

R U 2 7 5 8 6 6 7 C 2

РОССИЙСКАЯ ФЕДЕРАЦИЯ



(19) RU (11) 2 758 667⁽¹³⁾ C2

(51) МПК
C07D 401/04 (2006.01)
C07D 401/14 (2006.01)
A01N 43/56 (2006.01)

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ

(52) СПК
C07D 401/04 (2021.08); C07D 401/14 (2021.08); A01N 43/56 (2021.08)

(21)(22) Заявка: 2018125940, 08.12.2016

(24) Дата начала отсчета срока действия патента:
08.12.2016

Дата регистрации:
01.11.2021

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
14.12.2015 US 62/266,844

(43) Дата публикации заявки: 20.01.2020 Бюл. № 2

(45) Опубликовано: 01.11.2021 Бюл. № 31

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 16.07.2018

(86) Заявка РСТ:
US 2016/065577 (08.12.2016)

(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2017/106000 (22.06.2017)

Адрес для переписки:
129090, Москва, ул. Б.Спасская, 25, строение 3,
ООО "Юридическая фирма Городисский и
Партнеры"

(72) Автор(ы):
ЧЖАН Вэньмин (US),
РОССИ Майкл Аллан (US)

(73) Патентообладатель(и):
ФМК КОРПОРЕЙШН (US)

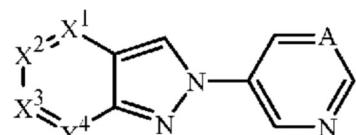
(56) Список документов, цитированных в отчете
о поиске: WO2015038503A1, 19.03.2015.
SURESH KUMAR GORLA et al., "Optimization
of Benzoazole-Based Inhibitors of
Cryptosporidium parvum Inosine 5'-
Monophosphate Dehydrogenase", JOURNAL OF
MEDICINAL CHEMISTRY, т.56, 10, стр.: 4028
- 4043, 2013. RU 2004139033A, 10.01.2006.

(54) ЗАМЕЩЕННЫЕ ПО ГЕТЕРОЦИКЛУ БИЦИКЛИЧЕСКИЕ АЗОЛ ПЕСТИЦИДЫ

(57) Реферат:

Изобретение относится к соединениям
формулы 1, а также к композициям, включающим
соединения формулы 1, и способам борьбы с
беспозвоночным вредителем и применению
соединения по п. 1 для проравливания семян.
Технический результат: получены новые
соединения, которые могут быть применимы для
борьбы с беспозвоночными вредителями. 4 н. и

1 з.п. ф-лы, 2 табл.



1

RUSSIAN FEDERATION



(19) **RU** (11) **2 758 667**⁽¹³⁾ **C2**

(51) Int. Cl.
C07D 401/04 (2006.01)
C07D 401/14 (2006.01)
A01N 43/56 (2006.01)

FEDERAL SERVICE
FOR INTELLECTUAL PROPERTY

(12) ABSTRACT OF INVENTION

(52) CPC
C07D 401/04 (2021.08); C07D 401/14 (2021.08); A01N 43/56 (2021.08)

(21)(22) Application: 2018125940, 08.12.2016

(24) Effective date for property rights:
08.12.2016

Registration date:
01.11.2021

Priority:

(30) Convention priority:

(43) Application published: 20.01.2020 Bull. № 2

(45) Date of publication: 01.11.2021 Bull. № 31

(85) Commencement of national phase: 16.07.2018

(86) PCT application:
US 2016/065577 (08.12.2016)

(87) PCT publication:
WO 2017/106000 (22.06.2017)

Mail address:

129090, Moskva, ul. B.Spasskaya, 25, stroenie 3,
OOO "Yuridicheskaya firma Gorodisskij i
Partnery"

(72) Inventor(s):

ZHANG, Wenming (US),
ROSSI, Michael Alan (US)

(73) Proprietor(s):

**FMC CORPORATION PATENT
ADMINISTRATOR (US)**

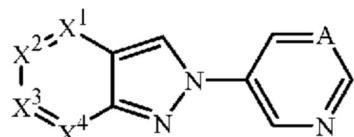
(54) BICYCLIC AZOLE PESTICIDES SUBSTITUTED BY HETERO CYCLE

(57) Abstract:

FIELD: agriculture.

SUBSTANCE: invention relates to compounds of the formula 1, as well as to compositions including compounds of the formula 1, and to methods for the control of an invertebrate pest, and to the use of a compound according to cl. 1 for seed treatment.

EFFECT: new compounds are obtained that can be used for the control of invertebrate pests.



1

5 cl, 2 tbl

ОБЛАСТЬ ТЕХНИКИ, К КОТОРОЙ ОТНОСИТСЯ ИЗОБРЕТЕНИЕ

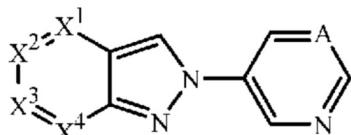
Настоящее изобретение относится к некоторым замещенным бициклическим азолам, их N-оксидам, солям и композициям, пригодным для агрономического и неагрономического применения, и способам их применения для борьбы с беспозвоночными вредителями, такими как членистоногие, в агрономических и неагрономических средах.

УРОВЕНЬ ТЕХНИКИ

Борьба с беспозвоночными вредителями чрезвычайно важна для обеспечения высокой урожайности сельскохозяйственных культур. Повреждение беспозвоночными вредителями растущих и хранящихся агрономических сельскохозяйственных культур может привести к значительному снижению урожайности и тем самым привести к подорожанию для потребителя. Борьба с беспозвоночными вредителями в лесном хозяйстве, парниковых культурах, декоративных растениях, пищевых культурах, хранящихся пищевых и волоконных продуктах, у домашнего скота, в домах, на газонах, пищевых продуктах, и для сохранения здоровья людей и животных также является важной. Для этой цели имеются в продаже многие препараты, но сохраняется необходимость в новых соединениях, которые более эффективны, дешевле, менее токсичны, экологически безопасны или обладают другими путями воздействия.

СУЩНОСТЬ ИЗОБРЕТЕНИЯ

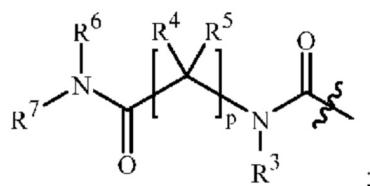
Настоящее изобретение относится к соединениям формулы 1 (включая все геометрические и стереоизомеры), N-оксиды и их соли, и содержащие их композиции, и к их применению для борьбы с беспозвоночными вредителями:



1

в которой

30 А означает CH, CF или N;

X¹ означает CR¹ и X² означает CR² или N; или X¹ означает CR² или N, и X² означает CR¹;X³ означает CR² или N;35 X⁴ означает CR² или N; при условии, что не более, чем один из X¹, X², X³ и X⁴ означает N;R¹ означает

45 каждый R² независимо означает H, галоген, цианогруппу, нитрогруппу, C₁-C₄ алкил, C₁-C₄ галогеналкил, C₁-C₄ алкооксигруппу или C₁-C₄ галогеналкооксигруппу;

R³ означает H, C(O)OR¹⁶, C(O)NR¹³R¹⁴, C(O)R¹⁷, S(O)_nR¹⁸ или Q; или C₁-C₆ алкил,

C_3 - C_6 циклоалкил, C_2 - C_6 алкенил или C_2 - C_6 алкинил, каждый является незамещенным или замещен по меньшей мере одним R^x ;

каждый R^4 независимо означает Н или C_1 - C_4 алкил;

⁵ каждый R^5 независимо означает Н или C_1 - C_4 алкил; или

R^4 и R^5 вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, образуют 3- - 6-членное кольцо, содержащее элементы кольца, выбранные из группы, включающей атомы углерода и до 2 гетероатомов, независимо выбранных из группы, включающей один атом кислорода, один атом серы и до 2 атомов азота, где до 2 элементов кольца атомов углерода независимо выбраны из группы, включающей $C(=O)$ и $C(=S)$, и элемент кольца атом серы выбран из группы, включающей S , $S(O)$ или $S(O)_2$, указанное кольцо является незамещенным или замещено с помощью до 4 R^x ; при условии, что R^4 и R^5 присоединены к одному атому углерода;

¹⁵ равно 1, 2, 3 или 4;

R^6 означает $NR^{13}R^{14}$, OR^{15} или $C(=NR^8)R^9$; или C_1 - C_6 алкил, замещенный по меньшей мере одним R^y ; или C_3 - C_6 циклоалкил, C_2 - C_6 алкенил или C_2 - C_6 алкинил, каждый является незамещенным или замещен по меньшей мере одним R^x ; или Q^a ;

R^7 означает Н, $C(O)R^{17}$ или $S(O)_nR^{18}$; или C_1 - C_6 алкил, C_3 - C_6 циклоалкил, C_2 - C_6 алкенил или C_2 - C_6 алкинил, каждый является незамещенным или замещен по меньшей мере одним R^x ; или фенил или 5- или 6-членное гетероциклическое ароматическое кольцо, каждое является незамещенным или содержит по меньшей мере один заместитель, независимо выбранный из группы, включающей галоген, цианогруппу, нитрогруппу, C_1 - C_4 алкил, C_3 - C_6 циклоалкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_1 - C_4 алcoxигруппу и C_1 - C_4 галогеналкоксигруппу;

³⁰ каждый R^x независимо означает галоген, цианогруппу, нитрогруппу, гидроксигруппу, C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 галогеналкил, C_3 - C_6 циклоалкил, C_1 - C_6 алcoxигруппу, C_1 - C_6 галогеналкоксигруппу, C_3 - C_6 циклоалкоксигруппу, $C(=NR^8)R^9$, $C(O)OR^{16}$, $C(O)NR^{13}R^{14}$, $OC(O)R^{17}$, $NR^{20}R^{21}$, $NR^{19}C(O)R^{17}$, $C(O)R^{17}$, $S(O)_nR^{18}$, $Si(R^{23})_3$, $OSi(R^{23})_3$ или Q ;

³⁵ каждый R^y независимо означает цианогруппу, нитрогруппу, гидроксигруппу, C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 галогеналкил, C_3 - C_6 циклоалкил, C_1 - C_6 алcoxигруппу, C_1 - C_6 галогеналкоксигруппу, C_3 - C_6 циклоалкоксигруппу, $C(=NR^8)R^9$, $C(O)OR^{16}$, $C(O)NR^{13}R^{14}$, $OC(O)R^{17}$, $NR^{20}R^{21}$, $NR^{19}C(O)R^{17}$, $C(O)R^{17}$, $S(O)_nR^{18}$, $Si(R^{23})_3$, $OSi(R^{23})_3$ или Q ;

каждый R^8 независимо означает OR^{10} , $S(O)_nR^{11}$ или NHR^{12} ;

каждый R^9 независимо означает Н; или C_1 - C_6 алкил, C_3 - C_6 циклоалкил, C_2 - C_6 алкенил или C_2 - C_6 алкинил, каждый является незамещенным или замещен по меньшей мере одним R^x ; или C_1 - C_6 алcoxигруппу, C_1 - C_6 галогеналкоксигруппу, C_3 - C_6 циклоалкоксигруппу, $C(O)OR^{16}$, $C(O)NR^{13}R^{14}$, $NR^{20}R^{21}$, $NR^{19}C(O)R^{17}$, $C(O)R^{17}$ или Q ;

каждый R¹⁰ независимо означает C₁-C₄ алкил, C₃-C₆ циклоалкил, C₁-C₄ галогеналкил, C(O)R¹⁷, S(O)_nR¹¹ или Q;

каждый R¹¹ независимо означает C₁-C₄ алкил или C₁-C₄ галогеналкил;

R¹² означает C₁-C₄ алкил, C₃-C₆ циклоалкил, C₁-C₄ галогеналкил, C(O)R¹⁷ или C(O)OR¹⁶; или фенил, незамещенный или содержащий по меньшей мере один заместитель, независимо выбранный из группы, включающей галоген, цианогруппу, нитрогруппу, C₁-C₄ алкил, C₃-C₆ циклоалкил, C₁-C₄ галогеналкил, C₁-C₄ алcoxигруппу и C₁-C₄ галогеналкоксигруппу;

каждый R¹³ независимо означает H, C₁-C₆ алкил, C₁-C₄ галогеналкил, C(O)R²² или S(O)₂R²²; или фенил или 5- или 6-членное гетероциклическое ароматическое кольцо, каждое является незамещенным или содержит по меньшей мере один заместитель, независимо выбранный из группы, включающей галоген, цианогруппу, нитрогруппу, C₁-C₄ алкил, C₃-C₆ циклоалкил, C₁-C₄ галогеналкил, C₁-C₄ алcoxигруппу и C₁-C₄ галогеналкоксигруппу;

каждый R¹⁴ независимо означает H, C₁-C₆ алкил или C₁-C₄ галогеналкил; или

R¹³ и R¹⁴ вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют 3- - 7-членное кольцо, содержащее элементы кольца, выбранные из группы, включающей атомы углерода и до 2 гетероатомов, независимо выбранных из группы, включающей один атом кислорода, один атом серы и до 2 атомов азота, где до 2 элементов кольца атомов углерода независимо выбраны из группы, включающей C(=O) и C(=S), и элемент кольца атом серы выбран из группы, включающей S, S(O) или S(O)₂, указанное кольцо является незамещенным или содержит по меньшей мере один заместитель, независимо выбранный из группы, включающей галоген, цианогруппу, нитрогруппу, C₁-C₄ алкил, C₃-C₆ циклоалкил, C₁-C₄ галогеналкил, C₁-C₄ алcoxигруппу и C₁-C₄ галогеналкоксигруппу;

R¹⁵ is C₁-C₄ алкил, C₃-C₆ циклоалкил или C₁-C₄ галогеналкил; или фенил, незамещенный или содержащий по меньшей мере один заместитель, независимо выбранный из группы, включающей галоген, цианогруппу, нитрогруппу, C₁-C₄ алкил, C₃-C₆ циклоалкил, C₁-C₄ галогеналкил, C₁-C₄ алcoxигруппу и C₁-C₄ галогеналкоксигруппу;

каждый R¹⁶ независимо означает H, C₁-C₄ алкил, C₁-C₄ галогеналкил, C₃-C₆ циклоалкил или C₃-C₆ галогенциклоалкил; или фенил, незамещенный или содержащий по меньшей мере один заместитель, независимо выбранный из группы, включающей галоген, цианогруппу, нитрогруппу, C₁-C₄ алкил, C₃-C₆ циклоалкил, C₁-C₄ галогеналкил, C₁-C₄ алcoxигруппу и C₁-C₄ галогеналкоксигруппу;

каждый R¹⁷ независимо означает C₁-C₄ алкил, C₁-C₄ галогеналкил, C₃-C₆ циклоалкил или C₃-C₆ галогенциклоалкил; или фенил, незамещенный или содержащий по меньшей мере один заместитель, независимо выбранный из группы, включающей галоген, цианогруппу, нитрогруппу, C₁-C₄ алкил, C₃-C₆ циклоалкил, C₁-C₄ галогеналкил, C₁-C₄

алкоксигруппу и C_1 - C_4 галогеналкоксигруппу;

каждый R^{18} независимо означает C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_3 - C_6 циклоалкил,

C_3 - C_6 галогенциклоалкил, C_3 - C_6 циклоалкилалкил или C_3 - C_6 галогенциклоалкилалкил;

или фенил, незамещенный или содержащий по меньшей мере один заместитель, независимо выбранный из группы, включающей галоген, цианогруппу, нитрогруппу, C_1 - C_4 алкил, C_3 - C_6 циклоалкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_1 - C_4 алкоксигруппу и C_1 - C_4 галогеналкоксигруппу;

каждый R^{19} независимо означает C_1 - C_4 алкил;

каждый R^{20} независимо означает H , C_1 - C_4 алкил или C_1 - C_4 галогеналкил; или фенил, незамещенный или содержащий по меньшей мере один заместитель, независимо выбранный из группы, включающей галоген, цианогруппу, нитрогруппу, C_1 - C_4 алкил,

C_3 - C_6 циклоалкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_1 - C_4 алкоксигруппу и C_1 - C_4 галогеналкоксигруппу;

каждый R^{21} независимо означает C_1 - C_4 алкил или C_1 - C_4 галогеналкил; или фенил, незамещенный или содержащий по меньшей мере один заместитель, независимо выбранный из группы, включающей галоген, цианогруппу, нитрогруппу, C_1 - C_4 алкил,

C_3 - C_6 циклоалкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_1 - C_4 алкоксигруппу и C_1 - C_4 галогеналкоксигруппу; или

R^{20} и R^{21} независимо вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют

3- - 7-членное кольцо, содержащее элементы кольца, выбранные из группы, включающей атомы углерода и до 2 гетероатомов, независимо выбранных из группы, включающей один атом кислорода, один атом серы и до 2 атомов азота, где до 2 элементов кольца атомов углерода независимо выбраны из группы, включающей $C(=O)$ и $C(=S)$, и элемент кольца атом серы выбран из группы, включающей S , $S(O)$ или $S(O)_2$, указанное кольцо

является незамещенным или содержит по меньшей мере один заместитель, независимо выбранный из группы, включающей галоген, цианогруппу, нитрогруппу, C_1 - C_4 алкил, C_3 - C_6 циклоалкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_1 - C_4 алкоксигруппу и C_1 - C_4 галогеналкоксигруппу;

каждый R^{22} независимо означает C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 галогеналкил, C_1 - C_6

алкоксигруппу, C_1 - C_6 галогеналкоксигруппу или $NR^{24}R^{25}$; или фенил или 5- или 6-членное гетероциклическое ароматическое кольцо, каждое является незамещенным или содержит по меньшей мере один заместитель, независимо выбранный из группы, включающей галоген, цианогруппу, нитрогруппу, C_1 - C_4 алкил, C_3 - C_6 циклоалкил, C_1 - C_4

галогеналкил, C_1 - C_4 алкоксигруппу и C_1 - C_4 галогеналкоксигруппу;

каждый R^{23} независимо означает C_1 - C_6 алкил, C_3 - C_6 циклоалкил или фенил;

каждый R^{24} независимо означает H или Q ; или C_1 - C_6 алкил, C_3 - C_6 циклоалкил, C_2 - C_6 алкенил или C_2 - C_6 алкинил, каждый является незамещенным или содержит по меньшей мере один заместитель, независимо выбранный из группы, включающей галоген, цианогруппу, нитрогруппу, C_1 - C_4 алкил, C_3 - C_6 циклоалкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_1 - C_4 алкоксигруппу и C_1 - C_4 галогеналкоксигруппу;

каждый R²⁵ независимо означает H или Q; или C₁-C₆ алкил, C₃-C₆ циклоалкил, C₂-C₆ алкенил или C₂-C₆ алкинил, каждый является незамещенным или содержит по меньшей мере один заместитель, независимо выбранный из группы, включающей галоген, 5 цианогруппу, нитрогруппу, C₁-C₄ алкил, C₃-C₆ циклоалкил, C₁-C₄ галогеналкил, C₁-C₄ аллоксигруппу и C₁-C₄ галогеналкоксигруппу; или

R²⁴ и R²⁵ вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют 3- - 10-членное кольцо, содержащее элементы кольца, выбранные из группы, включающей 10 атомы углерода и до 2 гетероатомов, независимо выбранных из группы, включающей один атом кислорода, один атом серы и до 2 атомов азота, где до 2 элементов кольца атомов углерода независимо выбраны из группы, включающей C(=O) и C(=S), и элемент кольца атом серы выбран из группы, включающей S, S(O) или S(O)₂, указанное кольцо 15 является незамещенным или замещено с помощью до 4 заместителей, независимо выбранных из группы, включающей галоген, цианогруппу, нитрогруппу, C₁-C₄ алкил, C₃-C₆ циклоалкил, C₁-C₄ галогеналкил, C₁-C₄ аллоксигруппу и C₁-C₄ галогеналкоксигруппу;

каждый Q независимо означает фенил, 5- или 6-членное гетероциклическое ароматическое кольцо, или 3- - 6-членное гетероциклическое неароматическое кольцо, 20 каждое кольцо содержит элементы кольца, выбранные из группы, включающей атомы углерода и до 2 гетероатомов, независимо выбранных из группы, включающей один атом кислорода, один атом серы и до 2 атомов азота, где до 2 элементов кольца атомов углерода независимо выбраны из группы, включающей C(=O) и C(=S), и элемент кольца атом серы выбран из группы, включающей S, S(O) или S(O)₂, каждое кольцо 25 является незамещенным или содержит по меньшей мере один заместитель, независимо выбранный из группы, включающей галоген, цианогруппу, нитрогруппу, C₁-C₄ алкил, C₃-C₆ циклоалкил, C₁-C₄ галогеналкил, C₁-C₄ аллоксигруппу и C₁-C₄ галогеналкоксигруппу;

Q^a означает 3- - 6-членное неароматическое кольцо, содержащее элементы кольца, выбранные из группы, включающей атомы углерода и до 2 гетероатомов, независимо выбранных из группы, включающей один атом кислорода, один атом серы и до 2 атомов азота, где до 2 элементов кольца атомов углерода независимо выбраны из группы, включающей C(=O) и C(=S), и элемент кольца атом серы выбран из группы, включающей S, S(O) или S(O)₂, каждое кольцо 35 является незамещенным или содержит по меньшей мере один заместитель, независимо выбранный из группы, включающей галоген, цианогруппу, нитрогруппу, C₁-C₄ алкил, C₃-C₆ циклоалкил, C₁-C₄ галогеналкил, C₁-C₄ аллоксигруппу и C₁-C₄ галогеналкоксигруппу; и

каждый n независимо равен 0, 1 или 2.

Настоящее изобретение также относится к композиции, включающей соединение формулы 1, его N-оксид или соль и по меньшей мере один дополнительный компонент, выбранный из группы, включающей поверхностно-активные вещества, твердые разбавители и жидкие разбавители. В одном варианте осуществления настояще 40 изобретение также относится к композиции для борьбы с беспозвоночным вредителем, включающей соединение формулы 1, его N-оксид или соль и по меньшей мере один дополнительный компонент, выбранный из группы, включающей поверхностно-активные вещества, твердые разбавители и жидкие разбавители, указанная композиция 45 необязательно дополнительно содержит по меньшей мере одно дополнительное

биологически активное соединение или средство.

Настоящее изобретение относится к способу борьбы с беспозвоночным вредителем, включающему взаимодействие беспозвоночного вредителя или окружающей его среды с биологически эффективным количеством соединения формулы 1, его N-оксида или соли, (например, в виде композиции, описанной в настоящем изобретении). Настоящее изобретение также относится к такому способу, в котором беспозвоночный вредитель или окружающую его среду вводят во взаимодействие с композицией, включающей биологически эффективное количество соединения формулы 1, его N-оксида или соли и по меньшей мере один дополнительный компонент, выбранный из группы, включающей поверхностно-активные вещества, твердые разбавители и жидкые разбавители, указанная композиция необязательно дополнительно содержит биологически эффективное количество по меньшей мере одного дополнительное биологически активное соединение или средство.

Настоящее изобретение также относится к способу защиты семян от беспозвоночного вредителя, включающему взаимодействие семян с биологически эффективным количеством соединения формулы 1, его N-оксида или соли, (например, в виде композиции, описанной в настоящем изобретении). Настоящее изобретение также относится к проправленным семенам.

ПОДРОБНОЕ ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ

При использовании в настоящем изобретении термины "содержит", "содержащий", "включает", "включающий", "имеет", "имеющий", "характеризующийся" или любые другие их варианты охватывают неисключительные включения, объект любого ограничения указан явно. Например, композиция, смесь, методика или способ, который включает перечень элементов необязательно ограничивается только этими элементами, а может включать другие элементы, явно не указанные или присущие такой композиции, смеси, методике или способу.

Переходное выражение "состоящий из" исключает любой не указанный элемент, стадию или ингредиент. В утверждении так заканчивается выражение о включении материалов, кроме указанных, за исключением примесей, обычно связанных с ними. Если выражение "состоящий из" содержится в разделе внутри выражения, а не сразу после начала, оно ограничивает только элемент, указанный в этом разделе; другие элементы не исключены из выражения в целом.

Переходное выражение "состоящий в основном из" используется для определения композиции или способа, который включает материалы, стадии, признаки, компоненты или элементы в дополнение к дословно раскрытым при условии, что эти дополнительные материалы, стадии, признаки, компоненты или элементы существенно не влияют на базовую и новую характеристику (характеристики) заявленного изобретения. Термин "состоящий в основном из" обладает промежуточным значением между терминами "включающий" и "состоящий из".

Когда заявители определили изобретение или его часть с помощью допускающего изменения термина, такого как "включающий", следует четко понимать, что (если не указано иное) описание следует понимать, как также описывающее такое изобретение с помощью терминов "состоящий в основном из" или "состоящий из".

Кроме того, если явно не указано иное, "или" означает включающее, а не исключающее "или". Например, условие А или В выполняется в любом из следующих случаев: А означает истинно (или содержится) и В означает ложно (или не содержится), А означает ложно (или не содержится) и В означает истинно (или содержится), и оба А и В означают истинно (или содержатся).

Кроме того, указание элемента или компонента в единственном числе не ограничивает количество случаев (т.е. появления) элемента или компонента. Поэтому указание в единственном числе следует понимать, как включающий один или по меньшей мере один, и указание элемента или компонента в единственном числе также включает

5 множественное число, если количество очевидно не является единичным.

В настоящем изобретении термин "беспозвоночный вредитель" включает экономически важных в качестве вредителей членистоногих, брюхоногих, нематод и гельминтов. Термин "членистоногое" включает насекомых, клещей, пауков, скорпионов, сороконожек, многоножек, мокриц свертывающихся и сидячебрюхих. Термин

10 "брюхоногое" включает улиток, слизней и других *Stylommatophora*. Термин "нематода" включает представителей типа *Nematoda*, такие как растительноядные нематоды и гельминты и нематоды, паразитирующие на животных. Термин "гельминт" включает всех паразитических червей, такие как круглые черви (тип *Nematoda*), сердечные черви (тип *Nematoda*, класс *Secernentea*), трематоды (тип *Platyhelminthes*, класс *Tematoda*),

15 скребни (тип *Acanthocephala*) и ленточные черви (тип *Platyhelminthes*, класс *Cestoda*).

В настоящем изобретении "борьба с беспозвоночным вредителем" означает подавление развития беспозвоночного вредителя (включая гибель, сокращение питания и/или нарушение спаривания), и родственные проявления определяются аналогично.

Термин "агрономические" относится к продукции полевых культур, такой как

20 пищевые продукты и волокна, и включает выращивание маиса или кукурузы, сои и других бобовых, риса, злаков (например, пшеницы, овса, ячменя, ржи и риса), листовых овощей (например, латука, капусты и других капустных культур), плодовых овощей (например, томатов, перца, баклажанов, крестоцветных и тыквенных), картофеля, батата, винограда, хлопчатника, плодовых деревьев (например, яблони, косточковых

25 и цитрусовых), ягодников (например, ягодников и вишен) и других специальных культур (например, канолы, подсолнечника и олив).

Термин "неагрономические" относится к неполевым культурам, таким как садовые культуры (например, тепличные, питомниковые или декоративные растения, не выращиваемые в поле), к применению в жилых, сельскохозяйственных, коммерческих

30 и промышленных сооружениях, дерну (например, фирма по производству дерна, выгон, поле для гольфа, теннисный корт, спортивная площадка и т.п.), продуктам из древесины, хранящимся продуктам, агролесомелиорации и управлению растительностью, общественному здравоохранению (т.е. здоровью людей и животных (например, одомашненных животных, таких как комнатные животные, домашний скот и птица,

35 неодомашненные животные, таких как дикие животные).

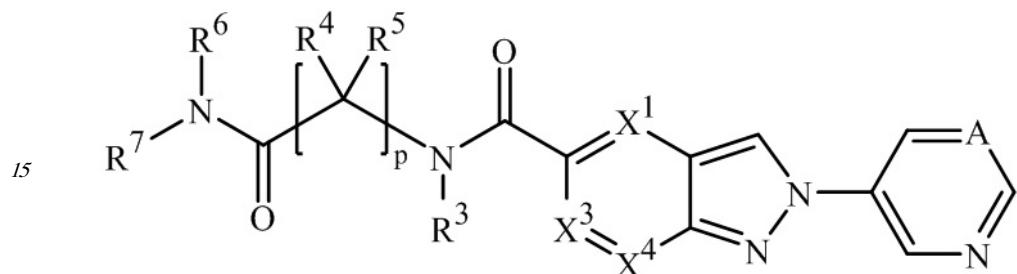
Термин "мощность культуры" означает степень роста или накопления биомассы сельскохозяйственного растения. "Увеличение мощности" означает увеличение роста или накопления биомассы в сельскохозяйственном растении по сравнению с необработанным контрольным сельскохозяйственным растением. Термин "урожайность

40 сельскохозяйственной культуры" означает возврат материала сельскохозяйственной культуры по количеству и качеству, полученный после сбора сельскохозяйственного растения. "Увеличение урожайности сельскохозяйственной культуры" означает увеличение урожайности сельскохозяйственной культуры по сравнению с необработанным контрольным сельскохозяйственным растением.

45 Термин "биологически эффективное количество" означает количество биологически активного соединения (например, соединения формулы 1), достаточное для оказания биологического воздействия при нанесении на (т.е. взаимодействии с) беспозвоночного вредителя, с которым проводят борьбу, или окружающую его среду, или на растение,

семя, из которого вырастает растение, или место произрастания растения (например, среду для выращивания) для защиты растения от повреждения беспозвоночным вредителем или для другого желательного эффекта (например, увеличения мощности растения).

5 Волнистая линия во фрагменте структуры указывает положение присоединения фрагмента к остальной части молекулы. Например, если переменная X^2 в формуле 1 определена, как CR^1 , волнистая линия, делящая пополам связь с R^1 , показывает, что R^1 присоединен к остальной части структуры формулы 1 в указанном положении, как 10 показано ниже.



В структуре формулы 1 переменные X^1 , X^2 , X^3 и X^4 определены следующим образом: 20 X^1 означает CR^1 и X^2 означает CR^2 или N; или X^1 означает CR^2 или N, и X^2 означает CR^1 ; X^3 означает CR^2 или N; и X^4 означает CR^2 или N; при условии, что не более, чем один из X^1 , X^2 , X^3 и X^4 означает N.

25 Это определение X^1 , X^2 , X^3 и X^4 описывает 8 возможных комбинаций X^1 , X^2 , X^3 и X^4 , приведенных ниже в таблице.

Комбинация	X^1	X^2	X^3	X^4
1	CR^1	CR^2	CR^2	CR^2
2	CR^1	CR^2	CR^2	N
3	CR^1	CR^2	N	CR^2
4	CR^1	N	CR^2	CR^2
5	CR^2	CR^1	CR^2	CR^2
6	CR^2	CR^1	CR^2	N
7	CR^2	CR^1	N	CR^2
8	N	CR^1	CR^2	CR^2

30 В указанных выше случаях термин "алкил" при использовании по отдельности или в названиях соединений, таких как "алкилтиогруппа" или "галогеналкил", включают обладающий линейной или разветвленной цепью алкил, такой как, метил, этил, н-пропил, изопропил, или разные изомеры бутила, пентила или гексила. "Алкенил" включает обладающие линейной или разветвленной цепью алкены, такие как этенил, 1-пропенил, 2-пропенил, и разные изомеры бутенила, пентенила и гексенила. "Алкенил" также включает полиены, такие как 1,2-пропадиенил и 2,4-гексадиенил. "Алкинил" включает обладающие линейной или разветвленной цепью алкины, такие как этинил, 1-пропинил, 2-пропинил и разные изомеры бутинила, пентинила и гексинила. "Алкинил" также 45 может включать фрагменты, содержащие несколько тройных связей, такие как 2,5-гексадиинил.

40 "Алcoxигруппа" включает, например, метоксигруппу, этоксигруппу, н-

пропилоксигруппу, изопропилоксигруппу и разные изомеры бутоксигруппы, пентоксигруппы и гексилоксигруппы. "Алкилтиогруппа" включает обладающие линейной или разветвленной цепью алкилтиольные фрагменты, такие как метилтиогруппу, этилтиогруппу, и разные изомеры пропилтиогруппы, бутилтиогруппы, пентилтиогруппы и гексилтиогруппы.

5 "Циклоалкил" включает, например, циклопропил, циклобутил, циклопентил и циклогексил.

Термин "галоген" при использовании по отдельности или в названиях соединений, таких как "галогеналкил", или при использовании в описаниях, таких как "алкил,

10 замещенный галогеном", включает фтор, хлор, бром или йод. Кроме того, при использовании в названиях соединений, таких как "галогеналкил", или при использовании в описаниях, таких как "алкил, замещенный галогеном", указанный алкил может быть частично или полностью замещен атомами галогенов, которые могут быть одинаковыми или разными. Примеры "галогеналкила" или "алкила, замещенного 15 галогеном" включают F_3C , $ClCH_2$, CF_3CH_2 и CF_3CCl_2 . Термины "галогеналкоксигруппа", "галогеналкилтиогруппа", "галогеналкенил", "галогеналкинил" и т.п., определены аналогично термину "галогеналкил". Примеры "галогеналкоксигруппы" включают CF_3O^- , $CCl_3CH_2O^-$, $HCF_2CH_2CH_2O^-$ и $CF_3CH_2O^-$. Примеры "галогеналкилтиогруппы" включают CCl_3S^- , CF_3S^- , $CCl_3CH_2S^-$ и $ClCH_2CH_2CH_2S^-$.

20 Химические аббревиатуры $S(O)$ и $S(=O)$ при использовании в настоящем изобретении означают сульфинильный фрагмент. Химические аббревиатуры SO_2 , $S(O)_2$ $S(=O)_2$ при использовании в настоящем изобретении означают сульфонильный фрагмент.

Химические аббревиатуры $C(O)$ и $C(=O)$ при использовании в настоящем изобретении 25 означают карбонильный фрагмент. Химические аббревиатуры CO_2 , $C(O)O$ и $C(=O)O$ при использовании в настоящем изобретении означают оксикарбонильный фрагмент. " CHO " означает формил.

30 Полное количество атомов углерода в замещающей группе показывает префикс " C_i-C_j ". Например, C_1-C_6 алкил означает метил, этил и разные изомеры пропила, бутила, пентила и гексила.

Если не указано иное, "кольцо", как компонент формулы 1 (например, заместитель R^X , где R^X означает Q) является карбоциклическим или гетероциклическим. Термин "элемент кольца" означает атом или другой фрагмент (например, $C(=O)$, $C(=S)$, $S(O)$ 35 или $S(O)_2$), образующий основную цепь кольца.

Термины "карбоциклическое кольцо", "карбоцикл" или "карбоциклическая кольцевая система" означают кольцо, в котором атомы, образующие основную цепь кольца, являются только атомами углерода. Термины "гетероциклическое кольцо" или "гетероцикл" означают кольцо, в котором по меньшей мере один атом, образующий 40 основную цепь кольца, не является углеродом, например, азот, кислород или сера. Обычно гетероциклическое кольцо содержит не более 4 атомов азота, не более 2 атомов кислорода и не более 2 атомов серы. При использовании в настоящем изобретении выражение "до 2 гетероатомов" означает 0, 1 или 2 гетероатома; аналогичным образом, выражение "до 2 атомов углерода - элементов кольца" означает 0, 1 или 2 атома углерода 45 - элементов кольца.

Если не указано иное, карбоциклическое кольцо или гетероциклическое кольцо может представлять собой насыщенное или ненасыщенное кольцо. "Насыщенное" означает кольцо, обладающее основной цепью, состоящей из атомов, связанных друг с другом

ординарными связями; если не указано иное, валентности остальных атомов заняты атомами водорода. Если не указано иное, "ненасыщенное кольцо" может быть частично ненасыщенным или полностью ненасыщенным. Выражение "полностью ненасыщенное кольцо" означает кольцо из атомов, в котором связи между атомами кольца являются 5 ординарными или двойными связями в соответствии с теорией валентной связи и, кроме того, связи между атомами кольца включают столько двойных связей, сколько это возможно без образования кумулированных двойных связей (т.е. без $C=C=C$ или $C=C=N$). Термин "частично ненасыщенное кольцо" означает кольцо, содержащее по меньшей мере один элемент кольца, связанный с соседним элементом кольца двойной связью и 10 которое может включать некоторое количество некумулированных двойных связей между соседними элементами кольца (т.е. в своей полностью ненасыщенной эквивалентной форме), которое больше имеющихся двойных связей (т.е. в своей частично ненасыщенной форме).

Если не указано иное, гетероциклические кольца и кольцевые системы могут быть

15 связаны с помощью любого доступного атома углерода или азота путем замещения атома водорода у указанного атома углерода или азота.

"Ароматическое" показывает, что все атомы кольца находятся в основном в одной плоскости и обладают p-орбиталью, перпендикулярной плоскости кольца, и в котором имеются $(4n+2)\pi$ -электрона, где n является положительным целым числом, связаны с 20 кольцом в соответствии с правилом Хюккеля. Если полностью ненасыщенное гетероциклическое кольцо удовлетворяет правилу Хюккеля, то указанное кольцо также называется "гетероароматическим кольцом" или "ароматическим гетероциклическим кольцом".

Термин "необязательно замещенный" в связи с гетероциклическим кольцом означает

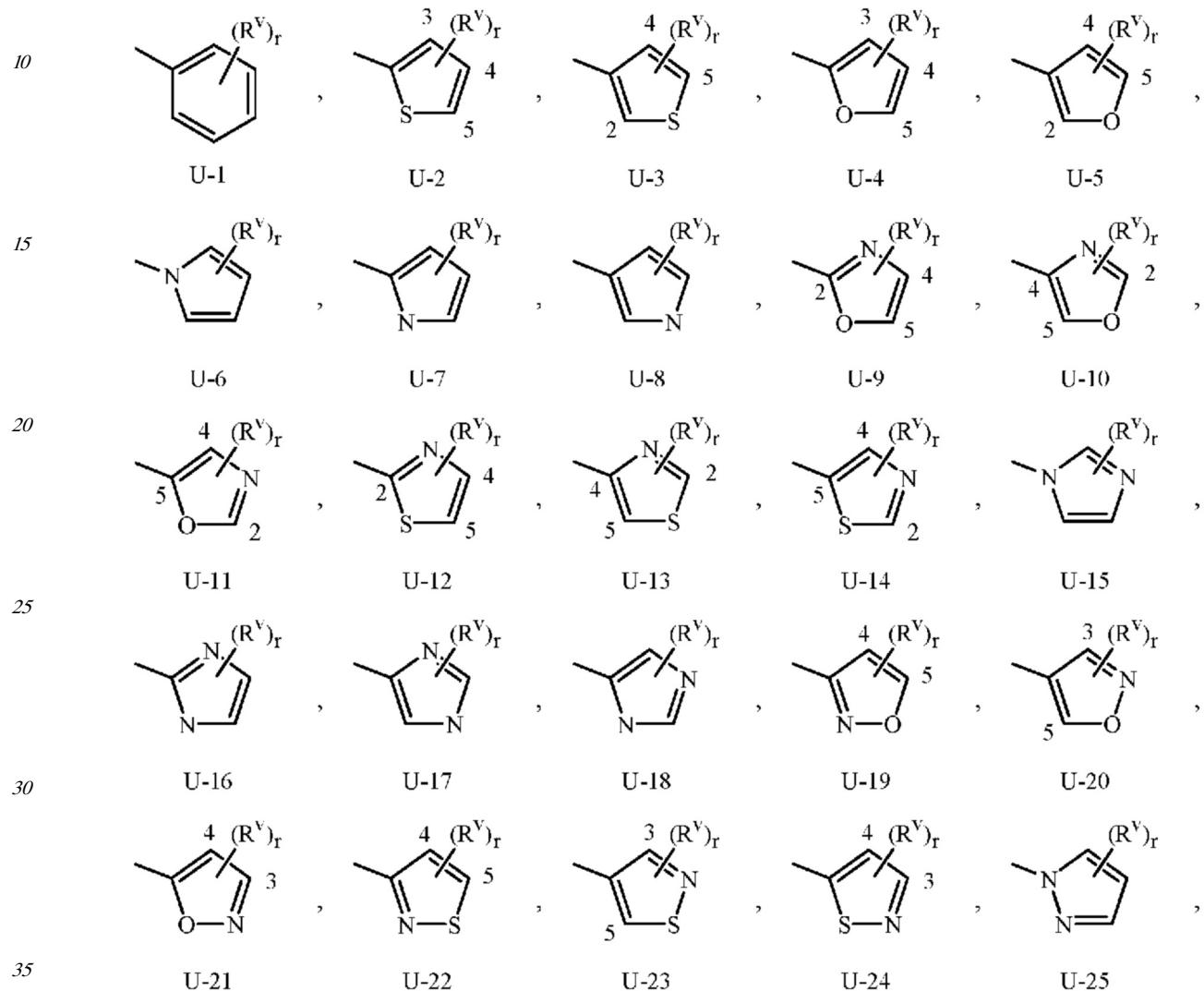
25 группы, которые являются незамещенными или содержат по меньшей мере один не являющийся водородом заместитель, который не нарушает биологическую активность, которой обладает незамещенный аналог. При использовании в настоящем изобретении используются следующие определения, если не указано иное. Термин "необязательно замещенный" используется взаимозаменяемым образом с выражением "замещенный" 30 или незамещенный" или с термином "(не)замещенный." Если не указано иное, необязательно замещенная группа может содержать заместитель в каждом пригодном для замещения положении группы и каждое замещение не зависит от другого.

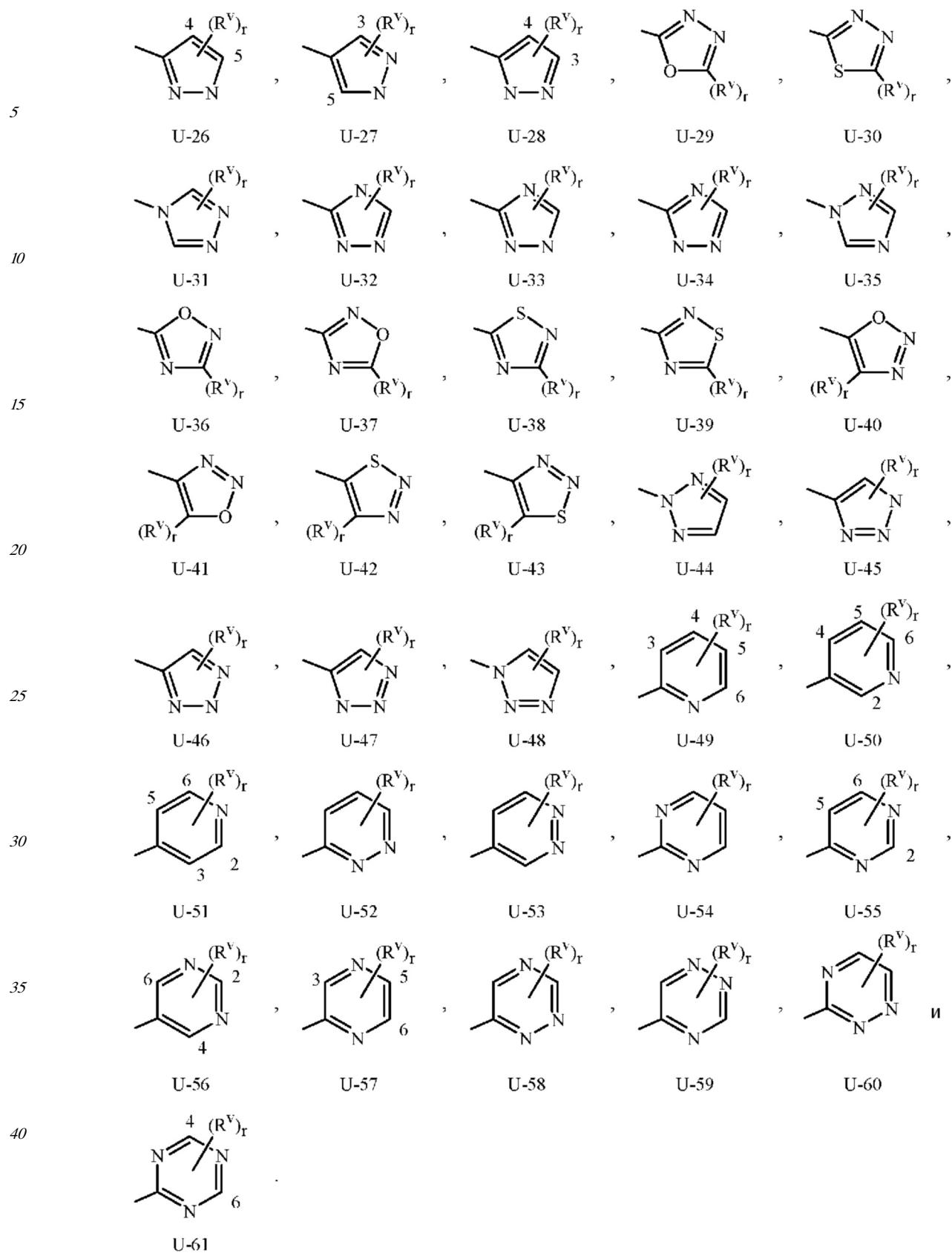
Если заместителем является 5- или 6-членное азотсодержащее гетероциклическое кольцо, оно может быть присоединено к остатку соединения формулы 1 через любой 35 доступный кольцевой атом углерода или азота, если не указано иное. Как отмечено выше, может (в частности) означать фенил, необязательно содержащий один или большее количество заместителей, выбранных из группы заместителей, определенной в Сущности изобретения. Примером фенила, необязательно содержащего от 1 до 5 заместителей, является кольцо, показанное под обозначением U-1 в приложении 1, где 40 R^V означает R^X , как определено в Сущности изобретения для Q, и g является целым числом, равным от 0 до 5.

Как отмечено выше, Q может (в частности) означать 5- или 6-членное гетероциклическое ароматическое кольцо, необязательно содержащее один или большее количество заместителей, выбранных из группы заместителей, определенной в Кратком 45 изложении сущности изобретения. Примеры 5- или 6-членного ненасыщенного ароматического гетероциклического кольца, необязательно содержащего один или большее количество заместителей, включают кольца U-2 - U-61, приведенные в приложении 1, где R^V означает любой заместитель, определенный в Сущности

изобретения для Q, и r является целым числом, равным от 0 до 4, ограниченным количеством доступных положений у каждой группы U. Поскольку U-29, U-30, U-36, U-37, U-38, U-39, U-40, U-41, U-42 и U-43 содержат только одно доступное положение, r для этих групп U ограничено целыми числами 0 или 1, и r, равное 0, означает, что 5 группа U является незамещенной и водород находится в положении, указанном с помощью $(R^V)_r$.

Приложение 1





45 Хотя группы R^V указаны в структурах U-1 - U-61, следует отметить, что они не обязательно содержатся, поскольку они являются необязательными заместителями. Следует отметить, что, если R^V означает H при присоединении к атому, это означает, что указанный атом является незамещенным. Атомы азота, для заполнения валентностей

которых необходимо замещение, замещены с помощью H или R^V. Следует отметить, что, если положение присоединения между (R^V)_r и группой U показано, как переменное, (R^V)_r может быть присоединен к любому доступному атому углерода или атому азота группы U. Следует отметить, что, если положение присоединения группы U показано, как переменное, группа U может быть присоединена к остальной части формулы 1 через любой доступный атом углерода или атом азота группы U путем замещения атома азота. Следует отметить, что некоторые группы U могут быть замещены лишь с помощью менее 4 групп R^V (например, U-2 - U-5, U-7 - U-48 и U-52 - U-61).

Самые различные методики синтеза известны в данной области техники для получения ароматических и неароматических гетероциклических колец и кольцевых систем; подробный обзор приведен в 8-томной публикации *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, A. R. Katritzky and C. W. Rees editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1984 и 12-томной публикации *Comprehensive Heterocyclic Chemistry II*, A. R. Katritzky, C. W. Rees and E. F. V. Scriven editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1996.

Соединения, предлагаемые в настоящем изобретении, могут существовать в виде одного или большего количества стереоизомеров. Различные стереоизомеры включают энантиомеры, диастереоизомеры, атропоизомеры и геометрические изомеры. Стереоизомеры являются изомерами одинакового состава, но различаются расположением атомов в пространстве и включают энантиомеры, диастереоизомеры, цис-транс-изомеры (также известные как геометрические изомеры) и атропоизомеры. Атропоизомеры образуются вследствие ограниченного вращения вокруг ординарных связей, когда барьер вращения достаточно высок, чтобы обеспечить выделение изомерных частиц. Специалист в данной области техники должен знать, что один стереоизомер может быть более активным и/или может оказывать благоприятное воздействие при его избытке по сравнению с другим стереоизомером (стереоизомерами) или в случае отделения от другого стереоизомера (стереоизомеров). Кроме того, специалист знает, как разделить, увеличить содержание и/или селективно приготовить указанные стереоизомеры. Подробное обсуждение всех аспектов стереоизомерии см. Ernest L. Eliel and Samuel H. Wilen, *Stereochemistry of Organic Compounds*, John Wiley & Sons, 1994.

Настоящее изобретение включает все стереоизомеры, конформационные изомеры и их смеси во всех отношениях, а также изотопозамещенные формы, такие как дейтерированные соединения.

Специалист в данной области техники должен понимать, что не все азотсодержащие гетероциклы могут образовывать N-оксиды, поскольку для окисления в оксид необходима неподеленная электронная пара атома азота; специалисту в данной области техники должны быть известны азотсодержащие гетероциклы, которые могут образовывать N-оксиды. Специалист в данной области техники также должен понимать, что третичные амины могут образовывать N-оксиды. Методики синтеза для получения N-оксидов гетероциклов и третичных аминов очень хорошо известны специалисту в данной области техники, включая окисление гетероциклов и третичных аминов пероксикислотами, такими как надуксусная и 3-хлорпербензойная кислота (МСРВА), пероксид водорода, алкилгидропероксиды, такие как трет-бутилгидропероксид, перборат натрия и диоксираны, такие как диметилдиоксиран. Эти методики получения N-оксидов подробно описаны в литературе и имеются обзоры, см., например: T. L. Gilchrist in *Comprehensive Organic Synthesis*, vol. 7, pp 748-750, S. V. Ley, Ed., Pergamon

Press; M. Tisler and B. Stanovnik in *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, vol. 3, pp 18-20, A. J. Boulton and A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M. R. Grimmett and B. R. T. Keene in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 43, pp 149-161, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler and B. Stanovnik in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 9, pp 285-291, A. R.

5 Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press; и G. W. H. Cheeseman and E. S. G. Werstiuk in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 22, pp 390-392, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press.

Специалист в данной области техники должен понимать, что, поскольку в среде и при физиологических условиях соли химических соединений находятся в равновесии с 10 соответствующими их несолевыми формами, соли обладают биологической применимостью несолевых форм. Таким образом, имеется много солей соединений формулы 1, применимых для борьбы с беспозвоночными вредителями. Соли соединений формулы 1 включают соли присоединения с неорганическими или органическими кислотами, такими как бромистоводородная, хлористоводородная, азотная, фосфорная, 15 серная, уксусная, масляная, фумаровая, молочная, малеиновая, щавелевая, пропионовая, салициловая, винная, 4-толуолсульфоновая или валериановая кислота. Если соединение формулы 1 содержит кислотный фрагмент, например, карбоксигруппу или фенольную группу, соли также включают образованные с органическими или неорганическими основаниями, такими как пиридин, триэтиламин или амимиак, или амидами, гидридами, 20 гидроксидами или карбонатами натрия, калия, лития, кальция, магния или бария. Соответственно, настоящее изобретение относится к соединениям, выбранным из числа соединений формулы 1, их N-оксидов и подходящих солей.

Соединения формулы 1, их стереоизомеры, таутомеры, N-оксиды и соли обычно существуют более, чем в одной форме и, таким образом, формула 1 включает все 25 кристаллические и некристаллические формы соединений, которые описываются формулой 1. Некристаллические формы включают варианты осуществления, которые являются твердыми веществами, такими как воска и камеди, а также варианты осуществления, которые являются жидкостями, такими как растворы и расплавы. Кристаллические формы включают варианты осуществления, которые представляют 30 собой в основном монокристаллический тип, и варианты осуществления, которые представляют собой смесь полиморфных форм (т.е. разных кристаллических типов). Термин "полиморфная форма" означает конкретную кристаллическую форму химического соединения, которая может кристаллизоваться в разных кристаллических формах, эти формы обладают разным расположением и/или конформациями молекул 35 в кристаллической решетке. Хотя полиморфные формы могут обладать одинаковым химическим составом, они также могут различаться по составу вследствие присутствия или отсутствия совместно закристаллизованной воды или других молекул, которые могут быть слабо или сильно связаны в решетке. Полиморфные формы могут различаться по таким химическим, физическим и биологическим характеристикам, как 40 форма кристалла, плотность, твердость, цвет, химическая стабильность, температура плавления, гигроскопичность, суспендируемость, скорость растворения и биологическая доступность. Специалист в данной области техники должен знать, что полиморфная форма соединения формулы 1 может обладать более благоприятными характеристиками (например, пригодность для получения полезных препаратов, улучшенные 45 биологические характеристики) чем другая полиморфная форма или смесь полиморфных форм того же соединения формулы 1. Получение и выделение конкретной полиморфной формы соединения формулы 1 можно провести по методикам, известным специалистам в данной области техники, включая, например, кристаллизацию использование

подобранных растворителей и температур. Соединения, предлагаемые в настоящем изобретении, могут существовать в виде одной или большего количества кристаллических полиморфных форм. Настоящее изобретение включает и отдельные полиморфные формы, и смеси полиморфных форм, включая смеси, обогащенные одной 5 полиморфной формой по сравнению с другими. Подробное обсуждение полиморфизма см. R. Hilfiker, Ed., *Polymorphism In the Pharmaceutical Industry*, Wiley-VCH, Weinheim, 2006.

Варианты осуществления настоящего изобретения, описанные в Сущности изобретения включают описанные ниже. В приведенных ниже вариантах осуществления 10 указание на "соединение формулы 1" включает определения заместителей, приведенные в Сущности изобретения, если иначе не определено в вариантах осуществления.

Вариант осуществления 1. Соединение формулы 1, в которой А означает СF или N.

Вариант осуществления 2. Соединение формулы 1, в которой А означает СН или СF.

Вариант осуществления 3. Соединение формулы 1, в которой А означает СН.

Вариант осуществления 4. Соединение формулы 1, в которой А означает N.

15 Вариант осуществления 5. Соединение формулы 1, в которой X¹ означает СR¹.

Вариант осуществления 5a. Соединение формулы 1, в которой X² означает СR².

Вариант осуществления 5b. Соединение формулы 1, в которой X² означает СН.

Вариант осуществления 5c. Соединение формулы 1, в которой X² означает N.

20 20 Вариант осуществления 5d. Соединение формулы 1, в которой X¹ означает СR¹ и X² означает СR².

Вариант осуществления 5d. Соединение формулы 1, в которой X¹ означает СR¹ и X² означает СН.

25 25 Вариант осуществления 5d. Соединение формулы 1, в которой X¹ означает СR¹ и X² означает N.

Вариант осуществления 6. Соединение формулы 1, в которой X¹ означает СR².

30 30 Вариант осуществления 6a. Соединение формулы 1, в которой X² означает СR¹.

Вариант осуществления 6b. Соединение формулы 1, в которой X¹ означает СR² и X² означает СR¹.

35 35 Вариант осуществления 6c. Соединение формулы 1, в которой X¹ означает СН и X² означает СR¹.

Вариант осуществления 6d. Соединение формулы 1, в которой X¹ означает N и X² означает СR¹.

Вариант осуществления 7. Соединение формулы 1, в которой X³ означает СR².

40 40 Вариант осуществления 7. Соединение формулы 1, в которой X³ означает СН.

Вариант осуществления 8. Соединение формулы 1, в которой X³ означает N.

Вариант осуществления 8a. Соединение формулы 1, в которой X⁴ означает СR².

Вариант осуществления 9. Соединение формулы 1, в которой X⁴ означает СН.

45 45 Вариант осуществления 9a. Соединение формулы 1, в которой X⁴ означает N.

Вариант осуществления 10. Соединение формулы 1 или любых вариантов

осуществления 1-9, в которой R³ означает Н.

Вариант осуществления 11. Соединение формулы 1 или любых вариантов

осуществления 1-10, в которой R^4 и R^5 означают Me и p равно 1.

Вариант осуществления 12. Соединение формулы 1 или любых вариантов осуществления 1-11, в которой R^7 означает H.

5 Варианты осуществления настоящего изобретения, включая варианты осуществления 1-12, указанные выше, а также любые другие варианты осуществления, описанные в настоящем изобретении, можно объединять любым образом и описания переменных в вариантах осуществления относятся не только к соединениям формулы 1, но и к исходным соединениям и промежуточным соединениям, применимым для получения 10 соединений формулы 1. Кроме того, варианты осуществления настоящего изобретения, включая варианты осуществления 1-12, указанные выше, а также любые другие варианты осуществления, описанные в настоящем изобретении, и любая их комбинация, относятся к композициям и способам настоящего изобретения.

Комбинации вариантов осуществления 1-12 иллюстрируются следующими 15 вариантами:

Вариант осуществления A. Соединение формулы 1, в которой X^1 означает CR¹ и X^2 означает CR².

Вариант осуществления B. Соединение варианта осуществления A, в котором 20 X^1 означает CR¹ и X^2 означает CH.

Вариант осуществления C. Соединение варианта осуществления B, в котором X^3 означает CH; и 25 X^4 означает CH.

Вариант осуществления D. Соединение варианта осуществления C, в котором 30 R^3 означает H.

Вариант осуществления E. Соединение варианта осуществления D, в котором R^4 и R^5 все независимо означают H или Me; 35 p равно 1; и R^7 означает H.

Вариант осуществления F. Соединение формулы 1, в которой

X^1 означает CR¹ и X^2 означает CH;

X^3 означает CH;

35 X^4 означает CH;

R^3 означает H;

R^4 и R^5 все независимо означают H или Me;

p равно 1; и

40 R^7 означает H.

Конкретные варианты осуществления включают соединения формулы 1, выбранные из группы, включающей (номера соединений приведены в таблице индексов А):

соединение 1;

соединение 12;

45 соединение 39;

соединение 43;

соединение 47; и

соединение 48.

Следует отметить, что соединения, предлагаемые в настоящем изобретении, обладают благоприятными характеристиками метаболизма и/или сохраняемости в почве и обладают активностью для борьбы со спектром агрономических и неагрономических беспозвоночных вредителей.

- 5 Следует особо отметить, что в связи с борьбой со спектром беспозвоночных вредителей и экономической важностью защита агрономических культур от поражения или повреждения, вызванного беспозвоночными вредителями, путем борьбы с беспозвоночными вредителями являются вариантами осуществления настоящего изобретения. Соединения, предлагаемые в настоящем изобретении, вследствие их 10 благоприятных характеристик переноса или системности в растениях также защищают лиственные или другие части растений, которые непосредственно не взаимодействуют с соединением формулы 1 или композицией, включающей соединение.

Также следует отметить, что вариантами осуществления настоящего изобретения являются композиции, включающие соединение любого из предыдущих вариантов 15 осуществления, а также любых других вариантов осуществления, описанных в настоящем изобретении, и любые их комбинации и по меньшей мере один дополнительный компонент, выбранный из группы, включающей поверхностно-активное вещество, твердый разбавитель и жидкий разбавитель, указанные композиции необязательно дополнительно содержит по меньшей мере одно дополнительное 20 биологически активное соединение или средство.

Также следует отметить, что вариантами осуществления настоящего изобретения являются композиции для борьбы с беспозвоночным вредителем, включающие соединение любого из предыдущих вариантов осуществления, а также любых других вариантов осуществления, описанных в настоящем изобретении, и любые их комбинации 25 и по меньшей мере один дополнительный компонент, выбранный из группы, включающей поверхностно-активное вещество, твердый разбавитель и жидкий разбавитель, указанные композиции необязательно дополнительно содержит по меньшей мере одно дополнительное биологически активное соединение или средство. Варианты осуществления настоящего изобретения дополнительно включают способы борьбы с 30 беспозвоночным вредителем, включающие взаимодействие беспозвоночного вредителя или окружающей его среды с биологически эффективным количеством соединения любого из предыдущих вариантов осуществления (например, в виде композиции, описанной в настоящем изобретении).

Варианты осуществления настоящего изобретения также включают композицию, 35 включающую соединение любого из предыдущих вариантов осуществления, в форме жидкого препарата для орошения почвы. Варианты осуществления настоящего изобретения дополнительно включают способы борьбы с беспозвоночным вредителем, включающие взаимодействие почвы с жидкой композицией для орошения почвы, включающей биологически эффективное количество соединения любого из предыдущих 40 вариантов осуществления.

Варианты осуществления настоящего изобретения также включают композицию для опрыскивания для борьбы с беспозвоночным вредителем, включающую биологически эффективное количество соединения любого из предыдущих вариантов осуществления и пропеллент. Варианты осуществления настоящего изобретения также 45 включают композицию приманки для борьбы с беспозвоночным вредителем, включающую биологически эффективное количество соединения любого из предыдущих вариантов осуществления, один или большее количество пищевых материалов, необязательно аттрактант и необязательно влагоудерживающее средство. Варианты

осуществления настоящего изобретения также включают устройство для борьбы с беспозвоночным вредителем, включающее композицию приманки и кожух для размещения указанной композиции приманки, где кожух содержит по меньшей мере одно отверстие такого размера, чтобы беспозвоночный вредитель мог проникать через

5 отверстие, так чтобы беспозвоночный вредитель мог получить доступ к указанной композиции приманки из положения за пределами кожуха, и где кожух дополнительно приспособлен для размещения на участке возможной или установленной активности беспозвоночного вредителя или вблизи от него.

Варианты осуществления настоящего изобретения также включают способы защиты

10 семян от беспозвоночного вредителя, включающие взаимодействие семян с биологически эффективным количеством соединения любого из предыдущих вариантов осуществления.

Варианты осуществления настоящего изобретения также включают способы защиты животного от паразитического беспозвоночного вредителя, включающие введение животному паразитицидно эффективного количества соединения любого из предыдущих

15 вариантов осуществления.

Варианты осуществления настоящего изобретения также включают способы борьбы с беспозвоночным вредителем, включающие взаимодействие беспозвоночного вредителя или окружающей его среды с биологически эффективным количеством соединения формулы 1, его N-оксида или соли, (например, в виде композиции, описанной в

20 настоящем изобретении), при условии, что способы не являются способами медицинского лечения организма человека или животного путем терапии.

Настоящее изобретение также относится к таким способам, в которых беспозвоночный вредитель или окружающую его среду вводят во взаимодействие с композицией, включающей биологически эффективное количество соединения формулы

25 1, его N-оксида или соли и по меньшей мере один дополнительный компонент, выбранный из группы, включающей поверхностно-активные вещества, твердые разбавители и жидкие разбавители, указанная композиция необязательно дополнительно содержит биологически эффективное количество по меньшей мере одного дополнительного биологически активного соединения или средства, при условии, что

30 способы не являются способами медицинского лечения организма человека или животного путем терапии.

Соединения формулы 1 можно получить с помощью одной или большего количества методик и вариантов, описанных на схемах 1-5. Определения заместителей в соединениях формул 1-9, приведенных ниже, являются такими, как определено выше в Сущности

35 изобретения если не указано иное. Соединения формул 1a-1b являются поднаборами соединений формулы 1 и все заместители для формул 1a-1b являются такими, как определено выше для формулы 1. Использованы следующие аббревиатуры: DMF означает N,N-диметилформамид, NMP означает N-метилпирролидинон, DCC означает N,N'-дициклогексилкарбодиимид и НАТУ означает 1-[бис(диметиламино)метилен]-1Н-40 1,2,3-триазоло[4,5-*b*]пиридиний-3-оксидгексафторфосфат.

Соединения формулы 1 можно получить из соединений формулы 2 по методике, приведенной на схеме 1, где соединение формулы 2 обрабатывают азидным реагентом (например, азидом натрия или тетрабутиламмонийазидом). Типичные условия

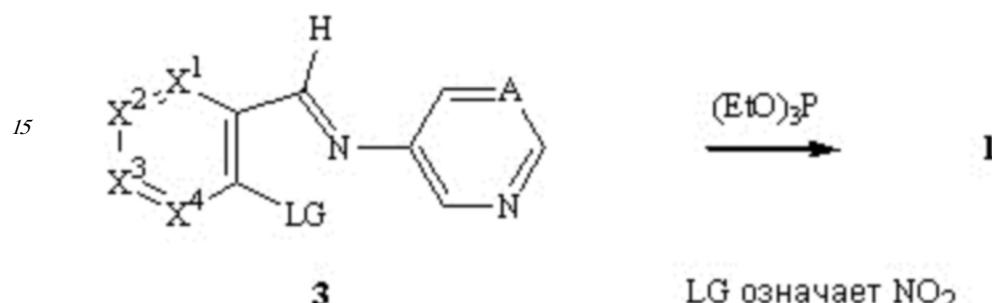
45 проведения реакции включают использование DMF или NMP в качестве растворителя и температуры реакции в диапазоне от 80°C до температуры кипения растворителя.

Схема 1



10 Соединения формулы 1 также можно получить из соединений формулы 3 по методике, приведенной на схеме 2, в которой соединение формулы 3 обрабатывают триэтилфосфитом.

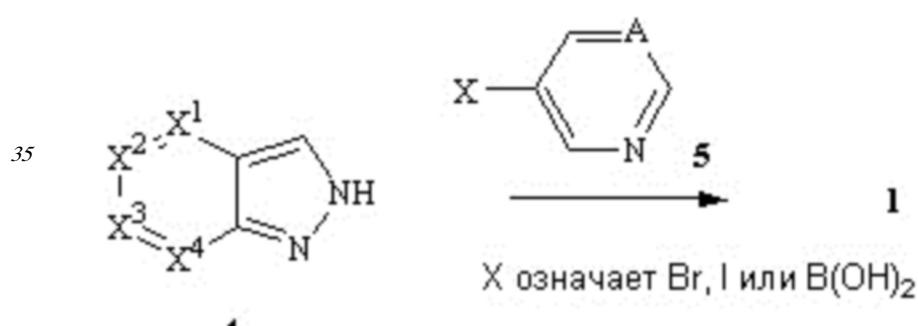
Схема 2



20 Соединения формул 2 и 3 являются шиффовыми основаниями и их можно получить по методикам, известным в данной области техники (см., например, March, J., Advanced Organic Chemistry, Wiley, 1992, pages 896-898).

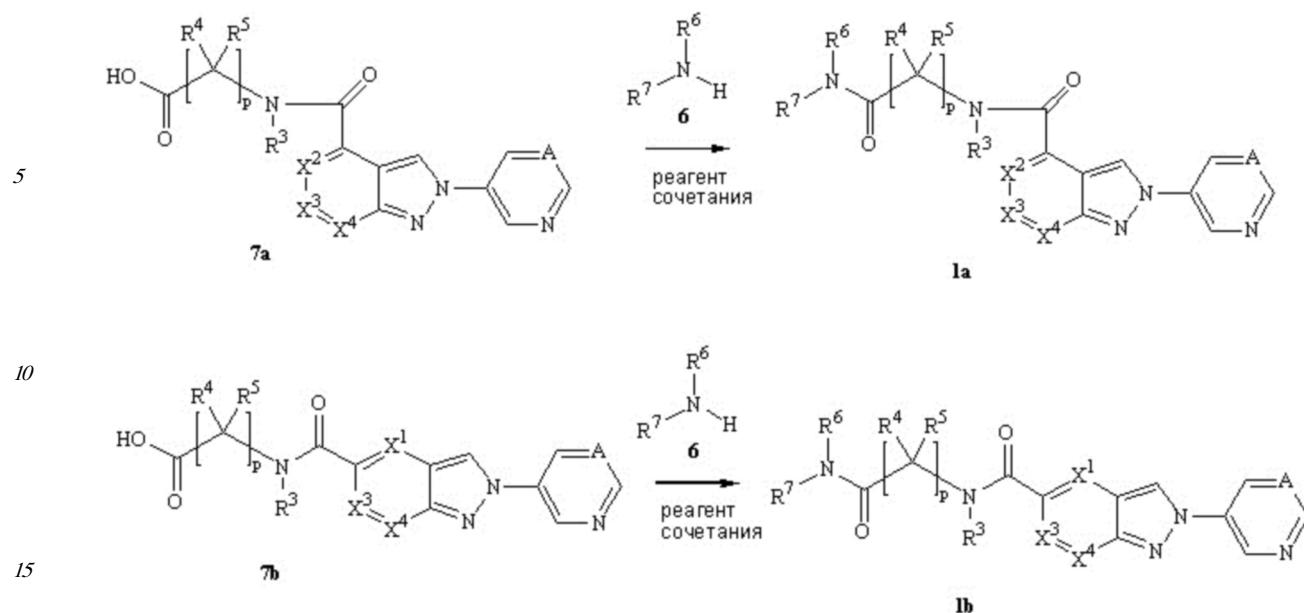
25 Соединения формулы 1 также можно получить по методике, приведенной ниже на схеме 3. В этой методике пиридин или пиридин формулы 5 обрабатывают соединением формулы 4 путем сочетания при катализе металлом и получают соединения формулы 1. Типичную методику с катализом родием, см. Organic Letters 2013, 15(6), pages 1290-1293; типичную методику с катализом медью, см. Applied Catalysis, A: General 2011, 403 (1-2), pages 104-111; и Journal of Molecular Catalysis A: Chemical 2006, 256(1-2), pages 256-260.

Схема 3



40 Как показано на схеме 4, соединения формул 1a и 1b можно получить по реакции образования амидной связи подходящей карбоновой кислоты формулы 7a или 7b с амином формулы 6 в присутствии реагента сочетания для образования амидной связи, такого как DCC или HATU. Типичные реагенты и условия проведения реакции, см. 45 Jones, J. The Chemical Synthesis of Peptides, International Series of Monographs on Chemistry, Oxford University: Oxford, 1994.

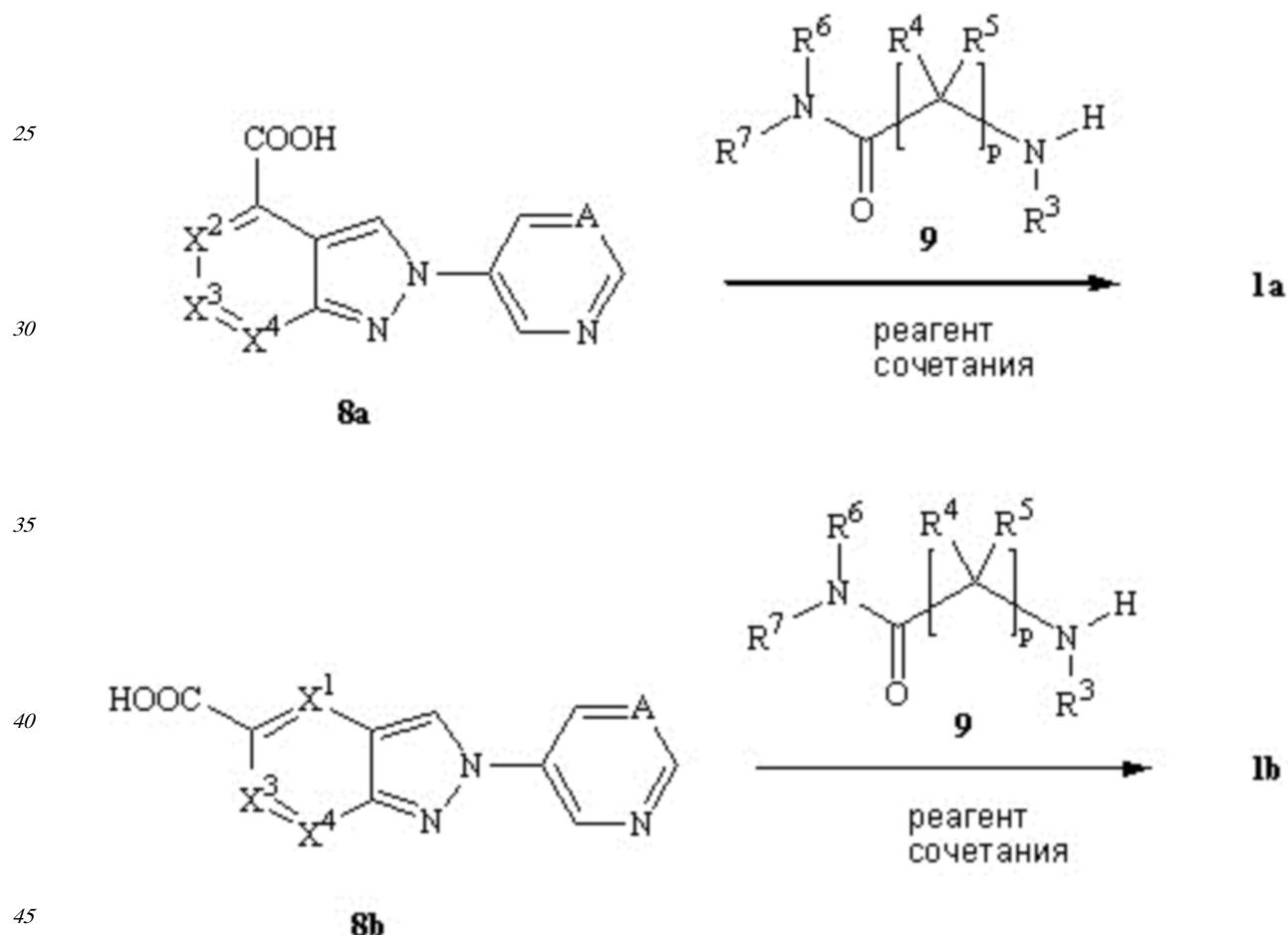
Схема 4



Альтернативно, соединения формул 1а и 1б также можно получить по реакции образования амидной связи подходящей карбоновой кислоты формулы 8а или 8б с амином формулы 9, как показано ниже на схеме 5. Реагенты сочетания и условия

20 проведения реакции аналогичны использованным в методиках схемы 4.

Схема 5



Известно, что некоторые реагенты и условия проведения реакции, описанные выше для получения соединений формулы 1, могут не быть совместимыми с некоторыми функциональными группами, содержащимися в промежуточных продуктах. В этих

случаях включение последовательности введения/удаления защитных групп или взаимопревращения функциональных групп при синтезе способствует получению искомых продуктов. Применение и выбор защитных групп очевидны для специалиста в химическом синтезе (см., например, Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. *Protective Groups in Organic Synthesis*, 2nd ed.; Wiley: New York, 1991). Специалист в данной области техники должен знать, что в некоторых случаях после введения данного реагента, как показано на любой отдельной схеме, может быть необходимо проведение дополнительных стандартных стадий синтеза, не описанных подробно для завершения синтеза соединений формулы 1. Специалист в данной области техники также должен знать, что может быть необходимо проведение комбинаций стадий, представленных на приведенных выше схемах, в порядке, отличающемся от представленного для получения соединений формулы 1.

Специалист в данной области техники также должен знать, что соединения формулы 1 и промежуточные продукты, описанные в настоящем изобретении можно ввести в различные реакции - электрофильные, нуклеофильные, радикальные, металлоорганические, окисления и восстановления для добавления заместителей или изменения имеющихся заместителей.

Без дополнительного уточнения предполагается, что специалист в данной области техники с использованием предыдущего описания может использовать настоящее изобретение в его наибольшей степени. Поэтому последующие примеры синтеза следует считать иллюстративными, а не ограничивающими настоящее изобретение. Стадии последующих примеров синтеза иллюстрируют методику для каждой стадии всего синтетического превращения и исходное вещество для каждой стадии необязательно получают по конкретной препаративной методике, которая описана в других примерах или стадиях. Содержания в процентах являются массовыми за исключением смесей хроматографических растворителей или, если указано иное. Содержания в частях и процентах для смесей хроматографических растворителей являются объемными, если не указано иное. Все спектры ЯМР сняты в слабопольном направлении от тетраметилсилана при 400 МГц, где, если не указано иное, "s" означает синглет, "d" означает дублет, "t" означает триплет, "q" означает квартет, "m" означает мультиплет, "dd" означает дублет дублетов, "dt" означает дублет триплетов, "brs" означает широкий синглет. DMF означает N,N-диметилформамид. Номера соединений соответствуют таблице А.

ПРИМЕР СИНТЕЗА 1

Получение N-[1,1-диметил-2-оксо-2-[(фенилметил)амино]этил]-2-(3-пиридинил)-2Н-индазол-4-карбоксамида (соединение 25)

Стадия А: Получение метилового эфира 2-метил-N-[[2-(3-пиридинил)-2Н-индазол-4-ил]карбонил]аланина

Раствор 2-(3-пиридинил)-2Н-индазол-4-карбоновой кислоты (12,0 г, 50 ммоля), метилового эфира 2-метилаланина (15,4 г, 100 ммоля), НАТУ (20,9 г, 55,2 ммоля) и триэтиламина (28 мл, 200 ммоля) в DMF (200 мл) перемешивали при комнатной температуре в течение ночи. Осадившееся твердое вещество собирали фильтрованием и затем промывали этилацетатом и затем водой. Твердое вещество сушили в вакууме и получали 14,65 г искомого соединения в виде белого твердого вещества. ¹Н ЯМР (500 МГц, DMSO-d₆) δ част./млн 9,38 (d, J=2,21 Гц, 1 Н), 9,30 (d, J=0,95 Гц, 1 Н), 8,75 (s, 1 Н), 8,67 (m, 1 Н), 8,57 (m, 1 Н), 7,95 (d, J=8,67 Гц, 1 Н), 7,78 (d, J=6,62 Гц, 1 Н), 7,64 (m, 1 Н), 7,44 (m, 1 Н), 3,62 (s, 3 Н), 1,53 (s, 6 Н).

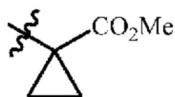
Стадия В: Получение 2-метил-N-[[2-(3-пиридинил)-2Н-индазол-4-ил]карбонил]аланина

Раствор продукта стадии А (12,8 г, 37,6 ммоля) в THF (150 мл) обрабатывали с помощью 1 н. NaOH (70 мл) и полученную реакционную смесь нагревали при 70°C в течение 4 ч. После охлаждения реакционной смеси до комнатной температуры THF удаляли при пониженном давлении. Оставшийся водный раствор промывали 5 этилацетатом (3×100 мл), охлаждали в бане со льдом и подкисляли концентрированной HCl до pH 4. Белый осадок отделяли фильтрованием и сушили и получали 11,8 г искомого продукта в виде почти белого твердого вещества. ^1H ЯМР (500 МГц, DMSO-d₆) δ част./млн 12,22 (s, 1 H) 9,37 (d, J=2,68 Гц, 1 H) 9,31 (d, J=0,95 Гц, 1 H) 8,67 (m, 1 H) 8,59 (s, 1 H) 8,57 (m, 1 H) 7,94 (d, J=8,83 Гц, 1 H) 7,78 (d, J=7,09 Гц, 1 H) 7,64 (m, 1 H) 7,44 (m, 1 H) 1,52 (s, 6 H).

Стадия С: Получение N-[1,1-диметил-2-оксо-2-[(фенилметил)амино]этил]-2-(3-пиридинил)-2Н-индазол-4-карбоксамида

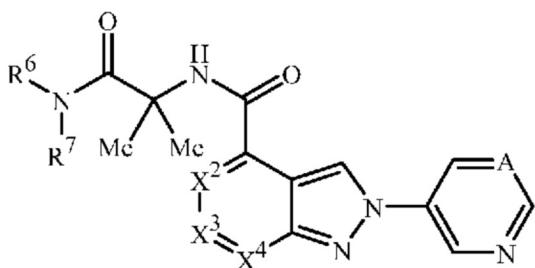
Продукт стадии В (0,06 г, 0,18 ммоля), бензиламин (0,039 г, 0,37 ммоля), НАТУ (0,077 г, 0,2 ммоля) и триэтиламин (0,1 мл, 0,74 ммоля) в DMF (2 мл) перемешивали при 40°C в течение ночи. После охлаждения до комнатной температуры реакционную смесь очищали с помощью колоночной хроматографии с обращенной фазой (колонка C₁₈, элюировали с помощью 0-100% ацетонитрила в воде) и получали 0,045 г искомого соединения, предлагаемого в настоящем изобретении, в виде почти белого 10 твердого вещества. ^1H ЯМР (500 МГц, DMSO-d₆) δ част./млн 9,35 (m, 1 H) 9,30 (d, J=0,95 Гц, 1 H) 8,68 (m, 1 H) 8,54 (m, 1 H) 8,39 (s, 1 H) 8,22 (m, 1 H) 7,93 (d, J=8,67 Гц, 1 H) 7,80 (d, J=6,46 Гц, 1 H) 7,62-7,68 (m, 1 H) 7,44 (dd, J=8,67, 6,94 Гц, 1 H) 7,20-7,32 (m, 4 H) 7,15 (m, 1 H) 4,30 (d, J=5,99 Гц, 2 H) 1,56 (s, 6 H).

Конкретные соединения формулы 1, полученные с помощью методик и вариантов, описанных на предшествующих схемах 1-5 и в примере синтеза 1, указаны ниже в таблице индексов. Можно использовать следующие аббревиатуры: t означает третичный, с означает цикло, Me означает метил, Et означает этил и Ph означает фенил. Волнистая линия или "—" во фрагменте структуры означает положение присоединения фрагмента к остальной части молекулы. Выражение "-C(-элементы кольца-)" используют для обозначения кольца, в котором первый и последний элементы кольца связаны с одним атомом углерода; например, "-C(-CH₂CH₂-)CO₂Me" означает следующую структуру:



После слова "Пример" и следует номер, указывающий номер примера синтеза, в котором получено соединение.

ТАБЛИЦА ИНДЕКСОВ А



A, X³ и X⁴ означают CH

Соединение №	R ⁶	R ⁷	X ²	Данные MS
1	-C(Me) ₂ CO ₂ Me	H	CH	424,4
2	-C(Me) ₂ C(O)NMe ₂	H	CH	437,4
3	-CH ₂ CO ₂ Me	H	CH	396,5
5	-CH ₂ C(O)NHMe	H	CH	395,5
6	-C(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)CO ₂ Me	H	CH	450,6
7	-C(-CH ₂ CH ₂ -)CO ₂ Me	H	CH	422,6
10	-CH ₂ (циклогексил)	H	CH	378,3
9	-CH(Me)(циклогексил)	H	CH	392,3
10	-CH ₂ C(O)NH ₂	H	CH	381,3
11	-CH ₂ C≡CH	H	CH	362,3
12	-CH(Me)CN	H	CH	377,3
13	-C(-CH ₂ CH ₂ -)CN	H	CH	389,3
15	-CH ₂ CH=CH ₂	H	CH	364,3
15	-CH(Me)CH ₂ OMe	H	CH	396,4
17	-CH ₂ C(O)N(Me) ₂	H	CH	409,2
18	-CH(Me)C(O)NHMe	H	CH	409,2
19	-CH ₂ CH(-CH ₂ CF ₂ -)	H	CH	414,3
20	-CH ₂ (тетрагидро-2-фуранил)	H	CH	408,4
21	-CH ₂ CH ₂ OMe	H	CH	382,3
22	-CH ₂ CH(OMe) ₂	H	CH	412,4
23	-CH ₂ CH ₂ SMe	H	CH	398,5
24	-NHCO ₂ Me	H	CH	397,4
25	-CH ₂ Ph	H	CH	414,3
26	-CH ₂ (2-пиридинил)	H	CH	415,3
27	-CH ₂ (3-пиридинил)	H	CH	415,3
28	-CH ₂ (4-пиридинил)	H	CH	415,3
29	-CH ₂ (5-метил-2-пиразинил)	H	CH	430,4
30	-C(Me) ₂ C(O)NHMe	H	CH	423,4
31	-C(Me) ₂ C≡CH	H	CH	390,3
32	-CH ₂ C(Me) ₂ CN	H	CH	405,6
33	-CH ₂ (2-тиенил)	H	CH	420,5
34	-CH ₂ CN	H	CH	363,5
35	-CH(Me)CH ₂ S(O)Me	H	CH	426,6
38	3-оксетанил	H	CH	380,5
39	-CH(Me)C≡CH	H	CH	376,5
40	-CH(-C(O)NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	H	CH	435,3
41	-CH ₂ (2-пирамидинил)	H	CH	416,6
42	-CH(CN)(циклогексил)	H	CH	403,6
40	циклогексил	H	CH	378,2
44	3-циклогексанон	H	CH	392,2
45	-C(Me) ₂ COOH	H	CH	410,2
46	-C(Me) ₂ C(O)NHEt	H	CH	437,2
47	-OMe	Me	CH	368,2
48	-OMe	H	CH	354,2
45	-C(Me) ₂ C(O)N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	H	CH	449,2

Соединение, предлагаемое в настоящем изобретении, обычно используют в качестве активного ингредиента для борьбы с беспозвоночным вредителем в композиции, т.е.

в препарате по меньшей мере с одним дополнительным компонентом, выбранным из группы, включающей поверхностно-активные вещества, твердые разбавители и жидкие разбавители, который служит в качестве носителя. Ингредиенты препарата или композиции выбирают так, чтобы они были согласованы с физическими 5 характеристиками активного ингредиента, путем нанесения и факторами окружающей среды, такими как тип, влажность и температура почвы.

Подходящие препараты включают жидкие и твердые композиции. Жидкие композиции включают растворы (включая эмульгирующиеся концентраты), суспензии, эмульсии (включая микроэмульсии, эмульсии типа масло-в-воде, сыпучие концентраты 10 и/или суспоэмульсии) и т.п., которые необязательно можно загустить в гели. Общими типами водных жидких композиций являются растворимый концентрат, концентрат суспензии, суспензия капсул, концентрированная эмульсия, микроэмульсия, эмульсия масло-в-воде, сыпучий концентрат и суспоэмульсия. Общими типами неводных жидких композиций являются эмульгирующийся концентрат, микроэмульгирующийся 15 концентрат, диспергирующийся концентрат и масляная дисперсия.

Общими типами твердых композиций являются дусты, порошки, гранулы, пеллеты, окатыши, пастилки, таблетки, заполненные пленки (включая покрытия семян) и т.п., которые могут быть диспергирующимися в воде ("смачивающимися") или растворимыми 20 в воде. Пленки и покрытия, образованные из пленкообразующих растворов или текучих суспензий, являются особенно подходящими для обработки семян. Активный ингредиент можно (микро)капсулировать и затем преобразовать в суспензию или твердый препарат; альтернативно весь препарат активного ингредиента можно капсулировать (или 25 "нанести покрытие"). Капсулирование может регулировать или задерживать высвобождение активного ингредиента. Эмульгирующиеся гранулы объединяют преимущества препарата эмульгирующегося концентрата и сухого гранулированного препарата. Концентрированные композиции в основном используют в качестве 30 промежуточных продуктов для последующих препаратов.

Препараты для опрыскивания обычно до опрыскивания помещают в подходящую среду. Такие жидкие и твердые препараты обычно готовят так, чтобы их можно было 35 легко разбавить в среде для опрыскивания, обычно в воде, но иногда в другой подходящей среде, такой как ароматический или парафиновый углеводород или растительное масло. Объемы для опрыскивания могут находиться в диапазоне от примерно одного до нескольких тысяч литров на гектар, но чаще они находятся в 40 диапазоне от примерно 1 до нескольких тысяч литров на гектар. Препараты для опрыскивания могут быть смешаны в баке с водой или другой подходящей средой для некорневой обработки путем воздушного или наземного нанесения или для нанесения на среду, в которой выращивают растения. Жидкие и сухие препараты можно дозировать прямо в системы капельного орошения или дозировать в борозды при посеве. Жидкие и твердые препараты можно наносить на семена культур и другую желательную 45 растительность в качестве средства для обработки семян до высева для защиты развивающихся корней и других подземных частей растения и/или листьев путем системного поглощения.

Препараты обычно содержат эффективные количества активного ингредиента, разбавителя и поверхностно-активного вещества в следующих использующихся 45 примерных диапазонах значений, к которым добавляют разбавитель до 100 мас.%.

Мас.%			
Активный ингредиент	Разбавитель	Поверхностно-активное вещество	

5	Диспергирующиеся в воде и растворимые в воде гранулы, таблетки и порошки	0,001-90	0-99,999	0-15
	Масляные дисперсии, суспензии, эмульсии, растворы (включая эмульгирующиеся концентраты)	1-50	40-99	0-50
10	Дусты	1-25	70-99	0-5
	Гранулы и пеллеты	0,001-99	5-99,999	0-15
	Концентрированные композиции	90-99	0-10	0-2

Твердые разбавители включают, например, глины, такие как бентонит, монтмориллонит, аттапульгит и каолин, гипс, целлюлоза, диоксид титана, оксид цинка, крахмал, декстрин, сахара (например, лактоза, сахароза), диоксид кремния, тальк, слюда, диатомовая земля, мочевина, карбонат кальция, карбонат и бикарбонат натрия и сульфат натрия. Типичные твердые разбавители описаны в Watkins et al., *Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers*, 2nd Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jersey.

Жидкие разбавители включают, например, воду, N,N-диметилалканамиды (например, N,N-диметилформамид), лимонен, диметилсульфоксид, N-алкилпирролидоны (например, N-метилпирролидинон), алкилфосфаты (например, триэтилфосфат), этиленгликоль, триэтиленгликоль, пропиленгликоль, дипропиленгликоль, полипропиленгликоль, пропиленкарбонат, бутиленкарбонат, парафины (например, белые минеральные масла, нормальные парафины, изопарафины), алкилбензолы, алкилнафталины, глицерин, глицеринтриацетат, сорбит, ароматические углеводороды, деароматизированные алифатические соединения, алкилбензолы, алкилнафталины, кетоны, такие как циклогексанон, 2-гептанон, изофорон и 4-гидрокси-4-метил-2-пентанон, ацетаты, такие как изоамилацетат, гексилацетат, гептилацетат, октилацетат, нонилацетат, тридецилацетат и изоборнилацетат, другие эфиры, такие как алкилированные лактаты, двузамещенные эфиры, алкил и арилбензоаты и γ -бутиrolактон, и спирты, которые могут быть линейными, разветвленными, насыщенными или ненасыщенными, такие как метанол, этанол, н-пропанол, изопропиловый спирт, н-бутанол, изобутиловый спирт, н-гексанол, 2-этилгексанол, н-октанол, деканол, изодециловый спирт, изооктадеканол, цетиловый спирт, лауриловый спирт, тридециловый спирт, олеиловый спирт, циклогексанол, тетрагидрофуриловый спирт, диацетоновый спирт, крезол и бензиловый спирт. Жидкие разбавители также включают глицерин сложные эфиры насыщенных и ненасыщенных жирных кислот (обычно C₆-C₂₂), такие как масла из семян растений и плодовые масла (например, масла оливы, касторовое, льняное, кунжутное, кукурузное (маисовое), арахисовое, подсолнечное, виноградное, сафлоровое, хлопковое, соевое, рапсовое, кокосовое и пальмоядровое), жиры из животных источников (например, говяжий жир, свиной жир, лярд, жир печени трески, рыбий жир) и их смеси. Жидкие разбавители также включают алкилированные жирные кислоты (например, метилированные, этилированные, бутилированные), где жирные кислоты можно получить путем гидролиза сложных эфиров глицерина из растительных и животных источников и можно очистить с помощью перегонки. Типичные жидкие разбавители описаны в Marsden, *Solvents Guide*, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950.

Твердые и жидкие композиции, предлагаемые в настоящем изобретении, часто включают одно или большее количество поверхностно-активных веществ. При добавлении к жидкости поверхностно-активные вещества (также известные, как "поверхностно-активные агенты") обычно изменяют, чаще всего снижают поверхностное натяжение жидкости. В зависимости от природы гидрофильных и липофильных групп в молекуле поверхностно-активного вещества поверхностно-активные вещества можно использовать, как смачивающие агенты, диспергирующие средства, эмульгаторы или пеноподавляющие агенты.

Поверхностно-активные вещества можно разделить на неионогенные, анионогенные или катионогенные. Неионогенные поверхностью-активные вещества, применимые для композиций, предлагаемых в настоящем изобретении, включают, но не ограничиваются только ими: алcoxилаты спиртов, такие как алcoxилаты спиртов на основе природных и синтетических спиртов (который может быть разветвленным или линейным) и получают из спиртов и этиленоксида, пропиленоксида, бутиленоксида или их смеси; аминэтоксилаты, алканоламиды и этоксилированные алканоламиды; алcoxилированные триглицериды, такие как этоксилированные соевое, касторовое и рапсовое масла; алкилфенолалcoxилаты, такие как октилфенолэтоксилаты, 5 нонилфенолэтоксилаты, динонилфенолэтоксилаты и додецилфенолэтоксилаты (получаемые из фенолов и этиленоксида, пропиленоксида, бутиленоксида или их смеси); блок-сополимеры, получаемые из этиленоксида или пропиленоксида и обращенные блок-сополимеры, где концевые блоки получают из пропиленоксида; этоксилированные жирные кислоты; этоксилированные жирные эфиры и масла; этоксилированные 10 метиловые эфиры; этоксилированный тристирилфенол (включая получаемые из этиленоксида, пропиленоксида, бутиленоксида или их смеси); эфиры жирных кислот, сложные эфиры глицерина, производные на основе ланолина, полиэтоксилированные сложные эфиры, такие как полиэтоксилированные сорбитановые эфиры жирных кислот, полиэтоксилированные сорбитановые эфиры жирных кислот и 15 20 25

полиэтоксилированные эфиры глицерина и жирных кислот; другие производные сорбитана, такие как сорбитановые эфиры; полимерные поверхностью-активные вещества, такие как статистические сополимеры, блок-сополимеры, алкидные ПЭГ (полиэтиленгликоль) смолы, привитые или гребенчатые полимеры и звездообразные полимеры; полиэтиленгликоли (ПЭГ); полиэтиленгликоловые эфиры жирных кислот; - поверхностью-активные вещества на основе силиконов; и производные сахара, такие как сложные эфиры сахарозы, алкилполигликазиды и алкилполисахариды.

Подходящие анионогенные поверхностью-активные вещества включают, но не ограничиваются только ими: алкиларилсульфоновые кислоты и их соли; карбоксилированные спирты или алкилфенолэтоксилаты; производные

30 дифенилсульфоната; лигнин и производные лигнина, такие как лигносульфонаты; малеиновые или янтарные кислоты или их ангидриды; олеинсульфонаты; фосфаты, такие как фосфаты алcoxилатов спиртов, фосфаты алкилфенолалcoxилатов и фосфаты стирилфенолэтоксилатов; поверхностью-активные вещества на основе белков; производные саркозина; сульфат эфира стирилфенола; сульфаты и сульфонаты масел 35 и жирных кислот; сульфаты и сульфонаты этоксилированных алкилфенолов; сульфаты спиртов; сульфаты этоксилированных спиртов; сульфонаты аминов и амидов, такие как N,N-алкилтаураты; сульфонаты бензола, кумола, толуола, ксилола, и додецил- и тридекилбензолы; сульфонаты конденсированных нафталинов; сульфонаты нафталина и алкилнафталина; сульфонаты фракционированной нефти; сульфосукцинаты; и 40 сульфосукцинаты и их производные, такие как соли диалкилсульфосукцинатов.

Подходящие катионогенные поверхностью-активные вещества включают, но не ограничиваются только ими: амиды и этоксилированные амиды; амины, такие как N-

45 алкилпропандиамины, трипропилентриамины и дипропилентетраамины, и этоксилированные амины, этоксилированные диамины и пропоксилированные амины (получаемые из аминов и этиленоксида, пропиленоксида, бутиленоксида или их смеси); соли аминов, такие как аминацетаты и соли диаминов; четвертичные аммониевые соли, такие как четвертичные соли, этоксилированные четвертичные соли и дичетвертичные соли; и аминоксиды, такие как алкилдиметиламиноксиды и бис-(2-гидроксигидил)-

алкиламиноксиды.

Также подходящими для композиций, предлагаемых в настоящем изобретении, являются смеси неионогенных и анионогенных поверхностно-активные вещества или смеси неионогенных и катионогенных поверхностно-активных веществ. Неионогенные, 5 анионогенные и катионогенные поверхностно-активные вещества и рекомендации по их применению приведены в различных публикациях, включая McCutcheon's Emulsifiers and Detergents, annual American and International Editions published by McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; Sisely and Wood, Encyclopedia of Surface Active Agents, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964; и A. S. Davidson and B. Milwidsky, 10 Synthetic Detergents, Seventh Edition, John Wiley and Sons, New York, 1987.

Композиции, предлагаемые в настоящем изобретении, также могут содержать вспомогательные вещества для препаратов и добавки, известные специалистам в данной области техники, как вспомогательные вещества для приготовления препаратов (некоторые из которых также можно считать действующими в качестве твердых 15 разбавителей, жидких разбавителей или поверхностно-активных веществ). Такие вспомогательные вещества для приготовления препаратов и добавки могут регулировать: pH (буферы), вспенивание во время обработки (противовспениватели, такие как полиорганосилоксаны), осаждение активных ингредиентов (суспендирующие агенты), вязкость (тиксотропные загустители), рост микробов в контейнере 20 (противомикробные средства), замерзание продукта (антифризы), цвет (красители/дисперсии пигментов), смывание (пленкообразователи или kleящие средства), испарение (замедлители испарения) и другие характеристики препаратов. Пленкообразователи включают, например, поливинилацетаты, сополимеры поливинилацетата, сополимер поливинилпирролидон-винацетат, поливиниловые спирты, сополимеры 25 поливинилового спирта и воска. Примеры вспомогательных веществ и добавок для препаратов включают указанные в McCutcheon's Volume 2: Functional Materials, annual International and North American editions published by McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; и PCT Publication WO 03/024222.

Соединение формулы 1 и любые другие активные ингредиенты обычно включают 30 в композиции, предлагаемые в настоящем изобретении, путем растворения активного ингредиента в растворителе или путем размола в жидком или сухом разбавителе. Растворы, включая эмульгирующиеся концентраты, можно получить простым смешиванием ингредиентов. Если растворитель жидкой композиции, предназначенный для использования в качестве эмульгирующегося концентрата, не смешивается с водой, 35 обычно добавляют эмульгатор для эмульгирования содержащего активное вещество растворителя при разбавлении водой. Взвеси активного ингредиента, обладающие частицами диаметром до 2000 мкм, можно подвергнуть мокрому размолу с использованием сред для размола и получить частицы со средним диаметром менее 3 мкм. Водные взвеси можно превратить в готовые концентраты супензии (см., например, 40 U.S. 3060084) или дополнительно обработать путем распылительной сушки и получить диспергирующиеся в воде гранулы. Для сухих препаратов обычно необходимы методики сухого размола, которые дают частицы со средним диаметром в диапазоне от 2 до 10 мкм. Дусты и порошки можно получить смешиванием и обычно размолом (например, в молотковой мельнице или струйной мельнице). Гранулы и пеллеты можно получить 45 путем опрыскивания активным веществом предварительно сформованных гранулированных носителей или по методикам агломерации. См. Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, December 4, 1967, pp 147-48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, pages 8-57 и following, и WO

91/13546. Пеллеты можно получить, как описано в U.S. 4172714. Диспергирующиеся в воде и растворимые в воде гранулы можно получить, как описано в U.S. 4144050, U.S. 3920442 и DE 3246493. Таблетки можно получить, как описано в U.S. 5180587, U.S. 5232701 и U.S. 5208030. Пленки можно получить, как описано в GB 2095558 и U.S. 3299566.

Информацию в области приготовления препаратов см. T. S. Woods, "The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture" in Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge, T. Brooks and T. R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge,

- 10 1999, pp. 120-133. См. также U.S. 3235361, столбец 6, строка 16 до столбца 7, строка 19 и примеры 10-41; U.S. 3309192, столбец 5, строка 43 до столбца 7, строка 62 и примеры 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138-140, 162-164, 166, 167 и 169-182; U.S. 2891855, столбец 3, строка 66 до столбца 5, строка 17 и примеры 1-4; Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pp 81-96; Hance et al., Weed Control Handbook,
- 15 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989; и Developments in formulation technology, PJB Publications, Richmond, UK, 2000.

В приведенных ниже примерах все содержания в процентах являются массовыми и все препараты готовят обычным образом. Номера соединения указывают соединения в таблицах индексов А-Н. Без дополнительного уточнения предполагается, что

- 20 специалист в данной области техники с использованием предыдущего описания может использовать настоящее изобретение в его наибольшей степени. Поэтому приведенные ниже примеры следует считать просто иллюстративными и никоим образом не ограничивающими настоящее изобретение. Содержания в процентах являются массовыми, если не указано иное.

25 Пример А

Высококонцентрированный концентрат	
Соединение 1	98,5%
аэрогель диоксида кремния	0,5%
синтетический аморфный тонкодисперсный диоксид кремния	1,0%

30 Пример В

Смачивающийся порошок	
Соединение 12	65,0%
додецилфеноловый эфир полиэтиленгликоля	2,0%
лигнинсульфонат натрия	4,0%
силикоалюминат натрия	6,0%
монтмориллонит (прокаленный)	23,0%

35 Пример С

Гранула	
Соединение 39	10,0%
аттапульгит гранулы (низкое содержание летучих веществ, 0,71/0,30 мм; U.S.S. сита № 25-50)	90,0%

40 Пример D

Экструдированная пеллета	
Соединение 43	25,0%
безводный сульфат натрия	10,0%
неочищенный лигнинсульфонат кальция	5,0%
алкилнафтилсульфонат натрия	1,0%
бентонит кальция/магния	59,0%

Пример Е

5	Эмульгирующийся концентрат	
	Соединение 47	10,0%
	полиоксистиленсorbitгексолеат	20,0%
	метиловый эфир С6-С10 жирной кислоты	70,0%

Пример F

10	Микроэмульсия	
	Соединение 48	5,0%
	сополимер поливинилпирролидон-винилацетат	30,0%
	алкилполигликозид	30,0%
	глицерилмоноолеат	15,0%
	вода	20,0%

Пример G

15	Средство для обработки семян	
	Соединение 1	20,00%
	сополимер поливинилпирролидон-винилацетат	5,00%
	кислый горный воск	5,00%
	лигнинсульфонат кальция	1,00%
20	блок-сополимеры полиоксистилен/полиоксипропилен	1,00%
	стеариловый спирт (POE 20)	2,00%
	полиорганосилан	0,20%
	красный краситель	0,05%
	вода	65,75%

Пример H

25	Удобрение в виде палочек	
	Соединение 12	2,5%
	сополимер пирролидон-стирол	4,8%
	тристирилфенил-16-этоксилат	2,3%
30	тальк	0,8%
	кукурузный крахмал	5,0%
	удобрение медленного высвобождения	36,0%
	каолин	38,0%
	вода	10,6%

Пример I

35	Концентрат суспензии	
	Соединение 39	35%
	блок-сополимер бутилполиоксистилен/полипропилен	4,0%
	сополимер стеариновая кислота/полиэтиленгликоль	1,0%
40	стирол-акриловый сополимер	1,0%
	ксантановая камедь	0,1%
	пропиленгликоль	5,0%
	противовспениватель на основе силикона	0,1%
	1,2-бензизотиазолин-3-он	0,1%
	вода	53,7%

Пример J

45	Эмульсия в воде	
	Соединение 1	10,0%
	блок-сополимер бутилполиоксистилен/полипропилен	4,0%

5	сополимер стеариновая кислота/полиэтиленгликоль	1,0%
	стирол-акриловый сополимер	1,0%
	ксантановая камедь	0,1%
	пропиленгликоль	5,0%
	противовспениватель на основе силикона	0,1%
	1,2-бензизотиазолин-3-он	0,1%
	ароматический углеводород нефти	20,0
	вода	58,7%

Пример К

10	Масляная дисперсия	
	Соединение 1	25%
	полиоксизиленсорбигексаолеат	15%
	органически модифицированная бентонитовая глина	2,5%
	метиловый эфир жирной кислоты	57,5%

Пример L

15	Суспензия	
	Соединение 48	10,0%
	имидаклоприд	5,0%
20	бутилполиоксизилен/полипропилен block copolymer	4,0%
	стеариновая кислота/полиэтиленгликоль сополимер	1,0%
	стирол-акриловый сополимер	1,0%
	ксантановая камедь	0,1%
	пропиленгликоль	5,0%
	противовспениватель на основе силикона	0,1%
25	1,2-бензизотиазолин-3-он	0,1%
	ароматический углеводород нефти	20,0%
	вода	53,7%

Соединения, предлагаемые в настоящем изобретении, обладают активностью по отношению к широкому спектру беспозвоночных вредителей. Эти вредители включают беспозвоночных, обитающих в разных средах, таких как, например, листья, корни

растений, почва, собранные культуры или другие пищевые продукты, здания или покровы тела животных. Эти вредители включают, например, беспозвоночных, питающихся на листьях (включая листья, стебли, цветки и плоды), семенах, древесине, текстильных волокнах или кровь или ткани животных, и тем самым вызывающим повреждение или поражение, например, растущих или хранящихся агрономических культур, лесов,

35 тепличных культур, декоративных растений, культур в питомниках, хранящихся пищевых продуктов или волоконных продуктов, или домов или других сооружений или их содержимого, или вредных для здоровья животных или общественного здравоохранения. Специалисты в данной области техники должны понимать, что не все соединения являются одинаково эффективными по отношению ко всем стадиям

40 роста всех вредителей.

Таким образом, соединения и композиции, предлагаемые в настоящем изобретении, применимы агрономически для защиты полевых культур от травоядных беспозвоночных вредителей и также неагрономически для защиты других садовых культур и растений от травоядных беспозвоночных вредителей. Это применение включает защиту

45 сельскохозяйственных культур и других растений (т.е. и агрономических, и неагрономических), которые содержат генетический материал, введенный с помощью генной инженерии (т.е. трансгенный) или модифицированный мутагенезом для придания благоприятных признаков. Примеры таких признаков включают устойчивость к

гербицидам, устойчивость к растительноядным вредителям (например, насекомым, клещам, тлям, паукам, нематодам, улиткам, фитопатогенным грибам, бактериям и вирусам), улучшенный рост растения, улучшенную устойчивость к неблагоприятным условиям роста, таким как высокие или низкие температуры, низкая или высокая

- 5 влажность почвы и высокая соленость, улучшенное цветение или плодоношение, более высокий собранный урожай, более быстрое созревание, более высокое качество и/или питательная ценность собранного продукта или улучшенные характеристики хранения или обработки собранных продуктов. Трансгенные растения можно модифицировать для экспрессирования многих признаков. Примеры растений, обладающих признаками,
- 10 приданым с помощью генной инженерии или мутагенеза, включают сорта кукурузы, хлопчатника, сои и картофеля, экспрессирующие инсектицидный токсин *Bacillus thuringiensis*, такие как YIELD GARD[®], KnockOut[®], StarLink[®], Bollgard[®], NuCOTN[®] и NewLeaf[®], INVICTA RR2 PROTM, и устойчивые к гербицидам сорта кукурузы,
- 15 хлопчатника, сои и парса, такие как Roundup Ready[®], Liberty Link[®], IMI[®], STS[®] и Clearfield[®], а также сельскохозяйственные культуры, экспрессирующие N-ацетилтрансферазу (GAT) с признаком устойчивости к гербициду глифосату или сельскохозяйственные культуры, содержащие ген HRA, придающий устойчивость к гербицидам, ингибирующим ацетолактатсингазу (ALS). Соединения и композиции,
- 20 предлагаемые в настоящем изобретении, могут взаимодействовать синергетически с признаками, введенными с помощью генной инженерии или модифицированными мутагенезом, тем самым усиливая экспрессию фенотипа или эффективность признаков или усиливая эффективность борьбы с беспозвоночным вредителем соединений и композиций, предлагаемых в настоящем изобретении. В частности, соединения и композиции, предлагаемые в настоящем изобретении, могут взаимодействовать синергетически с фенотипической экспрессией белков или других натуральных продуктов, токсичных для беспозвоночных вредителей и обеспечить превышающую аддитивную борьбу с этими вредителями.

Композиции, предлагаемые в настоящем изобретении, также необязательно могут включать питательные вещества для растений, например, композицию удобрения, включающую по меньшей мере одно питательное вещество для растений, выбранное из группы, включающей азот, фосфор, калий, серу, кальций, магний, железо, медь, бор, марганец, цинк и молибден. Следует отметить композиции, включающие по меньшей мере одну композицию удобрения, включающую по меньшей мере одно питательное вещество для растений, выбранное из группы, включающей азот, фосфор, калий, серу, кальций и магний. Композиции, предлагаемые в настоящем изобретении, которые дополнительно включают по меньшей мере одно питательное вещество для растений, могут находиться в форме жидкостей или твердых веществ. Следует отметить твердые препараты в форме гранул, небольших кусочков или таблеток. Твердые препараты, включающие композицию удобрения можно получить смешиванием соединения или композиции, предлагаемой в настоящем изобретении, с композицией удобрения вместе с ингредиентами для приготовления препаратов и с последующим приготовлением препарата по методикам, таким как гранулирование или экструзия. Альтернативно, твердые препараты можно получить путем нанесения опрыскиванием раствора или суспензии соединения или композиции, предлагаемой в настоящем изобретении, в летучем растворителе на предварительно приготовленную композицию удобрения в форме смесей со стабильными размерами, например, гранул, небольших кусочков или таблеток с последующим выпариванием растворителя.

Неагрономические применения относятся к борьбе с беспозвоночным вредителем на участках кроме полей сельскохозяйственных растений. Неагрономические применения соединений и композиций, предлагаемых в настоящем изобретении, включают борьбу с беспозвоночными вредителями в хранимом зерне, фасоли и других пищевых веществ, 5 и в текстильных материалах, таких как одежда и ковры. Неагрономические применения соединений и композиций, предлагаемых в настоящем изобретении, также включают борьбу с беспозвоночным вредителем в декоративных растениях, лесах, на железнодорожных путях, на обочинах дорог и полосах отвода железнодорожных путей, и в дерне, таком как газоны, поле для гольфа и выгоны. Неагрономические применения 10 соединений и композиций, предлагаемых в настоящем изобретении, также включают борьбу с беспозвоночным вредителем в домах и других зданиях, в которых могут жить люди и/или домашние животные, фермах, фермерских хозяйствах, зоопарках или на других животных. Неагрономические применения соединений и композиций, 15 предлагаемых в настоящем изобретении, также включают борьбу с вредителями, такими как термиты, которые могут повреждать древесину или другие строительные материалы, использующиеся в зданиях.

Неагрономические применения соединений и композиций, предлагаемых в настоящем изобретении, также включают защиту здоровья людей и животных путем борьбы с беспозвоночными вредителями, которые являются паразитическими или переносят 20 инфекционные болезни. Борьба с паразитами животных включает борьбу с наружными паразитами, которые паразитируют на поверхности тела животного-хозяина (например, плечах, подмышках, животе, внутренней части бедер) и внутренними паразитами, которые паразитируют внутри тела животного-хозяина (например, в желудке, кишечнике, легких, венах, под кожей, в лимфатической ткани). Наружные паразитические 25 или переносящие заболевания вредители включают, например, клещей-тромбикулидов, зудней, вшей, комаров, мух, клещей и блох. Внутренние паразиты включают сердечных червей, анкилостом и гельминтов. Соединения и композиции, предлагаемые в настоящем изобретении, являются подходящими для системной и/или несистемной борьбы с заражением или инфицированием животных паразитами. Соединения и композиции, 30 предлагаемые в настоящем изобретении, являются особенно подходящими для борьбы с внешними паразитическими или переносящими заболевания вредителями. Соединения и композиции, предлагаемые в настоящем изобретении, являются подходящими для борьбы с паразитами, которые заражают сельскохозяйственных животных, таких как крупный рогатый скот, овцы, козы, лошади, свиньи, ослы, верблюды, буйволы, кролики, 35 куры, индейки, утки, гуси и пчелы; комнатные животные и домашние животные, такие как собаки, кошки, комнатные птицы и аквариумные рыбки; а также так называемые подопытные животные, такие как хомяки, морские свинки, крысы и мыши. Путем борьбы с этими паразитами уменьшается смертность и в меньшей степени ухудшаются рабочие характеристики (с точки зрения количества получаемого мяса, молока, шерсти, 40 кожи, яиц, меда и т.п.), так что нанесение композиции, включающей соединение, предлагаемое в настоящем изобретении, делает более экономичным и простым содержание животных.

Примеры агрономических или неагрономических беспозвоночных вредителей включают яйца, личинки и взрослых отряда Lepidoptera, таких как походные черви, 45 совки, пяденицы и совки семейства Noctuidae (например, розовый стеблевой точильщик (*Sesamia inferens* Walker), огневка кукурузная стеблевая (*Sesamia nonagrioides* Lefebvre), южные походные черви (*Spodoptera eridania* Cramer), совка травяная (*Spodoptera frugiperda* J. E. Smith), совка малая (*Spodoptera exigua* Hübner), гусеница хлопковая (*Spodoptera*

littoralis Boisduval), совка полосатая желто-бурая (*Spodoptera ornithogalli* Guenée), совка-ипсилон (*Agrotis epsilon* Hufnagel), гусеница, вредящая соевым культурам (*Anticarsia gemmatalis* Hübner), плодожорка зеленая (*Lithophane antennata* Walker), совка капустная (*Barathra brassicae* Linnaeus), пяденица соевая (*Pseudoplusia includens* Walker), совка ни⁵ (*Trichoplusia ni* Hübner), табачная листовертка (*Heliothis virescens* Fabricius)); сверлильщики, чехликовые моли, гусеницы, строящие паутинные гнезда, моли, гусеницы капустницы и вредители, скелетирующие листья, семейства *Pyralidae* (например, мотылек кукурузный (*Ostrinia nubilalis* Hübner), гусеница, вредящая цитрусовым (*Amyelois transitella* Walker), огневка (*Crambus caliginosellus* Clemens), луговые мотыльки (*Pyralidae: Crambinae*), такие¹⁰ как луговой мотылек (*Herpetogramma licarsialis* Walker), точильщик стеблей сахарного тростника (*Chilo infuscatellus* Snellen), томатная огневка (*Neoleucinodes elegantalis* Guenée), рисовая огневка (*Cnaphalocrocis medinalis*), огневка виноградная (*Desmia funeralis* Hübner), бабочка-огневка (*Diaphania nitidalis* Stoll), огневка капустная (*Hellula hydralis* Guenée), желтый стеблевой сверлильщик (*Scirpophaga incertulas* Walker), огневка стеблевая рисовая¹⁵ (*Scirpophaga infuscatellus* Snellen), белый стеблевой точильщик (*Scirpophaga innotata* Walker), сверлильщик верхних побегов (*Scirpophaga nivella* Fabricius), сверлильщик рисовый черноголовый полосатый (*Chilo polychrysus* Meyrick), сверлильщик рисовый стеблевой (*Chilo suppressalis* Walker), сердечная капустница (*Crocidiolomia binotalis* English));²⁰ листовертки, листовертки-почкоеды, плодожорки и плодовые черви семейства *Tortricidae* (например, плодожорка яблонная (*Cydia pomonella* Linnaeus), листовертка виноградная (*Endopiza viteana* Clemens), плодожорка восточная персиковая (*Grapholita molesta* Busck), ложная яблонная плодожорка (*Cryptophlebia leucotreta* Meyrick), совка цитрусовая (*Ecdytolopha aurantiana* Lima), листовертка цитрусовая (*Argyrotaenia velutinana* Walker), скошеннополосая листовертка (*Choristoneura rosaceana* Harris), светло-коричневая моль²⁵ яблонная (*Epiphyas postvittana* Walker), двулетняя виноградная листовертка (*Eupoecilia ambiguella* Hübner), смородиновая листовертка (*Pandemis pyrusana* Kearfott), всеядная листовертка (*Platynota stultana* Walsingham), кривоусая смородиновая листовертка (*Pandemis cerasana* Hübner), листовертка кривоусая ивовая (*Pandemis heparana* Denis & Schiffermüller)); и многие другие экономически важные lepidoptera (например, моль³⁰ капустная (*Plutella xylostella* Linnaeus), розовый коробочный червь (*Pectinophora gossypiella* Saunders), шелкопряд непарный (*Lymantria dispar* Linnaeus), персиковая плодожорка (*Carposina nipponensis* Walsingham), моль фруктовая полосатая (*Anarsia lineatella* Zeller), картофельная моль (*Phthorimaea operculella* Zeller), яблонная моль-пестрянка (*Lithocolletis blancardella* Fabricius), азиатская моль яблонная минирующая (*Lithocolletis ringoniella*³⁵ Matsumura), листовертка рисовая (*Lerodea eufala* Edwards), моль яблонная минирующая (*Leucoptera scitella* Zeller)); яйца, куколки и взрослых отряда *Blattodea*, включая таракановые семейства *Blattellidae* и *Blattidae* (например, таракан черный (*Blatta orientalis* Linnaeus), таракан азиатский (*Blatella asahinai* Mizukubo), таракан рыжий (*Blattella germanica* Linnaeus), мебельный таракан (*Supella longipalpa* Fabricius), таракан⁴⁰ американский (*Periplaneta americana* Linnaeus), коричневый таракан (*Periplaneta brunnea* Burmeister), мадейрский таракан (*Leucophaea maderae* Fabricius)), дымчато-коричневый таракан (*Periplaneta fuliginosa* Service), таракан австралийский (*Periplaneta australasiae* Fabr.), серый таракан (*Nauphoeta cinerea* Olivier) и гладкий таракан (*Symploce pallens* Stephens)); яйца, поедающие листья, поедающие плоды, поедающие корни, поедающие⁴⁵ семена и поедающие пузырчатую ткань личинки и взрослых отряда *Coleoptera*, включая зерновки семейств *Anthribidae*, *Bruchidae* и *Curculionidae* (например, долгоносик хлопковый (*Anthonomus grandis* Boheman), долгоносик рисовый водяной (*Lissorhoptrus oryzophilus* Kuschel), долгоносик амбарный обыкновенный (*Sitophilus granarius* Linnaeus),

долгоносик рисовый (*Sitophilus oryzae* Linnaeus)), долгоносик мятлика однолетнего (*Listronotus maculicollis* Dietz), долгоносик мятлика (*Sphenophorus parvulus* Gyllenhal), рыскающий долгоносик (*Sphenophorus venatus vestitus*), долгоносик Денвера (*Sphenophorus cicatristriatus* Fahraeus)); земляные блошки, блошки картофельные, личинки,

- 5 повреждающие корни, листоеды, колорадский жук и минирующие мушки семейства Chrysomelidae (например, колорадский жук (*Leptinotarsa decemlineata* Say), западный кукурузный жук (*Diabrotica virgifera virgifera* LeConte)); хрущи и другие жуки семейства Scarabaeidae (например, хрущик японский (*Popillia japonica* Newman), хрущик восточный (*Anomala orientalis* Waterhouse, *Exomala orientalis* (Waterhouse) Barraud), северный
- 10 кукурузный жук (*Cyclocephala borealis* Arrow), южный кукурузный жук (*Cyclocephala immaculata* Olivier или *C. lurida* Bland), навозник и личинка хруща (*Aphodius* spp.), черный травяной навозник (*Ataenius spretulus* Haldeman), хрущ блестящий зеленый (*Cotinis nitida* Linnaeus), хрущик азиатский садовый (*Maladera castanea* Arrow), майский/июньский жуки (*Phyllophaga* spp.) и европейский хрущ (*Rhizotrogus majalis* Razoumowsky)); кожеды
- 15 обыкновенные ковровые семейства Dermestidae; проволочники семейства Elateridae; короеды семейства Scolytidae и мучные хрущаки семейства Tenebrionidae.

Кроме того, агрономические и неагрономические вредители включают: яйца, взрослых и личинки отряда Dermaptera, включая уховертки семейства Forficulidae (например, европейская уховертка (*Forficula auricularia* Linnaeus), черная уховертка (*Chelisoches morio* Fabricius)); яйца, незрелых, взрослых и куколки отрядов Hemiptera и Homoptera, такие как, слепняки семейства Miridae, цикады семейства Cicadidae, цикадки (например, *Empoasca* spp.) семейства Cicadellidae, клопы постельные (например, *Cimex lectularius* Linnaeus) семейства Cimicidae, цикадовые семейства Fulgoroidae и Delphacidae, горбатки семейства Membracidae, настоящие листоблошки семейства Psyllidae, белокрылки семейства Aleyrodidae, тли семейства Aphididae, филлоксера семейства Phylloxeridae, войлокники семейства Pseudococcidae, равнокрылые семейства Coccidae, Diaspididae и Margarodidae, клопы-кружевницы семейства Tingidae, щитники семейства Pentatomidae, земляные клопы (например, пшеничный клоп-черепашка (*Blissus leucopterus hirtus* Montandon) и южный клоп-черепашка (*Blissus insularis* Barber)) и другие наземники семейства Lygaeidae, пенницы семейства Cercopidae, клопы-ромбовики семейства Coreidae и клопы постельные и красноклопы хлопковые семейства Pyrrhocoridae.

Агрономические и неагрономические вредители также включают: яйца, личинки, куколки и взрослых отряда Acari (клещи), такие как клещики паутинные и клещи красные паутинные семейства Tetranychidae (например, клещ красный плодовый (*Panonychus ulmi* Koch), клещик паутинный двупятнистый (*Tetranychus urticae* Koch), клещ *McDaniel* (*Tetranychus mcdanieli* McGregor)); плоские клещи семейства Tenuipalpidae (например, оранжевый клещ (*Brevipalpus lewisi* McGregor)); галловые и почковые клещи семейства Eriophyidae и другие питающиеся листьями клещи и клещи, важные для здоровья людей и животных, т.е. пылевые клещи семейства Epidermoptidae, угрицы семейства Demodicidae, зерновые клещи семейства Glycyphagidae; зудни семейства Ixodidae, общеизвестные, как твердые клещи (например, черноногий клещ (*Ixodes scapularis* Say), австралийский паралитический клещ (*Ixodes holocyclus* Neumann), собачий иксодовый клещ (*Dermacentor variabilis* Say) иксодовый клещ *Amblyomma* (*Amblyomma americanum* Linnaeus)) и зудни семейства Argasidae, общеизвестные, как аргазиды (например, аргасовый клещ (*Ornithodoros turicata*), обыкновенный персидский клещ (*Argas radiatus*)); конский и чесоточный клещи семейств Psoroptidae, Pyemotidae и Sarcoptidae; яйца, взрослых и незрелых отряда Orthoptera, включая кузнецики, саранчу и сверчки (например, миграционные кузнецики (например, *Melanoplus sanguinipes* Fabricius, *M. differentialis*

- Thomas), американские кузнечики (например, *Schistocerca americana* Drury), саранча африканская (*Schistocerca gregaria* Forskal), саранча перелетная (*Locusta migratoria* Linnaeus), саранчовые (*Zonocerus* spp.), сверчок домашний (*Acheta domesticus* Linnaeus), медведки обыкновенные (например, медведка десятипалая (*Scapteriscus vicinus* Scudder) и медведка южная (*Scapteriscus borellii* Giglio-Tos)); яйца, взрослых и незрелых отряда Diptera, включая миниирующие мушки (например, *Liriomyza* spp., такие как томатный листовой минер (*Liriomyza sativae* Blanchard)), мошки, плодовые мушки (Tephritidae), злаковые мушки (например, *Oscinella frit* Linnaeus), цветочные мушки, мухи комнатные (например, *Musca domestica* Linnaeus), малые мухи комнатные (например, *Fannia canicularis* Linnaeus, *F. femoralis* Stein), жигалки обыкновенные (например, *Stomoxys calcitrans* Linnaeus), мухи обыкновенные полевые, жигалки коровьи малые, мухи мясные синие (например, *Chrysomya* spp., *Phormia* spp.) и другие мускоидные мухи-вредители, слепни (например, *Tabanus* spp.), носоглоточные оводы (например, *Gastrophilus* spp., *Oestrus* spp.), оводы бычьи (например, *Hypoderma* spp.), олены слепни (например, *Chrysops* spp.);
- 15 кровососки (например, *Melophagus ovinus* Linnaeus) и другие Brachycera, комары (например, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp.), мошки (например, *Prosimulium* spp., *Simulium* spp.), мокрецы, москиты, плодовые комарики и другие Nematocera; яйца, взрослых и незрелых отряда Thysanoptera, включая трипс луковый (*Thrips tabaci* Lindeman), трипсы обыкновенные (*Frankliniella* spp.) и другие питающиеся листьями трипсы;
- 20 насекомые-вредители отряда Hymenoptera, включая муравьев семейства Formicidae, включая флоридский муравей-древоточец (*Camponotus floridanus* Buckley), красный муравей-древоточец (*Camponotus ferrugineus* Fabricius), пенсильванский муравей-древоточец (*Camponotus pennsylvanicus* De Geer), белоногий муравей (*Technomyrmex albipes* fr. Smith), большеголовый муравей (*Pheidole* sp.), муравей-призрак (*Tapinoma melanocephalum* Fabricius); муравей домовый (*Monomorium pharaonis* Linnaeus), малый огненный муравей (*Wasmannia auropunctata* Roger), муравей огненный (*Solenopsis geminata* Fabricius), муравей огненный импортный красный (*Solenopsis invicta* Buren), муравей аргентинский (*Iridomyrmex humilis* Mayr), медовый муравей (*Paratrechina longicornis* Latreille), муравей дерновый (*Tetramorium caespitum* Linnaeus), муравей садовый бледноногий (*Lasius alienus* Förster) и муравей домашний пахучий (*Tapinoma sessile* Say). Другие Hymenoptera, включая пчел (включая пчел-плотников), шершней, настоящих ос, ос и пилильщиков (*Neodiprion* spp.; *Cephus* spp.); насекомые-вредители отряда Isoptera, включая термитов семейств Терmitidae (например, *Macrotermes* sp., *Odontotermes obesus* Rambur), Kalotermitidae (например, *Cryptotermes* sp.) и Rhinotermitidae (например, *Reticulitermes* sp., *Coptotermes* sp., *Heterotermes tenuis* Hagen), терmit желтоногий (*Reticulitermes flavipes* Kollar), западный ринотермит (*Reticulitermes hesperus* Banks), китайский подземный терmit (*Coptotermes formosanus* Shiraki), терmit индийский древесный (*Incisitermes immigrans* Snyder), терmit суходревный (*Cryptotermes brevis* Walker), терmit суходревный пьяный (*Incisitermes snyderi* Light), темный юго-восточный подземный терmit (*Reticulitermes virginicus* Banks), западный суходревный терmit (*Incisitermes minor* Hagen), древесные термиты, такие как *Nasutitermes* sp. и другие имеющие экономическое значение термиты; насекомые-вредители отряда Thysanura, такие как чешуйницы (*Lepisma saccharina* Linnaeus) и чешуйница домашняя (*Thermobia domestica* Packard); насекомые-вредители отряда Mallophaga и, включая вошь головную (*Pediculus humanus capititis* De Geer), вошь платянную (*Pediculus humanus* Linnaeus), пухоед двухщетинковый куриный (*Menacanthus stramineus* Nitszch), пухоед собачий (*Trichodectes canis* De Geer), пухоед куриный пестробрюхий (*Goniocotes gallinae* De Geer), власоед овечий (*Bovicola ovis* Schrank), вошь коровья коротконогая (*Haematopinus eurysternus*

Nitzsch), вошь крупного рогатого скота долгоносая кровососущая (*Linognathus vituli* Linnaeus) и другие сосущие и грызущие паразитические вши, нападающие на людей и животных; насекомые-вредители отряда Siphonoptera, включая блоха крысиная южная (*Xenopsylla cheopis* Rothschild), блоха кошачья (*Ctenocephalides felis* Bouche), блоха собачья (*Ctenocephalides canis* Curtis), блоха куриная (*Ceratophyllus gallinae* Schrank), блоха присасывающаяся (*Echidnophaga gallinacea* Westwood), блоха человеческая (*Pulex irritans* Linnaeus) и другие блохи, поражающие млекопитающих и птиц. Дополнительные членистоногие вредители covered включают: пауков отряда Araneae, такие как коричневый паук-отшельник (*Loxosceles reclusa* Gertsch & Mulaik) и южная черная вдова (*Latrodectus mactans* Fabricius) и сороконожки отряда Scutigeromorpha, такие как обыкновенная мухоловка (*Scutigera coleoptrata* Linnaeus).

Примеры беспозвоночных вредителей хранящегося зерна включают большой точильщик зерновой (*Prostephanus truncatus*), точильщик зерновой (*Rhyzopertha dominica*), долгоносик рисовый (*Stiophilus oryzae*), кукурузный долгоносик (*Stiophilus zeamais*), зерновка четырехпятнистая (*Callosobruchus maculatus*), хрущак каштановый (*Tribolium castaneum*), долгоносик амбарный обыкновенный (*Stiophilus granarius*), моль индийская мучная (*Plodia interpunctella*), огневка мельничная (*Ephestia kuhniella*) и малый или ржаво-красный мукоед (*Cryptolestes ferrugineus*).

Соединения, предлагаемые в настоящем изобретении, могут обладать активностью по отношению к представителям классов Nematoda, Cestoda, Trematoda и Acanthocephala, включая экономически важных представителей отрядов Strongylida, Ascaridida, Oxyurida, Rhabditida, Spirurida и Enoplida, таких как, но не ограничиваясь только ими, экономически важные сельскохозяйственные вредители (т.е. яванские галловые нематоды рода *Meloidogyne*, ранящие нематоды рода *Pratylenchus*, корневые нематоды рода *Trichodorus* и т.п.) и animal и human health вредители (т.е. все экономически важные trematodes, ленточные черви и круглые черви, такие как *Strongylus vulgaris* у лошадей, *Toxocara canis* у собак, *Haemonchus contortus* у овец, *Dirofilaria immitis* Leidy у собак, *Anoplocephala perfoliata* у лошадей, *Fasciola hepatica* Linnaeus у жвачных животных и т.п.).

Соединения, предлагаемые в настоящем изобретении, могут обладать активностью по отношению к вредителям отряда Lepidoptera (например, *Alabama argillacea* Hübner (совка азиатская хлопковая), *Archips argyrospila* Walker (листовертка плодовых деревьев), *A. rosana* Linnaeus (листовертка резанная) и другие *Archips* species, *Chilo suppressalis* Walker (сверлильщик рисовый стеблевой), *Cnaphalocrosis medinalis* Guenée (листовертка рисовая), *Crambus caliginosellus* Clemens (огневка), *Crambus teterrellus* Zincken (огневка), *Cydia pomonella* Linnaeus (плодожорка яблонная), *Earias insulana* Boisduval (совка хлопковая египетская), *Earias vittella* Fabricius (совка пятнистая), *Helicoverpa armigera* Hübner (совка хлопковая), *Helicoverpa zea* Boddie (совка кукурузная), *Heliothis virescens* Fabricius (табачная листовертка), *Herpetogramma licarsialis* Walker (луговой мотылек), *Lobesia botrana* Denis & Schiffermüller (листовертка виноградная), *Pectinophora gossypiella* Saunders (розовый коробочный червь), *Phylloconistis citrella* Stainton (цитрусовая минирующая моль), *Pieris brassicae* Linnaeus (белянка капустная), *Pieris rapae* Linnaeus (белянка репная), *Plutella xylostella* Linnaeus (моль капустная), *Spodoptera exigua* Hübner (совка малая), *Spodoptera litura* Fabricius (табачная совка, cluster caterpillar), *Spodoptera frugiperda* J. E. Smith (совка травяная), *Trichoplusia ni* Hübner (совка ни) и *Tuta absoluta* Meyrick (южноамериканская томатная моль)).

Соединения, предлагаемые в настоящем изобретении, обладают значительной активностью по отношению к представителям отряда Homoptera, включая: *Acyrthosiphon pisum* Harris (тля гороховая), *Aphis craccivora* Koch (тля люцерновая), *Aphis fabae* Scopoli

(тля свекловичная), *Aphis gossypii* Glover (тля хлопковая, тля бахчевая), *Aphis pomi* De Geer (тля яблонная), *Aphis spiraecola* Patch (тля таволговая), *Aulacorthum solani* Kaltenbach (тля картофельная обыкновенная), *Chaetosiphon fragaefolii* Cockerell (тля земляничная), *Diuraphis noxia* Kurdjumov/Mordvilko (тля ячменная), *Dysaphis plantaginea* Paaserini (тля розовая), *Eriosoma lanigerum* Hausmann (тля кровяная яблонная), *Hyalopterus pruni* Geoffroy (тля мучнистая слиновая), *Lipaphis erysimi* Kaltenbach (тля ложнокапустная), *Metopolophium dirrhodum* Walker (тля розанно-злаковая), *Macrosiphum euphorbiae* Thomas (тля картофельная), *Myzus persicae* Sulzer (тля персиково-картофельная, тля персиковая зеленая), *Nasonovia ribisnigri* Mosley (тля салатная зеленая), *Pemphigus* spp. (корневые тли и галловые тли), *Rhopalosiphum maidis* Fitch (тля кукурузная), *Rhopalosiphum padi* Linnaeus (тля черемуховая обыкновенная), *Schizaphis graminum* Rondani (тля злаковая обыкновенная), *Sitobion avenae* Fabricius (тля злаковая), *Theroaphis maculata* Buckton (тля клеверная), *Toxoptera aurantii* Boyer de Fonscolombe (тля померанцевая) и *Toxoptera citricida* Kirkaldy (тля цитрусовая); *Adelges* spp. (хермесы); *Phylloxera devastatrix* Pergande (pecan phylloxera); *Bemisia tabaci* Gennadius (тобакко белокрылка, табачная белокрылка), *Bemisia argentifolii* Bellows & Perring (магнолиевая белокрылка), *Dialeurodes citri* Ashmead (белокрылка цитрусовая) и *Trialeurodes vaporariorum* Westwood (белокрылка тепличная); *Empoasca fabae* Harris (цикадка картофельная), *Laodelphax striatellus* Fallen (малый коричневый дельфацид), *Macrolestes quadrilineatus* Forbes (астровая цикадка), *Nephrotettix cinticeps* Uhler (цикадка зеленая), *Nephrotettix nigropictus* Stål (рисовая цикадка), *Nilaparvata lugens* Stål (коричневый дельфацид), *Peregrinus maidis* Ashmead (цикадка кукурузная), *Sogatella furcifera* Horvath (белоспинная цикадка), *Sogatodes orizicola* Muir (дельфацид рисовый), *Typhlocyba pomaria* McAtee цикадка яблонная, *Erythroneura* spp. (цикадки виноградные); *Magicicada septendecim* Linnaeus (периодическая цикада); *Icerya purchasi* Maskell (червец австралийский желобчатый), *Quadrastriotus perniciosus* Comstock (щитовка калифорнийская); *Planococcus citri* Risso (мучнистый червец виноградный); *Pseudococcus* spp. (другое сообщество червецов); *Cacopsylla pyricola* Foerster (медяница грушевая), *Trioza diospyri* Ashmead (листоблошка хурмовая).

Соединения, предлагаемые в настоящем изобретении, также обладают активностью по отношению к представителям отряда Hemiptera, включая: *Acrosternum hilare* Say (клоп-щитник), *Anasa tristis* De Geer (клоп-ромбовик печальный), *Blissus leucopterus* leucopterus Say (земляной клоп), *Cimex lectularius* Linnaeus (клоп постельный) *Corythuca gossypii* Fabricius (клоп хлопковый), *Cyrtopeltis modesta* Distant (клоп томатный), *Dysdercus suturellus* Herrich-Schäffer (красноклоп хлопковый), *Euchistus servus* Say (щитник коричневый), *Euchistus variolarius* Palisot de Beauvois (клоп-щитник однопятнистый), *Graptosthetus* spp. (сообщества клопов-наземников), *Halymorpha halys* Stål (коричневомраморный клоп), *Leptoglossus corculus* Say (клоп-краевик семян сосны), *Lygus lineolaris* Palisot de Beauvois (клоп луговой), *Nezara viridula* Linnaeus (южный зеленый овощной клоп), *Oebalus pugnax* Fabricius (щитник рисовый), *Oncopeltus fasciatus* Dallas (клоп молочайный большой), *Pseudatomoscelis seriatus* Reuter (блошка хлопковая). Другие отряды насекомых, с которыми обеспечивают борьбу соединения, предлагаемые в настоящем изобретении, включают *Thysanoptera* (например, *Frankliniella occidentalis* Pergande (трипс цветочный западный), *Scirtothrips citri* Moulton (трипс цитрусовый), *Sericothrips variabilis* Beach (трипс соевый) и *Thrips tabaci* Lindeman (трипс луковый); и отряд *Coleoptera* (например, *Leptinotarsa decemlineata* Say (колорадский жук), *Epilachna varivestis* Mulsant (мексиканский жук) и проволочники родов *Agriotes*, *Athous* или *Limonius*).

Следует отметить, что в некоторых современных системах классификации Homoptera

относят к подотряду отряда Hemiptera.

Следует отметить применение соединений, предлагаемых в настоящем изобретении, для борьбы с трипсом цветочным западным (*Frankliniella occidentalis*). Следует отметить применение соединений, предлагаемых в настоящем изобретении, для борьбы с цикадкой 5 картофельной (*Empoasca fabae*). Следует отметить применение соединений, предлагаемых в настоящем изобретении, для борьбы с тлей бахчевой (*Aphis gossypii*). Следует отметить применение соединений, предлагаемых в настоящем изобретении, для борьбы с тлей персиковой зеленою (*Myzus persicae*). Следует отметить применение соединений, предлагаемых в настоящем изобретении, для борьбы с табачной белокрылкой (*Bemisia 10 tabaci*).

Соединения, предлагаемые в настоящем изобретении, также могут быть применимы для увеличения мощности сельскохозяйственного растения. Этот способ включает взаимодействие сельскохозяйственного растения (например, листья, цветков, плодов или корней) или семян из которых вырастает сельскохозяйственное растение, с

15 соединением формулы 1 в количестве, достаточном для обеспечения желательного влияния на мощность растения (т.е. в биологически эффективном количестве). Обычно соединение формулы 1 наносят в приготовленной композиции. Хотя соединение формулы 1 часто наносят прямо на сельскохозяйственное растение или его семена, его также можно наносить на участок произрастания сельскохозяйственного растения, т.е.

20 среду расположения сельскохозяйственного растения, в частности, на участок среды, находящийся в непосредственной близости для обеспечения возможности миграции соединения формулы 1 на сельскохозяйственное растение. Участок произрастания, относящийся к этому способу, чаще всего включает среду произрастания (т.е. среду, предоставляющую растению питательные вещества), обычно почву, в которой

25 произрастает растение. Таким образом, обработка сельскохозяйственного растения для увеличения мощности сельскохозяйственного растения включает взаимодействие сельскохозяйственного растения, семян, из которых вырастает сельскохозяйственное растение, или участка произрастания сельскохозяйственного растения с биологически эффективным количеством соединения формулы 1.

30 Увеличенная мощность культуры может привести к одному или большему количеству следующих наблюдающихся эффектов: (а) оптимальное укоренение сельскохозяйственной культуры, о чем свидетельствует превосходное прорастание семян, всхожесть сельскохозяйственной культуры и густота сельскохозяйственной культуры; (б) усиленный рост сельскохозяйственной культуры, о чем свидетельствует

35 быстрый и мощный рост листьев (например, измеряемый индексом площади листьев), высота растений, количество побегов (например, для риса), множество корней и общая масса в сухом состоянии растительной массы сельскохозяйственной культуры; (с) улучшенная урожайность сельскохозяйственных культур, о чем свидетельствует время до цветения, длительность цветения, количество цветков, полная накопленная биомасса

40 (т.е. величина урожая) и/или рыночная рентабельность полученных плодов и зерна (т.е. качество урожая); (д) улучшенная способность сельскохозяйственной культуры переносить или предупреждать заражение болезнями растений и членистоногими, нематодами или моллюсками - вредителями; и (е) улучшенная способность сельскохозяйственной культуры переносить экологические стрессы, такие как

45 воздействие экстремальных тепловых условий, субоптимальной влажности или фитотоксичных химикатов.

Соединения, предлагаемые в настоящем изобретении, могут увеличивать мощность обработанных растений по сравнению с необработанными растениями путем

уничтожения или проводимого иным образом предотвращения кормления травоядных беспозвоночных вредителей в среде растений. При отсутствии такой борьбы с травоядными беспозвоночными вредителями вредители уменьшают мощность растения путем поедания тканей или сока растения, или переноса патогенов растений, таких как 5 вирусы. Даже при отсутствии травоядных беспозвоночных вредителей, соединения, предлагаемые в настоящем изобретении, могут увеличивать мощность растения путем изменения метаболизма растений. Обычно мощность сельскохозяйственного растения наиболее значительно увеличивается при обработке растения соединением, предлагаемым в настоящем изобретении, если растение растет в неидеальной среде, 10 т.е. среде, включающей один или большее количество аспектов, вредных для достижения растением полного генетического потенциала, который оно проявляет в идеальной среде.

Следует отметить способ увеличения мощности сельскохозяйственного растения, в котором сельскохозяйственное растение растет в среде, включающей травоядных 15 беспозвоночных вредителей. Также следует отметить способ увеличения мощности сельскохозяйственного растения, в котором сельскохозяйственное растение растет в среде, не включающей травоядных беспозвоночных вредителей. Также следует отметить способ увеличения мощности сельскохозяйственного растения, в котором 20 сельскохозяйственное растение растет в среде, содержащей количество влаги, меньшее, чем идеальное для поддержания роста сельскохозяйственного растения. Следует отметить способ увеличения мощности сельскохозяйственного растения, в котором сельскохозяйственной культурой является рис. Также следует отметить способ 25 увеличения мощности сельскохозяйственного растения, в котором сельскохозяйственной культурой является маис (кукуруза). Также следует отметить способ увеличения мощности сельскохозяйственного растения, в котором сельскохозяйственной культурой является соя.

Соединения, предлагаемые в настоящем изобретении, также можно смешать с одним или большим количеством других биологически активных соединений или средств, включая инсектициды, фунгициды, нематоциды, бактерициды, акарициды, гербициды, 30 антидоты гербицидов, регуляторы роста, такие как ингибиторы линьки насекомых и стимуляторы укоренения, хемостерилизаторы, сигнальные биологически активные вещества, репелленты, аттрактанты, феромоны, стимуляторы кормления, другие биологически активные соединения или энтомопатогенные бактерии, вирусы или грибы, 35 с образованием многокомпонентного пестицида, обладающего даже более широким спектром агрономического и неагрономического применения. Таким образом, настоящее изобретение также относится к композиции, включающей биологически эффективное количество соединения формулы 1, по меньшей мере один дополнительный компонент выбран из группы, включающей поверхностно-активные вещества, твердые разбавители и жидкие разбавители и по меньшей мере одно дополнительное биологически активное 40 соединение или средство. Для смесей, предлагаемых в настоящем изобретении, другие биологически активные соединения или средства можно приготовить вместе с соединениями, предлагаемыми в настоящем изобретении, включая соединения формулы 1, с образованием премикса, или другие биологически активные соединения или средства 45 можно приготовить отдельно от соединений, предлагаемых в настоящем изобретении, включая соединения формулы 1 и два препарата объединить до нанесения (например, в баке для опрыскивания) или, альтернативно, нанести последовательно.

Примерами таких биологически активных соединений или средств, вместе с которыми можно приготовить соединения, предлагаемые в настоящем изобретении, являются

инсектициды, такие как абамектин, ацефат, ацехиноцил, ацетамиприд, акринатрин, афидопиропен ([(3S,4R,4aR,6S,6aS,12R,12aS,12bS)-3-[(циклогексилкарбонил)окси]-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-декагидро-6,12-дигидрокси-4,6a,12b- trimetil-11-оксо-9-(3-пиридинил)-2H,11H-нафто[2,1-b]пиран-4-ил]

- 5 метилциклогексилкарбоксилат), амидофлумет, амитраз, авермектин, азадирахтин, азинфос-метил, бенфуракарб, бенсултап, бифентрин, бифеназат, бистрифлурон, борат, бупрофезин, кадусафос, карбарил, карбофуран, картап, карзол, хлорантранилипирол, хлорфенапир, хлорфлуазурон, хлорпирифос, хлорпирифос-метил, хромафенозид, клофентезин, клотианидин, циантранилипирол (3-бром-1-(3-хлор-2-пиридинил)-N-[4-циано-2-метил-6-[(метиламино)карбонил]фенил]-1H-пиразол-5-карбоксамид), цикланилипирол (3-бром-N-[2-бром-4-хлор-6-[(1-циклогексилкарбонил)амино]карбонил]фенил]-1-(3-хлор-2-пиридинил)-1H-пиразол-5-карбоксамид), циклопротрин, циклоксаприд ((5S,8R)-1-[(6-хлор-3-пиридинил)метил]-2,3,5,6,7,8-гексагидро-9-нитро-5,8-эпокси-1H-имидазо[1,2-a]азепин) цифлуметофен, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, гамма-цигалотрин, лямбда-цигалотрин, циперметрин, альфа-циперметрин, дзета-циперметрин, циромазин, дельтаметрин, диафентиурон, диазинон, диэльдрин, дифлубензурон, димефлутрин, димегипо, диметоат, динотефуран, диофенолан, эмамектин, эндосульфан, эсфенвалерат, этипрол, этофенпрокс, этоксазол, фенбутатиноксид, фенитротион, фенотиокарб, феноксикарб, фенпропатрин, фенвалерат, 20 фипронил, флометоквин (2-этил-3,7-диметил-6-[4-(трифторметокси)фенокси]-4-хинолинилметилкарбонат), флоникамид, флубендиамид, флуцитринат, флуфенерим, флуфеноксурон, флуфеноксистробин (метил (αE)-2-[[2-хлор-4-(трифторметил)фенокси]метил]-α-(метоксиметилен)бензолацетат), флуфенсульфон (5-хлор-2-[(3,4,4-трифторметил)бутен-1-ил]сульфонил)тиазол), флугексафон, флуопирам, флупипирол (1-[2,6-дихлор-4-(трифторметил)фенил]-5-[(2-метил-2-пропен-1-ил)амино]-4-[(трифторметил)сульфинил]-1H-пиразол-3-карбонитрил), флунирадифурон (4-[[6-хлор-3-пиридинил)метил](2,2-дифторэтил)амино]-2(5H)-фуранон), флавалинат, тау-флавалинат, фенофос, форметанат, фостиазат, галофенозид, гептафлутрин ([2,3,5,6-тетрафтор-4-(метоксиметил)фенил]метил-2,2-диметил-3-[(1Z)-3,3,3-трифторметил-1-пропен-1-ил]циклогексилкарбоксилат), 30 гексафлумурон, гекситиазокс, гидраметилнон, имидаклоприд, индоксакарб, инсектицидные мыла, изофенфос, луфенурон, малатион, меперфлутрин ([2,3,5,6-тетрафтор-4-(метоксиметил)фенил]метил (1R,3S)-3-(2,2-дихлорэтенил)-2,2-диметилциклогексилкарбоксилат), метафлумизон, метальдегид, метамидофос, метидатион, метиодикарб, метомил, метопрен, метоксихлор, метофлутрин, 35 метоксифенозид, метофлутрин, монокротофос, монофтоторотрин ([2,3,5,6-тетрафтор-4-(метоксиметил)фенил]метил 3-(2-циано-1-пропен-1-ил)-2,2-диметилциклогексилкарбоксилат), никотин, нитенпирам, нитизазин, новалурон, новифлумурон, оксамил, паратион, паратион-метил, перметрин, форат, фозалон, фосмет, фосфамидон, пиримикарб, профенофос, профлутрин, пропаргит, протрифенбут, 40 пифлубумид (1,3,5-триметил-N-(2-метил-1-оксопропил)-N-[3-(2-метилпропил)-4-[2,2,2-трифторметил-1-метокси-1-(трифторметил)этил]фенил]-1H-пиразол-4-карбоксамид), пиметрозин, пирафлупрол, пиретрин, пиридабен, пиридалил, пирифлухиназон, пириминостробин (метил (αE)-2-[[2-[(2,4-дихлорфенил)амино]-6-(трифторметил)-4-пиридинил]окси]метил]-α-(метоксиметилен)бензолацетат), пирипрол, пирипроксифен, 45 ротенон, рианодин, силафлуофен, спинеторам, спиносад, спиродиклофен, спиромезифен, спиротетрамат, сульпрофос, сульфоксафлор (N-[метилоксида[1-[6-(трифторметил)-3-пиридинил]этил]-λ⁴-сульфанилиден]цианамид), тебуфенозид, тебуфенпирад, тефлубензурон, тефлутрин, тербуфос, тетрахлорвинфос, тетраметрин,

тетраметилфлутрин ([2,3,5,6-тетрафтор-4-(метоксиметил)фенил]метил-2,2,3,3-тетраметилциклогексанкарбоксилат), тетрапирипрол, тиаклоприд, тиаметоксам, тиодикарб, тиосултап-натрий, тиоксазафен (3-фенил-5-(2-тиенил)-1,2,4-оксадиазол), толфенпираад, трапометрин, триазамат, трихлорфон, трифлумезопирим (2,4-диоксо-1-(5-пиримидинилметил)-3-[3-(трифторметил)фенил]-2Н-пиридо[1,2-а]пиримидиниевая внутренняя соль), трифлумурон, *Bacillus thuringiensis* дельта-эндотоксины, энтомопатогенные бактерии, энтомопатогенные вирусы и энтомопатогенные грибы.

Следует отметить инсектициды, такие как абамектин, ацетамиприд, акринатрин, афидопиропен, амитраз, авермектин, азадирахтин, бенфуракарб, бенсултап, бифентрин, бупрофезин, кадусафос, карбарил, картап, хлорантранилпрол, хлорфенапир, хлорпирифос, клотианидин, циантранилпрол, цикланилпрол, циклопротрин, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, гамма-цигалотрин, лямбда-цигалотрин, циперметрин, альфа-циперметрин, дзета-циперметрин, циромазин, дельтаметрин, диэльдрин, динотефуран, диофенолан, эмамектин, эндосульфан, эсфенвалерат, этипрол, этофенпрокс, этоксазол, фенитротион, фенотиокарб, феноксикарб, фенвалерат, фипронил, флометоквин, флоникамид, флубендиамид, флуфеноксурон, флуфеноксистробин, флуфенсульфон, флупипрол, флутирадифурон, флувалинат, форметанат, фостиазат, гептафлутрин, гексафлумурон, гидраметилон, имидаклоприд, индоксакарб, луфенурон, меперфлутрин, метафлумизон, метиодикарб, метомил, метопрен, метоксифенозид, метофлутрин, монофторотрин, нитенпирам, нитиазин, новалурон, оксамил, пифлубумид, пиметрозин, пиретрин, пиридабен, пиридалил, пириминостробин, пирипроксифен, рианодин, спинеторам, спиносад, спиродиклофен, спиромезифен, спиротетрамат, сульфоксафлор, тебуфенозид, тетраметрин, тетраметилфлутрин, тиаклоприд, тиаметоксам, тиодикарб, тиосултап-натрий, трапометрин, триазамат, трифлумезопирим, трифлумурон, *Bacillus thuringiensis* дельта-эндотоксины, все штаммы *Bacillus thuringiensis* и все штаммы вирусов ядерного полиэдроза.

Один вариант осуществления биологических агентов для смешивания с соединениями, предлагаемыми в настоящем изобретении, включает энтомопатогенные бактерии, такие как *Bacillus thuringiensis*, и капсулированные дельта-эндотоксины *Bacillus thuringiensis*, такие как биоинсектициды MVP[®] и MVPII[®], полученные по технологии CellCap[®] (CellCap[®], MVP[®] и MVPII[®] являются торговыми марками фирмы Mycogen Corporation, Indianapolis, Indiana, USA); энтомопатогенные грибы, такие как зеленые мускариновые грибы; и энтомопатогенные (природные и генетически модифицированные) вирусы, включая бакуловирус, вирус ядерного полиэдроза (NPV), такой как вирус ядерного полиэдроза *Helicoverpa zea* (HzNPV), вирус ядерного полиэдроза *Anagrapha falcifera* (AfNPV); и вирус гранулеза (GV), такой как вирус гранулеза *Cydia pomonella* (CpGV).

Следует особо отметить такую комбинацию, в которой другой обеспечивающий борьбу с беспозвоночным вредителем активный ингредиент относится к другому химическому классу или обладает иным центром воздействия, чем соединение формулы 1. В некоторых случаях комбинация по меньшей мере с одним другим обеспечивающим борьбу с беспозвоночным вредителем активным ингредиентом, обладающим сходным спектром борьбы, но иным центром воздействия, является особенно полезной для борьбы с резистентностью. Таким образом, композиция, предлагаемая в настоящем изобретении, может дополнительно включать биологически эффективное количество по меньшей мере одного дополнительного обеспечивающим борьбу с беспозвоночным вредителем активного ингредиента, обладающего сходным спектром борьбы но относящегося к другому химическому классу или обладающего иным центром

воздействия. Эти дополнительные биологически активные соединения или средства включают, но не ограничиваются только ими, ингибиторы ацетилхолинэстеразы (AChE), такие как карбаматы метомил, оксамил, тиодикарб, триазамат, и фосфороганические соединения хлорпирифос; регулируемые посредством GABA антагонисты хлоридных каналов, такие как циклодиены диэльдрин и эндосульфан, и фенилпиразолы этипрол и фипронил; модуляторы натриевых каналов, такие как пиретроиды бифентрин, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, лямбда-цигалотрин, циперметрин, дельтаметрин, димефлутрин, эсфенвалерат, метофлутрин и профлутрин; агонисты никотинового ацетилхолинового рецептора (nAChR), такие как неоникотиноиды ацетамиприд, клотианидин, динотефуран, имидаклоприд, нитенпирам, нитиазин, тиаклоприд, и тиаметоксам, и сульфоксафлор; аллостерические активаторы никотинового ацетилхолинового рецептора (nAChR), такие как спинозины спинеторам и спиносад; активаторы хлоридных каналов, такие как авермектины абамектин и эмамектин; имитаторы ювенильного гормона, такие как диофенолан, метопрен, феноксикарб и пирипроксиfen; селективные блокаторы питания равнокрылых, такие как пиметрозин и флоникамид; ингибиторы роста клещей, такие как этоксазол; ингибиторы митохондриальной АТФ-синтазы, такие как пропаргит; разобщители окислительного фосфорилирования путем нарушения протонного градиента, такие как хлорфенапир; блокаторы каналов никотинового ацетилхолинового рецептора (nAChR), такие как аналог нереистоксина картап; ингибиторы биосинтеза хитина, такие как бензоилмочевины флуфеноксурон, гексафлумурон, луфенурон, новалурон, новифлумурон и трифлумурон, и бупрофезин; средства, нарушающие линьку двукрылых, такие как циромазин; агонисты экдизонового рецептора, такие как диацилгидразины метоксифенозид и тебуфенозид; агонисты октопаминового рецептора, такие как амитраз; ингибиторы митохондриального комплекса III переноса электронов, такие как гидраметилнон; ингибиторы митохондриального комплекса I переноса электронов, такие как пиридабен; блокаторы потенциалзависимых натриевых каналов, такие как индоксакарб; ингибиторы ацетил-СоА-карбоксилазы, такие как тетроновая и тетраминовая кислоты спиродиклофен, спиромезифен и спиротетрамат; ингибиторы митохондриального комплекса II переноса электронов, такие как β -кетонитрилы циенопираfen и цифлуметофеен; модуляторы рианидинового рецептора, такие как диамиды антрапиля хлорантрапилипирол, циантрапилипирол и циантрапилипирол, диамиды, такие как флубендиамид, и лиганды рианидинового рецептора, такие как рианодин; соединения, для которых целевой сайт, ответственный за биологическую активность, неизвестен или неохарактеризован, такие как азадирахтин, бифеназат, пиридалил, пирифлухиназон и трифлумезопирим; микробиологические дезинтеграторы мемьян средней кишки насекомых, такие как *Bacillus thuringensis* и прелуцируемые ими дельта-эндотоксины и *Bacillus sphaericus*; и биологические агенты, включая вирусы ядерного полиэдроза (NPV) и другие природные или генетически модифицированные инсектицидные вирусы.

Другими примерами биологически активных соединений или средств, с которыми можно приготовить соединения, предлагаемые в настоящем изобретении, являются: фунгициды, такие как ацибензолар-S-метил, альдиморф, аметоктрадин, амисулбром, анилазин, азаконазол, азоксистробин, беналаксил (включая беналаксил-М), беноданил, беномил, бентиаваликарб (включая бентиаваликарб-изопропил), бензовиндифлупир, бетоксазин, бинапакрил, бифенил, битертанол, биксафен, бластицидин-S, боскалид, бромуконазол, бупирамат, бутиобат, карбоксин, карпропамид, каптафол, каптан, карбендазим, хлоронеб, хлороталонил, хлозолинат, гидроксид меди, оксихлорид меди,

сульфат меди, кумоксистробин, циазофамид, цифлуфенамид, цимоксанил, ципроконазол, ципродинил, дихлофлуанид, диклоцимет, дикломезин, диклоран, диэтофенкарб, дифеноконазол, дифлуметорим, диметиримол, диметоморф, димоксистробин, диниконазол (включая диниконазол-М), динокап, дитианон, дитиоланы, додеморф, 5 додин, эконазол, этаконазол, эдифенфос, эноксастробин (также известный, как энестробурин), эпоксионазол, этабоксам, этиримол, этридиазол, фамоксадон, фенамидон, фенаминстробин, фенаримол, фенбуконазол, фенфурам, фенгексамид, феноксанил, фенпиклонил, фенпропидин, фенпропиморф, фенпиразамин, ацетат фентина, гидроксид фентина, фербам, феримзон, флометоквин, флуазинам, флудиоксонил, 10 флуфеноксистробин, флуморф, флуопиколид, флуопирам, флуоксастробин, флухинконазол, флусилазол, флусульфамид, флутанил, флутоланил, флутриафол, флуксапироксад, фолпет, фталид (также известный, как фталид), фуберидазол, фуралаксил, фураметпир, гексаконазол, гимексазол, гуазатин, имазалил, имибенконазол, иминоктадин албезилат, иминоктадинтриацетат, иодикарб, ипконазол, изофетамид, 15 ипробенфос, ипродион, ипроваликарб, изопротиолан, изопиразам, изотианил, касугамицин, крезоксим-метил, манкозеб, мандистробин, манеб, мапанипирин, мепронил, мептилдинокап, металаксил (включая металаксил-М/ мефеноксам), метконазол, метасульфокарб, метирам, метоминостробин, метрафенон, миклобутанил, нафтитин, нео-асозин (метанарсонат железа(III)), нуаримол, октилион, 20 офорац, орисастробин, оксадиксил, оксатиопролин, оксолиновая кислота, окспоконазол, оксикарбоксин, окситетрациклин, пенконазол, пенцикурон, пенфлуfen, пентиопирад, перфуразоат, фосфорная кислота (включая ее соли, например, фосетил-алюминий), пикоксистробин, пипералин, полиоксин, пробеназол, прохлораз, процимидон, пропамокарб, пропиконазол, пропинеб, проквиназид, протиокарб, 25 протиоконазол, пираклостробин, пираметостробин, пираоксистробин, пиразофос, пирибенкарб, пирибутакарб, пирифенокс, пирифенон, перизоксазол, пираметанил, пирифенокс, пирролнитрин, пирохилон, хинконазол, хинметионат, хиноксилен, квинтоцен, силтиофам, седаксан, симеконазол, спироксамин, стрептомицин, серу, тебуконазол, тебуфлохин, теклофталам, текназен, тербинафин, 30 тетраконазол, тиабендазол, тифлузамид, тиофанат, тиофанат-метил, тирам, тиадинил, толкрофос-метил, толпрокарб, толилфлуанид, триадимефон, триадименол, триаримол, триазоксид, трехосновной сульфат меди, триклопирикарб, тридеморф, трифлоксистробин, трифлумизол, триморфамид, трициклазол, трифлоксистробин, трифорин, тритиконазол, униконазол, валидамицин, валифеналат (также известный, 35 как валифенал), винклозолин, зинеб, зирам, зоксамид и 1-[4-[4-[5-(2,6-дифторфенил)-4,5-дигидро-3-изоксазолил]-2-тиазолил]-1-пиперидинил]-2-[5-метил-3-(трифторметил)-1Н-пиразол-1-ил]этанон; нематоциды, такие как флуопирам, спиротетрамат, тиодикарб, фостиазат, абамектин, ипродион, флуенсульфон, диметилдисульфид, тиоксазафен, 1,3-дихлорпропен (1,3-D), метам (-натрий и -калий), дазомет, хлорпикрин, фенамифос, 40 этопрофос, кадусафос, тербуфос, имициафос, оксамил, карбофуран, тиоксазафен, *Bacillus firmus* и *Pasteuria nishizawai*; бактерициды, такие как стрептомицин; акарициды, такие как амитраз, хинметионат, хлорбензилат, цигексатин, дикофол, диенохлор, этоксазол, феназахин, фенбутатиноксид, фенпропатрин, фенпироксимат, гекситиазокс, пропаргит, пиридабен и тебуфенпирад.

45 В некоторых случаях комбинации соединения, предлагаемого в настоящем изобретении, с другими биологически активными (в особенности для борьбы с беспозвоночным вредителем) соединениями или средствами (т.е. активными ингредиентами) может привести к большему, чем аддитивный (т.е. синергетическому)

эффекту. Всегда желательно уменьшение количества активных ингредиентов, высвобождающихся в среде, с обеспечением эффективной борьбы с вредителем. Если синергизм обеспечивающих борьбу с беспозвоночным вредителем активных ингредиентов проявляется при нормах расхода, приводящих к агрономически

5 удовлетворительным степеням борьбы с беспозвоночным вредителем, такие комбинации могут быть полезными для уменьшения стоимости продукции сельскохозяйственной культуры и уменьшения нагрузки на окружающую среду.

Соединения, предлагаемые в настоящем изобретении, и содержащие их композиции можно наносить на растения, генетически трансформированные для экспрессии белков, 10 токсичных для беспозвоночных вредителей (таких как дельта-эндотоксины *Bacillus thuringiensis*). Такое нанесение может обеспечить более широкий спектр защиты растений и полезен для борьбы с резистентностью. Влияние экзогенного нанесения соединений, предлагаемых в настоящем изобретении, на борьбу с беспозвоночным вредителем может быть синергетическим с экспрессированными белковыми токсинами.

15 Общая литература по этим сельскохозяйственным средствам защиты (т.е. инсектицидам, фунгицидам, нематоцидам, акарицидам, гербицидам и биологическим средствам) включает The Pesticide Manual, 13th Edition, C. D. S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2003 and The BioPesticide Manual, 2nd Edition, L. G. Coping, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2001.

20 25 Борьбу с беспозвоночными вредителями проводят в агрономических и неагрономических условиях путем нанесения одного или большего количества соединений, предлагаемых в настоящем изобретении, обычно в форме композиции, в биологически эффективном количестве на среду, в которой находятся вредители, включая агрономический и/или неагрономический участок заражения, на защищаемые участки или прямо на вредителей, с которыми проводят борьбу.

Таким образом, настоящее изобретение включает способ борьбы с беспозвоночным вредителем в агрономических и/или неагрономических случаях, включающий взаимодействие беспозвоночного вредителя или окружающей его среды с биологически эффективным количеством одного или большего количества соединений, предлагаемых в настоящем изобретении, или с композицией, включающей по меньшей мере одно такое соединение или композицию, включающую по меньшей мере одно такое соединение и биологически эффективное количество по меньшей мере одного дополнительного биологически активного соединения или средства. Примеры подходящих композиций, включающих соединение, предлагаемое в настоящем изобретении, и биологически эффективное количество по меньшей мере одного дополнительного биологически активного соединения или средства, включают гранулированные композиции, в которых дополнительное активное соединение содержится в той же грануле, что и соединение, предлагаемое в настоящем изобретении, или в гранулах, отделенных от этих соединений, предлагаемых в настоящем изобретении.

40 45 Для обеспечения взаимодействия с соединением или композицией, предлагаемой в настоящем изобретении, для защиты полевой культуры от беспозвоночных вредителей, соединение или композицию обычно наносят на семена сельскохозяйственной культуры до высева, на листву (например, листья, стебли, цветки, плоды) сельскохозяйственных растений или на почву или другую среду для выращивания до или после высева сельскохозяйственной культуры.

Одним вариантом осуществления способа взаимодействия является опрыскивание. Альтернативно, гранулированную композицию, включающую соединение, предлагаемое в настоящем изобретении, можно наносить на листву растения или почву. Соединения,

предлагаемые в настоящем изобретении, также можно эффективно доставлять с помощью потребления растением путем взаимодействия растения с композицией, включающей соединение, предлагаемое в настоящем изобретении, наносимой в форме жидкого препарата для орошения почвы, гранулированного препарата на почву,

- 5 обработки ящика с рассадой или погружения саженцев. Следует отметить композицию, предлагаемую в настоящем изобретении, в форме жидкого препарата для орошения почвы. Также следует отметить способ борьбы с беспозвоночным вредителем, включающий взаимодействие беспозвоночного вредителя или окружающей его среды с биологически эффективным количеством соединения, предлагаемого в настоящем
- 10 изобретении, или с композицией, включающей биологически эффективное количество соединения, предлагаемого в настоящем изобретении. Также следует отметить этот способ, в котором окружающей средой является почва и композицию наносят на почву в форме препарата для орошения почвы. Также следует отметить, что соединения, предлагаемые в настоящем изобретении, также являются эффективными при местном
- 15 нанесении на зараженный участок. Другие методики взаимодействия включают нанесение соединения или композиции, предлагаемой в настоящем изобретении, путем прямого опрыскивания и опрыскивания раствором с последействием, опрыскивания с самолетов, использования гелей, нанесения покрытия на семена, использования микрокапсулированных препаратов, системного потребления, использования приманок,
- 20 ушных бирок, болясов, туманообразователей, фумигантов, аэрозолей, дустов и многое другое. Один вариант осуществления способа взаимодействия представляет собой обладающую стабильным размером гранулу, шашку или таблетку удобрения, включающую соединение или композицию, предлагаемую в настоящем изобретении. Соединениями, предлагаемыми в настоящем изобретении, также можно пропитать
- 25 материалы для изготовления устройств для борьбы беспозвоночными (например, противомоскитные сетки).

Соединения, предлагаемые в настоящем изобретении, применимы для обработки всех растений, частей растений и семян. Вариететы и сорта растений и семян можно получить по обычным методикам размножения и скрещивания или по методикам генной инженерии. Генетически модифицированные растения или семена (трансгенные растения или семена) являются такими, в которых гетерологичный ген (трансген) был стабильно встроен в геном растения или семени. Трансген, который определяется по его конкретному положению в геноме растения, называется трансформацией или трансгенным событием.

- 35 Генетически модифицированные сорта растения на участке, который можно обработать в соответствии с настоящим изобретением, включают такие, которые устойчивы по отношению к одному или большему количеству биотических стрессов (вредителям, таким как нематоды, насекомые, клещи, грибы и т.п.) или абиотических стрессов (засухе, низкой температуре, солености почвы и т.п.), или которые обладают
- 40 другими желательными характеристиками. Растения и семена можно генетически модифицировать для придания признаков, например, переносимости гербицида, устойчивости к насекомым, модифицированных профилей масел или переносимости засухи.

Обработка генетически модифицированных растений и семян соединениями, предлагаемыми в настоящем изобретении, может привести к превышающим аддитивные или синергетическим эффектам. Например, уменьшение норм расхода, расширение спектра активности, улучшенная переносимость биотических/абиотических стрессов или повышенная стабильность при хранении могут быть больше, чем ожидаемые

вследствие простых аддитивных последствий нанесения соединений, предлагаемых в настоящем изобретении, на генетически модифицированные растения и семена.

Соединения, предлагаемые в настоящем изобретении, также применимы в средствах для обработки семян для защиты семян от беспозвоночных вредителей. В настоящем

изобретении и формуле изобретения обработка семян означает взаимодействие семян с биологически эффективным количеством соединения, предлагаемого в настоящем изобретении, которое обычно готовят в виде композиции, предлагаемой в настоящем изобретении. Эта обработка семян защищает семена от беспозвоночных почвенных вредителей и обычно также может защищать корни и другие части соприкасающегося с почвой проростка, развившегося из проросшего семени. Обработка семян также может обеспечить защиту листьев за счет перемещения соединения, предлагаемого в настоящем изобретении, или второго активного ингредиента в растущем растении. Средства для обработки семян можно наносить на все типы семян, включая те, из которых прорастают растения, генетически модифицированные для экспрессирования специальных признаков. Типичные примеры включают растения, экспрессирующие белки, токсичные для беспозвоночных вредителей, такие как токсин *Bacillus thuringiensis*, или экспрессирующие стойкость к гербициду, такую как глифосатацетилтрансфераза, которая придает стойкость к глифосату. Средства для обработки семян, содержащие соединения, предлагаемые в настоящем изобретении, также могут увеличить мощность

растений, вырастающих из семян.

Одним способом обработки семян является опрыскивание или опрыскивание семян соединением, предлагаемым в настоящем изобретении (т.е. в виде приготовленной композиции), до высеваания семян. Композиции, приготовленные для обработки семян обычно включает пленкообразователь или kleящий агент. Поэтому обычно композиция

покрытия для семян, предлагаемая в настоящем изобретении, включает биологически эффективное количество соединения формулы 1, его N-оксида или соли, и пленкообразователь или kleящий агент. На семена путем опрыскивания можно нанести текучий концентрат суспензии в переворачивающемся слое семян и затем высушить семена. Альтернативно, на семена путем опрыскивания можно нанести препараты других типов, такие смачивающиеся порошки, растворы, суспензии, эмульгирующиеся концентраты и эмульсии в воде. Эта процедура является особенно подходящей для нанесения пленочных покрытий на семена. Для специалиста в данной области техники доступны различные машины и методики нанесения покрытий.

Подходящие методики включают приведенные в P. Kosters et al., *Seed Treatment: Progress and Prospects*, 1994 BCPC Mongraph No. 57, и цитированной в ней литературе.

Соединения формулы 1 и содержащие их композиции по отдельности и в комбинации с другими инсектицидами, нематоцидами и фунгицидами являются особенно подходящими для обработки семян сельскохозяйственных культур, включая, но не ограничиваясь только ими, maize или кукурузу, сою, хлопчатник, злаки (например, пшеницу, овес, ячмень, рожь и рис), картофель, овощи и масличный рапс.

Другие инсектициды, с которыми можно приготовить соединения формулы 1 с получением смесей, подходящих для обработки семян, включают абамектин, ацетамиприд, акринатрин, амитраз, авермектин, азадирактин, бенсултап, бифентрин, бупрофезин, кадусафос, карбарил, карбофуран, картап, хлорантранилипирол, хлорфенапир, хлорпирифос, клотианидин, циантранилипирол, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, гамма-цигалотрин, лямбда-цигалотрин, циперметрин, альфа-циперметрин, дзета-циперметрин, циромазин, дельтаметрин, дизельдрин, динотефуран, диофенолан, эмамектин, эндосульфан, эсфенвалерат, этипирол, этофенпрокс, этоксазол,

фенотиокарб, феноксикарб, фенвалерат, фипронил, флоникамид, флубендиамид, флуфеноксурон, флувалинат, форметанат, фостиазат, гексафлумурон, гидраметилнон, имидаклоприд, индоксакарб, луфенурон, метафлумизон, метиокарб, метомил, метопрен, метоксифенозид, нитенпирам, нитиазин, новалурон, оксамил, пиметрозин, пиретрин, 5 пиридабен, пиридалил, пирипроксиfen, рианодин, спинеторам, спиносад, спиродиклофен, спиромезифен, спиротетрамат, сульфоксафлор, тебуфенозид, тетраметрин, тиаклоприд, тиаметоксам, тиодикарб, тиосултап-натрий, трапометрин, триазамат, трифлумурон, *Bacillus thuringiensis* дельта-эндотоксины, все штаммы *Bacillus thuringiensis* и все штаммы вирусов ядерного полиэдроза.

10 Фунгициды, с которыми можно приготовить соединения формулы 1 с получением смесей, подходящих для обработки семян, включают амисулбром, азоксистробин, боскалид, карбендазим, карбоксин, цимоксанил, ципроконазол, дифеноконазол, диметоморф, флуазинам, флудиоксонил, флухинконазол, флуопиколид, флуокастробин, флутриафол, флуксапироксад, ипконазол, ипродион, металаксил, мефеноксам, 15 метконазол, миклобутанил, паклобутразол, пенфлуен, пикоксистробин, протиоконазол, пираклостробин, седаксан, силтиофам, тебуконазол, тиабендазол, тиофанат-метил, тирам, трифлоксистробин и тритиконазол.

20 Композиции, включающие соединения формулы 1, подходящие для обработки семян, могут дополнительно включать бактерии и грибы, которые обладают способностью обеспечивать защиту от вредных воздействий фитопатогенных грибов или бактерий и/или находящихся в почве животных, таких как нематоды. Бактерии, обладающие 25 нематоцидной способностью, могут включать, но не ограничиваются только ими, *Bacillus firmus*, *Bacillus cereus*, *Bacillus subtilis* и *Pasteuria penetrans*. Подходящим штаммом *Bacillus firmus* является штамм CNCM I-1582 (GB-126), который продается под названием BioNem™. Подходящим штаммом *Bacillus cereus* является штамм NCMM I-1592. Оба 30 штамма *Bacillus* раскрыты в US 6406690. Другими подходящими бактериями, обладающими нематоцидной способностью, являются *B. amyloliquefaciens* IN937a и *B. subtilis* штамм GB03. Бактерии, обладающие фунгицидной способностью, могут включать, но не ограничиваются только ими, *B. pumilus* штамм GB34. Виды грибов, 35 обладающие нематоцидной способностью, могут включать, но не ограничиваются только ими, *Myrothecium verrucaria*, *Paecilomyces lilacinus* и *Purpureocillium lilacinum*.

Средства для обработки семян также могут включать один или большее количество 35 нематоцидных средств природного происхождения, таких как раздражающий белок гаргин, который выделяют из некоторых бактериальных патогенов растений, таких как *Erwinia amylovora*. Примером является технология обработки семян Harpin-N-Tek под названием N-Habit™ Gold CST.

Средства обработки семян также могут включать один или большее количество 40 видов клубеньковых бактерий бобовых, таких как микросимбиотические азотфикссирующие бактерии *Bradyrhizobium japonicum*. Эти инокуляты могут необязательно включать один или большее количество липохитоолигосахаридов (LCOs), которые являются факторами образования клубеньков (Nod), производимыми микоризами во время инициирования образования клубеньков на корнях бобовых. Например, технология обработки семян торговой марки Optimize® включает LCO Promoter Technology™ в комбинации с инокулятом.

45 Средства обработки семян также могут включать один или большее количество изофлавонов, которые могут увеличивать степень колонизации корней микоризами. Микоризы улучшают рост растения путем увеличения потребления корнями питательных веществ, таких как вода, сульфаты, нитраты, фосфаты и металлы. Примеры

изофлавонов включают, но не ограничиваются только ими, генистеин, биоханин А, формононетин, дайдзein, глицитеин, гесперитин, налингенин и пратензейн. Формононетин выпускается в качестве активного ингредиента в микоризных инокулятах, таких как РНС Colonize® AG.

5 Средства обработки семян также могут включать один или большее количество активаторов растений, которые индуцируют системно приобретенную устойчивость растений после взаимодействия с патогеном. Примером активатора растения, который индуцирует такие защитные механизмы, является ацибензолар-S-метил.

Протравленные семена обычно содержат соединение, предлагаемое в настоящем изобретении, в количестве, равном примерно от 0,1 г до 1 кг на 100 кг семян (т.е. примерно от 0,0001 до 1 мас.% семян до обработки). Текущая суспензия, приготовленная для обработки семян, обычно включает от примерно 0,5 до примерно 70% активного ингредиента, от примерно 0,5 до примерно 30% пленкообразующего клея, от примерно 0,5 до примерно 20% диспергирующего агента, от 0 примерно до 5% загустителя, от 0 15 примерно до 5% пигмента и/или красителя, от 0 примерно до 2% противовспенивающего агента, от 0 примерно до 1% консерванта и от 0 примерно до 75% летучего жидкого разбавителя.

Соединения, предлагаемые в настоящем изобретении, также можно включать в композицию приманки, которую поедает беспозвоночный вредитель, или использовать 20 в устройстве, таком как ловушка, приманивающая установка и т.п. Такие композиции приманки могут находиться в форме гранул, которые включают (a) активные ингредиенты, а именно, биологически эффективное количество соединения формулы 1, его N-оксида или соли; (b) один или большее количество пищевых материалов; необязательно (c) аттрактант, и необязательно (d) один или большее количество 25 влагоудерживающих средств. Следует отметить гранулы или композиции приманки, которые включают примерно 0,001-5% активных ингредиентов, примерно 40-99% пищевого материала и/или аттрактанта; и необязательно примерно 0,05-10% влагоудерживающие средства, которые являются эффективными для борьбы в почве с беспозвоночными вредителями при очень низких нормах расхода, в частности, при 30 дозах активного ингредиента, которые летальны при проглатывании, а не при непосредственном соприкосновении. Некоторые пищевые материалы могут действовать, и как источник пищи, и как аттрактант. Пищевые материалы включают углеводы, белки и липиды. Примерами пищевых материалов являются растительная мука, сахар, крахмалы, животный жир, растительное масло, экстракты дрожжей и сухое молоко. 35 Примерами аттрактантов являются одоранты и вкусовые вещества, такие как плодовые или растительные экстракты, отдушка или другой животный или растительный компонент, феромоны или другие агенты, для которых известно, что они привлекают целевого беспозвоночного вредителя. Примерами влагоудерживающих средств, т.е. средств, удерживающих влагу, являются гликоли и другие полиолы, глицерин и сорбит. 40 Следует отметить композицию приманки (и способ применения такой композиции приманки), использующуюся для борьбы по меньшей мере с одним беспозвоночным вредителем, выбранным из группы, включающей муравьев, термитов и таракановых. Устройство для борьбы с беспозвоночным вредителем может включать композицию приманки, предлагаемую в настоящем изобретении, и кожух для размещения композиции 45 приманки, где кожух содержит по меньшей мере одно отверстие такого размера, чтобы беспозвоночный вредитель мог проникать через отверстие, так чтобы беспозвоночный вредитель мог получить доступ к указанной композиции приманки из положения за пределами кожуха, и где кожух дополнительно приспособлен для размещения на участке

возможной или установленной активности беспозвоночного вредителя или вблизи от него.

В одном варианте осуществления настоящее изобретение относится к способу борьбы с беспозвоночными вредителями, включающему разбавление водой пестицидной композиции, предлагаемой в настоящем изобретении (соединение формулы 1, приготовленное с поверхностно-активными веществами, твердыми разбавителями и жидкими разбавителями или приготовленная смесь соединения формулы 1 и по меньшей мере одного другого пестицида), и необязательно добавление вспомогательного вещества с образованием разбавленной композиции, и взаимодействие беспозвоночного вредителя или окружающей его среды с эффективным количеством указанной разбавленной композиции.

Хотя композиция для опрыскивания, полученная разбавлением водой с получением композиции, предлагаемой в настоящем изобретении, в достаточной концентрации, может обеспечить достаточную эффективность борьбы с беспозвоночными вредителями, в баковые смеси для опрыскивания также можно добавить отдельно приготовленные препараты вспомогательных веществ. Эти дополнительные вспомогательные вещества обычно называются "вспомогательными веществами для опрыскивания" или "вспомогательными веществами для баковой смеси" и включают любое вещество, смешанное в баке для опрыскивания для улучшения рабочих характеристик пестицида или изменения физических характеристик смеси для опрыскивания. Вспомогательные вещества могут представлять собой поверхностно-активные вещества, эмульгирующие агенты, растительные масла на основе нефти, масла из семян сельскохозяйственных растений, подкислители, буферы, загустители или пеноподавляющие агенты.

Вспомогательные вещества используют для повышения эффективности (например, биологической доступности, адгезии, проникновения, равномерности покрытия и длительности защиты) или сведения к минимуму или устранения затруднений при нанесении опрыскиванием, связанных с несовместимостью, вспениванием, сносом, испарением, улетучиванием и разложением. Для обеспечения оптимальных рабочих характеристик вспомогательные вещества выбирают в соответствии с характеристиками активного ингредиента, препарата и цели (например, сельскохозяйственных культур, насекомых-вредителей).

Из вспомогательных веществ для опрыскивания масла, включающие растительные масла, концентраты масел из культурных растений, концентраты растительных масел и концентраты метилированных растительных масел чаще всего используют для повышения эффективности пестицидов, возможно, путем стимулирования более ровного и равномерного осаждения при опрыскивании. В случаях, когда вызывает озабоченность фитотоксичность, которая может быть обусловлена маслами или другими не смешивающимися с водой жидкостями, композиции для опрыскивания, которые готовят из композиции, предлагаемой в настоящем изобретении, обычно не содержат вспомогательные вещества для опрыскивания на масляной основе. Однако в случаях, когда фитотоксичность, вызванная вспомогательными веществами для опрыскивания на масляной основе, с коммерческой точки зрения несущественна, композиции для опрыскивания, полученные из композиции, предлагаемой в настоящем изобретении, также может содержать вспомогательные вещества для опрыскивания на масляной основе, которые могут дополнительно обеспечивать усиленную борьбу с беспозвоночными вредителями, а также стойкость к дождю.

Продукты, описываемые, как "растительное масло", обычно содержат от 95 до 98% парафинового масла или нефтяного масла на основе нафты и от 1 до 2% одного или

большего количества поверхностно-активных веществ, действующих, как эмульгаторы. Продукты, описываемые, как "концентраты растительного масла", обычно содержат от 80 до 85% эмульгирующегося масла на основе нефти и от 15 до 20% неионогенных поверхностно-активных веществ. Продукты, корректно описываемые, как "концентраты 5 растительного масла", обычно от 80 до 85% растительного масла (т.е. масла из семян или плодов, чаще всего из хлопка, льна, сои или подсолнечника) и от 15 до 20% неионогенных поверхностно-активных веществ. Характеристики вспомогательного вещества можно улучшить путем замены растительного масла метиловыми эфирами жирных кислот, которые обычно получают из растительных масел. Примеры

10 концентратов метилированных растительных масел включают концентрат MSO[®] (UAP-Loveland Products, Inc.) и метилированное инсектицидное масло Premium MSO (Helena Chemical Company).

Количество вспомогательных веществ, добавляемых в смеси для опрыскивания, 15 обычно не превышает примерно 2,5 об.% и чаще количество равно от примерно 0,1 до примерно 1 об.%. Нормы расхода вспомогательных веществ, добавляемых в смеси для опрыскивания обычно равны примерно от 1 до 5 л на гектар. Типичные примеры вспомогательных веществ для опрыскивания включают: Adigor[®] (Syngenta) 47% метилированное рапсовое масло в жидких углеводородах, Silwet[®] (Helena Chemical 20 Company) модифицированный полиалкиленоксидом гептаметилтрисилоксан и Assist[®] (BASF) 17% смеси поверхностно-активных веществ в 83% минеральном масле на основе парафина.

Соединения, предлагаемые в настоящем изобретении, можно наносить без других 25 вспомогательных веществ, но чаще всего наносят препарат, включающий один или большее количество активных ингредиентов с подходящими носителями, разбавителями и поверхностно-активными веществами и, возможно, в комбинации с пищей в зависимости от конечного назначения. Одна методика нанесения включает опрыскивание водной дисперсией или раствором в рафинированном масле соединения, предлагаемого в настоящем изобретении. Комбинации с инсектицидными маслами, 30 концентратами инсектицидного масла, распределяющим средством, kleящими средствами, вспомогательными веществами, другими растворителями и синергетиками, такими как пиперонилбутоксид, часто повышают эффективность соединения. Для неагрономических применений такое опрыскивание можно проводить из контейнеров для опрыскивания, таких как бак, бутылка или другой контейнер, с помощью насоса 35 или путем высвобождения из контейнера, находящегося под давлением, например, аэрозольного баллона для опрыскивания, находящегося под давлением. Такие композиции для опрыскивания могут находиться в разных формах, например, спреи, воздушные дисперсии, пены, дымы или туман. Таким образом, такие композиции для опрыскивания могут дополнительно включать пропелленты, вспенивающие агенты и т.п. в зависимости от обстоятельств. Следует отметить композицию для опрыскивания, 40 включающую биологически эффективное количество соединения или композиции, предлагаемой в настоящем изобретении, и носитель. Один вариант осуществления таких композиций для опрыскивания включает биологически эффективное количество соединения или композиции, предлагаемой в настоящем изобретении, и пропеллент. 45 Типичные пропелленты включают, но не ограничиваются только ими, метан, этан, пропан, бутан, изобутан, бутен, пентан, изопентан, неопентан, пентен, гидрофтоглероды, хлорфтоглероды, диметиловый эфир и их смеси. Следует отметить композицию для опрыскивания (и способ использования таких композиций

для опрыскивания, подаваемых из контейнера для опрыскивания), использующуюся для борьбы по меньшей мере с одним беспозвоночным вредителем, выбранным из группы, включающей следующих: комары, мошки, жигалки обыкновенные, олени слепни, слепни, осы, настоящие осы, шерши, зудни, пауки, муравьи, гнус и т.п., в том

5 числе по отдельности или в комбинациях.

Описанные ниже исследования демонстрируют эффективность борьбы с помощью соединений, предлагаемых в настоящем изобретении, с конкретными вредителями. "Эффективность борьбы" означает подавление развития беспозвоночного вредителя (включая гибель), к которому приводит значительное уменьшение питания. Однако

10 защита от вредителей, обеспечиваемая соединениями, не ограничивается этими видами. В таблице индексов приведены описания соединений.

БИОЛОГИЧЕСКИЕ ПРИМЕРЫ ИЗОБРЕТЕНИЯ

Препарат и методология опрыскивания для исследований А-Е

Исследуемые соединения готовили с использованием раствора, содержащего 10%

15 ацетона, 90% воды и 300 част./млн распределяющего средства X-77® Lo-Foam Formula, неионогенного поверхностно-активного вещества, содержащего алкиларилполиоксиэтилен, свободные жирные кислоты, гликоли и изопропанол (Loveland Industries, Inc. Greeley, Colorado, USA). Приготовленные соединения наносили в 1 мл жидкости с помощью атомизирующего сопла SUJ2 со специальным корпусом 20 1/8 JJ (Spraying Systems Co. Wheaton, Illinois, USA), расположенного на 1,27 см (0,5 дюйма) выше верха каждого испытательного устройства. Исследуемые соединения наносили опрыскиванием при указанных нормах расхода и каждое исследование повторяли трижды.

Исследование А

25 Для исследования борьбы с молью капустной (*Plutella xylostella* (L.)) испытательное устройство состояло из небольшого открытого контейнера с растением горчицы в возрасте 12-14 дней внутри. Его предварительно заражали с помощью ~50 новорожденных личинок, которые вводили в испытательное устройство с помощью измельченного кукурузного початка с помощью инокулятора. После введения в 30 испытательное устройство личинки передвигались по исследуемому растению.

Исследуемые соединения готовили и наносили опрыскиванием в дозе 250 и/или 50 част./млн. После опрыскивания приготовленными исследуемыми соединениями, каждому испытательному устройству давали высыхать в течение 1 ч и затем сверху помещали черную крышку с сеткой. Испытательные устройства выдерживали в течение 6 дней в 35 камере для выращивания при 25°C и равной 70% относительной влажности. Затем визуально определяли повреждение растений вследствие поедания на основе количества съеденных листьев и определяли смертность личинок.

40 Соединения формулы 1 исследовали в дозе 250 част./млн, она обеспечивала показатели эффективности борьбы от хорошего до превосходного (40% или менее повреждение вследствие поедания и/или 100% смертность): 2.

Исследование В

Для исследования борьбы с цикадкой картофельной (*Empoasca fabae* (Harris)) 45 вследствие воздействия контактных и/или системных средств испытательное устройство состояло из небольшого открытого контейнера с растением фасоли Soleil в возрасте 5-6 дней (появились первичные листья) внутри. К верхнему слою почвы добавляли белый песок и один из первичных листьев отрезали до нанесения исследуемого соединения.

Исследуемые соединения готовили и наносили опрыскиванием в дозе 250 и/или 50

част./млн. После опрыскивания приготовленными исследуемыми соединениями, испытательным устройствам давали высыхать в течение 1 ч, затем их заражали с помощью 5 цикадок картофельных (взрослые в возрасте 18-21 дней). Сверху на испытательное устройство помещали черную крышку с сеткой и испытательные устройства выдерживали в течение 6 дней в камере для выращивания при 24°C и равной 70% относительной влажности. Затем для каждого испытательного устройства визуально определяли смертность насекомых.

Соединения формулы 1 исследовали в дозе 250 част./млн, она приводила к смертности, равной по меньшей мере 80%: 8, 14, 22 и 41.

10 Исследование С

Для исследования борьбы с тлей персиковой зеленой (*Myzus persicae* (Sulzer)) вследствие воздействия контактных и/или системных средств испытательное устройство состояло из небольшого открытого контейнера с растением редиса в возрасте 12-15 дней внутри. Его предварительно заражали путем помещения на лист исследуемого 15 растения 30-40 тлей на кусок листа, отрезанный от культурного растения (методика отрезания листа). Тли передвигались по исследуемому растению по мере высыхания куска листа. После предварительного заражения почву в испытательном устройстве покрывали слоем песка.

Исследуемые соединения готовили и наносили опрыскиванием в дозе 250 и/или 50 20 част./млн. После опрыскивания приготовленными исследуемыми соединениями каждому испытательному устройству давали высыхать в течение 1 ч и затем сверху помещали черную крышку с сеткой. Испытательные устройства выдерживали в течение 6 дней в камере для выращивания при 19-21°C и равной 50-70% относительной влажности. Затем для каждого испытательного устройства визуально определяли смертность насекомых.

25 Соединения формулы 1 исследовали в дозе 250 част./млн, она приводила к смертности, равной по меньшей мере 80%: 2, 8, 11, 12, 19, 21, 39, 41, 47 и 48.

Соединения формулы 1 исследовали в дозе 50 част./млн, она приводила к смертности, равной по меньшей мере 80%: 2, 6, 7, 8, 9, 11, 12, 13, 14, 15, 19, 21, 25, 26, 29, 30, 31, 34, 38, 39, 41, 43, 47 и 48.

30 Исследование D

Для исследования борьбы с тлей бахчевой (*Aphis gossypii* (Glover)) вследствие воздействия контактных и/или системных средств испытательное устройство состояло из небольшого открытого контейнера с растением хлопчатника в возрасте 6-7 дней 35 внутри. Его предварительно заражали с помощью 30-40 насекомых на куске листа по методике отрезания листа и почву в испытательном устройстве покрывали слоем песка.

Исследуемые соединения готовили и наносили опрыскиванием в дозе 250 и/или 50 част./млн. После опрыскивания испытательные устройства выдерживали в камере для выращивания в течение 6 дней при 19°C и равной 70% относительной влажности. Затем для каждого испытательного устройства визуально определяли смертность насекомых.

40 Соединения формулы 1 исследовали в дозе 250 част./млн, она приводила к смертности, равной по меньшей мере 80%: 7, 26, 39 и 41.

Соединения формулы 1 исследовали в дозе 50 част./млн, она приводила к смертности, равной по меньшей мере 80%: 1, 2, 5, 7, 8, 9, 11, 12, 13, 14, 15, 17, 18, 19, 21, 22, 25, 26, 31, 38, 41, 43, 46, 47, 48 и 49.

45 Исследование E

Для исследования борьбы с табачной белокрылкой (*Bemisia tabaci* (Gennadius)) вследствие воздействия контактных и/или системных средств испытательное устройство состояло из небольшого открытого контейнера с растением хлопчатника в возрасте

12-14 дней внутри. До нанесения опрыскиванием обе семядоли удаляли с растения, оставляя для исследования только один настоящий лист. Взрослым белокрылкам давали отложить яйца на растение и затем их удаляли из испытательного устройства. Растения хлопчатника, зараженные с помощью по меньшей мере 15 яиц направляли для

5 исследование опрыскиванием.

Исследуемые соединения готовили и наносили опрыскиванием в дозе 250 и/или 50 част./млн. После опрыскивания, испытательным устройствам давали высыхать в течение 1 ч. Затем цилиндры удаляли и устройства переносили в камеру для выращивания и выдерживали в течение 13 дней при 28°C и равной 50-70% относительной влажности.

10 Затем для каждого испытательного устройства визуально определяли смертность насекомых.

Соединения формулы 1 исследовали в дозе 250 част./млн, она приводила к смертности, равной по меньшей мере 50%: 12, 26, 30, 32, 33, 37, 38, 39, 40, 47 и 48.

15 Соединения формулы 1 исследовали в дозе 50 част./млн, она приводила к смертности, равной по меньшей мере 50%: 26.

Исследование F

Для исследования борьбы с трипсом цветочным западным (*Frankliniella occidentalis* (Pergande)) вследствие воздействия контактных и/или системных средств испытательное устройство состояло из небольшого открытого контейнера с растением фасоли Soleil 20 в возрасте 5-7 дней внутри.

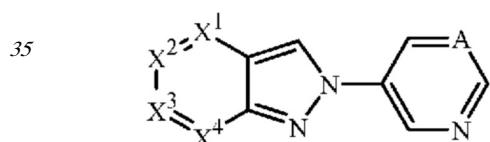
Исследуемые соединения готовили и наносили опрыскиванием в дозе 250 и/или 50 част./млн. После опрыскивания, испытательным устройствам давали высыхать в течение 1 ч, и затем в каждое устройство помещали 22-27 взрослых трипсов. Сверху помещали черную крышку с сеткой и испытательные устройства выдерживали в течение 6 дней 25 при 25°C и равной 45-55% относительной влажности.

Соединения формулы 1 исследовали в дозе 250 част./млн, она обеспечивала показатели эффективности борьбы от хорошего до превосходного (30% или менее повреждение растения и/или 100% смертность): 43, 47 и 48.

Соединения формулы 1 исследовали в дозе 50 част./млн, она приводила к смертности, 30 равной по меньшей мере 50%: 43, 47 и 48.

(57) Формула изобретения

1. Соединение, выбранное из числа соединений формулы 1:



1

40

в которой

А означает CH;

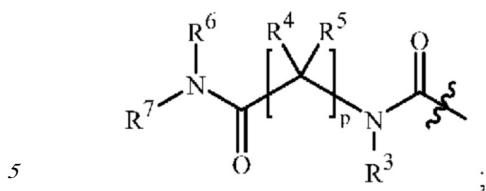
X¹ означает CR¹ и X² означает CH;

X³ означает CH;

45

X⁴ означает CH;

R¹ означает



R³ означает H;

каждый R⁴ независимо означает C₁-C₄ алкил;

каждый R⁵ независимо означает C₁-C₄ алкил;

р равно 1;

15 R⁶ означает NR¹³R¹⁴ или OR¹⁵; или C₁-C₆ алкил, замещенный одним или двумя R^y;

или C₃-C₆ циклоалкил, C₂-C₆ алкенил или C₂-C₆ алкинил, каждый является незамещенным

или замещен одним R^x; или Q^a;

R⁷ означает H или C₁-C₆ алкил;

каждый R^x независимо означает цианогруппу или C(O)OR¹⁶;

каждый R^y независимо означает цианогруппу C₃-C₆ циклоалкил, C₁-C₆ алcoxигруппу,

20 C(O)OR¹⁶, C(O)NR¹³R¹⁴, S(O)_nR¹⁸ или Q;

каждый R¹³ независимо означает H, C₁-C₆ алкил или C(O)R²²;

каждый R¹⁴ независимо означает H, C₁-C₆ алкил; или

25 R¹³ и R¹⁴ вместе с атомом азота, к которому они присоединены, образуют 3-5-членное кольцо, содержащее элементы кольца, выбранные из группы, включающей атомы углерода и один атом азота;

R¹⁵ означает C₁-C₄ алкил;

30 каждый R¹⁶ независимо означает H или C₁-C₄ алкил;

каждый R¹⁸ независимо означает C₁-C₄ алкил;

каждый R²² независимо означает C₁-C₆ алcoxигруппу;

35 каждый Q независимо означает фенил, 5- или 6-членное гетероциклическое ароматическое кольцо, содержащее элементы кольца, выбранные из группы, включающей атомы углерода и до 2 гетероатомов, независимо выбранных из группы, включающей один атом серы и до 2 атомов азота, или 4-6-членное гетероциклическое неароматическое кольцо, содержащее элементы кольца, выбранные из группы, включающей атомы углерода и до одного атома кислорода, каждое кольцо является незамещенным или содержит один заместитель, независимо выбранный из группы, включающей цианогруппу и C₁-C₄ алкил;

40 Q^a означает 3-5-членное неароматическое кольцо, содержащее элементы кольца, выбранные из группы, включающей атомы углерода и до одного атома кислорода, где до 1 элемента кольца атома углерода независимо выбран из C(=O); и

каждый n независимо равен 0, 1 или 2.

2. Соединение по п.1, в котором R⁷ означает H.

3. Композиция для борьбы с беспозвоночными вредителями, содержащая

биологически эффективное количество соединения по п. 1 и по меньшей мере один дополнительный компонент, выбранный из группы, включающей поверхностно-активные вещества, твердые разбавители и жидкие разбавители.

4. Способ борьбы с беспозвоночным вредителем, включающий контактирование

⁵ беспозвоночного вредителя или окружающей его среды с биологически эффективным количеством соединения по п. 1.

5. Применение соединения по п. 1 для проправливания семян путем контактирования семян с соединением по п. 1 в количестве, равном от примерно от 0,0001 до 1 мас.% от семян до обработки.

10

15

20

25

30

35

40

45