого як пренільовані, ацетильовані або фарнезилъовані фрагменти або PEG фрагменти (наприклад, як розкрито в Biotechnol Prog. 2001 Jul-Aug; 17(4):720-8., Protein Eng Des Sel. 2004 Jan;17(1):57-66, Nat. Protoc. 2007;2(5):1225-35., Curr. Opin. Chem. Biol. 2006 Oct; 10(5):487-91. Epub 2006 Aug 28., Biomaterials. 2001 Mar; 22(5):405-17, Bioconjug Chem. 2005 Jan-Feb;16(1):113-21).

25

30

35

Термін "культурні рослини", використовуваний тут, далі включає рослини, яким надана стійкість до застосування особливих класів гербіцидів, таких як інгібітори гідроксифенілпіруватдіоксигенази (HPPD); інгібітори ацетолактатсинтази (ALS), такі як сульфонілсечовини (див., наприклад, US 6,222,100, WO 01/82685, WO 00/26390, WO 97/41218, WO 98/02526, WO 98/02527, WO 04/106529, WO 05/20673, WO 03/14357, WO 03/13225, WO 03/14356, WO 04/16073) або імідазолінони (див., наприклад, US 6,222,100, WO 01/82685, WO 00/26390, WO 97/41218, WO 98/02526, WO 98/02527, WO 04/106529, WO 05/20673, WO 03/14357, WO 03/13225, WO 03/14356, WO 04/16073); інгібітори енолпірувілшикімат-3-фосфатсинтази (EPSPS), такі як гліфосат (див., наприклад, WO 92/00377); інгібітори глутамінсинтетази (GS), такі як глюфозинат (див., наприклад, EP-A-0242236, EP-A-242246) або оксинілові гербіциди (див., наприклад, US 5,559,024), в результаті звичайних методів брідингу або генної інженерії. Деяким культурним рослинам надана стійкість до гербіцидів шляхом звичайних методів брідингу (мутагенез), наприклад, Clearfield® суріпиця (Canola) є стійкою до імідазолінонів, наприклад, імазамоксу. Методи генної інженерії застосовували для надання культурним рослинам, таким як соєві боби, бавовна, кукурудза, буряк та рапс, стійкості до гербіцидів, таким як гліфосат та глюфозинат, деякі з яких доступні для придбання під торговими назвами RoundupReady® (гліфосат) та LibertyLink® (глюфозинат).

40

45

50

55

Термін "культурні рослини", використовуваний тут, далі включає рослини, які, шляхом застосування технології рекомбінантних ДНК, є здатними синтезувати один або декілька інсектицидних білків, зокрема тих, які відомі з бацил, одного з родів бактерій, зокрема з *Bacillus thuringiensis*, таких як δ -ендотоксини, наприклад, CryIA(b), CryIA(c), CryIF, CryIF(a2), CryIIA(b), CryIIIA, CryIIIB(b1) або Cry9c; рослинних інсектицидних білків (VIP), наприклад, VIP1, VIP2, VIP3 або VIP3A; інсектицидних білків бактерій, що колонізують нематоди, наприклад, *Photorhabdus* spp. або *Xenorhabdus* spp.; токсинів, що виробляються тваринами, таких як токсини скорпіона, токсини павукоподібних, токсини оси, або інші специфічні нейротоксини комах; токсинів, що виробляються грибами, таких як токсини *Streptomyces*, рослинні лектини, такі як лектини

60

гороху або ячменя; агглютининів; інгібіторів протеїнази, таких як інгібітори трипсину, інгібітори серинпротеази, інгібітори пататину, цистатину або папаїну; білків, що інактивують рибосому (RIP), таких як рицин, маїс-RIP, абрін, лужинин, сапорин або бріудин; ферментів метаболізму стероїдів, таких як 3-гідроксистероїдоксидаза, екдистероїд-IDP-глікозил-трансфераза, холестериноксидаза, екдизон або HMG-CoA-редуктаза; блокаторів іонних каналів, таких як блокатори натрієвих або кальцієвих каналів; ферментів - естераз ювенільного гормону; рецепторів діуретичного гормону (рецепторів гелікокініну); стильбенсинтази, дибензилсинтази, хітинази або глюканази. У контексті даного винаходу ці інсектицидні білки або токсини слід ясно розуміти також як претоксини, гібридні білки, укорочені або іншим способом модифіковані білки. Гібридні білки характеризовані новою комбінацією білкових доменів (див., наприклад, WO 02/015701). Додаткові приклади таких токсинів або генетично-модифікованих рослин, здатних синтезувати такі токсини, розкриті, наприклад, в EP-A 374 753, WO 93/007278, WO 95/34656, EP-A 427 529, EP-A 451 878, WO 03/018810 та WO 03/052073. Способи одержання таких генетично модифікованих рослин звичайно відомі спеціалісту в даній галузі техніки та описуються, наприклад, в публікаціях, згаданих вище. Ці інсектицидні білки, що містяться в генетично модифікованих рослинах, надають рослинам, що виробляють ці білки, захист від шкідників з певних таксономічних груп членистоногих комах, зокрема жуків (Coleoptera), мух (Diptera), та метеликів та мотилів (Lepidoptera), та від нематод-паразитів рослин (Nematoda).

Термін "культурні рослини", використовуваний тут, далі включає рослини, які, шляхом застосування технології рекомбінантних ДНК, є здатними синтезувати один або декілька білків для збільшення своєї стійкості до або переносимості бактеріальних, вірусних або грибкових патогенів. Прикладами таких білків є так називані "патогенез-зв'язані білки" (PR білки, див., наприклад, EP-A 0 392 225), гени стійкості рослин до хвороб (наприклад, культивари картоплі, які експресують гени стійкості, які діють на *Phytophthora infestans*, похідні мексиканської дикої картоплі *Solanum bulbocastanum*) або T4-лізоцим (наприклад, культивари картоплі, здатні синтезувати ці білки, які підвищують стійкість щодо бактерій, таких як *Erwinia amylovora*).

Способи одержання таких генетично модифікованих рослин у цілому відомі спеціалісту в даній галузі техніки та описані, наприклад, в публікаціях, згаданих вище.

Термін "культурні рослини", використовуваний тут, далі включає рослини, які, шляхом застосування технології рекомбінантних ДНК, здатні синтезувати один або декілька білків для збільшення продуктивності (наприклад, виробництва біомаси, урожаю зерна, збільшення вмісту крохмалю, олії або білку), збільшення здатності переносити засуху, підвищений рівень вмісту солі або інших факторів навколишнього середовища, що обмежують ріст, або збільшення переносимості шкідників та грибів, бактеріальних або вірусних патогенів цих рослин.

Термін "культурні рослини", використовуваний тут, далі включає рослини, які, шляхом застосування технології рекомбінантних ДНК, містять модифіковану кількість речовин або нових речовин, зокрема, для покращення харчування людини або тварин, наприклад, олійні культури, які виробляють довголанцюжкові омега-3 жирні кислоти або ненасичені омега-9 жирні кислоти, що сприяють зміцненню здоров'я (наприклад, рапс Nexera®).

Термін "культурні рослини", використовуваний тут, далі включає рослини, які, шляхом застосування технології рекомбінантних ДНК, містять модифіковану кількість речовин або нових речовин, зокрема, для покращення одержання сировинного матеріалу, наприклад, картоплі, яка виробляє збільшені кількості амілопектину (наприклад, картопля Amflora®).

Органічні фрагменти, наведені в вищезгаданих визначеннях змінних, є - подібно терміну "галоген" - збірними термінами для індивідуальних переліків індивідуальних членів груп. Префікс C_n-C_m показує у кожному випадку можливе число атомів вуглецю в групі.

Термін галоген у кожному випадку означає фтор, бром, хлор або йод, зокрема фтор, хлор або бром.

Термін "алкіл", використовуваний тут, та в алкільних фрагментах алкоксилкілу, алкіламіно, діалкіламіно, алкілкарбонілу, алкілтіо, алкілсульфінілу та алкілсульфонілу у кожному випадку означає алкільну групу з нерозгалуженим або розгалуженим ланцюгом, яка має від 1 до 10 атомів вуглецю, найчастіше від 1 до 6 атомів вуглецю, переважно від 1 до 4 атомів вуглецю. Прикладами алкільної групи є метил, етил, н-пропіл, ізо-пропіл, н-бутил, 2-бутил, ізо-бутил, трет-бутил, н-пентил, 1-метилбутил, 2-метилбутил, 3-метилбутил, 2,2-диметилпропіл, 1-

етилпропіл, н-гексил, 1,1-диметилпропіл, 1,2-диметилпропіл, 1-метилпентил, 2-метилпентил, 3-метилпентил, 4-метилпентил, 1,1-диметилбутил, 1,2-диметилбутил, 1,3-диметилбутил, 2,2-диметилбутил, 2,3-диметилбутил, 3,3-диметилбутил, 1-етилбутил, 2-етилбутил, 1,1,2-триметилпропіл, 1,2,2-триметилпропіл, 1-етил-1-метилпропіл, 1-етил-2-метилпропіл, н-гептил, 1-метилгексил, 2-метилгексил, 3-метилгексил, 4-метилгексил, 5-метилгексил, 1-етилпентил, 2-етилпентил, 3-етилпентил, 1-пропілпентил, н-октил, 1-метилоктил, 2-метилгептил, 1-етилгексил, 2-етилгексил, 1,2-диметилгексил, 1-пропілпентил та 2-пропілпентил.

Термін "галоалкіл", використовуваний тут, та в галоалкільних фрагментах галоалкілію та галоалкілсульфонілу, у кожному випадку означає алкільну групу з нерозгалуженим або розгалуженим ланцюгом, яка має від 1 до 10 атомів вуглецю, найчастіше від 1 до 6 атомів вуглецю, де атоми водню цих груп частково або повністю заміщені атомами галогену. Кращі галоалкільні фрагменти вибирають із C₁-C₄-галоалкілу, більш переважно з C₁-C₂-галоалкілу, зокрема з C₁-C₂-фторалкілу, наприклад, фторметилу, дифторметилу, трифторметилу, 1-фторетилу, 2-фторетилу, 2,2-дифторетилу, 2,2,2-трифторетилу, пентафторетилу, гептафторізопропілу та подібних.

Термін "алкокси", використовуваний тут, у кожному випадку означає алкільну групу з нерозгалуженим або розгалуженим ланцюгом, яка приєднана через атом кисню та звичайно має від 1 до 10 атомів вуглецю, найчастіше від 1 до 6 атомів вуглецю, переважно від 1 до 4 атомів вуглецю. Прикладами алкокси групи є метокси, етокси, н-пропокси, ізо-пропокси, н-бутилокси, 2-бутилокси, ізо-бутилокси, трет-бутилокси, пентилокси, 1-метилбутилокси, 2-метилбутилокси, 3-метилбутилокси, 2,2-диметилпропілокси, 1-етилпропілокси, гексилокси, 1,1-диметилпропілокси, 1,2-диметилпропілокси, 1-метилпентилокси, 2-метилпентилокси, 3-метилпентилокси, 4-метилпентилокси, 1,1-диметилбутилокси, 1,2-диметилбутилокси, 1,3-диметилбутилокси, 2,2-диметилбутилокси, 2,3-диметилбутилокси, 3,3-диметилбутилокси, 1-етилбутилокси, 2-етилбутилокси, 1,1,2-триметилпропілокси, 1,2,2-триметилпропілокси, 1-етил-1-метилпропілокси, 1-етил-2-метилпропілокси, н-гептилокси, 1-метилгексилокси, 2-метилгексилокси, 3-метилгексилокси, 4-метилгексилокси, 5-метилгексилокси, 1-етилпентилокси, 2-етилпентилокси, 3-етилпентилокси, 1-пропілпентилокси, н-октилокси, 1-метилоктилокси, 2-метилгептилокси, 1-етилгексилокси, 2-етилгексилокси, 1,2-диметилгексилокси, 1-пропілпентокси та 2-пропілпентилокси.

Термін "галоалкокси", використовуваний тут, у кожному випадку означає алкокси групу з нерозгалуженим або розгалуженим ланцюгом, яка має від 1 до 10 атомів вуглецю, найчастіше від 1 до 6 атомів вуглецю, переважно від 1 до 4 атомів вуглецю, де атоми водню цих груп частково або повністю заміщені атомами галогену, зокрема атомами фтору. Кращі галоалкокси фрагменти включають C₁-C₄-галоалкокси, зокрема C₁-C₂-фторалкокси, такі як фторметокси, дифторметокси, трифторметокси, 1-фторетокси, 2-фторетокси, 2,2-дифторетокси, 2,2,2-трифторетокси, 2-хлор-2-фторетокси, 2-хлор-2,2-дифторетокси, 2,2-дихлор-2-фторетокси, 2,2,2-трихлоретокси, пентафторетокси та подібні.

Термін "циклоалкіл", використовуваний тут, та в циклоалкільних фрагментах C₃-C₁₀-циклоалкілметилу у кожному випадку означає моно- або біциклічний циклоаліфатичний радикал, який звичайно має від 3 до 10 С атомів або від 3 до 6 С атомів, такий як циклопропіл, циклобутил, циклопентил, циклогексил, циклогептил, циклооктил, біцикло[2.1.1]гексил, біцикло[3.1.1]гептил, біцикло[2.2.1]гептил, та біцикло[2.2.2]октил.

Термін "галоциклоалкіл", використовуваний тут, та в галоциклоалкільних фрагментах C₃-C₁₀-галоциклоалкілметилу у кожному випадку означає моно- або біциклічний циклоаліфатичний радикал, який звичайно має від 3 до 10 С атомів або від 3 до 6 С атомів, де, принаймні, один, наприклад, 1, 2, 3, 4 або 5 атомів водню замінені на галоген, зокрема фтор або хлор. Прикладами є 1- та 2- фторциклопропіл, 1,2-, 2,2- та 2,3-дифторциклопропіл, 1,2,2-трифторциклопропіл, 2,2,3,3-тетрафторциклопропіл, 1- та 2-хлорциклопропіл, 1,2-, 2,2- та 2,3-дихлорциклопропіл, 1,2,2-трихлорциклопропіл, 2,2,3,3-тетрахлорциклопропіл, 1,2- та 3-фторциклопентил, 1,2-, 2,2-, 2,3-, 3,3-, 3,4-, 2,5-дифторциклопентил, 1,2- та 3-хлорциклопентил, 1,2-, 2,2-, 2,3-, 3,3-, 3,4-, 2,5-дихлорциклопентил та подібні.

Термін "алкеніл", використовуваний тут, у кожному випадку означає однократно ненасичений вуглеводневий радикал, який звичайно має від 2 до 10, наприклад, 2, 3, 4, 5, 6, 7

або 8 С-атомів, наприклад, вініл, аліл (2-пропен-1-іл), 1-пропен-1-іл, 2-пропен-2-іл, металіл (2-метилпроп-2-ен-1-іл), 2-бутен-1-іл, 3-бутен-1-іл, 2-пентен-1-іл, 3-пентен-1-іл, 4-пентен-1-іл, 1-метилбут-2-ен-1-іл, 2-етилпроп-2-ен-1-іл та подібні.

Термін "алкініл", використовуваний тут, у кожному випадку означає однократно ненасичений вуглеводневий радикал, який звичайно має від 2 до 10, наприклад, 2, 3, 4, 5, 6, 7 або 8 С-атомів, наприклад, етиніл, пропаргил (2-пропін-1-іл), 1-пропін-1-іл, 1-метилпроп-2-ін-1-іл, 2-бутин-1-іл, 3-бутин-1-іл, 1-пентин-1-іл, 3-пентин-1-іл, 4-пентин-1-іл, 1-метилбут-2-ін-1-іл, 1-етилпроп-2-ін-1-іл та подібні.

Термін "C₁-C₄-алкокси-C₁-C₄-алкіл", використовуваний тут, відноситься до C₁-C₄-алкілу, де 1 атом вуглецю несе C₁-C₄-алкокси радикал, як згадано вище. Прикладами є CH₂OCH₃, CH₂-OC₂H₅, н-пропоксиметил, CH₂-OCH(CH₃)₂, н-бутоксиметил, (1-метилпропокси)-метил, (2-метилпропокси)-метил, CH₂-OC(CH₃)₃, 2-(метокси)етил, 2-(етокси)етил, 2-(н-пропокси)-етил, 2-(1-метилетокси)-етил, 2-(н-бутокси)етил, 2-(1-метилпропокси)-етил, 2-(2-метилпропокси)-етил, 2-(1,1-диметилетокси)-етил, 2-(метокси)-пропіл, 2-(етокси)-пропіл, 2-(н-пропокси)-пропіл, 2-(1-метилетокси)-пропіл, 2-(н-бутокси)-пропіл, 2-(1-метилпропокси)-пропіл, 2-(2-метилпропокси)-пропіл, 2-(1,1-диметилетокси)-пропіл, 3-(метокси)-пропіл, 3-(етокси)-пропіл, 3-(н-пропокси)-пропіл, 3-(1-метилетокси)-пропіл, 3-(н-бутокси)-пропіл, 3-(1-метилпропокси)-пропіл, 3-(2-метилпропокси)-пропіл, 3-(1,1-диметилетокси)-пропіл, 2-(метокси)-бутил, 2-(етокси)-бутил, 2-(н-пропокси)-бутил, 2-(1-метилетокси)-бутил, 2-(н-бутокси)-бутил, 2-(1-метилпропокси)-бутил, 2-(2-метилпропокси)-бутил, 2-(1,1-диметилетокси)-бутил, 3-(метокси)-бутил, 3-(етокси)-бутил, 3-(н-пропокси)-бутил, 3-(1-метилетокси)-бутил, 3-(н-бутокси)-бутил, 3-(1-метилпропокси)-бутил, 3-(2-метилпропокси)-бутил, 3-(1,1-диметилетокси)-бутил, 4-(метокси)-бутил, 4-(етокси)-бутил, 4-(н-пропокси)-бутил, 4-(1-метилетокси)-бутил, 4-(н-бутокси)-бутил, 4-(1-метилпропокси)-бутил, 4-(2-метилпропокси)-бутил, 4-(1,1-диметилетокси)-бутил та подібні.

Термін "алкілтіо" (алкілсульфаніл: алкіл-S-), використовуваний тут, відноситься до насиченої алкільної групи з нерозгалуженим або розгалуженим ланцюгом, яка має від 1 до 10 атомів вуглецю, переважно від 1 до 4 атомів вуглецю (= C₁-C₄-алкілтіо) (як згадано вище), яка приєднана через атом сірки.

Термін "галоалкілтіо", використовуваний тут, відноситься до алкілтіо групи, як згадано вище, де атоми водню частково або повністю заміщені за допомогою фтору, хлору, бромов і/або йоду.

Термін "алкілсульфініл" (алкілсульфоксил: C₁-C₆-алкіл-S(=O)-), використовуваний тут, відноситься до насиченої алкільної групи з нерозгалуженим або розгалуженим ланцюгом (як згадано вище), яка має від 1 до 10 атомів вуглецю, переважно від 1 до 4 атомів вуглецю (= C₁-C₄-алкілсульфініл), яка приєднана через атом сірки сульфінільної групи у будь-якому положенні алкільної групи.

Термін "галоалкілсульфініл", використовуваний тут, відноситься до алкілсульфінільної групи, як згадано вище, де атоми водню частково або повністю заміщені за допомогою фтору, хлору, бромов і/або йоду.

Термін "алкілсульфоніл" (алкіл-S(=O)₂-), використовуваний тут, відноситься до насиченої алкільної групи з нерозгалуженим або розгалуженим ланцюгом, яка має від 1 до 10 атомів вуглецю, переважно від 1 до 4 атомів вуглецю (= C₁-C₄-алкілсульфоніл) (як згадано вище), яка приєднана через атом сірки сульфонільної групи у будь-якому положенні алкільної групи.

Термін "галоалкілсульфоніл", використовуваний тут, відноситься до алкілсульфонільної групи, як згадано вище, де атоми водню частково або повністю заміщені за допомогою фтору, хлору, бромов і/або йоду.

Термін "гетероцикліл" включає загалом 5-, 6-, 7- або 8-членні моногетероциклічні радикали та 8-10 членні біциклічні гетероциклічні радикали, причому моно- та біциклічні радикали можуть бути насиченими, ненасиченими або ароматичними (= гетарил). Моно- та біциклічні гетероциклічні радикали як члени кільця звичайно включають 1, 2, 3 або 4 гетероатома, які вибрані з N, O та S.

Термін "гетарил" включає моноциклічні 5- або 6-членні гетероароматичні радикали, які включають як члени кільця 1, 2, 3 або 4 гетероатома, які вибрані з N, O та S. Приклади 5- або 6-членних гетероароматичних радикалів включають піридил, тобто 2-, 3-, або 4-піридил, піримідиніл, тобто 2-, 4- або 5-піримідиніл, піразиніл, піридазиніл, тобто 3- або 4-піридазиніл, тієніл, тобто 2- або 3-тієніл, фурил, тобто 2- або 3-фурил, піроліл, тобто 2- або 3-піроліл, оксазоліл, тобто 2-, 3- або 5-оксазоліл, ізоксазоліл, тобто 3-, 4- або 5-ізоксазоліл, тіазоліл, тобто 2-, 3- або 5-тіазоліл, ізотіазоліл, тобто 3-, 4- або 5-ізотіазоліл, піразоліл, тобто 1-, 3-, 4- або 5-піразоліл, тобто 1-, 2-, 4- або 5-імідазоліл, оксадіазоліл, наприклад, 2- або 5-[1,3,4]оксадіазоліл, 4- або 5-(1,2,3-оксадіазол)іл, 3- або 5-(1,2,4-оксадіазол)іл, 2- або 5-(1,3,4-тіадіазол)іл, тіадіазоліл, наприклад, 2- або 5-(1,3,4-тіадіазол)іл, 4- або 5-(1,2,3-тіадіазол)іл, 3- або 5-(1,2,4-тіадіазол)іл, триазоліл, наприклад, 1Н-, 2Н- або 3Н-1,2,3-триазол-4-іл, 2Н-триазол-3-іл, 1Н-, 2Н-, або 4Н-1,2,4-триазоліл та тетразоліл, тобто 1Н- або 2Н-тетразоліл.

Термін "гетарил" також включає біциклічні 8-10-членні гетероароматичні радикали, які включають як члени кільця 1, 2 або 3 гетероатома, які вибрані з N, O та S, де 5- або 6-членне гетероароматичне кільце приконденсоване до фенільного кільця або до 5- або 6-членного гетероароматичного радикала. Приклади 5- або 6-членного гетероароматичного кільця, приконденсованого до фенільного кільця або до 5- або 6-членного гетероароматичного радикала, включають бензофураніл, бензотієніл, індоліл, індазоліл, бензімідазоліл, бензоксатіазоліл, бензоксадіазоліл, бензотіадіазоліл, бензоксазиніл, хінолініл, ізохінолініл, пуриніл, 1,8-нафтиридил, птеридил, піrido[3,2-d]піримідил або піridoімідазоліл та подібні. Ці конденсовані гетарильні радикали можуть бути приєднані до частини молекули, що залишилася, через будь-який атом кільця 5- або 6-членного гетероароматичного кільця або через атом вуглецю приконденсованого фенільного фрагмента.

Приклади насичених або ненасичених гетероциклічних кілець включають насичені або ненасичені, неароматичні гетероциклічні кільця, такі як піролідініл, піразолініл, імідазолініл, піролініл, піразолініл, імідазолініл, тетрагідрофураніл, дигідрофураніл, 1,3-діоксоланіл, діоксоленіл, тіоланіл, дигідротієніл, оксазолідиніл, ізоксазолідиніл, оксазолініл, ізоксазолініл, тіазолініл, ізотіазолініл, тіазолідиніл, ізотіазолідиніл, оксатіоланіл, піперидиніл, піперазиніл, піраніл, дигідропіраніл, тетрагідропіраніл, 1,3- та 1,4-діоксаніл, тіопіраніл, дигідротіопіраніл, тетрагідротіопіраніл, морфолініл, тiazиніл та подібні. Прикладами гетероциклічних кілець, які як члени кільця також включають 1 або 2 карбонільні групи, є піролідин-2-оніл, піролідин-2,5-діоніл, імідазолідин-2-оніл, оксазолідин-2-оніл, тіазолідин-2-оніл та подібні.

Терміни "феніл-С₁-С₄-алкіл" та "феноксі-С₁-С₄-алкіл" відносяться до фенілу або фенокси, відповідно, які приєднані до частини молекули, що залишилася, через С₁-С₄-алкільну групу, зокрема метильну групу (= гетарилметил), причому приклади включають бензил, 1-фенілетил, 2-фенілетил, 2-феноксіетил і т.д.

Терміни "гетероцикліл-С₁-С₄-алкіл" та "гетарил-С₁-С₄-алкіл" відносяться до гетероциклілу або гетарилу, відповідно, як визначено вище, які приєднані до частини молекули, що залишилася, через С₁-С₄-алкільну групу, зокрема метильну групу (= гетероциклілметил або гетарилметил, відповідно).

Зауваження, зроблені нижче відносно кращих варіантів здійснення змінних сполук формул I або II, особливостей використання та способу відповідно до винаходу, та композиції відповідно до винаходу, справедливі самостійно, також як й - переважно - у комбінації одне з одним.

Кращий варіант здійснення винаходу відноситься до піразольних сполук формули I, до їх солей, до їх N-оксидів та до способів та застосувань таких сполук. Серед сполук формули I, перевагу віддають тим сполукам, де X¹ у формулі I означає кисень, сірку або фрагмент N-R^{1a}. Особливу перевагу віддають тим сполукам формули I, де X¹ означає кисень.

У сполуках формули I, де X означає NR^{1a}, окремий варіант здійснення відноситься до тих сполук, де R^{1a} означає С₁-С₆-алкіл, С₁-С₆-галоалкіл, С₃-С₆-циклоалкіл, С₃-С₆-циклоалкілметил, С₃-С₆-галоциклоалкіл, С₂-С₆-алкеніл, С₂-С₆-галоалкеніл, С₂-С₆-алкініл, С₁-С₄-алкокси-С₁-С₆-алкіл, феніл, гетарил, феніл-С₁-С₄-алкіл та гетарил-С₁-С₄-алкіл, де ароматичне кільце в чотирьох згаданих останніми радикалах може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3 або 4 замісника, які незалежно один від одного вибирають із групи, що складається із галогену, ціано, нітро, С₁-

С₄-алкілу, С₁-С₄-галоалкілу, С₁-С₄-алкокси та С₁-С₄-галоалкокси, або фрагмент OR^a. Зокрема, R^{1a} означає С₁-С₆-алкіл, С₃-С₆-циклоалкілметил, С₃-С₆-алкеніл, С₃-С₆-алкініл, С₁-С₄-алкокси-С₁-С₄-алкіл або фрагмент OR^a, де R^a приймає визначені вище значення й, зокрема, вибирають із С₁-С₆-алкілу, С₃-С₆-циклоалкілметилу, С₃-С₆-алкенілу, С₃-С₆-алкінілу та С₁-С₄-алкокси-С₁-С₄-алкілу.

Серед сполук формули I, перевагу віддають тим сполукам, де R¹ означає водень, CN, С₁-С₁₀-алкіл, С₁-С₁₀-галоалкіл, С₂-С₁₀-алкеніл, С₂-С₁₀-галоалкеніл, С₂-С₁₀-алкініл, С₁-С₄-алкокси-С₁-С₁₀-алкіл, С₁-С₄-алкілен-CN, OR^a, C(Y)R^b, C(Y)OR^c або S(O)₂R^d. Більшу перевагу віддають сполукам формули I, де R¹ означає водень, С₁-С₁₀-алкіл, С₁-С₁₀-галоалкіл, С₂-С₁₀-алкеніл, С₂-С₁₀-галоалкеніл, С₂-С₁₀-алкініл, С₁-С₄-алкокси-С₁-С₁₀-алкіл або С₁-С₄-алкілен-CN, зокрема водень, С₁-С₃-алкіл або С₁-С₄-алкілен-CN, зокрема водень, метил або етил.

Другий варіант здійснення винаходу відноситься до піразольних сполук формули II, до їх солей, до їх N-оксидів та до способів та застосувань таких сполук. У сполуках формули II, перевагу віддають тим сполукам, де X² у формулі II означає OR^{2a} або SR^{2a}. У таких сполуках R^{2a} переважно означає С₁-С₆-алкіл, С₃-С₆-алкеніл, С₃-С₆-алкініл, С₃-С₆-циклоалкілметил або С₁-С₄-алкокси-С₁-С₁₀-алкіл. Другий варіант здійснення відноситься до сполук формули I, де X² означає NR^{2b}R^{2c}. В цих сполуках R^{2b} та R^{2c} переважно вибирають, незалежно один від одного, з С₁-С₆-алкілу, С₃-С₆-циклоалкілметилу або С₁-С₄-алкокси-С₁-С₁₀-алкілу або R^{2b} та R^{2c}, разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, утворюють насичений, азот-зв'язаний 5- або 6-членний гетероцикл, який може включати додатковий гетероатом, вибраний із O, S та N, наприклад, NR^{2b}R^{2c} являє собою 1-піролідиніл, 1-піперидиніл, 1-піперазиніл, 4-морфолініл або 4-тіоморфолініл.

У способах та застосуваннях та серед сполук відповідно до даного винаходу, перевагу віддають сполукам, способам та застосуванням, де R² в формулах I та II вибирають із водню, метилу, дифторметилу, трифторметилу, метокси, дифторметокси та трифторметокси.

У способах та застосуваннях та серед сполук відповідно до даного винаходу, перевагу віддають сполукам, способам та застосуванням, де R³ в формулах I та II вибирають із водню, метилу, дифторметилу, трифторметилу, метокси, дифторметокси та трифторметокси.

Зокрема, принаймні, один із радикалів R² або R³ в формулах I та II означає водень. Найбільш кращий варіант здійснення винаходу відноситься до сполук формул I та II та до їх солей, де обидва R² та R³ означають водень.

Другий кращий варіант здійснення винаходу відноситься до сполук формул I та II та до їх солей та до їх N-оксидів, де R² означає водень та R³ вибирають із водню, метилу, дифторметилу, трифторметилу, метокси, дифторметокси та трифторметокси. Другий кращий варіант здійснення винаходу відноситься до сполук формул I та II та до їх солей, де R³ означає водень та R² вибирають із водню, метилу, дифторметилу, трифторметилу, метокси, дифторметокси та трифторметокси.

Кращий варіант здійснення винаходу відноситься до піразольних сполук формул I та II, до їх солей, до їх N-оксидів та до способів та застосувань таких сполук, де A означає радикал A1. Серед них, перевагу віддають сполукам формули I, де X¹, R¹, R² та R³ приймають визначені вище значення й, зокрема, мають одне з кращих значень.

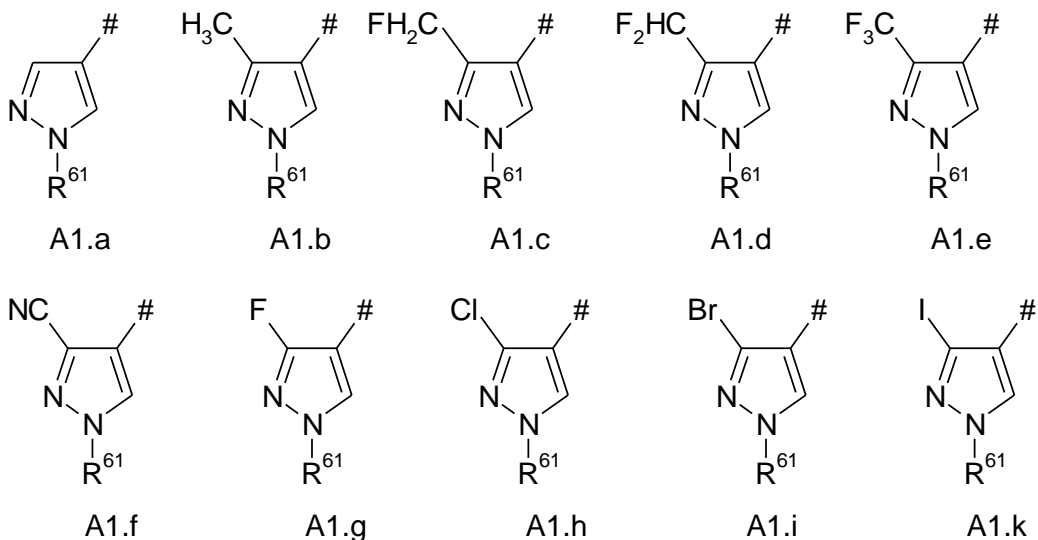
У піразольних сполуках формул I та II, де A означає радикал A1, R⁴¹ та R⁵¹ переважно вибирають, незалежно один від одного, із водню, галогену, CN, С₁-С₁₀-алкілу, С₃-С₁₀-циклоалкілу, С₂-С₁₀-алкенілу та С₂-С₁₀-алкінілу, де аліфатичні або циклічні фрагменти в 4 згаданих останніми радикалах можуть бути незаміщеними, можуть бути частково або повністю галогенованими або можуть нести 1 або 2 ідентичних або різних замісників R^y. Зокрема, R⁴¹ та R⁵¹ вибирають, незалежно один від одного, із водню, галогену, CN, С₁-С₄-алкілу, С₁-С₄-галоалкілу, С₃-С₆-циклоалкілу та С₃-С₆-галоциклоалкілу, та більш переважно із водню, галогену, CN, CH₃, CH₂F, CHF₂ та CF₃.

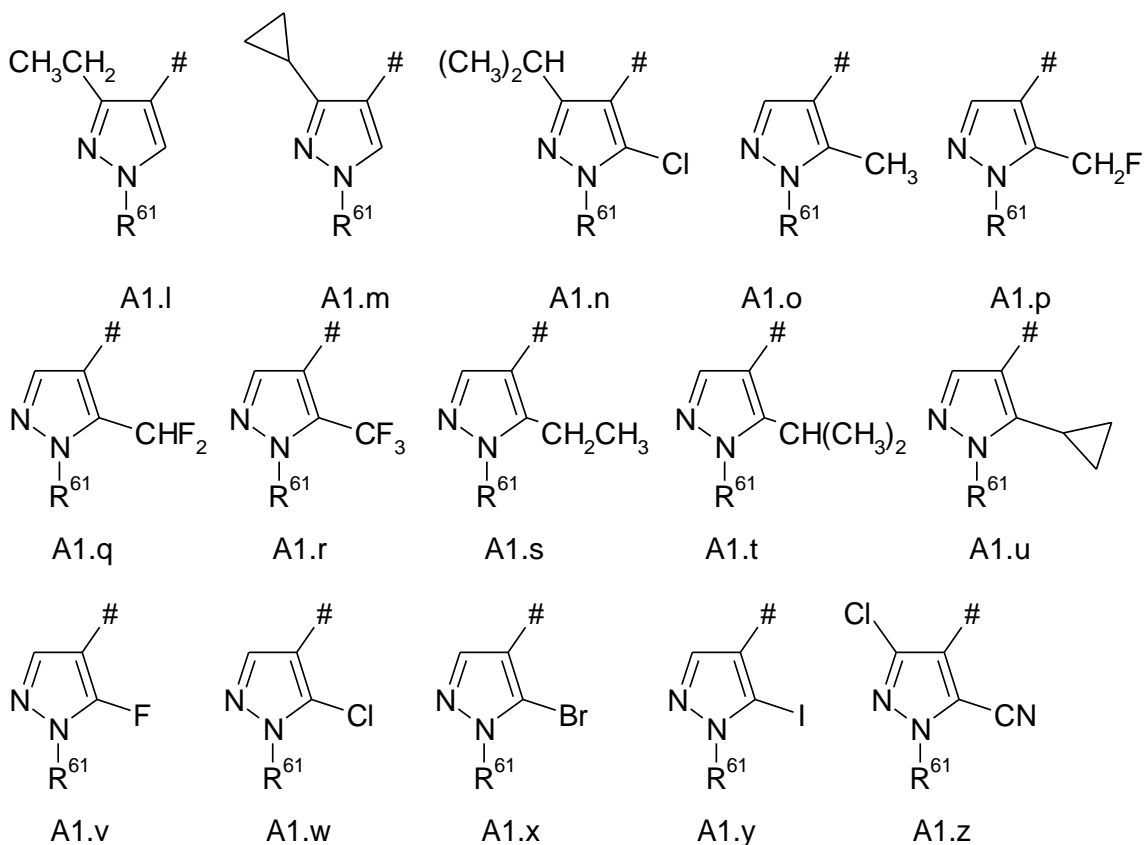
Переважно, принаймні, один з або обидва радикали R⁴¹ та R⁵¹ означають водень. Зокрема, або R⁴¹ або R⁵¹ вибирають із галогену, CN, С₁-С₁₀-алкілу, С₃-С₁₀-циклоалкілу, С₂-С₁₀-алкенілу та

С₂-С₁₀-алкінілу, де аліфатичні або циклічні фрагменти в 4 згаданих останніми радикалах можуть бути незаміщеними, можуть бути частково або повністю галогенованими або можуть нести 1 або 2 ідентичних або різних замісників R^y, у той час як радикал, що залишився, R⁴¹ або R⁵¹ означає водень або галоген, зокрема водень. Більш переважно, або R⁴¹ або R⁵¹ вибирають із галогену, CN, С₁-С₄-алкілу, С₁-С₄-галоалкілу, С₃-С₆-циклоалкілу та С₃-С₆-галоциклоалкілу, та найбільш краще з галогену, CN, CH₃, CH₂F, CHF₂ та CF₃, у той час як радикал, що залишився, R⁴¹ або R⁵¹ означає водень.

У піразольних сполуках формул I та II, де А означає радикал А1, R⁶¹ переважно вибирають із групи, що складається із С₁-С₁₀-алкілу, С₁-С₁₀-галоалкілу, С₃-С₁₀-циклоалкілу, С₃-С₁₀-галоциклоалкілу, С₃-С₁₀-циклоалкілметилу, С₃-С₁₀-галоциклоалкілметилу, С₂-С₁₀-алкенілу, С₂-С₁₀-галоалкенілу, С₁-С₄-алкокси-С₁-С₁₀-алкілу, фенілу, бензилу, феноксиметилу, 5- або 6-членного гетарилу, 5- або 6-членного гетарилметилу, де (гетеро)ароматичне кільце 5 згаданих останніми радикалів може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3, 4 або 5 ідентичних або різних замісників R^x, які приймають визначені вище значення та переважно вибирають із галогену, С₁-С₄-алкілу, С₁-С₄-галоалкілу, С₁-С₄-алкокси, С₁-С₄-галоалкокси, С₁-С₄-алкілсульфонілу, та С₁-С₄-галоалкілсульфонілу. Більш переважно R⁶¹ означає С₁-С₄-алкіл або С₁-С₄-галоалкіл, зокрема метил, етил н-пропіл, ізопропіл, дифторметил, трифторметил, 2-фторетил, 2,2-дифторетил та 2,2,2-трифторетил. Також кращими є сполуки формул I та II, де А означає радикал А1, де R⁴¹ та R⁵¹ приймають визначені тут значення, та де R⁶¹ вибирають із фенілу, бензилу та 5- або 6-членного гетарилу, зокрема піридилу, піразолілу, імідазолілу, оксазолілу, тіазолілу, ізоксазолілу, ізотіазолілу, 1,2,4-тіадіазолілу, 1,3,4-тіадіазолілу, 1,2,3-триазолілу, 1,2,4-триазолілу або тетразолілу, де ароматичний фрагмент у фенілі, бензилі та 5- або 6-членному гетарилі є незаміщеним або може нести 1, 2 або 3 ідентичних або різних замісників R^x, які приймають визначені вище значення та переважно вибирають із галогену, С₁-С₄-алкілу, С₁-С₄-галоалкілу, С₁-С₄-алкокси, С₁-С₄-галоалкокси, С₁-С₄-алкілсульфонілу, та С₁-С₄-галоалкілсульфонілу.

Прикладами придатних радикалів А1 є радикали формул А1.а, А1.б, А1.с, А1.д, А1.е, А1.ф, А1.г, А1.х, А1.і, А1.к, А1.л, А1.м, А1.н, А1.о, А1.п, А1.р, А1.с, А1.т, А1.у, А1.в, А1.х, А1.у та А1.з, де R⁶¹ приймає значення, визначене в одному рядку таблиці А1 (радикали від А1.а1-А1.а81 до А1.з1-А1.з81):





5

Таблиця А1

	$\text{R}^{61}/\text{R}^{52}$
1	H
2	CH_3
3	CH_2CH_3
4	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$
5	$\text{CH}(\text{CH}_3)_2$
6	CH_2CF_3
7	$\text{C}(\text{CH}_3)_3$
8	C_6H_5
9	4-Cl- C_6H_4
10	4-F- C_6H_4
11	2,4-Cl ₂ - C_6H_3
12	4-(CH_3O)- C_6H_4
13	2-піридил
14	5-хлор-2-піридил
15	$\text{CH}_2\text{-C}_6\text{H}_5$
16	4-(OCF_3)- C_6H_4
17	4-(SCF_3)- C_6H_4
18	4-(OCHF_2)- C_6H_4
19	4-($\text{CF}(\text{CF}_3)_2$)- C_6H_4
20	4-(SO_2CH_3)- C_6H_4
21	2,6-Cl-4- CF_3 - C_6H_2
22	3-хлор-5-трифторметилпіридин-2-іл
23	3-піридил
24	4-піридил
25	2-тіазоліл
26	4,5-диметил-тіазол-2-іл
27	4-тіазоліл

Таблиця А1

	R^{61}/R^{52}
28	5-тіазоліл
29	4-трифторметил-тіазол-2-іл
30	4-метилтіазол-2-іл
31	4-фенілтіазол-2-іл
32	5-триазоліл
33	3-метил-триазол-5-іл
34	4-хлорбензил
35	4-нітро-1-піразоліл-метил
36	2-імідазоліл
37	4-імідазоліл
38	5-імідазоліл
39	2-оксазоліл
40	4-оксазоліл
41	5-оксазоліл
42	3-ізоксазоліл
43	4-ізоксазоліл
44	5-ізоксазоліл
45	3-метилізоксазол-5-іл
46	5-метилізоксазол-3-іл
47	3-піразоліл
48	[1,3,4]тіадіазол-2-іл
49	5-тетразоліл
50	4-NO ₂ -C ₆ H ₄
51	4-CF ₃ -C ₆ H ₄
52	2,4-F ₂ -C ₆ H ₃
53	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃
54	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃
55	4-C(CH ₃) ₃ -C ₆ H ₄
56	3-Cl-C ₆ H ₄
57	3-F-C ₆ H ₄
58	2-F-C ₆ H ₄
59	2-CF ₃ -C ₆ H ₄
60	2-CH ₃ O-C ₆ H ₄
61	3-CH ₃ O-C ₆ H ₄
62	3-Cl-4-F-C ₆ H ₃
63	3-NO ₂ -C ₆ H ₄
64	2-CH ₃ -C ₆ H ₄
65	3-CH ₃ -C ₆ H ₄
66	4-CH ₃ -C ₆ H ₄
67	2-феніл-C ₆ H ₄
68	3-феніл-C ₆ H ₄
69	2-F-4-Cl-C ₆ H ₃
70	2,4,6-Cl ₃ -C ₆ H ₂
71	2,3,4-Cl ₃ -C ₆ H ₂
72	2,6-F ₂ -C ₆ H ₃
73	CH ₂ F
74	CHF ₂
75	CF ₃
76	CH ₂ CHF ₂
77	CH ₂ Cl
78	CHCl ₂
79	CCl ₃
80	CH ₂ CHCl ₂
81	CH ₂ CCl ₃

Тут та у наступних таблицях C_6H_5 означає феніл, $CH_2-C_6H_5$ означає бензил, $4-Cl-C_6H_4$ означає 4-хлорфеніл, $4-F-C_6H_4$ означає 4-фторфеніл, $4-(CH_3O)-C_6H_4$ означає 4-метоксифеніл, $2,4-Cl_2-C_6H_3$ означає 2,4-дихлорфеніл, $4-(CF(CF_3)_2)-C_6H_4$ означає 4-(1,2,2,2-тетрафтор-1-(трифторметил)етил)феніл, $4-(OCF_3)-C_6H_4$ означає 4-(трифторметокси)феніл, $4-(SCF_3)-C_6H_4$ означає 4-(трифторметилсульфаніл)феніл, $4-(OCHF_2)-C_6H_4$ означає 4-(дифторметокси)феніл, $4-(SO_2CH_3)-C_6H_4$ означає 4-(метилсульфоніл)феніл, $2,6-Cl-4-CF_3-C_6H_2$ означає 2,6-дихлор-4-(трифторметил)феніл, $4-NO_2-C_6H_4$ означає 4-нітрофеніл, $4-CF_3-C_6H_4$ означає 4-(трифторметил)феніл, $2,4-F_2-C_6H_3$ означає 2,4-дифторфеніл, $3,5-Cl_2-C_6H_3$ означає 3,5-дихлорфеніл, $3,4-Cl_2-C_6H_3$ означає 3,4-дихлорфеніл, $4-C(CH_3)_3-C_6H_4$ означає 4-трет-бутилфеніл, $3-Cl-C_6H_4$ означає 3-хлорфеніл, $3-F-C_6H_4$ означає 3-фторфеніл, $2-F-C_6H_4$ означає 2-фторфеніл, $2-CF_3-C_6H_4$ означає 2-(трифторметил)феніл, $2-CH_3O-C_6H_4$ означає 2-метоксифеніл, $3-CH_3O-C_6H_4$ означає 3-метоксифеніл, $3-Cl-4-F-C_6H_3$ означає 3-хлор-4-фторфеніл, $3-NO_2-C_6H_4$ означає 3-нітрофеніл, $2-CH_3-C_6H_4$ означає 2-толіл, $3-CH_3-C_6H_4$ означає 3-толіл, $4-CH_3-C_6H_4$ означає 4-толіл, $2-феніл-C_6H_4$ означає біфеніл-2-іл, $3-феніл-C_6H_4$ означає біфеніл-3-іл, $2-F-4-Cl-C_6H_3$ означає 2-фтор-4-хлорфеніл, $2,4,6-Cl_3-C_6H_2$ означає 2,3,4-трихлорфеніл, $2,3,4-Cl_3-C_6H_2$ означає 2,3,4-трихлорфеніл, та $2,6-F_2-C_6H_3$ означає 2,6-дифторфеніл.

Подальший варіант здійснення винаходу відноситься до піразольних сполук формул I та II, до їх солей та до способів та застосувань таких сполук, де А означає радикал A_2 . Серед них, перевагу віддають сполукам формули I, де X^1 , R^1 , R^2 та R^3 приймають визначені вище значення й, зокрема, мають одне з кращих значень.

У піразольних сполуках формул I та II, де А означає радикал A_2 , R^{42} переважно вибирають із водню, галогену, CN, C_1-C_4 -алкілу, C_1-C_4 -галоалкілу, C_3-C_{10} -циклоалкілу, C_3-C_{10} -галоциклоалкілу та фенілу, який може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3, 4 або 5 ідентичних або різних замісників R^x , які приймають визначені вище значення та які переважно вибирають із галогену, C_1-C_4 -алкілу, C_1-C_4 -галоалкілу, C_1-C_4 -алкокси, C_1-C_4 -галоалкокси, C_1-C_4 -алкілсульфонілу, та C_1-C_4 -галоалкілсульфонілу. Зокрема, R^{42} вибирають із водню, галогену, CN, C_1-C_4 -алкілу, C_1-C_4 -галоалкілу, C_3-C_6 -циклоалкілу та C_3-C_6 -галоциклоалкілу, та більш переважно із водню, галогену, CN, CH_3 , CH_2F , CHF_2 та CF_3 .

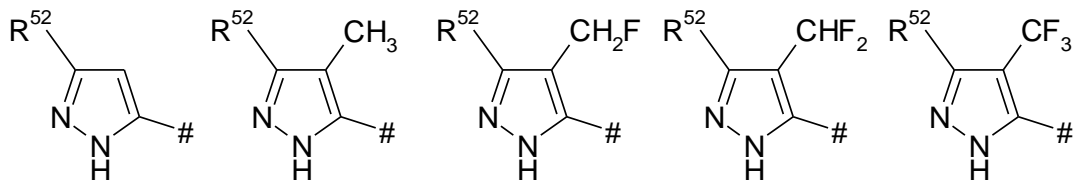
У піразольних сполуках формул I та II, де А означає радикал A_2 , R^{52} переважно вибирають із групи, що складається із водню, галогену, C_1-C_{10} -алкілу, C_1-C_{10} -галоалкілу, C_3-C_{10} -циклоалкілу, C_3-C_{10} -галоциклоалкілу, C_3-C_{10} -циклоалкілметилу, C_3-C_{10} -галоциклоалкілметилу, C_2-C_{10} -алкенілу, C_2-C_{10} -галоалкенілу, C_1-C_4 -алкокси- C_1-C_{10} -алкілу, фенілу, бензилу, феноксиметилу, 5- або 6-членного гетарилу, 5- або 6-членного гетарилметилу, де (гетеро)ароматичне кільце 5 згаданих останніми радикалів може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3, 4 або 5 ідентичних або різних замісників R^x , які приймають визначені вище значення та переважно вибирають із галогену, C_1-C_4 -алкілу, C_1-C_4 -галоалкілу, C_1-C_4 -алкокси, C_1-C_4 -галоалкокси, C_1-C_4 -алкілсульфонілу, та C_1-C_4 -галоалкілсульфонілу. Більш переважно R^{52} вибирають із групи, що складається із водню, галогену, CN, C_1-C_{10} -алкілу, C_1-C_{10} -галоалкілу, C_3-C_{10} -циклоалкілу, C_3-C_{10} -галоциклоалкілу, C_3-C_{10} -циклоалкілметилу, C_3-C_{10} -галоциклоалкілметилу, C_2-C_{10} -алкенілу, C_2-C_{10} -галоалкенілу та C_1-C_4 -алкокси- C_1-C_{10} -алкілу. Найбільш краще R^{52} означає водень, галоген, C_1-C_4 -алкіл або C_1-C_4 -галоалкіл, зокрема метил, етил, н-пропіл, ізопропіл, дифторметил, трифторметил та 2,2,2-трифторетил. Також кращими є сполуки формул I та II, де А означає радикал A_2 , де R^{42} та R^{62} приймають визначені тут значення, та де R^{52} вибирають із фенілу, бензилу та 5- або 6-членного гетарилу, зокрема піридилу, піразолілу, імідазолілу, оксазолілу, тіазолілу, ізоксазолілу, ізотіазолілу, 1,2,4-тіадіазолілу, 1,3,4-тіадіазолілу, 1,2,3-тріазолілу, 1,2,4-тріазолілу або тетразолілу, де ароматичний фрагмент у фенілі, бензилі та 5- або 6-членному гетарилі є незаміщеним або може нести 1, 2 або 3 ідентичних або різних замісників R^x , які приймають визначені вище значення та переважно вибирають із галогену, C_1-C_4 -алкілу, C_1-C_4 -галоалкілу, C_1-C_4 -алкокси, C_1-C_4 -галоалкокси, C_1-C_4 -алкілсульфонілу, та C_1-C_4 -галоалкілсульфонілу.

У піразольних сполуках формул I та II, де А означає радикал A_2 , R^{62} переважно вибирають із групи, що складається із C_1-C_{10} -алкілу, C_1-C_{10} -галоалкілу, C_3-C_{10} -циклоалкілу, C_3-C_{10} -галоциклоалкілу, C_3-C_{10} -циклоалкілметилу, C_3-C_{10} -галоциклоалкілметилу, C_2-C_{10} -алкенілу, C_2-C_{10} -галоалкенілу, C_1-C_4 -алкокси- C_1-C_{10} -алкілу, фенілу, бензилу та феноксиметилу, де ароматичне кільце 3 згаданих останніми радикалів може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3, 4 або 5 ідентичних або різних замісників R^x , які приймають визначені вище значення, та більш

переважно вибирають із галогену, C₁-C₄-алкілу, C₁-C₄-галоалкілу, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-галоалкокси, C₁-C₄-алкілсульфонілу, та C₁-C₄-галоалкілсульфонілу. Більш переважно R⁵² означає C₁-C₄-алкіл або C₁-C₄-галоалкіл, зокрема метил, етил, н-пропіл, ізопропіл, дифторметил, трифторметил та 2,2,2-трифторетил.

5

Прикладами придатних радикалів A2 є радикали формул A2.aa, A2.ab, A2.ac, A2.ad, A2.ae, A2.af, A2.ag, A2.ah, A2.ai, A2.ak, A2.al, A2.am, A2.an та A2.ao, де R⁵² приймає значення, визначене в одному рядку таблиці A1 (радикали від A2.aa1-A2.aa81 до A2.ao1-A2.ao81):



A2.aa

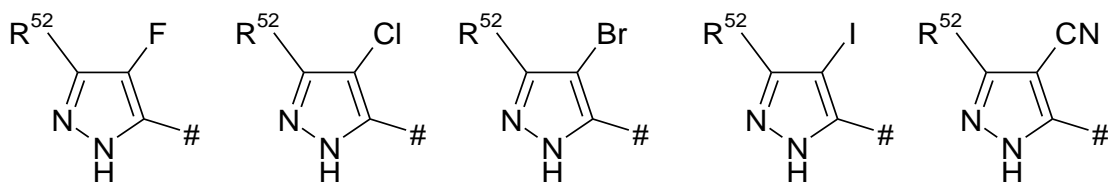
A2.ab

A2.ac

A2.ad

A2.ae

10



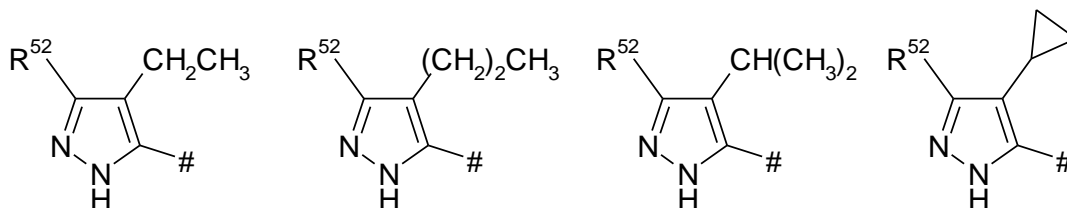
A2.af

A2.ag

A2.ah

A2.ai

A2.ak



A2.al

A2.am

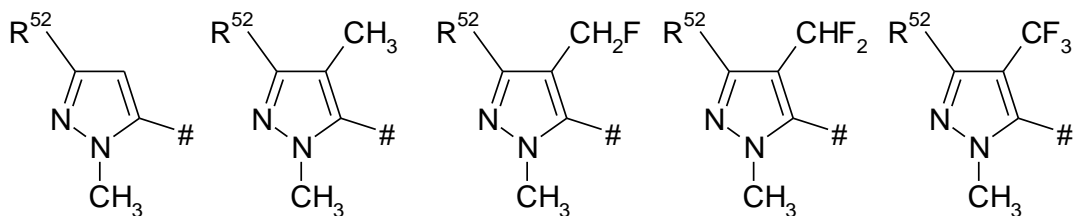
A2.an

A2.ao

15

Подальшими прикладами придатних радикалів A2 є радикали формул A2.ba, A2.bb, A2.bc, A2.bd, A2.be, A2.bf, A2.bg, A2.bh, A2.bi, A2.bk, A2.bl, A2.bm, A2.bn та A2.bo, де R⁵² приймає значення, визначене в одному рядку таблиці A1 (радикали від A2.ba1-A2.ba81 до A2.bo1-A2.bo81):

20



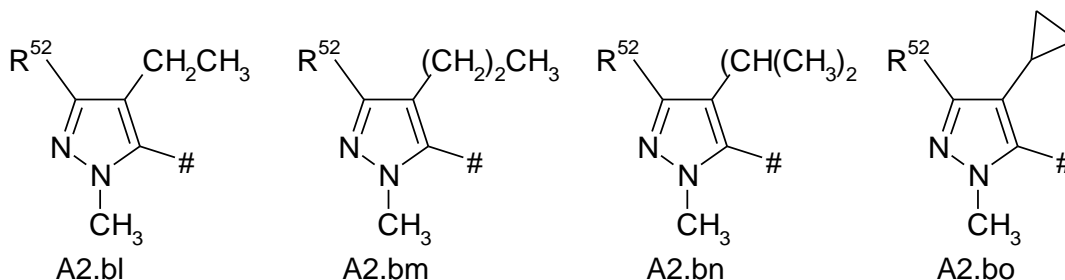
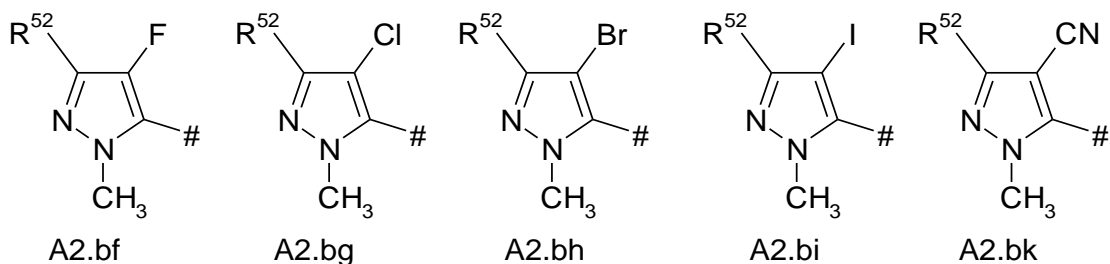
A2.ba

A2.bb

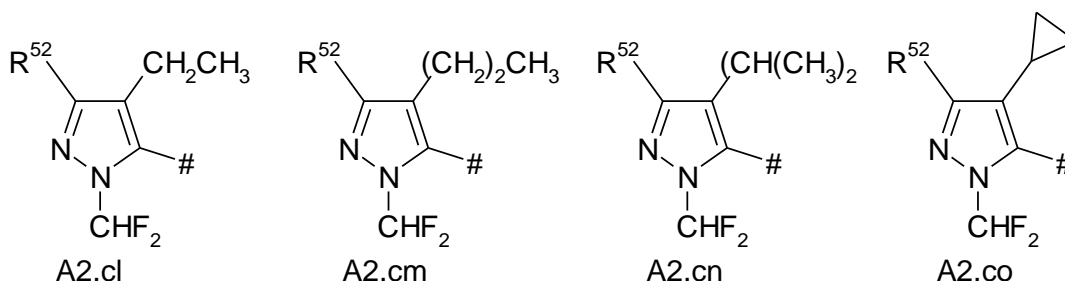
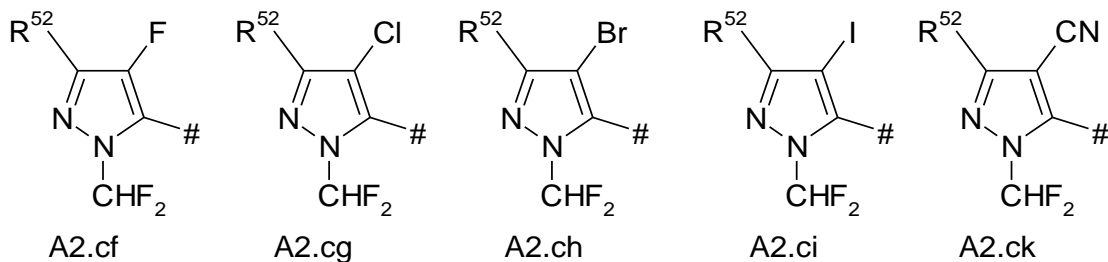
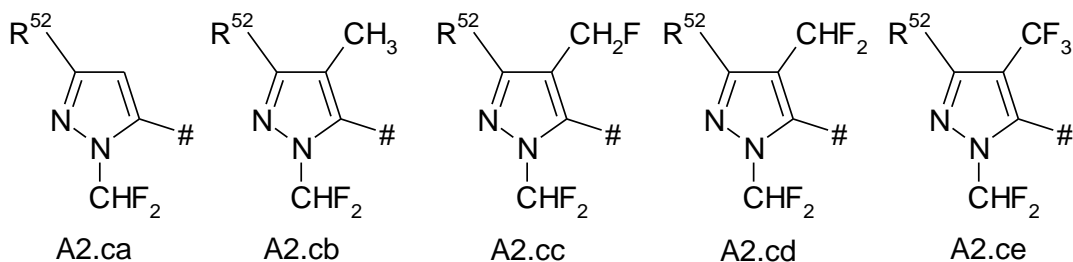
A2.bc

A2.bd

A2.be

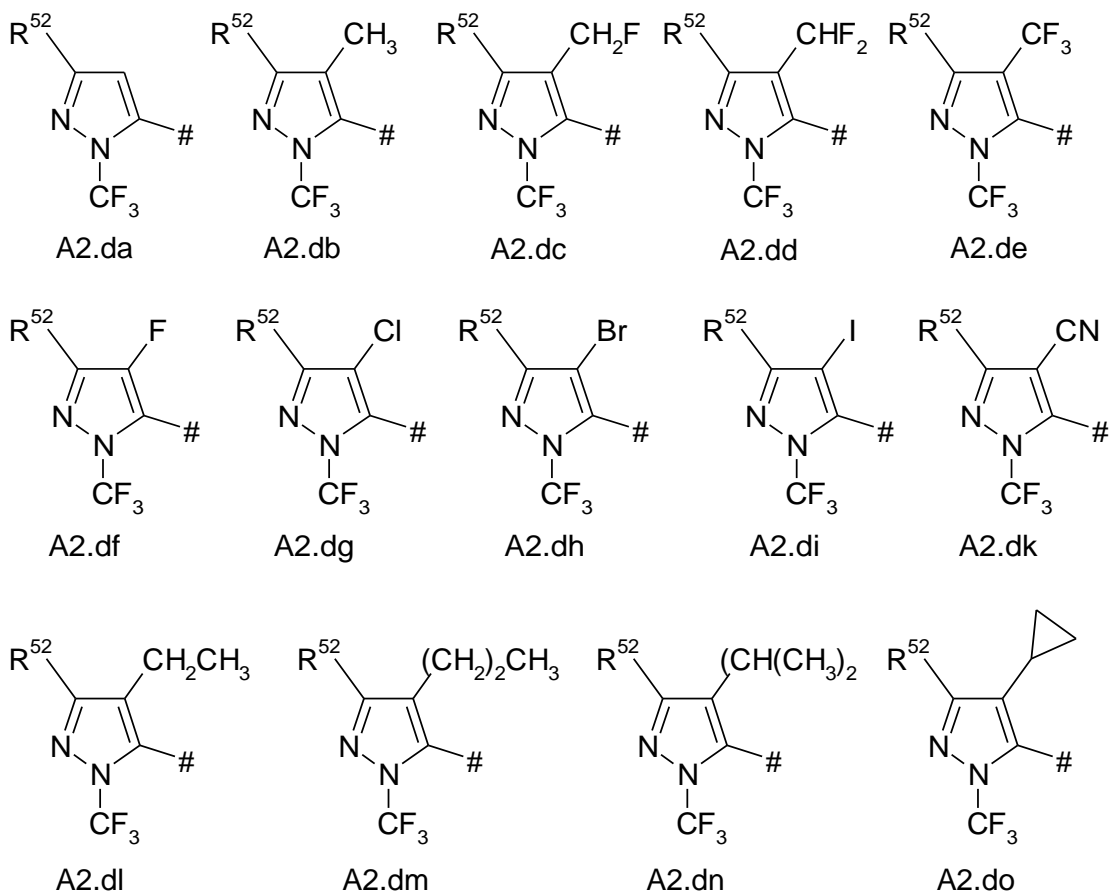


5 Подальшими прикладами придатних радикалів A2 є радикали формул A2.ca, A2.cb, A2.cc, A2.cd, A2.ce, A2.cf, A2.cg, A2.ch, A2.ci, A2.ck, A2.cl, A2.cm, A2.cn та A2.co, де R⁵² приймає значення, визначене в одному рядку таблиці A1 (радикали від A2.ca1-A2.ca81 до A2.co1-A2.co81):



15 Подальшими прикладами придатних радикалів A2 є радикали формул A2.da, A2.db, A2.dc, A2.dd, A2.de, A2.df, A2.dg, A2.dh, A2.di, A2.dk, A2.dl, A2.dm, A2.dn та A2.do, де R⁵² приймає значення, визначене в одному рядку таблиці A1 (радикали від A2.da1-A2.da81 до A2.do1-A2.do81):

20



5

Подальший варіант здійснення винаходу відноситься до піразольних сполук формул I та II, до їх солей та до способів та застосувань таких сполук, де А означає радикал АЗ. Серед них, перевагу віддають сполукам формули I, де X^1 , R^1 , R^2 та R^3 приймають визначені вище значення й, зокрема, мають одне з кращих значень.

10

У піразольних сполуках формул I та II, де А означає радикал АЗ, R^{43} переважно вибирають із водню, галогену, CN, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілу та фенілу, який може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3, 4 або 5 ідентичних або різних замісників R^x , які приймають визначені вище значення та які переважно вибирають із галогену, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкілсульфонілу, та C_1 - C_4 -галоалкілсульфонілу. Зокрема, R^{43} вибирають із водню, галогену, CN, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_3 - C_6 -циклоалкілу та C_3 - C_6 -галоциклоалкілу, та більш переважно із водню, галогену, CN, CH_3 , CH_2F , CHF_2 та CF_3 .

15

20

У піразольних сполуках формул I та II, де А означає радикал АЗ, R^{53} переважно вибирають із групи, що складається із водню, галогену, C_1 - C_{10} -алкілу, C_1 - C_{10} -галоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілметилу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілметилу, C_2 - C_{10} -алкенілу, C_2 - C_{10} -галоалкенілу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_{10} -алкілу, фенілу, бензилу, феноксиметилу, 5- або 6-членного гетарилу, 5- або 6-членного гетарилметилу, де (гетеро)ароматичне кільце 5 згаданих останніми радикалів може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3, 4 або 5 ідентичних або різних замісників R^x , які приймають визначені вище значення та переважно вибирають із галогену, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкілсульфонілу, та C_1 - C_4 -галоалкілсульфонілу. Більш переважно R^{53} вибирають із групи, що складається із водню, галогену, CN, C_1 - C_{10} -алкілу, C_1 - C_{10} -галоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілметилу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілметилу, C_2 - C_{10} -алкенілу, C_2 - C_{10} -галоалкенілу та C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_{10} -алкілу. Найбільш краще R^{53} означає водень, галоген, C_1 - C_4 -алкіл або C_1 - C_4 -галоалкіл, зокрема метил, етил, н-пропіл, ізопропіл, дифторметил, трифторметил або 2,2,2-трифторетил. Також кращими є сполуки формул I та II, де А означає радикал А2, де R^{43} та R^{63} приймають визначені тут значення, та де R^{53} вибирають із фенілу, бензилу та 5- або 6-членного гетарилу, зокрема піридилу, піразолілу, імідазолілу, оксазолілу,

25

30

35

тіазолілу, ізоксазолілу, ізотіазолілу, 1,2,4-тіадіазолілу, 1,3,4-тіадіазолілу, 1,2,3-триазолілу, 1,2,4-триазолілу або тетразолілу, де ароматичний фрагмент у фенілі, бензилі та 5- або 6-членному гетарилі є незаміщеним або може нести 1, 2 або 3 ідентичних або різних замісника R^x , які приймають визначені вище значення та переважно вибирають із галогену, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкілсульфонілу, та C_1 - C_4 -галоалкілсульфонілу.

У піразольних сполуках формул I та II, де А означає радикал АЗ, R^{63} переважно вибирають із групи, що складається із водню, C_1 - C_{10} -алкілу, C_1 - C_{10} -галоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілметилу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілметилу, C_2 - C_{10} -алкенілу, C_2 - C_{10} -галоалкенілу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_{10} -алкілу, фенілу, бензилу, феноксиметилу, 5- або 6-членного гетарилу, 5- або 6-членного гетарилметилу, де (гетеро)ароматичне кільце 5 згаданих останніми радикалів може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3, 4 або 5 ідентичних або різних замісників R^x , які приймають визначені вище значення та переважно вибирають із галогену, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкілсульфонілу, та C_1 - C_4 -галоалкілсульфонілу. Більш переважно R^{63} означає C_1 - C_4 -алкіл або C_1 - C_4 -галоалкіл, зокрема метил, етил, н-пропіл, ізопропіл, дифторметил, трифторметил та 2,2,2-трифторетил. Також кращими є сполуки формул I та II, де А означає радикал А2, де R^{43} та R^{63} приймають визначені тут значення, та де R^{63} вибирають із фенілу, бензилу та 5- або 6-членного гетарилу, зокрема піридилу, піразолілу, імідазолілу, оксазолілу, тіазолілу, ізоксазолілу, ізотіазолілу, 1,2,4-тіадіазолілу, 1,3,4-тіадіазолілу, 1,2,3-триазолілу, 1,2,4-триазолілу або тетразолілу, де ароматичний фрагмент у фенілі, бензилі та 5- або 6-членному гетарилі є незаміщеним або може нести 1, 2 або 3 ідентичних або різних замісника R^x , які приймають визначені вище значення та переважно вибирають із галогену, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкілсульфонілу, та C_1 - C_4 -галоалкілсульфонілу.

Серед піразольних сполук формул I та II, де А означає радикал АЗ, є особливо переважними ті, де або R^{53} або R^{63} означає водень, CN, C_1 - C_4 -алкіл або C_1 - C_4 -галоалкіл, зокрема водень, CN, CH_3 , CH_2F , CHF_2 або CF_3 , де R^{53} також може означати галоген, тоді як інший радикал R^{53} , R^{63} вибирають із групи, що складається із C_1 - C_{10} -алкілу, C_1 - C_{10} -галоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілметилу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілметилу, C_2 - C_{10} -алкенілу, C_2 - C_{10} -галоалкенілу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_{10} -алкілу, фенілу, бензилу, феноксиметилу, 5- або 6-членного гетарилу, 5- або 6-членного гетарилметилу, де (гетеро)ароматичне кільце 5 згаданих останніми радикалів може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3, 4 або 5 ідентичних або різних замісників R^x , які приймають визначені вище значення й, зокрема, вибирають з галогену, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкілсульфонілу, та C_1 - C_4 -галоалкілсульфонілу.

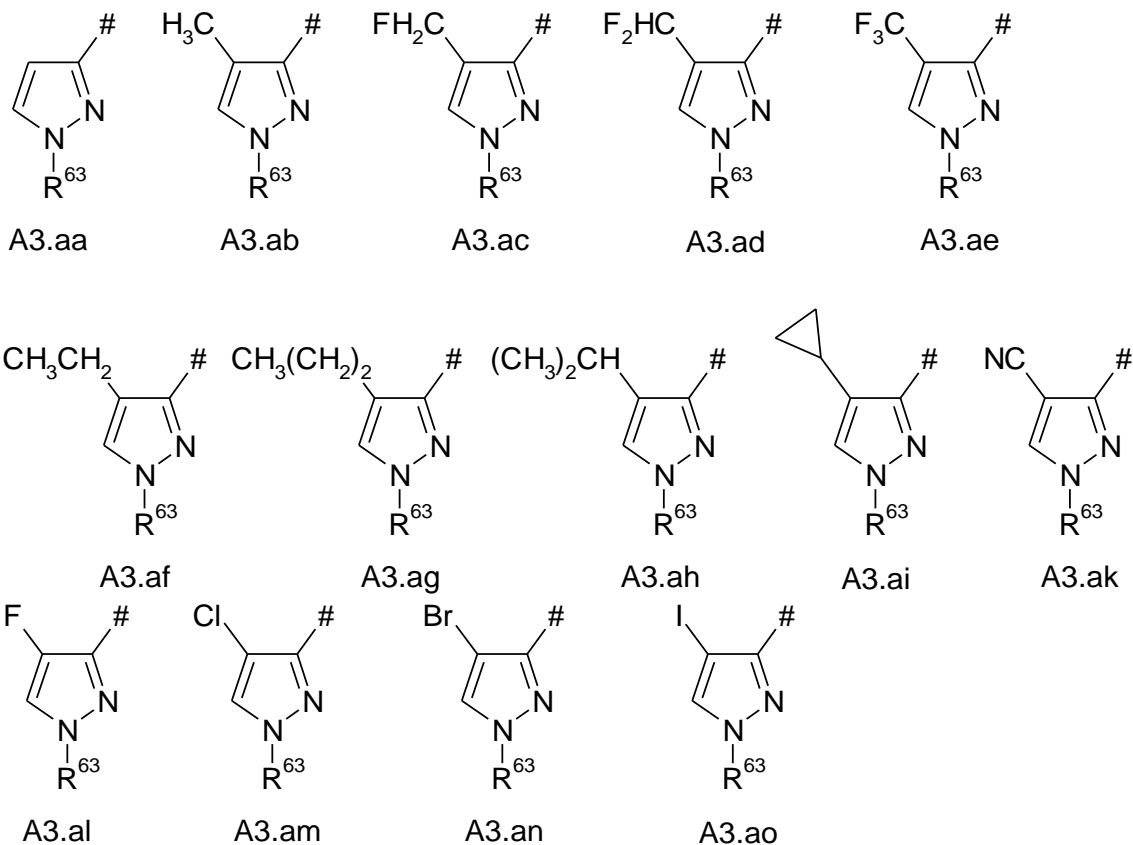
Зокрема R^{63} означає водень, CN, C_1 - C_4 -алкіл або C_1 - C_4 -галоалкіл, особливо водень, CN, CH_3 , CH_2F , CHF_2 або CF_3 , та R^{53} вибирають із C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, зокрема метилу, етилу, н-пропілу, ізопропілу, дифторметилу, трифторметилу та 2,2,2-трифторетилу, фенілу, бензилу та 5- або 6-членного гетарилу, зокрема піридилу, піразолілу, імідазолілу, оксазолілу, тіазолілу, ізоксазолілу, ізотіазолілу, 1,2,4-тіадіазолілу, 1,3,4-тіадіазолілу, 1,2,3-триазолілу, 1,2,4-триазолілу або тетразолілу, де ароматичний фрагмент у фенілі, бензилі та 5- або 6-членному гетарилі є незаміщеним або може нести 1, 2 або 3 ідентичних або різних замісника R^x , які приймають визначені вище значення та переважно вибирають із галогену, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкілсульфонілу, та C_1 - C_4 -галоалкілсульфонілу,

або

R^{53} означає водень, галоген, CN, C_1 - C_4 -алкіл або C_1 - C_4 -галоалкіл, особливо водень, CN, CH_3 , CH_2F , CHF_2 або CF_3 , та R^{63} вибирають із C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, зокрема метилу, етилу, н-пропілу, ізопропілу, дифторметилу, трифторметилу та 2,2,2-трифторетилу, фенілу, бензилу та 5- або 6-членного гетарилу, зокрема піридилу, піразолілу, імідазолілу, оксазолілу, тіазолілу, ізоксазолілу, ізотіазолілу, 1,2,4-тіадіазолілу, 1,3,4-тіадіазолілу, 1,2,3-триазолілу, 1,2,4-триазолілу або тетразолілу, де ароматичний фрагмент у фенілі, бензилі та 5- або 6-членному гетарилі є незаміщеним або може нести 1, 2 або 3 ідентичних або різних замісника R^x , які приймають визначені вище значення та переважно вибирають із галогену, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -

галоалкілу, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-галоалкокси, C₁-C₄-алкілсульфонілу, та C₁-C₄-галоалкілсульфонілу.

- 5 Прикладами придатних радикалів A3 є радикали формул A3.aa, A3.ab, A3.ac, A3.ad, A3.ae, A3.af, A3.ag, A3.ah, A3.ai, A3.ak, A3.al, A3.am, A3.an та A3.ao, де R⁶³ приймає значення, визначене в одному рядку таблиці A3 (радикали від A3.aa1-A3.aa81 до A3.ao1-A3.ao81):



Таблиця A3

	R ⁵³ /R ⁶³
1	H
2	CH ₃
3	CH ₂ CH ₃
4	CH ₂ CH ₂ CH ₃
5	CH(CH ₃) ₂
6	CH ₂ CF ₃
7	C(CH ₃) ₃
8	C ₆ H ₅
9	4-Cl-C ₆ H ₄
10	4-F-C ₆ H ₄
11	2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃
12	4-(CH ₃ O)-C ₆ H ₄
13	2-піридил
14	5-хлор-2-піридил
15	CH ₂ -C ₆ H ₅
16	4-(OCF ₃)-C ₆ H ₄
17	4-(SCF ₃)-C ₆ H ₄
18	4-(OCHF ₂)-C ₆ H ₄
19	4-(CF(CF ₃) ₂)-C ₆ H ₄
20	4-(SO ₂ CH ₃)-C ₆ H ₄
21	2,6-Cl-4-CF ₃ -C ₆ H ₂

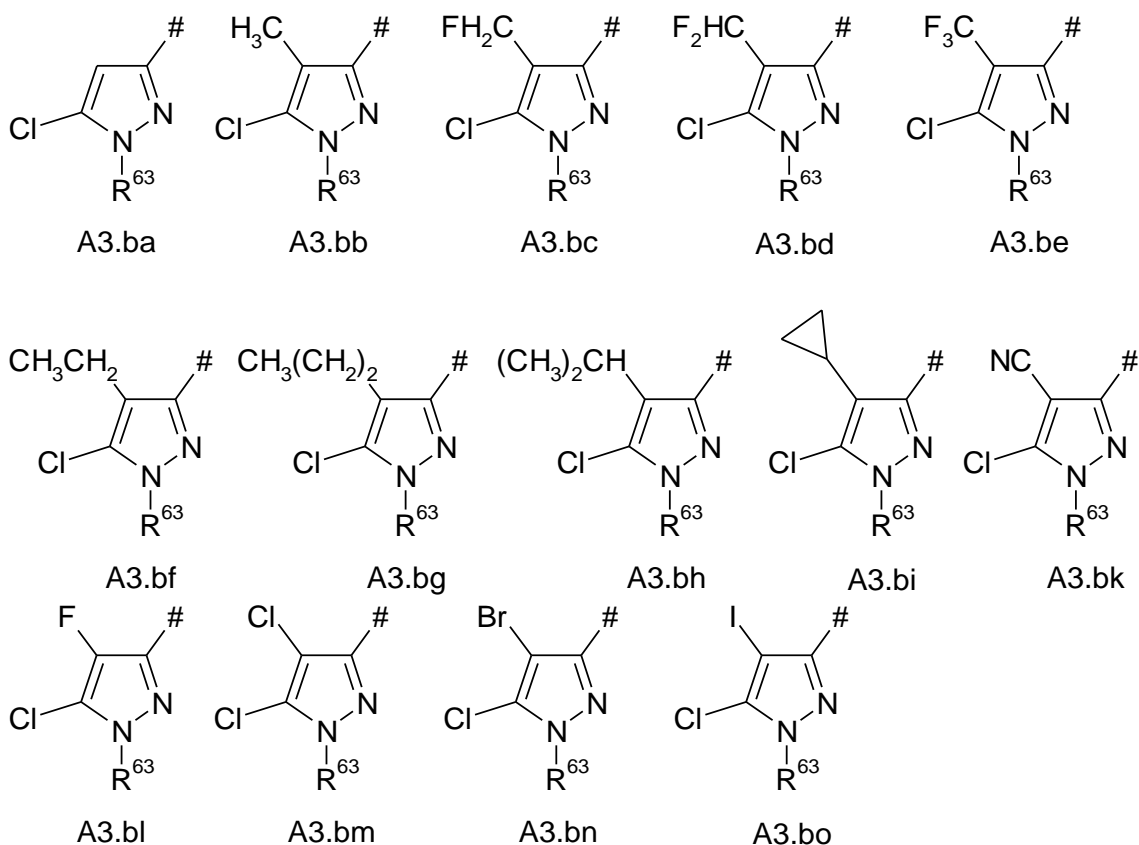
	R^{53}/R^{63}
22	3-хлор-5-трифторметилпіридин-2-іл
23	3-піридил
24	4-піридил
25	2-тіазоліл
26	4,5-диметил-тіазол-2-іл
27	4-тіазоліл
28	5-тіазоліл
29	4-трифторметил-тіазол-2-іл
30	4-метилтіазол-2-іл
31	4-фенілтіазол-2-іл
32	5-триазоліл
33	3-метил-триазол-5-іл
34	4-хлорбензил
35	4-нітро-1-піразоліл-метил
36	2-імідазоліл
37	4-імідазоліл
38	5-імідазоліл
39	2-оксазоліл
40	4-оксазоліл
41	5-оксазоліл
42	3-ізоксазоліл
43	4-ізоксазоліл
44	5-ізоксазоліл
45	3-метилізоксазол-5-іл
46	5-метилізоксазол-3-іл
47	3-піразоліл
48	[1,3,4]тіадіазол-2-іл
49	5-тетразоліл
50	4-NO ₂ -C ₆ H ₄
51	4-CF ₃ -C ₆ H ₄
52	2,4-F ₂ -C ₆ H ₃
53	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃
54	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃
55	4-C(CH ₃) ₃ -C ₆ H ₄
56	3-Cl-C ₆ H ₄
57	3-F-C ₆ H ₄
58	2-F-C ₆ H ₄
59	2-CF ₃ -C ₆ H ₄
60	2-CH ₃ O-C ₆ H ₄
61	3-CH ₃ O-C ₆ H ₄
62	3-Cl-4-F-C ₆ H ₃
63	3-NO ₂ -C ₆ H ₄
64	2-CH ₃ -C ₆ H ₄
65	3-CH ₃ -C ₆ H ₄
66	4-CH ₃ -C ₆ H ₄
67	2-феніл-C ₆ H ₄
68	3-феніл-C ₆ H ₄
69	2-F-4-Cl-C ₆ H ₃
70	2,4,6-Cl ₃ -C ₆ H ₂
71	2,3,4-Cl ₃ -C ₆ H ₂
72	2,6-F ₂ -C ₆ H ₃
73	CH ₂ F
74	CHF ₂
75	CF ₃
76	CH ₂ CHF ₂

Таблиця А3

	R^{53}/R^{63}
77	CH_2Cl
78	$CHCl_2$
79	CCl_3
80	CH_2CHCl_2
81	CH_2CCl_3

Подальшими прикладами придатних радикалів А3 є радикали формул А3.ba, А3.bb, А3.bc, А3.bd, А3.be, А3.bf, А3.bg, А3.bh, А3.bi, А3.bk, А3.bl, А3.bm, А3.bn та А3.bo, де R^{63} приймає значення, визначене в одному рядку таблиці А3 (радикали від А3.ba1-А3.ba81 до А3.bo1-А3.bo81):

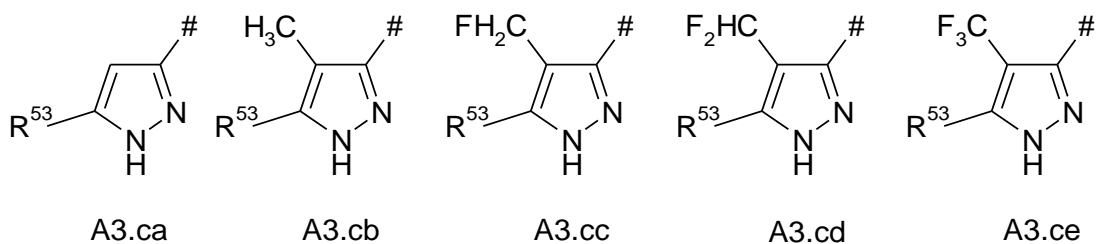
5

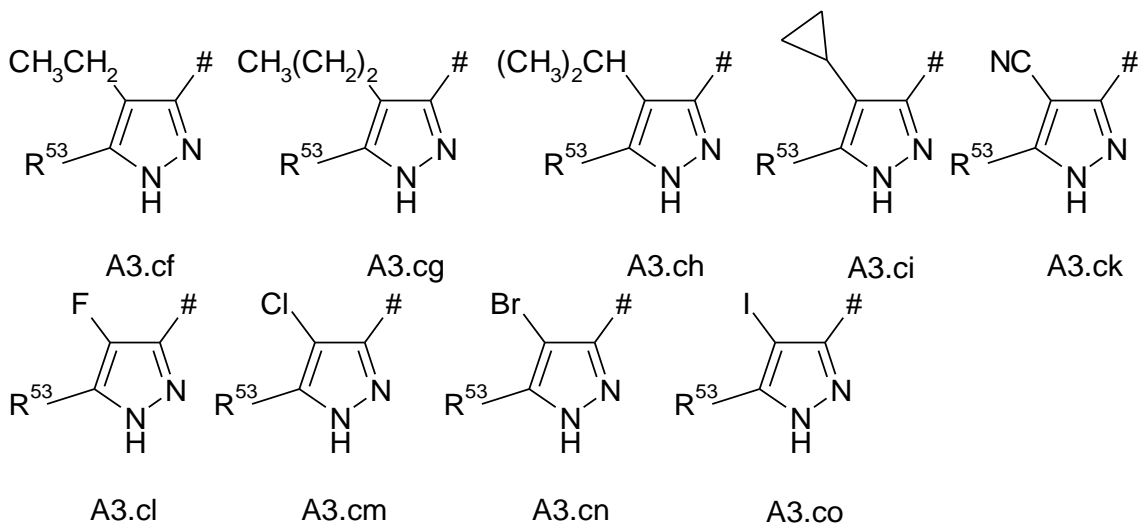


10

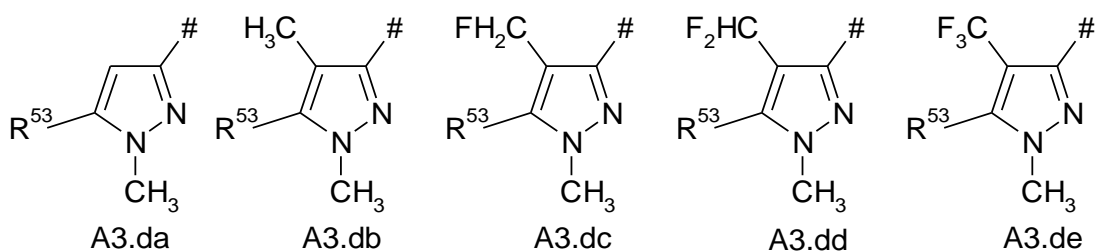
Подальшими прикладами придатних радикалів А3 є радикали формул А3.ca, А3.cb, А3.cc, А3.cd, А3.ce, А3.cf, А3.cg, А3.ch, А3.ci, А3.ck, А3.cl, А3.cm, А3.cn та А3.co, де R^{53} приймає значення, визначене в одному рядку таблиці А3 (радикали від А3.ca1-А3.ca81 до А3.co1-А3.co81):

15

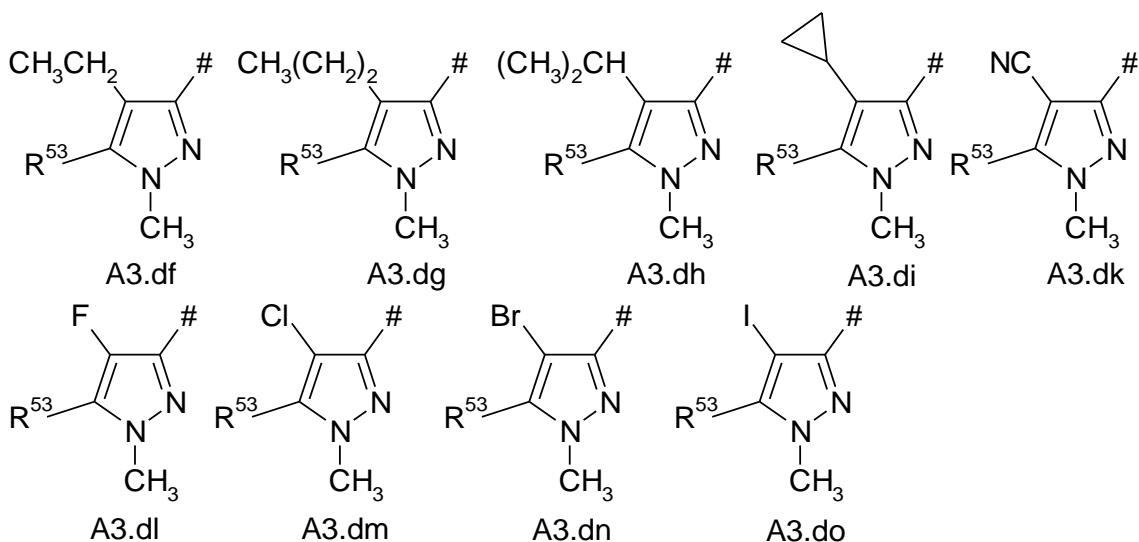




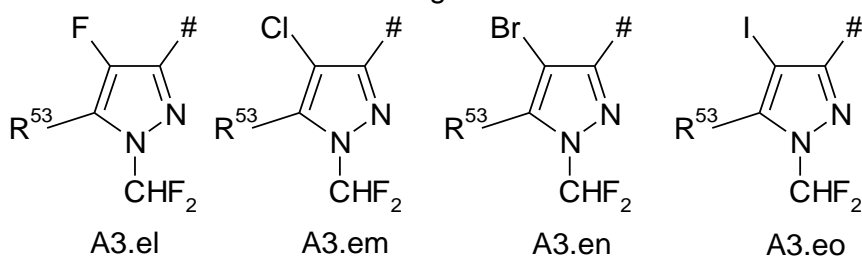
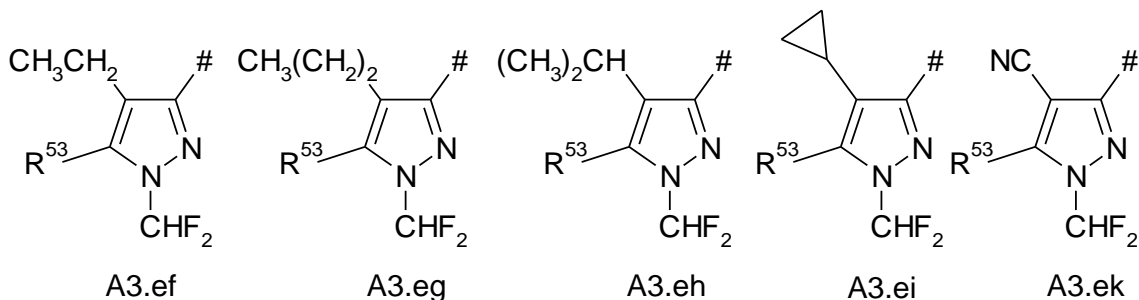
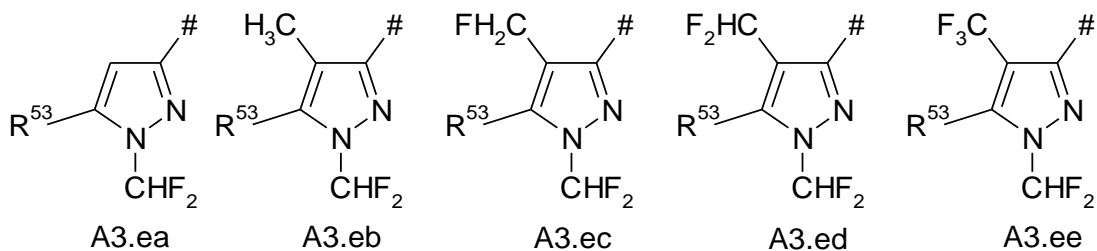
5 Подальшими прикладами придатних радикалів A3 є радикали формул A3.da, A3.db, A3.dc, A3.dd, A3.de, A3.df, A3.dg, A3.dh, A3.di, A3.dk, A3.dl, A3.dm, A3.dn та A3.do, де R^{53} приймає значення, визначене в одному рядку таблиці A3 (радикали від A3.da1-A3.da81 до A3.do1-A3.do81):



10

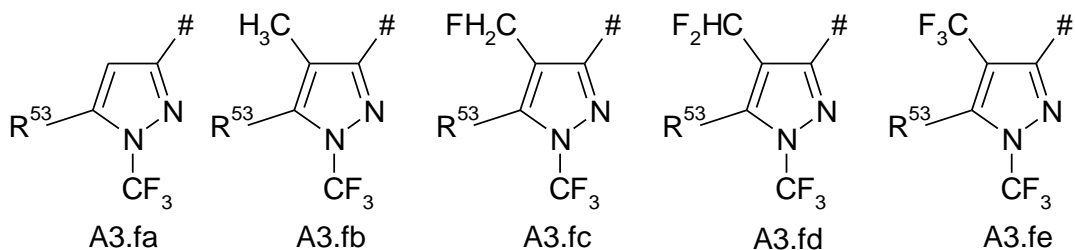


15 Подальшими прикладами придатних радикалів A3 є радикали формул A3.ea, A3.eb, A3.ec, A3.ed, A3.ee, A3.ef, A3.eg, A3.eh, A3.ei, A3.ek, A3.el, A3.em, A3.en та A3.eo, де R^{53} приймає значення, визначене в одному рядку таблиці A3 (радикали від A3.ea1-A3.ea81 до A3.eo1-A3.eo81):

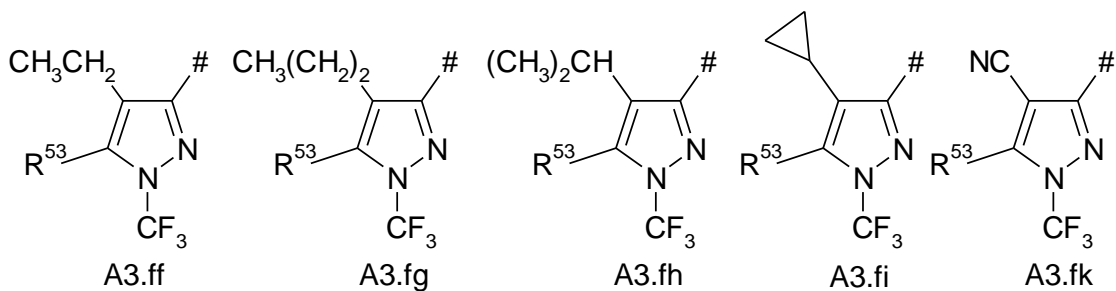


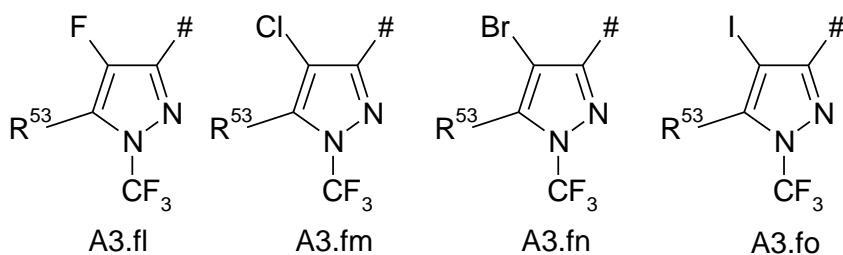
5

Подальшими прикладами придатних радикалів А3 є радикали формул А3.фа, А3.фб, А3.фс, А3.фд, А3.фе, А3.фф, А3.фг, А3.фх, А3.фі, А3.фк, А3.фі, А3.фм, А3.фн та А3.фо, де R^{53} приймає значення, визначене в одному рядку таблиці А3 (радикали від А3.фа1-А3.фа81 до А3.фо1-А3.фо81):



10





Крім того, X^3 краще означає неподілену пару. Сполуки формул I або II, де X означає O, також називають N-оксидами сполук I або II.

Крім того, змінні Y , R^a , R^b , R^c , R^d , R^e , R^f , R^g , R^h , R^x та R^y , незалежно один від одного, переважно мають одне із наступних значень:

Y означає O;

R^a , R^b , R^c незалежно один від одного вибирають із водню, C_1 - C_4 -алкілу та C_1 - C_4 -галоалкілу;

R^d вибирають із C_1 - C_4 -алкілу та C_1 - C_4 -галоалкілу;

R^e , R^f незалежно один від одного вибирають із водню, C_1 - C_4 -алкілу, або

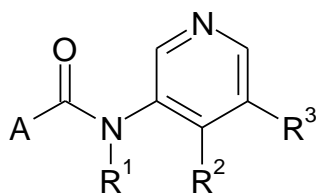
R^e та R^f разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, утворюють 5- або 6-членний, насичений гетероцикл, який може нести додатковий гетероатом, що вибирають з O, S та N як атом – член кільця, наприклад, піролідин-1-іл, піперидин-1-іл, морфолін-4-ил, пиперазин-1-іл або 4-метилпиперазин-1-іл;

R^g , R^h , R^i незалежно один від одного вибирають із водню та C_1 - C_4 -алкілу;

R^x вибирають із групи, що складається із галогену, ціано, нітро, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкілсульфонілу та C_1 - C_4 -галоалкілсульфонілу;

R^y вибирають із C_1 - C_4 -алкокси, C_3 - C_6 -циклоалкілу та фенілу.

Найбільш кращий варіант здійснення винаходу відноситься до сполук формули I та до їх солей, де X^1 означає O та X^3 означає неподілену пару. Ці сполуки в подальшому також згадуються як сполуки Ia.



(Ia)

У формулі Ia, змінні A , R^1 , R^2 та R^3 мають визначене тут значення. Серед сполук формули Ia, перевагу віддають тим сполукам, де A означає радикал A1, наприклад, радикал, вибраний із піразольних радикалів A1.a1-A1.z81. Серед сполук формули Ia, перевагу віддають тим сполукам, де, принаймні, один із радикалів R^1 , R^2 та R^3 , переважно, принаймні, два із радикалів R^1 , R^2 та R^3 , та більш переважно всі радикали R^1 , R^2 та R^3 мають одне з кращих значень.

Окремий кращий варіант здійснення відноситься до сполук формули Ia та до їх солей, де

A означає радикал A1, як визначено у даному описі, зокрема радикал A1, де R^{41} , R^{51} та R^{61} мають кращі значення, зокрема піразольний радикал формул A1.a-A1.z, наприклад, радикал, вибраний із піразольних радикалів A1.a1-A1.z81;

R^1 означає водень, C_1 - C_4 -алкіл або C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_2 -алкіл, найбільш краще водень, метил або етил;

5 R^2 вибирають із водню, метилу, дифторметилу, трифторметилу, метокси, дифторметокси та трифторметокси; та

R^3 вибирають із водню, метилу, дифторметилу, трифторметилу, метокси, дифторметокси та трифторметокси; та де переважно один або обидва радикали R^2 та R^3 означають водень.

10 Прикладами сполук цього окремого кращого варіанта здійснення є сполуки, що наведені у нижчеподаних таблицях 1-75.

Таблиця 1: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 , R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.a1-A1.a81.

15 Таблиця 2: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає метил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.a1-A1.a81.

Таблиця 3: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає етил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.a1-A1.a81.

20 Таблиця 4: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 , R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.b1-A1.b81.

Таблиця 5: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає метил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.b1-A1.b81.

Таблиця 6: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає етил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.b1-A1.b81.

25 Таблиця 7: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 , R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.c1-A1.c81.

Таблиця 8: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає метил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.c1-A1.c81.

30 Таблиця 9: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає етил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.c1-A1.c81.

Таблиця 10: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 , R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.d1-A1.d81.

Таблиця 11: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає метил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.d1-A1.d81.

35 Таблиця 12: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає етил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.d1-A1.d81.

Таблиця 13: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 , R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.e1-A1.e81.

40 Таблиця 14: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає метил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.e1-A1.e81.

Таблиця 15: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає етил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.e1-A1.e81.

Таблиця 16: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 , R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.f1-A1.f81.

45 Таблиця 17: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає метил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.f1-A1.f81.

Таблиця 18: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає етил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.f1-A1.f81.

50 Таблиця 19: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 , R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.g1-A1.g81.

Таблиця 20: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає метил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.g1-A1.g81.

Таблиця 21: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає етил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.g1-A1.g81.

55 Таблиця 22: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 , R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.h1-A1.h81.

Таблиця 23: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає метил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.h1-A1.h81.

60 Таблиця 24: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає етил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.h1-A1.h81.

Таблиця 55: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 , R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.t1-A1.t81.

Таблиця 56: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає метил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.t1-A1.t81.

5 Таблиця 57: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає етил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.t1-A1.t81.

Таблиця 58: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 , R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.u1-A1.u81.

10 Таблиця 59: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає метил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.u1-A1.u81.

Таблиця 60: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає етил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.u1-A1.u81.

Таблиця 61: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 , R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.v1-A1.v81.

15 Таблиця 62: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає метил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.v1-A1.v81.

Таблиця 63: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає етил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.v1-A1.v81.

20 Таблиця 64: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 , R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.w1-A1.w81.

Таблиця 65: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає метил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.w1-A1.w81.

Таблиця 66: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає етил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.w1-A1.w81.

25 Таблиця 67: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 , R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.x1-A1.x81.

Таблиця 68: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає метил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.x1-A1.x81.

30 Таблиця 69: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає етил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.x1-A1.x81.

Таблиця 70: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 , R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.y1-A1.y81.

Таблиця 71: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає метил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.y1-A1.y81.

35 Таблиця 72: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає етил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.y1-A1.y81.

Таблиця 73: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 , R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.z1-A1.z81.

40 Таблиця 74: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає метил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.z1-A1.z81.

Таблиця 75: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає етил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A1.z1-A1.z81.

45 Інший окремий кращий варіант здійснення відноситься до сполук формули Ia та до їх солей, де

A означає радикал A2, як визначено у даному описі, зокрема радикал A2, де R^{42} , R^{52} та R^{62} мають кращі значення, зокрема піразольний радикал формул A2.aa-A2.do, наприклад, радикал, вибраний із піразольних радикалів від A2.aa1-A2.aa81 до A2.do1-A2.do81;

50 R^1 означає водень, C_1 - C_4 -алкіл або C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_2 -алкіл, найбільш краще водень, метил або етил;

55 R^2 вибирають із водню, метилу, дифторметилу, трифторметилу, метокси, дифторметокси та трифторметокси; та

R^3 вибирають із водню, метилу, дифторметилу, трифторметилу, метокси, дифторметокси та трифторметокси; та де переважно один або обидва радикали R^2 та R^3 означають водень.

Прикладами сполук цього окремого кращого варіанта здійснення є сполуки, що наведені у нижчеподаних таблицях 76-231.

Таблиця 76: Сполуки формули Ia та їх солі, де R¹, R² та R³ означають водень та де А вибирають із радикалів A2.aa1-A2.aa81.

Таблиця 77: Сполуки формули Іа та Іх солі, де R¹ означає метил, R² та R³ означають водень та де А вибирають із радикалів А2.aa1-А2.aa81.

Таблиця 78: Сполуки формули Ia та їх солі, де R¹ означає етил, R² та R³ означають водень та де A вибирають із радикалів A2.aa1-A2.aa81.

10 Таблиця 79: Сполуки формули Іа та їх солі, де R¹, R² та R³ означають водень та де А вибирають із радикалів A2.ab1-A2.ab81.

Таблиця 80: Сполуки формули Ia та їх солі, де R¹ означає метил, R² та R³ означають водень та де A вибирають із радикалів A2.ab1-A2.ab81.

15 Таблиця 81: Сполуки формули Ia та їх солі, де R¹ означає етил, R² та R³ означають водень та де A вибирають із радикалів A2.ab1-A2.ab81.

Таблиця 82: Сполуки формули Ia та їх солі, де R¹, R² та R³ означають водень та де А вибирають із радикалів A2.ac1-A2.ac81.

Таблиця 83: Сполуки формули Іа та їх солі, де R¹ означає метил, R² та R³ означають водень та де А вибирають із радикалів А2.ac1-A2.ac81.

20 Таблиця 84: Сполуки формули Ia та їх солі, де R¹ означає етил, R² та R³ означають водень та де A вибирають із радикалів A2.ac1-A2.ac81.

Таблиця 85: Сполуки формули Ia та їх солі, де R¹, R² та R³ означають водень та де А вибирають із радикалів A2.ad1-A2.ad81.

25 Таблиця 86: Сполуки формули Іа та їх солі, де R¹ означає метил, R² та R³ означають водень та де А вибирають із радикалів A2.ad1-A2.ad81.

Таблиця 87: Сполуки формули Ia та їх солі, де R¹ означає етил, R² та R³ означають водень та де A вибирають із радикалів A2.ad1-A2.ad81.

Таблиця 88: Сполуки формули Ia та їх солі, де R¹, R² та R³ означають водень та де А вибирають із радикалів A2.ae1-A2.ae81.

30 Таблиця 89: Сполуки формули Ia та їх солі, де R¹ означає метил, R² та R³ означають водень та де А вибирають із радикалів A2.ae1-A2.ae81.

Таблиця 90: Сполуки формули Ia та їх солі, де R¹ означає етил, R² та R³ означають водень та де A вибирають із радикалів A2.ae1-A2.ae81.

35 Таблиця 91: Сполуки формули Ia та їх солі, де R¹, R² та R³ означають водень та де A вибирають із радикалів A2.af1-A2.af81.

Таблиця 92: Сполуки формули Ia та їх солі, де R¹ означає метил, R² та R³ означають водень та де A вибирають із радикалів A2.af1-A2.af81.

Таблиця 93: Сполуки формули Ia та їх солі, де R¹ означає етил, R² та R³ означають водень та де A вибирають із радикалів A2.af1-A2.af81.

40 Таблиця 94: Сполуки формули Ia та їх солі, де R¹, R² та R³ означають водень та де A вибирають із радикалів A2.ag1-A2.ag81.

Таблиця 95: Сполуки формули Ia та їх солі, де R¹ означає метил, R² та R³ означають водень та де A вибирають із радикалів A2.ag1-A2.ag81.

Таблиця 96: Сполуки формули Ia та їх солі, де R¹ означає етил, R² та R³ означають водень та де A вибирають із радикалів A2.ah1-A2.ah81.

Таблиця 97: Сполуки формули Ia та їх солі, де R¹, R² та R³ означають водень та де А вибирають із радикалів A2.ai1-A2.ai81.

Таблиця 98: Сполуки формули Ia та їх солі, де R¹ означає метил, R² та R³ означають водень та де А вибирають із радикалів A2.ai1-A2.ai81.

50 Таблиця 99: Сполуки формули Ia та їх солі, де R¹ означає етил, R² та R³ означають водень та де A вибирають із радикалів A2.ai1-A2.ai81.

Таблиця 100: Сполуки формули Ia та їх солі, де R¹, R² та R³ означають водень та де А вибирають із радикалів A2.ak1-A2.ak81.

Таблиця 101: Сполуки формули Ia та їх солі, де R¹ означає метил, R² та R³ означають водень та де A вибирають із радикалів A2.ak1-A2.ak81.

Таблиця 102: Сполуки формули Ia та їх солі, де R¹ означає етил, R² та R³ означають водень та де A вибирають із радикалів A2.ak1-A2.ak81.

Таблиця 103: Сполуки формули Ia та їх солі, де R¹, R² та R³ означають водень та де А вибирають із радикалів A2.al1-A2.al81.

Таблиця 224: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає метил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A2.dm1-A2.dm81.

Таблиця 225: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає етил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A2.dm1-A2.dm81.

5 Таблиця 226: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 , R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A2.dn1-A2.dn81.

Таблиця 227: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає метил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A2.dn1-A2.dn81.

10 Таблиця 228: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає етил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A2.dn1-A2.dn81.

Таблиця 229: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 , R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A2.do1-A2.do81.

Таблиця 230: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає метил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A2.do1-A2.do81.

15 Таблиця 231: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає етил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A2.do1-A2.do81.

Інший окремий кращий варіант здійснення відноситься до сполук формули Ia та до їх солей, де

20 A означає радикал A3, як визначено у даному описі, зокрема радикал A3, де R^{43} , R^{53} та R^{63} мають кращі значення, зокрема піразольний радикал формул A3.aa-A3.do, наприклад, радикал, вибраний із піразольних радикалів від A3.aa1-A3.aa81 до A3.do1-A3.do81;

25 R^1 означає водень, C_1 - C_4 -алкіл або C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_2 -алкіл, найбільш краще водень, метил або етил;

R^2 вибирають із водню, метилу, дифторметилу, трифторметилу, метокси, дифторметокси та трифторметокси; та

30 R^3 вибирають із водню, метилу, дифторметилу, трифторметилу, метокси, дифторметокси та трифторметокси; та де переважно один або обидва радикали R^2 та R^3 означають водень.

Прикладами сполук цього окремого кращого варіанта здійснення є сполуки, що наведені у нижчеподаних таблицях 232-477.

Таблиця 232: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 , R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A3.aa1-A3.aa81.

40 Таблиця 233: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає метил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A3.aa1-A3.aa81.

Таблиця 234: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає етил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A3.aa1-A3.aa81.

Таблиця 235: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 , R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A3.ab1-A3.ab81.

45 Таблиця 236: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає метил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A3.ab1-A3.ab81.

Таблиця 237: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає етил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A3.ab1-A3.ab81.

50 Таблиця 238: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 , R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A3.ac1-A3.ac81.

Таблиця 239: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає метил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A3.ac1-A3.ac81.

Таблиця 240: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає етил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A3.ac1-A3.ac81.

55 Таблиця 241: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 , R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A3.ad1-A3.ad81.

Таблиця 242: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає метил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A3.ad1-A3.ad81.

60 Таблиця 243: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає етил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A3.ad1-A3.ad81.

Таблиця 454: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає етил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A3.ff1-A3.ff81.

Таблиця 455: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 , R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A3.fg1-A3.fg81.

5 Таблиця 456: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає метил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A3.fg1-A3.fg81.

Таблиця 457: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає етил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A3.fg1-A3.fg81.

10 Таблиця 458: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 , R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A3.fh1-A3.fh81.

Таблиця 459: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає метил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A3.fh1-A3.fh81.

Таблиця 460: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає етил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A3.fh1-A3.fh81.

15 Таблиця 461: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 , R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A3.fi1-A3.fi81.

Таблиця 462: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає метил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A3.fi1-A3.fi81.

20 Таблиця 463: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає етил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A3.fi1-A3.fi81.

Таблиця 464: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 , R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A3.fk1-A3.fk81.

Таблиця 465: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає метил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A3.fk1-A3.fk81.

25 Таблиця 466: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає етил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A3.fk1-A3.fk81.

Таблиця 467: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 , R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A3.fl1-A3.fl81.

30 Таблиця 468: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає метил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A3.fl1-A3.fl81.

Таблиця 469: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає етил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A3.fl1-A3.fl81.

Таблиця 470: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 , R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A3.fm1-A3.fm81.

35 Таблиця 471: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає метил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A3.fm1-A3.fm81.

Таблиця 472: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає етил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A3.fm1-A3.fm81.

40 Таблиця 473: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 , R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A3.fn1-A3.fn81.

Таблиця 474: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає метил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A3.fn1-A3.fn81.

Таблиця 475: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає етил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A3.fn1-A3.fn81.

45 Таблиця 476: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 , R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A3.fo1-A3.fo81.

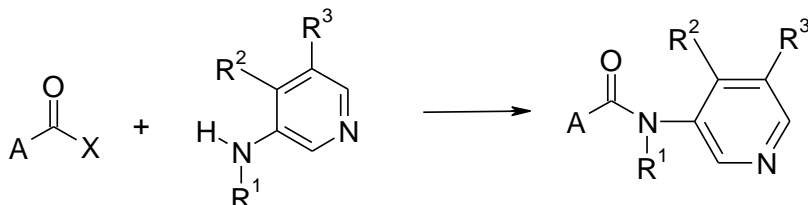
Таблиця 477: Сполуки формули Ia та їх солі, де R^1 означає метил, R^2 та R^3 означають водень та де A вибирають із радикалів A3.fo1-A3.fo81.

50 Сполуки формул I або II можуть бути одержані за допомогою стандартних методів органічної хімії, наприклад, за допомогою методів, описаних далі або в демонстраційних прикладах:

55 Сполуки формули I, де X^1 означає O та X^3 означає неподілену пару, можуть бути одержані, наприклад, відповідно до способів, зображених на схемі 1 шляхом взаємодії активованої похідної піразолкарбонової кислоти II з 3-амінопіридиновою сполукою III (див., наприклад, Houben-Weyl: "Methoden der organ. Chemie" [Методи органічної хімії], Georg-Thieme-Verlag, Stuttgart, New York 1985, т. E5, сс. 941-1045). Активовані похідні піразолкарбонової кислоти II являють собою, наприклад, галогенангідриди, активовані складні ефіри, ангідриди, азиди, наприклад, хлорангідриди, фторангідриди, бромангідриди, пара-нітрофенілові складні ефіри, пентафторфенілові складні ефіри, N-гідроксисукцинімідиди, гідроксибензотриазол-1-ілові складні ефіри. На схемі 1, радикали A, R^1 , R^2 та R^3 мають значення, зазначені вище, й, зокрема,

значення, зазначені як кращі, X означає придатну відхідну групу, таку як галоген, N₃, пара-нітрофенокси або пентафторфенокси і т.д.

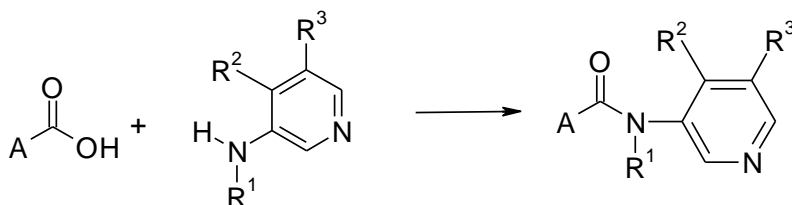
Схема 1:



5 (II) (III) (I): X¹ = O, X³ = неподілена пара

Активні сполуки формули I, де X¹ означає O та X³ означає неподілену пару, також можуть бути одержані, наприклад, шляхом взаємодії піразолкарбонової кислоти IV з 3-амінопіридиною сполукою III за присутності агента сполучення відповідно до схеми 2. На
10 схемі 2, радикали A, R¹, R² та R³ мають значення, зазначені вище, й, зокрема, значення, зазначені як кращі.

Схема 2:



(IV) (III) (I): X¹ = O, X³ = неподілена пара

Придатними агентами сполучення є, наприклад:

- агенти сполучення на основі карбодіїмідів, наприклад, N, N'-дициклогексилкарбодіїмід [J.C. Sheehan, G.P. Hess, J. Am. Chem. Soc. 1955, 77, 1067], N-(3-диметиламінопропіл)-N'-етилкарбодіїмід;

- агенти сполучення, які утворюють змішані ангідриди зі складними ефірами вугільної кислоти, наприклад, 2-етоксі-1-етоксикарбоніл-1,2-дигідрокінолін [B. Belleau, G. Malek, J. Amer. Chem. Soc. 1968, 90, 1651], 2-ізобутилокси-1-ізобутилоксикарбоніл-1,2-дигідрокінолін [Y. Kiso, H. Yajima, J. Chem. Soc., Chem. Commun. 1972, 942];

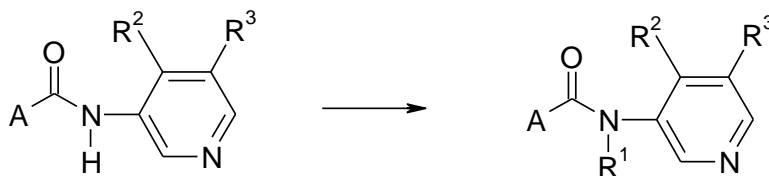
- агенти сполучення на основі фосфонієвих солей, наприклад, гексафторфосфат (бензотриазол-1-ілокси)трис(диметиламіно)фосфонію [B. Castro, J.R. Domoy, G. Evin, C. Selve, Tetrahedron Lett. 1975, 14, 1219], гексафторфосфат (бензотриазол-1-ілокси)трипіролідинофосфонію [J. Coste та ін., Tetrahedron Lett. 1990, 31, 205];

- агенти сполучення на основі уронієвих солей або такі, що мають структуру N-оксиду гуанідинію, наприклад, гексафторфосфат N, N,N',N'-тетраметил-O-(1H-бензотриазол-1-іл)уронію [R. Knorr, A. Trzeciak, W. Bannwarth, D. Gillessen, Tetrahedron Lett. 1989, 30, 1927], тетрафторборат N, N,N',N'-тетраметил-O-(бензотриазол-1-іл)уронію, гексафторфосфат (бензотриазол-1-ілокси)дипіперидинокарбенію [S. Chen, J. Xu, Tetrahedron Lett. 1992, 33, 647];

- агенти сполучення, які утворюють хлорангідриди, наприклад, хлорангідрид біс-(2-осооксазолідиніл)фосфінової кислоти [J. Diago-Mesequer, Synthesis 1980, 547].

Сполуки I, де X¹ означає O, X₃ означає неподілену пару та R¹ є відмінним від водню, також можуть бути одержані за допомогою алкілювання амідів I (у яких R¹ означає водень, та які можуть бути одержані відповідно до схеми 1 або 2) з використанням придатних алкілюючих агентів за присутності основ.

Схема 3:



Піразолкарбонові кислоти IV та їх активовані похідні II, також як і 3-амінопіридинові сполуки III, відомі з рівня техніки або є доступними для придбання, або можуть бути одержані за допомогою способів, відомих з літератури.

Сполуки формули I, де X^1 є відмінним від кисню, можуть бути одержані зі сполуки Ia за допомогою загальноприйнятих методів:

Сполуки формули I, де X^1 означає S, можуть бути одержані, наприклад, шляхом взаємодії сполуки Ia з 2,4-біс(4-метоксифеніл)-1,3,2,4-дитіадифосфетан-2,4-дисульфідом або пентасульфідом фосфору відповідно до методу, описаного у роботі M. Jesberger та ін. в *Synthesis* 2003, 1929.

Сполуки формули I, де X^1 означає NR^{1a} , можуть бути одержані, наприклад, шляхом взаємодії сполуки Ia з 2,4-біс(4-метоксифеніл)-1,3,2,4-дитіадифосфетан-2,4-дисульфідом з одержанням відповідного тіоаміду (сполука I, де X^1 означає S), який потім вводять в реакцію з придатним аміном відповідно до методу, що описаний в роботі V. Glushkov та ін. в *Pharmaceutical Chemistry Journal* 2005, 39(10), 533-536.

Сполуки формули II, де $X^2=SR^{2a}$, можуть бути одержані шляхом алкілування відповідного тіоаміду (сполука I, де X^1 означає S) шляхом взаємодії з алкілувальним агентом відповідно до методу, що описаний в роботі V. Glushkov та ін. в *Pharmaceutical Chemistry Journal* 2005, 39(10), 533-536. Подібним чином можуть бути одержані сполуки I, де X^2 означає OR^{2a} або $NR^{2b}R^{2c}$. Сполуки формули II, де $X^2=SOR^{2a}$ або SO_2R^{2a} , можуть бути одержані шляхом окиснення сполук II за допомогою $X^2=SR^{2a}$.

Сполуки формул I та II, де X^3 означає O, можуть бути одержані шляхом окиснення сполук I, де X^3 означає неподілену пару, відповідно до загальноприйнятих методів одержання N-оксидів піридину, наприклад, за допомогою методу, описаного в роботі C. Botteghi та ін. в *Journal of Organometallic Chemistry* 1989, 370, 17-31.

Як правило, сполуки формул I або II можуть бути одержані за допомогою методів, описаних вище. Якщо індивідуальні сполуки неможливо одержати вищеописаним шляхом, вони можуть бути одержані шляхом дериватизації інших сполук I або II, або шляхом звичайних модифікацій описаних шляхів синтезу. Наприклад, у окремих випадках, визначені сполуки I або II можуть переважно бути одержані з інших сполук I або II за допомогою гідролізу складного ефіру, амідування, утворення складного ефіру, розщеплення складного ефіру, олефінування, відновлення, окиснення, й т.п.

Реакційні суміші обробляють загальноприйнятим способом, наприклад, шляхом змішування з водою, розділення фаз, й, при необхідності, очистки сирих продуктів за допомогою хроматографії, наприклад, на глиноземі або на силікагелі. Деякі з проміжних та кінцевих продуктів можуть бути одержані у вигляді безбарвних або блідо-коричневих в'язких масел, які звільняють або очищають від летких компонентів при зниженому тиску та при помірно підвищеній температурі. Якщо проміжні та кінцеві продукти одержують у вигляді твердих речовин, останні можна очистити за допомогою перекристалізації або розтирання.

Завдяки їх чудовій активності, сполуки загальних формул I або II можуть застосовуватися для боротьби з безхребетними шкідниками.

Відповідно, даний винахід також забезпечує спосіб боротьби з безхребетними шкідниками, який включає обробку шкідників, їх харчових ресурсів, їх місця поширення або їх місця розмноження або культивованої рослини, матеріалу розмноження рослини (такого, як насіння),

грунту, ділянки, матеріалу або навколишнього середовища, у якому шкідники ростуть або можуть рости, або матеріалів, культурних рослин, матеріалів розмноження рослини (таких, як насіння), ґрунтів, поверхонь або просторів, які підлягають захисту від нападу або інвазії шкідниками, пестицидно ефективною кількістю сполуки формул (I) або (II) або її солі або N-оксиду або композицією, як визначено вище.

Переважно, спосіб відповідно до винаходу слугує для захисту матеріалу розмноження рослини (такого, як насіння) та рослини, яка виростає з нього, від нападу або інвазії безхребетними шкідниками, та включає обробку матеріалу розмноження рослини (такого, як насіння) пестицидно ефективною кількістю сполуки формул (I) або (II) або її сільськогосподарсько-прийнятної солі або N-оксиду, як визначено вище, або пестицидно ефективною кількістю сільськогосподарської композиції, як визначено вище та нижче. Спосіб відповідно до винаходу не обмежений захистом "субстрату" (рослини, матеріалів розмноження рослини, ґрунтової маси і т.д.), який обробляють відповідно до винаходу, а також проявляє профілактичну дію, таким чином, наприклад, здійснює відповідний захист рослини, яка виростає з оброблених матеріалів розмноження рослини (таких, як насіння), причому саму цю рослину не обробляють.

В смислі даного винаходу, "безхребетні шкідники" переважно вибирають із членистоногих та нематод, більш переважно з шкідливих комах, павукоподібних та нематод, та ще більш переважно з комах, акарид та нематод.

Винахід далі забезпечує сільськогосподарську композицію для пригнічення таких безхребетних шкідників, яка включає таку кількість, принаймні, однієї сполуки загальних формул I або II або, принаймні, однієї її сільськогосподарсько-прийнятної солі або N-оксиду й, принаймні, одного інертного рідкого і/або твердого агрономічно прийнятного носія, яка має пестицидну дію й, при необхідності, принаймні, одну поверхнево-активну речовину.

Такі композиції можуть включати одну єдину активну сполуку формул I або II або її сіль або N-оксид, або суміш декількох активних сполук I або II або їх солей відповідно до даного винаходу. Композиція відповідно до даного винаходу може включати індивідуальний ізомер або суміші ізомерів, також як і індивідуальний таутомер або суміші таутомерів.

Сполуки формул I або II та пестицидні композиції, які їх містять, є ефективними засобами для боротьби з членистоногими шкідниками та нематодами. Безхребетні шкідники, з якими можна вести боротьбу за допомогою сполук формул I або II, включають, наприклад

комахи з ряду лускокрилих (Lepidoptera), наприклад, *Agrotis ypsilon*, *Agrotis segetum*, *Alabama argillacea*, *Anticarsia gemmatilis*, *Argyresthia conjugella*, *Autographa gamma*, *Bupalus piniarius*, *Cacoecia murinana*, *Capua reticulana*, *Cheimatobia brumata*, *Choristoneura fumiferana*, *Choristoneura occidentalis*, *Cirphis unipuncta*, *Cydia pomonella*, *Dendrolimus pini*, *Diaphania nitidalis*, *Diatraea grandiosella*, *Earias insulana*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Eupoecilia ambiguella*, *Evetria bouliana*, *Feltia subterranea*, *Galleria mellonella*, *Grapholitha funebrana*, *Grapholitha molesta*, *Heliothis armigera*, *Heliothis virescens*, *Heliothis zea*, *Hellula undalis*, *Hibernia defoliaria*, *Hyphantria cunea*, *Hyponomeuta malinellus*, *Keiferia lycopersicella*, *Lambdina fiscellaria*, *Laphygma exigua*, *Leucoptera coffeella*, *Leucoptera scitella*, *Lithocolletis blancardella*, *Lobesia botrana*, *Loxostege sticticalis*, *Lymantria dispar*, *Lymantria monacha*, *Lyonetia clerkella*, *Malacosoma neustria*, *Mamestra brassicae*, *Orgyia pseudotsugata*, *Ostrinia nubilalis*, *Panolis flammea*, *Pectinophora gossypiella*, *Peridroma saucia*, *Phalera bucephala*, *Phthorimaea operculella*, *Phyllocnistis citrella*, *Pieris brassicae*, *Plathypena scabra*, *Plutella xylostella*, *Pseudoplusia includens*, *Rhyacionia frustrana*, *Scrobipalpus absoluta*, *Sitotroga cerealella*, *Sparganothis pilleriana*, *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera littoralis*, *Spodoptera litura*, *Thaumtopoea pityocampa*, *Tortrix viridana*, *Trichoplusia ni* та *Zeiraphera canadensis*;

жуки (Coleoptera), наприклад, *Agrilus sinuatus*, *Agriotes lineatus*, *Agriotes obscurus*, *Amphimallus solstitialis*, *Anisandrus dispar*, *Anthonomus grandis*, *Anthonomus pomorum*, *Atomaria linearis*, *Blastophagus piniperda*, *Blitophaga undata*, *Bruchus rufimanus*, *Bruchus pisorum*, *Bruchus lentis*, *Byctiscus betulae*, *Cassida nebulosa*, *Cero-toma trifurcata*, *Ceuthorrhynchus assimilis*, *Ceuthorrhynchus napi*, *Chaetocnema tibi-alis*, *Conoderus vespertinus*, *Crioceris asparagi*, *Diabrotica longicornis*, *Diabrotica 12 punctata*, *Diabrotica virgifera*, *Epilachna varivestis*, *Epitrix hirtipennis*,

Eutinobothrus brasiliensis, *Hylobius abietis*, *Hypera brunneipennis*, *Hypera postica*, *Ips typographus*, *Lema bilineata*, *Lema melanopus*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Limonius californicus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Melanotus communis*, *Meligethes aeneus*, *Melolontha hip-pocastani*, *Melolontha melolontha*, *Oulema oryzae*, *Ortiorrhynchus sulcatus*, *Otiorrhynchus ovatus*, *Phaedon cochleariae*,
 5 *Phyllotreta chrysocephala*, *Phyllophaga* sp., *Phyl-lopertha horticola*, *Phyllotreta nemorum*, *Phyllotreta striolata*, *Popillia japonica*, *Sitona lineatus* та *Sitophilus granaria*;

двокрилі (Diptera), наприклад, *Aedes aegypti*, *Aedes vexans*, *Anastrepha ludens*, *Anopheles maculipennis*, *Ceratitis capitata*, *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya homi-nivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Contarinia sorghicola*, *Cordylobia anthropophaga*, *Culex pipiens*, *Dacus cucurbitae*, *Dacus oleae*, *Dasineura brassicae*, *Fannia canicularis*, *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hylemyia platura*, *Hypoderma lineata*, *Liriomyza sativae*, *Liriomyza trifolii*, *Lucilia caprina*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*, *Lycoria pectoralis*, *Mayetiola destructor*, *Musca domestica*, *Muscina stabulans*, *Oestrus ovis*, *Oscinella frit*, *Pegomya hyso-cyami*, *Phorbia antiqua*, *Phorbia brassicae*, *Phorbia coarctata*, *Rhagoletis cerasi*, *Rhagoletis pomonella*, *Tabanus bovinus*, *Tipula oleracea* та *Tipula paludosa*;

бахромчастокрилі (Thysanoptera), наприклад, *Dichromothrips corbetti*, *Frankliniella fusca*, *Frankliniella occidentalis*, *Frankliniella tritici*, *Scirtothrips citri*, *Thrips oryzae*, *Thrips palmi* та *Thrips tabaci*;

перетинчастокрилі (Hymenoptera), наприклад, *Athalia rosae*, *Atta cephalotes*, *Atta sexdens*, *Atta texana*, *Hoplocampa minuta*, *Hoplocampa testudinea*, *Monomorium pharaonis*, *Solenopsis geminata* та *Solenopsis invicta*;

напівжорсткокрилі (Heteroptera), наприклад, *Acrosternum hilare*, *Blissus leucopterus*, *Cyrtopeltis notatus*, *Dysdercus cingulatus*, *Dysdercus intermedius*, *Eurygaster integriceps*, *Euschistus impictiventris*, *Leptoglossus phyllopus*, *Lygus lineolaris*, *Lygus pratensis*, *Nezara viridula*, *Piesma quadrata*, *Solubea insularis* та *Thyanta perditor*;

рівнокрилі хоботні (Homoptera), наприклад, *Acyrtosiphon onobrychis*, *Adelges laricis*, *Aphidula nasturtii*, *Aphis fabae*, *Aphis forbesi*, *Aphis pomi*, *Aphis gossypii*, *Aphis grossulariae*, *Aphis schneideri*, *Aphis spiraecola*, *Aphis sambuci*, *Acyrtosiphon pisum*, *Aulacorthum solani*, *Bemisia argentifolii*, *Bemisia tabaci*, *Brachycaudus cardui*, *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycaudus persicae*,
 35 *Brachycaudus prunicola*, *Brevicoryne brassicae*, *Capitophorus horni*, *Cerosipha gossypii*, *Chaetosiphon fragaefolii*, *Cryptomyzus ribis*, *Dreyfusia nordmannianae*, *Dreyfusia piceae*, *Dysaphis radicola*, *Dysaulacorthum pseudosolani*, *Dysaphis plantaginea*, *Dysaphis pyri*, *Empoasca fabae*, *Hyalopterus pruni*, *Hyperomyzus lactucae*, *Macrosiphum avenae*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Macrosiphum rosae*, *Megoura viciae*, *Melanaphis pyraeae*, *Metopolophium dirhodum*, *Myzodes persicae*, *Myzus ascalonicus*, *Myzus cerasi*, *Myzus persicae*, *Myzus varians*, *Nasonovia ribis-nigri*,
 40 *Nilaparvata lugens*, *Pemphigus bursarius*, *Perkinsiella saccharicida*, *Phorodon humuli*, *Psylla mali*, *Psylla piri*, *Rhopalosiphum ascalonicus*, *Rhopalosiphum maidis*, *Rhopalosiphum padi*, *Rhopalosiphum insertum*, *Sappaphis mala*, *Sappaphis mali*, *Schizaphis graminum*, *Schizoneura lanuginosa*, *Sitobion avenae*, *Sogatella furcifera*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Toxoptera aurantiiand*, та *Viteus vitifolii*;

терміти (Isoptera), наприклад, *Calotermes flavicollis*, *Leucotermes flavipes*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes lucifugus* та *Termes natalensis*;

прямокрилі (Orthoptera), наприклад, *Acheta domestica*, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*,
 50 *Forficula auricularia*, *Gryllotalpa gryllotalpa*, *Locusta migratoria*, *Melanoplus bivittatus*, *Melanoplus femurrubrum*, *Melanoplus mexicanus*, *Melanoplus sanguinipes*, *Melanoplus spretus*, *Nomadacris septemfasciata*, *Periplaneta americana*, *Schistocerca americana*, *Schistocerca peregrina*, *Stauronotus maroccanus* та *Tachycines asynamorus*;

арачноідеа, такі як павукоподібні (Acarina), наприклад, родин *Argasidae*, *Ixodidae* та *Sarcoptidae*, такі як *Amblyomma americanum*, *Amblyomma variegatum*, *Argas persicus*, *Boophilus annulatus*, *Boophilus decoloratus*, *Boophilus microplus*, *Dermacentor silvarum*, *Hyalomma truncatum*, *Ixodes ricinus*, *Ixodes rubicundus*, *Ornithodoros moubata*, *Otobius megnini*, *Dermanyssus gallinae*, *Psoroptes ovis*, *Rhipicephalus appendiculatus*, *Rhipicephalus evertsi*, *Sarcoptes scabiei*, та
 60 *Eriophyidae* spp., такі як *Aculus schlechtendali*, *Phyllocoptata oleivora* та *Eriophyes sheldoni*;

Tarsonemidae spp., такі як *Phytonemus pallidus* та *Polyphagotarsonemus latus*; Tenuipalpidae spp., такі як *Brevipalpus phoenicis*; Tetranychidae spp., такі як *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus kanzawai*, *Tetranychus pacificus*, *Tetranychus telarius* та *Tetranychus urticae*, *Panonychus ulmi*, *Panonychus citri*, та *oligonychus pratensis*;

5

блохи, наприклад, *Xenopsylla cheopsis*, *Ceratophyllus* spp.

Композиції та сполуки формул I або II придатні для боротьби з нематодами, головним чином нематодами - паразитами рослин, такими як яванські галові нематоди, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne javanica*, та інші види *Meloidogyne*;

10

гетеродериди, *Globodera rostochiensis* та інші види *Globodera*; *Heterodera avenae*, *Heterodera glycines*, *Heterodera schachtii*, *Heterodera trifolii*, та інші види *Heterodera*; насінні галові нематоди, види *Anguina*; стеблові та листкові нематоди, види *Aphelenchoides*; жалючі нематоди, *Belonolaimus longicaudatus* та інші види *Belonolaimus*; соснові нематоди, *Bursaphelenchus xylophilus* та інші види *Bursaphelenchus*; кільчасті нематоди, види *Criconema*, види *Criconemella*, види *Criconemoides*, види *Mesocriconema*; стовбурні та цибулинні нематоди, *Ditylenchus destructor*, *Ditylenchus dipsaci* та інші види *Ditylenchus*; довгостилетні нематоди, види *Dolichodorus*; спіральні нематоди, *Helicotylenchus multicinctus* та інші види *Helicotylenchus*; оболонкові та оболонкоподібні нематоди, види *Hemicycliophora* та види *Hemicriconemoides*; види *Hirshmanniella*; ланцетоподібні нематоди, види *Hoploaimus*; несправжні яванські галові нематоди, види *Nacobbus*; голчасті нематоди, *Longidorus elongatus* та інші види *Longidorus*; Pin-нематоди, види *Paratylenchus*; нематоди, що ранять, *Pratylenchus neglectus*, *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus curvatus*, *Pratylenchus goodeyi* та інші види *Pratylenchus*; норові нематоди, *Radopholus similis* та інші види *Radopholus*; ниркоподібні нематоди, *Rotylenchus robustus* та інші види *Rotylenchus*; види *Scutellonema*; нематоди, що призводять до тупих кінців коріння, *Trichodorus primitivus* та інші види *Trichodorus*, види *Paratrichodorus*; карликові нематоди, *Tylenchorhynchus claytoni*, *Tylenchorhynchus dubius* та інші види *Tylenchorhynchus*; цитрусові нематоди, види *Tylenchulus*; виноградні нематоди, види *Xiphinema*; та інші види паразитуючих на рослинах нематод.

15

20

25

30

В кращому варіанті здійснення винаходу сполуки формул I або II застосовують для боротьби з комахами або павукоподібними, зокрема комахами рядів *Lepidoptera*, *Coleoptera*, *Thysanoptera* та *Homoptera*, та павукоподібними ряду *Acarina*. Сполуки формул I або II відповідно до даного винаходу, зокрема, є придатними для боротьби з комахами ряду *Thysanoptera* та *Homoptera*.

35

Сполуки формул I або II або пестицидні композиції, які їх включають, можуть застосовуватися для захисту зростаючих рослин та сільськогосподарських культур від нападу або інвазії безхребетними шкідниками, особливо комахами, кліщами або павукоподібними, шляхом введення рослини/культури в контакт з пестицидно ефективною кількістю сполук формул I або II. Термін "сільськогосподарська культура" відноситься й до зростаючих, й до зібраних сільськогосподарських культур.

40

Сполуки формул I або II можуть бути перетворені на звичайні складки, наприклад, розчини, емульсії, суспензії, дусти, порошки, пасти та грануляти. Форма застосування залежить від конкретної галузі передбачуваного застосування; у кожному випадку, повинно бути забезпечено тонке та рівномірне розподілення сполуки відповідно до винаходу.

45

Складки приготують відповідним способом (див., наприклад, для огляду, US 3,060,084, EP-A 707 445 (для рідких концентратів), Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, Dec. 4, 1967, 147-48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4^е вид., McGraw-Hill, New York, 1963, сс. 8-57 та далі, WO 91/13546, US 4,172,714, US 4,144,050, US 3,920,442, US 5,180,587, US 5,232,701, US 5,208,030, GB 2,095,558, US 3,299,566, Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, Hance та ін., Weed Control Handbook, 8^е вид., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989 та Mollet, H., Grubemann, A., Formulation technology, Wiley VCH Verlag GmbH, Weinheim (Німеччина), 2001, 2. D. A. Knowles, Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations, Kluwer Academic Publishers, Dordrecht, 1998 (ISBN 0-7514-0443-8)), наприклад, шляхом розподілення активної сполуки з допоміжними речовинами, придатними для складів агрохімікатів, такими як розчинники і/або носії, при необхідності емульгатори, поверхнево-активні речовини та диспергатори, консерванти, піногасники, присадки, що знижують температуру замерзання, а для складів для обробки насіння, необов'язково також з барвними

50

55

60

речовинами і/або сполучними і/або гелеутворюючими агентами.

Прикладами придатних розчинників є вода, ароматичні розчинники (наприклад, продукти Solvesso, ксилол), парафіни (наприклад, фракції мінерального масла), спирти (наприклад, метанол, бутанол, пентанол, бензиловий спирт), кетони (наприклад, циклогексанон, гама-бутиролактон), піролідони (N-метилпіролідон [НМП], N-октилпіролідон [НОП]), ацетати (глікольдіацетат), гліколі, диметиламіди кислот жирного ряду, жирні кислоти та складні ефіри жирних кислот. В принципі, також можна використовувати суміші розчинників.

Придатними емульгаторами є неіоногенні та аніонні емульгатори (наприклад, поліоксіетиленові ефіри жирних кислот, алкілсульфонати та арилсульфонати).

Прикладами диспергаторів є відпрацьовані лігнінсульфітні луги та метилцелюлоза.

Придатними для використання поверхнево-активними речовинами, є солі лужних, лужноземельних металів та амонієві солі лігносульфоокислоти, нафталінсульфоокислоти, фенолсульфоокислоти, дибутилнафталінсульфоокислоти, алкіларилсульфонати, алкілсульфати, алкілсульфонати, сульфати спиртів жирного ряду, гліколеві ефіри кислот жирного ряду та сульфатованих спиртів жирного ряду, крім того, продукти конденсації сульфонованого нафталіну та похідних нафталіну з формальдегідом, конденсати нафталіну або нафталінсульфонової кислоти з фенолом та формальдегідом, поліоксіетиленоктилфеноловий ефір, етоксилований ізооктилфенол, октилфенол, нонілфенол, алкілфенолполігліколеві ефіри, трибутилфенілполігліколевий ефір, тристеарилфенілполігліколевий ефір, алкіларилполіефірні спирти, конденсати спирту та спирту жирного ряду/етиленоксиду, етоксилована рицинова олія, поліоксіетиленалкілові ефіри, етоксилований поліоксипропілен, поліглікольєфірний ацеталь лаурилового спирту, складні ефіри сорбіту, відпрацьовані лігносульфітні луги та метилцелюлоза.

Речовинами, придатними для одержання підходящих для безпосереднього розбризкування розчинів, емульсій, паст або масляних дисперсій є фракції нафти з середньою – високою точкою кипіння, такі як керосин або дизельне паливо, далі кам'яновугільні масла та масла рослинного або тваринного походження, аліфатичні, циклічні або ароматичні вуглеводні, наприклад толуол, ксилол, парафін, тетрагідронафталін, алкіловані нафталіни або їх похідні, метанол, етанол, пропанол, бутанол, циклогексанол, циклогексанон, ізофорон, сильно полярні розчинники, наприклад, диметилсульфоксид, N-метилпіролідон або вода.

До складу також можуть бути додані присадки, що знижують температуру замерзання, такі як гліцерин, етиленгліколь, пропіленгліколь, та бактеріциди.

Придатними піногасниками є, наприклад, піногасники на основі кремнієорганічних сполук або стеарату магнію.

Придатним консервантом є, наприклад, дихлорфен.

Склади для обробки насіння додатково можуть включати сполучні й, необов'язково, барвні речовини.

Сполучні можуть бути додані для покращення адгезії активних речовин на насінні після обробки. Придатними сполучними є блокспівполімерні ЕО/ПО поверхнево-активні речовини, але також й полівінілспирти, полівінілпіролідони, поліакрилати, поліметакрилати, полібутени, поліізобутилені, полістироли, поліетиленаміни, поліетиленаміди, поліетиленіміни (Lupasol®, Polymín®), поліефіри, поліуретани, полівінілацетат, тилоза та співполімери, похідні з вищевказаних полімерів.

Необов'язково, до складів також можуть бути включені й барвні речовини. Придатними барвними речовинами або барвниками для складів для обробки насіння є Родамін В, С.І. пігмент червоний 112, С.І. сольвент червоний 1, пігмент голубий 15:4, пігмент голубий 15:3, пігмент голубий 15:2, пігмент голубий 15:1, пігмент голубий 80, пігмент жовтий 1, пігмент жовтий 13, пігмент червоний 112, пігмент червоний 48:2, пігмент червоний 48:1, пігмент червоний 57:1, пігмент червоний 53:1, пігмент жовтогарячий 43, пігмент жовтогарячий 34, пігмент жовтогарячий

5, пігмент зелений 36, пігмент зелений 7, пігмент білий 6, пігмент коричневий 25, основний фіолетовий 10, основний фіолетовий 49, кислотний червоний 51, кислотний червоний 52, кислотний червоний 14, кислотний голубий 9, кислотний жовтий 23, основний червоний 10, основний червоний 108.

5

Прикладом гелеутворюючого агента є караген (Satiagel®).

Порошки, препарати для розкидання та дисти можуть бути приготовлені шляхом змішування або спільного розмелювання активних речовин з твердим носієм.

10

Гранулят, наприклад покритий, просочений та гомогенний, може бути одержаний за допомогою сполучення активних сполук з твердими носіями.

15

Прикладами твердих носіїв є мінеральні землі, такі, як силікагель, силікати, тальк, каолін, аттаклей, вапняк, вапно, крейда, болюс, лес, глина, доломіт, діатомова земля, сульфат кальцію, сульфат магнію, оксид магнію, розмелені синтетичні матеріали, добрива, наприклад сульфат амонію, фосфат амонію, нітрат амонію, сечовини, та продукти рослинного походження, такі як мука зернових культур, мука деревної кори, деревна мука та мука горіхової шкарлупи, целюлозні порошки та інші тверді носії.

20

Загалом, склади включають від 0.01 до 95 мас. %, переважно від 0.1 до 90 мас. %, активної(-их) сполуки(сполук). У цьому випадку, активна(-и) сполука(-и) використовуються з чистотою від 90 до 100 мас. %, переважно від 95 до 100 мас. % (відповідно до спектра ЯМР).

25

Для обробки насіння, відповідні склади можна розбавляти в 2-10 раз, одержуючи концентрації в готових до застосування препаратах в діапазоні від 0.01 до 60 мас. % активної сполуки, переважно, від 0.1 до 40 мас. %.

30

Сполуки формул I або II можна застосовувати як такі, у вигляді їх складів, або у формах застосування, що приготуються з них, наприклад, у вигляді підходящих для безпосереднього розбризкування розчинів, порошків, суспензій або дисперсій, емульсій, масляних дисперсій, паст, дустів, матеріалів для розкидання або грануляту шляхом обприскування, дрібнокрапельного обприскування, обпилювання, розкидання або поливу. Форми застосування повністю залежать від галузі передбачуваного застосування; у кожному випадку повинен бути забезпечений максимально тонкий та рівномірний розподіл активної(-их) сполуки(сполук) відповідно до винаходу.

35

Водні форми застосування можуть бути приготовлені з концентратів емульсій, паст або змочуваних порошків (порошків для розпилення, масляних дисперсій) шляхом додавання води. Для одержання емульсій, паст або масляних дисперсій, речовини можна як такі або розчинені у маслі або розчиннику гомогенізувати у воді за допомогою змочувального агента, речовини для підвищення клейкості, диспергатора або емульгатора. Тим не менше, також можливе приготування концентратів, що придатні для розведення водою, які складаються з активної речовини, змочувального агента, речовини для підвищення клейкості, диспергатора або емульгатора й, якщо прийнятно, розчинника або масла.

40

45

Концентрації активної сполуки в готових до застосування препаратах можуть варіюватися в відносно широких діапазонах. Загалом, вони становлять від 0.0001 до 10 мас. %, переважно від 0.01 до 1 мас. %.

50

Активну(-и) сполуку(-и) з успіхом також можна використовувати в ультрамалооб'ємному способі (ULV), що дозволяє застосування складів, які включають більш ніж 95 мас. % активної сполуки або активної сполуки без добавок.

55

Далі наведені приклади складів:

1. Продукти для розведення водою, призначені для позакореневого внесення. Такі продукти, призначені для обробки насіння, можуть наноситися на останнє в розведеному або нерозведеному вигляді.

60

А) Розчинні у воді концентрати (SL, LS)

10 мас. частин активної(-их) сполуки(сполук) розчиняють в 90 мас. частинах води або водорозчинного розчинника. Як альтернатива, додають змочувальні агенти або інші допоміжні речовини. При розведенні водою активна(-і) сполука(-и) розчиняється(-ються), за допомогою чого одержують склад, який містить 10 % (мас./мас.) активної(-их) сполуки(сполук).

Б) Здатні до диспергування концентрати (DC)

10 20 мас. частин активної(-их) сполуки(сполук) розчиняють в 70 мас. частинах циклогексанону з додаванням 10 мас. частин диспергатора, наприклад, полівінілпіролідону. Розведення водою дає дисперсію, за допомогою чого одержують склад, який містить 20 % (мас./мас.) активної(-их) сполуки(сполук).

15 В) Здатні до емульгування концентрати (EC)

20 15 мас. частин активної(-их) сполуки(сполук) розчиняють в 7 мас. частинах ксилолу з додаванням додецилбензолсульфонату кальцію та етоксилату рицинової олії (у кожному випадку до 5 мас. % концентрації). Розведення водою дає емульсію, за допомогою чого одержують склад, який містить 15 % (мас./мас.) активної(-их) сполуки(сполук).

Г) Емульсії (EW, EO, ES)

25 25 мас. частин активної(-их) сполуки(сполук) розчиняють в 35 мас. частинах ксилолу з додаванням додецилбензолсульфонату кальцію та етоксилату рицинової олії (у кожному випадку до 5 мас. % концентрації). Цю суміш вводять в 30 мас. частин води за допомогою емульгувального пристрою (наприклад, Ultraturrax), та доводять до гомогенної емульсії. Розведення водою дає емульсію, за допомогою чого одержують склад, який містить 25 % (мас./мас.) активної(-их) сполуки(сполук).

Д) Суспензії (SC, OD, FS)

35 20 мас. частин активної(-их) сполуки(сполук) подрібнюють з додаванням 10 мас. частин диспергаторів, змочувальних агентів та 70 мас. частин води або органічного розчинника в кульовому млині з мішалкою з одержанням тонкої суспензії активної(-их) сполуки(сполук). Розведення водою дає стабільну суспензію активної(-их) сполуки(сполук), за допомогою чого одержують склад, який містить 20 % (мас./мас.) активної(-их) сполуки(сполук).

Е) Здатний до диспергування у воді гранулят та розчинний у воді гранулят (WG, SG)

40 50 мас. частин активної(-их) сполуки(сполук) тонко подрібнюють з додаванням 50 мас. частин диспергаторів та змочувальних агентів, та за допомогою технічних пристроїв (наприклад, екструзійного пристрою, розпилювальної башти, псевдозрідженого шару) одержують здатний до диспергування у воді або розчинний у воді гранулят. Розведення водою дає стабільну дисперсію або розчин активної(-их) сполуки(сполук), за допомогою чого одержують склад, який містить 50 % (мас./мас.) активної(-их) сполуки(сполук).

Є) Здатні до диспергування у воді порошки та розчинні у воді порошки (WP, SP, SS, WS)

50 75 мас. частин активної(-их) сполуки(сполук) перемелюють в роторно-статорному млині з додаванням 25 мас. частин диспергаторів, змочувальних агентів та силікагелю. Розведення водою дає стабільну дисперсію або розчин активної(-их) сполуки(сполук), за допомогою чого одержують склад, який містить 75 % (мас./мас.) активної(-их) сполуки(сполук).

55 Ж) Гелеподібні склади (GF)

60 20 мас. частин активної(-их) сполуки(сполук) подрібнюють з додаванням 10 мас. частин диспергаторів, 1 мас. частинки гелеутворюючих змочувальних агентів та 70 мас. частин води або органічного розчинника в кульовому млині з мішалкою з одержанням тонкої суспензії активної(-их) сполуки(сполук). Розведення водою дає стабільну суспензію активної(-их)

сполуки(сполук), за допомогою чого одержують склад, який містить 20 % (мас./мас.) активної(-их) сполуки(сполук).

2. Продукти для застосування в нерозбавленому вигляді, призначені для позакореневого внесення. Такі продукти, призначені для обробки насіння, можуть наноситися на останні в розведеному або нерозведеному вигляді.

3) Порошки для розпилення (DP, DS)

5 мас. частин активної(-их) сполуки(сполук) тонко подрібнюють та ретельно перемішують з 95 мас. частинами тонкоподрібненого каоліну. Це дає продукт для розпилення, що має вміст активної(-их) сполуки(сполук) 5 % (мас./мас.).

И) Гранулят (GR, FG, GG, MG)

0.5 мас. частин активної(-их) сполуки(сполук) тонко подрібнюють та зв'язують з 95.5 мас. частинами носіїв, за допомогою чого одержують склад, який містить 0.5 % (мас./мас.) активної(-их) сполуки(сполук). Звичайними методами, застосовуваними при цьому, є екструзія, розпилювальне сушіння або обробка в псевдозрідженому шарі. Це дає гранулят для застосування в нерозбавленому вигляді для позакореневого внесення.

I) ULV розчини (UL)

10 мас. частин активної(-их) сполуки(сполук) розчиняють в 90 мас. частинах органічного розчинника, наприклад, ксилолу. Це дає продукт, що має вміст активної(-их) сполуки(сполук) 10 % (мас./мас.), який застосовують в нерозведеному вигляді для позакореневого внесення.

Сполуки формул I або II також придатні для обробки матеріалів розмноження рослини (таких, як насіння). Звичайні склади для обробки насіння включають, наприклад, текучі концентрати FS, розчини LS, порошки для сухої обробки DS, здатні до диспергування у воді порошки для обробки рідиною WS, розчинні у воді порошки SS та емульсії ES та EC, та гелеподібні склади. Ці склади можна наносити на насіння в розведеному або нерозведеному вигляді. Обробку насіння ведуть перед посівом, або безпосередньо насіння, або після попереднього пророщення пізніше.

В кращому варіанті для обробки насіння застосовують FS-склад. Звичайно FS-склад може включати 1-800 г/л активного інгредієнта, 1-200 г/л поверхнево-активної речовини, 0-200 г/л присадки, що знижує температуру замерзання, 0-400 г/л сполучного, 0-200 г/л пігменту та до 1 літра розчинника, переважно, води.

Інші кращі FS склади сполук формул I або II для обробки насіння включають від 0.5 до 80 мас. % активного інгредієнта, від 0,05 до 5 мас. % змочувального агента, від 0.5 до 15 мас. % диспергатора, від 0,1 до 5 мас. % загусника, від 5 до 20 мас. % присадки, що знижує температуру замерзання, від 0,1 до 2 мас. % піногасника, від 1 до 20 мас. % пігменту і/або барвника, від 0 до 15 мас. % клейкої/покращуючої зчеплення речовини, від 0 до 75 мас. % наповнювача/основи, та від 0,01 до 1 мас. % консерванту.

Різні типи масел, змочувальних агентів, ад'ювантів, гербіцидів, фунгіцидів, інших пестицидів, або бактерицидів можуть бути додані до активних інгредієнтів, при необхідності, тільки безпосередньо перед застосуванням (бакова суміш). Ці агенти звичайно змішують з агентами відповідно до винаходу в масовому співвідношенні від 1:10 до 10:1.

Сполуки формул I або II є ефективними й за допомогою контакту (через ґрунт, скло, стіни, надліжкові сітки, килими, частинки рослин або тварин), й за допомогою проковтування (принада, або частинки рослин).

Для застосування щодо мурах, термітів, ос, мух, москітів, цвіркунів або тарганів, сполуки формул I або II переважно застосовують у вигляді композиції, яка містить принаду.

Принада може бути рідким, твердим або напівтвердим складом (як, наприклад, гель). Тверді принади можуть бути приготовлені різних видів та форм, придатних для відповідного застосування, наприклад у вигляді грануляту, кубиків, паличок, дисків. Рідкими принадами можна заповнити різні пристрої, забезпечуючи належне застосування, наприклад, відкриті

5 емності, обприскувачі, джерела-розпилювачі або джерела-випарники. Гелі можуть бути водними або масляними та можуть бути приготовлені з необхідною липкістю, вмістом води або характеристиками старіння.

Принада, застосовувана в композиції, являє собою продукт, достатньо ефективний для спонукання комах, таких, як мурахи, терміти, оси, мухи, москїти, цвїркуни і т.д. або таргани, до його поїдання. Атрактивністю можна управляти за допомогою застосування стимуляторів харчування або статевих феромонів. Харчові стимулятори вибирають, без обмеженням перерахованим, наприклад з тваринних і/або рослинних білків (м'ясне-, рибне- або кров'яне борошно, частинки комах, яєчний жовток), з жирів та масел (олій) тваринного і/або рослинного

15 походження, або моно-, оліго- або поліорганосахаридів, зокрема, з сахарози, лактози, фруктози, декстрози, глюкози, крохмалю, пектину, а також з м'яса або меду. Свіжі або гниючі частинки плодів, сільськогосподарських культур, рослин, тварин, комах, або особливі їх частинки також слугують стимуляторами харчування. Статеві феромони, як відомо, найбільш специфічні щодо комах. Специфічні феромони описані в літературі та відомі спеціалісту в даній галузі техніки.

Склади сполук формул I або II у вигляді аерозолів (наприклад, в аерозольних балончиках), масляних препаратів для розбризкування або препаратів для розбризкування за допомогою помпи надзвичайно придатні для непрофесійного користувача для боротьби зі шкідниками, такими, як мухи, блохи, кліщі, москїти або таргани. Аерозольні засоби переважно включають активну сполуку, розчинники, такі, як нижчі спирти (наприклад, метанол, етанол, пропанол, бутанол), кетони (наприклад, ацетон, метилетилкетон), парафінові вуглеводні (наприклад, гас), що мають інтервал кипіння приблизно від 50 до 250 °C, диметилформамід, N-метилпіролідон, диметилсульфоксид, ароматичні вуглеводні, такі, як толуол, ксилол, вода, крім того, допоміжні речовини, такі, як емульгатори, такі, як моноолеат сорбіту, олеїлетоксилат, що містить 3-7 моль етиленоксиду, етоксилат жирного спирту, парфумерні олії, такі, як ефірні олії, ефіри середніх жирних кислот та нижчих спиртів, ароматичні карбонільні сполуки, при необхідності стабілізатори, такі, як бензоат натрію, амфотерні поверхнево-активні речовини, нижчі епоксиди, триетилортоформат й, при необхідності, пропеленти, такі, як пропан, бутан, азот, стиснуте повітря, диметилловий ефір, вуглекислий газ, оксид азоту, або суміші цих газів.

Масляніклади для розбризкування відрізняються від аерозольних засобів тим, що в них не використовуються пропеленти.

Сполуки формул I або II та їх відповідні композиції також можуть застосовуватися в москїтних та окурювальних спіральках, димових шашках, випарних пластинах або тривало діючих випарниках та також в антимольних папірцях, антимольних подушечках або інших, незалежних від нагрівання випарних системах.

Методи боротьби з інфекційними захворюваннями, що передаються комахами (наприклад, малярією, пропасницею денге та жовтою пропасницею, філяріатозом лімфовузлів та лейшманіозом) за допомогою сполук формул I або II, а також їх відповідних композицій, включають обробку поверхні бараків та домів, обробку розбризкуванням та просочуванням фіранок, палаток, предметів обмундирування, надліжкових сіток, пасток для мух це-це й т.п. Інсектицидні композиції для обробки ниток, тканин, трикотажних виробів, нетканих матеріалів, сітчастих матеріалів або фольги та брезентів переважно включають суміш, що містить інсектицид, необов'язково репелент й, принаймні, одну сполучну речовину. Придатними репелентами, наприклад, є N,N-діетил-м-толуамід (ДЕТА), N,N-діетилфенілацетамід (ДЕФА), 1-(3-циклогексан-1-іл-карбоніл)-2-метилпіперин, лактон (2-гідроксиметилциклогексил)оцтової кислоти, 2-етил-1,3-гександіол, індалон, метилнеодеканамід (МНДА), не використовуваний для боротьби з комахами піретроїд, такий, як {(+/-)-3-аліл-2-метил-4-оксоциклопент-2-(+)-еніл-(+)-транс-хризантемат (есбіотрин)}, а також репелент, що є похідною від такого або ідентичним такому з екстрактів рослин, такий як лимонен, еugenol, (+)-еукамалол (1), (-)-1-eni-eукамалол, або не перероблені екстракти з рослин, таких, як *Eucalyptus maculata*, *Vitex rotundifolia*, *Symborogan martinii*, *Symborogan citratus* (сорго лимонне), *Symborogan nardus* (цитронела).

60 Придатні сполучні речовини вибирають, наприклад, з полімерів та співполімерів вінілових

ефірів аліфатичних кислот (таких, як вінілацетат та вінілверсатат), акрилових та метакрилових ефірів спиртів, таких, як бутилакрилат, 2-етилгексилакрилат та метилакрилат, моно- та ді-етиленових ненасичених вуглеводнів, таких, як стирол, та аліфатичних дієнів, таких, як бутадієн.

5

Просочення фіранок та надліжкових сіток звичайно виконують зануренням текстильного матеріалу в емульсії або дисперсії активних сполук формул I та II або оббризкуванням ними сіток.

10

Способи, які можна використовувати для обробки насіння, в принципі, являють собою всі придатні методи обробки насіння й, особливо, методи протруєння насіння, відомі в рівні техніки, такі, як покриття насіння (наприклад, дражування насіння), опудрювання насіння та просочування насіння (наприклад, вимочування насіння). Тут, "обробка насіння" відноситься до всіх методів, які вводять насіння та сполуки формул I або II в контакт одне з одним, а "протруєння насіння" - до методів обробки насіння, які забезпечують насіння певною кількістю сполук формул I або II, тобто які приводять до насінням, що включає сполуку формул I або II. В принципі, насіння можна піддавати обробці в будь-який час від збирання урожаю насіння до посіву насіння. Насіння можна обробляти безпосередньо перед висадкою або під час висадки насіння, наприклад, з використанням методу, що включає застосування "баку сіялки". Тим не менше, обробку також можна проводити за декілька тижнів або місяців, наприклад, аж до 12 місяців, до висадки насіння, наприклад, шляхом протруєння насіння, що не приводить до істотного зниження ефективності.

15

20

25

Доцільно, обробку застосовують до невисіяного насіння. Використовуваний тут термін "невисіяне насіння" означає насіння, у будь-якому періоді від його збирання до посіву в ґрунт з метою пророщування та вирощування рослини.

30

Зокрема, притримуються методу обробки, при якому насіння змішують в придатному пристрої, наприклад, змішувальному пристрої для твердих або твердих/рідких компонентів суміші, з необхідною кількістю складів для обробки насіння, або як таких, або після попереднього розведення водою, до тих пір, поки композиція не буде однорідно розподілена на насінні. При необхідності, після цього йде стадія сушіння.

35

Сполуки формул I або II або їх енантіомери або ветеринарно-прийнятні солі є, зокрема, також придатними для застосування для пригнічення паразитів усередині та на тваринах.

40

Внаслідок цього, додатковий об'єкт даного винаходу полягає в забезпеченні нових способів боротьби з паразитами усередині та на тваринах. Другий об'єкт винаходу полягає в забезпеченні безпечних пестицидів для тварин. Другий об'єкт винаходу полягає далі в забезпеченні пестицидів для тварин, які можуть застосовуватися в більш низьких дозах, ніж існуючі пестициди. Й другий об'єкт винаходу полягає в забезпеченні пестицидів для тварин, які забезпечують тривалу залишкову боротьбу з паразитами.

45

Винахід також відноситься до композицій, що включають паразитоцидно ефективну кількість сполук формул I або II або їх енантіомерів або ветеринарно-прийнятних солей, та прийнятний носій, для пригнічення паразитів усередині та на тваринах.

50

Даний винахід також забезпечує спосіб лікування, боротьби, запобігання та захисту тварин від інвазії та інфікування паразитами, який включає пероральне, місцеве або парентеральне введення або нанесення на тварину(тварин) паразитоцидно ефективної кількості сполук формул I або II або їх енантіомерів або ветеринарно-прийнятних солей або композицій, що включають їх.

55

Винахід також забезпечує спосіб одержання композицій для лікування, боротьби, запобігання або захисту тварин від інвазії або інфікування паразитами, яка включає паразитоцидно ефективну кількість сполук формул I або II або їх енантіомерів або ветеринарно-прийнятних солей або композицій, що включають їх.

60

Активність сполук щодо сільськогосподарських шкідників не свідчить про їх придатність для боротьби з ендо- та ектопаразитами усередині та на тваринах, що вимагає, наприклад, низьких,

таких що не викликає блювоту доз у випадку перорального застосування, метаболічної сумісності з твариною, низької токсичності та можливості безпечного поводження.

5 Несподівано виявлено, що сполуки формул I або II є придатними для пригнічення з ендо- та ектопаразитами усередині та на тваринах.

10 Сполуки формул I або II або їх енантіомери або ветеринарно прийнятні солі, та композиції, що їх містять, переважно застосовуються для боротьби та запобігання інвазії та інфікування тварин, включаючи теплокровних тварин (у тому числі людину) та рибу. Вони, наприклад, придатні для боротьби та запобігання зараження та інфікування ссавців, таких як велика рогата худоба, вівці, поросята, верблюди, олені, коні, свині, домашні птахи, кролики, кози, собаки та кішки, азіатські буйволи, осли, лані та північні олені, а також хутрових звірів, таких як норка, шиншили та єноти, птахів, таких як кури, гуси, індички та качки, та риби, такої як риба, яка живе у прісній та морській воді, наприклад, форель, короп та вугор.

15 Сполуки формул I або II або їх енантіомери і/або ветеринарно прийнятні солі, та композиції, що їх містять, переважно застосовуються для боротьби та запобігання інвазії та інфікування домашніх тварин, таких як собаки або кішки.

20 Інвазія теплокровних тварин та риби включає, але не обмежується перерахованим, зараження такими шкідниками, як воші, пухоїди, кліщі, носова личинка овода, кровососки, муха, що жалить, кімнатна муха, мухи, личинки мух, які викликають ентомоз, кліщі-тромбікуліди, комарі, москити та блохи.

25 Сполуки формул I або II або їх енантіомери і/або ветеринарно прийнятні солі, та композиції, що їх містять, придатні для системної і/або несистемної боротьби з екто- і/або ендопаразитами. Вони активні на всіх або деяких стадіях розвитку.

30 Сполуки формул I або II особливо придатні для пригнічення ектопаразитів.

Сполуки формул I або II особливо придатні для пригнічення ектопаразитів з наступних рядів та видів, відповідно:

35 блохи (Siphonaptera), наприклад *Ctenocephalides felis*, *Ctenocephalides canis*, *Xenopsylla cheopis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, та *Nosopsyllus fasciatus*,

таргани (Blattaria-Blattodea), наприклад *Blattella germanica*, *Blattella asahinae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta japonica*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliggi-nosa*, *Periplaneta australasiae*, та *Blatta orientalis*,

40 мухи, москити (Diptera), наприклад *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes vexans*, *Anastrepha ludens*, *Anopheles maculipennis*, *Anopheles crucians*, *Anopheles albimanus*, *Anopheles gambiae*, *Anopheles freeborni*, *Anopheles leucosphyrus*, *Anopheles minimus*, *Anopheles quadrimaculatus*, *Calliphora vicina*, *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Chrysops discalis*, *Chrysops silacea*, *Chrysops atlanticus*, *Cochliomyia hominivorax*, *Cordylobia anthropophaga*, *Culicoides furens*, *Culex pipiens*, *Culex nigripalpus*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex tarsalis*, *Culiseta inornata*, *Culiseta melanura*, *Dermatobia hominis*, *Fannia canicularis*, *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Glossina palpalis*, *Glossina fuscipes*, *Glossina tachinoides*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hippelates* spp., *Hypoderma lineata*, *Leptoconops torrens*, *Lucilia caprina*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*, *Lycoria pectoralis*, *Mansonia* spp., *Musca domestica*, *Muscina stabulans*, *Oestrus ovis*, *Phlebotomus argentipes*, *Psorophora columbiae*, *Psorophora discolor*, *Prosimulium mixtum*, *Sarcophaga haemorrhoidalis*, *Sarcophaga* sp., *Simulium vittatum*, *Stomoxys calcitrans*, *Tabanus bovinus*, *Tabanus atratus*, *Tabanus lineola*, та *Tabanus similis*,

55 воші (Phthiraptera), наприклад *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Phthirus pubis*, *Haematopinus eurysternus*, *Haematopinus suis*, *Linognathus vituli*, *Bovicola bovis*, *Menopon gallinae*, *Menacanthus stramineus* та *Solenopotes capillatus*.

60 іксодові кліщі та паразитичні кліщі (Parasitiformes): іксодові кліщі (Ixodida), наприклад *Ixodes scapularis*, *Ixodes holocyclus*, *Ixodes pacificus*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Dermacentor andersoni*,

Dermacentor variabilis, *Amblyomma americanum*, *Amblyomma maculatum*, *Ornithodoros hermsi*, *Ornithodoros turicata* та паразитичні кліщі (*Mesostigmata*), наприклад *Ornithonyssus bacoti* та *Dermanyssus gallinae*,

5 *actiniedida* (*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., та *Laminosioptes* spp,

10 клопи (*Heteropterida*): *Cimex lectularius*, *Cimex hemipterus*, *Reduvius senilis*, *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus* spp. та *Arilus critatus*,

15 *Anoplurida*, наприклад *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phthirus* spp., та *Solenopotes* spp,

Mallophagida (підряд *Armblycerina* та *Ischnocerina*), наприклад *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Trichodectes* spp., та *Felicola* spp,

20 Круглі гельмінти:

Дротяники та трихінозис (*Trichosyringida*), наприклад *Trichinellidae* (*Trichinella* spp.), (*Trichuridae*) *Trichuris* spp., *Capillaria* spp,

25 *Rhabditida*, наприклад *Rhabditis* spp, *Strongyloides* spp., *Helicephalobus* spp,

Strongylida, наприклад *Strongylus* spp., *Ancylostoma* spp., *Necator americanus*, *Bunostomum* spp. (анкілостома), *Trichostrongylus* spp., *Haemonchus contortus*., *Ostertagia* spp., *Cooperia* spp., *Nematodirus* spp., *Dictyocaulus* spp., *Cyathostoma* spp., *Oesophagostomum* spp., *Stephanurus* spp., *Ollulanus* spp., *Chabertia* spp., *Stephanurus dentatus*, *Syngamus trachea*, *Ancylostoma* spp., *Uncinaria* spp., *Globocephalus* spp., *Necator* spp., *Metastrongylus* spp., *Muellerius capillaris*, *Protostrongylus* spp., *Angiostrongylus* spp., *Parelaphostrongylus* spp. *Aleurostrongylus abstrusus*, та *Dioctophyma renale*,

35 Аскариди (*Ascaridida*), наприклад *Ascaris lumbricoides*, *Ascaris suum*, *Ascaridia galli*, *Parascaris equorum*, *Enterobius vermicularis* (гостриця), *Toxocara canis*, *Toxascaris leonine*, *Skrjabinema* spp., та *Oxyuris equi*,

40 *Camallanida*, наприклад *Dracunculus medinensis* (ришта)

Spirurida, наприклад *Thelazia* spp. *Wuchereria* spp., *Brugia* spp., *Onchocerca* spp., *Dirofilaria* spp., *Dipetalonema* spp., *Setaria* spp., *Elaeophora* spp., *Spirocerca lupi*, та *Habronema* spp.,

45 Колючоголовчасті хробаки (*Acanthocephala*), наприклад *Acanthocephalus* spp., *Macracanthorhynchus hirudinaceus* та *Oncicola* spp,

Справжні планарії (*Plathelminthes*):

50 Трематоди (*Trematoda*), наприклад *Faciola* spp., *Fascioloides magna*, *Paragonimus* spp., *Dicrocoelium* spp., *Fasciolopsis buski*, *Clonorchis sinensis*, *Schistosoma* spp., *Trichobilharzia* spp., *Alaria alata*, *Paragonimus* spp., та *Nanocyetes* spp,

55 *Cercaromorphs*, зокрема цестода (стрічковий хробак), наприклад *Diphyllbothrium* spp., *Tenia* spp., *Echinococcus* spp., *Dipylidium caninum*, *Multiceps* spp., *Hymenolepis* spp., *Mesocestoides* spp., *Vampirolepis* spp., *Moniezia* spp., *Anoplocephala* spp., *Sirometra* spp., *Anoplocephala* spp., та *Hymenolepis* spp.

60 Сполуки формул I або II та композиції, що їх містять, зокрема придатні для боротьби з шкідниками з рядів *Diptera*, *Siphonaptera* та *Ixodida*.

Крім того, застосування сполук формул I або II та композицій, що їх містять, для пригнічення москитів є особливо кращим.

5 Застосування сполук формул I або II та композицій, що їх містять, для пригнічення мух є подальшим кращим варіантом здійснення даного винаходу.

Крім того, застосування сполук формул I або II та композицій, що їх містять, для пригнічення бліх є особливо кращим.

10 Застосування сполук формул I або II та композицій, що їх містять, для пригнічення іксодових кліщів є подальшим кращим варіантом даного винаходу.

15 Сполуки формул I або II також надзвичайно придатні для пригнічення ендопаразитів (круглі гельмінти, колючоголовчасті хробаки та справжні планарії).

Нанесення може бути здійснено як з профілактичною, так й з терапевтичною ціллю.

20 Введення активних сполук здійснюють безпосередньо або у вигляді придатних препаратів, перорально, місцево/дермально або парентерально.

Для перорального введення теплокровним тваринам, сполуки формул I або II можна вводити до складів, наприклад, до корму для тварин, добавок до корму для тварин, концентратів кормів для тварин, пігулок, розчинів, паст, суспензій, мікстур, гелів, таблеток, шариків та капсул. До того ж, сполуки формул I або II можна вводити тваринам з питною водою. 25 Для перорального введення, лікарську форму вибирають, з метою забезпечити введення тварині від 0.01 мг/кг до 100 мг/кг маси тіла тварини сполук формул I або II на день, переважно від 0.5 мг/кг до 100 мг/кг маси тіла тварини на день.

30 Альтернативно, сполуки формул I або II можуть вводитися тваринам парентерально, наприклад, інтравенно, внутрішньом'язово, внутрішньовенно або підшкірно. Для підшкірної ін'єкції сполуки формул I або II можуть бути дисперговані або розчинені в фізіологічно прийнятному носії. Альтернативно, сполуки формул I або II можуть бути введені в імплантат для підшкірного введення. До того ж можливе трансдермальне введення тваринам сполук формул I або II. У випадку парентерального введення, лікарську форму вибирають, враховуючі 35 необхідність введення тваринам сполук формул I або II у дозі від 0.01 мг/кг до 100 мг/кг маси тіла тварини на день.

40 Сполуки формул I або II можуть також наноситися тваринам місцево у формі розчинів для занурення, дустів, порошоків, нашийників, медальйонів, спреїв, шампунів, засобів spot-on та pour-on та у вигляді мазей або емульсій масло-у-воді або вода-у-маслі. Призначені для місцевого застосування рідини для занурення та спреї звичайно містять от 0.5 до 5,000 млн.ч., та переважно від 1 до 3,000 млн.ч. сполук формул I або II. До того ж, сполуки формул I або II можуть міститися в вушних бирках для тварин, зокрема чотириногих, таких як велика рогата худоба та вівці.

45 Придатними препаратами є:

50 Розчини, такі як розчини для перорального введення, концентрати для перорального введення після розведення, розчини для нанесення на шкіру або в порожнини тіла, склади для поливу, гелі;

Емульсії та суспензії для перорального або дермального введення; напівтверді препарати;

55 Склади, в яких активна сполука вводиться в мазеву основу або в емульсійну основу типа масло-у-воді або вода-у-маслі;

60 Тверді препарати, такі як порошки, премікси або концентрати, грануляти, пелети, таблетки, шарики, капсули; аерозолі та засоби для інгаляції та профільовані вироби, які містять активну сполуку.

Композиції, придатні для ін'єкції приготують шляхом розчинення активного інгредієнта в придатному розчиннику й, необов'язково, додавання додаткових інгредієнтів, таких як кислоти, основи, буферні солі, консерванти та солюбілізатори. Розчини фільтрують та стерилізують.

5 Придатними розчинниками є фізіологічно прийнятні розчинники, такі як вода, спирти, такі як етанол, бутанол, бензиловий спирт, гліцерин, пропіленгліколь, поліетиленгліколь, N-метилпіролідон, 2-піролідон та їх суміші.

10 Активні сполуки можна необов'язково розчиняти в фізіологічно прийнятних рослинних або синтетичних маслах, які є придатними для ін'єкцій.

15 Придатними солюбілізаторами є розчинники, які сприяють розчиненню активної сполуки в основному розчиннику або запобігають її випаданню в осад. Прикладами є полівінілпіролідон, полівініловий спирт, поліоксіетилована рицинова олія та поліетоксирований ефір сорбіту.

Придатними консервантами є бензиловий спирт, трихлорбутанол, ефіри п-гідроксибензойної кислоти та н-бутанол.

20 Пероральні розчини вводяться безпосередньо. Концентрати вводяться перорально після попереднього розведення до цільової концентрації. Пероральні розчини та концентрати приготують відповідно до рівня техніки та як описано вище у випадку розчинів для ін'єкцій, стерильні методики не потрібні.

25 Розчини для нанесення на шкіру являють собою препарати для краплювання на, розповсюдження на, втирання в, розбризкування або розпилення на шкіру.

Розчини для застосування на шкіру приготують відповідно до рівня техніки та як описано вище у випадку розчинів для ін'єкцій, стерильні методи не потрібні.

30 Крім того, придатними розчинниками є поліпропіленгліколь, фенілетанол, феноксіетанол, складні ефіри, такі як етил- або бутилацетат, бензилбензоат, ефіри, такі як алкілові ефіри алкіленгліколю, наприклад монометилловий ефір дипропіленгліколю, кетони, такі як ацетон, метилетилкетон, ароматичні вуглеводні, природні та синтетичні масла, диметилформамід, диметилацетамід, моноетилловий ефір діетиленгліколю (transcutol), ізопропіліденгліцерин (solketal), пропіленкарбонат та їх суміші.

40 Під час приготування може бути корисним додавання загусників. Придатними загусниками є неорганічні загусники, такі як бентоніти, колоїдна кремнієва кислота, моностеарат алюмінію, органічні загусники, такі як похідні целюлози, полівінілові спирти та їх співполімери, акрилати та метакрилати.

45 Гелі наносяться або розповсюджуються на шкіру або вводяться в порожнини тіла. Гелі приготують шляхом обробки розчинів, приготовлених як описано у випадку розчинів для ін'єкцій, достатньою кількістю загусників, причому прозорий матеріал має в результаті мазеподібну консистенцію. Використовуваними загусниками є загусники, наведені вище.

Препарати pour-on розливають або розпилюють на обмежені ділянки шкіри, активна сполука проникає через шкіру та діє системно.

50 Препарати pour-on приготують шляхом розчинення, суспендування або емульгування активної сполуки в придатних сумісних з шкірою розчинниках або сумішах розчинників. При необхідності, можуть бути додані інші допоміжні засоби, такі як барвні речовини, стимулятори біоабсорбції, антиоксиданти, світлостабілізатори, адгезиви.

55 Придатними розчинниками є: вода, спирти, гліколі, такі як поліетиленгліколь, поліпропіленгліколі, гліцерин, ароматичні спирти, такі як бензиловий спирт, фенілетанол, феноксіетанол, складні ефіри, такі як етилацетат, бутилацетат, бензилбензоат, ефіри, такі як алкілові ефіри алкіленгліколю, такі як монометилловий ефір дипропіленгліколю, монобутиловий ефір діетиленгліколю, кетони, такі як ацетон, метилетилкетон, циклічні карбонати, такі як пропіленкарбонат, етиленкарбонат, ароматичні і/або аліфатичні вуглеводні, рослинні або

60

синтетичні масла (олії), ДМФА, диметилацетамід, н-алкілпіролідони, такі як метилпіролідон, н-бутилпіролідон або н-октилпіролідон, N-метилпіролідон, 2-піролідон, 2,2-диметил-4-оксиметил-1,3-діоксолан та суміш 5-гідрокси-1,3-діоксану з 4-гідроксиметил-1,3-діоксоланом (glycerol formal).

5

Придатними барвними речовинами є усі барвні речовини, які дозволені для застосування до тварин та які здатні розчинятися або суспендуватися.

10

Придатними стимуляторами абсорбції є, наприклад, ДМСО, масла з гарною здатністю до розтікання, такі як ізопропілміристан, пеларгонат дипропіленгліколю, силіконові масла та їх співполімери з поліефірами, складні ефіри кислот жирного ряду, тригліцериди, жирні спирти.

15

Придатними антиоксидантами є сульфіти або метабісульфіти, такі як метабісульфіт калію, аскорбінова кислота, бутилгідрокситолуол, бутилгідроксіанізол, токоферол.

Придатними світлостабілізаторами є, наприклад, 2-феніл-5-бензімідазолсульфонова кислота (novantisolic acid).

20

Придатними адгезивами є, наприклад, похідні целюлози, похідні крохмалю, поліакрилати, природні полімери, такі як альгірати, желатин.

Емульсії можуть вводиться перорально, дермально або за допомогою ін'єкції.

25

Вони можуть являти собою емульсію типу вода-у-маслі або масло-у-воді.

30

Емульсії приготавливаються шляхом розчинення активної сполуки або в гідрофобній або в гідрофільній фазі та гомогенізації з розчинником другої фази за допомогою придатних емульгаторів й, при необхідності, інших допоміжних речовин, таких як барвні речовини, стимулятори абсорбції, консерванти, антиоксиданти, світлостабілізатори, речовини, що збільшують в'язкість.

35

Придатними гідрофобними фазами (маслами) є: рідкі парафіни, силіконові масла, натуральні рослинні масла, такі як кунжутне масло, мигдальне масло, рицинова олія, синтетичні тригліцериди, такі як каприлат/капринат дигліцерид, тригліцеридні суміші рослинних жирних кислот з довжиною ланцюга C₈-C₁₂, або інші спеціально вибрані природні жирні кислоти, суміші неповних гліцеридів насичених або ненасичених жирних кислот, що можливо також містять гідроксильні групи, моно- та дигліцериди C₈-C₁₀ жирних кислот,

40

ефіри кислот жирного ряду, такі як етил стеарат, ди-н-бутирил адипат, гексил лаурат, дипропіленгліколь перларгонат, складні ефіри розгалужених кислот жирного ряду, що мають середню довжину ланцюга, з насиченими жирними спиртами, що мають довжину ланцюга C₁₆-C₁₈, ізопропілміристан, ізопропілпальмітат, ефіри каприлової/капринової кислоти з насиченими жирними спиртами з довжиною ланцюга C₁₂-C₁₈, ізопропілстеарат, олеїлолеат, децилолеат, етилолеат, етиллактат, воскові складні ефіри кислот жирного ряду, такі як синтетичний жир куприкової залози качки, дибутилфталат, діізопропіладипат та суміші складних ефірів останнього, жирні спирти, такі як ізотридециловий спирт, 2-октилдодеканол, цетилстеариловий спирт, олеїловий спирт, та жирні кислоти, такі як олеїнова кислота та їх суміші.

45

50

Придатними гідрофільними фазами є: вода, спирти, такі як пропіленгліколь, гліцерин, сорбіт та їх суміші.

55

Придатними емульгаторами є: неіонні поверхнево-активні речовини, наприклад поліетоксилована рицинова олія, поліетоксилований сорбітанмоноолеат, сорбітанмоностеарат, гліцеринмоностеарат, поліоксіетилстеарат, алкілфенолполігліколевий ефір; амфолітичні поверхнево-активні речовини, такі як динатрію N-лаурил-р-імінодипропіонат або лецитин; аніонні поверхнево-активні речовини, такі як лаурилсульфат натрію, сульфати ефірів жирних спиртів, моноетаноламінова сіль складного ефіру ортофосфорної кислоти та моно/діалкіл-полігліколевого ефіру;

60

катионні поверхнево-активні речовини, такі як хлорид цетилтриметиламонію.

Крім того, придатними допоміжними засобами є: речовини, які збільшують в'язкість та стабілізують емульсію, такі як карбоксиметилцелюлоза, метилцелюлоза та інші похідні целюлози та крохмалю, поліакрилати, альгірати, желатин, гуміарабік, полівінілпіролідон, полівініловий спирт, співполімери метилвінілового ефіру та малеїнового ангідриду, поліетиленгліколі, воски, колоїдна кремнієва кислота або суміші згаданих речовин.

Суспензії можуть бути введені перорально або місцево/дермально. Вони приготровляються шляхом суспендування активної сполуки в суспендуючому агенті, при необхідності з додаванням інших допоміжних засобів, таких як змочувальні речовини, барвні речовини, стимулятори біоабсорбції, консерванти, антиоксиданти, світлостабілізатори.

Рідкими суспендуючими агентами є всі однорідні розчинники та суміші розчинників.

Придатними змочувальними речовинами (диспергаторами) є наведені вище емульгатори.

Іншими допоміжними засобами, які можна згадати, є наведені вище засоби.

Напівтверді препарати можуть бути введені перорально або місцево/дермально. Вони відрізняються від суспензій та емульсій, описаних вище, тільки своєю високою в'язкістю.

Для одержання твердих препаратів, активну сполуку змішують з придатними наповнювачами, при необхідності з додаванням допоміжних речовин, та доводять до бажаного вигляду.

Придатними наповнювачами є всі фізіологічно прийнятні тверді інертні речовини. Як такі застосовуються неорганічні та органічні речовини. Неорганічними речовинами є, наприклад, хлорид натрію, карбонати, такі як карбонат кальцію, гідрокарбонати, оксиди алюмінію, оксид титану, кремнієві кислоти, глина, осажденний або колоїдний кремнезем, або фосфати. Органічними речовинами є, наприклад, цукор, целюлоза, харчові продукти та корми, такі як сухе молоко, тваринна мука, мука та крупи з зерна та крохмаль.

Придатними допоміжними засобами є консерванти, антиоксиданти, і/або барвники, які були згадані вище.

Іншими придатними допоміжними засобами є змащувачі та речовини, які сприяють ковзанню, такі як стеарат магнію, стеаринова кислота, тальк, бентоніти, речовини, які сприяють розкладанню, такі як крохмаль або зшитий полівінілпіролідон, сполучні речовини, такі як крохмаль, желатин або лінійний полівінілпіролідон, та сухі сполучні речовини, такі як мікрокристалічна целюлоза.

Загалом, "паразитоцидно ефективна кількість" означає таку кількість активного інгредієнта, яка необхідна для досягнення видимої дії на розвиток, у тому числі ефектів некрозу, загибелі, затримки розвитку, запобігання та видалення, руйнування або іншого зменшення чисельності та активності цільових організмів. Паразитоцидно ефективна кількість для різних сполук/композицій, застосовуваних відповідно до винаходу, може бути різною. Паразитоцидно ефективна кількість композицій також залежить від переважаючих умов, таких, як бажана паразитоцидна дія та її тривалість, цільові види, спосіб застосування й т.п.

Композиції, які можуть застосовуватися відповідно до винаходу, звичайно включають від біля 0.001 до 95 % сполуки формул I або II.

Звичайно краще застосовувати сполуки формул I або II в загальних кількостях від 0.5 мг/кг до 100 мг/кг на день, переважно від 1 мг/кг до 50 мг/кг на день.

Готові до застосування препарати містять сполуки, які діють відносно паразитів, переважно ектопаразитів, в концентраціях від 10 млн.ч. до 80 мас. %, переважно, від 0.1 до 65 мас. %, більш краще, від 1 до 50 мас. %, найбільш краще, від 5 до 40 мас. %.

Препарати, які розбавляються перед застосуванням, містять сполуки, які діють відносно ектопаразитів, в концентраціях від 0.5 до 90 мас. %, переважно від 1 до 50 мас. %.

Крім того, препарати, активні щодо ендопаразитів, включають сполуки формул I або II в концентраціях від 10 млн.ч. до 2 мас. %, переважно від 0.05 до 0.9 мас. %, в вищому ступені переважно від 0.005 до 0.25 мас. %.

- 5 В кращому варіанті здійснення даного винаходу, композиції, що включають сполуки формул I або II, наносяться дермально/місцево.

В іншому переважному варіанті, місцеве застосування здійснюють за допомогою профільованих виробів, які містять сполуку, таких як нашійники, медальйони, вушні бирки, стрічки для закріплення на частинах тіла, та липкі стрічки та фольга.

Звичайно корисно застосовувати тверді препарати, що вивільняють сполуки формул I або II в загальних кількостях від 10 мг/кг до 300 мг/кг, переважно від 20 мг/кг до 200 мг/кг, найбільш краще від 25 мг/кг до 160 мг/кг маси тіла тварини, що одержує лікування, протягом трьох тижнів.

Для приготування профільованих виробів застосовується термопластична та еластична пластмаса, також як й еластomers та термопластичні еластomers. Придатними пластмасами та еластomers є полівінільні полімери, поліуретан, поліакрилат, епоксидні полімери, целюлоза, похідні целюлози, поліаміди та складні поліефіри, в достатньому ступені сумісні зі сполуками формул I або II. Докладний перелік пластмас та еластomers, також як й методик виготовлення профільованих виробів, наведений, наприклад, у заявці WO 03/086075.

Сполуки, що підлягають застосуванню відповідно до даного винаходу, можуть також містити інші активні інгредієнти, наприклад, інші пестициди, інсектициди, гербіциди, фунгіциди, інші пестициди, або бактерициди, добрива, такі як нітрат амонію, сечовина, поташ та суперфосфат, фітотоксиканти та регулятори росту рослин, сафенери та нематодциди. Ці додаткові інгредієнти можуть застосовуватися послідовно або в комбінації з вищевказаними композиціями, при необхідності їх можна додавати тільки безпосередньо перед застосуванням (бакова суміш). Наприклад, рослину(-и) можна оббризувати композицією відповідно до винаходу або до або після обробки іншими активними інгредієнтами.

Ці додаткові активні агенти можна домішувати до агентів, застосовуваним відповідно до винаходу, у масовому відношенні від 1:10 до 10:1. Змішування сполук I або II або композицій, які їх містять, призначених для застосування як пестициди, з іншими пестицидами найчастіше приводить до розширенню спектра пестицидної активності.

Наступний перелік пестицидів M, разом з якими можуть застосовуватися сполуки I або II відповідно до винаходу, та з якими можуть виникати потенційні синергетичні ефекти, призначений для ілюстрації можливих комбінацій, а не якого-небудь обмеження:

M.1. Органо(тіо)фосфати: ацефат, азаметіфос, азинфос-етил, азинфос-метил, хлоретоксифос, хлорфенвінфос, хлормефос, хлорпірифос, хлорпірифос-метил, коумафос, ціанофос, деметон-S-метил, діазинон, дихлорвос/ DDVP, дикротофос, диметоат, диметилвінфос, дисульфотон, EPN, етіон, етопрофос, фамфур, фенаміфос, фенітротіон, фентіон, флупіразофос, фостіазат, гептенофос, ізоксатіон, малатіон, мекарбам, метамідофос, метидатіон, мевінфос, монокротофос, налед, ометоат, оксидеметон-метил, паратіон, паратіон-метил, фентоат, форат, фосалон, фосмет, фосфамідон, фоксим, піриміфос-метил, профенофос, пропетамфос, протіофос, піраклофос, піридафентіон, хіналфос, сульфотеп, тебупіриміфос, темефос, тербуфос, тетрахлорвінфос, тіометон, триазофос, трихлорфон, вамідотіон;

M.2. Карбамати: алдикарб, аланікарб, бендіокарб, бенфуракарб, бутоккарбоксим, бутоксикарбоксим, карбарил, карбофуран, карбосульфат, етіофенкарб, фенобукарб, форметанат, фураціокарб, ізопрокарб, метіокарб, метоміл, метолкарб, оксаміл, піримікарб, пропоксур, тіодикарб, тіофанокс, триметакарб, ХМС, ксилілкарб, триазамат;

M.3. Піретроїди: акринатрин, алетрин, d-цис-транс алетрин, d-транс алетрин, біфентрин, біоалетрин, біоалетрин S-циклопентеніл, біоресметрин, циклопротрин, цифлутрин, бета-іфлутрин, цигалотрин, лямбда-цигалотрин, гамма-цигалотрин, циперметрин, альфа-циперметрин, бета-циперметрин, тета-циперметрин, зета-циперметрин, цифенотрин,

дельтаметрин, емпентрин, есфенвалерат, етофенпрокс, фенпропатрин, фенвалерат, флуцитринат, флуметрин, тау-флувалінат, галфенпрокс, іміпротрин, перметрин, фенотрин, пралетрин, ресметрин, RU 15525, силафлуофен, тефлутрин, тетраметрин, тралометрин, трансфлутрин, ZXI 8901;

5

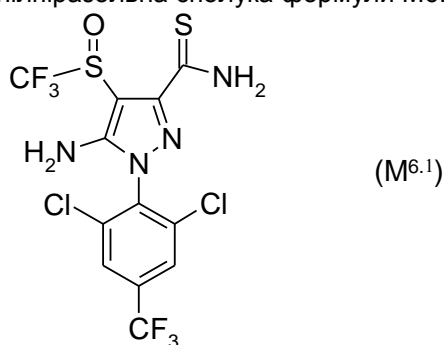
М.4. Імітатори ювенільних гормонів: гідропрен, кінопрен, метопрен, феноксикарб, пірипроксифен;

10

М.5. Сполуки - агоністи/антагоністи нікотинового рецептора: ацетаміпрід, бенсултап, картап гідрохлорид, клотіанідин, динотефуран, імідаклопрід, тіаметоксам, нітенпірам, нікотин, спіносад (алостеричний агоніст), тіаклопрід, тіоциклам, тіосультап-натрій та AKD1022;

15

М.6. Сполуки - антагоністи ГАМК-регульованого хлоридного каналу: хлордан, ендосульфат, гамма-НСН (ліндан); ацетопрол, етипрол, фіпроніл, пірафлупрол, пірипрол, ваніліпрол, фенілпіразольна сполука формули М6.1



М.7. Активатори хлоридного каналу: абамектин, емаектин бензоат, мібемектин, лепімектин;

20

М.8. MET I сполуки: феназахін, фенпіроксимат, піримідифен, піридабен, тебуфенпірад, толфенпірад, флуфенерим, ротенон;

М.9. MET II та III сполуки: ацеквіноцил, флуациприм, гідраметилнон;

25

М.10. Роз'єднувальні агенти окисного фосфорилування: хлорфенапір, DNOC;

М.11. Інгібітори окисного фосфорилування: азоциклотин, цигексатин, діафентіурон, фенбутатин оксид, пропаргіт, тетрадифон;

30

М.12. Сполуки, які порушують процес линьки: циромазин, хромафенозид, галофенозид, метоксифенозид, тебуфенозид;

М.13. Синергісти: піперонілбутоксид, трибуфос;

35

М.14. Сполуки-блокатори натрієвих каналів: індоксакарб, метафлумізон;

М.15. Фуміганти: метилбромід, хлорпікрин, сульфурилфторид;

40

М.16. Селективні блокатори харчування: крилот, піметрозин, флонікамід;

М.17. Інгібітори росту кліщів: клофентезин, гекситіазокс, етоксазол;

45

М.18. Інгібітори синтезу хітину: бупрофезин, бістрифлурон, хлорфлуазурон, дифлубензурон, флуциклоксурон, флуфенксурон, гексафлумурон, лufenuron, новалурон, новіфлумурон, тефлубензурон, трифлумурон;

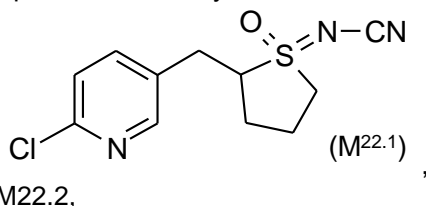
М.19. Інгібітори біосинтезу ліпідів: спіродиклофен, спіромесифен, спіротетрамат;

М.20. Октапамінергічні агоністи: амітраз;

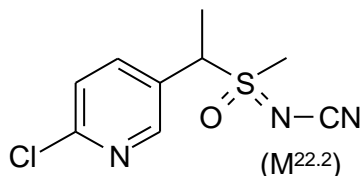
50

М.21. Модулятори ріанодинового рецептора: флубендіамід;

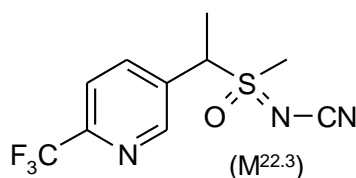
М.22. Різні: фосфід алюмінію, амідофлумет, бенклотіаз, бензоксимат, біфеназат, боракс, бромпропілат, ціанід, цієнопірафен, цифлуметофен, цинометіонат, дикофол, фторацетат, фосфін, піридаліл, пірифлуквіназон, сірка, органічні сполуки сірки, антимонілтартрат калію, сульфоксиминові сполуки М22.1,



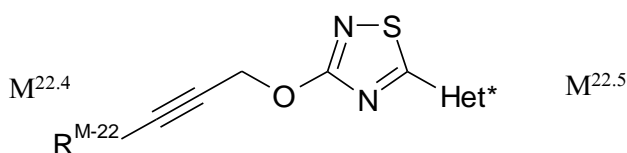
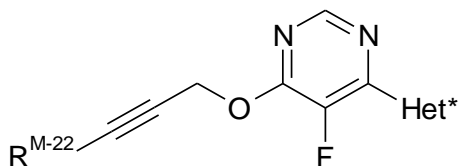
М22.2,



або М22.3,



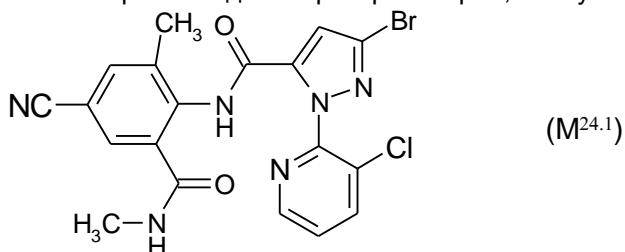
піримідиніалкінілефірні сполуки М22.4 або тіадіазоліалкінілефірні сполуки М22.5,



де RM-22 означає метил або етил та Het* означає 3,3-диметилпіролідін-1-іл, 3-метилпіперидин-1-іл, 3,5-диметилпіперидин-1-іл, 3-трифторметилпіперидин-1-іл, гексагідроазепін-1-іл, 2,6-диметилгексагідроазепін-1-іл або 2,6-диметилморфолін-4-іл;

М.23. N-R'-2,2-дигало-1-R''цикло-пропанкарбоксамід-2-(2,6-дихлор-α,α,α-три-фтор-п-толіл)гідразон або N-R'-2,2-ди(R''')пропіонамід-2-(2,6-дихлор-α,α,α-трифтор-п-толіл)-гідразон, де R' означає метил або етил, гало означає хлор або бром, R'' означає водень або метил та R''' означає метил або етил;

М.24. Антраніламіди: хлорантраніліпрол, сполука формули М^{24.1}



М.25. Малононітрильні сполуки: CF₂HCF₂CF₂CF₂CH₂C(CN)₂CH₂CH₂CF₃, (2-(2,2,3,3,4,4,5,5-октафторпентил)-2-(3,3,3-трифторпропіл)малононітрил), CF₃(CH₂)₂C(CN)₂CH₂(CF₂)₅CF₂H, (2-(2,2,3,3,4,4,5,5,6,6,7,7-додекафторгептил)-2-(3,3,3-трифторпропіл)-малононітрил), CF₃(CH₂)₂C(CN)₂(CH₂)₂C(CF₃)₂F (2-(3,4,4,4-тетрафтор-3-трифторметилбутил)-2-(3,3,3-трифторпропіл)-малононітрил), CF₃(CH₂)₂C(CN)₂(CH₂)₂(CF₂)₃CF₃ (2-(3,3,4,4,5,5,6,6,6-

нонафторгексил)-2-(3,3,3-трифторпропіл)-малононітрил), $\text{CF}_2\text{H}(\text{CF}_2)_3\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$
 (2,2-біс-(2,2,3,3,4,4,5,5-октафторпентил)-малононітрил), $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$ (2-
 (2,2,3,3,4,4,5,5-нонафторпентил)-2-(3,3,3-трифторпропіл)-малононітрил),
 $\text{CF}_3(\text{CF}_2)_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$ (2-(2,2,3,3,4,4,4-гептафторбутил)-2-(2,2,3,3,4,4,5,5-
 5 октафторпентил)-малононітрил), $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$ (2-(2,2,3,3,4,4,5,5-
 октафторпентил)-2-(2,2,3,3,3-пентафторпропіл)-малононітрил),
 $\text{CF}_2\text{HCF}_2\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ (2-(2,2,3,3,4,4,5,5-октафторпентил)-2-(3,3,4,4,4-
 пентафторбутил)-малононітрил), $\text{CF}_3(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{CN})_2\text{CH}_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_2\text{H}$ (2-(2,2,3,3,4,4,5,5-
 октафторпентил)-2-(3,3,3-трифторбутил)-малононітрил);

М.26. Мікробні дезінтегратори: *Bacillus thuringiensis* subsp. *Israelensi*, *Bacillus sphaericus*,
Bacillus thuringiensis subsp. *Aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subsp. *Kurstaki*, *Bacillus thuringiensis*
 subsp. *Tenebrionis*;

Доступні для придбання сполуки з групи М можна знайти, серед інших публікацій, й в *The Pesticide Manual*, 13^е вид., British Crop Protection Council (2003).

Тіоаміди формули М6.1 та їх одержання описано в WO 98/28279. Лепімектин відомий з Agro
 Project, PJB Publications Ltd, November 2004. Бенклотіаз та його одержання описано в EP-A1
 454621. Метидатон та параоксон та їх одержання описано в Farm Chemicals Handbook, т. 88,
 Meister Publishing Company, 2001. Ацетопрол та його одержання описано в WO 98/28277.
 Метафлумізон та його одержання описано в EP-A1 462 456. Флупіразофос описаний в Pesticide
 Science 54, 1988, с. 237-243 та в US 4822779. Пірафлупрол та його одержання описано в JP
 2002193709 та в WO 01/00614. Пірипрол та його одержання описано в WO 98/45274 та в US
 6335357. Амідофлумет та його одержання описано в US 6221890 та в JP 21010907.
 Флуфенерим та його одержання описано в WO 03/007717 та в WO 03/007718. AKD 1022 та його
 одержання описано в US 6300348. Хлорантраніліпрол описаний в WO 01/70671, WO 03/015519
 та WO 05/118552. Антраніламідні похідні формули М24.1 описані в WO 01/70671, WO 04/067528
 та WO 05/118552. Цифлуметофен та його одержання описано в WO 04/080180.
 Амінохіназолінонова сполука пірифлухіназон описана в EP A 109 7932. Сульфоксімінові похідні
 формул М22.1, М22.2 або М22.3 або їх аналоги та їх способи одержання описані в WO
 2006/060029. Алкінілефірні сполуки М22.4 та М22.5 описані, наприклад, в JP 2006131529.
 Органічні сірковмісні сполуки описані в WO 2007060839. Малононітрильні сполуки описані в WO
 02/089579, WO 02/090320, WO 02/090321, WO 04/006677, WO 05/068423, WO 05/068432 та WO
 05/063694.

Фунгіцидними компонентами суміші є сполуки, вибрані з групи, що складається з
 ацилаланінів, таких як беналаксил, металаксил, офураце, оксадиксил, похідних амінів, таких як
 алдиморф, додин, додеморф, фенпропіморф, фенпропідин, гуазатин, іміноктадин, спіроксамін,
 тридеморф, анілінопіримідинів, таких як піриметаніл, мепаніпірим або циродиніл, антибіотиків,
 таких як циклогексимід, гризеофульвін, касугаміцин, натаміцин, поліоксин або стрептоміцин,
 азолів, таких як бітертанол, бромоназол, ципроконазол, дифеноконазол, диніконазол,
 епоксиконазол, фенбуконазол, флухіконазол, флузілазол, гексаконазол, імазаліл, метконазол,
 міклобутаніл, пенконазол, пропіконазол, прохлораз, протіконазол, тебуконазол, триадимефон,
 триадименол, трифлумізол, трітіконазол, флутриафол, дикарбоксимідів, таких як іпродіон,
 міклозолін, процимідон, вінклозолін, дітіокарбаматів, таких як фербам, набам, манеб, манкозеб,
 метам, метирам, пропінеб, полікарбамат, тирам, зирам, зинеб, гетероциклічних сполук, таких як
 анілазин, беноміл, боскалід, карбендазим, карбоксин, оксикарбоксин, ціазофамід, дазомет,
 дитіанон, фамоксадон, фенамідон, фенаримол, фуберидазол, флутоланіл, фураметпір,
 ізопротіолан, мепроніл, нуаримол, пробеназол, проквіназид, пірифенокс, піроквілон, хіноксифен,
 силтіофам, тіабендазол, тифлузамід, тіофанат-метил, тіадиніл, трициклазол, трифорин,
 мідьвмісних фунгіцидів, таких як Бордоська рідина, ацетат міді, оксихлорид міді, основний
 сульфат міді, похідних нітрофенілу, таких як бінапакрил, динокап, динобутон,
 нітрофталізопропіл, фенілпіроліл, таких як фенпіклоніл або флудіоксоніл, сірки, інших
 фунгіцидів, таких як ацибензолар-S-метил, бентіавакарб, карпропамід, хлороталоніл,
 цифлуфенамід, цимоксаніл, дикломезин, диклоцимет, діетофенкарб, едифенфос, етабоксам,
 фенгексамід, фентин-ацетат, феноксаніл, феримзон, флуазилам, фосетил, фосетил-алюміній,
 іпровалікарб, гексахлорбензол, метрафенон, пенцикурон, пропамокарб, фталід, толклофос-
 метил, квінтозен, зоксамід, стробілуринові, таких як азоксистробін, димоксистробін,
 флуоксастробін, крезоксим-метил, метоміностробін, орисастробін, пікоксистробін або

трифлуксистеробін, похідних сульфенової кислоти, таких як каптафол, каптан, дихлофлуанід, фолпет, толілфлуанід, цінамідів та їх аналогів, таких як диметоморф, флуметовер або флуморф.

5 Безхребетний шкідник, тобто членистоногі та нематоди, рослина, ґрунт або вода, у якій рослина росте, може вводитися в контакт з даною(-ими) сполукою(-ами) I або II або композицією(-ями), що містить(-ять) її(їх), за допомогою методу нанесення, відомого з рівня техніки. По суті, "введення в контакт" включає й безпосередній контакт (застосування сполук/композицій безпосередньо на безхребетний шкідник або рослину - звичайно на листя, стебла або корені рослини), й непрямий контакт (нанесення сполук/композицій на локус безхребетного шкідника або рослину).

15 Крім того, боротьбу з безхребетними шкідниками можна вести шляхом введення в контакт цільового шкідника, його харчових ресурсів, місця поширення, місця розмноження або його локусу з пестицидно ефективною сполукою формул I або II. По суті, застосування може вестись до або після інфікування шкідником локусу, зростаючих сільськогосподарських культур або зібраних сільськогосподарських культур.

20 "Локус" означає місце поширення, місце розмноження, культурні рослини, матеріал розмноження рослини (такий, як насіння), ґрунт, ділянку, матеріал або навколишнє середовище, у якому шкідник або паразит росте або може рости.

25 Загалом, "пестицидно ефективна кількість" означає кількість активного інгредієнта, необхідну для досягнення видимої дії на розвиток, в тому числі ефектів некрозу, загибелі, затримки розвитку, запобігання та видалення, руйнування або іншого зменшення чисельності та активності цільових організмів. Пестицидно ефективна кількість для різних сполук/композицій, застосовуваних відповідно до винаходу, може бути різною. Пестицидно ефективна кількість композицій також залежить від переважаючих умов, таких, як бажана пестицидна дія та її тривалість, погода, цільові види, локус, спосіб застосування й т.п.

30 Сполуки формул I або II та їх композиції можуть застосовуватися для захисту дерев'яних матеріалів, таких як колоди, дощаті забори, шпали й т.д., та будівель, таких, як дома, надвірні будови, виробничі будівлі, але також й будівельних матеріалів, меблів, шкіри, волокон, виробів з вінілу, електричних дротів та кабелів й т.д. від мурах і/або термітів, та для запобігання нанесення мурахами та термітами шкоди сільськогосподарським культурам або людям (наприклад, у випадку нашествия шкідників в будинки та громадські приміщення). Сполуки можна наносити не тільки на найближчу поверхню ґрунту або на розташований під підлогою ґрунт для того, щоби захистити дерев'яні матеріали, але й на вироби з пиломатеріалів, наприклад, можна обробляти бетонні поверхні під підлогою, опори в нішах, бруси, клеєну фанеру, меблі й т.д., 40 дерев'яні вироби, такі, як ДСП, півдуймова дошка й т.д., та вінілові вироби, такі, як ізольовані електричні дроти, вінілові листи, теплоізоляційні матеріали, такі, як стирольні піни й т.д. У випадку застосування щодо мурах, що наносять шкоду сільськогосподарським культурам або людям, препарат відповідно до даного винаходу наносять на сільськогосподарські культури або навколишній ґрунт, або безпосередньо на гніздо мурах або т.п.

45 Сполуки формул I та II можуть також наноситися превентивно на місця, де очікується поява шкідників в майбутньому.

50 Сполуки формул I або II також можна використовувати для захисту зростаючих рослин від нападу або інвазії шкідниками шляхом введення в контакт рослини з пестицидно ефективною кількістю сполук формули I або II. По суті, "введення в контакт" включає й безпосередній контакт (застосування сполук/композицій безпосередньо на шкідника і/або рослину - звичайно на листя, стебла або корені рослини), й непрямий контакт (нанесення сполук/композицій на локус тварини-шкідника і/або рослини).

55 У випадку обробки ґрунту або застосування до місцезнаходження шкідників або гнізда, кількість активного інгредієнта знаходиться в інтервалі від 0.0001 до 500 г на 100 м², переважно від 0.001 до 20 г на 100 м².

60 Звичайні норми внесення при захисті матеріалів становлять, наприклад, від 0.01 г до 1000 г активної сполуки на м² оброблюваного матеріалу, бажано від 0.1 г до 50 г на м².

Інсектицидні композиції для застосування для просочування матеріалів звичайно містять від 0.001 до 95 мас. %, переважно від 0.1 до 45 мас. %, та більш переважно від 1 до 25 мас. %, принаймні, одного репеленту і/або інсектициду.

5 Для застосування в композиціях, які містять принаду, звичайний вміст активного інгредієнта становить від 0.001 мас. % до 15 мас. %, бажано від 0.001 мас. % до 5 мас. % активної сполуки.

10 Для застосування в композиціях, призначених для розбризкування, вміст активного інгредієнта становить від 0.001 до 80 мас. %, переважно від 0.01 до 50 мас. % та найбільш краще від 0.01 до 15 мас. %.

15 При застосуванні для обробки сільськогосподарських культур, норма витрати активних інгредієнтів відповідно до винаходу може знаходитися в інтервалі від 0.1 г до 4000 г на гектар, бажано від 25 г до 600 г на гектар, більш бажано від 50 г до 500 г на гектар.

При обробці насіння, норми внесення активних інгредієнтів звичайно становлять від 0,1 г до 10 кг на 100 кг насіння, переважно від 1 г до 5 кг на 100 кг насіння, зокрема від 1 г до 1000 г на 100 кг насіння.

20 Даний винахід далі ілюструється у додаткових деталях за допомогою прикладів.

I. Приклади одержання

25 Методику, описану в наступних прикладах синтезу, використовували для одержання додаткових сполук формули I шляхом відповідної модифікації вихідної речовини. Одержувані сполуки, разом з їх фізичними даними, зведені нижче у таблиці I та II.

30 Продукти характеризували за допомогою ВЕРХ (високоєфективна рідинна хроматографія - мас-спектрометрія). ВЕРХ проводили з використанням аналітичної RP-18 колонки (Chromolith Speed ROD від фірми Merck KGaA, Німеччина), яку експлуатували при 40 °C. Суміш ацетонітрилу та 0.1 % за об'ємом трифтороцтової кислоти/води та 0.1 % за об'ємом трифтороцтової кислоти слугувала рухомою фазою; швидкість потоку: 1.8 мл/хв та інжектований об'єм: 2 мкл.

35 Приклад 13: Піридин-3-іл-амід 1-метил-3-трифторметил-1H-піразол-4-карбонової кислоти

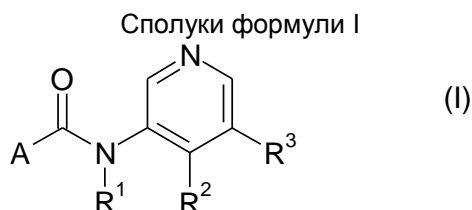
40 2.5 г (12.9 ммоль) 1-метил-3-трифторметил-1H-піразол-4-карбонової кислоти в 25 мл N,N-диметилформаміду (ДМФА) та 2.1 г (12.9 ммоль) N,N'-карбонілдіімідазолу (CDI) перемішували при температурі навколишнього середовища протягом 1 години перед додаванням 1.2 г (12.9 ммоль) 3-амінопіридину. Після трьох днів перемішування, розчинник упарювали, залишок розчиняли в дихлорметані, двічі промивали насиченим розчином NaHCO₃ та водою. Об'єднані органічні фази упарювали, та сирий продукт очищали за допомогою колонкової флеш-хроматографії (кремнезем з використанням дихлорметану/метанолу = 95/5) з одержанням 1.33 г (48 %) зазначеної у заголовку сполуки.

45 Приклад 29: Метилпіридин-3-іл-амід 1-метил-3-трифторметил-1H-піразол-4-карбонової кислоти

50 1.0 г (3.7 ммоль) піридин-3-іл-аміду 1-метил-3-трифторметил-1H-піразол-4-карбонової кислоти з прикладу 13 в 10 мл тетрагідрофурану (ТГФ) та 3.7 г (11.1 ммоль) карбонату цезію перемішували при температурі навколишнього середовища, та до суміші додавали 790 мг (5.55 ммоль) метилйодиду. Після двох днів перемішування, суспензію фільтрували, розчинник упарювали, та сирий продукт очищали за допомогою колонкової флеш-хроматографії (кремнезем з використанням циклогексану/етилацетату) з одержанням 327 мг (31 %) метилованого аміду.

55

Таблиця І



Прикл.	A	R ¹	R ²	R ³	Фізико-хімічні дані ч.у. [хв.]
1	1-метил-1H-піразол-3-іл	H	H	H	н.д.
2	1-(2,3-дихлорфеноксиметил)-1H-піразол-3-іл	H	H	H	2.461
3	2,5-диметил-2H-піразол-3-іл	H	H	H	1.320
4	4-хлор-2,5-диметил-2H-піразол-3-іл	H	H	H	1.543
5	5-хлор-1-метил-1H-піразол-3-іл	H	H	H	1.499
6	1-метил-5-трифторметил-1H-піразол-3-іл	H	H	H	1.779
7	4-хлор-1-метил-1H-піразол-3-іл	H	H	H	1.353
8	1-метил-5-феніл-1H-піразол-3-іл	H	H	H	2.124
9	2-метил-5-феніл-2H-піразол-3-іл	H	H	H	2.193
10	1,5-диметил-1H-піразол-3-іл	H	H	H	1.311
11	2-метил-5-трифторметил-2H-піразол-3-іл	H	H	H	1.954
12	2-метил-2H-піразол-3-іл	H	H	H	1.125
13	1-метил-3-трифторметил-1H-піразол-4-іл	H	H	H	1.548
14	3-дифторметил-1-метил-1H-піразол-4-іл	H	H	H	1.295
15	1-(6-хлорпіридин-2-іл)-5-трифторметил-1H-піразол-4-іл	H	H	H	2.273
16	1-бензил-5-трифторметил-1H-піразол-4-іл	H	H	H	2.290
17	1-етил-3-трифторметил-1H-піразол-4-іл	H	H	H	1.771
18	1-етил-5-трифторметил-1H-піразол-4-іл	H	H	H	1.704
19	1-алил-3-трифторметил-1H-піразол-4-іл	H	H	H	2.187
20	5-дифторметил-1-метил-1H-піразол-4-іл	H	H	H	1.588
21	5-ціано-1-(2,4-дихлорфеніл)-1H-піразол-4-іл	H	H	H	2.475
22	5-трифторметил-1-(4-хлорфеніл)-1H-піразол-4-іл	H	H	H	2.517
23	5-трифторметил-1-феніл-1H-піразол-4-іл	H	H	H	2.185
24	1-(2,4-дихлорфеніл)-5-трифторметил-1H-піразол-4-іл	H	H	H	2.587
25	1-(4-фторфеніл)-5-метил-1H-піразол-4-іл	H	H	H	1.834
26	1-(2,2,2-трифторетил)-5-трифторметил-1H-піразол-4-іл	H	H	H	1.980
27	5-хлор-1-метил-3-трифторметил-1H-піразол-4-іл	H	H	H	1.651
28	1-метил-3-трифторметил-1H-піразол-4-іл	бензил	H	H	2.457
29	1-метил-3-трифторметил-1H-піразол-4-іл	CH ₃	H	H	1.504
30	1-трет-бутил-5-трифторметил-1H-піразол-4-іл	H	H	H	2.197
31	1-(4-нітрофеніл)-5-трифторметил-1H-піразол-4-іл	H	H	H	2.269
32	1-(5-хлорпіридин-2-іл)-5-трифторметил-1H-піразол-4-іл	H	H	H	2.339
33	1-метил-3-трифторметил-1H-піразол-4-іл	H	H	CH ₃	1.793
34	1-метил-3-трифторметил-1H-піразол-4-іл	H	H	Cl	2.444
35	5-дифторметил-1-метил-1H-піразол-4-іл	C ₂ H ₅	H	H	1.645
36	5-дифторметил-1-метил-1H-піразол-4-іл	CH ₃	H	H	1.487
37	1-метил-3-трифторметил-1H-піразол-4-іл	H	H	CF ₃	2.844
38	1-метил-3-трифторметил-1H-піразол-4-іл	H	H	F	2.194
39	1-ізопропіл-3-трифторметил-1H-піразол-4-іл	H	H	H	2.041
40	1-ізобутил-3-трифторметил-1H-піразол-4-іл	H	H	H	2.271
41	1-метил-3-трифторметил-1H-піразол-4-іл	H	CH ₃	H	1.597
42	5-хлор-1,3-диметил-1H-піразол-4-іл	H	H	H	1.385
43	1-пропіл-3-трифторметил-1H-піразол-4-іл	H	H	H	2.040

Таблиця І

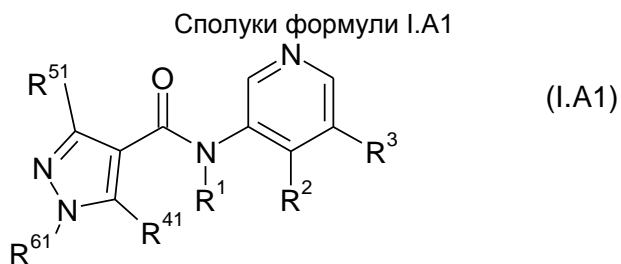


Прикл.	A	R ¹	R ²	R ³	Фізико-хімічні дані ч.у. [хв.]
44	1-метил-3-етокси-1Н-піразол-4-іл	H	H	H	1.550
45	1-пропіл-5-трифторметил-1Н-піразол-4-іл	H	H	H	2.101
46	5-трифторметил-1Н-піразол-4-іл	H	H	H	1.410
47	3-циклопропіл-1-метил-1Н-піразол-4-іл	H	H	H	1.491
48	1-(2,2,2-трифторетил)-5-трифторметил-1Н-піразол-4-іл	CH ₃	H	H	2.032
49	1-(2,2,2-трифторетил)-5-трифторметил-1Н-піразол-4-іл	C ₂ H ₅	H	H	2.281
50	1-(2,2,2-трифторетил)-5-трифторметил-1Н-піразол-4-іл	ізо- бутил	H	H	2.767
51	1-метил-3-трифторметил-1Н-піразол-4-іл	H	Cl	H	1.868
52	1-метил-3-трифторметил-1Н-піразол-4-іл	H	OCH ₃	H	1.652
53	3-метокси-1-метил-1Н-піразол-4-іл	H	H	H	1.333
54	5-бром-2-(3-хлорпіридин-2-іл)-2Н-піразол-3-іл		H	H	1,92
55	2-(3-хлорпіридин-2-іл)-5-трифторметил-2Н-піразол-3-іл	H	H	H	2.283
56	3-трифторметил-1-(4-хлорфеніл)-1Н-піразол-4-іл	H	H	H	2.548
57	1-(4-метоксифеніл)-5-метил-1Н-піразол-4-іл	H	H	H	2.005
58	5-феніл-1Н-піразол-4-іл	H	H	H	1.504
59	1-етил-5-метил-1Н-піразол-4-іл	H	H	H	1.426
60	1-метил-5-феніл-1Н-піразол-4-іл	H	H	H	1.751
61	1,3-диметил-1Н-піразол-4-іл	H	H	H	1.219
62	2-метил-5-трет-бутил-2Н-піразол-3-іл	H	H	H	1.78
63	2-метил-4-хлор-2Н-піразол-3-іл	H	H	H	1.49
64	2-(3-хлорпіридин-3-іл)-5-трифторметил-2Н-піразол-3-іл	H	H	H	2.28
65	4-ізопропіл-1-метил-1Н-піразол-3-іл	H	H	H	1.81
66	5-ізопропіл-2-метил-2Н-піразол-3-іл	H	H	H	1.56
67	5-етил-2-метил-2Н-піразол-3-іл	H	H	H	1.53
68	4,5-диметил-2-метил-2Н-піразол-3-іл	H	H	H	1.42
69	2-метил-5-н-пропіл-2Н-піразол-3-іл	H	H	H	1.76

ч.у. час утримання

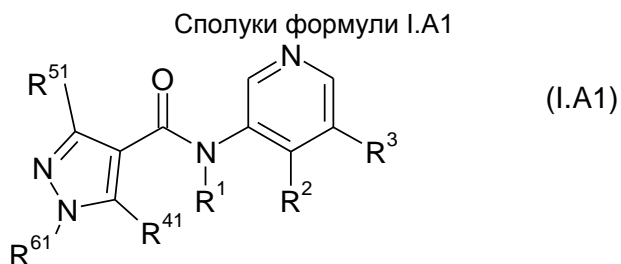
н.д. немає даних.

Таблиця II



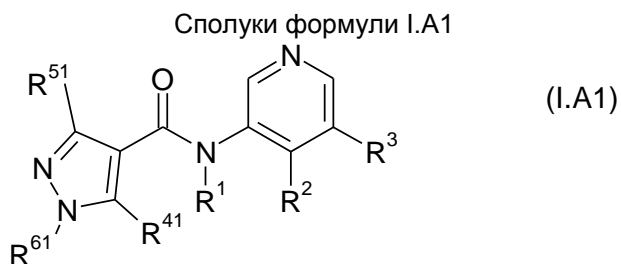
Прикл.	R ⁴¹	R ⁵¹	R ⁶¹	R ¹	R ²	R ³	ч.у. [хв.]; т.пл. [°C]
70	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	1.27; н.д.
71	феніл	H	CH ₃	H	H	H	1.80; н.д.
72	CH ₃	H	C ₂ H ₅	H	H	H	1.47; н.д.
73	H	CF ₃	4-хлорфеніл	H	H	H	2.59; н.д.
74	феніл	H	H	H	H	H	1.50; н.д.
75	CH ₃	H	4-метокси-феніл	H	H	H	2.01; н.д.
76	4-фтор-феніл	H	H	H	H	H	1.57; н.д.
77	2-тієніл	H	H	H	H	H	1.47; н.д.
78	F	CF ₃	CH ₃	H	H	H	1.63; н.д.
79	н-пропіл	H	4-хлорфеніл	H	H	H	2.53; н.д.
80	CHF ₂	H	1-метил-1,3,4-триазин-2-іл	H	H	H	н.д.; 130
81	H	H	4-хлорбензил	H	H	H	н.д.; 218
82	H	H	бензил	H	H	H	н.д.; 165
83	Cl	H	CH ₃	H	H	H	н.д.; 186
84	H	CH ₃	феніл	H	H	H	2.08; н.д.
85	CHF ₂	H	4-(трифторметил)феніл	H	H	H	2.75; н.д.
86	CHF ₂	H	4-хлорфеніл	H	H	H	2.55; н.д.
87	H	H	H	H	H	H	0.54; н.д.
88	CHF ₂	H	4-(метил-сульфоніл)-феніл	H	H	H	1.89; н.д.
89	цикло-пропіл	H	CH ₃	H	H	H	1.41; н.д.
90	ізопропіл	H	CH ₃	H	H	H	1.65; н.д.
91	2-метил-пропіл	H	CH ₃	H	H	H	2.71; н.д.
92	CHF ₂	H	4-(гептафтор-ізопропіл)-феніл	H	H	H	3.12; н.д.
93	CHF ₂	H	4-(трифторметилтіо)-феніл	H	H	H	2.94; н.д.
94	CHF ₂	H	4-фторфеніл	H	H	H	2.39; н.д.
95	CHF ₂	H	4-(трифтор-метокси)-феніл	H	H	H	2.73; н.д.
96	C(=O)NH ₂	H	CH ₃	H	H	H	н.д.; 230
97	H	H	ізопропіл	H	H	H	н.д.; 174
98	H	H	2-метилпропіл	H	H	H	н.д.; 143
99	H	H	2,2-дифтор-етил	H	H	H	н.д.; 152
100	H	CF ₃	CH ₃	H	H	H	1.69; н.д. (у вигляді N-оксиду)
101	CHF ₂	H	2,6-дихлор-4-(трифторметил)феніл	H	H	H	2.91; н.д.

Таблиця II



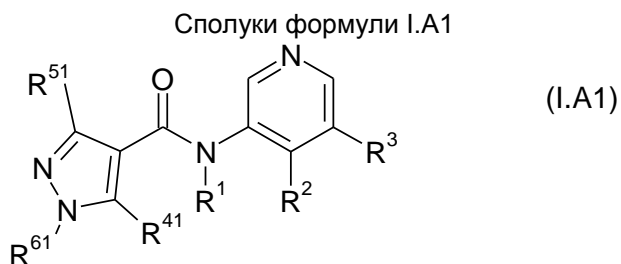
Прикл.	R ⁴¹	R ⁵¹	R ⁶¹	R ¹	R ²	R ³	ч.у. [хв.]; т.пл. [°C]
102	H	H	етил	H	H	H	н.д.; 126
103	H	H	2,2,2-трифторетил	H	H	H	н.д.; 191
104	H	CF ₃	4-(трифторметил)-тіазолін-2-іл	H	H	H	н.д.; 194
105	H	H	піридин-2-іл	H	H	H	н.д.; 244
106	H	H	феніл	H	H	H	н.д.; 241
107	H	H	CH ₃	H	H	H	н.д.; 180
108	H	H	н-пропіл	H	H	H	н.д.; 119
109	CF ₃	H	CH ₃	H	H	H	1.51; н.д.
110	H	OCHF ₂	CH ₃	H	H	H	1.43; н.д.
111	H	CF ₃	бензил	H	H	H	2.34; н.д.
112	H	CF ₂ Cl	CH ₃	H	H	H	1.69; н.д.
113	H	H	4-фторфеніл	H	H	H	н.д.; 235
114	H	H	(4-нітро-піразол-1-іл)-метил	H	H	H	н.д.; 227
115	CH ₃	H	1-метил-1,3,4-триазин-2-іл	H	H	H	н.д.; 206
116	CH ₃	H	тіазол-2-іл	H	H	H	н.д.; 205
117	CHF ₂	H	4-(трифторметил)тіазол-2-іл	H	H	H	н.д.; 171
118	CH ₃	H	4-(трифторметил)тіазол-2-іл	H	H	H	н.д.; 240
119	H	H	циклопропіл	H	H	H	н.д.; 145
120	ізопропіл	H	феніл	H	H	H	2.32; н.д.
121	CH ₃	H	4,5-диметил-тіазол-2-іл	H	H	H	н.д.; 235
122	CHF ₂	H	4,5-диметил-тіазол-2-іл	H	H	H	н.д.; 182
123	Cl	H	феніл	H	H	H	н.д.; 171
124	I	H	4-фторфеніл	H	H	H	н.д.; 188
125	H	2-фтор-етил	CH ₃	H	H	H	1.22; н.д.
126	H	CF ₃	CH ₃	цикло-пропілметил	H	H	2.13; н.д.
127	H	CF ₃	CH ₃	етил	H	H	1.73; н.д.
128	CHF ₂	H	3-метил-3H-1,3,4-триазин-2-іл	H	H	H	1.18; н.д.
129	H	CF ₃	CH ₃	н-пропіл	H	H	2.06; н.д.
130	H	CF ₃	CH ₃	ізо-пропіл	H	H	2.00; н.д.
131	H	CF ₃	CH ₃	(1-метил-3-(трифторметил)-піразол-4-іл)карбоніл	H	H	186; н.д.
132	H	CF ₃	CH ₃	трет-бутилокси-карбоніл	H	H	н.д.; н.д.

Таблиця II



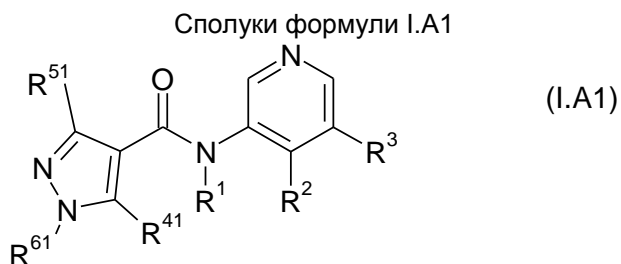
Прикл.	R ⁴¹	R ⁵¹	R ⁶¹	R ¹	R ²	R ³	ч.у. [хв.]; т.пл. [°C]
133	H	CF ₃	CH ₃	трет-бутил-карбоніл	H	H	2.83; н.д.
134	H	CF ₃	CH ₃	ацетил	H	H	н.д.; 143
135	CHF ₂	H	2,4-дифторфеніл	H	H	H	2.38; н.д.
136	H	CF ₃	CH ₃	тозил	H	H	2.98; н.д.
137	CHF ₂	H	3,5-дихлорфеніл	H	H	H	2.77; н.д.
138	CHF ₂	H	4-толіл	H	H	H	2.43; н.д.
139	H	CF ₃	CH ₃	CH ₂ -CN	H	H	1.88; н.д.
140	H	H	н-гептил	H	H	H	2.63; н.д.
141	H	CF ₃	CH ₃	2-пропініл	H	H	1.89; н.д.
142	CH ₃	H	4-хлорфеніл	H	H	H	2.26; н.д.
143	етил	H	4-хлорфеніл	H	H	H	2.42; н.д.
144	етил	H	4-нітрофеніл	H	H	H	2.26; н.д.
145	етил	H	4-(трифторметил)феніл	H	H	H	2.69; н.д.
146	етил	H	4-фторфеніл	H	H	H	2.26; н.д.
147	CHF ₂	H	3-(трифторметил)феніл	H	H	H	2.61; н.д.
148	CHF ₂	H	2-хлорфеніл	H	H	H	2.24; н.д.
149	CHF ₂	H	2-(трифторметил)феніл	H	H	H	2.38; н.д.
150	CHF ₂	H	2-метокси-феніл	H	H	H	2.12; н.д.
151	CHF ₂	H	3-хлор-4-фторфеніл	H	H	H	2.54; н.д.
152	CHF ₂	H	4-трет-бутилфеніл	H	H	H	2.95; н.д.
153	CHF ₂	H	3-нітрофеніл	H	H	H	2.25; н.д.
154	CHF ₂	H	3,4-дихлор-феніл	H	H	H	2.75; н.д.
155	CHF ₂	H	2,4-дихлор-феніл	H	H	H	2.62; н.д.
156	CHF ₂	H	2-толіл	H	H	H	2.34; н.д.
157	CHF ₂	H	3-хлорфеніл	H	H	H	2.46; н.д.
158	CHF ₂	H	3-толіл	H	H	H	2.42; н.д.
159	CHF ₂	H	4-хлор-2-фторфеніл	H	H	H	2.57; н.д.
160	CHF ₂	H	2,4,6-трихлор-феніл	H	H	H	2.79; н.д.
161	CHF ₂	H	2,3,4-трихлор-феніл	H	H	H	2.85; н.д.
162	CHF ₂	H	2,6-дифтор-феніл	H	H	H	2.29; н.д.
163	H	CF ₃	CH ₃	етокси-карбоніл	H	H	н.д.; 104
164	H	CF ₃	CH ₃	етокси-метил	H	H	2.19; н.д.
165	CH ₃	H	4-фторфеніл	H	H	H	2.17; н.д.; (у вигляді N-оксиду)
166	CH ₃	H	4-(трифторметил)феніл	H	H	H	2.50; н.д.
167	CHF ₂	H	CH ₃	H	H	H	н.д.; 172; (у вигляді гідрохлориду)
168	CF ₃	H	2,2,2-трифторетил	ацетил	H	H	2.52; н.д.
169	CF ₃	H	2,2,2-трифторетил	CH ₃	H	H	н.д.; 131; (у вигляді N-оксиду)

Таблиця II



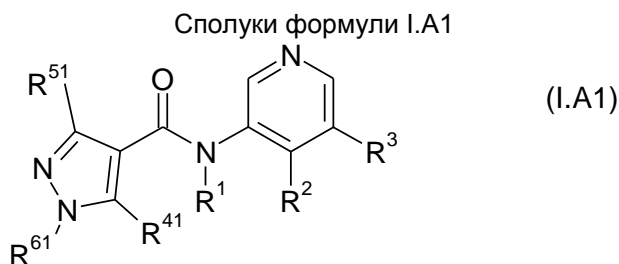
Прикл.	R ⁴¹	R ⁵¹	R ⁶¹	R ¹	R ²	R ³	ч.у. [хв.]; т.пл. [°C]
170	H	CHF ₂	CH ₃	H	H	H	1.67; н.д.; (у вигляді N-оксиду)
171	H	CHF ₂	4-нітрофеніл	H	H	H	2.46; н.д.
172	CH ₃	H	2,2,2-трифторетил	H	H	H	1.65; н.д.
173	CH ₃	H	2,2,2-трифторетил	CH ₃	H	H	1.79; н.д.
174	CF ₃	H	CH ₃	CH ₃	H	H	1.44; н.д.
175	CHF ₂	H	2,2,2-трифторетил	H	H	H	2.07; н.д.
176	CHF ₂	H	2,2,2-трифторетил	CH ₃	H	H	1.82; н.д.
177	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	0.85; н.д.
178	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	H	H	0.99; н.д.
179	CH ₃	H	CH ₃	H	H	H	1.32; н.д.
180	CH ₃	H	етил	CH ₃	H	H	1.22; н.д.
181	H	CHF ₂	етил	H	H	H	2.00; н.д.
182	H	CHF ₂	етил	CH ₃	H	H	1.39; н.д.
183	H	CF ₃	етил	CH ₃	H	H	1.77; н.д.
184	етил	H	етил	H	H	H	1.59; н.д.
185	етил	H	етил	CH ₃	H	H	1.49; н.д.
186	CF ₃	H	етил	CH ₃	H	H	1.89; н.д.
187	H	H	етил	CH ₃	H	H	1.11; н.д.
188	CHF ₂	H	CHF ₂	H	H	H	1.73; н.д.
189	CHF ₂	H	CHF ₂	CH ₃	H	H	1.66; н.д.
190	CF ₃	H	CHF ₂	H	H	H	2.00; н.д.
191	CF ₃	H	CHF ₂	CH ₃	H	H	2.05; н.д.
192	H	CF ₃	CHF ₂	H	H	H	1.90; н.д.
193	H	CF ₃	CHF ₂	CH ₂ -CN	H	H	2.43; н.д.
194	H	CHF ₂	CHF ₂	H	H	H	1.82; н.д.
195	H	CF ₃	CHF ₂	CH ₃	H	H	1.77; н.д.
196	H	CF ₃	CH ₃	H	H	H	1.49; н.д.; (у вигляді гідрохлориду)
197	CHF ₂	H	CH ₃	H	H	H	1.46; н.д.; (у вигляді гідрохлориду)
198	CF ₃	H	2,2,2-трифторетил	H	H	H	1.93; н.д.; (у вигляді гідрохлориду)
199	CF ₃	H	4-нітрофеніл	H	H	H	2.23; н.д.; (у вигляді гідрохлориду)
200	H	H	ізопропіл	H	H	H	1.36; н.д.; (у вигляді гідрохлориду)

Таблиця II



Прикл.	R ⁴¹	R ⁵¹	R ⁶¹	R ¹	R ²	R ³	ч.у. [хв.]; т.пл. [°C]
201	CHF ₂	H	3-метил-3Н-1,3,4-триазин- 2-іл	H	H	H	1.11; н.д.; (у вигляді гідрохлориду)
202	H	CF ₃	CH ₃	н-пропіл	H	H	1.98; н.д.; (у вигляді гідрохлориду)
203	CH ₃	H	2,2,2-трифторетил	CH ₃	H	H	1.43; н.д.; (у вигляді гідрохлориду)
204	H	H	2,2-дифтор-етил	CH ₃	H	H	1.10; н.д.
205	H	H	CF ₃	H	H	H	н.д.; 208
206	H	CHF ₂	етил	CH ₂ -CN	H	H	1.75; н.д.
207	CF ₃	H	CHF ₂	CH ₂ -CN	H	H	2.47; н.д.
208	CH ₃	H	CHF ₂	H	H	H	1.50; н.д.
209	H	CH ₃	CHF ₂	H	H	H	1.54; н.д.
210	CHF ₂	H	CHF ₂	CN	H	H	2.10; н.д.
211	CF ₃	H	CH ₃	CH ₂ -CN	H	H	2.02; н.д.
212	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂ -CN	H	H	1.47; н.д.
213	H	H	CHF ₂	H	H	H	н.д.; 174
214	CHF ₂	H	CF ₃	CH ₂ -CN	H	H	2.21; н.д.
215	CH ₃	H	2,2,2-трифторетил	CH ₂ -CN	H	H	1.76; н.д.
216	CHF ₂	H	CH ₃	CH ₂ -CN	H	H	2.29; н.д.
217	CF ₃	H	етил	CH ₂ -CN	H	H	2.04; н.д.
218	етил	H	етил	CH ₂ -CN	H	H	1.70; н.д.
219	H	H	2,2,2-трифторетил	CH ₃	H	H	н.д.; 90
220	CH ₃	H	CHF ₂	CH ₃	H	H	1.35; н.д.
221	CH ₃	H	CHF ₂	CH ₂ -CN	H	H	1.72; н.д.
222	H	H	CHF ₂	CH ₃	H	H	1.11; н.д.
223	H	H	CH ₃	CH ₂ -CN	H	H	1.53; н.д.
224	H	H	етил	CH ₂ -CN	H	H	1.34; н.д.
225	CF ₃	H	4-(трифторметил)феніл	H	H	H	2.68; н.д.
226	CF ₃	H	4-метокси-феніл	H	H	H	2.25; н.д.
227	CF ₃	H	4-(метил-сульфоніл)-феніл	H	H	H	1.85; н.д.
228	CF ₃	H	4-фторфеніл	H	H	H	2.26; н.д.
229	H	CH ₃	CHF ₂	CH ₃	H	H	1.40; н.д.
230	H	CH ₃	CHF ₂	CH ₂ -CN	H	H	1.76; н.д.
231	CH ₃	H	4-нітрофеніл	H	H	H	2.04; н.д.
232	H	CF ₃	2,2-дифтор-етил	H	H	H	1.81; н.д.
233	H	H	CF ₃	CH ₃	H	H	1.49; н.д.
234	H	CF ₃	2,2-дифтор-етил	CH ₃	H	H	1.76; н.д.
235	H	H	2,2-дифтор-етил	CH ₂ -CN	H	H	1.40; н.д.
236	H	H	2,2,2-трифторетил	CH ₂ -CN	H	H	1.76; н.д.
237	CF ₃	H	2,4-дифтор-феніл	H	H	H	2.32; н.д.

Таблиця II



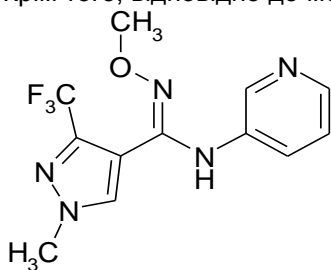
Прикл.	R ⁴¹	R ⁵¹	R ⁶¹	R ¹	R ²	R ³	ч.у. [хв.]; т.пл. [°C]
238	CF ₃	H	4-толіл	H	H	H	2.50; н.д.
239	CF ₃	H	3,5-дихлор-феніл	H	H	H	2.87; н.д.
240	H	CHF ₂	CH ₃	CH ₂ -CN	H	H	1.57; н.д.
241	H	CHF ₂	CH ₃	CH ₃	H	H	1.29; н.д.

ч.у. час утримання

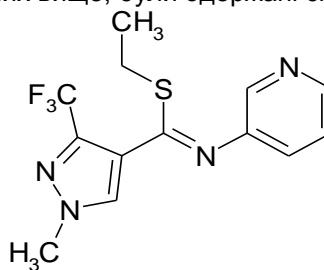
т.пл. температура плавлення

н.д. немає даних.

Крім того, відповідно до методів, відзначених вище, були одержані сполуки 242 та 243.



(242): ч.у. = 1.77 хв.



(243): ч.у. = 2.24 хв.

5 2. Оцінка пестицидної активності:

Table 1 II.1 Хлопкова попелиця (*aphis gossypii*, змішані вікові стадії)

Table 2

Активні сполуки вводили до складу із сумішшю 50:50 (об.:об.) ацетон:вода та 100 млн.ч. поверхнево-активної речовини Kinetica™.

Рослини бавовни на стадії сім'ядолі (одна рослина на горшок) були інвазовані шляхом розташування сильно інвазованого листка з основної колонії наверху кожної сім'ядолі. Протягом однієї ночі було дозволено переміщення попелиці, після чого використовуваний для перенесення попелиці листок видаляли. Сім'ядолі занурювали в досліджуваний розчин та дозволяли їм висушитися. Через 5 днів визначали загибель шкідників.

Table 3

Table 4 У цьому дослідженні, сполуки 1, 3, 5, 6, 10, 11, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 28, 29, 30, 31, 32, 35, 36, 37, 38, 39, 40, 41, 43, 44, 45, 46, 47, 48, 49, 50 51, 62, 65, 66, 67, 69, 70, 71, 72, 73, 75, 80, 82, 83, 85, 86, 87, 88, 89, 91, 92, 93, 94, 95, 96. 97, 98, 99, 100, 102, 103, 104, 105, 107, 108, 109, 110, 115, 116, 118, 119, 120, 121, 122, 123, 124, 125, 126, 127, 128, 129, 130, 131, 132, 133, 134, 135, 136, 137, 138, 139, 141, 142, 143, 144, 145, 147, 148, 149, 150, 151, 154, 155, 156, 157, 158, 161, 163, 164, 165, 166, 167, 168, 169, 170, 172, 173, 174, 175, 176, 177, 178, 179, 180, 181, 182, 183, 184, 185, 186, 187, 188, 189, 190, 191, 192, 193, 194, 195, 196, 197, 199, 200, 201, 202, 203, 204, 205, 206, 207, 208, 209, 210, 211, 212, 213, 214, 215, 216, 217, 218, 219, 220, 221, 222, 223, 224, 225, 226, 227, 228, 229, 230, 233, 242 та 243,

відповідно, при концентрації 300 млн.ч. показували смертність шкідників, принаймні, 75 % у порівнянні з необробленими контролями.

Table 5

II.2 Попелиця персикова зелена (*Myzus persicae*, змішані вікові стадії)

Активні сполуки вводили до складу із сумішшю 50:50 (об.:об.) ацетон:вода та 100 млн.ч. поверхнево-активної речовини KineticaTM.

Рослини перцю на стадії 2-ї пари листків (сорт 'California Wonder') були інвазовані приблизно 40 особинами вирощеної в лабораторії попелиці шляхом розташування частин інвазованого листка зверху досліджуваних рослин. Частинки листка видаляли через 24 год. Листя неушкоджених рослин занурювали в розчини тестованих сполук різних концентрацій та залишали сушитися. Досліджувані рослини витримували при люмінесцентному освітленні (24 годинний фотоперіод) при приблизно 25 °C та відносній вологості 20-40 %. Смертність попелиці на оброблених рослинах, відносно смертності на контрольних рослинах, визначали через 5 днів.

Table 6 У цьому дослідженні, сполуки 1, 3, 5, 6, 10, 11, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 29, 30, 31, 32, 35, 36, 37, 39, 40, 41, 43, 45, 46, 47, 48, 49, 50, 62, 65, 66, 67, 69, 70, 71, 73, 75, 79, 80, 81, 82, 83, 85, 86, 87, 88, 89, 91, 92, 93, 94, 95, 96, 97, 98, 99, 100, 102, 103, 104, 105, 107, 108, 109, 110, 115, 116, 118, 119, 120, 121, 122, 123, 124, 125, 126, 127, 128, 129, 130, 131, 132, 133, 134, 135, 136, 137, 138, 139, 140, 141, 142, 143, 144, 145, 147, 148, 149, 150, 151, 154, 155, 156, 157, 158, 161, 163, 164, 165, 166, 167, 168, 169, 170, 172, 173, 174, 175, 176, 177, 178, 179, 180, 181, 182, 183, 184, 185, 186, 187, 188, 189, 190, 192, 193, 194, 195, 196, 197, 199, 200, 201, 202, 203, 204, 205, 206, 207, 208, 209, 210, 211, 212, 213, 214, 215, 216, 217, 218, 219, 220, 221, 222, 223, 224, 225, 226, 227, 228, 229, 233, 242 та 243, відповідно, при концентрації 300 млн.ч. показували смертність шкідників, принаймні, 50 % у порівнянні з необробленими контролями.

Table 7

Table 8 II.3 Попелиця люцернова (*aphis craccivora*)

Table 9

Table 10 Активні сполуки вводили до складу із сумішшю 50:50 (об.:об.) ацетон:вода. Досліджуваний розчин приготували в день застосування.

Table 11

Горшкові рослини вігні китайської, колонізовані 100-150 особинами попелиці різних стадій після реєстрації популяції шкідників обризували препаратом. Зниження популяції реєстрували через 24, 72 та 120 годин.

Table 12

Table 13 У цьому дослідженні, сполуки 1, 3, 5, 6, 7, 9, 10, 11, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 28, 29, 30, 31, 33, 35, 36, 38, 39, 40, 43, 44, 45, 46, 47, 62, 65, 66, 67, 69, 70, 72, 73, 75, 79, 80, 81, 82, 83, 85, 86, 87, 88, 89, 90, 91, 92, 93, 94, 95, 97, 98, 99, 100, 102, 103, 104, 106, 107, 108, 109, 110, 113, 114, 115, 116, 117, 118, 119, 120, 121, 122, 123, 124, 132, 133, 134, 135, 136, 138, 139, 141, 142, 143, 144, 145, 147, 148, 149, 156, 157, 158, 161, 163, 164, 165, 166, 167, 168, 169, 170, 172, 174, 175, 176, 177, 178, 179, 180, 181, 182, 183, 184, 185, 186, 187, 188, 189, 190, 191, 192, 193, 194, 195, 196, 197, 198, 199, 200, 201, 202, 203, 204, 205, 206, 207, 208, 209, 210, 211, 212, 213, 214, 215, 216, 217, 218, 219, 220, 221, 222, 223, 224, 242 та 243 відповідно, при концентрації 300 млн.ч. показували смертність шкідників, принаймні, 75 % у порівнянні з необробленими контролями.

Table 14

Table 15 II.4 Попелиця бобова (*Aphis fabae*)

Table 16

Активні сполуки вводили до складу із сумішшю 50:50 (об.:об.) ацетон:вода та 100 млн.ч. поверхнево-активної речовини KineticaTM.

Рослини красолі, вирощені в ґрунто-суміші "Metro mix", на стадії 1-ї пари листів (сорт "Mixed Jewel") інвазували приблизно 2-30 особинами культивованої в лабораторії попелиці шляхом розташування інвазованих зрізаних рослин зверху досліджуваних рослин. Зрізані рослини видаляли через 24 год. Кожну рослину занурювали в досліджуваний розчин, забезпечуючи повну обробку листя, стебел, виступаючої поверхні насіння та оточуючої поверхні, та залишали сушитися в витяжній шафі. Оброблені рослини витримували при приблизно 25 °C та безперервному люмінесцентному освітленні. Смертність попелиці визначали через 3 дня.

Table 17

Table 18 У цьому дослідженні, сполуки 13, 14, 18, 20, 29, 75, 80, 94, 116, 122, 123, 126, 127, 129, 135, 142, 143, 166 та 168, відповідно, при концентрації 10 млн.ч. показували смертність шкідників, принаймні, 90 % у порівнянні з необробленими контролями.

Table 19

5 Table 20 II.5 Білокрилка (*bemisia argentifolii*, дорослі особини)

Table 21

Table 22 Активні сполуки вводили до складу із сумішшю 50:50 (об.:об.) ацетон:вода та 100 млн.ч. поверхнево-активної речовини Kinetica™.

Table 23

10 Відібрані рослини бавовни вирощували до фази сім'ядолі (одна рослина на горщик). Сім'ядолі занурювали в досліджуваний розчин для забезпечення повного покриття листків та поміщали в добре провітрюване місце для сушіння. Кожний горщик з обробленим саджанцем поміщали в пластикову чашку та вносили 10-12 дорослих особин білокрилки (приблизно в віці 3-5 діб). Комах збирали, використовуючи аспіратор та 0.6-сантиметрову нетоксичну трубку Tugon® (R-3603), з'єднану з наконечником піпетки з бар'єром. Наконечник, що містить зібрані комах, потім обережно вставляли в ґрунт, що містить оброблену рослину, дозволяючи комахам виповзати за межі кінця трубки на листки для харчування. Чашки закривали багаторазовою 15 гратчастою кришкою (комірка - 150 мікрон, поліефірне сито PeCap від Tetko Inc). Досліджувані рослини витримували в камері схову при приблизно 25 °C та відносній вологості 20-40 % 20 протягом 3 днів, уникаючи прямого впливу люмінесцентного освітлення (24 годинний світловий день) для запобігання поглинання тепла внутрішністю чашки. Смертність визначали через 3 дня після обробки рослин.

Table 24

25 Table 25 У цьому дослідженні, сполуки 16, 18, 21, 26, 29, 35, 46, 48, 49, 50, 62, 73, 75, 80, 82, 83, 84, 89, 100, 102, 109, 133, 134, 163, 168, 173, 180, 212, 215 та 229, відповідно, при концентрації 300 млн.ч. показували смертність шкідників, принаймні, 50 % у порівнянні з необробленими контролями.

Table 26

30 Table 27 II.6 Бура цикадка (*nilaparvata lugens*)

Table 28

Table 29 Активні сполуки вводили до складу з розчином 50:50 (об.:об.) ацетон:вода. Поверхнево-активну речовину (Alkamuls EL 620) додавали в кількості 0.1 % (об./об.).

Table 30

35 Рисові саджанці очищали та промивали 24 год. до оббризування. Горшкові рисові саджанці оббризували 5 мл досліджуваного розчину, сушили на повітрі, поміщали в ізолятори та інокулювали 10 дорослими особинами. Оброблені рисові рослини витримували при 28-29 °C та відносній вологості 50-60 %. Процентну смертність шкідників реєстрували через 72 години.

40 Table 31 У цьому дослідженні, сполуки 36, 65, 176 та 195, відповідно, при концентрації 300 млн.ч. показували смертність шкідників, принаймні, 50 % у порівнянні з необробленими контролями.

Table 32

Table 33 II.7 Південна совка (*spodoptera eridania*, 2^a вікова стадія)

Table 34

45 Table 35 Активні сполуки вводили до складу із сумішшю 50:50 (об.:об.) ацетон:вода та 100 млн.ч. поверхнево-активної речовини Kinetica™.

Table 36

50 Пару перших справжніх листків лімської фасолі занурювали в досліджуваний розчин та залишали сушитися. Листки потім поміщали в пластиковий перфорований пакет з застібною блискавкою, та додавали десять гусениць 2-ї вікової стадії. Через 4 днів, спостерігали за смертністю шкідників та зниженням харчування.

Table 37

55 Table 38 У цьому дослідженні, сполуки 48, 76, 77, 78, 79, 92, 98, 118, 155, 157, 158, 170, 173, 174, 175, 179, 189, 191, 196, 199, 201, 209, 213, 215, 218, 219, 220, 221, 223, 224, 228 та 233, відповідно при концентрації 300 млн.ч. показували смертність шкідників, принаймні, 50 % у порівнянні з необробленими контролями.

Table 39

Table 40 II.8 Попелиця вікова (*Megoura viciae*)

Table 41

Активні сполуки вводили до складу із сумішшю 1:3 (об.:об.) ДМСО: вода при різних концентраціях введеної сполуки.

Пластижки листків бобів поміщали в мікротитраційні планшети, які містили 0.8 % агару та 2.5 млн.ч. OPUSTM. Пластижки листків оббризували 2.5 мкл досліджуваного розчину, після чого від 5 до 8 дорослих особин попелиці поміщали в мікротитраційні планшети, які потім закривали та витримували при 23 ± 1 °C та вологості 50 ± 5 % при люмінесцентному освітленні протягом 6 днів. Загибель шкідників визначали на основі активності попелиці та її способности до розмноження. Смертність попелиці та її плодовитість потім оцінювали візуально.

Table 42

Table 43 У цьому дослідженні, сполуки 3, 9, 11, 13, 14, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 28, 29, 62, 65, 66, 67, 69, 71, 72, 73, 75, 85, 87, 89, 91, 93, 94, 95, 96, 97, 98, 99, 100, 102, 103, 104, 107, 108, 109, 110, 112, 116, 117, 119, 120, 121, 122, 123, 124, 125, 126, 127, 128, 129, 130, 131, 132, 133, 134, 135, 136, 138, 140, 141, 142, 143, 144, 145, 147, 148, 149, 150, 152, 153, 154, 155, 156, 157, 158, 159, 161, 162, 163, 164, 165, 166, 167, 181, 182, 183, 184, 185, 186, 189, 190, 191, 193, 194, 195, 201, 202, 203, 204, 205, 206, 207, 210, 218, 220, 221, 225, 226, 227, 228, 230, 231, 232, 234, 242 та 243, відповідно при концентрації досліджуваного розчину 2500 мг/л показували смертність шкідників, принаймні, 80 %.

Table 44

Table 45 II.9 Довгоносик бавовняний (*Anthonomus grandis*)

Table 46

Сполуки вводили до складу із сумішшю 75:25 (об.:об.) вода: ДМСО.

Тестовий модуль для оцінки боротьби з довгоносом бавовняним (*Anthonomus grandis*), складався з 24-лункових титраційних мікропланшетів, які містять їжу для комах та 20-30 яєць *A. grandis*. Їжу для комах обприскували 20 мкл складів сполук з різними концентраціями, використовуючи виготовлений на замовлення мікророзпилювач, у двох повтореннях. Після нанесення, титраційні мікропланшети інкубували при 23 ± 1 °C та відносній вологості 50 ± 5 % протягом 5 днів. Потім візуально оцінювали смертність яєць та личинок.

Table 47

Table 48 У цьому дослідженні, сполуки 19, 33, 62, 65, 66, 69, 81, 85, 86, 87, 88, 92, 93, 94, 95, 99, 101, 102, 104, 105, 106, 107, 108, 109, 110, 116, 138, 143, 145, 147, 148, 149, 150, 151, 153, 154, 155, 156, 157, 159, 160, 161, 162, 166, 167, 171, 185, 186, 188, 189, 190, 191, 192, 193, 194, 206, 207, 220, 221, 234 та 243, відповідно, при концентрації досліджуваного розчину 2500 мг/л показували смертність шкідників 100 %. У цьому дослідженні, сполуки 11, 13, 14, 16, 20, 22 та 30, відповідно, при концентрації досліджуваного розчину 2500 мг/л показували смертність шкідників, принаймні, 50 %.

Table 49

Table 50 II.10 Активність щодо середземноморської плодової мухи (*Ceratitis capitata*)

Table 51

Активні сполуки вводили до складу із сумішшю 1:3 (об.:об.) ДМСО: вода.

Тестовий модуль для оцінки боротьби з середземноморською плодовою мухою, складався з титраційних мікропланшетів, які містять їжу для комах та 50-80 С. яєць *capitata*.

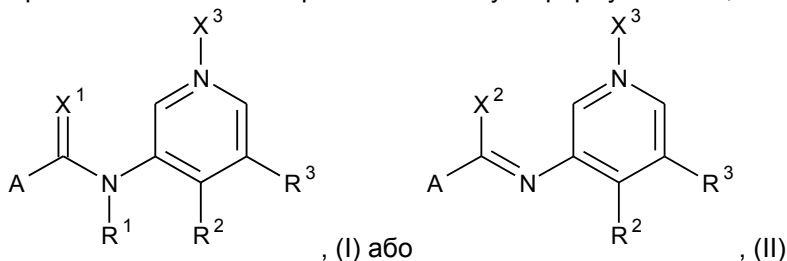
Їжу для комах обприскували 5 мкл складів сполук з різними концентраціями, використовуючи виготовлений на замовлення мікророзпилювач, у двох повтореннях. Після нанесення, титраційні мікропланшети інкубували при 28 ± 1 °C та відносній вологості 80 ± 5 % протягом 5 днів. Потім візуально оцінювали смертність яєць та личинок.

Table 52

У цьому дослідженні, яйця, які були оброблені 2500 млн.ч. сполуки 7, 21, 62, 63, 77, 79, 84, 92, 100, 101, 126, 128, 147, 166, 181, 183, 184, 231, 232 та 234, відповідно, показували смертність шкідників 50 %.

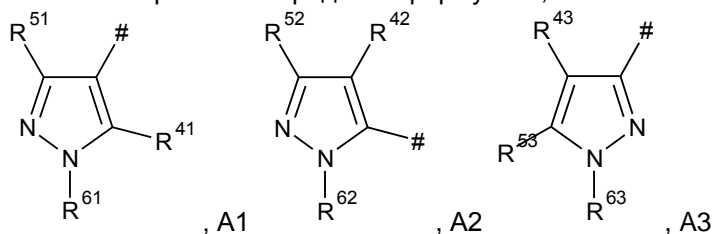
ФОРМУЛА ВИНАХОДУ

1. Спосіб боротьби з безхребетними шкідниками, вибраними з комах, павукоподібних і нематод, який включає обробку шкідників, їх харчових ресурсів, їх місця поширення або їх місця розмноження, або рослин, насіння, ґрунту, ділянки, матеріалу, або навколишнього середовища, у якому шкідники ростуть або можуть рости, або матеріалів, рослин, насіння, ґрунтів, поверхонь, або просторів, які підлягають захисту від нападу або інвазії шкідниками, пестицидно ефективною кількістю піразольної сполуки формул I або II, або її солі, або N-оксиду:



де

A означає піразольний радикал формул A1, A2 або A3



означає місце приєднання до частини формул I або II, що залишилися;

X¹ означає S, O або NR^{1a};

X² означає OR^{2a}, NR^{2b}R^{2c}, S(O)_mR^{2d};

X³ означає неподілену пару або кисень;

R¹ означає водень, CN, C₁-C₁₀-алкіл, C₁-C₁₀-галоалкіл, C₃-C₁₀-циклоалкіл, C₃-C₁₀-галоциклоалкіл, C₃-C₁₀-циклоалкілметил, C₃-C₁₀-галоциклоалкілметил, C₂-C₁₀-алкеніл, C₂-C₁₀-галоалкеніл, C₂-C₁₀-алкініл, C₃-C₁₀-галоалкініл, C₁-C₄-алкілен-CN, OR^a, C₁-C₄-алкілен-OR^a, C(Y)R^b, C₁-C₄-алкілен-C(Y)R^b, C(Y)OR^c, C₁-C₄-алкілен-C(Y)OR^c, S(O)₂R^d, NR^eR^f, C₁-C₄-алкілен-NR^eR^f, C(Y)NR^gR^h, C₁-C₄-алкілен-C(Y)NR^gR^h, S(O)_mNR^eR^f, C(Y)NRⁱNR^eR^f, феніл, гетарил, феніл-C₁-C₄-алкіл та гетарил-C₁-C₄-алкіл, де ароматичне кільце чотирьох згаданих останніми радикалів може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3, 4 або 5 ідентичних або різних замісників R^x;

R² означає водень, галоген, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-галоалкіл, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-галоалкокси, C₁-C₄-алкілтіо, C₁-C₄-галоалкілтіо, C₁-C₄-алкілсульфініл, C₁-C₄-галоалкілсульфініл, C₁-C₄-алкілсульфоніл, C₁-C₄-галоалкілсульфоніл, C₃-C₆-циклоалкіл, C₃-C₆-галоциклоалкіл, C₂-C₄-алкеніл, C₂-C₄-галоалкеніл, C₂-C₄-алкініл або C₁-C₄-алкокси-C₁-C₄-алкіл;

R³ означає водень, галоген, C₁-C₄-алкіл, C₁-C₄-галоалкіл, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-галоалкокси, C₁-C₄-алкілтіо, C₁-C₄-галоалкілтіо, C₁-C₄-алкілсульфініл, C₁-C₄-галоалкілсульфініл, C₁-C₄-алкілсульфоніл, C₁-C₄-галоалкілсульфоніл, C₃-C₆-циклоалкіл, C₃-C₆-галоциклоалкіл, C₂-C₄-алкеніл, C₂-C₄-галоалкеніл, C₂-C₄-алкініл або C₁-C₄-алкокси-C₁-C₄-алкіл;

m приймає значення 0, 1 або 2;

R⁴¹, R⁴², R⁴³ вибирають із групи, що складається із водню, галогену, CN, NO₂, C₁-C₁₀-алкілу, C₃-C₁₀-циклоалкілу, C₅-C₁₀-циклоалкенілу, C₃-C₁₀-циклоалкілметилу, C₂-C₁₀-алкенілу, C₂-C₁₀-алкінілу, де аліфатичні або циклічні фрагменти в 6 згаданих останніми радикалах можуть бути незаміщеними, можуть бути частково або повністю галогенованими або можуть нести 1, 2 або 3 ідентичних або різних замісників R^y;

OR^a, SR^a, C(Y)R^b, C(Y)OR^c, S(O)₂R^d, NR^eR^f, C(Y)NR^gR^h, фенілу, феніл-C₁-C₄-алкілу, фенокси-C₁-C₄-алкілу, 5-членного гетарилу та гетероцикліл-C₁-C₄-алкілу, де гетероцикліл та ароматичне кільце 5 згаданих останніми радикалів можуть бути незаміщеними або можуть нести 1, 2, 3, 4 або 5 ідентичних або різних замісників R^x;

R⁵¹ вибирають із групи, що складається із водню, галогену, CN, NO₂, C₁-C₁₀-алкілу, C₃-C₁₀-циклоалкілу, C₅-C₁₀-циклоалкенілу, C₃-C₁₀-циклоалкілметилу, C₂-C₁₀-алкенілу, C₂-C₁₀-алкінілу, де аліфатичні або циклічні фрагменти в 6 згаданих останніми радикалах можуть бути

- незаміщеними, можуть бути частково або повністю галогенованими або можуть нести 1, 2 або 3 ідентичних або різних замісників R^y , OR^a , SR^a , $C(Y)R^b$, $C(Y)OR^c$, $S(O)_2R^d$, NR^eR^f , $C(Y)NR^gR^h$, фенілу, феніл- C_1 - C_4 -алкілу, фенокси- C_1 - C_4 -алкілу, 5-членного гетарилу та гетероциклі- C_1 - C_4 -алкілу, де гетероциклі- та ароматичне кільце 5 згаданих останніми радикалів можуть бути незаміщеними або можуть нести 1, 2, 3, 4 або 5 ідентичних або різних замісників R^x ;
- R^{62} , R^{63} вибирають із групи, що складається із водню, галогену, CN , NO_2 , C_1 - C_{10} -алкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілу, C_5 - C_{10} -циклоалкенілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілметилу, C_2 - C_{10} -алкенілу, C_2 - C_{10} -алкінілу, де аліфатичні або циклічні фрагменти в 6 згаданих останніми радикалах можуть бути незаміщеними, можуть бути частково або повністю галогенованими або можуть нести 1, 2 або 3 ідентичних або різних замісників R^y , OR^a , SR^a , $C(Y)R^b$, $C(Y)OR^c$, $S(O)_2R^d$, NR^eR^f , $C(Y)NR^gR^h$, гетероциклілу, фенілу, феніл- C_1 - C_4 -алкілу, фенокси- C_1 - C_4 -алкілу та гетероциклі- C_1 - C_4 -алкілу, де гетероциклі- та ароматичне кільце 5 згаданих останніми радикалів можуть бути незаміщеними або можуть нести 1, 2, 3, 4 або 5 ідентичних або різних замісників R^x ;
- R^{61} , R^{63} вибирають із групи, що складається із водню, NO_2 , C_1 - C_{10} -алкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілу, C_5 - C_{10} -циклоалкенілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілметилу, C_2 - C_{10} -алкенілу, C_2 - C_{10} -алкінілу, де аліфатичні або циклічні фрагменти в 6 згаданих останніми радикалах можуть бути незаміщеними, можуть бути частково або повністю галогенованими або можуть нести 1, 2 або 3 ідентичних або різних замісників R^y , OR^a , SR^a , $C(Y)R^b$, $C(Y)OR^c$, $S(O)_2R^d$, NR^eR^f , $C(Y)NR^gR^h$, $S(O)_mNR^eR^f$, $C(Y)NR^iNR^eR^f$, гетероциклілу, фенілу, феніл- C_1 - C_4 -алкілу, фенокси- C_1 - C_4 -алкілу та гетероциклі- C_1 - C_4 -алкілу, де гетероциклі- та ароматичне кільце 5 згаданих останніми радикалів можуть бути незаміщеними або можуть нести 1, 2, 3, 4 або 5 ідентичних або різних замісників R^x ;
- R^{62} вибирають із групи, що складається із водню, NO_2 , C_1 - C_{10} -алкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілу, C_5 - C_{10} -циклоалкенілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілметилу, C_2 - C_{10} -алкенілу, C_2 - C_{10} -алкінілу, де аліфатичні або циклічні фрагменти в 6 згаданих останніми радикалах можуть бути незаміщеними, можуть бути частково або повністю галогенованими або можуть нести 1, 2 або 3 ідентичних або різних замісників R^y , OR^a , SR^a , $C(Y)R^b$, $C(Y)OR^c$, $S(O)_2R^d$, NR^eR^f , $C(Y)NR^gR^h$, $S(O)_mNR^eR^f$, $C(Y)NR^iNR^eR^f$, фенілу, феніл- C_1 - C_4 -алкілу, фенокси- C_1 - C_4 -алкілу, 5-членного гетарилу та гетероциклі- C_1 - C_4 -алкілу, де гетероциклі- та ароматичне кільце 5 згаданих останніми радикалів можуть бути незаміщеними або можуть нести 1, 2, 3, 4 або 5 ідентичних або різних замісників R^x ;
- Y означає O або S ;
- R^{1a} вибирають із водню, C_1 - C_{10} -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілметилу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілу, C_2 - C_{10} -алкенілу, C_2 - C_{10} -галоалкенілу, C_2 - C_{10} -алкінілу, C_1 - C_{10} -алкокси- C_1 - C_4 -алкілу, OR^a , фенілу, гетарилу, феніл- C_1 - C_4 -алкілу та гетарил- C_1 - C_4 -алкілу, де ароматичне кільце в чотирьох згаданих останніми радикалах може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3 або 4 замісників, які незалежно один від одного вибирають із групи, що складається із галогену, ціано, нітро, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси та C_1 - C_4 -галоалкокси;
- R^{2a} вибирають із C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_3 - C_6 -циклоалкілу, C_3 - C_6 -галоциклоалкілу, C_2 - C_4 -алкенілу, C_2 - C_4 -галоалкенілу, C_2 - C_4 -алкінілу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_4 -алкілу, фенілу, гетарилу, феніл- C_1 - C_4 -алкілу та гетарил- C_1 - C_4 -алкілу, де ароматичне кільце в чотирьох згаданих останніми радикалах може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3 або 4 замісників, які незалежно один від одного вибирають із групи, що складається із галогену, ціано, нітро, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси та C_1 - C_4 -галоалкокси;
- R^{2b} , R^{2c} незалежно один від одного вибирають із водню, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_3 - C_6 -циклоалкілу, C_3 - C_6 -галоциклоалкілу, C_2 - C_4 -алкенілу, C_2 - C_4 -галоалкенілу, C_2 - C_4 -алкінілу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -алкілкарбонілу, C_1 - C_4 -галоалкілкарбонілу, C_1 - C_4 -алкілсульфонілу, C_1 - C_4 -галоалкілсульфонілу, фенілу, фенілкарбонілу, фенілсульфонілу, гетарилу, гетарилкарбонілу, гетарилсульфонілу, феніл- C_1 - C_4 -алкілу та гетарил- C_1 - C_4 -алкілу, де ароматичне кільце в восьми згаданих останніми радикалах може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3, 4 або 5 замісників, які незалежно один від одного вибирають із групи, що складається із галогену, ціано, нітро, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси та C_1 - C_4 -галоалкокси; або
- R^{2b} та R^{2c} разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, утворюють 5- або 6-членний, насичений або ненасичений гетероцикл, який може нести додатковий гетероатом, що вибирають з O , S та N як атом - член кільця, та який може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3, 4 або 5 замісників, які незалежно один від одного вибирають із групи, що складається із галогену, ціано, нітро, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси та C_1 - C_4 -галоалкокси;

R^{2d} вибирають із C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_3 - C_6 -циклоалкілу, C_3 - C_6 -галоциклоалкілу, C_2 - C_4 -алкенілу, C_2 - C_4 -галоалкенілу, C_2 - C_4 -алкінілу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_4 -алкілу, фенілу, гетарилу, феніл- C_1 - C_4 -алкілу та гетарил- C_1 - C_4 -алкілу, де ароматичне кільце в чотирьох згаданих останніми радикалах може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3, 4 або 5 замісників, які незалежно один від одного вибирають із групи, що складається із галогену, ціано, нітро, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси та C_1 - C_4 -галоалкокси;

R^a , R^b , R^c незалежно один від одного вибирають із водню, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_3 - C_6 -циклоалкілу, C_3 - C_6 -циклоалкілметилу, C_3 - C_6 -галоциклоалкілу, C_2 - C_4 -алкенілу, C_2 - C_4 -галоалкенілу, C_2 - C_4 -алкінілу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_4 -алкілу, фенілу, гетарилу, феніл- C_1 - C_4 -алкілу та гетарил- C_1 - C_4 -алкілу, де ароматичне кільце в чотирьох згаданих останніми радикалах може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3 або 4 замісників, які незалежно один від одного вибирають із групи, що складається із галогену, ціано, нітро, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси та C_1 - C_4 -галоалкокси;

R^d вибирають із C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_3 - C_6 -циклоалкілу, C_3 - C_6 -циклоалкілметилу, C_3 - C_6 -галоциклоалкілу, C_2 - C_4 -алкенілу, C_2 - C_4 -галоалкенілу, C_2 - C_4 -алкінілу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_4 -алкілу, фенілу, гетарилу, феніл- C_1 - C_4 -алкілу та гетарил- C_1 - C_4 -алкілу, де ароматичне кільце в чотирьох згаданих останніми радикалах може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3, 4 або 5 замісників, які незалежно один від одного вибирають із групи, що складається із галогену, ціано, нітро, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси та C_1 - C_4 -галоалкокси;

R^e , R^f незалежно один від одного вибирають із водню, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_3 - C_6 -циклоалкілу, C_3 - C_6 -циклоалкілметилу, C_3 - C_6 -галоциклоалкілу, C_2 - C_4 -алкенілу, C_2 - C_4 -галоалкенілу, C_2 - C_4 -алкінілу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -алкілкарбонілу, C_1 - C_4 -галоалкілкарбонілу, C_1 - C_4 -алкілсульфонілу, C_1 - C_4 -галоалкілсульфонілу, фенілу, фенілкарбонілу, фенілсульфонілу, гетарилу, гетарилкарбонілу, гетарилсульфонілу, феніл- C_1 - C_4 -алкілу та гетарил- C_1 - C_4 -алкілу, де ароматичне кільце в восьми згаданих останніми радикалах може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3, 4 або 5 замісників, які незалежно один від одного вибирають із групи, що складається із галогену, ціано, нітро, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси та C_1 - C_4 -галоалкокси; або

R^e та R^f разом з атомом азоту, до якого вони приєднані, утворюють 5- або 6-членний, насичений або ненасичений гетероцикл, який може нести додатковий гетероатом, що вибирають з O, S та N як атом - член кільця, та який може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3, 4 або 5 замісників, які незалежно один від одного вибирають із групи, що складається із галогену, ціано, нітро, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси та C_1 - C_4 -галоалкокси;

R^g , R^h незалежно один від одного вибирають із водню, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_3 - C_6 -циклоалкілу, C_3 - C_6 -галоциклоалкілу, C_2 - C_4 -алкенілу, C_2 - C_4 -галоалкенілу, C_2 - C_4 -алкінілу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_4 -алкілу, фенілу, гетарилу, феніл- C_1 - C_4 -алкілу та гетарил- C_1 - C_4 -алкілу, де ароматичне кільце в чотирьох згаданих останніми радикалах може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3 або 4 замісника, які незалежно один від одного вибирають із групи, що складається із галогену, ціано, нітро, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси та C_1 - C_4 -галоалкокси;

R^i вибирають із групи, що складається із водню, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_3 - C_6 -циклоалкілу, C_3 - C_6 -циклоалкілметилу, C_3 - C_6 -галоциклоалкілу, C_2 - C_4 -алкенілу, C_2 - C_4 -галоалкенілу, C_2 - C_4 -алкінілу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_4 -алкілу, фенілу та феніл- C_1 - C_4 -алкілу, де фенільне кільце в двох згаданих останніми радикалах може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3, 4 або 5 замісників, які незалежно один від одного вибирають із групи, що складається із галогену, ціано, нітро, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси та C_1 - C_4 -галоалкокси;

R^x вибирають із групи, що складається із галогену, ціано, нітро, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкілтію, C_1 - C_4 -галоалкілтію, C_1 - C_4 -алкілсульфінілу, C_1 - C_4 -галоалкілсульфінілу, C_1 - C_4 -алкілсульфонілу, C_1 - C_4 -галоалкілсульфонілу, C_1 - C_4 -алкілкарбонілу, C_1 - C_4 -галоалкілкарбонілу, C_3 - C_6 -циклоалкілу, C_3 - C_6 -галоциклоалкілу, C_2 - C_4 -алкенілу, C_2 - C_4 -галоалкенілу, C_2 - C_4 -алкінілу та C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_4 -алкілу,

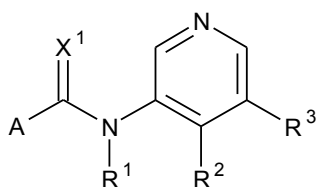
R^y незалежно один від одного вибирають із C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкілтію, C_1 - C_4 -галоалкілтію, C_1 - C_4 -алкілсульфінілу, C_1 - C_4 -галоалкілсульфінілу, C_1 - C_4 -алкілсульфонілу, C_1 - C_4 -галоалкілсульфонілу, C_3 - C_6 -циклоалкілу, C_3 - C_6 -галоциклоалкілу, C_2 - C_4 -алкенілу, C_2 - C_4 -галоалкенілу, C_2 - C_4 -алкінілу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_4 -алкілу та C_1 - C_{10} -алкілкарбонілу.

2. Спосіб за п. 1, де піразольна сполука являє собою сполуку формули I.

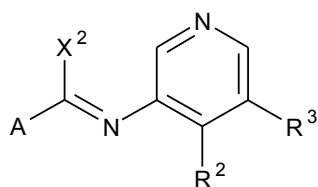
3. Спосіб за п. 1, де піразольна сполука являє собою сполуку формули I, де X^1 у формулі I означає кисень.

4. Спосіб за п. 1, де піразольна сполука являє собою сполуку формули I, де R^1 означає водень, CN, C_1 - C_{10} -алкіл, C_1 - C_{10} -галоалкіл, C_2 - C_{10} -алкеніл, C_2 - C_{10} -галоалкеніл, C_2 - C_{10} -алкініл, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_{10} -алкіл, C_1 - C_4 -алкілен-CN, OR^a , $C(Y)R^b$, $C(Y)OR^c$ або $S(O)_2R^d$.
5. Спосіб за п. 4, де R^1 означає водень, C_1 - C_3 -алкіл або C_1 - C_4 -алкілен-CN.
6. Спосіб за будь-яким із попередніх пунктів, де R^2 означає водень, метил, дифторметил, трифторметил, метокси, дифторметокси або трифторметокси.
7. Спосіб за будь-яким із попередніх пунктів, де R^3 означає водень, метил, дифторметил, трифторметил, метокси, дифторметокси або трифторметокси.
8. Спосіб за будь-яким із попередніх пунктів, де принаймні один із радикалів R^2 або R^3 означає водень.
9. Спосіб за будь-яким із попередніх пунктів, де обидва радикали R^2 та R^3 означають водень.
10. Спосіб за будь-яким із попередніх пунктів, де A означає радикал A1.
11. Спосіб за п. 10, де R^{41} та R^{51} незалежно вибирають із водню, галогену, CN, C_1 - C_{10} -алкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілу, C_2 - C_{10} -алкенілу та C_2 - C_{10} -алкінілу, де аліфатичні або циклічні фрагменти в 4 згаданих останніми радикалах можуть бути незаміщеними, можуть бути частково або повністю галогенованими або можуть нести 1 або 2 ідентичних або різних замісників R^y .
12. Спосіб за п. 10 або 11, де R^{41} та R^{51} вибирають, незалежно один від одного, із водню, CN, галогену, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_3 - C_6 -циклоалкілу та C_3 - C_6 -галоциклоалкілу.
13. Спосіб за п. 12, де R^{41} та R^{51} вибирають, незалежно один від одного, із водню, CN, галогену, CH_3 , CH_2F , CHF_2 та CF_3 .
14. Спосіб за будь-яким із пп. 10-13, де або R^{41} або R^{51} означає водень або обидва R^{41} та R^{51} означають водень.
15. Спосіб за будь-яким із пп. 10-14, де R^{61} вибирають із групи, що складається із C_1 - C_{10} -алкілу, C_1 - C_{10} -галоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілметилу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілметилу, C_2 - C_{10} -алкенілу, C_2 - C_{10} -галоалкенілу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_{10} -алкілу, фенілу, бензилу, феноксиметилу, 5- або 6-членного гетарилу, 5- або 6-членного гетарилметилу, де (гетеро)ароматичне кільце 5 згаданих останніми радикалів може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3, 4 або 5 ідентичних або різних замісників R^x , які вибирають із галогену, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкілсульфонілу, та C_1 - C_4 -галоалкілсульфонілу.
16. Спосіб за п. 15, де R^{61} означає C_1 - C_4 -алкіл або C_1 - C_4 -галоалкіл.
17. Спосіб за будь-яким із пп. 10-16, де піразольна сполука являє собою сполуку формули I, де A означає радикал A1.
18. Спосіб за п. 17, де X^1 у формулі I означає кисень.
19. Спосіб за будь-яким із пп. 1-9, де A означає радикал A2.
20. Спосіб за п. 19, де R^{42} вибирають із водню, галогену, CN, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілу та фенілу, який може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3, 4 або 5 ідентичних або різних замісників R^x , які вибирають із галогену, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси та C_1 - C_4 -галоалкокси.
21. Спосіб за п. 20, де R^{42} вибирають із водню, галогену, CN, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_3 - C_6 -циклоалкілу та C_3 - C_6 -галоциклоалкілу.
22. Спосіб за будь-яким із пп. 19-21, де R^{52} вибирають із групи, що складається із водню, галогену, CN, C_1 - C_{10} -алкілу, C_1 - C_{10} -галоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілметилу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілметилу, C_2 - C_{10} -алкенілу, C_2 - C_{10} -галоалкенілу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_{10} -алкілу, фенілу, бензилу, феноксиметилу, 5- або 6-членного гетарилу, 5- або 6-членного гетарилметилу, де (гетеро)ароматичне кільце 5 згаданих останніми радикалів може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3, 4 або 5 ідентичних або різних замісників R^x , які вибирають із галогену, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкілсульфонілу та C_1 - C_4 -галоалкілсульфонілу.
23. Спосіб за п. 22, де R^{52} вибирають із групи, що складається із водню, галогену, CN, C_1 - C_{10} -алкілу, C_1 - C_{10} -галоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілметилу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілметилу, C_2 - C_{10} -алкенілу, C_2 - C_{10} -галоалкенілу та C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_{10} -алкілу.
24. Спосіб за будь-яким із пп. 19-23, де R^{62} вибирають із групи, що складається із водню, C_1 - C_{10} -алкілу, C_1 - C_{10} -галоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілметилу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілметилу, C_2 - C_{10} -алкенілу, C_2 - C_{10} -галоалкенілу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_{10} -алкілу, фенілу, 5-членного гетарилу, бензилу та феноксиметилу, де ароматичне кільце 4 згаданих останніми радикалів може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3, 4 або 5 ідентичних або різних замісників R^x , які вибирають із галогену, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкілсульфонілу, та C_1 - C_4 -галоалкілсульфонілу.

25. Спосіб за п. 24, де R^{62} означає водень, C_1 - C_4 -алкіл або C_1 - C_4 -галоалкіл.
26. Спосіб за будь-яким із пп. 19-24, де піразольна сполука являє собою сполуку формули I.
27. Спосіб за п. 26, де X^1 у формулі I означає кисень.
28. Спосіб за будь-яким із пп. 1-9, де A означає радикал A3.
- 5 29. Спосіб за п. 28, де R^{43} вибирають із водню, галогену, CN, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілу та фенілу, який може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3, 4 або 5 ідентичних або різних замісників R^x , які вибирають із галогену, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкілсульфонілу, та C_1 - C_4 -галоалкілсульфонілу.
- 10 30. Спосіб за п. 29, де R^{43} вибирають із водню, галогену, CN, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_3 - C_6 -циклоалкілу та C_3 - C_6 -галоциклоалкілу.
31. Спосіб за будь-яким із пп. 28-30, де R^{53} вибирають із групи, що складається із водню, галогену, CN, C_1 - C_{10} -алкілу, C_1 - C_{10} -галоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілметилу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілметилу, C_2 - C_{10} -алкенілу, C_2 - C_{10} -галоалкенілу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_{10} -алкілу, фенілу, бензилу, феноксиметилу, 5- або 6-членного гетарилу, 5- або 6-членного гетарилметилу, де (гетеро)ароматичне кільце 5 згаданих останніми радикалів може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3, 4 або 5 ідентичних або різних замісників R^x , які вибирають із галогену, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкілсульфонілу, та C_1 - C_4 -галоалкілсульфонілу.
- 15 32. Спосіб за п. 31, де R^{53} вибирають із групи, що складається із водню, галогену, CN, C_1 - C_{10} -алкілу, C_1 - C_{10} -галоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілметилу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілметилу, C_2 - C_{10} -алкенілу, C_2 - C_{10} -галоалкенілу або C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_{10} -алкілу.
- 20 33. Спосіб за будь-яким із пп. 28-32, де R^{63} вибирають із групи, що складається із водню, C_1 - C_{10} -алкілу, C_1 - C_{10} -галоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілметилу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілметилу, C_2 - C_{10} -алкенілу, C_2 - C_{10} -галоалкенілу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_{10} -алкілу, фенілу, бензилу, феноксиметилу, 5- або 6-членного гетарилу, 5- або 6-членного гетарилметилу, де (гетеро)ароматичне кільце 5 згаданих останніми радикалів може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3, 4 або 5 ідентичних або різних замісників R^x , які вибирають із галогену, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкілсульфонілу та C_1 - C_4 -галоалкілсульфонілу.
- 25 34. Спосіб за п. 33, де або R^{53} або R^{63} означає водень, C_1 - C_4 -алкіл або C_1 - C_4 -галоалкіл, тоді як інший радикал R^{53} , R^{63} вибирають із групи, що складається із C_1 - C_{10} -алкілу, C_1 - C_{10} -галоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілметилу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілметилу, C_2 - C_{10} -алкенілу, C_2 - C_{10} -галоалкенілу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_{10} -алкілу, фенілу, бензилу, феноксиметилу, 5- або 6-членного гетарилу, 5- або 6-членного гетарилметилу, де (гетеро)ароматичне кільце 5 згаданих останніми радикалів може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3, 4 або 5 ідентичних або різних замісників R^x , які вибирають із галогену, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкілсульфонілу, та C_1 - C_4 -галоалкілсульфонілу.
- 30 35. Спосіб за будь-яким із пп. 28-34, де піразольна сполука являє собою сполуку формули I.
36. Спосіб за п. 35, де X^1 у формулі I означає кисень.
37. Спосіб за будь-яким із попередніх пунктів, де безхребетні шкідники є нематодами.
38. Спосіб за за будь-яким із попередніх пунктів, де безхребетні шкідники є комахами.
- 45 39. Спосіб за п. 38, де безхребетні шкідники є комахами ряду Homoptera.
40. Спосіб за будь-яким із пп. 1-36, де безхребетні шкідники є акаридами.
41. Спосіб захисту матеріалу розмноження рослини і/або рослин, які виростають із нього, який включає обробку насіння пестицидно ефективною кількістю сполуки формул I або II або її сільськогосподарсько прийнятної солі або N-оксиду за будь-яким із пп. 1-36.
- 50 42. Матеріал розмноження рослини, який включає принаймні одну сполуку формул I або II за будь-яким із пп. 1-36 і/або її сільськогосподарсько-прийнятну сіль або N-оксид.
43. Спосіб лікування або захисту тварин від інвазії або інфікування паразитами, який включає приведення тварини у контакт з паразитоцидно ефективною кількістю сполуки формул I або II, або її ветеринарно-прийнятної солі, або N-оксиду за будь-яким із пп. 1-36.
- 55 44. Піразольні сполуки формул I або II



(I)



(II)

де А, X^1 , X^2 , R^1 , R^2 та R^3 приймають значення, визначені в п. 1 та їх солі та N-оксиди, за винятком сполук формули I, де

А означає формулу А2, X^1 означає О, R^1 , R^2 , R^3 , R^{42} та R^{62} кожний означає водень, та R^{52} означає 2-гідроксифеніл, 2-гідрокси-5-метилфеніл, 2-гідрокси-5-етилфеніл, 2-гідрокси-5-хлорфеніл, 2-гідрокси-4,5-диметилфеніл, 2-гідрокси-3,4-диметилфеніл або 2-гідрокси-3,5-диметилфеніл,

А означає формулу А3, X^1 означає О, R^1 , R^2 , R^3 , R^{43} та R^{63} кожний означає водень, та R^{53} означає феніл, 4-фторфеніл, 4-метоксифеніл, 3-бромфеніл, 4-бромфеніл, 4-хлорфеніл, 4-метилфеніл, 4-етоксифеніл, 2,4-диметилфеніл, 2-гідроксифеніл, 2-гідрокси-5-метилфеніл, 2-гідрокси-5-етилфеніл, 2-гідрокси-5-хлорфеніл, 2-гідрокси-4,5-диметилфеніл, 2-гідрокси-3,4-диметилфеніл або 2-гідрокси-3,5-диметилфеніл,

X^1 означає О, R^1 , R^2 та R^3 кожний означає водень та А означає 1-(фенілметил)-3-нітропіразол-5-іл, 1-метил піразол-5-іл, 1-метил-4-хлорпіразол-5-іл, 1-етил-4-бромпіразол-3-іл, 1-етил-3-метилпіразол-4-іл, 1-метил-3-трифторметилпіразол-4-іл, 1-феніл-5-бензоїламінопіразол-4-іл, 1-(4-хлорфеніл)-3-феніламінокарбоніл-5-метилпіразол-4-іл, 1-феніл-5-[(4-метилфеніл)карбоніл]амінопіразол-4-іл, 4-йодпіразол-3-іл, 1-метилпіразол-3-іл, 5-хлор-1-метилпіразол-3-іл, 5-нітропіразол-3-іл, 1-(4-хлорфеніл)-5-трифторметилпіразол-4-іл, 1-феніл-3-тіофен-2-ілпіразол-4-іл, 1-феніл-3,5-диметилпіразол-4-іл, 4-бром-5-нітропіразол-3-іл, 5-циклопропіл-1-(1,1-діоксотетрагідротіофен-3-іл)-1Н-піразол-3-іл;

й також за виключенням наступних сполук:

піридин-3-іламід 1-(4-хлорфеніл)-5-трифторметил-1Н-піразол-4-карбонової кислоти,

піридин-3-іламід 1-феніл-3-тіофен-2-іл-1Н-піразол-4-карбонової кислоти,

піридин-3-іламід 3,5-диметил-1-феніл-1Н-піразол-4-карбонової кислоти,

піридин-3-іламід 5-(4-хлорфеніл)-1-(2,4-дихлорфеніл)-4(2Н-тетразол-5-ілметил)-1Н-піразол-3-карбонової кислоти,

крім того, за виключенням наступних сполук:

сполук формули I, де А означає формулу А3, X^1 означає О, R^1 , R^2 , R^3 та R^{43} кожний означає водень, R^{53} означає 4-піридил та R^{63} означає 3-фторфеніл або 3-хлорфеніл;

сполук формули I, де А означає формулу А3, X^1 означає О, R^1 означає водень, C_1 - C_6 -алкіл або C_1 - C_6 -галоалкіл, R^2 , R^3 , R^{43} та R^{53} кожний означає водень та R^{63} означає $C(Y)R^b$, $C(Y)OR^c$, $S(O)_2R^d$, $C(Y)NR^gR^h$ або $S(O)_mNR^eR^f$, де m означає 2, Y означає О або S, та де R^b , R^c , R^d , R^e , R^f , R^g та R^h приймають значення, визначені в пункті 1; сполук формули I, де А означає формулу А3, X^1 означає О, R^1 , R^2 та R^3 кожний означає водень, R^{43} означає метокси, R^{53} означає 4-хлорфеніл та R^{63} означає 2-хлорфеніл; та

сполук формули I, де А означає формулу А2, X^1 означає О, R^1 , R^2 та R^{42} кожний означає водень, R^3 означає водень або трифторметил, R^{52} означає трет-бутил та R^{62} означає бензил.

45. Сполука за п. 44 формули I.

46. Сполука за п. 44 формули I, де X^1 означає кисень.

47. Сполука за п. 44 формули I, де R^1 означає водень, C_1 - C_{10} -алкіл, CN, C_1 - C_{10} -галоалкіл, C_2 - C_{10} -алкеніл, C_2 - C_{10} -галоалкеніл, C_2 - C_{10} -алкініл, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_{10} -алкіл, C_1 - C_4 -алкілен-CN, OR^a , $C(Y)R^b$, $C(Y)OR^c$ або $S(O)_2R^d$.

48. Сполука за п. 47, де R^1 означає водень, C_1 - C_3 -алкіл або C_1 - C_4 -алкілен-CN.

49. Сполука за будь-яким із пп. 44-48, де R^2 означає водень, метил, дифторметил, трифторметил, метокси, дифторметокси або трифторметокси.

50. Сполука за будь-яким із пп. 44-49, де R^3 означає водень, метил, дифторметил, трифторметил, метокси, дифторметокси або трифторметокси.

51. Сполука за будь-яким із пп. 44-50, де принаймні один із радикалів R^2 або R^3 означає водень.

52. Сполука за будь-яким із пп. 44-51, де обидва радикали R^2 та R^3 означають водень.

53. Сполука за будь-яким із пп. 44-52, де А означає радикал А1.

54. Сполука за п. 53, де R^{41} та R^{51} незалежно вибирають із водню, галогену, CN, C_1 - C_{10} -алкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілу, C_2 - C_{10} -алкенілу та C_2 - C_{10} -алкінілу, де аліфатичні або циклічні фрагменти в 4 згаданих останніми радикалах можуть бути незаміщеними, можуть бути частково або повністю галогенованими або можуть нести 1 або 2 ідентичних або різних замісників R^y .

55. Сполука за п. 53 або 54, де R^{41} та R^{51} вибирають, незалежно один від одного, із водню, галогену, CN, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_3 - C_6 -циклоалкілу та C_3 - C_6 -галоциклоалкілу.
56. Сполука за п. 55, де R^{41} та R^{51} вибирають, незалежно один від одного, із водню, галогену, CN, CH_3 , CH_2F , CHF_2 та CF_3 .
- 5 57. Сполука за будь-яким із пп. 53-56, де або R^{41} або R^{51} означає водень або обидва R^{41} та R^{51} означають водень.
58. Сполука за будь-яким із пп. 53-57, де R^{61} вибирають із групи, що складається із C_1 - C_{10} -алкілу, C_1 - C_{10} -галоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілметилу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілметилу, C_2 - C_{10} -алкенілу, C_2 - C_{10} -галоалкенілу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_{10} -алкілу, фенілу, бензилу, феноксиметилу, 5- або 6-членного гетарилу, 5- або 6-членного гетарилметилу, де (гетеро)ароматичне кільце 5 згаданих останніми радикалів може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3, 4 або 5 ідентичних або різних замісників R^x , які вибирають із галогену, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкілсульфонілу та C_1 - C_4 -галоалкілсульфонілу.
- 10 59. Сполука за п. 58, де R^{61} означає C_1 - C_4 -алкіл або C_1 - C_4 -галоалкіл.
60. Сполука за будь-яким із пп. 53-59, де піразольна сполука являє собою сполуку формули I.
61. Сполука за п. 60, де X^1 означає кисень.
62. Сполука за будь-яким із пп. 44-52, де A означає радикал A2.
63. Сполука за п. 62, де R^{42} вибирають із водню, галогену, CN, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілу та фенілу, який може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3, 4 або 5 ідентичних або різних замісників R^x , які вибирають із галогену, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкілсульфонілу, та C_1 - C_4 -галоалкілсульфонілу.
- 20 64. Сполука за п. 63, де R^{42} вибирають із водню, галогену, CN, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_3 - C_6 -циклоалкілу та C_3 - C_6 -галоциклоалкілу.
- 25 65. Сполука за будь-яким із пп. 62-64, де R^{52} вибирають із групи, що складається із водню, галогену, CN, C_1 - C_{10} -алкілу, C_1 - C_{10} -галоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілметилу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілметилу, C_2 - C_{10} -алкенілу, C_2 - C_{10} -галоалкенілу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_{10} -алкілу, фенілу, бензилу, феноксиметилу, 5- або 6-членного гетарилу, 5- або 6-членного гетарилметилу, де (гетеро)ароматичне кільце 5 згаданих останніми радикалів може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3, 4 або 5 ідентичних або різних замісників R^x , які вибирають із галогену, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкілсульфонілу, та C_1 - C_4 -галоалкілсульфонілу.
- 30 66. Сполука за будь-яким із пп. 62-65, де R^{62} вибирають із групи, що складається із водню, C_1 - C_{10} -алкілу, C_1 - C_{10} -галоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілметилу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілметилу, C_2 - C_{10} -алкенілу, C_2 - C_{10} -галоалкенілу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_{10} -алкілу, фенілу, 5-членного гетарилу, бензилу та феноксиметилу, де ароматичне кільце 4 згаданих останніми радикалів може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3, 4 або 5 ідентичних або різних замісників R^x , які вибирають із галогену, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкілсульфонілу, та C_1 - C_4 -галоалкілсульфонілу.
- 35 67. Сполука за п. 66, де R^{62} означає водень, C_1 - C_4 -алкіл, C_1 - C_4 -галоалкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл або C_3 - C_6 -галоциклоалкіл.
- 40 68. Сполука за будь-яким із пп. 62-67, де піразольна сполука являє собою сполуку формули I.
69. Сполука за п. 68, де X^1 означає кисень.
- 45 70. Сполука за будь-яким із пп. 44-52, де A означає радикал A3.
71. Сполука за п. 70, де R^{43} вибирають із водню, галогену, CN, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілу та фенілу, який може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3, 4 або 5 ідентичних або різних замісників R^x , які вибирають із галогену, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкілсульфонілу та C_1 - C_4 -галоалкілсульфонілу.
- 50 72. Сполука за п. 71, де R^{43} вибирають із водню, галогену, CN, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_3 - C_6 -циклоалкіл та C_3 - C_6 -галоциклоалкілу.
73. Сполука за будь-яким із пп. 70-72, де R^{53} вибирають із групи, що складається із водню, галогену, CN, C_1 - C_{10} -алкілу, C_1 - C_{10} -галоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілметилу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілметилу, C_2 - C_{10} -алкенілу, C_2 - C_{10} -галоалкенілу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_{10} -алкілу, фенілу, бензилу, феноксиметилу, 5- або 6-членного гетарилу, 5- або 6-членного гетарилметилу, де (гетеро)ароматичне кільце 5 згаданих останніми радикалів може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3, 4 або 5 ідентичних або різних замісників R^x , які вибирають із галогену, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкілсульфонілу та C_1 - C_4 -галоалкілсульфонілу.
- 55 60 74. Сполука за п. 73, де R^{53} означає водень, C_1 - C_4 -алкіл, C_1 - C_4 -галоалкіл, C_3 - C_6 -циклоалкіл або C_3 - C_6 -галоциклоалкіл.

74. Сполука за будь-яким із пп. 70-73, де R^{63} вибирають із групи, що складається із водню, C_1 - C_{10} -алкілу, C_1 - C_{10} -галоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілметилу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілметилу, C_2 - C_{10} -алкенілу, C_2 - C_{10} -галоалкенілу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_{10} -алкілу, фенілу, бензилу, феноксиметилу, 5- або 6-членного гетарилу, 5- або 6-членного гетарилметилу, де (гетеро)ароматичне кільце 5 згаданих останніми радикалів може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3, 4 або 5 ідентичних або різних замісників R^x , які вибирають із галогену, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкілсульфонілу, та C_1 - C_4 -галоалкілсульфонілу.
75. Сполука за п. 74, де або R^{53} або R^{63} означає водень, CN, C_1 - C_4 -алкіл або C_1 - C_4 -галоалкіл, тоді як інший радикал R^{53} , R^{63} вибирають із групи, що складається із C_1 - C_{10} -алкілу, C_1 - C_{10} -галоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілу, C_3 - C_{10} -циклоалкілметилу, C_3 - C_{10} -галоциклоалкілметилу, C_2 - C_{10} -алкенілу, C_2 - C_{10} -галоалкенілу, C_1 - C_4 -алкокси- C_1 - C_{10} -алкілу, фенілу, бензилу, феноксиметилу, 5- або 6-членного гетарилу, 5- або 6-членного гетарилметилу, де (гетеро)ароматичне кільце 5 згаданих останніми радикалів може бути незаміщеним або може нести 1, 2, 3, 4 або 5 ідентичних або різних замісників R^x , які вибирають із галогену, C_1 - C_4 -алкілу, C_1 - C_4 -галоалкілу, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -галоалкокси, C_1 - C_4 -алкілсульфонілу, та C_1 - C_4 -галоалкілсульфонілу, де R^{53} також може означати галоген.
76. Сполука за будь-яким із пп. 70-75, де піразольна сполука являє собою сполуку формули I.
77. Сполука за п. 76, де X^1 означає кисень.
78. Сільськогосподарська композиція, яка містить принаймні одну сполуку формул I або II за будь-яким із пп. 44-77 і/або її сільськогосподарсько прийнятну сіль або N-оксид й принаймні один рідкий або твердий носій.

Комп'ютерна верстка Л. Литвиненко

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

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