(19) SUOMI - FINLAND
(FI)

PATENTTI- JA REKISTERIHALLITUS
PATENT- OCH REGISTERSTYRELSEN
FINNISH PATENT AND REGISTRATION OFFICE

(10) **FI 931971 A7**

(12) **JULKISEKSI TULLUT PATENTTIHAKEMUS**
PATENTANSÖKAN SOM BLIVIT OFFENTLIG
PATENT APPLICATION MADE AVAILABLE TO THE PUBLIC

(21) Patenttihakemus - Patentansökan - Patent application 931971

(51) Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassifikation - International patent classification
C07D213/74
C07D215/42
A01N 43/40
A01N 43/42

(22) Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date **02.09.1992**

(23) Saapumispäivä - Ankomstdag - Reception date **30.04.1993**

(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig - Available to the public **30.04.1993**

(43) Julkaisupäivä - Publiceringsdag - Publication date **13.06.2019**

(86) Kansainvälinen hakemus - Internationell ansökan - International application **02.09.1992 PCT/US1992/007531**

(32) (33) (31) Etuoikeus - Prioritet - Priority

03.09.1991 US 753519

(71) Hakija - Sökande - Applicant

1 • **DowElanco,** 9002 Purdue Road, Indianapolis IN 46268, USA, AMERIKAN YHDYSVALLAT, (US)

(72) Keksijä - Uppfinnare - Inventor

1 • **Hackler, Ronald E.,** USA, AMERIKAN YHDYSVALLAT, (US)
2 • **Jourdan, Glen P.,** USA, AMERIKAN YHDYSVALLAT, (US)
3 • **Johnson, Peter L.,** USA, AMERIKAN YHDYSVALLAT, (US)
4 • **Thoreen, Brian R.,** USA, AMERIKAN YHDYSVALLAT, (US)
5 • **Samaritoni, Jack G.,** USA, AMERIKAN YHDYSVALLAT, (US)

(74) Asiamies - Ombud - Agent

Kolster Oy Ab, Salmisaarenaukio 1, 00180 Helsinki

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention

N-(4-pyridyyli- tai 4-kinolinyyli)aryyliasetamidipestisidejä

N-(-pyridyl)- eller 4-kinolinyl)arylacetamidpesticider

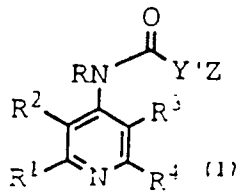
N-(4-pyridyyli- tai 4-kinolinyyli)aryyliasetamidipestisidejä

Tämä keksintö tarjoaa uusia yhdisteitä, jotka ovat käyttökelpoisia nematisideina, insektisideina, mitisideina ja kasvin fungisideina. Keksintö tarjoaa myös nematisidisiä, insektisidisiä, mitisidisiä ja fungisidisiä menetelmiä.

On olemassa akuutti tarve uusille nematisideille, insektisideille, mitisideille ja kasvin fungisideille. Saatavilla olevilla nematisideilla on tyypillisesti korkea nisäkästoksisuus ja niitä täytyy käyttää suurina määrinä. Nematisidi, jota voidaan käyttää pienempinä määrinä ja jolla on alhaisempi nisäkästoksisuus, edustaisi merkittävää edistysaskelta.

Punkit ja hyönteiset kehittävät resistenssiä nykyisessä käytössä olevia mitisidejä ja insektisidejä vastaan. Resistenssi insektisidejä kohtaan antropodeissa on laajalle levinnyt, vähintään 400 lajia on resistentti yhdelle tai useammalle insektisidille. Resistenssin kehittyminen joitakin vanhempia insektisidejä kohtaan, kuten DDT, karbamaatit ja organofosfaatit, tunnetaan hyvin. Mutta resistenssi on kehittynyt jopa joitakin uudempia pyretroidi-insektisidejä ja -mitisidejä kohtaa. Vastaavasti, kohdepatogeenit kehittävät nopeasti resistenssiä nykyisin käytettyjä fungisidejä vastaan. Ainakin 50 sienilajia on kehittänyt resistenssin bentsimidatsoli-fungisideja vastaan. Jopa äskettäin esitetyt fungisidit, kuten asyylialaniinit, jotka alunperin osoittivat erinomaista perunamyöhäishomesienen (potato late blight) ja viinirypäle- downy mildew'n kontrolloimista pellolla, ovat resistenssin vuoksi tulleet tehottomammiksi. Siksi on olemassa tarve uusille insektisideille, mitisideille ja fungisideille ja erityisesti yhdisteille, joilla on uusi tai ei-tyypillinen toimintatapa.

Tämä keksintö tarjoaa yhdisteitä, joilla on kaava (1):



(1)

ja niiden N-oksideja ja suoloja, joissa

R on H, C_{1-4}-alkyyli tai bentsyyli;

R^1, R^2, R^3 ja R^4 merkitsevät yhtä seuraavista:

a) R^3 ja R^4 ovat H, ja R^1 ja R^2 merkitsevät toisistaan riippumatta halogeenia, C_{1-4}-alkyyliä, halogeeni-C_{1-4}-alkyyliä, C_{3-4}-haarautunutta alkyyliä, C_{3-7}-sykloalkyyliä, C_{1-4}-alkoksia tai halogeeni-C_{1-4}-alkoksia;

b) yksi ryhmistä R^1, R^2, R^3, ja R^4 on C_{1-4}-alkyyli, C_{3-4}-haarautunut alkyyli, C_{1-4}-alkoksi, halogeeni-C_{1-4}-alkyyli, halogeeni-C_{1-4}-alkoksi, C_{1-4}-alkyylitio, C_{1-4}-alkyylisulfinyyli, C_{1-4}-alkyylisulfonyyli, aryyli tai substituoitu amino, ja muut ovat H;

c) R^1, R^2, R^3 ja R^4 merkitsevät toisistaan riippumatta H:ä tai halogeenia; tai

d) R^1 ja R^2 yhdistyvät, jolloin muodostuu tyydyttynyt tai tyydyttymätön C_{5-6}-karbosyklinen rengas, joka on mahdollisesti substituoitu yhdellä tai kahdella ryhmällä, jotka valitaan ryhmästä, jonka muodostavat halogeeni, C_{1-4}-alkyyli, C_{3-4}-haarautunut alkyyli, halogeeni-C_{1-4}-alkyyli, C_{3-7}-sykloalkyyli, C_{1-4}-alkoksi, halogeeni-C_{1-4}-alkoksi tai NO_2, ja R^3ja R^4 ovat H;

R^5 on H, C_{1-4}-alkyyli tai C_{1-4}-asyyli;

R^6 ja R^7 merkitsevät toisistaan riippumatta C_{1-4}-alkyyliä, C_{3-4}-haarautunut alkyyliä, fenyyliä tai substituoitua fenyyliä;

Y'Z yhdessä muodostaa tyydyttyneen tai tyydyttymättömän C_{4-11}-hiilivetyketjun, haarautumattoman tai haarautu-

neen, joka mahdollisesti sisältää heteroatomin, joka valitaan ryhmästä, jonka muodostavat O, NR^5, S, SO, SO_2 ja SiR^6R^7, jossa R^5, R^6, R^7 ovat edellä määriteltyjä, ja joka on mahdollisesti substituoitu yhdellä tai useammalla ryhmällä, jotka valitaan toisistaan riippumatta C_{1-4}-alkyylistä, C_{2-4}-alkenyylistä, C_{2-4}-alkynyylistä, haarautuneesta C_{3-7}-alkyylistä, C_{3-7}-sykloalkyylistä, C_{3-7}-sykloalkenyylistä, halogeenista, halogeeni-C_{1-4}-alkyylistä, halogeeni-C_{1-4}-alkoksista, hydroksista tai C_{1-4}-asyylistä; tai

Y' on sidos tai bivalenttinen hiilivetyradikaali, joka on 1 - 5 hiiliatomia pitkä, mahdollisesti substituoitu C_{1-4}-alkyylillä, C_{2-4}-alkenyylillä, C_{2-4}-alkynyylillä, haarautuneella C_{3-7}-alkyylillä, C_{3-7}-sykloalkyylillä tai C_{3-7}-sykloalkenyylillä, halogeenilla, halogeeni-C_{1-4}-alkyylillä, halogeeni-C_{1-4}-alkoksilla, hydroksilla, CN:lla tai C_{1-4}-asyylillä; ja

Z on

(a) aryyli tai

(b) C_{3-8}-sykloalkyyli tai sykloalkenyyli, joka on mahdollisesti substituoitu yhdellä tai useammalla ryhmällä, jotka valitaan toisistaan riippumatta C_{1-4}-alkyylistä, C_{1-4}-alkoksista, halogeeni-C_{1-4}-alkyylistä, halogeeni-C_{1-4}-alkoksista, halogeenista, hydroksista tai C_{1-4}-asyylistä; jossa

aryyli on

(a) fenyyliryhmä, joka on mahdollisesti substituoitu yhdellä tai useammalla ryhmällä, jotka valitaan toisistaan riippumatta seuraavista:

halogeeni,

I,

C_{3-8}-sykloalkyyli,

C_{3-8}-sykloalkenyyli,

fenoksi,

substituoitu fenoksi,

fenyylitio,

substituoitu fenyylitio,

fenyyli,

substituoitu fenyyli,

NO_2,

O
"
$-C-R^8$, jossa R^8 on C_{1-7}-alkyyli, halogeeni-C_{1-7}-alkyyli, C_{3-7}-haarautunut alkyyli, halogeeni-C_{3-7}-haarautunut alkyyli, C_{3-7}-sykloalkyyli, halogeeni-C_{3-7}-sykloalkyyli, C_{1-7}-alkoksi, fenyyli tai substituoitu fenyyli,

asetoksi,

OH,

CN,

$SiR^9R^{10}R^{11}$ tai $OSiR^9R^{10}R^{11}$, jossa R^9, R^{10} ja R^{11} merkitsevät toisistaan riippumatta C_{1-4}-alkyyliä, C_{3-4}-haarautunutta alkyyliä, fenyyliä, tai substituoitua fenyyliä,

$NR^{12}R^{13}$, jossa R^{12} ja R^{13} merkitsevät toisistaan riippumatta H:ä, C_{1-4}-alkyyliä tai C_{1-4}-asyyliä,

$S(O)R^{14}$ tai SO_2R^{14}, jossa R^{14} on C_{1-10}-alkyyli, fenyyli tai substituoitu fenyyli;

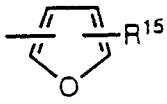
tyydyttynyt tai tyydyttymätön C_{1-12}-hiilivetyketju, haarautumaton tai haarautunut sisältäen mahdollisesti heteroatomin, joka valitaan ryhmästä, jonka muodostavat O, S, SO, SO_2, NR^5 ja SiR^6R^7, jossa R^5, R^6, R^7 ovat edellä määriteltyjä, ja joka on mahdollisesti substituoitu halogeenilla, halogeeni-C_{1-4}-alkoksilla, hydroksilla, C_{3-8}-sykloalkyylillä tai sykloalkenyylillä, C_{1-4}-asyylillä, fenoksilla, substituoidulla fenoksilla, fenyylillä, substituoitulla fenyylillä, fenyylitiolla tai substituoidulla fenyylitiolla;

C_{1-7}-alkoksi, joka on mahdollisesti substituoitu halogeenilla, fenyylillä, substituoidulla fenyylillä, C_{3-8}-sykloalkyylillä tai sykloalkenyylillä, fenoksilla tai substituoidulla fenoksilla;

C_{1-7}-alkyylitio, joka on mahdollisesti substituoitu halogeenilla, fenyylillä, substituoidulla fenyylillä,

C_{3-8}-sykloalkyylillä tai sykloalkenyylillä, fenoksilla tai substituoidulla fenoksilla;

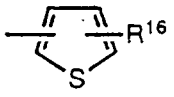
(b) furyyliryhmä, jolla on kaava (3)



(3)

jossa R^{15} on H, halogeeni, halogeenimetyyli, CN, NO_2, C_{1-4}-alkyyli, C_{3-4}-haarautunut alkyyli, fenyyli, C_{1-4}-alkoksi, halogeeni-C_{1-4}-alkoksi;

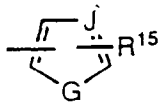
(c) tienyyliryhmä, jolla on kaava (4)



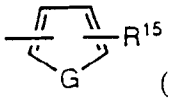
(4)

jossa R^{16} on H, halogeeni, halogeenimetyyli, CN, NO_2, C_{1-4}-alkyyli, C_{3-4}-haarautunut alkyyli, fenyyli, C_{1-4}-alkoksi, halogeeni-C_{1-4}-alkoksi tai tienyyli;

(d) ryhmä, jolla on kaava (5) tai (6)



(5)



(6)

jossa R^{15} on määritelty kappaleessa (b), J on N tai CH, ja G on O, NR^{17}, tai S, edellyttäen, että jos J ei ole N, silloin G on NR, jossa R^{17} on H, C_{1-4}-alkyyli, C_{1-4}-asyyli, fenyylisulfonyyli tai substituoitu fenyylisulfonyyli;

(e) ryhmä, joka valitaan

mahdollisesti substituoidusta naftyylistä, dihydronaftyylistä, tetrahydronaftyylistä ja dekahydronaftyylistä;

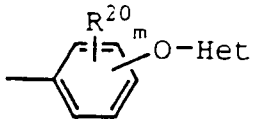
mahdollisesti substituoidusta indolyylistä;

1,3-bentsodioksolyylistä;

2,6-dimetyyli-4-morfolinyylistä; ja

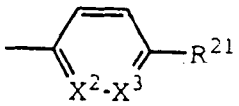
1-adamantyylistä;

(f) ryhmä, jolla on kaava



jossa m on 4; R^{20} on toisista riippumatta H, halogeeni, alempi alkyyli, alempi alkoksi, halogeenialkyyli, halogeenialkoksi, NO_2, CN, alempi alkyylikarbonyyli, fenoksi, tai substituoitu fenoksi, edellyttäen, että vähintään kaksi ryhmistä R^{20} valitaan H:sta ja F:stä; ja Het on pyridyyli, pyratsinyyli, pyrimidinyyli, tai pyridatsinyyli, joka on mahdollisesti substituoitu yhdellä tai useammalla ryhmällä, jotka valitaan halogeenista, alempi alkyylistä, alempi alkoksista, halogeenialkyylistä, halogeenialkoksista, NO_2:sta, CN:sta, ja alempi alkyylikarbonyylistä;

(g) ryhmä, jolla on kaava



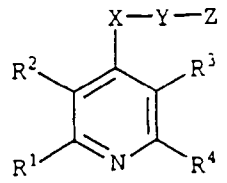
toinen ryhmistä X^2 ja X^3 on N ja toinen on CH;

R^{21} on $-Z-R^{22}$, fenyyli, tai substituoitu fenyyli;

Z on O tai S; ja

R^{22} on C_{1-4}-alkyyli, C_{3-7}-haarautunut alkyyli, halogeeni-C_{1-7}-alkyyli, halogeeni-C_{3-7}-(haarautunut alkyyli), C_{1-4}-alkoksisubstituoitu C_{1-4}-alkyyli, tai naftyyli tai fenyyli, joista kumpi tahansa voi mahdollisesti olla substituoitu enintään kolmella ryhmällä, jotka valitaan halogeenista, C_{1-10}-alkyylistä, haarautuneesta C_{3-7}-alkyylistä, halogeeni-C_{1-7}-alkyylistä, hydroksi-C_{1-7}-alkyylistä, C_{1-4}-alkoksista, halogeeni-C_{1-4}-alkoksista, fenoksista, substituoidusta fenoksista, fenyylistä, substituoidusta fenyylistä, CN:stä, NO_2:sta, OH:sta, C_{1-4}-alkanoyylioksista, tai bentsyylioksista.

Keksintö tarjoaa myös uusia yhdisteitä, joilla on kaava (1A):



(1A)

ja niiden N-oksideja ja suoloja, joissa

R^1, R^2, R^3 ja R^4 merkitsevät yhtä seuraavista:

a) R^3 ja R^4 ovat H, ja R^1 ja R^2 merkitsevät toisistaan riippumatta halogeenia, C_{1-4}-alkyyliä, halogeeni-C_{1-4}-alkyyliä, C_{3-4}-haarautunutta alkyyliä, C_{3-7}-sykloalkyyliä, C_{1-4}-alkoksia tai halogeeni-C_{1-4}-alkoksia;

b) yksi ryhmistä R^1, R^2, R^3, ja R^4 on C_{1-4}-alkyyli, C_{3-4}-haarautunut alkyyli, C_{1-4}-alkoksi, halogeeni-C_{1-4}-alkyyli, halogeeni-C_{1-4}-alkoksi, C_{1-4}-alkyylitio, C_{1-4}-alkyylisulfinyyli, C_{1-4}-alkyylisulfonyyli, aryyli tai substituoitu amino, ja muut ovat H;

c) R^1, R^2, R^3 ja R^4 merkitsevät toisistaan riippumatta halogeenia tai H:ä;

X on O, S, tai NR^5;

R^5 on H, C_{1-4}-alkyyli tai C_{1-4}-asyyli;

R^6 ja R^7 merkitsevät toisistaan riippumatta C_{1-4}-alkyyliä, C_{3-4}-haarautunutta alkyyliä, fenyyliä tai substituoitua fenyyliä;

YZ yhdessä muodostaa tyydyttyneen tai tyydyttymättömän C_{5-12}-hiilivetyketjun, haarautumattoman tai haarautuneen, joka mahdollisesti sisältää heteroatomin, joka valitaan ryhmästä, jonka muodostavat O, NR^5, S, SO, SO_2 ja SiR^6R^7, jossa R^5, R^6, R^7 ovat edellä määriteltyjä, ja joka on mahdollisesti substituoitu yhdellä tai useammalla ryhmistä, jotka valitaan toisistaan riippumatta C_{1-4}-alkyylistä, C_{2-4}-alkenyylistä, C_{2-4}-alkynyylistä, haarautuneesta C_{3-7}-alkyylistä, C_{3-7}-sykloalkyylistä, C_{3-7}-sykloalkenyylistä,

halogeenista, halogeeni-C_{1-4}-alkyylistä, halogeeni-C_{1-4}-alkoksista, hydroksista tai C_{1-4}-asyylistä; tai

Y on sidos tai bivalenttinen hiilivetyradikaali, joka on 1 - 6 hiiliatomia pitkä, mahdollisesti substituoitu yhdellä tai useammalla ryhmällä, jotka valitaan toisistaan riippumatta C_{1-4}-alkyylistä, C_{2-4}-alkenyylistä tai C_{3-7}-alkynyylistä, haarautuneesta C_{3-7}-alkyylistä, C_{3-7}-sykloalkyylistä, C_{3-7}-sykloalkenyylistä, halogeenista, halogeeni-C_{1-4}-alkyylistä, halogeeni-C_{1-4}-alkoksista, hydroksista tai C_{1-4}-asyylistä; ja

Z on

(a) aryyli tai

(b) C_{3-8}-sykloalkyyli tai sykloalkenyyli, mahdollisesti substituoitu yhdellä tai useammalla ryhmällä, jotka valitaan toisistaan riippumatta C_{1-4}-alkyylistä, C_{1-4}-alkoksista, halogeeni-C_{1-4}-alkyylistä, halogeeni-C_{1-4}-alkoksista, halogeenista, hydroksista tai C_{1-4}-asyylistä; jossa

aryyli on

(a) fenyyliryhmä, joka on mahdollisesti substituoitu yhdellä tai useammalla ryhmällä, jotka valitaan toisistaan riippumatta seuraavista:

halogeeni,

I,

C_{3-8}-sykloalkyyli,

C_{3-8}-sykloalkenyyli,

fenoksi,

substituoitu fenoksi,

fenyylitio,

substituoitu fenyylitio,

fenyyli,

substituoitu fenyyli,

NO_2,

O
"
-C

-R^8, jossa R^8 on C_{1-7}-alkyyli, halogeeni-C_{1-7}-alkyyli, C_{3-7}-haarautunut alkyyli, halogeeni-C_{3-7}-(haarautunut alkyyli), C_{3-7}-sykloalkyyli, halogeeni-C_{3-7}-sykloalkyyli, C_{1-7}-alkoksi, fenyyli tai substituoitu fenyyli,

asetoksi,

OH,

CN,

$SiR^9R^{10}R^{11}$ tai $OSiR^9R^{10}R^{11}$, jossa R^9, R^{10} ja R^{11} merkitsevät toisistaan riippumatta C_{1-4}-alkyyliä, C_{3-4}-haarautunutta alkyyliä, fenyyliä, tai substituoitua fenyyliä,

$NR^{12}R^{13}$, jossa R^{12} ja R^{13} merkitsevät toisistaan riippumatta H:ä, C_{1-4}-alkyyliä tai C_{1-4}-asyyliä,

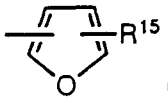
$S(O)R^{14}$ tai SO_2R^{14}, jossa R^{14} on C_{1-10}-alkyyli, fenyyli tai substituoitu fenyyli;

tyydyttynyt tai tyydyttymätön C_{1-12}-hiilivetyketju, haarautumaton tai haarautunut sisältäen mahdollisesti heteroatomin, joka valitaan ryhmästä, jonka muodostavat O, S, SO, SO_2, NR^5, ja SiR^6R^7, jossa R^5, R^6, R^7 ovat edellä määriteltyjä, ja joka on mahdollisesti substituoitu halogeenilla, halogeeni-C_{1-4}-alkoksilla, hydroksilla, C_{3-8}-sykloalkyylillä tai sykloalkenyylillä, C_{1-4}-asyylillä, fenoksilla, substituoidulla fenoksilla, fenyylillä, substituoitulla fenyylillä, fenyylitiolla tai substituoidulla fenyylitiolla;

C_{1-7}-alkoksi, joka on mahdollisesti substituoitu halogeenilla, fenyylillä, substituoidulla fenyylillä, C_{3-8}-sykloalkyylillä tai sykloalkenyylillä, fenoksilla tai substituoidulla fenoksilla; tai

C_{1-7}-alkyylitio, joka on mahdollisesti substituoitu halogeenilla, fenyylillä, substituoidulla fenyylillä, C_{3-8}-sykloalkyylillä tai sykloalkenyylillä, fenoksilla tai substituoidulla fenoksilla;

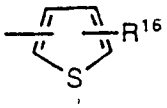
(b) furyyliryhmä, jolla on kaava (3)



(3)

jossa R^{15} on H, halogeeni, halogeenimetyyli, CN, NO_2, C_{1-4}-alkyyli, C_{3-4}-haarautunut alkyyli, fenyyli, C_{1-4}-alkoksi, halogeeni-C_{1-4}-alkoksi;

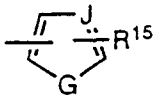
(c) tienyyliryhmä, jolla on kaava (4)



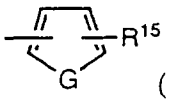
(4)

jossa R^{16} on H, halogeeni, halogeenimetyyli, CN, NO_2, C_{1-4}-alkyyli, C_{3-4}-haarautunut alkyyli, fenyyli, C_{1-4}-alkoksi, halogeeni-C_{1-4}-alkoksi tai tienyyli;

(d) ryhmä, jolla on kaava (5) tai (6)



(5)



(6)

jossa R^{15} on määritelty kappaleessa (b), J on N tai CH, ja G on O, NR^{17}, tai S, edellyttäen, että jos J ei ole N, silloin G on NR, jossa R^{17} on H, C_{1-4}-alkyyli, C_{1-4}-asyyli, fenyylisulfonyyli tai substituoitu fenyylisulfonyyli;

(e) ryhmä, joka valitaan

mahdollisesti substituoidusta naftyylistä, dihydronaftyylistä, tetrahydronaftyylistä ja dekahydronaftyylistä;

mahdollisesti substituoidusta pyridyylistä;

mahdollisesti substituoidusta indolyylistä;

1,3-bentsodioksolyylistä;

2,6-dimetyyli-4-morfolinyylistä; ja

1-adamantyylistä.

Keksintö tarjoaa myös menetelmän sukkulamatopopulaation inhiboimiseksi, joka käsittää sukkulamatoja inaktivoivan määrän kaavan (1) mukaista yhdistettä, joka on edellä määritelty, käytön sukkulamatopaikassa.

Keksintö tarjoaa myös menetelmän hyönteis- tai punkkipopulaation inhiboimiseksi, joka käsittää vaikuttavan hyönteisiä tai punkkeja inaktivoivan määrän kaavan (1) mukaista yhdistettä käyttämisen hyönteis- tai hämähäkkipaikkaan.

Keksintö tarjoaa myös menetelmän kasvipatogeenien inhiboimiseksi, joka käsittää vaikuttavan määrän kaavan (1) mukaista yhdistettä käyttämisen patogeenipaikkaan.

Koko tämän dokumentin ajan kaikki lämpötilat annetaan Celsius-asteina, ja kaikki prosenttiosuudet ovat painoprosenttiosuuksia ellei toisin ilmoiteta.

Termi "halogeeni" viittaa F-, Cl- tai Br-atomiin.

Termit "alkoksi", "halogeenialkyyli", "alkyylisulfinyyli" ja "alkyylisulfonyyli" viittaavat haarautumattoman ketjun ja haarautuneen ketjun ryhmiin.

Termit "substituoitu fenyyli", "substituoitu fenoksi", "substituoitu fenyylitio", ja "substituoitu fenyylisulfonyyli" viittaavat sellaisiin ryhmiin, joissa fenyylirengas on substituoitu enintään kolmella ryhmällä, jotka valitaan toisistaan riippumatta halogeenistä, I:sta, C_{1-10}-alkyylistä, haarautuneesta C_{3-6}-alkyylistä, halogeeni-C_{1-7}-alkyylistä, hydroksi-C_{1-7}-alkyylistä, C_{1-7}-alkoksista, halogeeni-C_{1-7}-alkoksista, fenoksista, substituoidusta fenoksista, fenyylistä, substituoidusta fenyylistä, NO_2:sta, OH:sta, CN:sta, C_{1-4}-alkanoyylistä, bentsoyylistä, C_{1-4}-alkanoyylioksista, C_{1-4}-alkoksikarbonyylistä, fenoksikarbonyylistä tai bentsoyylioksista.

Termit "substituoitu naftyyli" ja "substituoitu indolyyli" viittaavat näihin rengassysteemeihin, jotka on substituoitu yhdellä tai useammalla ryhmällä, jotka valitaan toisistaan riippumatta halogeenista, halogeeni-C_{1-4}-

alkyylistä, CN:sta, NO_2sta, C_{1-4}-alkyylistä, C_{3-4}-haarautuneesta alkyylista, fenyylistä, C_{1-4}-alkoksista tai halogeeni-C_{1-4}-alkoksista.

Termi "karbosyklinen rengas" viittaa tyydyttyneeseen tai tyydyttymättömään karbosykliseen renkaaseen, joka sisältää viisi tai kuusi hiiliatomia.

Termi "tyydyttymätön hiilivetyketju" viittaa hiilivetyketjuun, joka sisältää yhden tai useamman tyydyttymättömän kohdan.

Termi "HPLC" viittaa korkeapainenestekromatografiaan.

Termi "bivalenttinen hiilivetyradikaali" viittaa bivalenttisiin radikaaleihin, jotka johdetaan normaaleista alkaaneista poistamalla vetyatomeja kummastakin ketjun kahdesta päätehiiliatomista, esim. metyleeni, etyleeni, trimetyleeni, tetrametyleeni, jne.

Termi "substituoitu amino" viittaa aminoryhmään, joka substituoidaan yhdellä tai kahdella C_{1-4}-alkyyliryhmällä tai yhdellä C_{1-4}-alkanoyyliryhmällä.

Termi "alempi alkyyli" viittaa C_{1-6} haarautumattomiin hiilivetyketjuihin ja C_{3-6} haarautuneisiin ja syklisiin ryhmiin.

Termit "alempi alkenyyli" ja "alempi alkynyyli" viittaavat C_{2-6} haarautumattomiin hiilivetyketjuihin ja C_{3-6} haarautuneisiin hiilivetyryhmiin, jotka sisältävät ainakin yhden tyydyttymättömän sidoksen.

Termit "alempi alkoksi" ja "alempi alkyylitio" viittaavat O-(alempi alkyyli)- ja S-(alempi alkyyli)-ryhmiin.

Termi "halogeenialkyyli" viittaa alempi alkyyli ryhmiin, jotka on substituoitu yhdellä tai useammalla halogeeniatomilla.

Termi "halogeenialkoksi" viittaa alempi alkoksi ryhmiin, jotka on substituoitu yhdellä tai useammalla halogeeniatomilla.

Ellei toisin mainita, kun sanotaan, että ryhmä voi olla substituoitu yhdellä tai useammalla substituentilla, jotka valitaan identifioidusta luokasta, tarkoitetaan, että substituentit voidaan valita toisistaan riippumatta tästä luokasta.

Edullisiin kaavan (1) mukaisiin yhdisteisiin kuuluvat seuraavat luokat:

a) kaavan (1) mukaiset yhdisteet, joissa Y on $-CH_2-$;

b) kaavan (1) mukaiset yhdisteet, joissa Z on fenyyli;

c) kaavan (1) mukaiset yhdisteet, joissa Z on substituoitu fenyyliryhmä, kuten kappaleessa (a) edellä "aryylin" määrityksessä on määritelty;

d) kaavan (1) mukaiset yhdisteet, joissa Z on fenyyliryhmä, joka on substituoitu C_{2-4}-alkoksiryhmällä;

e) kaavan (1) mukaiset yhdisteet, joissa Z on fenyyliryhmä, joka on substituoitu C_{3-7}-haarautunut alkoksi -ryhmällä;

f) kaavan (1) mukaiset yhdisteet, joissa Z on fenyyliryhmä, joka on substituoitu halogeeni-C_{2-4}-alkoksiryhmällä;

g) kaavan (1) mukaiset yhdisteet, joissa Z on fenyyliryhmä, joka on substituoitu halogeeni-C_{3-7}-(haarautunut alkoksi)ryhmällä;

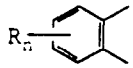
h) kaavan (1) mukaiset yhdisteet, joissa Z on fenyyliryhmä, joka on substituoitu fenoksilla tai substituoidulla fenoksiryhmällä;

i) minkä tahansa edellä olevien kaavojen c) - h) mukaiset yhdisteet, joissa fenyyliryhmä on monosubstituoitu 4-asemaan;

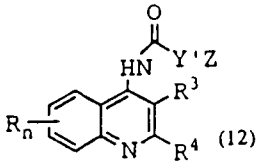
j) kaavan (1) mukaiset yhdisteet, joissa R^1 on C_{1-4}-alkyyli ja R^2 on halogeeni;

l) kaavan (1) mukaiset yhdisteet, joissa R^1 on etyyli ja R^2 on kloori;

m) kaavan (1) mukaiset yhdisteet, joissa R^1 ja R^2 yhdistyvät, jolloin muodostuu



so. kaavan (12) mukaiset yhdisteet:

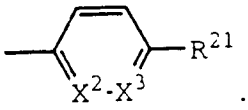


(12)

jossa Y' ja Z ovat edellä kaavalle (1) määriteltyjä, n on 1 tai 2, R valitaan toisista riippumatta halogeenista, C_{1-4}-alkyylistä, C_{3-4}-haarautuneesta alkyylistä, halogeeni-C_{1-4}-alkyylistä, C_{3-7}-sykloalkyylistä, C_{1-4}-alkoksista, halogeeni-C_{1-4}-alkoksista, tai NO_2:sta, ja R^3 ja R^4 ovat H;

n) yhdisteet, jotka on määritelty edellä kappaleessa m), joissa n on 0 tai n on 1 ja R on 8-fluori.

o) kaavan (1) mukaiset yhdisteet, joissa Z on ryhmä, jolla on kaava

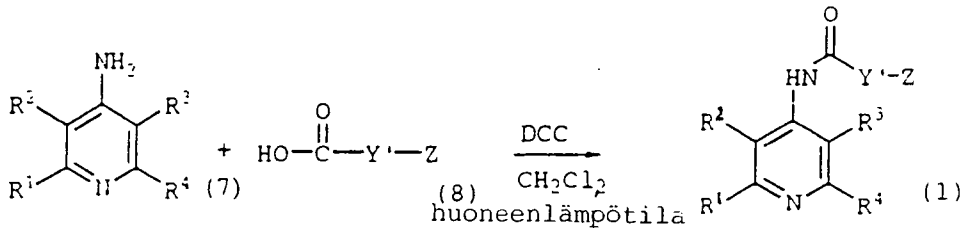


Synteesit

Tämän keksinnön yhdisteet valmistetaan käyttäen hyvin tunnettuja kemiallisia menetelmiä. Vaadittuja lähtöaineita saadaan kaupallisesti, tai ne syntetisoidaan helposti käyttäen standardimenetelmiä.

Kaavan (1) mukaisia yhdisteitä voidaan valmistaa käyttäen seuraavassa kaaviossa havainnollistettua menetelmää:

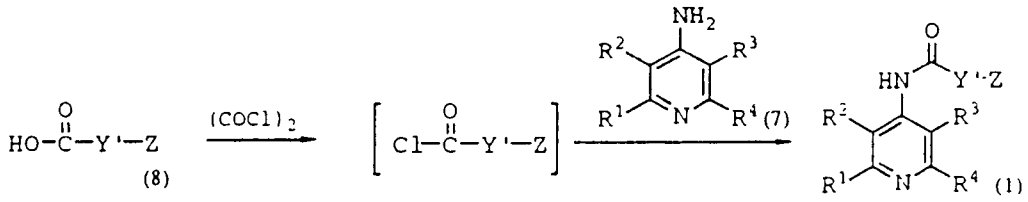
Kaavio 1



Tässä menetelmässä happojohdannainen (8) CH_2Cl_2:ssa sekoitetaan huoneenlämpötilassa ekvimolaarisen määrän kanssa 4-aminopyridiinijohdannaista (7). Tähän liuokseen lisätään ekvimolaarinen määrä 1,3-disykloheksyyli-karbodi-imidiä. Seosta sekoitetaan noin 20 tuntia, sitten suodatetaan. Jäännös otetaan talteen metyleenikloridiin ja suodatetaan uudelleen jäljelle jääneen 1,3-disykloheksyyliurean poistamiseksi.

Kaavan (1) mukaisia yhdisteitä voidaan valmistaa myös käyttäen kaavioissa 2 ja 3 havainnollistettuja menetelmiä.

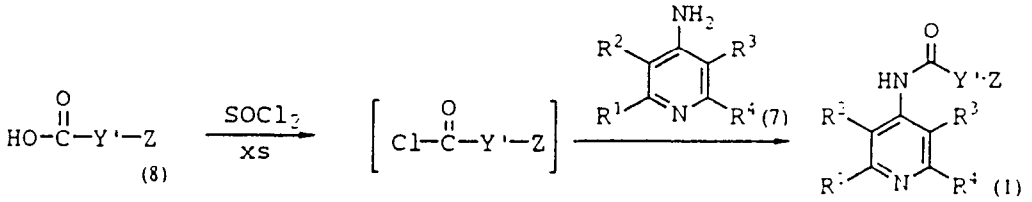
Kaavio 2



Kaaviossa 2 havainnollistetussa menetelmässä lisätään pieni ylimäärä oksalyylikloridia tipoittain karboksyylihapon (8) liuokseen sopivassa orgaanisessa liuottimessa, kuten THF, metyleenikloridi tai ksyleenit, käyttäen typpeä huoneenlämpötilassa. Seos voi sisältää myös 1 - 2 ekvivalenttia pyridiiniä tai trietyyliamiinia. Kun seosta oli sekoitettu 30 minuuttia - 2 tuntia, amiini, liuoksessa sopivassa orgaanisessa liuottimessa, kuten THF, metyleenikloridi tai ksyleeni, lisätään tipoittain. Seosta kuumen-

netaan palautusjäähdyttäen 8 - 24 tuntia, sitten annetaan jäähtyä huoneenlämpötilaan ja jakouutetaan 1 N natriumhydroksidilla ja etyylieetterillä. Vesifaasi uutetaan etyylieetterillä. Yhdistetyt orgaaniset aineet pestään vedellä ja kylläisellä natriumkloridiliuoksella, sitten kuivataan, suodatetaan ja väkevöidään.

Kaavio 3

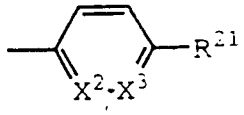


Kaavion 3 havainnollistamassa menetelmässä happojohdannaista (8) kuumennetaan palautusjäähdyttäen ylimäärässä tionyylikloridia noin kaksi tuntia. Tionyylikloridiylimäärä poistetaan sitten alentamalla painetta. Jäännökseen lisätään sitten aminopyridiinin (7) ja mahdollisesti noin kahden ekvivalentin trietyyliamiinia liuosta sopivassa orgaanisessa liuottimessa, kuten asetonitriili, tolueeni tai ksyleeni. Seosta kuumennetaan palautusjäähdyttäen 8 - 24 tuntia, annetaan sitten jäähtyä huoneenlämpötilaan ja jakouutetaan 1 N natriumhydroksidilla ja etyylieetterillä. Vesifaasi uutetaan etyylieetterillä. Yhdistetyt orgaaniset aineet pestään vedellä ja kylläisellä natriumkloridiliuoksella, sitten kuivataan, suodatetaan ja väkevöidään.

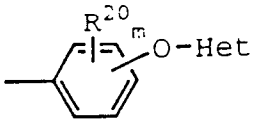
Kaavan (7) mukaisia yhdisteitä voidaan valmistaa käyttäen tunnettuja menetelmiä. Esimerkiksi, 2-alkyyli-4-amino-3-bromipyridiinin ja 2-alkyyli-4-amino-3-klooripyridiinin johdannaisten valmistus kuvataan julkaisussa J. Med. Chem. vol. 32, sivut 1 970 - 77 (1989). J. Prakt. Chem., vol. 331, sivut 369 - 374 (1989) kuvaa aminopikoliinien bromauksen, josta saadaan muita käyttökelpoisia lähtöaineita. Kaavan (7) mukaisia yhdisteitä voidaan val-

mistaa myös pelkistämällä vastaavia atsideja samanlaisilla menetelmillä kuin J. Prakt. Chem., vol 327, sivut 521 - 522 (1985), kuten havainnollistetaan valmistuksessa 2 tämän jälkeen.

Karboksyylihappojohdannaisia, joilla on kaava (8), jossa Z on fenyyli tai substituoitu fenyyli, voidaan valmistaa käyttäen tunnettuja menetelmiä, jotka havainnollistetaan kaaviossa 4. Karboksyylihappojohdannaisia, joilla on kaava (8), jossa Z on ryhmä, jolla on kaava



voidaan valmistaa käyttäen analogista menetelmää. Karboksyylihappojohdannaisia, joilla on kaava (8), jossa Z on ryhmä, jolla on kaava



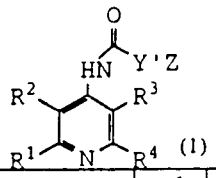
voidaan valmistaa saattamalla p-hydroksifenyylietikkahappo reagoimaan sopivan kloorisubstituoidun heterosyklisen yhdisteen kanssa, kuten havainnollistetaan tämän jälkeen valmistuksessa 3.

Kaavan (1) mukaisten yhdisteiden N-oksideja ja suoloja saadaan tavanomaisella tavalla.

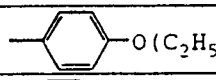
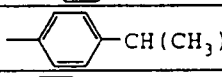
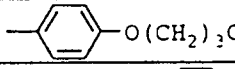
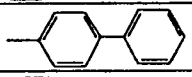
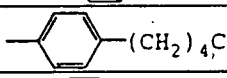
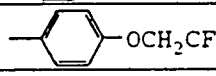
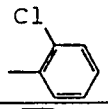
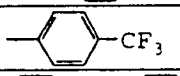
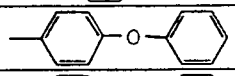
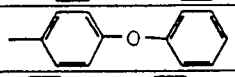
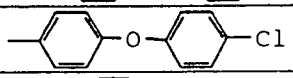
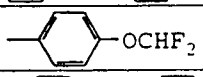
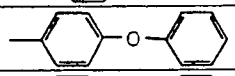
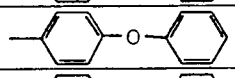
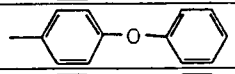
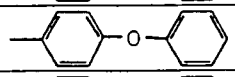
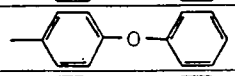
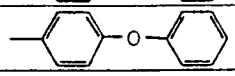
Esimerkkejä

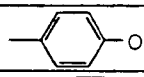
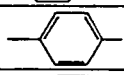
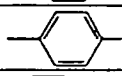
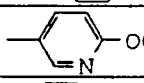
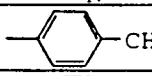
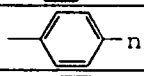
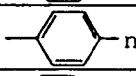
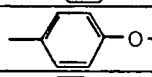
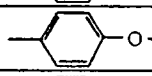
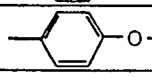
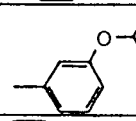
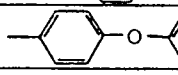
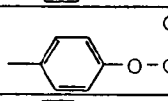
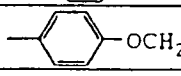
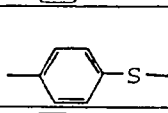
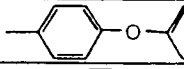
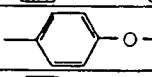
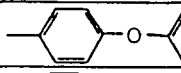
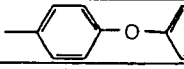
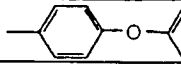
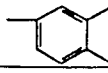
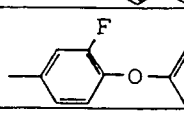
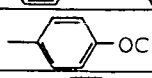
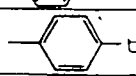
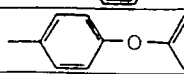
Seuraavat taulukot identifioivat kaavan (1) mukaisia yhdisteitä, jotka valmistettiin menetelmillä, joita havainnollistetaan edellä olleissa kaavioissa. Yksityiskohtaiset esimerkit, jotka havainnollistavat esimerkki yhdisteiden valmistusta seuraavat taulukoita.

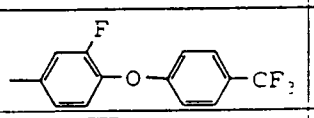
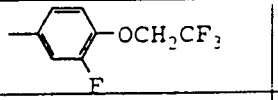
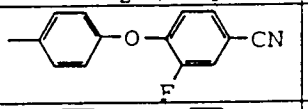
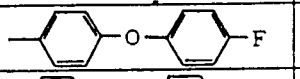
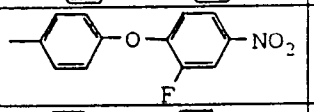
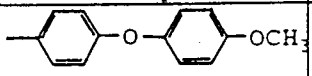
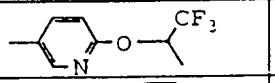
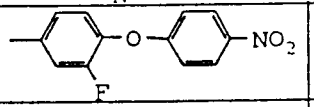
Taulukko I



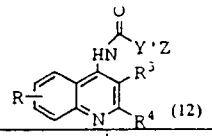
(I)

Yhdiste	Y'	Z	R^1	R^2	R^3	R^4	Sp. °C
1	CH_2		H	H	H	H	104-105
2	CH_2		H	H	H	H	Öljy
3	CH_2		H	H	H	H	107
4	CH_2		H	H	H	H	145
5	CH_2		H	H	H	H	87
6	CH_2		H	H	H	H	120
7	CH_2		H	H	H	H	60
8	CH_2		H	H	H	H	148
9	CH_2		H	H	H	H	
10	CH_2		CH_3	CH_3	H	H	92
11	CH_2		CH_3	CH_3	H	H	148
12	CH_2		CH_3	CH_3	H	H	146
13	CH_2		CH_3	H	H	H	<50
14	CH_2		H	H	Cl	CH_3	152
15	CH_2		F	F	F	F	138
16	CH_2		H	H	H	C_2H_5	Vaha
17	CH_2		H	Cl	Cl	CH_3	139
18	CH_2		H	H	Cl	C_2H_5	öljy

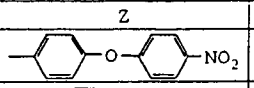
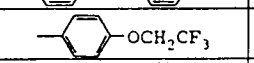
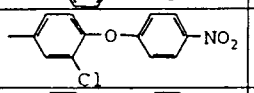
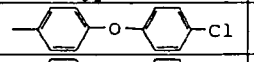
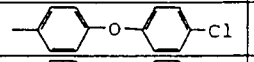
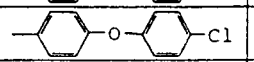
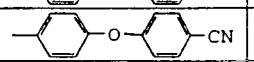
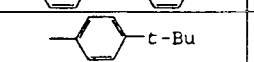
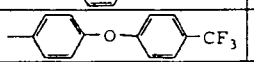
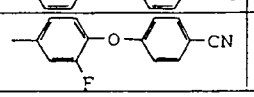
Yhdiste	Y'	Z	R^1	R^2	R^3	R^4	Sp. °C
19	CH_2		H	H	Cl	C_2H_5	121
20	CH_2		H	H	Cl	C_2H_5	98
21	CH_2		H	H	Cl	C_2H_5	107
22	CH_2		H	H	Cl	C_2H_5	104
23	CH_2		H	H	Cl	C_2H_5	90
24	CH_2		H	H	Cl	C_2H_5	102
25	CH_2		H	H	Cl	C_2H_5	92
26	CH_2		H	H	Cl	H	88
27	CH_2		H	H	CH_3	H	58-61
28	CH_2		CH_3	H	CH_3	H	122
29	CH_2		H	H	Cl	C_2H_5	63-66
30	CH_2		H	H	Cl	C_2H_5	72-74
31	CH_2		H	H	Cl	C_2H_5	75
32	CH_2		H	H	Cl	C_2H_5	102
33	CH_2		H	H	Cl	C_2H_5	166
34	CH_2		H	H	Cl	C_2H_5	101.3
35	CH_2		CH_3	H	H	CH_3	56
36	CH_2		H	H	Cl	C_2H_5	96
37	CH_2		H	H	Cl	C_2H_5	120-122
38	CH_2		H	H	Br	C_2H_5	73-75
39	CH_2		H	H	Cl	C_2H_5	140-141
40	CH_2		H	H	Cl	C_2H_5	102-103
41	CH_2		H	H	H	C_2H_5	132-133
42	CH_2		H	H	H	C_2H_5	105-106
43	CH_2		H	H	H	C_2H_5	117-119

Yhdiste	Y'	Z	R^1	R^2	R^3	R^4	Sp. °C
44	CH_2		H	H	Cl	C_2H_5	119-120
45	CH_2		H	H	Cl	C_2H_5	112-114
46	$CHCH_3$	$(CH_2)_7CH_3$	H	H	Cl	C_2H_5	52-53
47	CH_2		H	H	Cl	C_2H_5	117-119
48	CH_2		H	H	Cl	C_2H_5	84-86
49	CH_2		H	H	Cl	C_2H_5	139
50	CH_2		H	H	Cl	C_2H_5	öljy
51	CH_2		H	H	Cl	C_2H_5	öljy
52	CH_2		H	H	Cl	C_2H_5	152-154
53	CH_2	$(CH_2)_5CH_3$	H	H	Cl	C_2H_5	58-60
54	CH_2	$(CH_2)_7CH_3$	H	H	Cl	C_2H_5	63-65
55	CH_2	$(CH_2)_9CH_3$	H	H	Cl	C_2H_5	78-80

Taulukko II

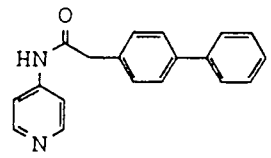


(12)

Yhdiste	Y'	Z	R	R^3	R^4	Sp. °C
56	CH_2		8-F	H	H	167-169
57	CH_2		8-F	H	H	168-170
58	CH_2		8-F	H	H	Lasi
59	CH_2		8-F	H	H	169
60	CH_2		H	H	CH_3	128-130
61	CH_2		H	H	H	165-167
62	CH_2		8-F	H	H	123-125
63	CH_2		8-F	H	H	Öljy
64	CH_2		8-F	H	H	145-147
65	CH_2		8-F	H	H	110-112

Esimerkki 1

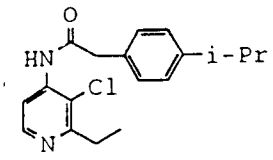
N-(4-pyridyyli)-4-bifenyyliasetamidi (Yhdiste 4)



Liuokseen, jonka muodostivat 0,941 g (10 mmol) 4-aminopyridiiniä ja 2,123 g 4-bifenyylietikkahappoa 50 ml:ssa metyleenikloridia, lisättiin 2,063 g 1,3-disykloheksyylikarbodi-imidiä. Kun seosta oli sekoitettu huoneenlämpötilassa noin 24 tuntia, seos suodatettiin ja väkevöitiin. Jäännös otettiin talteen metyleenikloridiin, suodatettiin ja väkevöitiin, jolloin saatiin 2,997 g hiutaleista, vaalean vihreää kiinteää ainetta. Tämä uudelleenkiteytettiin heksaani/etyyliasetaatista ja kuivattiin tyhjöuunissa, jolloin saatiin 2,138 g vaalean vihreää kiinteää ainetta. Saanto 74 %. Sp. 145,3 °C.

Esimerkki 2

N-(3-kloori-2-etyyli-4-pyridyyli)(4-isopropyylifenyyli)asetamidi (Yhdiste 23)

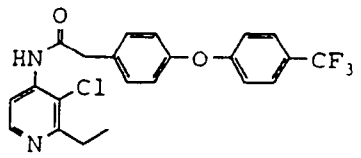


Oksalyylikloridia (0,48 ml, 5,50 mmol) lisättiin 4-isopropyylifenyylietikkahapon (0,935 g, 5,25 mmol) liuokseen 20 ml:ssa ksyleeniä huoneenlämpötilassa. Kun seosta oli sekoitettu noin 15 minuuttia, lisättiin 0,8 ml pyridiiniä. Seosta sekoitettiin vielä 30 minuuttia, jonka jälkeen lisättiin 4-amino-3-kloori-2-etyylipyridiiniä (0,783 g, 5,00 mmol), ja saatua seosta kuumennettiin palautusjäähdyttäen. Kun oli palautusjäähdytetty noin 17 tuntia, seoksen annettiin jäähtyä huoneenlämpötilaan ja

jakouutettiin 1 N NaOH:lla (75 ml) ja etyylieetterillä (75 ml). Vesifaasi uutettiin etyylieetterillä (75 ml). Yhdistetyt orgaaniset aineet pestiin vedellä (1 x 100 ml), kylläisellä NaCl:lla (1 x 100 ml), ja sitten kuivattiin, suodatettiin ja väkevöitiin, jolloin saatiin 1,71 g ruskeaa öljyä. Öljy kromatografoitiin silikageelillä, eluoiden 80 % heksaani/20 % EtOAc:lla. Päätuotteen eristyksestä saatiin 0,391 g haluttua yhdistettä kiinteänä aineena. Sp. 90 °C.

Esimerkki 3

N-(3-kloori-2-etyyli-4-pyridyyli)(4-((4-(trifluorimetyyli)fenyyli)oksi)fenyyli)asetamidi (Yhdiste 34)



(4-((4-(trifluorimetyyli)fenyyli)oksi)fenyyli)etikkahapon (1,05 g, 3,5 mmol) ja 20 ml:n tionyylikloridin seosta kuumennettiin palautusjäähdyttäen. Kun oli palautusjäähdytetty kaksi tuntia, tionyylikloridiylimäärä poistettiin alentamalla painetta. Jäännöstä käsiteltiin sitten 4-amino-3-kloori-2-etyylipyridiinin ja 1 ml:n trietyyliamiinin liuoksella 20 ml:ssa asetonitriiliä. Seosta kuumennettiin ja annettiin refluksoitua noin 24 tuntia, sitten jäähdytettiin huoneenlämpötilaan ja jakouutettiin 1 N NaOH:lla (75 ml) ja etyylieetterillä (75 ml). Vesifaasi uutettiin etyylieetterillä (75 ml). Yhdistetyt orgaaniset aineet pestiin vedellä (1 x 75 ml), kylläisellä NaCl:lla (1 x 75 ml), ja sitten kuivattiin, suodatettiin ja väkevöitiin, jolloin saatiin 1,32 g keltaista öljyä. Se kromatografoitiin silikageelillä, eluoiden 80 % heksaani/20 % EtOAc:lla. Päätuotteen eristyksestä saatiin 0,202 g haluttua yhdistettä kiinteänä aineena. Sp. 101,3 °C.

Valmistus 1

4-atsido-8-fluorikinoliini

Seosta, jonka muodostivat 2,08 g (0,0114 mol) 4-kloori-8-fluorikinoliinia, 1,12 g (0,0172 mol) natriumatsidia ja 4,10 g (0,0127 mol) tetrabutyyliammoniumbromidia 70 ml:ssa dikloorimetaania ja 25 ml:ssa vettä, palautusjäähdytettiin yön yli. Kerrokset erotettiin sitten ja orgaaninen kerros pestiin kerran vedellä, vietiin faasinerotuspaperin läpi, ja väkevöitiin öljyksi, joka trituroitiin eetterillä. Kiinteä aine suodatettiin ja suodos väkevöitiin, jolloin saatiin 2,0 g otsikon tuotetta.

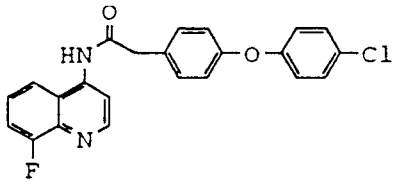
Valmistus 2

4-amino-8-fluorikinoliini

4-atsido-8-fluorikinoliinin liuokseen 12 ml:ssa absoluuttista etanolia 15 - 20 °C:ssa lisättiin 0,57 g:n (0,015 mol) erä natriumboorihydridiä. Havaittiin voimakas eksotermi voimakkaan kaasun muodostumisen kera. Liuos jäähdytettiin jäässä ja hydridijäännös lisättiin pieninä annoksina viiden minuutin aikana. Jäähaude poistettiin sitten. Noin kahden tunnin kuluttua seos kaadettiin noin 200 ml:aan jäävettä. Sakka otettiin talteen ja ilma-kuivattiin yön yli. Saanto 1,35 g. Sp. 184 - 186 °C.

Esimerkki 4

N-(8-fluori-4-kinolinyyli)(4-((4-kloorifenyyli)oksi)fenyyli)asetamidi (Yhdiste 59)



0,63 g:n (0,0024 mol) (4-(4-kloorifenyyli)oksi)fenyylietikkahapon ja ylimäärän (10 ml) tionyylikloridia seosta palautusjäähdytettiin kaksi tuntia. Tionyylikloridin ylimäärä poistettiin sitten alentamalla painetta,

jäännös otettiin talteen ksyleeniin ja lisättiin 0,39 g (0,0024 mol) 4-amino-8-fluorikinoliinia. Seosta palautusjäähdytettiin yön yli. Ksyleeni poistettiin alentamalla painetta, jäännös otettiin sitten talteen metyleenikloridiin ja saatu seos pestiin kerran vedellä ja kerran 0,1 N natriumhydroksidilla. Vesikerroksen pH säädettiin arvoon 7, ja tuote uutettiin etyyliasetaatilla. Metyleenikloridi- ja etyleenikloridikerrokset yhdistettiin ja kuivattiin, väkevöitiin öljyksi. NMR osoitti, että tuote oli lähtöainehapon ja halutun tuotteen seos. Tuote otettiin talteen metyleenikloridiin, pestiin emäksellä (0,1 N natriumhydroksidi), kuivattiin ja väkevöitiin öljyksi. Tämä kromatografoitiin 100-%:isella CH_2Cl_2:lla → 10-%:isella CH_2Cl_2/EtOAc:lla 2 %/litra lisääntymisellä, ja 0,14 g otsikon tuotetta otettiin talteen. Tämä sekoitettiin heksaanin kanssa ja suodatettiin, jolloin saatiin vaalean ruskeaa kiinteää ainetta. Saanto 0,13 g. Sp. 169 °C.

Valmistus 3

4-(3-kloori-6-pyridatsinyylioksi)fenyylietikkahappo

Seokseen, jonka muodosti 0,54 g (0,013 mol, 2,0 ekviv.) 60-%:ista natriumhydridi/mineraaliöljydispersiota 10 ml:ssa kuivaa DMF:a, lisättiin tipoittain huoneenlämpötilassa 1,02 g:n (0,0067 mol) fenyylietikkahappoa liuosta 2,3 ml:ssa DMF:a. 15 - 20 minuutin jälkeen syntyi kiinteä aine, jota oli vaikea sekoittaa. Pyridatsiini (1,0 g, 0,0067 mol) lisättiin sitten ja seosta kuumennettiin 60 - 65 °C:ssa noin 2 tuntia ja annettiin jäähtyä. Seos kaadettiin jääveteen ja pH säädettiin arvoon 5 2,0 N HCl:lla, ja sakka otettiin talteen. Tämä aine trituroitiin käyttäen heptaania, jolloin saatiin 880 mg otsikon tuotetta. Sp. 124 - 127 °C.

Insektisidin ja mitisidin käyttökelpoisuus

Kaavan (1) mukaiset yhdisteet osoittavat aktiivisuutta lukuisia hyönteisiä ja punkkeja vastaan. Spesifisemmin, yhdisteet osoittavat aktiivisuutta melonilehtitäi-

tä (melon aphid) vastaan, joka on hyönteislahkon *Homoptera* jäsen. Muihin *Homopteran* jäseniin kuuluvat kaskakset, kasvisirkat (planthopper), päärynä-pyslla, omenanimijä (apple sucker), kilpikirvat, valkokärpäset, sylkiluteet (spittle bug) samoin kuin lukuisat muut isäntäkasville spesifiset lehtitäilajit. Aktiivisuutta on havaittu myös kasvihonethripsejä vastaan, jotka ovat *Thysanoptera*-lahkon jäseniä. Yhdisteet osoittavat myös aktiivisuutta eteläistä armeijamatoa (Southern armyworm) vastaan, joka on hyönteislahkon *Lepidoptera* jäsen. Muita tämän lahkon tyypillisiä jäseniä ovat ruokaomenakoi (codling moth), yökkösen toukka, vaatekoi, maissijauhokoi, lehtipyörijät (leaf roller), maissikorvamato (corn earworm), eurooppalainen maissiporaaja (European corn borer), kaalimato, kaalin mittarimato, puuvillan kotamato, pussikehrääjän toukka, itäinen telttaperhosen toukka (eastern tent caterpillar), turvekutojamato (sod webworm) ja syysarmeijamato (fall armyworm).

Kaavan (1) mukaiset yhdisteet ovat käyttökelpoisia pienentämään hyönteis- ja punkkipopulaatioita, ja niitä käytetään hyönteis- tai punkkipopulaation inhibointimenetelmässä, joka käsittää vaikuttavan hyönteisiä tai punkkeja inaktivoivan määrän kaavan (1) mukaista yhdistettä käyttämisen hyönteis- tai punkkipaikkaan. Hyönteisten tai punkkien "paikka" on termi, jota käytetään tässä viittaamaan ympäristöön, jossa hyönteiset tai punkit elävät tai jossa niiden munat ovat, mukaan lukien niitä ympäröivän ilman, ruuan, jota ne syövät, tai kohteet, joita ne koskettavat. Esimerkiksi, kasveja ravinnokseen ottavia hyönteisiä ja punkkeja voidaan kontrolloida käyttämällä aktiivista yhdistettä kasvinosiin, joita hyönteiset tai punkit syövät, erityisesti lehtiin. Tutkitaan yhdisteiden käyttökelpoisuutta suojaamaan tekstiilejä, paperia, varastoitua viljaa, tai siemeniä käyttämällä aktiivista yhdistettä tällaiseen aineeseen. Termi "hyönteisen tai punkin inhi-

bointi" viittaa elävien hyönteisten tai punkkien lukumäärän vähenemiseen; tai elinkykyisten hyönteisen tai punkin munien lukumäärän vähenemiseen. Yhdisteellä saavutetun vähenemän laajuus riippuu, tietenkin tietyn yhdisteen käytettävästä yhdistemäärästä, ja kohteena olevista hyönteis- tai punkkilajeista. Tulisi käyttää vähintään hyönteisiä inaktivoivaa tai punkkeja inaktivoivaa määrää. Termejä "hyönteisiä inaktivoiva määrä" ja "punkkeja inaktivoiva määrä" käytetään kuvaamaan määrää, joka on riittävä aiheuttamaan mitattavan vähenemän käsitellyssä hyönteis- tai punkkipopulaatiossa. Yleensä käytetään määrää, joka on alueella noin 1 - 1 000 ppm aktiivista yhdistettä.

Joidenkin edellä identifioiduista yhdisteistä insektisidistä, mitisidistä ja nematisidistä aktiivisuutta testattiin kahdeksaa lajia kohtaan. Tulokset raportoidaan seuraavassa taulukossa, jossa käytetään seuraavia lyhenteitä:

ALH viittaa asterikaskakseen

BAW viittaa juurikasarmeijamatoon (beet armyworm)

CA viittaa puuvillalehtitäihin

NEM viittaa maapähkinäjuurisolmusukkulamatoon (peanut rootknot nematode)

SCRW viittaa eteläiseen maissijuurimatoon (southern corn rootworm)

TBW viittaa tupakannuppumatoon (tobacco budworm)

TSSM viittaa kaksipilkkuiseen hämähäkkipunkkiin (two spotted spider mite)

GECR viittaa saksalaiseen torakkaan (German cockroach)

Johdettaessa insektisidisen aktiivisuuden arvioitia jokainen koeyhdiste formuloitiin 400 ppm liuokseksi, ja tämä liuos laimennettiin sitten vedellä, jolloin saatiin pienempiä pitoisuuksia. 400 ppm liuos valmistettiin yhdistämällä 19,2 ml 0,05 % Tween 20 (polyoksietyleeni (20) sorbitaanimonolauraatti) liuosta vedessä liuoksen kanssa,

joka muodostui 8 mg:sta yhdistettä 0,8 ml:ssa asetoni/EtOH:a (9/1).

Aktiivisuus asterikaskasta (*Macrosteles fascifrons*) vastaan testattiin seuraavasti. Koe suoritettiin käyttäen pitoisuuksia 400 ppm ja 50 ppm. Yhden unssin muovisia kuppeja, jotka sisälsivät puuvillasydämen, suihkutettiin 0,4 ml:lla formuloitua ainetta käyttäen litteää viuhkamaista suutinta. Kosteusylimäärän annettiin haihtua. Sitten jokaiseen kuppiin lisättiin 5 - 10 hiilidioksidilla nukutettua aikuista kaskasta. Kupit suljettiin ja pidettiin huoneenlämpötilassa 24 tuntia. Kuolleisuusprosentti määritettiin tällöin.

Aktiivisuus juurikasarmeijamatoa (*Spodoptera exiqua*) vastaan arvioitiin seuraavasti. Koe suoritettiin käyttäen pitoisuuksia 400 ppm ja 50 ppm. Yleisiin tarkoituksiin tarkoitettu perhosen keinotekoinen ruokavalio laimennettiin puoleen vahvuuteen 5 %:isella ei-ravitsevalla agarilla. 8 ml tätä ruokavalioainetta jaettiin yhden unssin dieettikuppeihin. Yksi tunti ennen käsittelyä, 35 - 40 munaa jaettiin dieettipinnalle. Kupit suihkutettiin sitten formuoidulla aineella litteän viuhkamaisen suuttimen läpi. Käsitellyt kupit kuivattiin ilmassa ennen sulkemista muovikorkeilla. Kuppeja pidettiin 6 vuorokautta huoneenlämpötilassa. Aktiivisuus merkittiin sitten perustuen elävien ja kuolleiden toukkien kokonaismäärään ja elävien toukkien kokoon.

Aktiivisuus puuvillalehtitäitä (*Aphis gossypii*) ja kaksitäpläistä hämähäkkipunkkia (*Tetranychus urticae*) vastaan arvioitiin seuraavasti. Kultaisia jättiläismantelikurpitsakasveja kasvatettiin laajaan sirkkalehtivaiheeseen (noin 6 - 8 vuorokautta). Kasveihin vietiin puuvillalehtitäitä ja kaksitäpläisiä hämähäkkipunkkeja 16 - 24 tuntia ennen koeaineen käyttöä siirtämällä kuhisevia lehtiä, jotka oli leikattu kantayhdyskunnasta. Juuri ennen koeaineen suihkulevitystä siirtolehdet poistetaan mantelikurpitsa-

kasveista. Koe suoritetaan käyttäen pitoisuuksia 400 ppm ja 50 ppm. Kasvit suihkutetaan koeliuoksella käyttäen sumuttavaa suihkutinta 17 psi:n paineessa. Molemmat lehtipinnat peitetään kunnes ylimääräinen valuu pois ja sitten annetaan kuivua. Jokaisen yhdisteen aktiivisuus määritetään kolme vuorokautta käsittelyn jälkeen. Aktiivisuus merkittiin prosentteina perustuen punkkien/lehtitäiden läsnäoloon kasveissa, jotka oli suihkutettu vain liuottimella.

Aktiivisuus maapähkinäjuurisolmusukkulamatoa (*Meloidogyne arenaria*) vastaan arvioitiin seuraavasti. Viisi käsittelemätöntä kurkun siementä asetettiin kirkkaan yhden unssin kupin pohjalle, lisättiin 20 g puhdasta valkoista hiekkaa, ja kupit suihkutettiin sillä aikaa kun ne pyörivät jalustalla sallien 1,0 ml 400 ppm liuosta kerrostua hiekalle. Jokaiseen kuppiin jaettiin 2,5 - 3,0 ml deionisoitua vettä, joka sisälsi 300 - 500 sukkulamatoa. Kuppeja pidettiin 10 - 12 vuorokautta ympäristön kasvukammiossa lämpötilassa 76 - 85 °F ja ympäröivässä kosteudessa 50 - 60 %. 10 - 12 vuorokauden jälkeen kupit arvioitiin kääntämällä kuppi ylösalaisin ja havainnoimalla sukkulamatokuolleisuus ja kurkkukasvien syömävahinko.

Aktiivisuus eteläistä maissijuurimatoa (*Diabrotica undecimpuctata howardi* Barber) vastaan arvioitiin lisäämällä 1 ml koeliuosta, joka sisälsi ennalta määrätyn pitoisuuden koeyhdistettä kuppiin, joka sisälsi maissin jyvän 16 g:ssa steriiliä maata. Näin saadaan maapitoisuus 24 ppm. 1,5 - 2 tunnin kuivauksen jälkeen lisättiin viisi neljänne sukupolven maissijuurimadon toukkaa yksittäisiin kuppeihin. Kuolleisuus mitattiin 3 - 4 päivänä tyhjentämällä kuppi vaa'an kuppiin ja etsimällä maasta eläviä juurimatoja.

Aktiivisuus tupakannuppumatoa (*Heliothis virescens*) vastaan arvioitiin seuraavasti. Yleisiin tarkoituksiin tarkoitettu perhosen keinotekoinen ruokavalio laimennet-

tiin puoleen vahvuuteen 5-%:isella ei-ravitsevalla agarilla. 8 ml tätä ruokavalioainetta jaettiin yhden unssin dieettikuppeihin. Yksi tunti ennen käsittelyä, 20 munaa jaettiin dieettipinnalle. Kupit suihkutettiin sitten formuloidulla aineella litteän viuhkamaisen suuttimen läpi. Koe suoritettiin käyttäen pitoisuuksia 400 ppm ja 50 ppm. Käsitellyt kupit kuivattiin ilmassa ennen sulkemista muovikorkeilla. Kuppeja pidettiin 6 vuorokautta huoneenlämpötilassa. Aktiivisuus merkittiin sitten perustuen elävien ja kuolleiden toukkien kokonaismäärään ja elävien toukkien kokoon.

Aktiivisuus saksalaista torakkaa (*Blattella germanicus*) vastaan arvioitiin seuraavasti. 8 ml alfalfapohjaista vihreää hyönteisruokavalioainetta jaettiin yhden unssin dieettikuppeihin. Kupit suihkutettiin sitten formuloidulla aineella litteän viuhkamaisen suuttimen läpi. Koe suoritettiin käyttäen pitoisuuksia 400 ppm ja 50 ppm. Käsiteltyjä kuppeja kuivattiin ilmassa 24 tuntia ja niihin vietiin viisi myöhäisen kolmannen tai aikaisen neljännen sukupolven saksalaista torakkaa. Kupit suljettiin ja pidettiin 10 vuorokautta ympäristön kasvukammiossa lämpötilassa 76 - 85 °C. Aktiivisuus merkittiin sitten perustuen elävien ja kuolleiden hyönteisten kokonaismäärään.

Insektisidi-, mitsidi- ja nematsiditiedot								
Yhdiste	ALH 400 ppm 50 ppm	BAW 400 ppm 50 ppm	CA 400 ppm 50 ppm	NEM 400 ppm 50 ppm	SCRW 400 ppm 50 ppm	TBW 400 ppm 50 ppm	TSSM 400 ppm 50 ppm	GECR 400 ppm 50 ppm
1	100 -	0 -	0 -		0 -	0 -	0 -	0 -
2								
3								
4	0 -	0 -	0 -		0 -	70 -	0 -	0 -
5		0 -	0 -		0 -	0 -	0 -	0 -
6		0 -	0 -		0 -	0 -	0 -	0 -
7	0 -	0 -	0 -		0 -	0 -	0 -	0 -
8	0 -	0 -	0 -		0 -	0 -	0 -	0 -
9	0 -	0 -	0 -		0 -	60 -	0 -	20 -
10	100 100	100 0	100 100	100 100	0 -	0 0	100 100	60 0
11	100 100	100 100	100 100	0 0	0 -	100 100	100 100	100 0
12	100 100	80 0	0 0	0 0	0 -	60 0	0 0	0 0
13	100 100	0 0	60 0	0 0	0 -	50 0	100 100	0 0
14	100 100	100 100	100 100	100 0	0 -	100 100	100 100	20 40
15	0 0	0 0	0 0	60 0	0 -	0 0	0 0	0 0
16	100 100	100 0	0 0	40 -	0 -	100 0	0 0	0 0
17	0 60	0 0	0 0	0 0	0 -	0 0	0 0	0 0
18	80 80	100 100	100 100	100 -	100 -	100 100	100 100	100 40
19	100 100	100 100	100 100	100 -	100 -	100 100	100 100	40 40

Yhdiste	ALH 400 ppm 50 ppm	BAW 400 ppm 50 ppm	CA 400 ppm 50 ppm	NEM 400 ppm 50 ppm	SCRW 400 ppm 50 ppm	TBW 400 ppm 50 ppm	TSSM 400 ppm 50 ppm	GECR 400 ppm 50 ppm
20	100 100	100 100	100 100	100 -	0 -	100 100	100 100	80 0
21	100 40	100 100	100 70	100 -	0 -	100 100	100 100	0 0
22	100 100	100 100	100 100	100 -	100 -	100 80	0 0	60 0
23	100 100	100 100	100 90	0 -	0 -	100 100	100 100	20 0
24	100 100	100 100	100 100	0 -	0 -	100 100	100 100	80 40
25	100 100	100 100	100 100	0 -	100 -	100 100	100 100	80 20
26	100 100	100 100	100 90	100 -	0 -	80 0	0 0	0 0
27	100 100	100 0	100 100	30 -	0 -	0 0	0 0	0 0
28	100 100	0 0	0 0	0 0	0 -	0 0	0 0	0 0
29	100 100	100 100	100 100	0 -	0 -	100 100	100 100	0 0
30	100 100	100 100	100 100	100 -	100 -	100 100	100 100	100 60
31	100 100	100 100	100 100	0 -	100 -	100 100	100 100	40 0
32	80 60	100 100	0 0	0 -	100 -	100 100	0 0	0 0
33	100 100	100 100	100 0	0 -	0 -	80 40	100 0	0 20
34	100 100	100 100	100 100	100 -	100 -	100 100	100 100	100 60
35	80 80	0 0	0 0	0 -	0 -	0 0	0 0	20 0
36	100 100	100 100	100 100	100 -	100 -	100 100	100 100	100 100
37	100 100	100 100	100 100	100 -	100 -	100 100	100 100	100 100
38	100 100	100 100	100 100	100 -	100 -	100 100	100 100	100 100
39	100 100	100 100	100 100	100 -	100 -	100 100	100 100	0 0
40	100 100	100 100	100 100	0 -	100 -	100 100	100 100	100 80
41	- -	- -	- -	- -	- -	- -	- -	- -
42	100 100	0 0	100 100	0 -	0 -	0 0	100 100	- -
43	100 100	100 100	0 0	0 -	0 -	100 100	0 0	- -
44	100 100	100 100	100 100	0 -	100 -	100 100	100 100	- -

Yhdiste	ALH 400 ppm 50 ppm	BAW 400 ppm 50 ppm	CA 400 ppm 50 ppm	NEM 400 ppm 50 ppm	SCRW 400 ppm 50 ppm	TBW 400 ppm 50 ppm	TSSM 400 ppm 50 ppm	GECR 400 ppm 50 ppm
45	100 100	100 100	100 100	0 -	100 -	100 100	100 0	- -
46	100 100	100 100	100 100	0 -	0 -	100 0	100 100	- -
47	100 100	100 100	100 100	0 -	0 -	100 100	100 100	- -
48	100 100	100 100	100 100	0 -	0 -	100 100	100 100	- -
49	100 100	100 10	100 100	0 -	0 -	100 100	0 0	- -
50	100 100	100 100	100 100	0 -	100 -	100 100	100 100	- -
51	100 100	100 100	100 100	0 -	100 -	100 100	100 100	- -
52	100 100	100 100	0 0	0 -	0 -	100 100	0 0	- -
53								
54								
55								
56	100 100	100 100	100 100	0 0	0 0	100 100	100 100	60 0
57	100 60	100 100	100 100	0 -	0 -	100 100	100 90	0 0
58	60 80	100 100	0 0	100 -	0 -	100 100	0 0	0 0
59	100 100	100 100	100 100	100 -	100 -	100 100	100 100	0 0
60	100 80	100 100	100 100	0 -	0 -	60 0	0 0	- -
61	100 100	100 100	100 100			100 0	100 100	
62	100 100	100 100	100 100	100 0		100 100	100 100	
63	100 100	100 70	100 100	0 0	0 0	100 100	90 80	
64	100 100	100 100	100 100	0 0	100 0	100 100	100 100	

Nematisidin käyttökelpoisuus

Tämän keksinnön yhdisteet ovat käyttökelpoisia pienentämään sukkulamatopopulaatioita. Sen mukaisesti, keksinnön merkittävä näkökohta on sukkulamatopopulaation inhibointimenetelmä, joka käsittää sukkulamatoja inaktivoivan määrän kaavan (1) mukaista yhdistettä käytön sukkulamatopaikkaan. Termi "sukkulamadon inhibointi" viittaa elävien sukkulamatojen lukumäärän vähenemiseen. Yhdisteellä saavutetun vähenemän suuruus riippuu tietyn käytetyn yhdisteen käyttömäärästä ja kohdelajeista. Vähintään tulisi käyttää sukkulamatoja inaktivoivaa määrää. Termiä "sukkulamatoja inaktivoiva määrä" käytetään kuvaamaan määrää, joka on riittävä aiheuttamaan mitattavan vähenemän käsitellyssä sukkulamatopopulaatiossa.

Menetelmää toteutetaan käytännössä nematisidien käytölle olevien standardimenetelmien mukaan. Yleensä, hyvää nematisidista aktiivisuutta voidaan odottaa määrillä 1 - 10 lbs/acre. Yhdiste voidaan formuloida kuten kuvataan alempana koostumukset-osassa. Kun se on formuloitu dispersioina, nematisidit levitetään tyypillisesti vesipitoisina suurina annoksina kasvavien kasvien ympärille tai käytetään lisääntyvästi kastelusysteemien kautta. Käytettäessä rakeina, nematisidit voidaan sisällyttää maahan ennen istuttamista, tai levittää nauhana siemenrivin päälle, tai hajakylvää ja sitten sisällyttää maahan, tai käyttää sivusuojana saadulle sadolle.

Fungisidin käyttökelpoisuus

Tämän keksinnön yhdisteiden on havaittu kontrolloivan sieniä, erityisesti kasvipatogeeneja. Käytettäesssä kasvin sienitautien hoidossa, yhdisteitä levitetään kasveille tautia inhiboivassa ja fytologisesti hyväksyttävässä määrässä. Termi "tautia inhiboiva ja fytologisesti hyväksyttävä määrä", kuten tässä käytetään, viittaa keksinnön yhdisteen määrään, joka tappaa tai inhiboi kasvitautia, jota varten halutaan hillintää, mutta se ei ole mer-

kittävästi toksinen kasville. Tämä määrä on yleensä noin 1 - 1 000 ppm, 10 - 500 ppm:n ollessa edullinen. Tarkka yhdisteen pitoisuus, joka tarvitaan, vaihtelee kontrolloitavan sienitaudin, käytetyn formulaatiotyypin, levitysmenetelmän, tiettyjen kasvilajien, ilmasto-olosuhteiden ja niiden kaltaisten mukaan. Sopiva käyttömäärä on tyypillisesti alueella 0,25 - 4 lb/A. Keksinnön yhdisteitä voidaan käyttää myös suojaamaan varastoitua viljaa ja muuta eikasvi paikkaa sienivahingolta.

Kasvihuonekokeet

Seuraavat kokeet suoritettiin laboratoriossa keksinnön yhdisteiden fungisidisen tehokkuuden määrittämiseksi.

Koeyhdisteet formuloitiin käyttöä varten liuottamalla 50 mg yhdistettä 1,25 ml:aan liuotinta. Liuotin valmistettiin sekoittamalla 50 ml "Tween 20" (polyoksietyleeni (20) sorbitaanimonolauraatti-emulgointiaine) 475 ml:n kanssa asetonia ja 475 ml:n kanssa etanolia. Liuotin/yhdiste-liuos laimennettiin 125 ml:aan deionisoidulla vedellä. Saatu formulaatio sisältää 400 ppm koekemikaalia. Alhaisemmat pitoisuudet saatiin sarjalaimennuksella liuotin-pinta-aktiivinen aine -seoksella

Formuloidut koeyhdisteet levitettiin lehtisumutteella. Seuraavia kasvipatogeeneja ja niitä vastaavia kasveja käytettiin.

Patogeeni	Nimitys seuraavassa taulukossa	Isäntäkasvi
Erysiphe graminis tritici (jauhomainen viljaruoste)	ERYSGT	vehnä
Pyricularia oryzae (riisihomesieni)	PYRIOR	riisi
Puccinia recondita tritici (lehtiruoste)	PUCCRT	vehnä
Leptosphaeria nodorum (vihnerakkula)	LEPTNO	vehnä
Plasmopara viticola (leväsieni)	PLASVI	rypäle

Formuloidut tekniset yhdisteet suihkutettiin kaikille isäntäkasvien (tai leikatun marjan) lehtipinnoille ylimääräisten ohittamiseksi. Yksittäiset ruukut jokaista isäntäkasvia asetettiin nostetuille, pyöriville jalustoille höyryhupussa. Koeliuokset suihkutettiin kaikille lehtipinnoille. Kaikkien käsittelyjen annettiin kuivua ja kasveihin siirrostettiin sopivat patogeenit 2 - 4 tunnin sisällä.

Seuraava taulukko esittää tämän keksinnön tyypillisten yhdisteiden aktiivisuuden, kun se arvioidaan tässä kokeessa. Koeyhdisteen tehokkuus taudin kontrolloinnissa merkittiin käyttäen seuraavaa skaalaa.

0 = ei testattu tätä organismia vastaan
\- = 0 - 19 % kontrolli 400 ppm:llä
\+ = 20 - 89 % kontrolli 400 ppm:llä
++ = 90 - 100 % kontrolli 400 ppm:llä
+++ = 90 - 100 % kontrolli 100 ppm:llä

Yhdisteen numero	ERYSGT	PYRIOR	PUCCRT	LEPTNO	PLASVI
1	-	-	-	-	+
2	++	-	-	0	0
3	-	-	+++	-	++
4	+	+	+	-	+++
5	-	-	++	-	-
6	+	+	+	-	+
7	-	-	+	-	-
8	+	-	+	-	+
9	+	+	++	0	0
10	++	+	+++	++	+++
11	+++	++	+++	++	++
12	++	+	++	-	+
13	++	++	+++	-	++
14	+++	+++	+++	++	+++
15	-	+	+	+	++
16	+++	++	+++	++	+++
17	-	-	-	-	-
18	+++	+++	+++	++	+++
19	+++	+++	+++	++	+++
20	+++	+++	+++	-	+++
21	++	++	++	++	++
22	++	+	++	+	+++
23	++	+	++	+	+++
24	++	+	++	+	+++
25	+	+	++	+	+++
26	++	++	++	+	++
27	++	+	+	++	++
28	++	-	++	+++	++
29	+++	+++	++	+	+++
30	+++	+++	++	+++	+++
31	+++	++	++	++	++
32	+++	+	++	++	++
33	+++	+	++	+	++
34	+++	++	++	+++	+++
35	++	+	++	++	++
36	++	+	++	+	++
37	++	+	++	++	+
38	++	+	++	++	+
39	-	-	++	+	-
40	++	+	++	++	++

Yhdisteen numero	ERYSGT	PYRIOR	PUCCRT	LEPTNO	PLASVI
41	+++	+++	++	++	+-
42	++	++	++	++	++
43	+++	++	-	+++	+++
44	++	++	++	++	-
45	++	+	++	++	++
46	++	+	++	++	+
47	++	-	++	-	++
48	++	++	++	-	++
49	+	-	++	+	-
50	++	++	++	++	++
51	++	++	++	++	++
52	+	+	++	+	-
53					
54					
55					
56	+++	++	0	++	+++
57	+++	-	0	-	+++
58	+++	+	0	+	+
59	+++	++	0	+	+++
60	+	-	0	-	+
61	-	-	0	-	+++
62	+	-	0	+	+++
63	+	+++	0	++	+++
64	+++	+	0	++	+++

Koostumukset

Kaavan (1) mukaisia yhdisteitä käytetään koostumusten muodossa, jotka ovat keksinnön tärkeitä toteutusmuotoja, ja jotka käsittävät kaavan (1) mukaisen yhdisteen ja fytologisesti hyväksyttävän inertin kantajan. Koostumukset ovat joko väkevöityjä formulaatioita, jotka dispergoidaan veteen käyttöä varten, tai pölymäisiä tai raemaisia formulaatioita, joita käytetään ilman lisäkäsittelyä. Koostumukset valmistetaan menetelmien ja kaavojen mukaan, jotka ovat tavanomaisia maatalouskemikaalien alalla, mutta jotka ovat uusia ja tärkeitä tämän keksinnön yhdisteiden niissä läsnäolon takia. Joitakin koostumusten formulaatioiden kuvauksia annetaan, kuitenkin, vakuuttamaan, että maata-

louskemistit voivat helposti valmistaa mitä tahansa haluttua koostumusta.

Dispersiot, joissa yhdisteitä käytetään, ovat useimmiten vesipitoisia suspensioita tai emulsioita, jotka valmistetaan väkevöidyistä yhdisteiden formulaatioista. Tällaisia veteenliukenevia, veteen suspendoitavia tai emulgoitavia formulaatioita ovat joko kiinteät aineet, jotka yleensä tunnetaan kostuvina jauheina, tai nesteet, jotka yleensä tunnetaan emulgoitavina konsentraatteina tai vesisuspensioina. Kostuvat jauheet, jotka voidaan tiivistää, jolloin muodostuu veteen dispergoituvia rakeita, käsittävät tasaisen aktiivisen yhdisteen, inertin kantajan ja pinta-aktiivisten aineiden seoksen. Aktiivisen yhdisteen pitoisuus on yleensä noin 10 - 90 paino-%. Inertti kantaja valitaan yleensä attapulgiitti-savista, montmorilloniitti-savista, piimaista, tai puhdistetuista silikaateista. Tehokkaita pinta-aktiivisia aineita, jotka käsittävät noin 0,5 % - 10 % kostuvaa jauhetta, löytyy sulfonoitujen ligniinien, kondensoitujen naftaleenisulfonaattien, naftaleenisulfonaattien, alkyylibentseenisulfonaattien, alkyylisulfaattien, ja ei-ionisten pinta-aktiivisten aineiden joukosta, kuten alkyylifenolien etyleenioksidiadduktit.

Yhdisteen emulgoitavat konsentraatit käsittävät sopivan pitoisuuden yhdistettä, kuten noin 50 - 500 grammaa nestelitraa kohti, ekvivalentti noin 10 - 50 %:ille, liuotettuna inerttiin kantajaan, joka on joko veteen sekoittuva liuotin tai veteen sekoittumattoman orgaanisen liuottimen ja emulgointiaineiden seos. Käyttökelpoisiin orgaanisiin liuottimiin kuuluvat aromaattiset aineet, erityisesti ksyleenit, ja raakaöljyfraktiot, erityisesti raakaöljyn korkealla kiehuvat naftaleeniset ja olefiiniset osat, kuten raskas aromaattinen nafta. Myös muita orgaanisia liuottimia voidaan käyttää, kuten terpeeniliuottimia, mukaan lukien hartsijohdannaiset, alifaattiset ketonit,

kuten sykloheksanoni, kompleksit alkoholit, kuten 2-etoksietanoli. Sopivat emulgointiaineet emulgoitaville konsentraateille valitaan tavanomaisista ei-ionisista pinta-aktiivisista aineista, kuten edellä keskusteltiin.

Vesipitoiset suspensiot koostuvat tämän keksinnön veteen liukenemattomista yhdisteistä, jotka on dispergoitu vesipitoiseen vehikkeliin pitoisuudessa alueella noin 5 - 50 paino-%. Suspensiot valmistetaan jauhamalla yhdiste hienoksi ja sekoittamalla se voimakkaasti vehikkeliin, joka koostuu vedestä ja pinta-aktiivisista aineista, jotka valitaan samoista tyypeistä kuin edellä keskusteltiin. Inerttejä ainesosia, kuten epäorgaanset suolat ja synteettiset tai luonnonkumit, voidaan myös lisätä, jolloin vesipitoisen vehikkelin tiheys ja viskositeetti kasvavat. Usein on tehokkainta jauhaa ja sekoittaa yhdiste samanaikaisesti valmistamalla vesipitoinen seos ja homogenisoimalla se työvälineessä, kuten hiekkamyllyssä, kuulamyllyssä, tai mäntä-tyyppisessä homogenisaattorissa.

Yhdisteitä voidaan käyttää myös raekoostumuksina, jotka ovat erityisen käyttökelpoisia maalle levitykseen. Raekoostumukset sisältävät yleensä noin 0,5 - 10 paino-% yhdistettä dispergoituna inerttiin kantajaan, joka koostuu kokonaan tai suurelta osalta savesta tai samanlaisesta halvasta aineesta. Tällaisia koostumuksia valmistetaan yleensä liuottamalla yhdiste sopivaan liuottimeen, ja levittämällä se rakeiselle kantajalle, joka on muokattu etukäteen sopivaan parikkelikokoon, alueella noin 0,5 - 3 mm. Tällaisia koostumuksia voidaan formuloida myös tekemällä tahna tai massa kantajasta ja yhdisteestä, ja murskaamalla ja kuivaamalla, jolloin saadaan haluttua raepartikkelikokoa.

Pölymäiset jauheet, jotka sisältävät yhdisteitä, valmistetaan yksinkertaisesti sekoittamalla jauhetussa muodossa oleva yhdiste perusteellisesti sopivan pölymäisen maatalouskantajan kanssa, kuten kaoliinisavi, maaperän

vulkaaninen kivi ja niiden kaltaiset. Pölymäiset aineet voivat sopivasti sisältää noin 1 - 10 % yhdistettä.

Yhtä käytönnöllistä on, kun jostain syystä halutaan käyttää yhdistettä liuoksen muodossa sopivassa orgaanisessa liuottimessa, yleensä mieto paloöljy, kuten ruiskuöljyt, joita käytetään laajalti maatalouskemiassa.

Insektisidejä ja mitisidejä käytetään yleensä aktiivisen ainesosan dispersioiden muodossa nestemäisessä kantajassa. On tavanomaista viitata käyttömääriin muodossa aktiivisen ainesosan pitoisuus kantajassa. Laajimmin käytetty kantaja on vesi.

Kaavan (1) mukaisia yhdisteitä voidaan käyttää myös aerosolikoostumuksen muodossa. Tällaisissa koostumuksissa aktiivinen yhdiste liuotetaan tai dispergoidaan inerttiin kantajaan, joka on painetta kehittävä ponneaineseos. Aerosolikoostumus pakataan säiliöön, josta seos jaetaan sumutusventtiilin läpi. Ponneaineseokset käsittävät joko matalalla kiehuvia halogeenihiilivetyjä, jotka voidaan sekoittaa orgaanisten liuottimien kanssa, tai vesipitoisia suspensioita, jotka paineistetaan inrteillä kaasuilla tai kaasumaisilla hiilivedyillä.

Todellinen hyönteis- tai punkkipaikkaan käytettävä yhdistemäärä ei ole ratkaiseva ja sen voivat alan ammattimiehet helposti määrittää ylempänä olevien esimerkkien pohjalta. Yleensä, pitoisuuksien 10 - 5 000 ppm yhdistettä odotetaan tarjoavan hyvän kontrollin. Monilla yhdisteillä, pitoisuudet 100 - 1 500 ppm riittävät. Peltosadoille, kuten soijapavut ja puuvilla, sopiva käyttömäärä yhdisteille on noin 0,5 - 1,5 lb/A, tyypillisesti käytettynä 50 gal/A:n sumutekoostumuksena, joka sisältää 1 200 - 3 600 ppm yhdistettä. Sitrussatoja varten, sopiva käyttömäärä on noin 100 - 1 500 gal/A sumuteformulaationa, joka on määränä 100 - 1 000 ppm.

Paikka, johon yhdistettä käytetään, voi olla mikä tahansa paikka, jossa hyönteiset tai hämähäkit asuvat,

esimerkiksi vihannessadot, hedelmä- ja pähkinäpuut, viiniköynnökset ja koristekasvit. Koska monet punkkilajit ovat spesifisiä tietylle isäntäkasville, edellä mainittu lista punkkilajeista tarjoaa valaisevan esimerkin laajoista puitteista, joissa näitä yhdisteitä voidaan käyttää.

Punkkien munien ainutlaatuisen kyvyn vastustaa myrkyn toimia vuoksi, toistuvat käytöt voivat olla toivottuja kontrolloimaan uudelleen ilmestyneitä toukkia, kuten on todettu muilla tunnetuilla akaridisideillä.

Seuraavat keksinnön yhdisteiden formulaatiot ovat tyypillisiä koostumuksia, jotka ovat käyttökelpoisia tämän keksinnön käytäntöön soveltamisessa.

A. 0,75 Emulgoitava konsentraatti

Kaavan (1) mukainen yhdiste	9,38 %
"TOXIMUL D"	2,50 %
(ei-ioninen/anioninen pinta-aktiivinen aineseos)	
"TOXIMUL H"	2,50 %
(ei-ioninen/anioninen pinta-aktiivinen aineseos)	
"EXXON 200"	85,62 %
(naftaleeninen liuotin)	

B. 1,5 Emulgoitava konsentraatti

Kaavan (1) mukainen yhdiste	18,50 %
"TOXIMUL D"	2,50 %
"TOXIMUL H"	2,50 %
"EXXON 200"	76,50 %

C. 1,0 Emulgoitava konsentraatti

Kaavan (1) mukainen yhdiste	12,50 %
N-metyylipyrrolidoni	25,00 %
"TOXIMUL D"	2,50 %
"TOXIMUL H"	2,50 %
"EXXON 200"	57,50 %

D. 1,0 Vesipitoinen suspensio

Kaavan (1) mukainen yhdiste	12,00 %
"PLURONIC P-103"	1,50 %

(propyleenioksidin ja etyleenioksidin lohkosekapolymeeri, pinta-aktiivinen aine)	
"PROXEL GXL"	0,05 %
(biosidi/säilöntäaine)	
"AF-100"	0,20 %
(silikonipohjainen vaahdonestoaine)	
"REAX 88B"	1,00 %
(lignosulfaatti dispergointiaine)	
propyleeniglykoli	10,00 %
veekumi	0,75 %
ksantaani	0,25 %
vesi	74,25 %

E. 1,0 Vesipitoinen suspensio

Kaavan (1) mukainen yhdiste	12,50 %
"MAKON 10" (10 moolia etyleenioksidia nonyylifenoli pinta-aktiivinen aine)	1,00 %
"ZEOSYL 200" (silika)	1,00 %
"AF-100"	0,20 %
"AGRIWET FR" (pinta-aktiivinen aine)	3,00 %
2-%:inen ksantaanihydraatti	10,00 %
vesi	72,30 %

F. 1,0 Vesipitoinen suspensio

Kaavan (1) mukainen yhdiste	12,50 %
"MAKON 10"	1,50 %
"ZEOSYL 200" (silika)	1,00 %
"AF-100"	0,20 %
"POLYFON H"	0,20 %
(lignosulfaatti dispergointiaine)	
2-%:inen ksantaanihydraatti	10,00 %
vesi	74,60 %

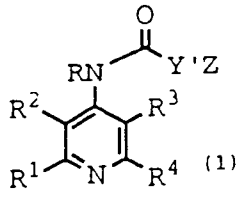
G. Kostuva jauhe

Kaavan (1) mukainen yhdiste	25,80 %
"POLYFON H"	3,50 %
"SELLOGEN HR"	5,00 %
"STEPANOL ME DRY"	1,00 %

	arabikumi	0,50 %
	"HISIL 233"	2,50 %
	Barden-savi	61,70 %
	H. Rakeet	
5	Kaavan (1) mukainen yhdiste	5,0 %
	propyleeniglykoli	5,0 %
	Exxon 200	5,0 %
	Florex 30/60 rakeinen savi	85,0 %

Patenttivaatimukset:

1. Yhdiste, jolla on kaava (1):



(1)

tai sen N-oksidi tai suola, jossa

R on H, C_{1-4}-alkyyli tai bentsyyli;

R^1, R^2, R^3 ja R^4 merkitsevät yhtä seuraavista:

a) R^3 ja R^4 ovat H, ja R^1 ja R^2 merkitsevät toisistaan riippumatta halogeenia, C_{1-4}-alkyyliä, halogeeni-C_{1-4}-alkyyliä, C_{3-4}-haarautunutta alkyyliä, C_{3-7}-sykloalkyyliä, C_{1-4}-alkoksia tai halogeeni-C_{1-4}-alkoksia;

b) yksi ryhmistä R^1, R^2, R^3, ja R^4 on C_{1-4}-alkyyli, C_{3-4}-haarautunut alkyyli, C_{1-4}-alkoksi, halogeeni-C_{1-4}-alkyyli, halogeeni-C_{1-4}-alkoksi, C_{1-4}-alkyylitio, C_{1-4}-alkyylisulfinyyli, C_{1-4}-alkyylisulfonyyli, aryyli tai substituoitu amino, ja muut ovat H;

c) R^1, R^2, R^3 ja R^4 merkitsevät toisistaan riippumatta H:ä tai halogeenia; tai

d) R^1 ja R^2 yhdistyvät, jolloin muodostuu tyydyttynyt tai tyydyttymätön C_{5-6}-karbosyklinen rengas, joka on mahdollisesti substituoitu yhdellä tai kahdella ryhmällä, jotka valitaan ryhmästä, jonka muodostavat halogeeni, C_{1-4}-alkyyli, C_{3-4}-haarautunut alkyyli, halogeeni-C_{1-4}-alkyyli, C_{3-7}-sykloalkyyli, C_{1-4}-alkoksi, halogeeni-C_{1-4}-alkoksi tai NO_2, ja R^3ja R^4 ovat H;

R^5 on H, C_{1-4}-alkyyli tai C_{1-4}-asyyli;

R^6 ja R^7 merkitsevät toisistaan riippumatta C_{1-4}-alkyyliä, C_{3-4}-haarautunutta alkyyliä, fenyyliä tai substituoitua fenyyliä;

Y'Z yhdessä muodostaa tyydyttyneen tai tyydyttymättömän C_{4-11}-hiilivetyketjun, haarautumattoman tai haarautuneen, joka mahdollisesti sisältää heteroatomin, joka valitaan ryhmästä, jonka muodostavat O, NR^5, S, SO, SO_2 ja SiR^6R^7, jossa R^5, R^6, R^7 ovat edellä määriteltyjä, ja joka on mahdollisesti substituoitu yhdellä tai useammalla ryhmistä, jotka valitaan toisistaan riippumatta C_{1-4}-alkyylistä, C_{2-4}-alkenyylistä, C_{2-4}-alkynyylistä, haarautuneesta C_{3-7}-alkyylistä, C_{3-7}-sykloalkyylistä, C_{3-7}-sykloalkenyylistä, halogeenista, halogeeni-C_{1-4}-alkyylistä, halogeeni-C_{1-4}-alkoksista, hydroksista tai C_{1-4}-asyylistä; tai

Y' on sidos tai bivalenttinen hiilivetyradikaali, joka on 1 - 5 hiiliatomia pitkä, mahdollisesti substituoitu C_{1-4}-alkyylillä, C_{2-4}-alkenyylillä, C_{2-4}-alkynyylillä, haarautuneella C_{3-7}-alkyylillä, C_{3-7}-sykloalkyylillä tai C_{3-7}-sykloalkenyylillä, halogeenilla, halogeeni-C_{1-4}-alkyylillä, halogeeni-C_{1-4}-alkoksilla, hydroksilla, CN:lla tai C_{1-4}-asyylillä; ja

Z on

(a) aryyli tai

(b) C_{3-8}-sykloalkyyli tai sykloalkenyyli, mahdollisesti substituoitu yhdellä tai useammalla ryhmällä, jotka valitaan toisistaan riippumatta C_{1-4}-alkyylistä, C_{1-4}-alkoksista, halogeeni-C_{1-4}-alkyylistä, halogeeni-C_{1-4}-alkoksista, halogeenista, hydroksista tai C_{1-4}-asyylistä; jossa

aryyli on

(a) fenyyliryhmä, joka on mahdollisesti substituoitu yhdellä tai useammalla ryhmällä, jotka valitaan toisistaan riippumatta seuraavista:

halogeeni,

I,

C_{3-8}-sykloalkyyli,

C_{3-8}-sykloalkenyyli,

fenoksi,

substituoitu fenoksi,

fenyylitio,
substituoitu fenyylitio,
fenyyli,
substituoitu fenyyli,
NO_2,

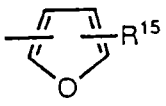
-R^8, jossa R^8 on C_{1-7}-alkyyli, halogeeni-C_{1-7}-alkyyli, C_{3-7}-haarautunut alkyyli, halogeeni-C_{3-7}-haarautunut alkyyli, C_{3-7}-sykloalkyyli, halogeeni-C_{3-7}-sykloalkyyli, C_{1-7}-alkoksi, fenyyli tai substituoitu fenyyli,
asetoksi,
OH,
CN,
$SiR^9R^{10}R^{11}$ tai $OSiR^9R^{10}R^{11}$, jossa R^9, R^{10} ja R^{11} merkitsevät toisistaan riippumatta C_{1-4}-alkyyliä, C_{3-4}-haarautunutta alkyyliä, fenyyliä, tai substituoitua fenyyliä,
$NR^{12}R^{13}$, jossa R^{12} ja R^{13} merkitsevät toisistaan riippumatta H:ä, C_{1-4}-alkyyliä tai C_{1-4}-asyyliä,
$S(O)R^{14}$ tai SO_2R^{14}, jossa R^{14} on C_{1-10}-alkyyli, fenyyli tai substituoitu fenyyli;

tyydyttynyt tai tyydyttymätön C_{1-12} hiilivetyketju, haarautumaton tai haarautunut sisältäen mahdollisesti heteroatomin, joka valitaan ryhmästä, jonka muodostavat O, S, SO, SO_2 NR^5 ja SiR^6R^7, jossa R^5, R^6, R^7 ovat edellä määriteltyjä, ja joka on mahdollisesti substituoitu halogeenilla, halogeeni-C_{1-4}-alkoksilla, hydroksilla, C_{3-8}-sykloalkyylillä tai sykloalkenyylillä, C_{1-4}-asyylillä, fenoksilla, substituoidulla fenoksilla, fenyylillä, substituoitulla fenyylillä, fenyylitiolla tai substituoidulla fenyylitiolla;

C_{1-7}-alkoksi, joka on mahdollisesti substituoitu halogeenilla, fenyylillä, substituoidulla fenyylillä, C_{3-8}-sykloalkyylillä tai sykloalkenyylillä, fenoksilla tai substituoidulla fenoksilla;

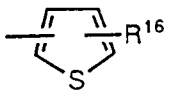
C_{1-7}-alkyylitio, joka on mahdollisesti substituoitu halogeenilla, fenyylillä, substituoidulla fenyylillä, C_{3-8}-sykloalkyylillä tai sykloalkenyylillä, fenoksilla tai substituoidulla fenoksilla;

(b) furyyliryhmä, jolla on kaava (3)


(3)

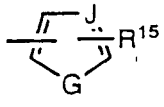
jossa R^{15} on H, halogeeni, halogeenimetyyli, CN, NO_2, C_{1-4}-alkyyli, C_{3-4}-haarautunut alkyyli, fenyyli, C_{1-4}-alkoksi, halogeeni-C_{1-4}-alkoksi;

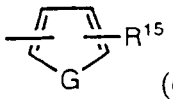
(c) tienyyliryhmä, jolla on kaava (4)


(4)

jossa R^{16} on H, halogeeni, halogeenimetyyli, CN, NO_2, C_{1-4}-alkyyli, C_{3-4}-haarautunut alkyyli, fenyyli, C_{1-4}-alkoksi, halogeeni-C_{1-4}-alkoksi tai tienyyli;

(d) ryhmä, jolla on kaava (5) tai (6)


(5)


(6)

jossa R^{15} on määritelty kappaleessa (b), J on N tai CH, ja G on O, NR^{17}, tai S, edellyttäen, että jos J ei ole N, silloin G on NR, jossa R^{17} on H, C_{1-4}-alkyyli, C_{1-4}-asyyli, fenyylisulfonyyli tai substituoitu fenyylisulfonyyli;

(e) ryhmä, joka valitaan

mahdollisesti substituoidusta naftyylistä, dihydronaftyylistä, tetrahydronaftyylistä ja dekahydronaftyylistä;

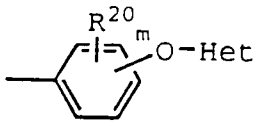
mahdollisesti substituoidusta indolyylistä;

1,3-bentsodioksolyylistä;

2,6-dimetyyli-4-morfolinyylistä; ja

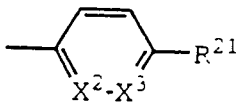
1-adamantyylistä;

(f) ryhmä, jolla on kaava



jossa m on 4; R^{20} on toisista riippumatta H, halogeeni, alempi alkyyli, alempi alkoksi, halogeenialkyyli, halogeenialkoksi, NO_2, CN, alempi alkyylikarbonyyli, fenoksi, tai substituoitu fenoksi, edellyttäen, että vähintään kaksi ryhmistä R^{20} valitaan H:sta ja F:stä; ja Het on pyridyyli, pyratsinyyli, pyrimidinyyli, tai pyridatsinyyli, joka on mahdollisesti substituoitu yhdellä tai useammalla ryhmällä, jotka valitaan halogeenista, alempi alkyylistä, alempi alkoksista, halogeenialkyylistä, halogeenialkoksista, NO_2:sta, CN:sta, ja alempi alkyylikarbonyylistä;

(g) ryhmä, jolla on kaava



toinen ryhmistä X^2 ja X^3 on N ja toinen on CH;

R^{21} on $-Z-R^{22}$, fenyyli, tai substituoitu fenyyli;

Z on O tai S; ja

R^{22} on C_{1-4}-alkyyli, C_{3-7}-haarautunut alkyyli, halogeeni-C_{1-7}-alkyyli, halogeeni-C_{3-7}-(haarautunut alkyyli), C_{1-4}-alkoksisubstituoitu C_{1-4}-alkyyli, tai naftyyli tai fenyyli, joista kumpi tahansa voi mahdollisesti olla substituoitu enintään kolmella ryhmällä, jotka valitaan halogeenista, C_{1-10}-alkyylistä, haarautuneesta C_{3-7}-alkyylistä, halogeeni-C_{1-7}-alkyylistä, hydroksi-C_{1-7}-alkyylistä, C_{1-4}-alkoksista, halogeeni-C_{1-4}-alkoksista, fenoksista, substituoidusta fenoksista, fenyylistä, substituoidusta fenyylistä, CN:stä,

NO_2:sta, OH:sta, C_{1-4}-alkanoyylioksista, tai bentsyylioksista.

2. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, jossa

R on H;

R^1, R^2, R^3 ja R^4 merkitsevät yhtä seuraavista:

a) R^1 ja R^2 merkitsevät toisistaan riippumatta halogeenia, C_{1-4}-alkyyliä, C_{1-4}-alkoksia, tai halogeeni-C_{1-4}-alkoksia, ja R^3 ja R^4 ovat H;

b) yksi ryhmistä R^1, R^2, R^3, ja R^4 on C_{1-4}-alkyyli, C_{3-4}-haarautunut alkyyli, C_{1-4}-alkoksi, halogeeni-C_{1-4}-alkyyli, halogeeni-C_{1-4}-alkoksi, C_{1-4}-alkyylitio, C_{1-4}-alkyylisulfinyyli, C_{1-4}-alkyylisulfonyyli, aryyli tai substituoitu amino, ja muut ovat H;

c) R^1, R^2, R^3 ja R^4 merkitsevät toisistaan riippumatta halogeenia tai H:ä;

Y'Z yhdessä muodostaa tyydyttyneen tai tyydyttymättömän C_{4-11}-hiilivetyketjun, haarautumattoman tai haarautuneen, joka mahdollisesti sisältää heteroatomin, joka valitaan ryhmästä, jonka muodostavat O, NR^5, S, SO, SO_2 ja SiR^6R^7, jossa R^5, R^6, R^7 ovat edellä määriteltyjä, ja joka on mahdollisesti substituoitu yhdellä tai useammalla ryhmistä, jotka valitaan toisistaan riippumatta C_{1-4}-alkyylistä, C_{2-4}-alkenyylistä, C_{2-4}-alkynyylistä, haarautuneesta C_{3-7}-alkyylistä, C_{3-7}-sykloalkyylistä, C_{3-7}-sykloalkenyylistä, halogeenista, halogeeni-C_{1-4}-alkyylistä, halogeeni-C_{1-4}-alkoksista, hydroksista tai C_{1-4}-asyylistä; tai

Y' on sidos tai bivalenttinen hiilivetyradikaali, joka on 1 - 5 hiiliatomia pitkä, mahdollisesti substituoitu C_{1-4}-alkyylillä, C_{2-4}-alkenyylillä, C_{2-4}-alkynyylillä, haarautuneella C_{3-7}-alkyylillä, C_{3-7}-sykloalkyylillä tai C_{3-7}-sykloalkenyylillä, halogeenilla, halogeeni-C_{1-4}-alkyylillä, halogeeni-C_{1-4}-alkoksilla, hydroksilla tai C_{1-4}-asyylillä; ja

Z on

(a) aryyli tai

(b) C_{3-8}-sykloalkyyli tai sykloalkenyyli, mahdollisesti substituoitu yhdellä tai useammalla ryhmällä, jotka valitaan toisistaan riippumatta C_{1-4}-alkyylistä, C_{1-4}-alkoksista, halogeeni-C_{1-4}-alkyylistä, halogeeni-C_{1-4}-alkoksista, halogeenista, hydroksista tai C_{1-4}-asyylistä; jossa

aryyli on

(a) fenyyliryhmä, joka on mahdollisesti substituoitu yhdellä tai useammalla ryhmällä, jotka valitaan toisistaan riippumatta seuraavista:

halogeeni,

I,

C_{3-8}-sykloalkyyli,

C_{3-8}-sykloalkenyyli,

fenoksi,

substituoitu fenoksi,

fenyylitio,

substituoitu fenyylitio,

fenyyli,

substituoitu fenyyli,

NO_2,

$-\overset{O}{\overset{\|}{C}}-R^8$, jossa R^8 on C_{1-7}-alkyyli, halogeeni-C_{1-7}-alkyyli, C_{3-7}-haarautunut alkyyli, halogeeni-C_{3-7}-(haarautunut alkyyli), C_{3-7}-sykloalkyyli, halogeeni-C_{3-7}-sykloalkyyli, fenyyli tai substituoitu fenyyli,

asetoksi,

OH,

CN,

$SiR^9R^{10}R^{11}$ tai $OSiR^9R^{10}R^{11}$, jossa R^9, R^{10} ja R^{11} merkitsevät toisistaan riippumatta C_{1-4}-alkyyliä, C_{3-4}-haarautunutta alkyyliä, fenyyliä, tai substituoitua fenyyliä,

$NR^{12}R^{13}$, jossa R^{12} ja R^{13} merkitsevät toisistaan riippumatta H:ä, C_{1-4}-alkyyliä tai C_{1-4}-asyyliä,

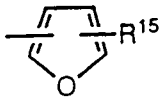
$S(O)R^{14}$ tai SO_2R^{14}, jossa R^{14} on C_{1-10}-alkyyli, fenyyli tai substituoitu fenyyli;

tyydyttynyt tai tyydyttymätön C_{1-12}-hiilivetyketju, haarautumaton tai haarautunut sisältäen mahdollisesti heteroatomin, joka valitaan ryhmästä, jonka muodostavat O, S, SO, SO_2, NR^5, ja SiR^6R^7, jossa R^5, R^6, R^7 ovat edellä määriteltyjä, ja joka on mahdollisesti substituoitu halogeenilla, halogeeni-C_{1-4}-alkoksilla, hydroksilla, C_{3-8}-sykloalkyylillä tai sykloalkenyylillä, C_{1-4}-asyylillä, fenoksilla, substituoidulla fenoksilla, fenyylillä, substituoitulla fenyylillä, fenyylitiolla tai substituoidulla fenyylitiolla;

C_{1-7}-alkoksi, joka on mahdollisesti substituoitu halogeenilla, fenyylillä, substituoidulla fenyylillä, C_{3-8}-sykloalkyylillä tai sykloalkenyylillä, fenoksilla tai substituoidulla fenoksilla; tai

C_{1-7}-alkyylitio, joka on mahdollisesti substituoitu halogeenilla, fenyylillä, substituoidulla fenyylillä, C_{3-8}-sykloalkyylillä tai sykloalkenyylillä, fenoksilla tai substituoidulla fenoksilla;

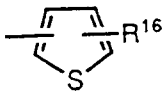
(b) furyyliryhmä, jolla on kaava (3)



(3)

jossa R^{15} on H, halogeeni, halogeenimetyyli, CN, NO_2, C_{1-4}-alkyyli, C_{3-4}-haarautunut alkyyli, fenyyli, C_{1-4}-alkoksi;

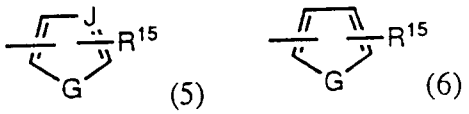
(c) tienyyliryhmä, jolla on kaava (4)



(4)

jossa R^{16} on H, halogeeni, halogeenimetyyli, CN, NO_2, C_{1-4}-alkyyli, C_{3-4}-haarautunut alkyyli, fenyyli, C_{1-4}-alkoksi, halogeeni-C_{1-4}-alkoksi tai tienyyli;

(d) ryhmä, jolla on kaava (5) tai (6)



(5) (6)

jossa R^{15} on määritelty kappaleessa (b), J on N tai CH, ja G on O, NR^{17}, tai S, edellyttäen, että jos J ei ole N, silloin G on NR, jossa R^{17} on H, C_{1-4}-alkyyli, C_{1-4}-asyyli, fenyylisulfonyyli tai substituoitu fenyylisulfonyyli;

(e) ryhmä, joka valitaan

mahdollisesti substituoidusta naftyylistä, dihydronaftyylistä, tetrahydronaftyylistä ja dekahydronaftyylistä;

mahdollisesti substituoidusta pyridyylistä;

mahdollisesti substituoidusta indolyylistä;

1,3-bentsodioksolyylistä;

2,6-dimetyyli-4-morfolinyylistä; ja

1-adamantyylistä.

3. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, jossa R^1 on C_{1-4}-alkyyli ja R^2 on halogeeni tai I.

4. Patenttivaatimuksen 3 mukainen yhdiste, jossa R^1 on etyyli ja R^2on kloori.

5. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, jossa Y' on $-CH_2-$.

6. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, jossa Z on substituoitu fenyyliryhmä, kuten on määritelty aryylin määritys-kappaleessa (a).

7. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, joka on N-(3-kloori-2-etyyli-4-pyridyyli)(4-((4-kloorifenyyli)oksi)fenyyli)asetamidi.

8. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, jossa R^1 ja R^2 yhdistyvät, jolloin muodostuu tyydyttynyt tai tyydyttymätön C_{5-6}-karbosyklinen rengas, joka mahdollisesti on substituoitu yhdellä tai kahdella ryhmällä, jotka valitaan halogeenista, C_{1-4}-alkyylistä, C_{3-4}-haarautunut alkyylistä,

halogeeni-C_{1-4}-alkyylistä, C_{3-7}-sykloalkyylistä, C_{1-4}-alkoksista, halogeeni-C_{1-4}-alkoksista tai NO_2:sta.

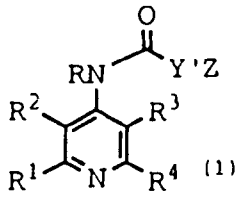
9. Menetelmä hyönteis- tai punkkipopulaation inhiboimiseksi, joka käsittää vaikuttavan hyönteisiä tai punkkeja inaktivoivan määrän patenttivaatimuksen 1 mukaista yhdistettä käyttämisen hyönteis- tai punkkipaikkaan.

10. Menetelmä sukkulamatopopulaation inhiboimiseksi, joka käsittää sukkulamatoja inaktivoivan määrän patenttivaatimuksen 1 mukaista yhdistettä käyttämisen sukkulamatopaikkaan.

11. Menetelmä kasvipatogeenien inhiboimiseksi, joka käsittää vaikuttavan määrän patenttivaatimuksen 1 mukaista yhdistettä käyttämisen patogeenipaikkaan.

Patentkrav: L10

1. Förening, k ä n n e t e c k n a d därav, att den har formeln:



(1)

eller en N-oxid eller ett salt därav, vari

R är H, C_{1-4}-alkyl eller bensyl;

R^1, R^2, R^3 och R^4 är en av följande:

a) R^3 och R^4 är H, och R^1 och R^2 är självständigt halogen, C_{1-4}-alkyl, halogen-C_{1-4}-alkyl, C_{3-4}-förgrenad alkyl, C_{3-7}-cykloalkyl, C_{1-4}-alkoxi eller halogen-C_{1-4}-alkoxi;

b) en av R^1, R^2, R^3 och R^4 är C_{1-4}-alkyl, C_{3-4}-förgrenad alkyl, C_{1-4}-alkoxi, halogen-C_{1-4}-alkyl, halogen- C_{1-4}-alkoxi, C_{1-4}-alkyltio, C_{1-4}-alkylsulfinyl, C_{1-4}- alkylsulfonyl, aryl, eller substituerad amino och återstoden är H;

c) R^1, R^2, R^3 och R^4 är sjalvständigt H eller halogen; eller

d) R^1 och R^2 kombineras för bildinde av en mättad eller omättad C_{5-6}-karbocyklisk ring, som valfritt är substituerad med en eller två grupper valda bland halogen, C_{1-4}-alkyl, C_{3-4}-förgrenad alkyl, halogen-C_{1-4}-alkyl, C_{3-7}-cykloalkyl, C_{1-4}-alkoxi, halogen-C_{1-4}-alkoxi eller NO_2, och R^3 och R^4 är H;

R^5 är H, C_{1-4}-alkyl eller C_{1-4}-acyl;

R^6 och R^7 är självständigt C_{1-4}-alkyl, C_{3-4}-förgrenad alkyl, fenyl eller substituerad fenyl;

Y'Z tillsammans bildar en mattad eller omättad C_{4-11}-kolvätekedja, rakkedjad eller förgrenad, som eventuellt innehåller en heteroatom, vald bland O, NR^5, S, SO, SO_2 eller SiR^6R^7, vari R^5, R^6 och R^7 är såsom ovan definierats,

och valfritt substituerad med en eller flera grupper självständigt valda bland C_{1-4}-alkyl, C_{2-4}-alkenyl, C_{2-4}-alkynyl, förgrenad C_{3-7}-alkyl, C_{3-7}-cykloalkyl, C_{3-7}-cykloalkenyl, halogen, halogen-C_{1-4}-alkyl, halogen-C_{1-4}-alkoxi, hydroxi eller C_{1-4}-acyl; eller

Y' är en bindning eller en bivalent kolväteradikal, som är 1 - 5 kolatomer lång, valfritt substituerad med C_{1-4}-alkyl, C_{2-4}-alkenyl, C_{2-4}-alkynyl, förgrenad C_{3-7}-alkyl, C_{3-7}-cykloalkyl eller C_{3-7}-cykloalkenyl, halogen, halogen-C_{1-4}-alkyl, halogen-C_{1-4}-alkoxi, hydroxi, CN eller C_{1-4}-acyl; och

Z är

(a) aryl eller

(b) C_{3-8}-cykloalkyl eller cykloalkenyl, valfritt substituerad med en eller flera grupper självständigt valda bland C_{1-4}-alkyl, C_{1-4}-alkoxi, halogen-C_{1-4}-alkyl, halogen-C_{1-4}-alkoxi, halogen, hydroxi eller C_{1-4}-acyl; vari

aryl är

(a) en fenylgrupp, valfritt substituerad med en eller flera grupper självständigt valda bland:

halogen,

I,

C_{3-8}-cykloalkyl,

C_{3-8}-cykloalkenyl,

fenoxi,

substituerad fenoxi,

fenyltio,

substituerad fenyltio,

fenyl,

substituerad fenyl,

NO_2,

O
"
C-R^8 vari R^8 är C_{1-7}-alkyl, halogen-C_{1-7}-alkyl, C_{3-7}-förgrenad alkyl, halogen-C_{3-7}-förgrenad alkyl, C_{3-7}-cykloal-

kyl, halogen-C_{3-7}-cykloalkyl, C_{1-7}-alkoxi, fenyl eller substituerad fenyl,

acetoxi,

OH,

CN,

$SiR^9R^{10}R^{11}$ eller $OSiR^9R^{10}R^{11}$, vari R^9, R^{10} och R^{11} självständigt är C_{1-4}-alkyl, C_{3-4}-förgrenad alkyl, fenyl eller substituerad fenyl,

$NR^{12}R^{13}$ vari R^{12} och R^{13} självständigt är H, C_{1-4}-alkyl eller C_{1-4}-acyl,

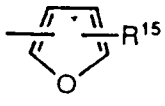
$S(O)R^{14}$ eller SO_2R^{14}, vari R^{14} är C_{1-10}-alkyl, fenyl eller substituerad fenyl;

en mättad eller omättad C_{1-12}-kolvätekedja, rakkedjad eller förgrenad och valfritt innehåller en heteroatom vald bland O, S, SO, SO_2, NR_5 eller SiR^6R^7, vari R^5, R^6 och R^7 är såsom ovan definierats, och valfritt substituerad med halogen, halogen-C_{1-4}-alkoxi, hydroxi, C_{3-8}-cykloalkyl eller cykloalkenyl, C_{1-4}-acyl, fenoxi, substituerad fenoxi, fenyl, substituerad fenyl, fenyltio eller substituerad fenyltio;

C_{1-7}-alkoxi, valfritt substituerad med halogen, fenyl, substituerad fenyl, C_{3-8}-cykloalkyl eller cykloalkenyl, fenoxi eller substituerad fenoxi;

C_{1-7}-alkyltio, valfritt substituerad med halogen, fenyl, substituerad fenyl, C_{3-8}-cykloalkyl eller cykloalkenyl, fenoxi eller substituerad fenoxi;

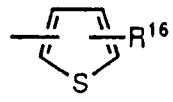
(b) en furylgrupp med formeln (3)



(3)

vari R^{15} är H, halogen, halogenmetyl, CN, NO_2, C_{1-4}-alkyl, C_{3-4}-förgrenad alkyl, fenyl, C_{1-4}-alkoxi, halogen-C_{1-4}-alkoxi;

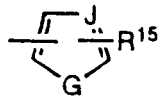
(c) en tienylgrupp med formeln (4)



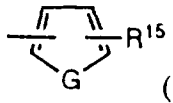
(4)

vari R^{16} är H, halogenmetyl, CN, NO_2, C_{1-4}-alkyl, C_{3-4}-förgrenad alkyl, fenyl, C_{1-4}-alkoxi, halogen-C_{1-4}-alkoxi eller tienyl;

(d) en grupp med formeln (5) eller (6)



(5)



(6)

vari R^{15} är såsom definierats i (b), J är N eller CH, och G är O, NR^{17} eller S, under förutsättning, att om J icke är N, är G NR, vari R^{17} är H, C_{1-4}-alkyl, C_{1-4}-acyl, fenylsulfonyl eller substituerad fenylsulfonyl;

(e) en grupp vald bland

valfritt substituerad naftyl, dihydronaftyl, tetrahydronaftyl och dekahydronaftyl;

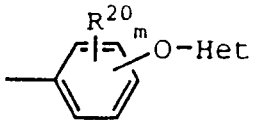
valfritt substituerad indolyl;

1,3-bensodioxolyl;

2,6-dimetyl-4-morfolinyl; och

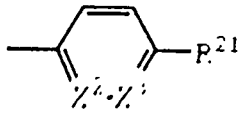
1-adamantyl;

(f) en grupp med formeln



vari m är 4; R^{20} är självständigt H, halogen, lägre alkyl, lägre alkoxi, halogenalkyl, halogenalkoxi, NO_2, CN, lägre alkylkarbonyl, fenoxi eller substituerad fenoxi, under förutsättning, att åtminstone två av R^{20} valts bland H och F; och Het är pyridyl, pyrazinyl, pyrimidinyl eller pyridazinyl, valfritt substituerad med en eller flera grupper valda bland halogen, lägre alkyl, lägre alkoxi, halogenalkyl, halogenalkoxi, NO^2, CN och lägre alkylkarbonyl;

(g) en grupp med formeln



vari den ena av X^2 och X^3 är N och den andra är CH;

R^{21} är -Z-R^{22}, fenyl eller substituerad fenyl;

Z är O eller S; och

R^{22} är C_{1-4}-alkyl, C_{3-7}-förgrenad alkyl, halogen-C_{1-7}-alkyl, halogen-C_{3-7}-förgrenad alkyl, C_{1-4}-alkoxisubstituerad C_{1-4}-alkyl, eller naftyl eller fenyl, av vilka någondera kan vara valfritt substituerad med upp till tre grupper valda bland halogen, C_{1-10}-alkyl, förgrenad C_{3-7}-alkyl, halogen-C_{1-7}-alkyl, hydroxi-C_{1-7}-alkyl, C_{1-4}-alkoxi, halogen-C_{1-4}-alkoxi, fenoxi, substituerad fenoxi, fenyl, substituerad fenyl, CN, NO^2, OH, C_{1-4}-alkanoyloxi eller bensyloxi.

2. Förening enligt patentkravet 1, k ä n n e t e c k n a d därav, att

R är H;

R^1, R^2, R^3 och R^4 är en av följande:

a) R^1 och R^2 är självständigt halogen, C_{1-4}-alkyl, C_{1-4}-alkoxi eller halogen-C_{1-4}-alkoxi och R^3 och R^4 är H;

b) en av R^1, R^2, R^3 och R^4 är C_{1-4}-alkyl, C_{3-4}-förgrenad alkyl, C_{1-4}-alkoxi, halogen-C_{1-4}-alkyl, halogen- C_{-1-4}-alkoxi, C_{1-4}-alkyltio, C_{1-4}-alkylsulfinyl, C_{1-4}- alkylsulfon-

yl, aryl, eller substituerad amino och återstoden är H; eller

c) R^1, R^2, R^3 och R^4 är självständigt halogen eller H;

Y'Z tillsammans bildar en mattad eller omättad C_{4-11}-kolvätekedja, rakkedjad eller förgrenad, som eventuellt innehåller en heteroatom, vald bland O, NR^5, S, SO, SO_2 eller SiR^6R^7, vari R^5, R^6 och R^7 är såsom ovan definierats, och valfritt substituerad med en eller flera grupper självständigt valda bland C_{1-4}-alkyl, C_{2-4}-alkenyl, C_{2-4}-alkynyl, förgrenad C_{3-7}-alkyl, C_{3-7}-cykloalkyl, C_{3-7}-cykloalkenyl, halogen, halogen-C_{1-4}-alkyl, halogen-C_{1-4}-alkoxi, hydroxi eller C_{1-4}-acyl; eller

Y' är en bindning eller en bivalent kolväteradikal, som är 1 - 5 kolatomer lång, valfritt substituerad med C_{1-4}-alkyl, C_{2-4}-alkenyl, C_{2-4}-alkynyl, förgrenad C_{3-7}-alkyl, C_{3-7}-cykloalkyl eller C_{3-7}-cykloalkenyl, halogen, halogen-C_{1-4}-alkyl, halogen-C_{1-4}-alkoxi, hydroxi, CN eller C_{1-4}-acyl; och

Z är

(a) aryl eller

(b) C_{3-8}-cykloalkyl eller cykloalkenyl, valfritt substituerad med en eller flera grupper självständigt valda bland C_{1-4}-alkyl, C_{1-4}-alkoxi, halogen-C_{1-4}-alkyl, halogen-C_{1-4}-alkoxi, halogen, hydroxi eller C_{1-4}-acyl; vari

aryl är

(a) en fenylgrupp, valfritt substituerad med en eller flera grupper självständigt valda bland:

halogen,

I,

C_{3-8}-cykloalkyl,

C_{3-8}-cykloalkenyl,

fenoxi,

substituerad fenoxi,

fenyltio,

substituerad fenyltio,

fenyl,

substituerad fenyl,

NO_2,

O

"

C-R^8 vari R^8 är C_{1-7}-alkyl, halogen-C_{1-7}-alkyl, C_{3-7}-förgrenad alkyl, halogen-C_{3-7}-förgrenad alkyl, C_{3-7}-cykloalkyl, halogen-C_{3-7}-cykloalkyl, C_{1-7}-alkoxi, fenyl eller substituerad fenyl,

acetoxi,

OH,

CN,

$SiR^9R^{10}R^{11}$ eller $OSiR^9R^{10}R^{11}$, vari R^9, R^{10} och R^{11} självständigt är C_{1-4}-alkyl, C_{3-4}-förgrenad alkyl, fenyl eller substituerad fenyl,

$NR^{12}R^{13}$ vari R^{12} och R^{13} självständigt är H, C_{1-4}-alkyl eller C_{1-4}-acyl,

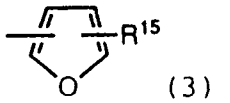
$S(O)R^{14}$ eller SO_2R^{14}, vari R^{14} är C_{1-10}-alkyl, fenyl eller substituerad fenyl;

en mättad eller omättad C_{1-12}-kolvätekedja, rakkedjad eller förgrenad och valfritt innehåller en heteroatom vald bland O, S, SO, SO_2, NR_5 eller SiR^6R^7, vari R^5, R^6 och R^7 är såsom ovan definierats, och valfritt substituerad med halogen, halogen-C_{1-4}-alkoxi, hydroxi, C_{3-8}-cykloalkyl eller cykloalkenyl, C_{1-4}-acyl, fenoxi, substituerad fenoxi, fenyl, substituerad fenyl, fenyltio eller substituerad fenyltio;

C_{1-7}-alkoxi, valfritt substituerad med halogen, fenyl, substituerad fenyl, C_{3-8}-cykloalkyl eller cykloalkenyl, fenoxi eller substituerad fenoxi;

C_{1-7}-alkyltio, valfritt substituerad med halogen, fenyl, substituerad fenyl, C_{3-8}-cykloalkyl eller cykloalkenyl, fenoxi eller substituerad fenoxi;

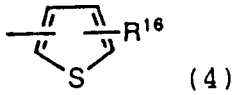
(b) en furylgrupp med formeln (3)



(3)

vari R^{15} är H, halogen, halogenmetyl, CN, NO_2, C_{1-4}-alkyl, C_{3-4}-förgrenad alkyl, fenyl, C_{1-4}-alkoxi, halogen-C_{1-4}-alkoxi;

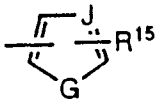
(c) en tienylgrupp med formeln (4)



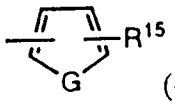
(4)

vari R^{16} är H, halogenmetyl, CN, NO_2, C_{1-4}-alkyl, C_{3-4}-förgrenad alkyl, fenyl, C_{1-4}-alkoxi, halogen-C_{1-4}-alkoxi eller tienyl;

(d) en grupp med formeln (5) eller (6)



(5)



(6)

vari R^{15} är såsom definierats i (b), J är N eller CH, och G är O, NR^{17} eller S, under förutsättning, att om J icke är N, är G NR, vari R^{17} är H, C_{1-4}-alkyl, C_{1-4}-acyl, fenylsulfonyl eller substituerad fenylsulfonyl;

(e) en grupp vald bland

valfritt substituerad naftyl, dihydronaftyl, tetrahydronaftyl och dekahydronaftyl;

valfritt substituerad pyridyl;

valfritt substituerad indolyl;

1,3-bensodioxolyl;

2,6-dimetyl-4-morfolinyl; och

1-adamantyl.

3. Förening enligt patentkravet 1, k ä n n e t e c k n a d därav, att R^1 är C_{1-4}-alkyl och R^2 är halogen eller I.

4. Förening enligt patentkravet 3, k ä n n e t e c k n a d därav, att R^1 är etyl och R^2 är klor.

5. Förening enligt patentkravet 1, k ä n n e t e c k n a d därav, att Y' är CH_2.

6. Förening enligt patentkravet 1, k ä n n e t e c k n a d därav, att Z är en substituerad fenylgrupp såsom definierats i (a) för aryl.

7. Förening enligt patentkravet 1, k ä n n e t e c k n a d därav, att den är N-(3-klor-2-etyl-4-pyridyl)(4-(4-((4-klorfenyl)oxi)fenyl)acetamid.

8. Förening enligt patentkravet 1, k ä n n e t e c k n a d därav, att R^1 och R^2 kombineras för bildinde av en mättad eller omättad C_{5-6}-karbocyklisk ring, som valfritt är substituerad med en eller två grupper valda bland halogen, C_{1-4}-alkyl, C_{3-4}-förgrenad alkyl, halogen-C_{1-4}-alkyl, C_{3-7}cykloalkyl, C_{1-4}-alkoxi, halogen-C_{1-4}-alkoxi eller NO_2.

9. Förfarande för hämmande av insekt- eller kvalsterpopulation, k ä n n e t e c k n a t därav, att man på vistelseplatsen för insekten eller kvalstret anbringar en effektiv insekt- eller kvalsterinaktiverande mängd av en förening enligt patentkravet 1.

10. Förfarande för hämmande av trådmaskpopulation, k ä n n e t e c k n a t därav, att man på vistelseplatsen för trådmasken anbringar en tradmaskinaktiverande mängd av en förening enligt patentkravet 1.

11. Förfarande för hämmande av växtpatogener, k ä n n e t e c k n a t därav, att man på växtplatsen för patogenen anbringar en effektiv mängd av en förening enligt patentkravet 1.