



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ

(21), (22) Заявка: 2003133144/04, 02.04.2002

(24) Дата начала отсчета срока действия патента:
02.04.2002(30) Конвенционный приоритет:
12.04.2001 DE 10118310.0

(43) Дата публикации заявки: 10.05.2005

(45) Опубликовано: 20.09.2007 Бюл. № 26

(56) Список документов, цитированных в отчете о
поиске: EP 0368592 A1, 16.05.1990. US 4659372
A, 21.04.1987. GB 1567300 A, 14.05.1980. SU
634670 A, 30.11.1978.(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную фазу:
12.11.2003(86) Заявка РСТ:
EP 02/03620 (02.04.2002)(87) Публикация РСТ:
WO 02/088098 (07.11.2002)

Адрес для переписки:
103064, Москва, ул. Казакова, 16, НИИР
Канцелярия "Патентные поверенные Квашнин,
Сапельников и партнеры", В.П.Квашнину

(72) Автор(ы):

ФИШЕР Райнер (DE),
УЛЬМАНН Астрид (DE),
ТРАУТВАЙН Аксель (DE),
ДРЕВЕС Марк Вильгельм (DE),
ЭРДЕЛЕН Кристоф (DE),
ДАМЕН Петер (DE),
ФОЙХТ Дитер (DE),
ПОНТЦЕН Рольф (DE),
КУК Карл-Хайнц (DE),
ВАХЕНДОРФ-НОЙМАНН Ульрике (DE)

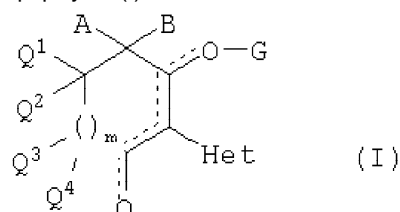
(73) Патентообладатель(и):

БАЙЕР КРОПСАЙЕНС АГ (DE)

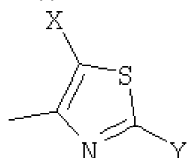
(54) ЗАМЕЩЕННЫЕ ТИАЗОЛИЛОМ КАРБОЦИКЛИЧЕСКИЕ 1,3-ДИОНЫ В КАЧЕСТВЕ СРЕДСТВ
ДЛЯ БОРЬБЫ С ВРЕДИТЕЛЯМИ

(57) Реферат:

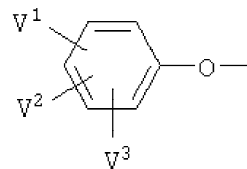
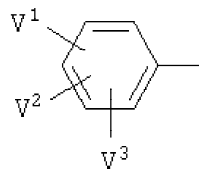
Изобретение относится к соединениям
формулы (I)



где Het означает группу

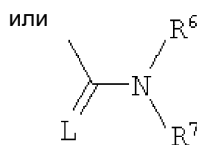
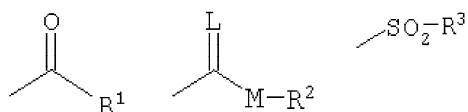


m означает числа 0 или 1, X означает водород
или алкил с 1-6 атомами углерода, Y означает
группы



V¹ означает галоген, алкил с 1-12 атомами
углерода или галогеналкил с 1-4 атомами углерода,
V² и V³ означают водород, V¹ и V² означают
вместе с атомом углерода, с которым они связаны,
незамещенный или замещенный алкилом с 1-4
атомами углерода или галогеном 5- или 6-членный
цикл, в котором, при необходимости, один до двух
атомов углерода могут быть заменены кислородом,

серой или азотом, А означает водород, незамещенные алкил с 1-12 атомами углерода, циклоалкил с 3-8 атомами углерода или арил, В означает водород или алкил с 1-6 атомами углерода, А, В и атом углерода, с которым они связаны, означают насыщенный циклоалкил с 3-10 атомами углерода, в котором, при необходимости, одно кольцевое звено заменено кислородом, А и Q¹ вместе означают незамещенный алкандиол с 3-6 атомами углерода, в котором два атома углерода, не находящиеся в непосредственном соседстве друг к другу, образуют, при необходимости, дальнейший незамещенный цикл, Q¹ означает водород, алкил с 1-6 атомами углерода или фенил, замещенный галогеном, Q² означает водород или алкил с 1-4 атомами углерода, Q³, Q⁴ означают водород, Q¹ и Q² означают вместе с атомом углерода, с которым они связаны, означают циклоалкил, G означает водород или одну из групп



где L означает кислород, M означает кислород или серу, R¹ означает незамещенные алкил с 1-20 атомами углерода, или алкоксиалкил с 1-8 атомами углерода в алкоксильной части и 1-8 атомами углерода в алкильной части, или незамещенный или замещенный галогеном циклоалкил с 3-8 атомами углерода, или замещенные галогеном фенил или гетарил, R² означает незамещенный алкил с 1-20 атомами углерода, фенил или бензил, R³ означает незамещенный алкил с 1-8 атомами углерода, R⁶ и R⁷ означают вместе с атомом азота, с которым они связаны, незамещенный алкиленовый радикал с 3-6 атомами углерода, в котором, при необходимости, один атом углерода заменен кислородом. Соединения согласно настоящему изобретению могут использоваться в качестве средств для борьбы с сельскохозяйственными вредителями. 3 з.п. ф-лы.



FEDERAL SERVICE
FOR INTELLECTUAL PROPERTY,
PATENTS AND TRADEMARKS

(51) Int. Cl.

C07D 277/24 (2006.01)*C07D 417/12* (2006.01)**(12) ABSTRACT OF INVENTION**(21), (22) Application: **2003133144/04, 02.04.2002**(24) Effective date for property rights: **02.04.2002**(30) Priority:
12.04.2001 DE 10118310.0(43) Application published: **10.05.2005**(45) Date of publication: **20.09.2007 Bull. 26**(85) Commencement of national phase: **12.11.2003**(86) PCT application:
EP 02/03620 (02.04.2002)(87) PCT publication:
WO 02/088098 (07.11.2002)

Mail address:
**103064, Moskva, ul. Kazakova, 16, NIIR
Kantsel'arija "Patentnye poverennye Kvashnin,
Sapel'nikov i partnery", V.P.Kvashninu**

(72) Inventor(s):

**FISHER Rajner (DE),
ULL'MANN Astrid (DE),
TRAUTVAJN Aksel' (DE),
DREVES Mark Vil'khel'm (DE),
EhrDELEN Kristof (DE),
DAMEN Peter (DE),
FOJKhT Diter (DE),
PONTTsEN Rol'f (DE),
KUK Karl-Khajnts (DE),
VAKhENDORFF-NOJMANN Ul'rike (DE)**

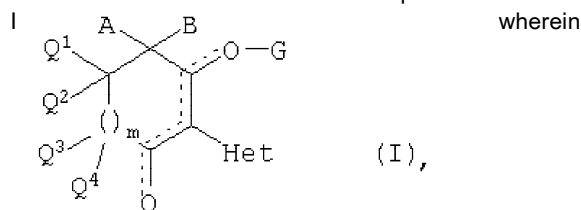
(73) Proprietor(s):

BAJER KROPSAJENS AG (DE)**(54) THIAZOLYL-SUBSTITUTED CARBOCYCLIC 1,3-DIONES AS AGENT FOR PEST CONTROLLING**

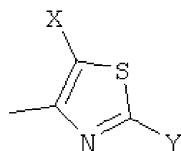
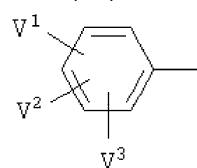
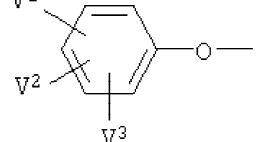
(57) Abstract:

FIELD: organic chemistry, agriculture.

SUBSTANCE: Disclosed are compound of formula wherein



Het represents group of formula 2

(m = 0 or 1; X is hydrogen or C₁-C₁₂-alkyl or C₁-C₄-haloalkyl; Y is group of formula 3 and 4V¹ V² V³ wherein substitutes

have meanings described in specification); A represents hydrogen, unsubstituted C₁-C₁₂-alkyl; C₃-C₈-cycloalkyl, or aryl; B represents hydrogen or C₁-C₆-alkyl; or A and B with carbon atom to which they are attached form saturated C₃-C₁₀-alkyl; A and Q¹ together represent unsubstituted C₃-C₆-alkanediyl, wherein two non-adjacent carbon atoms optionally form further unsubstituted cycle; meanings of the rest substitutes are as described in specification.

EFFECT: new agents for controlling of agriculture pests.

4 cl, 28 ex

Текст описания представлен в факсимильном виде.

Описание

5

Настоящее изобретение касается новых замещенных тиазолилом производные цикlopентан- и циклогексан-1,3-диона, способов их получения, и их применения

10

в качестве биологически активных веществ в сельском хозяйстве.

15

Уже известен 2-(2-амино-тиазол-4-ил)-3-гидрокси-5,5-диметил-циклогексен-2-ено-
н); Пшеничный В.Н. и др.; CNCIALi; Chem. Heterocycl. Compd. (англ. перевод) EN;
26, 1175-1178 (1990).

20

25

30

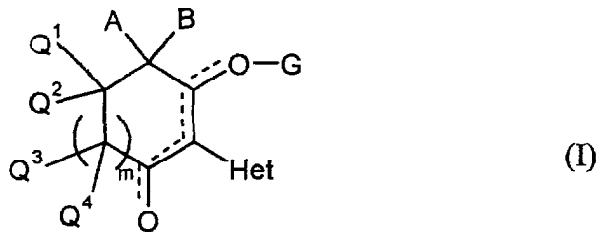
35

40

45

50

Теперь были найдены новые соединения формулы (I)



где

Het - содержащий азот 5-кольцевой гетероцикл, предпочтительно из тиазолильного ряда, незамещенный или замещенный остатками из группы, включающей галоген, алкил, алкоксил, алкенилокси, галогеналкил, галогеналкоксил, галогеналкенилокси, циано, нитро, алкилтио, алкилсульфинил, алкилсульфонил, незамещенные или замещенные фенил или феноксид,

m - числа 0 или 1,

A - водород, незамещенные или замещенные галогеном алкил, алкенил, алкоксиалкил, полиалкоксиалкил, алкилтиоалкил, насыщенный или ненасыщенный, незамещенный или замещенный циклоалкил, в котором, при необходимости, по меньшей мере один кольцевой атом заменен гетероатомом, или арил, арилалкил или гетарил, незамещенные или замещенные остатками из группы, включающей галоген, алкил, галогеналкил, алкоксил, галогеналкоксил, циано или нитро,

B - водород или алкил,

А и В вместе с атомом углерода, с которым они связаны, означают насыщенный или ненасыщенный, содержащий по меньшей мере один гетероатом незамещенный или замещенный цикл,

А и Q¹ вместе означают незамещенный или замещенный алкандиол, в котором два атома углерода, не находящихся в непосредственном соседстве друг к другу, образуют, при необходимости, дальнейший незамещенный или замещенный цикл

Q¹ - водород, алкил, алкоксиалкил, незамещенный или замещенный циклоалкил (в котором, при необходимости, метиленовая группа заменена кислородом или серой) или незамещенные или замещенные фенил, гетарил, фенилалкил или гетарилалкил,

Q², Q³, Q⁴ означают независимо друг от друга водород или алкил,

Q¹ и Q² вместе с атомом углерода, с которым они связаны, означают насыщенный или ненасыщенный, содержащий по меньшей мере один гетероатом незамещенный или замещенный цикл,

G - водород (а) или одна из групп

R^3 - незамещенные или замещенные алкил, галогеналкил, фенил или бензил

5

R^4 и R^5 независимо друг от друга означают незамещенные или замещенные галогеном алкил, алкоксил, алкиламино, диалкиламино, алкилтио, алкенилтио, циклоалкилтио, или незамещенные или замещенные фенил, бензил фенокси или фенилтио,

10

15

R^6 и R^7 независимо друг от друга означают водород, незамещенные или замещенные галогеном алкил, циклоалкил, алкенил, алкоксил, незамещенный или замещенный фенил, незамещенный или замещенный бензил, или вместе с атомом азота, с которым они связаны, означают непрерывный или прерванный кислородом или серой цикл.

20

25

30

Соединения формулы (I) могут иметься – также в зависимости от вида заместителей, в форме геометрических и/или оптических изомеров или смесей изомеров различного состава, которые, при необходимости, можно разделять обычным методом. Как чистые изомеры, так и изомерные смеси, их получение и применение, а также средства, в которых они содержатся, являются объектом настоящего изобретения. В нижеследующем для упрощения речь идет о соединениях формулы (I), хотя и имеются ввиду как чистые изомеры, так и, при необходимости, смеси с различным содержанием изомерных соединений.

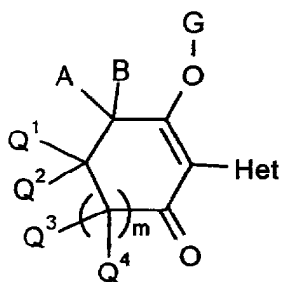
35

40

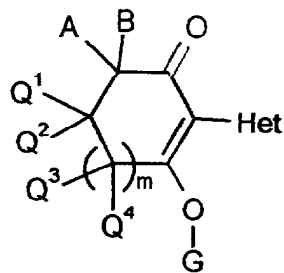
45

50

Соединения формулы (I) могут, в зависимости от положения заместителя G, иметься в обеих изомерных формах формул (I- α) и (I- β),



(I-α)



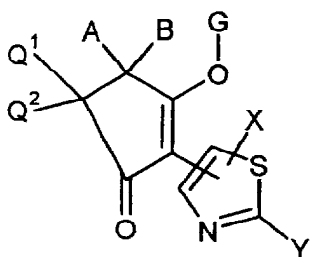
(I-β)

что выражается находящейся в формуле (I) штрихованной линией.

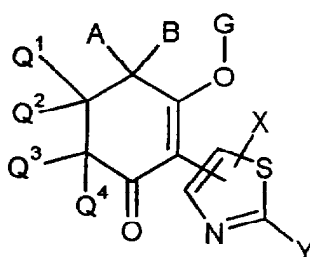
Соединения формул (I-α) и (I-β) могут иметься как в форме смесей, так и в форме их чистых изомеров. Смеси соединений формул (I-α) и (I-β) можно, при необходимости, известным по себе образом разделить физическими способами, например, хроматографическим методом.

В целях лучшей наглядности в нижеследующем приводится лишь один из возможных изомеров. Этим не исключается, что соединения, при необходимости, могут иметься в форме изомерных смесей или, в данном случае, в другой форме изомера.

Принимая во внимание тиазолил для определения группы Het и индекс m, означающий числа 0 и 1, получаются следующие основные структуры (I-1) и (I-2)

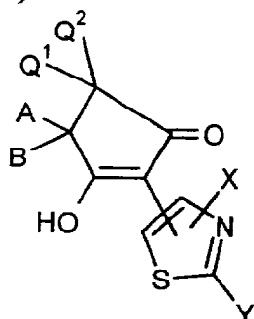
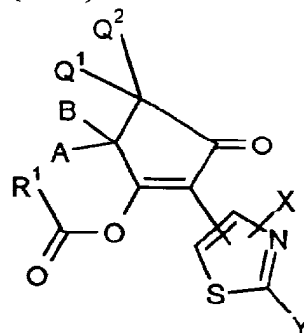
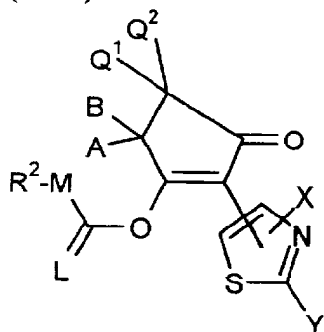
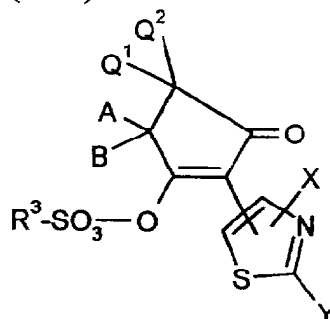
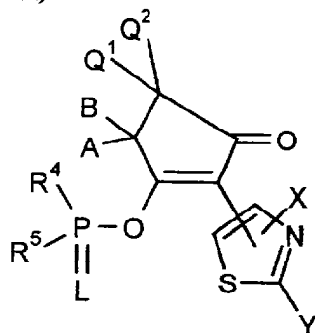
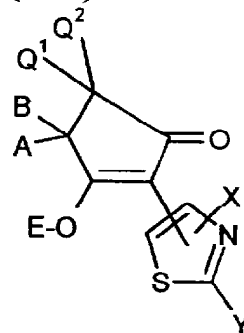


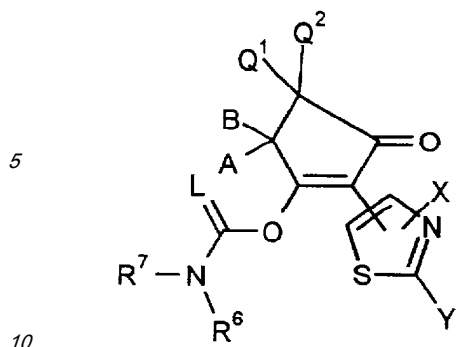
(I-1)



(I-2)

Включая различные значения (а), (б), (в), (г), (д), (е) и (ж) группы G, получаются следующие основные структуры (I-1-а) до (I-1-ж) в случае, если m означает число 0 (I-1),

(I-1-а):**(I-1-б):****(I-1-в):****(I-1-г):****(I-1-д):****(I-1-е):****(I-1-ж):**



где

15 A, B, E, L, M, Q¹, Q², R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ и R⁷ имеют указанные выше значения, и

20 X - водород, галоген, алкил, алкоксил, алкенилокси, нитро, циано или незамещенный или замещенный фенил, и

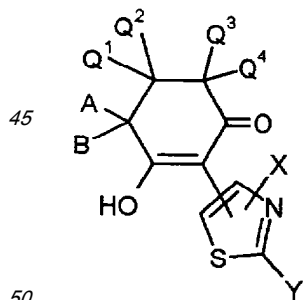
25 Y - галоген, алкил, галогеналкил, алкоксил, галогеналкоксил или незамещенные или замещенные фенил или фенокси.

30

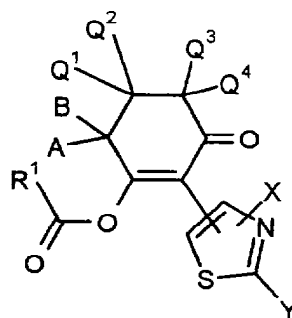
Принимая во внимание различные значения (а), (б), (в), (г), (д), (е) и (ж) группы G,
35 получаются следующие основные структуры (I-2-а) до (I-2-ж) в случае, если m означает число 1 (I-2),

40

(I-2-а):

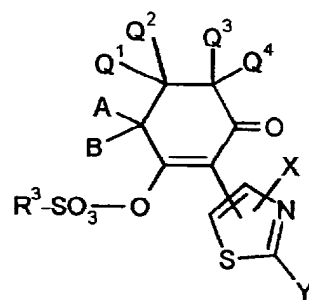
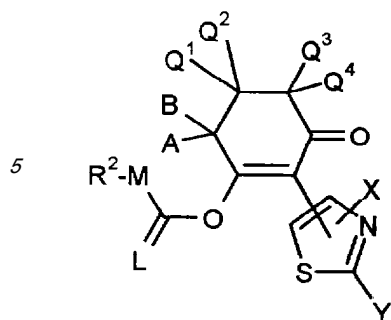


(I-2-б):

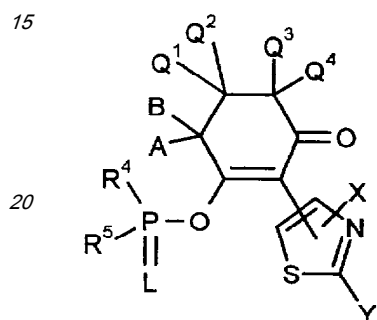


(I-2-в):

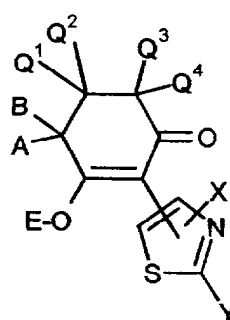
(I-2-г):



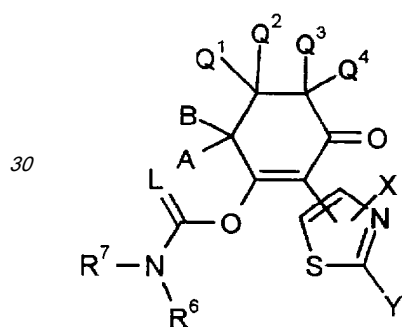
(I-2-д):



(I-2-е):



(I-1-ж):



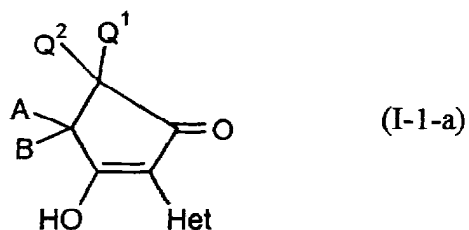
где

40 A, B, E, L, M, Q¹, Q², Q³, Q⁴, X, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ и R⁷ имеют указанные выше значения.

45 Кроме того, было найдено, что новые соединения формулы (I) получают по одному из описываемых ниже способов:

50

(A) Замещенные цикlopentan-1,3-дионы или их енолы формулы (I-1-a)

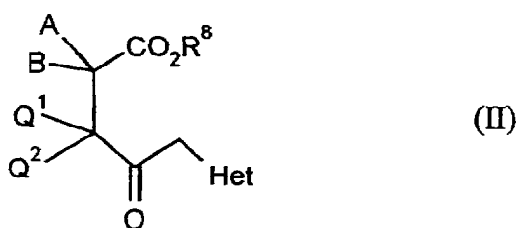


где

A, B, Q¹, Q² и Het имеют вышеуказанные значения,

получают за счет того, что

сложные эфиры кетокислоты формулы (II)



где

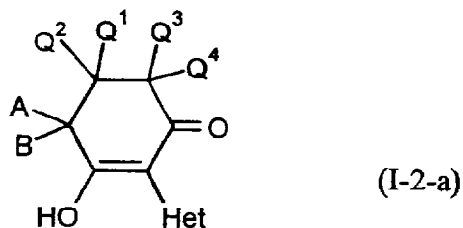
A, B, Q¹, Q² и Het имеют вышеуказанные значения, и

R⁸ означает алкил (предпочтительно алкил с 1 – 6 атомами углерода),

подвергают внутримолекулярной конденсации, при необходимости, в среде разбавителя и в присутствии основания.

Кроме того, было найдено, что

(Б) замещенные циклогексан-1,3-дионы формулы (I-2-a)

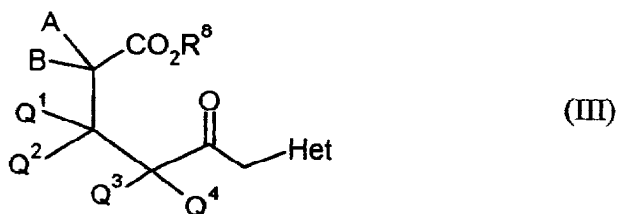


где

A, B, Q¹, Q², Q³, Q⁴ и Het имеют вышеуказанные значения,

получают за счет того, что

сложные эфиры кетокарбоновой кислоты формулы (III)



где

A, B, Q¹, Q², Q³, Q⁴ и Het имеют вышеуказанные значения, и

R⁸ означает алкил (предпочтительно алкил с 1 – 6 атомами углерода),

подвергают внутримолекулярной конденсации в среде разбавителя и в присутствии основания.

Кроме того, было найдено,

(В) что соединения приведенных выше формул (I-1-б) до (I-2-б), где А, В, Q¹, Q², Q³, Q⁴, m, R¹ и Het имеют вышеуказанные значения, получают за счет того, что соединения вышеприведенных формул (I-1-а) до (I-2-а), где А, В, Q¹, Q², Q³, Q⁴, m и Het имеют вышеуказанные значения,

подвергают взаимодействию

(α) с галоидангидридами формулы (IV)



где

R¹ имеет вышеуказанное значение и

Hal означает галоген (в частности хлор или бром)

или

(β) с ангидридами карбоновой кислоты формулы (V)



где

R¹ имеет вышеуказанное значение,

при необходимости, в среде разбавителя и, при необходимости, в присутствии связующего кислоты;

5

(Г) что соединения приведенных выше формул (I-1-в) до (I-2-в), где A, B, Q¹, Q², Q³, Q⁴, m, R², M и Het имеют вышеуказанные значения и L означает кислород, получают за счет того, что соединения вышеприведенных формул (I-1-а) до (I-2-а), где A, B, Q¹, Q², Q³, Q⁴, m и Het имеют вышеуказанные значения,

10

15

20

подвергают взаимодействию

25

со сложными эфирами хлормуравьиной кислоты или сложными тиоэфирами хлормуравьиной кислоты формулы (VI)

30



где

35

R² и M имеют вышеуказанные значения,

40

при необходимости, в среде разбавителя и, при необходимости, в присутствии связующего кислоты;

45

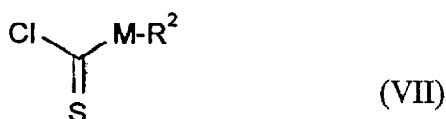
(Д) что соединения приведенных выше формул (I-1-в) до (I-2-в), где A, B, Q¹, Q², Q³, Q⁴, m, R², M и Het имеют вышеуказанные значения и L означает серу, получают за счет того, что соединения вышеприведенных формул

50

(I-1-a) до (I-2-a), где A, B, Q¹, Q², Q³, Q⁴, m и Het имеют вышеуказанные значения,

подвергают взаимодействию

со сложными эфирами хлормонотиомуравьиной кислоты или сложными эфирами хлордитиомуравьиной кислоты формулы (VII)



где

M и R² имеют вышеуказанные значения,

при необходимости, в среде разбавителя и, при необходимости, в присутствии связующего кислоты,

и

(E) что соединения приведенных выше формул (I-1-г) до (I-2-г), где A, B, Q¹, Q², Q³, Q⁴, m, R³ и Het имеют вышеуказанные значения, получают за счет того, что соединения вышеприведенных формул (I-1-a) до (I-2-a), где A, B, Q¹, Q², Q³, Q⁴, m и Het имеют вышеуказанные значения,

подвергают взаимодействию

с хлорангидридами сульфокислоты формулы (VIII)

5



где

10

R^3 имеет вышеуказанное значение,

15

при необходимости, в среде разбавителя и, при необходимости, в присутствии связующего кислоты,

20

(Ж) что соединения приведенных выше формул (I-1-д) до (I-2-д), где A, B, L, Q^1 , Q^2 , Q^3 , Q^4 , m, R^4 , R^5 и Het имеют вышеуказанные значения, получают за счет того, что соединения вышеприведенных формул (I-1-а) до (I-2-а), где A, B, Q^1 , Q^2 , Q^3 , Q^4 , m и Het имеют вышеуказанные значения,

25

30

подвергают взаимодействию

35

с фосфорными соединениями формулы (IX)

40



45

где

L, R^4 и R^5 имеют вышеуказанные значения, и

50

Hal означает галоген (в частности, хлор или бром),

при необходимости, в среде разбавителя и, при необходимости, в присутствии связующего кислоты,

(3) что соединения приведенных выше формул (I-1-е) до (I-2-е), где A, B, E, Q¹, Q², Q³, Q⁴, m и Het имеют вышеуказанные значения, получают за счет того, что соединения вышеприведенных формул (I-1-а) до (I-2-а), где A, B, Q¹, Q², Q³, Q⁴, m и Het имеют вышеуказанные значения,

подвергают взаимодействию

с соединениями металла или аминами формул (X) и (XI)



где

Me - одно- или двухвалентный металл (предпочтительно щелочный металл или щелочноземельный металл, например, литий, натрий, калий, магний или кальций),

t - число 1 или 2, и

R¹¹, R¹², R¹³ независимо друг от друга означают водород или алкил (предпочтительно алкил с 1 – 8 атомами углерода),

при необходимости, в среде разбавителя,

(И) что соединения приведенных выше формул (I-1-ж) до (I-2-ж), где A, B, L, Q¹, Q², Q³, Q⁴, m, R⁶, R⁷ и Het имеют вышеуказанные значения, получают за счет того, что соединения вышеприведенных формул (I-1-а) до (I-2-а), где A, B, Q¹, Q², Q³, Q⁴, m и Het имеют вышеуказанные значения,

подвергают взаимодействию

(α) с изоцианатами или изотиоцианатами формулы (XII)



где

R⁶ и L имеют вышеуказанные значения и

при необходимости, в среде разбавителя и, при необходимости, в присутствии катализатора, или

(β) с хлорангидридами карбамидной кислоты или хлорангидридами тиокарбамидной кислоты формулы (XIII)



где

L, R⁶ и R⁷ имеют вышеуказанные значения,

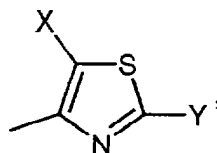
при необходимости, в среде разбавителя и, при необходимости, в присутствии связующего кислоты.

Кроме того, было найдено, что новые соединения в зависимости от заместителей обладают очень хорошей активностью как в качестве средств для борьбы с вредителями, предпочтительно в качестве инсектицидов и акарицидов, так и в качестве гербицидов и фунгицидов.

Предлагаемые соединения в общем определяются формулой формулой (I).

Предпочитаемые заместители или значения приведенных в выше- или нижеупомянутых формулах радикалов поясняются в нижеследующем:

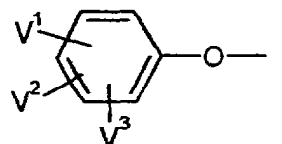
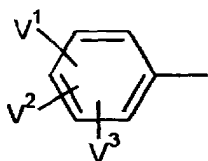
Het означает предпочтительно группу



m означает предпочтительно числа 0 или 1,

X означает предпочтительно водород, галоген, алкил с 1 – 6 атомами углерода, алкоксил с 1 - 6 атомами углерода, алкенилокси с 1 – 6 атомами углерода, нитро или циано,

Y означает предпочтительно галоген, алкил с 1 – 6 атомами углерода, галогеналкил с 1 – 6 атомами углерода, алкоксил с 1 – 6 атомами углерода, галогеналкоксил с 1 – 6 атомами углерода или группы



V¹ означает предпочтительно водород, галоген, алкил с 1 – 12 атомами углерода, алкоксил с 1 – 6 атомами углерода, алкилтио с 1 – 6 атомами углерода, алкилсульфинил с 1 – 6 атомами углерода, алкилсульфонил с 1 – 6 атомами углерода, галогеналкил с 1 – 4 атомами углерода, галогеналкоксил с 1 – 4 атомами углерода, нитро, циано, или

Фенил, фенокси, феноксиалкил с 1 – 4 атомами углерода в алкильной части, фенилалкоксил с 1 – 4 атомами углерода в алкоксильной части, фенилтиоалкил с 1 – 4 атомами углерода в алкильной части или фенилалкилтио с 1 – 4 атомами углерода в алкильной части,

V² и V³ предпочтительно означают независимо друг от друга водород, галоген, алкил с 1 – 6 атомами углерода, алкоксил с 1 – 6 атомами углерода, галогеналкил с 1 – 6 атомами углерода или галогеналкоксил с 1 – 6 атомами углерода,

V¹ и V² предпочтительно означают вместе с атомом углерода, с которым они связаны, незамещенный или замещенный алкилом с 1 – 4 атомами углерода или галогеном 5 – или 6-членный цикл, в котором, при необходимо-

сти, один до двух атомов углерода могут быть заменены кислородом, серой или азотом,

5

А означает предпочтительно водород или незамещенные или замещенные галогеном алкил с 1 – 12 атомами углерода, алкенил с 3 – 8 атомами углерода, алкоксиалкил с 1 – 6 атомами углерода в алкоксильной части и 1 – 4 атомами углерода в алкильной части, незамещенные или замещенные галогеном, алкилом с 1 – 4 атомами углерода или алкоксилем с 1 – 4 атомами углерода циклоалкил с 3 – 8 атомами углерода или циклоалкилалкил с 3 – 6 атомами углерода в циклоалкильной части и 1 – 4 атомами углерода в алкильной части, в котором, при необходимости, один или два кольцевых члена, не находящихся в непосредственном соседстве друг к другу, заменены кислородом и/или серой, или

10

15

20

25

Фенил, бензил, гетарил с 5 – 6 кольцевыми атомами (такими, как, например, фуранил, пиридил, имидазолил, триазолил, пиразолил, пиримидил, тиазолил или тиенил) или гетарилалкил с 1 – 4 атомами углерода в алкильной части с 5 – 6 кольцевыми атомами (такими, как, например, пиридилалкил с 1 – 4 атомами углерода в алкильной части, пиримидилалкил с 1 – 4 атомами углерода в алкильной части или тиазолилалкил с 1 – 4 атомами углерода в алкильной части),

30

35

40

45

В означает предпочтительно водород или алкил с 1 – 6 атомами углерода,

50

А, В и атом углерода, с которым они связаны, означают предпочтительно насыщенный циклоалкил с 3 – 10 атомами углерода или ненасыщенный цикло-

алкил с 5 – 10 атомами углерода, где, при необходимости, кольцевое звено
заменено кислородом или серой, и которые незамещены или одно- или
5 двухкратно замещены остатками из группы, включающей алкил с 1 – 6 ато-
мами углерода, циклоалкил с 3 – 8 атомами углерода, галогеналкил с 1 – 6
атомами углерода, алкоксил с 1 – 6 атомами углерода, алкилтио с 1 – 6
10 атомами углерода, галоген или фенил,

15 А и Q¹ вместе означают предпочтительно алкандиил с 3 – 6 атомами углерода,
незамещенный или одно- или двухкратно замещенный одинаковыми или
20 различными остатками из группы, включающей алкил с 1 – 4 атомами угле-
рода, алкоксил с 1 – 4 атомами углерода,

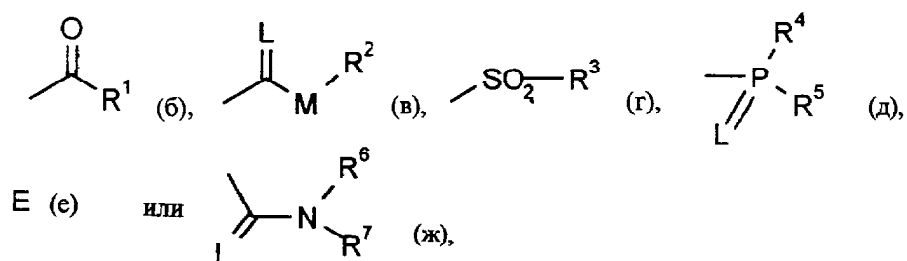
25 Q¹ означает предпочтительно водород, алкил с 1 – 6 атомами углерода, алк-
оксиалкил с 1 – 6 атомами углерода в алкоксильной части и 1 – 2 атомами
30 углерода в алкильной части, циклоалкил с 3 – 8 атомами углерода, в ко-
тором, при необходимости, метиленовая группа заменена кислородом или
серой, и который незамещен или замещен остатками из группы, включаю-
35 щей фтор, хлор, алкил с 1 – 4 атомами углерода, галогеналкил с 1 – 2 ато-
мами углерода или алкоксил с 1 – 4 атомами углерода, или фенил, пири-
40 дил, тиенил, тиазолил, фенилалкил с 1 – 4 атомами углерода в алкильной
части, пиридилалкил с 1 – 2 атомами углерода в алкильной части или тиа-
45 золилалкил с 1 – 2 атомами углерода в алкильной части, незамещенные
или замещенные остатками из группы, включающей галоген, алкил с 1 – 4
атомами углерода, алкоксил с 1 – 4 атомами углерода, галогеналкил с 1 –
50

2 атомами углерода, галогеналкоксил с 1 – 2 атомами углерода, циано или нитро,

Q^1 , Q^2 , Q^3 предпочтительно означают независимо друг от друга водород или алкил с 1 – 4 атомами углерода

Q^1 и Q^2 предпочтительно означают вместе с атомом углерода, с которым они связаны, циклоалкил, в котором, при необходимости, кольцевое звено заменена кислородом или серой, и который незамещен или замещен остатками из группы, включающей алкил с 1 – 6 атомами углерода, алкоксил с 1 – 6 атомами углерода или галогеналкил с 1 – 2 атомами углерода,

G означает предпочтительно водород (а) или одну из групп



в частности (а), (б), (в) или (ж),

где

E - ион металла или аммониевый ион,

L - кислород или серу, и

M - кислород или серу,

R¹ означает предпочтительно незамещенные или замещенные галогеном алкил с 1 – 20 атомами углерода, алкенил с 2 – 20 атомами углерода, алкоксиалкил с 1 – 8 атомами углерода в алкоксильной части и 1 – 8 атомами углерода в алкильной части, алкилтиоалкил с 1 – 8 атомами углерода в алкилтио-части и 1 – 8 атомами углерода в алкильной части, полиалкоксиалкил с 1 – 8 атомами углерода в алкоксильной части и 1 – 8 атомами углерода в алкильной части, или незамещенный или замещенный галогеном, алкилом с 1 – 6 атомами углерода или алкоксилем с 1 – 6 атомами углерода циклоалкил с 3 – 8 атомами углерода, в котором, при необходимости, одно или много (предпочтительно одно или два) кольцевых звеньев, которые не находятся в непосредственном соседстве друг к другу, заменены кислородом и/или серой,

Фенил, незамещенный или замещенный остатками из группы, включающей галоген, циано, нитро, алкил с 1 – 6 атомами углерода, алкоксил с 1 – 6 атомами углерода, галогеналкил с 1 – 6 атомами углерода, галогеналкоксил с 1 – 6 атомами углерода, алкилтио с 1 – 6 атомами углерода или алкилсульфонил с 1 – 6 атомами углерода,

Фенилалкил с 1 – 6 атомами углерода, незамещенный или замещенный остатками из группы, включающей галоген, нитро, циано, алкил с 1 – 6 ато-

мами углерода, алкоксил с 1 – 6 атомами углерода, галогеналкил с 1 – 6 атомами углерода или галогеналкоксил с 1 – 6 атомами углерода,

5

незамещенный или замещенный галогеном, алкилом с 1 – 6 атомами углерода или трифторметилом 5- или 6-членный гетарил (например, пиразол-
ил, тиазолил, пиридил, пиримидил, фуранил или тиенил),

15

незамещенный или замещенный галогеном или алкилом с 1 – 6 атомами углерода феноксипалкил с 1 – 6 атомами углерода в алкильной части, или

20

незамещенный или замещенный галогеном, амино-группой или алкилом с 1 – 6 атомами углерода 5- или 6-членный гетарилалкоксипалкил с 1 – 6 атомами углерода в алкильной части (например, пиридилалкоксипалкил с 1 – 6 атомами углерода в алкильной части, пиримидилалкоксипалкил с 1 – 6 атомами углерода в алкильной части или тиазолилалкоксипалкил с 1 – 6 атомами углерода в алкильной части),

35

R^2 означает предпочтительно незамещенные или замещенные галогеном алкил с 1 – 20 атомами углерода, алкенил с 2 – 20 атомами углерода, алкоксипалкил с 1 – 8 атомами углерода в алкоксильной части и 2 – 8 атомами углерода в алкильной части и полиалкоксипалкил с 1 – 8 атомами углерода в алкоксильной части 2 – 8 атомами углерода в алкильной части,

50

незамещенный или замещенный галогеном, алкилом с 1 – 6 атомами углерода или алкоксилем с 1 – 6 атомами углерода циклоалкил с 3 – 8 атомами углерода,

фенил или бензил, незамещенные или замещенные остатками из группы, включающей галоген, циано, нитро, алкил с 1 – 6 атомами углерода, алкоксил с 1 – 6 атомами углерода, галогеналкил с 1 – 6 атомами углерода, галогеналкоксил с 1 – 6 атомами углерода,

R^3 означает предпочтительно незамещенный или замещенный галогеном алкил с 1 – 8 атомами углерода, или фенил или бензил, незамещенные или замещенные остатками из группы, включающей галоген, алкил с 1 – 6 атомами углерода, алкоксил с 1 – 6 атомами углерода, галогеналкил с 1 – 4 атомами углерода, галогеналкоксил с 1 – 4 атомами углерода, циано или нитро,

R^4 и R^5 предпочтительно означают независимо друг от друга незамещенные или замещенные галогеном алкил с 1 – 8 атомами углерода, алкоксил с 1 – 8 атомами углерода, алкиламино с 1 – 8 атомами углерода, диалкиламино с 1 – 8 атомами углерода, алкилтио с 1 – 8 атомами углерода, алкенилтио с 2 – 8 атомами углерода, циклоалкилтио с 3 – 7 атомами углерода, или фенил, бензил, фенокси или фенилтио, незамещенные или замещенные остатками из группы, включающей галоген, нитро, циано, алкоксил с 1 – 4 атомами углерода, галогеналкоксил с 1 – 4 атомами углерода, алкилтио с 1

– 4 атомами углерода, галогеналкилтио с 1 – 4 атомами углерода, алкил с 1 – 4 атомами углерода или галогеналкил с 1 – 4 атомами углерода,

5

R^6 и R^7 предпочтительно означают независимо друг от друга водород, незамещенные или замещенные галогеном алкил с 1 – 8 атомами углерода, циклоалкил с 3 – 8 атомами углерода, алкоксил с 1 – 8 атомами углерода, алкенил с 3 – 8 атомами углерода, алкоксиалкил с 1 – 8 атомами углерода в алкоксильной части и 1 – 8 атомами углерода в алкильной части,

10

15

Фенил, незамещенный или замещенный остатками из группы, включающей галоген, галогеналкил с 1 – 8 атомами углерода, алкил с 1 – 8 атомами углерода или алкоксил с 1 – 8 атомами углерода,

20

бензил, незамещенный или замещенный остатками из группы, включающей галоген, алкил с 1 – 8 атомами углерода, галогеналкил с 1 – 8 атомами углерода или алкоксил с 1 – 8 атомами углерода, или

25

30

вместе с атомом азота, с которым они связаны - незамещенный или замещенный алкилом с 1 – 4 атомами углерода алкиленовый радикал с 3 – 6 атомами углерода, в котором, при необходимости, один атом углерода заменен кислородом или серой,

35

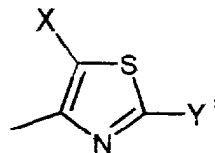
40

В списках значений, которые указаны как предпочтительные, галоген, также в качестве заместителя, например, галогеналкила, означает фтор, хлор, бром и йод, в частности фтор и хлор.

45

50

Het означает особенно предпочтительно группу



5

m означает особенно предпочтительно числа 1 или 2,

10

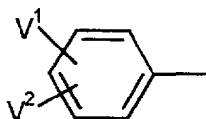
X означает особенно предпочтительно водород, хлор, бром или алкил с 1 – 4 атомами углерода,

15

Y особенно предпочтительно означает хлор, бром, алкил с 1 – 4 атомами углерода, галогеналкил с 1 – 4 атомами углерода, алкоксил с 1 – 4 атомами углерода, галогеналкоксил с 1 – 4 атомами углерода или группу

20

25



30

V¹ означает особенно предпочтительно водород, фтор, хлор, алкил с 1 – 6 атомами углерода, алкоксил с 1 – 4 атомами углерода, галогеналкил с 1 – 2 атомами углерода, галогеналкоксил с 1 – 2 атомами углерода, нитро, циано, или фенокси, незамещенный или одно- или двухкратно замещенный остатками из группы, включающей фтор, хлор, бром, алкил с 1 – 4 атомами углерода, алкоксил с 1 – 4 атомами углерода, галогеналкил с 1 – 2 атомами углерода, галогеналкоксил с 1 – 2 атомами углерода, нитро или циано,

35

40

45

50

V^2 означает особенно предпочтительно водород, фтор, хлор, бром, алкил с 1 – 4 атомами углерода, алкоксил с 1 – 4 атомами углерода, галогеналкил с 1 – 2 атомами углерода или галогеналкоксил с 1 – 2 атомами углерода,

V^1 и V^2 вместе с атомом углерода, с которым они связаны, особенно предпочтительно означают незамещенный или замещенный фтором или метилом 5- или 6-членный цикл, в котором, при необходимости, один или два атома углерода могут быть заменены кислородом,

A означает особенно предпочтительно водород, незамещенные или одно- до трехкратно замещенные фтором алкил с 1 – 8 атомами углерода или алкоксиалкил с 1 – 4 атомами углерода в алкоксильной части и 1 – 2 атомами углерода в алкильной части,

циклоалкил с 5 – 6 атомами углерода или циклоалкилалкил с 3 – 6 атомами углерода в циклоалкильной части и 1 – 2 атомами углерода в алкильной части, в котором, при необходимости, кольцевое звено заменено кислородом или серой, незамещенные или одно- до двухкратно замещенные остатками из группы, включающей фтор, хлор, метил, этил или метокси, или

фенил или бензил, незамещенные или одно- до двухкратно замещенные остатками из группы, включающей фтор, хлор, бром, алкил с 1 – 4 атомами углерода, галогеналкил с 1 – 2 атомами углерода, алкоксил с 1 – 4 атомами углерода или галогеналкоксил с 1 – 2 атомами углерода,

В означает особенно предпочтительно водород или алкил с 1 – 4 атомами углерода

5

А, В и атом водорода, с которым они связаны, особенно предпочтительно означают насыщенный циклоалкил с 5 – 6 атомами углерода, в котором, при необходимости, одно кольцевое звено заменено кислородом, и который незамещен или однократно замещен остатками из группы, включающей алкил с 1 – 4 атомами углерода, трифторметил или алкоксил с 1 – 4 атомами углерода,

10

15

20

при условии, что в этом случае Q¹ означает лишь водород или алкил с 1 – 4 атомами углерода,

25

А и Q¹ вместе означают особенно предпочтительно алкандиил с 3 – 4 атомами углерода, незамещенный или одно- или двухкратно замещенный остатками из группы, включающей метил, этил, метокси или этокси,

30

35

Q¹ особенно предпочтительно означает водород, алкил с 1 – 4 атомами углерода, алкоксиалкил с 1 – 4 атомами углерода в алкоксильной части и 1 – 2 атомами углерода в алкильной части, или

40

циклоалкил с 3 – 6 атомами углерода, в котором, при необходимости, метиленовая группа заменена кислородом, незамещенный или замещенный остатками из группы, включающей метил или метокси, или

45

50

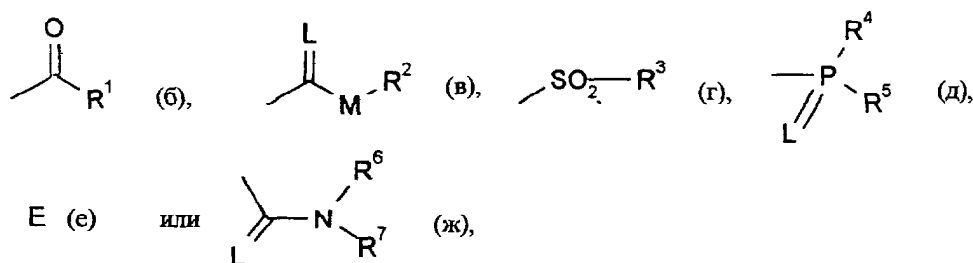
фенил или бензил, незамещенные или одно- до двухкратно замещенные
остатками из группы, включающей фтор, хлор, бром, алкил с 1 – 4 атомами
5 углерода, алкоксил с 1 – 4 атомами углерода, трифторметил или трифтор-
метокси,

10 Q^2 , Q^3 , Q^4 особенно предпочтительно означают независимо друг от друга водо-
род, метил или этил

15 Q^1 и Q^2 особенно предпочтительно означают вместе с атомом углерода, с
20 которым они связаны, незамещенный или замещенный алкилом с 1 – 4
атомами углерода или алкоксилом с 1 – 4 атомами углерода насыщенный
25 циклоалкил с 5 – 6 атомами углерода, в котором, при необходимости, одно
кольцевое звено заменено кислородом,

30 при условии, что в этом случае А означает лишь водород или алкил с 1 – 4
атомами углерода,

35 G означает особенно предпочтительно водород (а) или одну из групп



50 в частности (а), (б) или (в),

где

5 E - ион металла или аммониевый ион,

L - кислород или серу, и

10

M - кислород или серу,

15

R¹ означает особенно предпочтительно незамещенные или одно- до пяти-
кратно замещенные фтором или хлором алкил с 1 – 16 атомами углерода,
20 алкенил с 2 – 16 атомами углерода, алкоксиалкил с 1 – 4 атомами углеро-
да в алкоксильной части и 1 – 2 атомами углерода в алкильной части, алк-
илтиоалкил с 1 – 4 атомами углерода в алкилтио-части и 1 – 2 атомами уг-
25 лерода в алкильной части, или незамещенный или одно- до двухкратно за-
мещенный фтором, хлором, алкилом с 1 – 4 атомами углерода или алкокс-
илом с 1 – 5 атомами углерода циклоалкил с 3 – 6 атомами углерода, в ко-
30 тором, при необходимости, одно или два кольцевых звена, которые не на-
ходятся в непосредственном соседстве друг к другу, заменены кислородом
и/или серой,

35

40

Фенил, незамещенный или одно- до двухкратно замещенный остатками из
группы, включающей фтор, хлор, бром, циано, нитро, алкил с 1 – 4 атома-
45 ми углерода, алкоксил с 1 – 4 атомами углерода, трифторметил или три-
фторметокси,

45

50

пиридил или тиенил, незамещенные или однократно замещенные остатками из группы, включающей фтор, хлор, бром, метил, этил, или трифторметил,

R^2 означает особенно предпочтительно алкил с 1 – 16 атомами углерода, алкенил с 2 – 16 атомами углерода или алкоксиалкил с 1 – 4 атомами углерода в алкоксильной части и 2 – 4 атомами углерода в алкильной части,

циклоалкил с 3 – 6 атомами углерода, незамещенный или одно- до двукратно замещенный остатками из группы, включающей метил, этил или метокси,

фенил или бензил, незамещенные или одно- до двукратно замещенные остатками из группы, включающей фтор, хлор, бром, циано, нитро, алкил с 1 – 4 атомами углерода, алкоксил с 1 – 4 атомами углерода, трифторметил или трифторметокси,

R^3 означает особенно предпочтительно незамещенный или одно- до пятикратно замещенный фтором алкил с 1 – 4 атомами углерода, или фенил, незамещенный или одно- до двукратно замещенный остатками из группы, включающей фтор, хлор, бром, алкил с 1 – 4 атомами углерода, алкоксил с 1 – 4 атомами углерода, трифторметил, трифторметокси, циано или нитро,

R⁴ означает особенно предпочтительно алкил с 1 – 6 атомами углерода, алкоксил с 1 – 6 атомами углерода, алкиламино с 1 – 6 атомами углерода, ди-
алкиламино с 1 – 6 атомами углерода, алкилтио с 1 – 6 атомами углерода, или фенил, бензил, фенокси или фенилтио, незамещенные или одно- до
двухкратно замещенные остатками из группы, включающей фтор, хлор, бром, нитро, циано, алкоксил с 1 – 3 атомами углерода, трифторметокси, алкил с 1 – 3 атомами углерода или трифторметил,

R⁵ означает особенно предпочтительно алкил с 1 – 4 атомами углерода, алкоксил с 1 – 4 атомами углерода или алкилтио с 1 – 4 атомами углерода,

R⁶ означает особенно предпочтительно водород, алкил с 1 – 6 атомами углерода, циклоалкил с 3 – 6 атомами углерода, алкоксил с 1 – 6 атомами углерода, алкенил с 3 – 6 атомами углерода, алкоксиалкил с 1 – 6 атомами углерода в алкоксильной части и 1 – 6 атомами углерода в алкильной части, фенил, незамещенный или одно- до двухкратно замещенный остатками из группы, включающей фтор, хлор, бром, трифторметил, алкил с 1 – 4 атомами углерода или алкоксил с 1 – 4 атомами углерода,

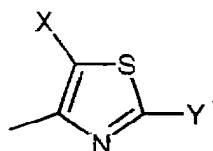
бензил, незамещенный или замещенный остатками из группы, включающей фтор, хлор, бром, метил, этил, трифторметил или метокси,

R⁷ означает особенно предпочтительно водород, алкил с 1 – 6 атомами углерода или алкенил с 3 – 6 атомами углерода,

R^6 и R^7 особенно предпочтительно означают вместе с атомом азота, с которым они связаны, незамещенный или одно- до двухкратно замещенный метилом или этилом алкиленовый радикал с 5 – 6 атомами углерода, в котором, при необходимости, метиленовая группа заменена кислородом или серой.

В списках значений, которые указаны как особенно предпочтительные, галоген, также в качестве заместителя, например, в галогеналкиле, означает фтор, хлор и бром, особенно фтор и хлор, в частности фтор.

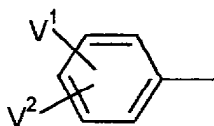
Het означает более предпочтительно



m означает более предпочтительно числа 0 или 1,

X означает более предпочтительно водород, хлор, бром, метил, этил, н.-пропил или изопропил,

Y означает более предпочтительно группу



V^1 означает более предпочтительно водород, фтор, хлор, бром, метил, этил, н.-пропил, изопропил, н.-бутил, изобутил, трет.бутил, метокси, этокси, н.-

пропокси, изопропокси, трифторметил, трифторметокси или 4-хлорфенок-
си,

5

V^2 означает более предпочтительно водород, фтор, хлор, бром, метил, мет-
окси или трифторметил,

10

A означает более предпочтительно водород, метил, этил, н.-пропил, изо-
пропил, н.-бутил, изобутил, трет.бутил, метоксиметил, этоксиметил, фенил
или циклогексил,

15

20

B означает более предпочтительно водород, метил или этил,

25

A, B и атом углерода, с которым они связаны, более предпочтительно означают
насыщенный циклоалкил с 5 – 6 атомами углерода, в котором, при
необходимости, одно кольцевое звено заменено кислородом, и который
незамещен или однократно замещен остатками из группы, включающей
метил, этил, н.-пропил, изопропил, н.-бутил, изобутил, трет.бутил, три-
фторметил, метокси, этокси, н.-пропокси, н.-бутокси или изобутокси,

30

35

40

при условии, что в этом случае Q^1 означает лишь водород,

45

A и Q^1 вместе означают более предпочтительно алкандиил с 3 – 4 атомами уг-
лерода,

50

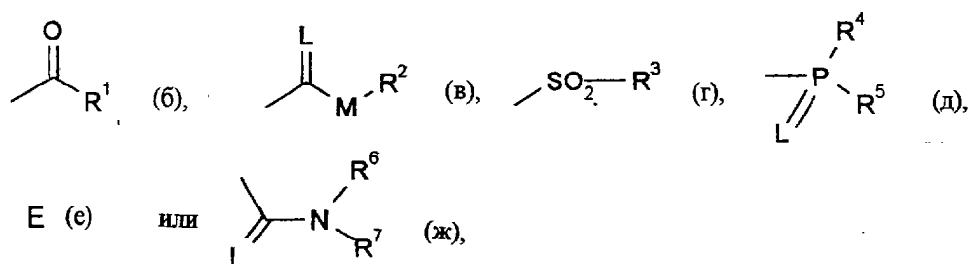
Q^1 означает более предпочтительно водород, метил, этил, н.-пропил, изо-пропил, циклопропил, циклопентил, циклогексил или 4-хлорфенил,

Q^2 , Q^3 , Q^4 означают более предпочтительно независимо друг от друга водород, метил или этил,

Q^1 и Q^2 более предпочтительно означают вместе с атомом углерода, с которым они связаны, насыщенный циклоалкил с 5 – 6 атомами углерода, в котором, при необходимости, одно кольцевое звено заменено кислородом, и который незамещен или замещен остатками из группы, включающей метил, этил, метокси, этокси, н.-пропокси или н.-бутокси,

при условии, что в этом случае А означает лишь водород,

G означает более предпочтительно водород (а) или одну из групп



в частности (а), (б) или (в),

где

E - ион металла или аммониевый ион,

L - кислород или серу, и

M - кислород или серу,

R¹ означает особенно предпочтительно незамещенные или замещенные фтором или хлором алкил с 1 – 8 атомами углерода, алкенил с 2 – 8 атомами углерода, алкоксиалкил с 1 – 2 атомами углерода в алкоксильной части и 1 – 2 атомами углерода в алкильной части, алкилтиоалкил с 1 – 2 атомами углерода в алкилтио-части и 1 – 2 атомами углерода в алкильной части, или циклопропил или циклогексил, незамещенные или однократно замещенные остатками из группы, включающей фтор, хлор, метил, этил или метокси,

Фенил, незамещенный или однократно замещенный остатками из группы, включающей фтор, хлор, бром, циано, нитро, метил, этил, изопропил, трет.бутил, метокси, трифторметил или трифторметокси,

тиенил или пиридил, незамещенные или однократно замещенные остатками из группы, включающей фтор, хлор, бром или метил,

R² означает более предпочтительно алкил с 1 – 8 атомами углерода, алкенил с 2 – 8 атомами углерода или алкоксиалкил с 1 – 4 атомами углерода в алкоксильной части и 2 атомами углерода в алкильной части,

циклоалкил с 3 – 6 атомами углерода, незамещенный или однократно замещенный остатками из группы, включающей метил, этил или метокси,

5

фенил или бензил, незамещенный или однократно замещенный остатками из группы, включающей фтор, хлор, циано, нитро, метил, этил, изопропил, трет.-бутил, метокси, трифторметил или трифторметокси,

15

R^3 означает более предпочтительно незамещенные или трехкратно замещенные фтором метил или этил, или фенил, незамещенный или однократно замещенный остатками из группы, включающей фтор, хлор, бром, метил, трет.бутил, метокси, трифторметил, трифторметокси, циано или нитро,

25

R^4 означает более предпочтительно алкил с 1 – 4 атомами углерода, алкоксил с 1 – 4 атомами углерода, алкиламино с 1 – 4 атомами углерода, диалкиламино с 1 – 4 атомами углерода, алкилтио с 1 – 4 атомами углерода, или фенил, фенокси или фенилтио, незамещенные или однократно замещенные остатками из группы, включающей фтор, хлор, бром, нитро, циано, алкоксил с 1 – 2 атомами углерода, трифторметокси или алкил с 1 – 3 атомами углерода,

40

R^5 означает более предпочтительно метил, этил, метокси, этокси, метилтио или этилтио,

45

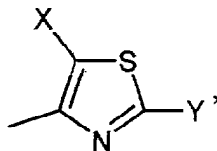
50

R^6 означает более предпочтительно водород, алкил с 1 – 4 атомами углерода, циклоалкил с 3 – 6 атомами углерода, алкоксил с 1 – 4 атомами углерода, алкенил с 3 – 4 атомами углерода или алкоксиалкил с 1 – 4 атомами углерода в алкоксильной части и 1 – 4 атомами углерода в алкильной части,

R^7 означает более предпочтительно водород, алкил с 1 – 4 атомами углерода или алкенил с 3 – 4 атомами углерода,

R^6 и R^7 более предпочтительно означают вместе с атомом азота, с которым они связаны, алкиленовый радикал с 5 атомами углерода, в котором, при необходимости, метиленовая группа заменена кислородом.

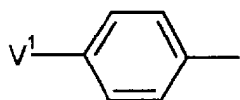
Het означает в частности



m означает в частности числа 0 или 1,

X означает в частности водород, метил или этил,

Y означает в частности группу



V¹ означает в частности водород, хлор, метил, этил, н.-пропил, изопропил, н.-бутил, изобутил, трет.бутил, трифторметил или 4-хлорфенокси,

5

A означает в частности водород, метил, этил, н.-пропил, изопропил, н.-бутил, изобутил, фенил или циклогексил,

10

B означает в частности водород, метил или этил,

15

A, B и атом углерода, с которым они связаны, в частности означают насыщенный циклоалкил с 5 – 6 атомами углерода, в котором, при необходимости, одно кольцевое звено заменено кислородом, и который незамещен или однократно замещен остатками из группы, включающей метил, этил, н.-пропил, изопропил, н.-бутил, изобутил, трет.бутил, метокси, этокси, н.-пропокси, н.-бутокси или изобутокси,

20

25

30

при условии, что в этом случае **Q¹** означает лишь водород,

35

Q¹ означает в частности водород, метил, этил, н.-пропил, изопропил или 4-хлорфенил,

40

Q² означает в частности водород метил или этил,

45

Q³ означает в частности водород,

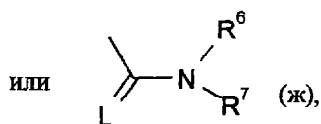
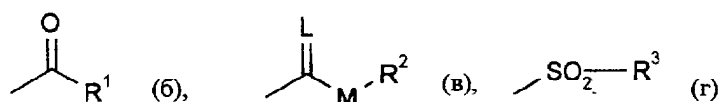
50

Q⁴ означает в частности водород,

Q¹ и Q² в частности означают вместе с атомом углерода, с которым они связаны, насыщенный циклоалкил с 5 – 6 атомами углерода,

при условии, что в этом случае А означает лишь водород,

G означает в частности водород (а) или одну из групп



где

L - кислород, и

M - кислород или серу,

R¹ означает в частности алкил с 1 – 8 атомами углерода, алкоксиалкил с 1 – 2 атомами углерода в алкоксильной части и 1 – 2 атомами углерода в алкильной части, или незамещенный или однократно замещенный хлором циклопропил,

незамещенный или однократно замещенный хлором фенил,

5

незамещенный или однократно замещенный хлором пиридил,

10

R^2 означает в частности алкил с 1 – 8 атомами углерода,

15

фенил или бензил,

20

R^3 означает в частности метил или этил,

25

R^6 и R^7 в частности означают вместе с атомом азота, с которым они связаны, алкиленовый радикал с 5 атомами углерода, в котором, при необходимости, метиленовая группа заменена кислородом.

30

35

Указанные выше как общие или как предпочтительные значения радикалов могут комбинироваться между собой любым образом, то есть, они могут также комбинироваться между указанными как предпочтительные соединениями. Они относятся как к конечным продуктам, так и соответственно к исходным продуктам и промежуточным продуктам.

40

45

Предпочтительными по изобретению являются соединения формулы (I), в которых имеется комбинация значений, указанных выше как предпочтительные.

50

Особенно предпочтительными по изобретению являются соединения формулы (I), в которых имеется комбинация значений, указанных выше как особенно предпочтительные.

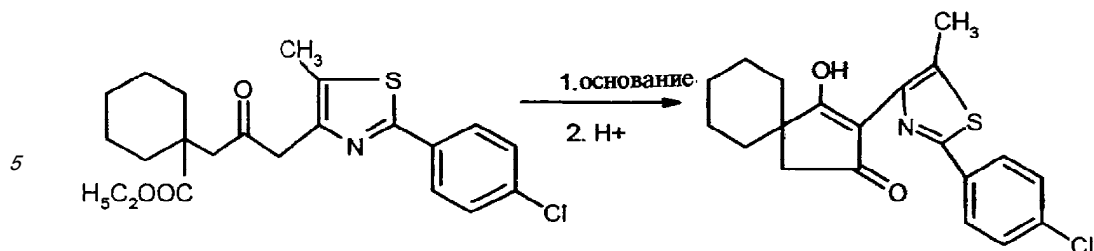
Более предпочтительными по изобретению являются соединения формулы (I), в которых имеется комбинация значений, указанных выше как более предпочтительные.

В частности предпочтительными по изобретению соединения формулы (I), в которых имеется комбинация значений, указанных как в частности предпочтительные.

Насыщенные или ненасыщенные углеводородные радикалы, такие, как, например, алкил или алкенил, могут быть, также в сочетании с гетероатомами, как, например, в алкоксиле, по возможности, линейными или разветвленными.

Незамещенные или замещенные радикалы могут быть однократно или многократно замещены, если ничего другого не указано, при этом в случае многократных замещений заместители могут быть одинаковыми или различными.

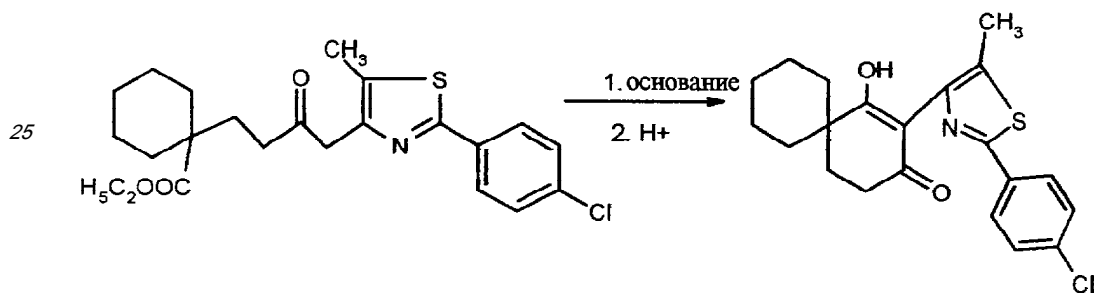
В случае, если согласно способу (A) в качестве исходного вещества применяют, например, 1-[4-(5-метил)-2-(-хлорфенил)-тиазолил]3-(этоксикарбонил-циклогексил)-пропанон, то ход реакции можно пояснять следующей реакционной схемой:



10

В случае, если согласно способу (Б) в качестве исходного вещества применяют, например, 1-[4-(5-метил)-2-(4-хлорфенил)-тиазолил]-4-(1-этоксикарбонил-цикло-
гексил)-бутан-2-он, то ход реакции можно пояснять следующей реакционной схе-
мой:

20



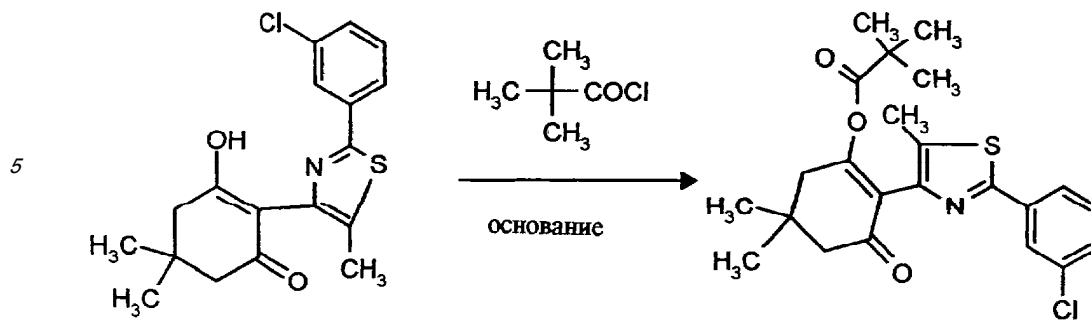
30

В случае, если согласно способу (Вa) в качестве исходных веществ применяют, например, 2-[4-(5-метил-2-(3-хлорфенил)-тиазолил]-5,5-диметил-циклогексан-1,3-
дион и хлористый пивалоид, то ход реакции можно пояснять следующей реакци-
онной схемой:

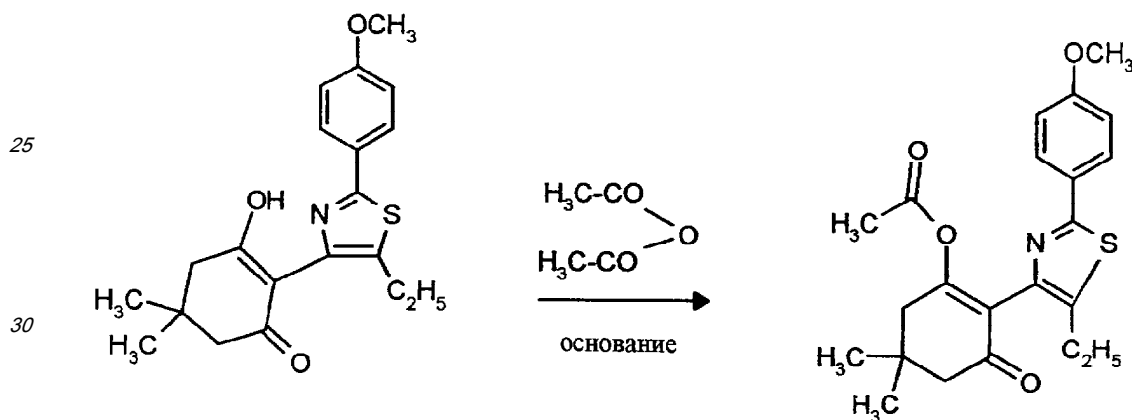
40

45

50



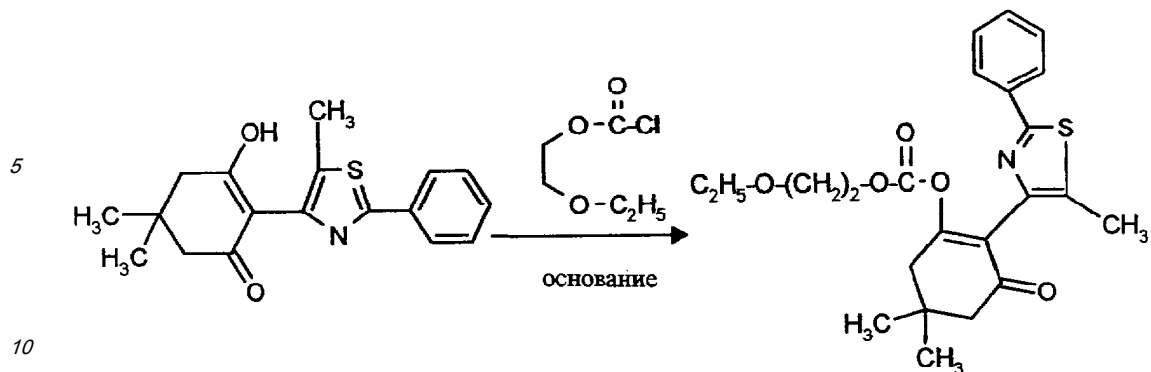
В случае, если согласно способу (Вβ) в качестве исходных соединений приме-
 15 няют, например, 2-[4-(5-этил-2-(4-метоксифенил))-тиазолил]-5,5-диметил-цикло-
 гексан-1,3-дион и ацетангидрид, то ход реакции можно пояснять следующей
 20 реакционной схемой:



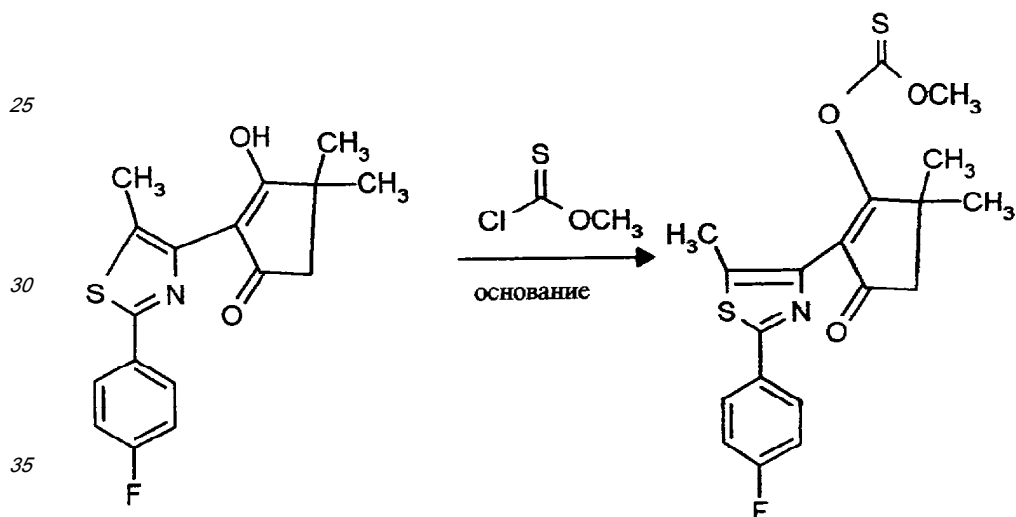
35 В случае, если согласно способу (Г) в качестве исходных соединений применяют,
 например, 2-[4-(5-метил-2-фенил)-тиазолил]-5,5-диметил-циклогексан-1,3-дион и
 40 сложный этиловый эфир хлормуравьиной кислоты, то ход реакции можно
 пояснять следующей реакционной схемой:

45

50

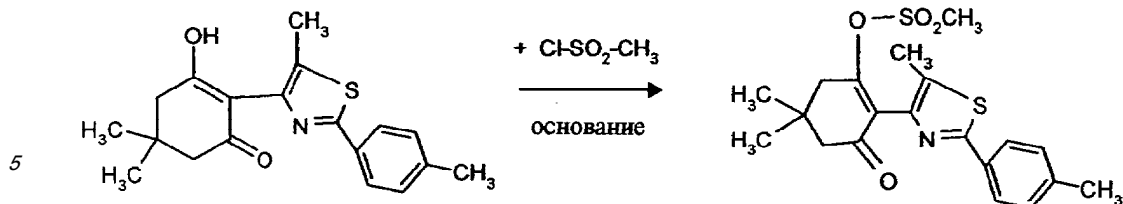


15 В случае, если согласно способу (Д) в качестве исходных продуктов применяют, например, 2-[4-(5-метил-2-(фторфенил))-тиазолил]-4,4-диметил-циклопентан-1,3-
 дион и сложный метиловый эфир хлормонотиомуравьиной кислоты, то ход реак-
 20 ции можно пояснять следующей реакционной схемой:



40 В случае, если согласно способу (Е) в качестве исходных продуктов применяют, например, 2-[4-(5-метил-3-(4-метилфенил)-тиазолил]-5,5-диметил-циклогексан-
 1,3-дион и хлорангидрид метансульфокислоты, то ход реакции можно пояснять
 45 следующей реакционной схемой:

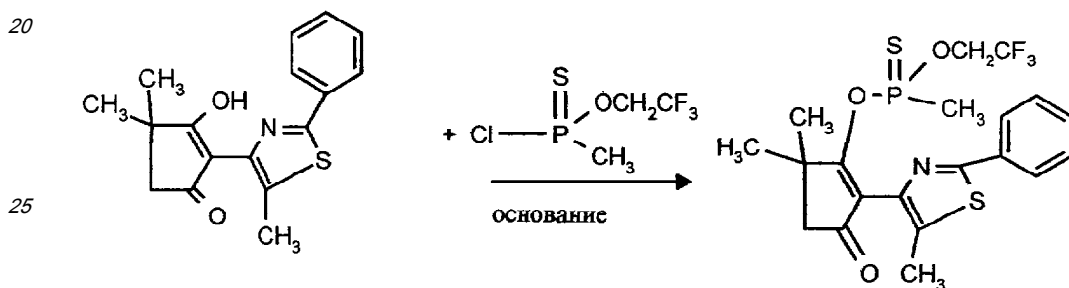
50



В случае, если согласно способу (Ж) в качестве исходных продуктов применяют, например, 2-[4-(5-метил-2-фенил-тиазолил)]-4,4-диметил-циклопентан-1,3-дион и (сложный 2,2,2-трифторэтиловый эфир) хлорангидрида метантио-фосфоновой

15

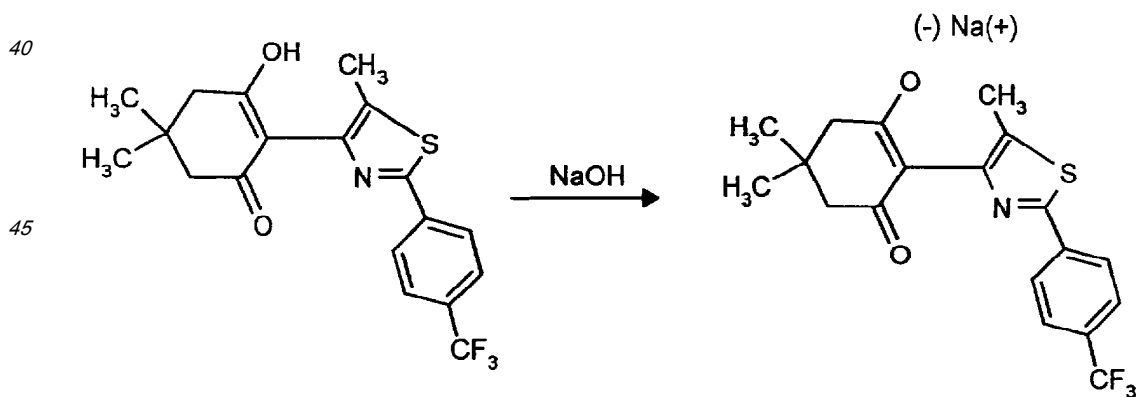
кислоты, то ход реакции можно пояснять следующей реакционной схемой:



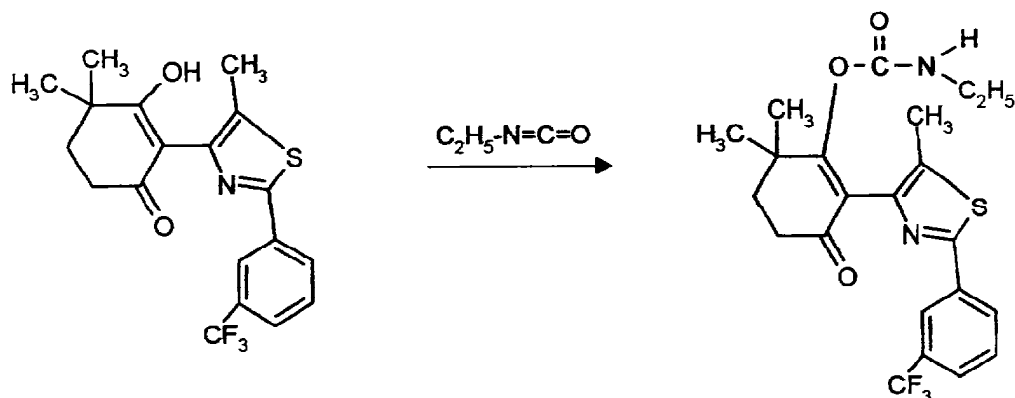
В случае, если согласно способу (3) в качестве компонентов применяют, например, 2-[4-(5-метил-2-(4-трифторметил-фенил))-тиазолил]-5,5-диметил-циклогексан-1,3-дион и гидроокись натрия, то ход реакции можно пояснять следующей реакционной схемой:

30

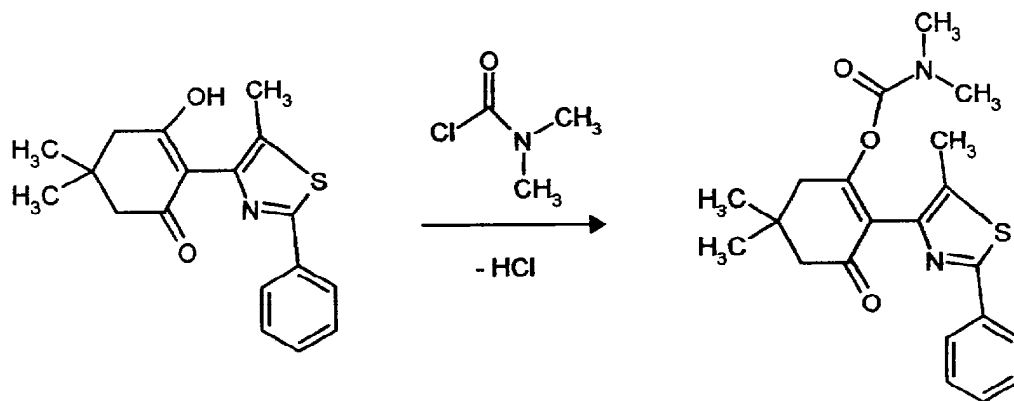
35



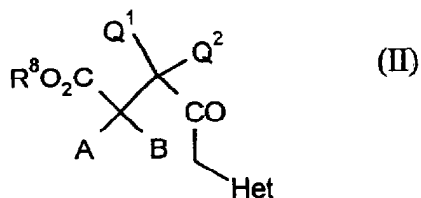
В случае, если согласно способу (И α) в качестве исходных продуктов применяют, например, 2-[4-(5-метил-2-(3-трифторметил-фенил))-тиазолил]-4,4-диметил-циклогексан-1,3-дион и этилизоцианат, то ход реакции можно пояснить следующей реакционной схемой:



В случае, если согласно способу (И β) в качестве исходных продуктов применяют, например, 2-[4-(5-метил-2-фенил)-тиазолил]-5,5-диметил-циклогексил-1,3-дион и хлорид диметилкарбамидовой кислоты, то ход реакции можно пояснить следующей реакционной схемой:



Необходимые при проведении способа (А) в качестве исходных веществ сложные эфиры кетокарбоновой кислоты формулы (II)



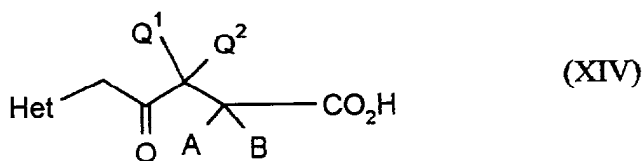
где

A, B, Het, Q¹, Q² и R⁸ имеют вышеуказанные значения,

представляют собой известные вещества.

Их можно, в принципе, получать по известным методам.

Сложные эфиры 5-гетарил-4-кетокарбоновой кислоты получают, например, за счет того, что 5-гетарил-4-кетокарбоновые кислоты формулы (XIV)

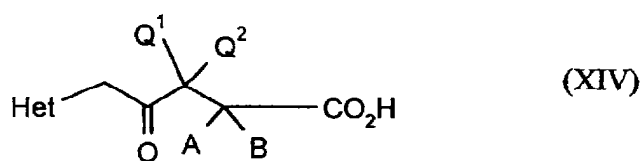


где

A, B, Het, Q¹ и Q² имеют вышеуказанные значения,

подвергают этерификации (см., например, Organikum, 15-ое издание, Берлин, 1977, стр. 499) или алкилированию (см. пример получения).

5-гетарил-4-кетокарбоновые кислоты формулы (XIV)

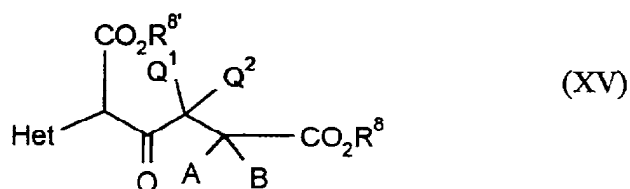


10 где

15 A, B, Het, Q¹ и Q² имеют вышеуказанные значения,

20 являются новыми, но их можно получать по принципиально известным методам (см. пример получения).

25 5-гетарил-4-кетокарбоновые кислоты формулы (XIV) получают, например, за счет того, что сложные эфиры 2-гетарил-3-оксо-адипиновой кислоты формулы (XV)



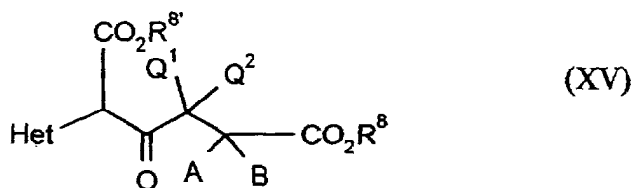
35 где

40 A, B, Het, Q¹ и Q² имеют вышеуказанные значения, и

45 R⁸ и R⁸' означают алкил (в частности, алкил с 1 – 8 атомами углерода),

подвергают декарбоксилированию, при необходимости, в среде разбавителя и, при необходимости, в присутствии основания или кислоты (см., например, Organikum, 15-ое издание, Берлин, 1977, стр. 519 - 521).

Соединения формулы (XV)



где

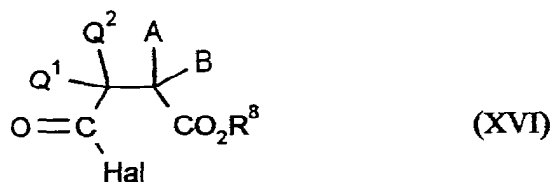
A, B, Het, Q¹, Q², R⁸ и R^{8'} имеют вышеуказанные значения,

- или в случае, если соединение формулы (XVII) было применено в качестве исходного вещества для получения -

то R⁸ означает водород,

являются новыми.

Соединения формулы (XV) получают, например, за счет того, что хлориды сложного полуэфира дикарбоновой кислоты формулы (XVI)

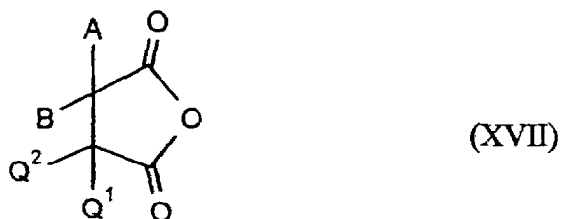


где

A, B, Q¹, Q² и R⁸ имеют вышеуказанные значения, и

Hal означает хлор или бром,

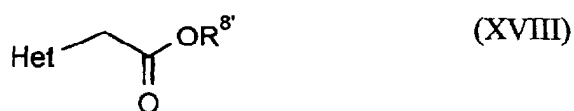
или ангидриды карбоновой кислоты формулы (XVII)



где

A, B, Q¹ и Q² имеют вышеуказанные значения,

подвергают ацилированию со сложным эфиром гетарилуксусной кислоты формулы (XVIII)



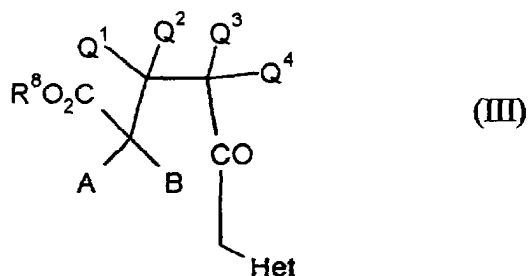
где

Het и R^8 имеют вышеуказанные значения,

при необходимости, в среде разбавителя и в присутствии основания (см., например, М.С. Чэмберс, Э. Дж. Томас, Д.Дж. Уилльямс, J. Chem. Soc. Chem. Commun., (1987), 1228, см. также примеры получения).

Соединения формул (XVI) и (XVII) представляют собой отчасти новые соединения органической химии и/или их можно получать простым образом по в принципе известным методам.

Необходимые при проведении способа (Б) в качестве исходных веществ сложные эфиры кетокарбоновой кислоты формулы (III)



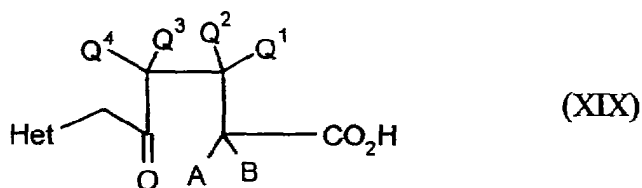
где

A, B, Het, Q^1 , Q^2 , Q^3 , Q^4 и R^8 имеют вышеуказанные значения,

являются новыми.

Их можно получать по в принципе известным методам.

Сложные эфиры 6-гетарил-5-кетокарбоновой кислоты формулы (III) получают, например, за счет того, что 6-гетарил-5-кетокарбоновую кислоту формулы (XIX)

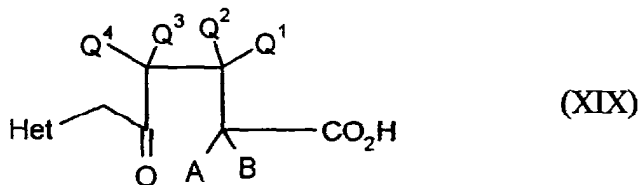


где

A, B, Het, Q¹, Q², Q³ и Q⁴ имеют вышеуказанные значения,

подвергают этерификации (см., например, Organikum, 15-ое издание, Берлин, 1977, стр. 499) или алкилированию (см. пример получения).

6-гетарил-5-кетокарбоновые кислоты формулы (XIX)

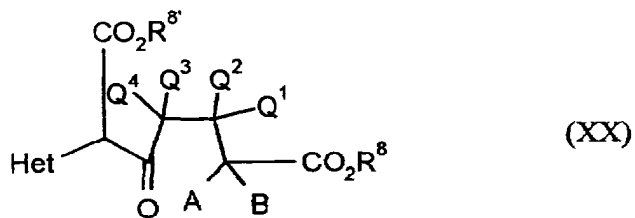


где

A, B, Het, Q¹, Q², Q³ и Q⁴ имеют вышеуказанные значения,

являются новыми. Их можно получать по в принципе известным методам, например, за счет того, что

замещенные сложные эфиры 2-гетарил-3-оксо-гептандикислоты формулы (XX)



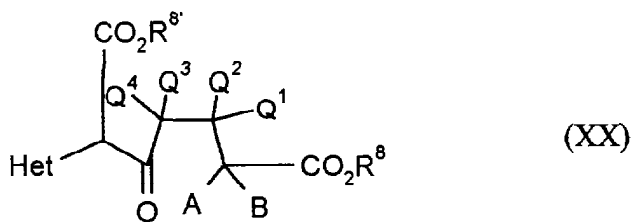
10 где

15 A, B, Het, Q¹, Q², Q³ и Q⁴ имеют вышеуказанные значения, и

20 R⁸ и R^{8'} означают алкил (в частности, алкил с 1 – 6 атомами углерода),

25 подвергают омылению и декарбоксилированию, при необходимости, в присутствии основания или кислоты (см., например, Organikum, 15-ое издание, Берлин, 1977, стр. 519 - 521).

30 Соединения формулы (XX)



45 где

50 A, B, Het, Q¹, Q², Q³ и Q⁴, R⁸ и R^{8'} имеют вышеуказанные значения,

- или в случае, если соединение формулы (XXII) было применено в качестве исходного вещества для получения,

5

то R^8 означает водород -

10

являются новыми.

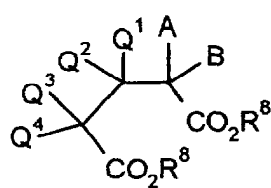
15

Соединения формулы (XX) получают, например, за счет того, что

20

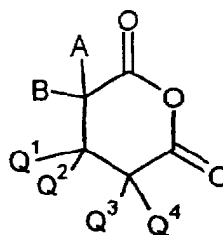
сложные эфиры дикарбоновой кислоты формулы (XXI) или ангидриды дикарбоновой кислоты формулы (XXII)

25



(XXI)

30



(XXII)

где

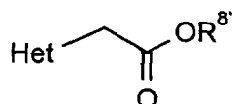
35

A, B, Q^1 , Q^2 , Q^3 и Q^4 и R^8 имеют вышеуказанные значения,

40

подвергают конденсации с замещенным сложным эфиром гетарилуксусной кислоты формулы (XVIII)

45



(XVIII)

50

где

Het и $R^{8'}$ имеют вышеуказанные значения,

при необходимости, в среде разбавителя и в присутствии основания.

5 Соединения формул (XXI) и (XXII) отчасти имеются в торговле, отчасти они известны и/или их можно получать по известным способам.

10

Соединения формулы (XVIII) отчасти новы, но их можно получать по в принципе известным способам:

15

1. Ч.С. Руней и др., *J. Med. Chem.*, **1983**, 26, 700-714.

20

2. М.С. Маламас и др., *J. Med. Chem.*, **1996**, 39, 237-245.

3. Дж.Л. Коллинс и др., *J. Med. Chem.*, **1998**, 41, 5037-5054.

25

4. Заявка № EP 0 177 353.

30

5. Заявка № EP 0 368 592.

6. Заявка № NL 6614130.

35

Необходимые, кроме того, при проведении способов (В), (Г), (Д), (Е), (Ж), (З) и (И)

40

в качестве исходных веществ галогениды кислоты формулы (IV), ангидриды

карбоновой кислоты формулы (V), сложные эфиры хлормуравьиной кислоты или

сложные тиозфиры хлормуравьиной кислоты формулы (VI), сложные эфиры

45

хлормонотиомуравьиной кислоты или сложные эфиры хлордителиомуравьиной

кислоты формулы (VII), хлориды сульфоновой кислоты формулы (VIII), фосфор-

50

ные соединения формулы (IX) и гидроокиси металла, алкоголяты металла или

амины формул (X) и (XI) и изоцианаты формулы (XII) и хлориды карбаминовой кислоты или хлориды тиокарбаминовой кислоты формулы (XIII) представляют собой общеизвестные соединения органической или неорганической химии.

Соединения формул (XVI), (XVII) и (XXI) отчасти имеются в торговле, отчасти они известны и/или их можно получать по в принципе известным методам.

Способ (A) отличается тем, что соединения формулы (II), где A, B, Q¹, Q², Het и R⁸ имеют вышеуказанные значения, подвергают интрамолекулярной конденсации в присутствии основания.

В качестве разбавителя для проведения способа (A) можно применять все инертные органические растворители. Предпочтительно используют углеводороды, такие, как, толуол и ксилол, кроме того, простые эфиры, такие, как простой дибутиловый эфир, тетрагидрофуран, диоксан, простой гликольдиметиловый эфир и простой дигликольдиметиловый эфир, кроме того, полярные растворители, такие, как диметилсульфоксид, сульфолан, диметилформамид, диметил-ацетамид или N-метилпирролидон, а также спирты, такие, как метанол, этанол, пропанол, изо-пропанол, бутанол, изо-бутанол и трет.бутанол.

В качестве основания (депротонирующего средства) для проведения способа (A) могут использоваться все обычные акцепторы протонов. Предпочтительно используют окись, гидроокись и карбонаты щелочных металлов или щелочно-земельных металлов, такие, как, например, гидроокись натрия, гидроокись калия, окись магния, окись кальция, карбонат натрия, карбонат калия и карбонат каль-

ция, которые могут использоваться также в присутствии катализаторов передачи фаз, таких, как, например, хлористый триэтилбензиламмоний, бромистый тетра-
5 бутиламмоний, Адоген 464 (= хлористый метилтриалкиламмоний с 8 – 10 атомами углерода в каждой алкильной группе или TDA 1 (= трис-(метоксиэтоксиэтил)-
10 амин). Кроме того, могут применяться щелочные металлы, такие, как натрий или калий. Кроме того, могут применяться амиды и гидриды щелочных металлов и щелочно-земельных металлов, такие, как амид натрия, гидрид натрия и гидрид
15 кальция, а также алкоголяты щелочного металла, такие, как метилат натрия, этилат натрия и трет.бутилат калия.

20
При проведении способа (А) температура реакции может варьироваться в широких пределах. Обычно работают при температурах от -80 °С до 180 °С, предпочтительно от -50 °С до 120 °С.

30
Реакцию при проведении способа (А) проводят обычно при атмосферном давлении.

35
При проведении способа (А) компоненты реакции формулы (II) и депротонирующие основания обычно применяют, приблизительно, в двойном эквимолярном
40 количестве. Является, однако, также возможным применять их в более избыточном количестве (до 3 моль).

45
Способ (Б) отличается тем, что соединения формулы (III), где А, В, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Het и R⁸ имеют вышеуказанные значения, подвергают интрамолекулярной конденсации в присутствии основания и в среде разбавителя.

В качестве разбавителя для проведения способа (Б) можно применять все инертные органические растворители. Предпочтительно используют углеводороды, такие, как, толуол и ксилол, кроме того, простые эфиры, такие, как простой дибутиловый эфир, тетрагидрофуран, диоксан, простой гликольдиметиловый эфир и простой дигликольдиметиловый эфир, кроме того, полярные растворители, такие, как диметилсульфоксид, сульфолан, диметилформамид и N-метилпирролидон, а также спирты, такие, как метанол, этанол, пропанол, изопропанол, бутанол, изо-бутанол и трет.бутанол.

В качестве основания (депротонирующего средства) для проведения способа (Б) могут использоваться все обычные акцепторы протонов. Предпочтительно используют окись, гидроокись и карбонаты щелочных металлов или щелочно-земельных металлов, такие, как, например, гидроокись натрия, гидроокись калия, окись магния, окись кальция, карбонат натрия, карбонат калия и карбонат кальция, которые могут использоваться также в присутствии катализаторов передачи фаз, таких, как, например, хлористый триэтилбензиламмоний, бромистый тетрабутиламмоний, Адоген 464 (= хлористый метилтриалкиламмоний с 8 – 10 атомами углерода в каждой алкильной группе или TDA 1 (= трис-(метоксиэтоксиэтил)-амин). Кроме того, могут применяться щелочные металлы, такие, как натрий или калий. Кроме того, могут применяться амиды и гидриды щелочных металлов и щелочно-земельных металлов, такие, как амид натрия, гидрид натрия и гидрид кальция, а также алкоголяты щелочного металла, такие, как метилат натрия, этилат натрия и трет.бутилат калия.

При проведении способа (Б) температура реакции может варьироваться в широких пределах. Обычно работают при температурах от -80 °С до 180 °С, предпочтительно от -50 °С до 120 °С.

Реакцию при проведении способа (Б) проводят обычно при атмосферном давлении.

При проведении способа (А) компоненты реакции формулы (III) и депротонирующие основания обычно применяют, приблизительно, в эквимольном количестве. Является, однако, также возможным применять их в более избыточном количестве (до 3 моль).

Способ (В-а) отличается тем, что соединения формул (I-1-а) до (I-2-а) подвергают взаимодействию с галогенидами карбоновой кислоты формулы (IV), при необходимости, в среде разбавителя и, при необходимости, в присутствии связующего кислоты.

В качестве разбавителя для проведения предлагаемого способа (В-а) можно применять все инертные по отношению к галогенидам кислоты растворители. Предпочтительно используют углеводороды, такие, как бензин, бензол, толуол, ксилол и тетралин, кроме того, галогенированные углеводороды, такие, как хлористый метилен, хлороформ, тетрахлорметан, хлорбензол и о-дихлорбензол, кроме того, кетоны, такие, как ацетон и метилизопропилкетон, простые эфиры, такие, как простой диэтиловый эфир, тетрагидрофуран и диоксан, сверх этого, сложные эфиры карбоновой кислоты, такие, как этилацетат, нитрилы, такие, как

ацетонитрил, а также высокополярные растворители, такие, как диметилформамид, диметилацетамид, диметилсульфоксид и сульфолан. При соответствующей стабильности галогенида кислоты к гидролизу реакция может проводиться также в присутствии воды.

В качестве связующего кислоты при проведении реакции по предлагаемому способу (B-α) можно назвать все обычные акцепторы кислоты. Предпочтительно используют третичные амины, такие, как триэтиламин, пиридин, диазабициклооктан, диазабициклоундецен, диазабициклононен, основание Хюнига и N,N-диметиланилин, кроме того, окислы щелочноземельных металлов, такие, как окись магния и окись кальция, кроме того, карбонаты щелочных металлов и щелочноземельных металлов, такие, как карбонат натрия, карбонат калия и карбонат кальция, а также гидроокиси щелочного металла, такие, как гидроокись натрия и гидроокись калия.

При проведении предлагаемого способа (B-α) температуры реакции могут варьироваться в широких пределах. Обычно работают при температурах от -20 °C до +150 °C, предпочтительно от 0 °C до 100 °C.

При проведении предлагаемого способа (B-α) исходные вещества формул (I-1-a) до (I-2-a) и галогенид карбоновой кислоты формулы (IV) обычно применяют, приблизительно, в эквимольных количествах. Является, однако, также возможным применять галогенид карбоновой кислоты в более избыточном количестве (до 5 моль). Переработку осуществляют по обычным методам.

Способ (B-β) отличается тем, что соединения формул (I-1-a) до (I-2-a) подвергают взаимодействию с ангидридами карбоновой кислоты формулы (V), при необходимости, в среде разбавителя и, при необходимости, в присутствии связующего кислоты.

В качестве разбавителя при проведении предлагаемого способа (B-β) могут использоваться предпочтительно те разбавители, которые предпочтительно применяют также при применении галогенидов кислоты. Также применяемый в избыточном количестве ангидрид карбоновой кислоты может одновременно служить разбавителем.

В качестве добавляемого, при необходимости, связующего кислоты при проведении способа (B-β) используют предпочтительно те связующие кислоты, которые предпочтительно используют также при применении галогенидов кислоты.

При проведении предлагаемого способа (B-β) температуры реакции могут варьироваться в широких пределах. Обычно работают при температурах от -20 °C до +150 °C, предпочтительно от 0 °C до 100 °C.

При проведении предлагаемого способа (B-β) исходные вещества формул (I-1-a) до (I-2-a) и ангидрид карбоновой кислоты формулы (V) обычно применяют, приблизительно, в эквимольных количествах. Является, однако, также возможным применять ангидрид карбоновой кислоты в более избыточном количестве (до 5 моль). Переработку осуществляют по обычным методам.

Разбавитель и имеющийся в избыточном количестве ангидрид карбоновой кислоты, а также образующуюся карбоновую кислоту удаляют путем перегонки или
5 путем промывки органическим растворителем или водой.

10 Способ (Г) отличается тем, что соединения формул (I-1-а) до (I-2-а) подвергают взаимодействию со сложными эфирами хлормуравьиной кислоты или сложными тиолевыми эфирами хлормуравьиной кислоты формулы (VI), при необходимости,
15 в среде разбавителя и, при необходимости, в присутствии связующего кислоты.

20 В качестве связующего кислоты при проведении реакции по предлагаемому способу (Г) можно назвать все обычные акцепторы кислоты. Предпочтительно используют третичные амины, такие, как триэтиламин, пиридин, диазабициклооктан,
25 диазабициклоундецен, диазабициклононен, основание Хюнига и N,N-диметиланилин, кроме того, окислы щелочноземельных металлов, такие, как окись магния и окись кальция, кроме того, карбонаты щелочных металлов и щелочно-
30 земельные металлов, такие, как карбонат натрия, карбонат калия и карбонат кальция, а также гидроокиси щелочного металла, такие, как гидроокись натрия и гидроокись калия.

40 В качестве разбавителя для проведения предлагаемого способа (Г) можно применять все инертные по отношению к сложными эфирами хлормуравьиной кислоты или сложным тиолевыми эфирам хлормуравьиной кислоты растворители. Предпочтительно используют углеводороды, такие, как бензин, бензол, толуол,
45 ол, ксилол и тетралин, кроме того, галогенированные углеводороды, такие, как
50

хлористый метилен, хлороформ, тетрахлорметан, хлорбензол и о-дихлорбензол, кроме того, кетоны, такие, как ацетон и метилизопропилкетон, простые эфиры, такие, как простой диэтиловый эфир, тетрагидрофуран и диоксан, сверх этого, сложные эфиры карбоновой кислоты, такие, как этилацетат, нитрилы, такие, как ацетонитрил, а также высокополярные растворители, такие, как диметилформамид, диметилацетамид, диметилсульфоксид и сульфолан.

При проведении предлагаемого способа (Г) температуры реакции могут варьироваться в широких пределах. В случае, если работают в среде разбавителя и в присутствии связующего кислоты, то температуры реакции составляют обычно от -20 °C до +100 °C, предпочтительно от 0 °C до 50 °C.

Предлагаемый способ (Г) обычно проводят при атмосферном давлении.

При проведении предлагаемого способа (Г) исходные вещества формул (I-1-a) до (I-2-a) и соответствующие сложный эфир хлормуравьиной кислоты или сложный тиоловый эфир хлормуравьиной кислоты формулы (VI) обычно применяют, приблизительно, в эквимольных количествах. Является, однако, также возможным применять другой компонент в более избыточном количестве (до 2 моль). Переработку осуществляют по обычным методам. Обычно поступают так, что осадившиеся соли и оставшуюся реакционную смесь сгущают путем отгонки разбавителя.

Предлагаемый способ (Д) отличается тем, что соединения формул (I-1-a) до (I-2-a) подвергают взаимодействию с соединениями формулы (VII), при необходимости

сти, в среде разбавителя и, при необходимости, в присутствии связующего кислоты.

5

При проведении способа получения (Д) на моль исходного соединения формул (I-1-а) до (I-2-а) подвергают реакции, приблизительно, 1 моль сложного эфира хлормонотиомуравьиной кислоты или сложного эфира хлордитиомуравьиной кислоты формулы (VII) при температуре от 0 °С до 120 °С, предпочтительно от 20 °С до 60 °С.

20

В качестве добавляемого, при необходимости, разбавителя можно назвать все инертные полярные органические растворители, такие, как нитрилы, сложные эфиры, амиды, сульфоны, сульфоксиды, а также галогеналканы.

30

Предпочтительно используют ацетонитрил, сложный этиловый эфир уксусной кислоты, диметилсульфоксид, тетрагидрофуран, диметилформамид или хлористый метилен.

35

В случае, если при предпочтительной форме исполнения получают энолатную соль соединений (I-1-а) до (I-2-а) путем добавки сильных депротонирующих средств, таких, как, например, гидрид натрия или трет.бутилат калия, то от дальнейшей прибавки связующего кислоты можно отказаться.

45

50

В случае применения связующих кислоты используют обычные неорганические или органические основания, например, гидроокись натрия, карбонат натрия, карбонат калия, пиридин, триэтиламин.

Реакция проводится при атмосферном давлении или при повышенном давлении, предпочтительно работают при атмосферном давлении. Переработка осуществляется по обычным методам.

Предлагаемый способ (E) отличается тем, что соединения формул (I-1-a) до (I-2-a) подвергают взаимодействию с хлоридами сульфоновой кислоты формулы (VIII), при необходимости, в среде разбавителя и, при необходимости, в присутствии связующего кислоты.

При проведении способа получения (E) на моль исходного соединения формул (I-1-a) до (I-2-a) подвергают реакции, приблизительно, 1 моль хлорида сульфоновой кислоты формулы (VIII) при температуре от -20 °C до 150 °C, предпочтительно от 20 °C до 70 °C.

В качестве добавляемого, при необходимости, разбавителя можно назвать все инертные полярные органические растворители, такие, как нитрилы, сложные эфиры, простые эфиры, амиды, сульфоны, сульфоксиды или галогенированные углеводороды, такие, как хлористый метилен.

Предпочтительно используют ацетонитрил, сложный этиловый эфир уксусной кислоты, диметилсульфоксид, тетрагидрофуран, диметилформамид, хлористый метилен.

В случае, если при предпочтительной форме исполнения получают энолатную соль соединений (I-1-а) до (I-2-а) путем добавки сильных депротонирующих средств, таких, как, например, гидрид натрия или трет.бутилат калия, то от дальнейшей прибавки связующего кислоты можно отказаться.

В случае применения связующих кислоты используют обычные неорганические или органические основания, например, гидроокись натрия, карбонат натрия, карбонат калия, пиридин, триэтиламин.

Реакция может проводиться при атмосферном давлении или при повышенном давлении, предпочтительно работают при атмосферном давлении. Переработка осуществляется по обычным методам.

Предлагаемый способ (Ж) отличается тем, что соединения формул (I-1-а) до (I-2-а) подвергают взаимодействию с фосфорными соединениями формулы (IX), при необходимости, в среде разбавителя и, при необходимости, в присутствии связующего кислоты.

При проведении способа получения (Ж) для получения соединений формул (I-1-д) до (I-2-д) на моль соединений формул (I-1-а) до (I-2-а) подвергают реакции,

приблизительно, 1 – 2 моль, предпочтительно 1 – 1,3 моль фосфорного соединения формулы (IX) при температуре от -40 °C до 150 °C , предпочтительно от -10 °C до 110 °C.

В качестве добавляемого, при необходимости, разбавителя можно назвать все инертные полярные органические растворители, такие, как простые эфиры, амиды, нитрилы, спирты, сульфиды, сульфоны, сульфоксиды и т. д..

Предпочтительно используют ацетонитрил, диметилсульфоксид, тетрагидрофур-ан, диметилформамид, хлористый метилен.

В качестве добавляемого, при необходимости, связующего кислоты можно назвать все неорганические и органические основания, такие, как гидроокислы, карбонаты или амины. В качестве примеров можно назвать гидроокись натрия, карбонат натрия, карбонат калия, пиридин, триэтиламин.

Реакция может проводиться при атмосферном давлении или повышенном давлении, предпочтительно работают при атмосферном давлении. Переработка осуществляется по обычным методам органической химии. Очистка получаемых конечных продуктов осуществляется предпочтительно путем кристаллизации, хроматографическим путем или путем удаления летучих составных частей в вакууме.

Предлагаемый способ (3) отличается тем, что соединения формул (I-1-а) до (I-2-а) подвергают взаимодействию с гидроокислами металлов или окислами металлов формулы (X) или с аминами формулы (XI), при необходимости, в среде разбавителя.

В качестве разбавителя при проведении предлагаемого способа могут использоваться предпочтительно простые эфиры, такие, как тетрагидрофуран, диоксан, простой диэтиловый эфир, или же спирты, такие, как метанол, этанол, изопропанол, а также вода.

Предлагаемый способ (3) обычно проводят при атмосферном давлении.

Температуры реакции обычно составляют от -20 °C до 100 °C , предпочтительно от 0 °C до 50 °C.

Предлагаемый способ (II) отличается тем, что соединения формул (I-1-а) до (I-2-а) подвергают взаимодействию с соединениями формулы (XII) (I-α) при необходимости, в среде разбавителя и, при необходимости, в присутствии катализатора или (I-β) с соединениями формулы (XIII), при необходимости, в среде разбавителя и, при необходимости, в присутствии связующего кислоты.

При проведении способа получения (I-α) на моль исходного соединения формул (I-1-а) до (I-2-а) подвергают реакции, приблизительно, 1 моль изоцианата формулы (XIII) при температуре от 0 °C до 100 °C , предпочтительно от 20 °C до 50 °C.

В качестве добавляемого, при необходимости, разбавителя можно назвать все инертные органические растворители, такие, как простые эфиры, амиды, нитрилы, сульфоны, сульфоксиды.

При необходимости, для ускорения реакции можно добавить катализаторы. В качестве катализаторов могут использоваться как очень выгодные катализаторы оловоорганические соединения, такие, как, например, дибутилдилауринат олова. Предпочтительно работают при атмосферном давлении.

При проведении способа получения (I-β) на моль исходного соединения формул (I-1-a) до (I-2-a) подвергают реакции, приблизительно, 1 моль хлорида карбаминной кислоты формулы (XIII) при температуре от -20 °C до 150 °C , предпочтительно от 0 °C до 70 °C.

В качестве добавляемого, при необходимости, разбавителя можно назвать все инертные полярные органические растворители, такие, как нитрилы, сложные эфиры, простые эфиры, амиды, сульфоны, сульфоксиды или галогенированные углеводороды.

Предпочтительно используют ацетонитрил, сложный этиловый эфир уксусной кислоты, диметилсульфоксид, тетрагидрофуран, диметилформамид или хлористый метилен.

В случае, если при предпочтительной форме исполнения получают энольную соль соединений (I-1-а) до (I-2-а) путем добавки сильных депротонирующих средств, таких, как, например, гидрид натрия или трет.бутилат калия, то от дальнейшей прибавки связующего кислоты можно отказаться.

Активные начала при хорошей переносимости растениями и выгодной токсичности по отношению к теплокровным животным годятся для борьбы с животными вредителями, в частности насекомыми, паукообразными и нематодами, имеющимися в областях сельского хозяйства, лесного хозяйства, защиты запасов и материала, а также в области гигиены. Предлагаемые вещества могут применяться предпочтительно как средства защиты растений. Они эффективны в борьбе с нормально чувствительными видами и резистентными видами вредителей, а также в борьбе с вредителями во всех или отдельных стадиях развития. К вышеупомянутым вредителям относятся:

Из отряда Isopoda, например, *Oniscus asellus*, *Armadillidium vulgare*, *Porcellio scaber*.

Из отряда Diplopoda, например, *Blaniulus guttulatus*.

Из отряда Chilopoda, например, *Geophilus carpophagus*, *Scutigera spec.*

Из отряда Symphyla, например, *Scutigera immaculata*.

Из отряда Thysanura, например, *Lepisma saccharina*.

5

Из отряда Collembola, например, *Onychiurus armatus*.

10

Из отряда Orthoptera, например, *Acheta domesticus*, *Grylotalpa* spp., *Locusta migratoria migratorioides*, *Melanoplus* spp., *Schistocerca gregaria*.

15

Из отряда Blattaria, например, *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Leucophaea maderae*, *Blattella germanica*,

20

Из отряда Dermaptera, например, *Forficula auricularia*.

25

Из отряда Isoptera, например, *Reticulitermes* spp.

30

Из отряда Phthiraptera, например, *Pediculus humanus corporis*, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Trichodectes* spp., *Damalinia* spp..

35

Из отряда Thysanoptera, например, *Hercinothrips femoralis*, *Thrips tabaci*, *Thrips palmi*, *Frankliniella accidentalis*.

40

Из отряда Heteroptera, например, *Eurygaster* spp., *Dysdercus intermedius*, *Piesma quadrata*, *Cimex lectularius*, *Rhodnius prolixus*, *Triatoma* spp.

45

50

Из отряда Homoptera, например, *Aleurodes brassicae*, *Bemisia tabaci*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Aphis gossypii*, *Brevicoryne brassicae*, *Cryptomyzus ribis*, *Aphis fabae*,
 5 *Aphis pomi*, *Eriosoma lanigerum*, *Hyalopterus arundinis*, *Phylloxera vastatrix*, *Pemphigus* spp., *Macrosiphum avenae*, *Myzus* spp., *Phorodon humuli*, *Rhopalosiphum padi*,
 10 *Empoasca* spp., *Euscelis bilobatus*, *Nephotettix cincticeps*, *Lecanium corni*, *Saissetia oleae*, *Laodelphax striatellus*, *Nilaparvata lugens*, *Aonidiella aurantii*, *Aspidiotus hederae*, *Pseudococcus* spp., *Psylla* spp..

Из отряда Lepidoptera, например, *Pectinophora gossypiella*, *Bupalus piniarius*, *Chematobia*
 20 *brumata*, *Lithocolletis blancardella*, *Hyponomeuta padella*, *Plutella maculipennis*, *Malacosoma neustria*, *Euproctis chrysorrhoea*, *Lymantria* spp., *Bucculatrix thurberiella*,
 25 *Phyllocnistis citrella*, *Agrotis* spp., *Euxoa* spp., *Feltia* spp., *Earias insulana*, *Heliothis* spp.,
Mamestra brassicae, *Panolis flammea*, *Spodoptera* spp., *Trichoplusia ni*, *Carpocapsa pomonella*,
 30 *Pieris* spp., *Chilo* spp., *Pyrausta nubilalis*, *Ephestia kuehniella*, *Galleria mellonella*,
Tineola bisselliella, *Tinea pellionella*, *Hofmannophila pseudospretella*, *Cacoecia podana*,
Capua reticulana, *Choristoneura fumiferana*, *Clyisia ambiguella*, *Homona magnanima*,
 35 *Tortrix viridana*, *Cnaphalocerus* spp., *Oulema oryzae*.

Из отряда Coleoptera, например, *Anobium punctatum*, *Rhizopertha dominica*, *Bruchidius*
 40 *optectus*, *Acanthoscelides obtectus*, *Hylotrupes bajulus*, *Agelastica alni*, *Leptinotarsa*
 45 *decemlineata*, *Phaedon cochleariae*, *Diabrotica* spp., *Psylliodes chrysocephala*,
Epilachna varivestis, *Atomaria* spp., *Oryzaephilus surinamensis*, *Anthonomus* spp.,
 50 *Sitophilus* spp., *Otiorrhynchus sulcatus*, *Cosmopolites sordidus*, *Ceuthorrhynchus*
assimilis, *Hypera postica*, *Dermestes* spp., *Trogoderma* spp., *Anthrenus*

spp., *Attagenus* spp., *Lyctus* spp., *Meligetis aeneus*, *Ptinus* spp., *Niptus hololeucus*,
Gibbium psylloides, *Tribolium* spp., *Tenebrio molitor*, *Agriotes* spp., *Conoderus* spp.,
 5 *Melolontha melolontha*, *Amphimallon solstitialis*, *Costelytra zealandica*, *Lissorhoptus*
oryzophilus.

10

Из отряда *Hymenoptera*, например, *Diprion* spp., *Hoplocampa* spp., *Lasius* spp.,
Monomorium pharaonis, *Vespa* spp..

15

Из отряда *Diptera*, например, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Drosophila*
 20 *melanogaster*, *Musca* spp., *Fannia* spp., *Calliphora erythrocephala*, *Lucilia* spp., *Chrysomya*
spp., *Cuterebra* spp., *Gastrophilus* spp., *Hyppobosca* spp., *Stomoxys* spp.,
 25 *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Tabanus* spp., *Tannia* spp., *Bibio hortulanus*, *Oscinella*
frit, *Phorbia* spp., *Pegomyia hyoscyami*, *Ceratitis capitata*, *Dacus oleae*, *Tipula*
paludosa, *Hylemnia* spp., *Liriomyza* spp..

30

Из отряда *Siphonaptera*, например, *Xenopsylla cheopis*, *Ceratophyllus* spp..

35

Из класса *Arachnida*, например, *Scorpio maurus*, *Latrodectus mactans*, *Acarus siro*,
 40 *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Eriophyes ribis*, *Phyllocoptruta*
oleivora, *Boophilus* spp., *Rhipicephalus* spp., *Amblyomma* spp., *Hyalomma* spp.,
 45 *Ixodes* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Sarcoptes* spp., *Tarsonemus* spp.,
Bryobia praetiosa, *Panonychus* spp., *Tetranychus* spp., *Hemitarsonemus* spp.,
Brevipulpus spp..

50

К паразитирующим на растениях нематодам относятся, например, *Pratylenchus* spp., *Radopholus similis*, *Dytilenchus dipsaci*, *Tylenchulus semipenetrans*, *Heterodera* spp., *Globodera* spp., *Meloidogyne* spp., *Aphelenchoides* spp., *Longidorus* spp., *Xiphinema* spp., *Trichodorus* spp., *Bursaphelenchus* spp..

При определенных концентрациях или применяемых количествах предлагаемые соединения могут, при необходимости, также применяться в качестве гербицидов и микробицидов, например, в качестве фунгицидов, противогрибковых средств и бактерицидов. проявляют фунгицидное действие. Их можно, кроме того, применять в качестве или. Их можно, при необходимости, также использовать в качестве промежуточных или предварительных продуктов для синтеза дальнейших активных начал.

Согласно изобретению можно обрабатывать все растения и части растений. При этом под растениями следует понимать все растения и популяции растений, такие, как желательные и нежелательные дикорастущие растения или культурные растения (включая дикорастущие культурные растения). Культурными растениями могут быть растения, подращиваемых традиционными методами культивирования или оптимизации или биотехнологическими методами или методами генной инженерии или комбинацией этих методов, включая трансгенные растения и включая храняемые в рамках законодательства по хранению сортов или нехраняемые растения. Под частями растений следует понимать все надземные и подземные части и органы растений, такие, как побег, лист, цветок, корень, при этом можно называть, например, лисья, хвоя, стебли, цветки, плодовые тела, плоды и семена, а также корни, клубни и корневища. К частям растений отно-

5 сятся также получаемый при уборке урожая материал и вегетативный и генеративный посевной материал, например, черенки, клубни, корневища, отводки и семена.

10 Обработка растений и частей растений активными началами согласно изобретению осуществляется путем нанесения активного начала непосредственно на растения или части растений или путем воздействия активного начала на их окру-
15 жающую среду, на среду их обитания или в складе, то есть, помещении их хранения, при этом обработку осуществляют по обычным методам, таким, как, например, погружение, опрыскивание, испарение, опыливание, рассеяние, намазыва-
20 ние, и, кроме того, при материале размножения, в частности, посевном материале, путем нанесения одно- или многослойного покрытия в виде оболочки.

25
Активные начала могут быть переведены в обычные препаративные формы, на-
30 пример, растворы, эмульсии, опрыскиваемые порошки, суспензии, порошки, опыливаемые средства, пасты, растворимые порошки, грануляты, концентраты в ви-
35 де суспензии и эмульсии, пропитанные активным началом натуральные и синтетические вещества, а также тонкоинкапсулированные в полимерных веществах формы.

40
Эти составы получают известным способом, например, смешиванием активного
45 начала с наполнителями, т.е. жидкими растворителями и/или твердыми носителями, при необходимости, с применением поверхностноактивных средств, т.е. эмульгаторов и/или диспергаторов и/или пенообразователей.
50

В случае использования воды в качестве наполнителя могут также использоваться, например, органические растворители в качестве вспомогательного средства,. В качестве жидкого растворителя используются в основном ароматические углеводороды, например, ксилол, толуол или алкилнафталины, хлорированные ароматические и хлорированные алифатические углеводороды, например, хлорбензол, хлористый этилен или хлористый метилен, алифатические углеводороды, например, циклогексан или парафины, например, нефтяные фракции, минеральные и растительные масла, спирты, например, бутанол или глицоль, а также их простые и сложные эфиры, кетоны, например, ацетон, метилэтилкетон, метилизобутилкетон или циклогексанон, высокополярные растворители, например, диметилформамид и диметилсульфоксид, а также вода.

В качестве твердых носителей используют:

например, соли аммониевого основания и помолы натуральных горных пород, например, каолин, глинозем, тальк, мел, кварц, аттапульгит, монтмориллонит или диатомовую землю и помолы синтетических горных пород, например, высокодисперсную кремневую кислоту, окись алюминия и силикаты. В качестве твердых носителей для гранулятов используют размельченные и фракционированные натуральные горные породы, например, кальцит, мрамор, пемзу, сепиолит, доломит, а также синтетические грануляты из неорганических и органических помолов, а также грануляты из органических материалов, например, опилок, кокосовой шелухи, кукурузных початков и стеблей табака. В качестве эмульгирующих и пенообразующих средств используют, например, неионогенные и анионные эмульгаторы, например, сложные эфиры полиоксиэтилена и жирных кислот, простые эфиры полиоксиэтилена и жирных спиртов, например, алкиларилполи-

гликолевый простой эфир, алкилсульфонаты, алкилсульфаты, арилсульфонаты и белковые гидролизаты. В качестве диспергатора используют, например, лигнинсульфитный щелок и метилцеллюлозу.

В составах также могут использоваться связующие, например, карбоксиметилцеллюлоза, натуральные и синтетические порошкообразные, зернистые или латексные полимеры, например, гуммиарабик, поливиниловый спирт, поливинилацетат, а также природные фосфолипиды, например, кефалины и лецитины, и синтетические фосфолипиды. Другими добавками могут быть минеральные и растительные масла.

Могут также использоваться красители, такие, как неорганические пигменты, например, окись железа, окись титана, ферроциановый голубой, и органические красители, например, ализариновый, азо- и металлфталоцианиновые красители, и микроэлементы в виде солей железа, марганца, бора, меди, кобальта, молибдена и цинка.

Составы содержат обычно от 0,1 до 95 вес.% активного начала, предпочтительно от 0,5 до 90 %.

Соединения согласно изобретению могут применяться как таковые или в виде составов в смеси с известными фунгицидами, бактерицидами, акарицидами, нематицидами или инсектицидами в целях расширения спектра действия и предотвращения развития устойчивости. При этом во многих случаях получают син-

эргистические эффекты, то есть, эффективность смеси активных начал превышает эффективность отдельных компонентов.

5

Добавляемыми к смеси соединениями являются, например, следующие:

10

Фунгициды:

15

альдиморф, ампропилфос, ампропилфос-калий, андоприм, анилазин, азаконазол, азоксистробин,

20

беналаксил, беноданил, беномил, бензамакрил, бензамакрил-изобутил, биалафос, бинапакрил, бифенил, битертанол, бластицидин-S, бромуконазол, бупиримат, бутиобат,

25

полисульфид кальция, капсимыцин, каптафол, каптан, карбендазим, карбоксин, карвон, хинометионат (квинометионат), хлобентиазон, хлорфеназол, хлоронеб, хлоропикрин, хлороталонил, хлозолинат, клоцилакон, куфранеб, кимоксанил, кипроконазол, кипродинил, кипрофурам,

30

35

дебакарб, дихлорофен, диклобутразол, диклофлуанид, дикломезин, диклоран, диэтофенкарб, дифеноконазол, диметиримол, диметоморф, диниконазол, диниконазол М, динокап, дифениламин, дипиритион, диталимфос, дитианон, додеморф, додин, дразоксолон,

40

45

эдифенфос, эпоксиконазол, этаконазол, этиримол, этридиазол,

фамоксадон, фенапанил, фенаримол, фенбуконазол, фенфурам, фенитропан,

50

фенпиклонил, фенпропидин, фенпропиморф, фентинацетат, фентингидроксид, фербам, феримзон, флуазинам, флуметовер, флуоромид, флуквинконазол, флу-

пиримидол, флузилазол, флусульфамид, флутоланил, флутриафол, фолпет, фозетил-алюминий, фозетил-натрий, фталид, фуберидазол, фуралаксил, фурамет-
5 пир, фуркарбонил, фурконазол, фурконазол-цис, фурмециклокс,

гуазатин,

10 гексахлорбензол, гексаконазол, гимексазол,

имазалил, имибенконазол, иминоктадин, иминоктадиналбезилат, иминоктадин-
15 триацетат, йодокарб, ипконазол, ипробенфос (IBP), ипродион, ирумацин, изо-
протиолан, изоваледион,

20 казугамицин, крезоксим-метил, композиции на основе меди, такие, как гидроокись
меди, нафтенат меди, оксихлорид меди, сульфат меди, окись меди, оксин-медь и
25 смесь-бордо,

манкоппер, манкоцеб, манеб, меферимзон, мепанипирим, мепронил, металаксил,
30 метконазол, метасульфокарб, метфуроксам, метирам, метомеклам, метсульфо-
вакс, милдиомицин, миклобутанил, миклозолин,

35 диметилдитиокарбамат никеля, нитротал-изопропил, нуаримол,

офурак, оксадиксил, оксамокарб, оксолиникацид, оксикарбоксим, оксифентиин,

40 паклобутразол, пефуразоат, пенконазол, пенцикурон, фосдифен, пимарицин, пи-
пералин, полиоксин, полиоксорим, пробеназол, прохлораз, процимидон, пропа-
45 мокарб, пропанозин-натрий, пропиконазол, пропинеб, пираклостробин, пиразо-
фос, пирифенокс, пириметанил, пироквилон, пироксуфур,

50 квинконазол, квинтоцен (PCNB),

сера и композиции на ее основе,

тебуконазол, теклофалам, текназен, тетциклазис, тетраконазол, тиабендазол,
 тициофен, тифлузамид, тиофанат-метил, тирам, тиоксимид, толклофос-метил,
 5 толилфлуанид, триадимефон, триадименол, триазбутил, триазоксид, трикламид,
 трициклазол, тридеморф, трифлуксистробин, трифлумизол, трифорин, тритикон-
 азол,

10 униконазол,

15 валидамицин А, винклозолин, виниконазол,

цариламид, цинеб, цирам, а также

20 Даггер G,

ОК-8705,

25 ОК-8801,

30 α -(1,1-диметилэтил)- β -(феноксиэтил)-1H-1,2,4-триазол-1-этанол,

α -(2,4-дихлорфенил)- β -фтор-*n*-пропил-1H-1,2,4-триазол-1-этанол,

35 α -(2,4-дихлорфенил)- β -метокси-*a*-метил-1H-1,2,4-триазол-1-этанол,

α -(5-метил-1,3-диоксан-5-ил)- β -[[4-(трифторметил)-фенил]-метилен]-1H-1,2,4-

40 триазол-1-этанол,

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

45 (E)-*a*-(метоксиимино)-N-метил-2-фенокси-фенилацетамид,

50 сложный 1-изопропиловый эфир {2-метил-1-[[[1-(4-метилфенил)-этил]-амино]-
 карбонил]-пропил}-карбаминовой кислоты

1-(2,4-дихлорфенил)-2-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)этанон-O-(фенилметил)-оксим,

1-(2-метил-1-нафталенил)-1H-пиррол-2,5-дион,

1,(3,5-(дихлорфенил)-3-(2-пропенил)-2,5-пирролидиндион,

1-[(дийодметил)-сульфонил]-4-метил-бензол,

1-[[2-(2,4-дихлорфенил)-1,3-диоксолан-2-ил]-метил]-1H-имидазол,

1-[[2-(4-хлорфенил)-3-фенилоксиранил]-метил]-1H-1,2,4-триазол,

1-[1-[2-[(2,4-дихлорфенил)-метокси]-фенил]-этинил]-1H-имидазол,

1-метил-5-нонил-2-(фенилметил)-3-пирролидинол,

2',6'-дибром-2-метил-4'-трифторметокси-4'-трифтор-метил-1,3-тиазол-5-карбокс-
анилид,

2,2-дихлор-N-[1-(4-хлорфенил)этил]-1-этил-3-метил-циклопропананкарбоксамид,

2,6-дихлор-5-(метилтио)-4-пиримидинил-тиоцианат,

2,6-дихлор-N-(4-трифторметилбензил)-бензамид,

2,6-дихлор-N-[[4-(трифторметил)-фенил]-метил]-бензамид,

2-(2,3,3-трийод-2-пропенил)-2H-тетразол,

2-[(1-метилэтил)сульфонил]-5-(трихлорметил)-1,3,4-тиадиазол,

2-[[6-деокси-4-O-(4-O-метил-β-D-глюкопиранозил)-α-D-глюкопиранозил]-амино]-4-
метокси-1H-пирроло[2,3-d]пиримидин-5-карбонитрил,

2-аминобутан,

2-бром-2-(бромметил)-пентандинитрил,

2-хлор-N-(2,3-дигидро-1,1,3-триметил-1H-инден-4-ил)-3-пиридинкарбоксамид,

2-хлор-N-(2,6-диметилфенил)-N-(изотиоцианатометил)-ацетамид,

2-фенилфенол (OPP),

3,4-дихлор-1-[4-(дифторметокси)-фенил]-1H-пиррол-2,5-дион,

3,5-дихлор-N-[циан[(1-метил-2-пропинил)-окси]-метил]-бензамид,

3-(1,1-диметилпропил-1-оксо-1H-инден-2-карбонитрил,

3-[2-(4-хлорфенил)-5-этокси-3-изоксазолидинил]-пиридин,

4-хлор-2-циан-N,N-диметил-5-(4-метилфенил)-1H-имидазол-1-сульфонамид,

4-метил-тетразоло[1,5-a]квиназолин-5(4H)-он,

8-(1,1-диметилэтил)-N-этил-N-пропил-1,4-диоксаспиро[4.5]декан-2-метанамин,

8-гидроксихинолинсульфат,

2-[(фениламино)-карбонил]-гидразид 9H-ксантен-9-карбоновой кислоты,

бис-(1-метилэтил-3-метил-4-[(3-метилбензоил)-окси]-2,5-тиофендикарбоксилат,

цис-1-(4-хлорфенил)-2-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)-циклогептанол,

цис-4-[3-[4-(1,1-диметилпропил)-фенил-2-метилпропил]-2,6-диметил-морфолин-
гидрохлорид,

этил-[(4-хлорфенил)-азо]-цианоацетат,

гидрокарбонат калия,

метантетратиол-натриевая соль,

метил-1-(2,3-дигидро-2,2-диметил-1H-инден-1-ил)-1H-имидазол-5-карбоксилат,

метил-N-(2,6-диметилфенил)-N-(5-изоксазолилкарбонил)-DL-аланинат,

метил-N-(хлорацетил)-N-(2,6-диметилфенил)-DL-аланинат,

N-(2,3-дихлор-4-гидроксифенил)-1-метил-циклогексанкарбоксамида.

N-(2,6-диметилфенил)-2-метокси-N-(тетрагидро-2-оксо-3-фуранил)-ацетамид,

N-(2,6-диметилфенил)-2-метокси-N-(тетрагидро-2-оксо-3-тиенил)-ацетамид,

N-(2-хлор-4-нитрофенил)-4-метил-3-нитро-бензолсульфонамид,

N-(4-циклогексилфенил)-1,4,5,6-тетрагидро-2-пиримидинамин,

N-(4-гексилфенил)-1,4,5,6-тетрагидро-2-пиримидинамин,

N-(5-хлор-2-метилфенил)-2-метокси-N-(2-оксо-3-оксазолидинил)-ацетамид,

N-(6-метокси)-3-пиридинил)-циклопропанкарбоксамида,

N-[2,2,2-трихлор-1-[(хлорацетил)-амино]-этил]-бензамид,

N-[3-хлор-4,5-бис(2-пропилилокси)-фенил]-N'-метокси-метанимидамид,

N-формил-N-гидрокси-DL-аланин-натриевая соль,

O,O-диэтил-[2-(дипропиламино)-2-оксоэтил]-этилфосфорамидотиоат,

O-метил-S-фенил-фенилпропилфосфорамидотиоат,

S-метил-1,2,3-бензотиадиазол-7-карботиоат,

спиро[2H]-1-бензопиран-2,1'(3'H)-изобензофуран]-3'-он.

4-[(3,4-диметоксифенил)-3-(4-фторфенил)-акрилоил]-морфолин

5

Бактерициды:

10

бронопол, дихлорофен, нитрапирин, диметилдитиокарбамат никеля, касугамицин, октилинон, фуранкарбоновая кислота, окситетрациклин, пробеназол, стрептомицин, теклофталам, сульфат меди и другие составы на основе меди.

15

20

Инсектициды / акарициды / нематициды:

25

абамектин, ацефат, ацетамиприд, акринатрин, аланикарб, алдикарб, алдоксикарб, альфа-циперметрин, альфаметрин, амитраз, авермектин, AZ 60541, азадирахтин, азаметифос, азинфос А, азинфос М, азоциклотин,

30

Bacillus popilliae, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus subtilis*, *Bacillus thuringiensis*, Бакуловирен, *Beauveria bassiana*, *Beauveria tenella*, бендиокарб, бенфуракарб, бенсультап, бензоксимат, бетацифлутрин, бифеназат, бифентрин, биоэтанометрин, биоперметрин, бистрифлурон, ВРМС, бромофос А, буфенкарб, бупрофезин, бутаиофос, бутокарбоксим, бутилпиридабен,

40

кадусафос, карбарил, карбофуран, карбофенотион, карбосульфат, картап, хлоэтокарб, хлоретоксифос, хлорфенапир, хлорфенвинфос, хлорфлуазурон, хлормефос, хлорпирифос, хлорпирифос М, хловапортрин, хромафенозид, цис-ресметрин, цисперметрин, клоцитрин, клоэтокарб, клофентезин, клотианидин, цианофос, циклопрен, циклопротрин, цифлутрин, цигалотрин, цигексатин, циперметрин, циромазин,

50

дельтаметрин, диметон М, диметон S, диметон-S-метил, диафентиурон, диази-
нон, дихлорфос, дикофол, дифлубензурон, диметоат, диметилвинфос, диофено-
5 лан, дисульфотон, докузат-натрий, дофенапин,

эфлузиланат, эмабектин, эмпентрин, эндосульфат, энтомофтор, эсфенвале-
10 рат, этиофенкарб, этион, этопрофос, этофенпрокс, этоксазол, этримфос,

фенамифос, феназаквин, фенбутатин-оксид, фенитротион, фенотиокарб, фен-
15 оксакрим, феноксикарб, фенпропатрин, фенпирад, фенпиритрин, фенпирокси-
мат, фенвалерат, фипронил, флазунама, флазулон, флуброцитринат, флу-
циклоксурон, флуцитринат, флуфеноксурон, флуметрин, флутензин, флува-
20 линат, фодофос, фосметилан, фосфиазат, фубфенпрокс, фуриатиокарб,

вирусы амилосы

25 галофенозид, HCN, гептенофос, гексафлумурон, гекситиазокс, гидропрен,

30 имидаклоприд, изадофос, изофенфос, изоксатион, ивермектин,

вирусы полиэдроза

35 лямбда-цигалотрин, луфенурон,

малатион, мекарбам, метальдегид, метамидофос, *Metharhizium anisopliae*, *Me-*
40 *tarhizium flavoviride*, метидатион, метиокарб, метопрен, метомил, метоксифен-
озид, метолкарб, метоксадиазон, мевинфос, мильбемектин, мильбемицин, моно-
45 кротофос,

налед, нитенпирам, нитиазин, новалурон,

50 ометоат, оксамил, оксидеметон М,

Paecilomyces fumosoroseus, паратион А, паратион М, перметрин, фентоат, форат,
 фозалон, фосмет, фосфамидон, фоксим, пиримикарб, пиримифос А, пиримифос
 5 М, профенофос, промекарб, пропаргит пропоксур, протиофос, протоат,
 пиметрозин, пираклофос, пиресметрин, пиретрум, пиридабен, пиридатион, пири-
 10 мидифен, пирипроксифен,

квиналфос,

15 рибавирин,

салитион, себуфос, силафлуофен, спиносад, спиродиклофен, сульфотеп, суль-
 20 профос,

тау-флувалинат, тебуфенозид, тебуфенпирад, тебупиримифос, тефлубензурон,
 25 тефлутрин, темефос, темивинфос, тербуфос, тетрахлорвинфос, тетрадифон,
 тетра-циперметрин, тиаклоприд, тиаметоксам, тиапронил, тиатрифос, тиоциклам,
 гидроген оксалат, тиодикарб, тиофанокс, турингиензин, тралоцитрин, тра-
 30 лометрин, триаратен, триазамат, триазофос, триазурон, трихлофенидин, три-
 хлорфон, трифлумурон, триметакарб,

35 вамидотион, ванилипрол, Verticillium lecanii,

YI 5302,

40 зета-циперметрин, золапрофос,

45 (1R-цис)-[5-(фенилметил)-3-фуранил]-метил-3-[(дигидро-2-оксо-3(2H)-фуранили-
 ден)-метил]-2,2-диметилциклопропанкарбоксилат,

50 (3-феноксифенил)-метил-2,2,3,3-тетраметилциклопропанкарбоксилат,

1-[(2-хлор-5-тиазолил)метил]тетрагидро-3,5-диметил-N-нитро-1,3,5-триазин-2(1H)

-имин,

5

2-(2-хлор-6-фторфенил)-4-[4-(1,1-диметилэтил)фенил]-4,5-дигидро-оксазол,

2-(ацетилокси)-3-додецил-1,4-нафталиндион,

10

2-хлор-N-[[[4-(1-фенилэтоксифенил)-амино]-карбонил]-бензамид,

15

2-хлор-N-[[[4-(2,2-дихлор-1,1-дифторэтоксифенил)-амино]-карбонил]-бензамид,

3-метилфенил-пропилкарбамат,

20

4-[4-(4-этоксифенил)-4-метилфенил]-1-фтор-2-феноксибензол,

4-хлор-2-(1,1-диметилэтил)-5-[[2-(2,6-диметил-4-феноксифенокси)этил]тио]-3(2H)

25

-пиридазинон,

4-хлор-2-(2-хлор-2-метилпропил)-5-[(6-йод-3-пиридинил)метокси]-3(2H)-пирида-

30

зинон,

4-хлор-5-[(6-хлор-3-пиридинил)метокси]-2-(3,4-дихлорфенил)-3(2H)-пиридазинон,

35

Bacillus thuringiensis strain EG-2348,

[2-бензоил-1-(1,1-диметилэтил)-гидразид бензойной кислоты,

40

сложный эфир 2,2-диметил-3-(2,4-дихлорфенил)-2-оксо-1-оксаспиро[4,5]дец-3-ен-

4-ил бутановой кислоты,

45

[3-[(6-хлор-3-пиридинил)метил]-2-тиазолидинилиден]-цианамид,

50

дигидро-2-(нитрометил)-2H-1,3-тиазин-3(4H)-карбоксальдегид,

этил-[2-[[1,6-дигидро-6-оксо-1-(фенилметил)-4-пиридазинил]окси]этил]-карбамат,

N-(3,3,4-трифтор-1-оксо-3-бутенил)-глицин,

5 N-(4-хлорфенил)-3-[4-(дифторметокси)фенил]-4,5-дигидро-4-фенил-1Н-пиразол-
1-карбоксамид,

10 N-[(2-хлор-5-тиазолил)метил]-N'-метил-N''-нитро-гуанидин,

N-метил-N'-(1-метил-2-пропенил)-1,2-гидразиндикарботиоамид,

15 N-метил-N'-2-пропенил-1,2-гидразиндикарботиоамид,

O,O-диэтил-[2-(дипропиламино)-2-оксоэтил]-этилфосфорамидотиоат,

20 N-цианометил-4-трифторметил-никотинамид,

25 3,5-дихлор-1-(3,3-дихлор-2-пропенилокси)-4-[3-(5-трифторметилпиридин-2-илок-
си)-пропокси]-бензол.

30 Возможно также смешивание с другими известными активными началами, таки-
ми, как гербициды, или с удобрениями и регуляторами роста.

35 При применении в качестве инсектицидов активное начало согласно изобре-
тению может иметься, кроме того, в принятых в торговле составах, а также в при-
40 готовляемых из этих составов препаратах в смеси с синэргистическими соеди-
нениями. Синэргистические соединения представляют собой соединения, при
45 помощи которых эффективность активных начал повышается также в случае,
если добавляемое синэргистическое соединение не проявляет активности.

Содержание активного начала в приготовляемых из принятых в торговле составов препаратах может варьироваться в широких пределах. Концентрация
5 активного начала в препаратах составляет от 0,0000001 до 95 вес.%, предпочтительно от 0,0001 до 1 вес.%.

10 Применение осуществляется по обычному и зависящему от препарата методу.

15 При применении в области гигиены или в области защиты запасов активное начало по изобретению отличается отличным продолжительным остаточным дей-
20 ствием на деревянных поверхностях или на глине, кроме того, оно отличается хорошей щелочестойкостью на имеющих известковую окраску поверхностях.

25 Как упомянуто выше, согласно изобретению можно обрабатывать все растения и их части. Согласно предпочтительной форме исполнения обрабатываются дикора-
30 стующие растения или виды и сорта растений и их части, получаемые традиционными биологическими методами культивирования, такими как, например, скрещивание или слияние протопластов. Согласно дальнейшей предпочтительной
35 форме исполнения обрабатывают трансгенные растения и сорта растений и их части, получаемые методами генной инженерии, при необходимости, в комбинации с традиционными методами (модифицированные методами генной инженерии организмы). Термин 'части' или 'части растений' более подробно пояснен
40 выше.

50 Особенно предпочтительно обрабатывают согласно изобретению растения имеющихся в торговле сортов растений. Под сортами растений понимают расте-

ния с новыми свойствами, получаемыми или традиционными методами культивирования, путем мутагенеза или путем рекомбинантных способов с использованием дирибонуклеиновой кислоты. Они могут представлять собой сорта, био- и генотипы.

В зависимости от видов или сортов растений, их местонахождения и условий роста (почвы, климата, вегетационного периода, питания) в результате обработки согласно изобретению могут встречаться также сверхаддитивные («синэргистические») эффекты. Так, например, возможны превышающие собственно ожидаемое действие эффекты, такие, как пониженное применяемое количество и/или расширение спектра действия и/или усиление действия применяемых по изобретению веществ и средств, улучшенный рост культурных растений, повышенная выносливость культурных растений по отношению к высоким или низким температурами, повышенная выносливость культурных растений по отношению к сухости или к содержанию соли в воде или почве, повышенная способность цветения, облегчение уборки урожая, ускорение спелости, повышенная урожайность, повышенное качество и/или повышенная питательная ценность продуктов урожая, повышенные способность полегания и/или обрабатываемость продуктов урожая.

К обрабатываемым согласно изобретению трансгенным (полученным генной инженерией) растениям или сортам растений относятся все растения, получившие в результате модификации генной инженерией генетический материал, придающий этим растениям особые ценные свойства. Примерами таких свойств являются улучшенный рост растений, повышенная выносливость по отношению к

высокими или низкими температурами, повышенная выносливость по отношению к сухости или к содержанию соли в воде или почве, повышенная способность цветения, облегчение уборки урожая, ускорение спелости, повышенная урожайность, повышенное качество и/или повышенная питательная ценность продуктов урожая, повышенная способность полегания и/или обрабатываемость продуктов урожая. Дальнейшими и в частности подчеркиваемыми примерами таких свойств являются повышенная защита растений от животных и микробных вредителей, например, от насекомых, клещ, фитопатогенных грибов, бактерий и/или вирусов, а также повышенная выносливость растений по отношению к определенным гербицидным активным началам. В качестве примеров трансгенных растений служат важные культурные растения, такие как, например, хлебные злаки (пшеница, рис), кукуруза, соя, картофель, хлопчатник, рапс, а также плодовые растения (яблоко, груша, цитрусовые и виноград) при этом особенно называют кукурузу, сою, картофель, хлопчатник и рапс. Особенно предпочитаемым свойством является защита растений от насекомых благодаря образующихся в растениях токсинов, в частности таких, которые создаются в растениях генетическим материалом из *Bacillus thuringiensis* (например, генами CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb и CryIF, а также их комбинациями) (называются в нижеследующем „Bt-растения“). Особенно предпочитаемым свойством является, кроме того, повышенная защита растений от грибов, бактерий и вирусов, вызванная системной акquirованной устойчивостью, сисемином, фитоалексином, элициторами, а также резистентными генами и соответственно экспримируемыми протеинами и токсинами. В качестве свойств особенно предпочитают, кроме того, повышенную выносливость растений по отношению к определенным гербицидным активным началам, таким, как имидазолинон, сульфонилмочевина, глифозат или фосфинотрицин (на-

пример, ген «РАТ»). Гены, которые придают желательные свойства, могут иметься в трансгенных растениях также в комбинации друг с другом. Примерами «Вt растений» являются сорта кукурузы, хлопчатника, сои и картофеля, которые продаются под торговыми названиями YIELD GARD® (например, кукуруза, хлопчатник, соя), KnockOut® (например, кукуруза), StarLink® (например, кукуруза), Bollgard® (хлопчатник), (Nucoton® (хлопчатник) и NewLeaf® (картофель). В качестве примеров выносливых по отношению к гербициду растений можно назвать сорта кукурузы, хлопчатника и сои, которые продаются под торговым названием Roundup Ready® (выносливость по отношению к глифозатам, (например, кукуруза, хлопчатник, соя), Liberty Link® (выносливость по отношению к фосфинотрицину, (например, рапс), IMI® (выносливость по отношению к имидазолинонам) и STS® (выносливость по отношению к сульфонилмочевинам (например, кукуруза). В качестве выносливых по отношению к гербициду (выращиваемых традиционными методами в целях достижения выносливости к гербицидам) растений можно назвать сорта, которые продаются под торговым названием Clearfield® (например, кукуруза). Разумеется, что вышеупомянутое касается также развиваемых или продаваемых на рынке в будущем сортов растений с указанными выше или развиваемыми в будущем генетическими свойствами («Traits»).

Вышеназванные растения можно согласно изобретению особенно выгодно обрабатывать соединениями общей формулы I или смесями активных начал по изобретению. Вышеуказанные в связи с активными началами или смесями предпочтительные значения относятся также к обработке этих растений. Особенно предпочтительной является обработка растений соединениями или смесями, специально указанными в данном тексте.

Используемые согласно изобретению вещества проявляют активность не только в борьбе с вредителями растений, вредителями в области гигиены и амбарными вредителями, но также в ветеринарной области в борьбе с животными паразитами (эктопаразитами), такими, как пастбищные клещи, аргасиды, чесоточные клещи, краснотелки, мухи (жалящие и лижущие), паразитирующие личинки мух, вши, власоеды, пухоеды и блохи. К этим паразитам относятся:

Из отряда Anoplurida, например, Haematopinus spp., Linognathus spp., Pediculus spp., Phtirus spp., Solenopotes spp..

Из отряда Mallophagida и подотрядов Amblycerina и Ischnocerina, например, Trimenopon spp., Menopon spp., Trinoton spp., Bovicola spp., Werneckiella spp., Lepikentron spp., Damalina spp., Trichodectes spp., Felicola spp..

Из отряда Diptera и подотрядов Nematocerina и Brachycerina, например, Aedes spp., Anopheles spp., Culex spp., Simulium spp., Eusimulium spp., Phlebotomus spp., Lutzomyia spp., Culicoides spp., Chrysops spp., Hybomitra spp., Atylotus spp., Tabanus spp., Haematopota spp., Philipomyia spp., Braula spp., Musca spp., Hydrotaea spp., Stomoxys spp., Haematobia spp., Morellia spp., Fannia spp., Glossina spp., Calliphora spp., Lucilia spp., Chrysomyia spp., Wohlfahrtia spp., Sarcophaga spp., Oestrus spp., Hypoderma spp., Gasterophilus spp., Hippobosca spp., Lipoptena spp., Melophagus spp..

Из отряда Siphonapterida, например, *Pulex* spp., *Ctenocephalides* spp., *Xenopsylla* spp., *Ceratophyllus* spp..

5

Из отряда Heteropterida, например, *Cimex* spp., *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus* spp..

10

Из отряда Blattarida, например, *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blattella germanica*, *Supella* spp..

15

Из подкласса Acaria (Acarida) и отрядов Meta- и Mesostigmata, например, *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Otobius* spp., *Ixodes* spp., *Amblyomma* spp., *Boophilus* spp., *Dermacentor* spp., *Haemophysalis* spp., *Hyalomma* spp., *Rhipicephalus* spp., *Dermanyssus* spp., *Raillietia* spp., *Pneumonyssus* spp., *Sternostoma* spp., *Varroa* spp..

20

25

Из отряда Actinedida (Prostigmata) и Acaridida (Astigmata), например, *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Ornithocheyletia* spp., *Myobia* spp., *Psorergatis* spp., *Demodex* spp., *Trombicula* spp., *Listrophorus* spp., *Acarus* spp., *Tyrophagus* spp., *Caloglyphus* spp., *Hypodectes* spp., *Pterolichus* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Otodectes* spp., *Sarcoptes* spp., *Notoedres* spp., *Knemidocoptes* spp., *Cytodites* spp., *Laminosioptes* spp..

30

35

40

Предлагаемые активные начала формулы (I) пригодны также для борьбы с членистоногими, поражающими сельскохозяйственных животных, таких, как, например, крупный рогатый скот, овцы, козы, лошади, свиньи, ослы, верблюды, буйво-

45

лы, кролики, курицы, индейки, утки, гуси, пчелы, других домашних животных, таких, как, например, собаки, кошки, декоративные птицы, аквариумные рыбы, а также так называемых подопытных животных, таких, как, например, хомяки, морские свинки, крысы и мышиные. Путем борьбы с этими членистоногими должны уменьшаться смертельные случаи и уменьшение производительности (например, при производстве мяса, молока, шерсти, кож и шкур, яиц, меда и т. д.), чтобы в результате применения активных начал согласно изобретению было возможным более экономичное и более простое содержание животных.

В ветеринарной области применение активных начал по изобретению осуществляется известным образом путем энтеральной дачи, например, в виде таблеток, капсул, через водопой, дренш, в виде гранулята, пасты, болюсов, способом автоматического кормления, в виде суппозиторий, путем парентеральной дачи, например, инъекции (внутримышечной, подкожной, внутривенной, внутрибрюшинной и др.), в виде имплантатов, путем носовой дачи, накожного применения, например, путем погружения или купания (кратковременного погружения в жидкость), опрыскивания (распылителем), наливания (выливанием и каплями), умывания, припудривания, а также при помощи содержащих активное вещество предметов, таких, как ошейники, ушные марки, хвостовые марки, бандажи и повязки для конечностей, недоузки, приспособления для маркировки и т. д..

При крупном рогатом скоте, птицах, домашних животных и т. д. активные начала формулы (I) можно применять в качестве составов (например, порошков, эмульсий, текучих средств), содержащих активное вещество в количестве от 1 до 80

вес.%, непосредственно или после 100- до 10000-кратного разбавления или использовать их в качестве химической ванны.

5

Кроме того, было найдено, что предлагаемые соединения формулы (I) проявляют сильное инсектицидное действие в борьбе с разрушающими техническими материалами насекомыми.

15

Например, но без ограничения, можно предпочтительно назвать следующие насекомые:

20

Жесткокрылые, например,

25

Hylotrupes bajulus, *Chlorophorus pilosis*, *Anobium punctatum*, *Xestobium rufovillosum*, *Ptilinus pecticornis*, *Dendrobium pertinex*, *Ernobius mollis*, *Priobium carpini*, *Lyctus brunneus*, *Lyctus africanus*, *Lyctus planicollis*, *Lyctus linearis*, *Lyctus pubescens*, *Trogoxylon aequale*, *Minthes rugicollis*, *Xyleborus spec.*, *Tryptodendron spec.*, *Apate monachus*, *Bostrychus capucins*, *Heterobostrychus brunneus*, *Sinoxylon spec.*, *Dinoderus minutus*.

30

35

40

Перепончатокрылые, например,

Sirex juvencus, *Urocerus gigas*, *Urocerus gigas taignus*, *Urocerus augur*.

45

Термиты, например,

50

Kaloterme flavicollis, Cryptoterme brevis, Heteroterme indicola, Reticuliterme flavipes, Reticuliterme santonensis, Reticuliterme lucifugus, Mastoterme darwiniensis,
5 Zootermopsis nevadensis, Coptoterme formosanus.

10 Щетинохвостки, например, Lepisma saccharina.

15 Под техническими материалами в данной связи следует понимать неживые материалы, предпочтительно, например, пластмассы, адгезивы, клеи, бумагу и картон, кожу, дерево и деревянные продукты, а также краски.

20

Защищаемым от поражения насекомыми материалом являются, в частности, де-
25 рево и продукты деревообрабатывающей промышленности.

30 Под деревом или продуктами деревообрабатывающей промышленности, которые можно защищать с помощью предлагаемого средства или содержащих это средство смесей, понимают, например:

35

строительные лесоматериалы, деревянные бревна, железнодорожные шпалы,
40 конструкционные элементы мостов, причальные помосты, деревянные коляски, телеги и повозки, ящики, тележки и поддоны, деревянные контейнеры, телеграфные столбы, деревянные обшивки, деревянные окна и двери, фанеру, стружечные плиты, столярные продукты или деревянные продукты, обычно применяемые в домостроении или в столярных мастерских.

50

Активные вещества могут применяться как таковые, в виде концентрата или в виде обычных составов, таких, как порошки, грануляты, растворы, суспензии, эмульсии или пасты.

Указанные составы можно получать известным по себе образом, например, смешиванием активных веществ по меньшей мере с одним растворителем или разбавителем, эмульгатором, диспергатором и/или связующим или фиксирующим веществом, водоотталкивающим средством, в случае необходимости, сиккативом и УФ-стабилизатором и, в случае необходимости, красками и пигментами, а также дальнейшими вспомогательными средствами.

Концентрация предлагаемого активного начала в применяемых для защиты дерева или деревянных материалов инсектицидных средствах или концентратах составляет от 0,0001 до 95 вес. %, в частности, от 0,001 до 60 вес. %.

Количество применяемых средств или концентратов зависит от вида и численности и местонахождения насекомых, а также от среды их применения. Оптимальное применяемое количество можно определять при применении в каждом случае с помощью контрольных опытов. В общем достаточно применять от 0,0001 до 20 вес. %, предпочтительно от 0,001 до 10 вес. % активного начала, в пересчете на защищаемый материал.

В качестве растворителя и/или разбавителя применяют органохимический растворитель или смесь растворителей и/или маслянистый или маслообразный слаболетучий органохимический растворитель или смесь растворителей и/или

полярный органохимический растворитель или смесь растворителей и/или воду и, при необходимости, эмульгатор и/или смачивающий агент.

5

В качестве органохимического растворителя применяют предпочтительно масля-
10 нистые или маслообразные растворители, испаряемость которых выше 35 и температура вспышки которых выше 30 °C, предпочтительно выше 45 °C. В качестве таких слаболетучих, нерастворимых в воде маслянистых и масло-
15 образных растворителей применяют соответствующие минеральные масла или их фракции ароматических углеводородов или содержащие минеральные масла смеси растворителей, предпочтительно уайт-спирит, петролейные фракции и/или алкилбензол.

25

Предпочтительно применяют минеральные масла с диапазоном кипения от 170 до 220 °C, уайт-спирит с диапазоном кипения от 170 до 220 °C, веретенное масло
30 с диапазоном кипения от 250 до 350 °C, нефтяные фракции или ароматические углеводороды с диапазоном кипения от 160 до 280 °C, терпентинное масло и тому подобное.

35

При предпочтительной форме выполнения применяют жидкие алифатические углеводороды с пределами кипения от 180 до 210 °C или высококипящие смеси ароматических и алифатических углеводородов с пределами кипения от 180 до
45 220 °C и/или веретенное масло и/или моноклорнафталин, предпочтительно α -моноклорнафталин.

50

Органические слаболетучие маслянистые или маслообразные растворители с испаряемостью свыше 35 и температурой вспышки свыше 30 °С, предпочтительно
5 но свыше 45 °С, могут отчасти заменяться легколетучими или средней летучести
 органо-химическими растворителями при условии, что смесь растворителей
 имеет также испаряемость свыше 35 и температуру вспышки свыше 30 °С, пред-
10 почтительно свыше 45 °С, и, что содержащаяся в этой смеси растворителей
 инсектицидно-фунгицидная смесь является растворимой и способной к эмульги-
15 рованию.

20 По предпочтительной форме выполнения часть органо-химического раствори-
 теля или смеси растворителей заменяется алифатическим полярным органо-
 химическим растворителем или смесью таких растворителей. Предпочтительно
25 применяют содержащие гидроксильные группы и/или группы сложного эфира
 и/или простого эфира алифатические органо-химические растворители, такие,
30 как, например, простой гликолевый эфир, сложный эфир или тому подобные.

35 В качестве органо-химических растворителей в рамках настоящего изобретения
 применяют известные по себе водорастворимые и/или растворимые в применяе-
 мых органо-химических растворителях или способные к диспергированию или
40 эмульгированию синтетические смолы и/или связующие высыхающие масла, в
 частности, связующие вещества, состоящие из или содержащие акрилатную смо-
45 лу, виниловую смолу, например, поливинилацетат, полиэфирную смолу, по-
 ликонденсационную или полиаддукционную смолу, полиуретановую смолу, алк-
 идную смолу или модифицированную алкидную смолу, фенольную смолу, угле-
50 водородную смолу, такую, как индено-кумароновая смола, кремнийорганическую

смолу, высыхающие растительные масла и/или высыхающие масла и/или физически высыхающие связующие на основе природной и/или синтетической смолы.

5

Применяемая в качестве связующего синтетическая смола может применяться в виде эмульсии, дисперсного продукта или в виде раствора. В качестве связующего могут также применяться битум или битуминозные вещества в количестве до 10 вес. %. Дополнительно могут применяться известные по себе красители, пигменты, водоотталкивающие средства, дезодорирующие средства и ингибиторы или антикоррозионные средства и тому подобные.

20

Согласно изобретению в качестве органо-химического связующего в средстве или в концентрате содержится, предпочтительно, по меньшей мере одна алкидная смола или модифицированная алкидная смола и/или одно высыхающее растительное масло. Согласно изобретению предпочитают алкидные смолы с содержанием масла не менее 45 вес. %, предпочтительно от 50 до 68 вес. %.

30

Упомянутое связующее можно вполне или частично заменять фиксатором (смесью фиксаторов) или пластификатором (смесью пластификаторов). Эти добавки служат для предотвращения улетучивания активных начал, а также для предотвращения кристаллизации или осаждения. Предпочтительно этими добавками заменяют 0,01 до 30 % связующего (в пересчете на 100 % применяемого связующего).

45

Пластификаторы происходят из химических классов сложных эфиров фталевой кислоты, таких, как дибутил-, диоктил- или бензилбутилфталат, сложных эфиров

50

фосфорной кислоты, таких, как трибутилфосфат, сложных эфиров адипиновой кислоты, таких, как ди-(2-этилгексил)-адипат, стеаратов, таких, как бутилстеарат или амилстеарат, олеатов, таких, как бутилолеат, простых эфиров глицерина или высокомолекулярных простых гликолевых эфиров, сложных эфиров глицерина, а также сложных эфиров р-толуолсульфокислоты.

Фиксаторы основываются в химическом смысле на простых эфирах поливинилалкила, таких, как, например, простой поливинилметилловый эфир, или кетонах, таких, как бензофенон, этиленбензофенон.

В качестве растворителей или разбавителей также пригодна, в частности, вода, при необходимости в смеси с одним или многими из указанных выше органо-химических растворителей или разбавителей, эмульгаторов и диспергаторов.

Особенно эффективная защита дерева получается с помощью технологических способов пропитки, например, вакуумной пропитки, пропитки в двойном вакууме или пропитки под давлением.

В случае необходимости, готовые к применению средства могут содержать еще дальнейшие инсектициды и, при необходимости, еще один или много фунгицидов.

В качестве дополнительных примешиваемых ингредиентов можно как предпочтительные назвать инсектициды и фунгициды, указанные в международной заявке

№ WO 94/29 268. Указанные в этом документе соединения являются безоговорочной составной частью настоящей заявки.

5

В частности предпочтительными примешиваемыми ингредиентами являются инсектициды, такие, как хлорпирифос, фоксим, силафлуофин, алфаметрин, цифлутрин, циперметрин, дельтаметрин, перметрин, имидаклоприд, NI-25, флуфеноксурон, гексафлумурон, трансфлутрин, тиаклоприд, метоксифеноксид и трифлумурон,

20

а также фунгициды, такие, как эпокисиконазол, гексаконазол, азаконазол, пропиконазол, тебуконазол, кипроконазол, метконазол, имазалил, дихлорфлуанид, толилфлуанид, 3-йод-2-пропинил-бутилкарбамат, N-октил-изотиазолин-3-он и 4,5-дихлор-N-октил-изотиазолин-3-он.

30

В то же время предлагаемые соединения можно применять для защиты от образования покрова на предметах и поверхностях, в частности, на корпусах судна, ситах, сетках, строительных, причальных и портовых сооружениях и сигнальных установках, имеющих контакт с морской или солоноватой водой.

40

Существование покрова, вызванного сидячими малощетинковыми червями, такими, как известковые трубочники, а также раковинами и видами группы Lepadomorpha (морских уток), такими, как различные виды Lepas или Scalpellum, или видами группы Balanomorpha, такими, как виды Balanus или Pollicipes, повышает у корпусов судна сопротивление трения и вследствие повышенного расхода

50

энергии и, сверх этого, необходимости частого проведения очистки в сухом доке приведет к явному повышению эксплуатационных расходов.

5

Кроме покрова водорослями, такими, как, например, виды *Ectocarpus* и *Ceramium*, особое значение имеет образование покрова сидячими группами энтомо-
страков, которые сводят под названием *Cirripedia* (усоногие раки).

15

Неожиданно было найдено, что предлагаемые соединения или отдельно или в комбинации с другими активными началами обладают превосходящим противо-
обрастающим действием (действием против покрова).

25

Благодаря применению предлагаемых соединений или отдельно или в комбинации с другими активными началами, можно обойтись без применения тяжелых металлов или в решающей степени уменьшить их концентрацию в соответствующих соединениях, таких, как, например, сульфиды бис-(триалкилолова), лауринат три-н.-бутилолова, хлорид три-н.-бутилолова, полуокись меди, хлорид три-
этилолова, три-н.-бутил(2-фенил-4-хлорфенокси)-олово, окись трибутилолова, сульфид молибдена, окись сурьмы, полимерный бутилтитанат, хлорид фенил-
(биспиридин)-висмута, фторид три-н.-бутилолова, этиленбистиокарбамат марганца, диметилдитиокарбамат цинка, этиленбистиокарбамат цинка, соли цинка и меди 2-пиридинтиол-2-окиси, этиленбистиокарбамат бисдиметилдитиокарбамо-
илцинка, окись цинка, этилен-бистиокарбамат меди (I), тиоцианат меди, нафтенат меди и галогениды трибутилолова.

50

Готовые к применению противообрастающие краски могут содержать, при необходимости, еще другие активные начала, предпочтительно, альгициды, фунгициды, гербициды, моллюскициды или другие активные начала противообрастающего действия.

В качестве добавляемых к предлагаемым противообрастающим средствам веществ предпочтительно годятся следующие соединения или средства

альгициды, такие, как

2-трет.-бутиламино-4-циклопропиламино-6-метилтио-1,3,5-триазин, дихлорофен, диурон, эндоталь, фентинацетат, изопротурон, метабензтиазурон, оксифторфен, квинокламин и тербутрин;

фунгициды, такие, как

циклогексиламид-S,S-диоксид бензо[b]тиофенкарбоновой кислоты, диклофлуанид, флуорфолпет, 3-йод-2-пропинил-бутилкарбамат, толилфлуанид и азолы, такие, как

азконазол, кипроконазол, эпоксиконазол, гексаконазол, метконазол, пропиконазол и тебуконазол;

моллюскициды, такие, как

фентинацетат, метальдегид, метиокарб, никлосамид, тиодикарб и триметакарб;

или обычные противообрастающие активные начала, такие, как

4,5-дихлор-2-октил-4-изотиазолин-3-он, дийодметилпаратрилсульфон, 2-(N,N-диметилтиокарбамоилтио)-5-нитротиазол, соли калия, меди, натрия и цинка 2-пи-

ридинтиол-1-окиси, пиридин-трифенилборан, тетрабутилдиоксан, 2,3,5,6-тетрахлор-4-(метилсульфонил)-пиридин, 2,4,5,6-тетрахлороизофталонитрил, тетраметилтиурамдисульфид и 2,4,6-трихлорфенилмалеинимид.

Концентрация предлагаемых активных начал соединений по изобретению составляет от 0,001 до 50 вес. %, в частности от 0,01 до 20 вес. %.

Предлагаемые противообрастающие средства содержат, кроме того, обычные описанные в литературе компоненты; см., например, Унгерер, Chem. Ind., 1985, 37, 730 - 732 и Уиллямс, Antifouling Marine Coatings, Нойе, Парк Ридж, 1973.

Примерами оправдавших себя связующих являются поливинилхлорид в системе растворителей, хлорированный каучук в системе растворителей, акриловые смолы в системе растворителей, в частности, в водной системе, сополимеры на основе винилхлорида/винилацетата в виде водной дисперсии или в виде систем органических растворителей, бутадиеновые/стирольные/акрилонитриловые каучуки, высыхающие масла, такие, как льняное масло, смоляные эфиры или модифицированные высокоплавкие смолы в комбинации с дёгтем или битумами, асфальт, а также эпоксидные соединения, небольшие количества хлорированного каучука, хлорированный полипропилен и виниловые смолы.

При необходимости, в красках содержатся также неорганические пигменты или красители, являющиеся нерастворимыми предпочтительно в морской воде. Кроме того, для обеспечения контролируемого освобождения активных начал краски могут содержать материалы, такие, как канифоль. Краски могут содер-

жать, кроме того, пластификаторы, влияющие на реологические свойства модификаторы, а также другие обычные компоненты. Предлагаемые соединения или
5 вышеназванные смеси могут содержаться также в самошлифующихся противобрастающих системах.

10 Активные начала пригодны также для борьбы с животными вредителями, в частности такими, как, насекомые, паукообразные, клещи, имеющиеся в закрытых
15 помещениях, например, жилых квартирах, заводских помещениях, бюро, кабинах водителя или машиниста или внутренних помещениях автомобилей и тому подобных помещениях. Активные начала могут применяться для борьбы с этими
20 вредителями отдельно или в комбинации с другими активными началами и вспомогательными веществами в хозяйственных инсектицидных продуктах.

25 Они обладают активностью в борьбе с чувствительными и резистентными видами вредителей, а также с вредителями во всех стадиях развития. К этим вредителям относятся:

35 Из отряда Scorpionidea, например, *Buthus occitanus*.

40 Из отряда Acarina, например, *Argas persicus*, *Argas reflexus*, *Bryobia* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Glyciphagus domesticus*, *Ornithodoros moubat*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Trombicula alfreddugesi*, *Neutrombicula autumnalis*, *Dermatophagoides pteronissimus*, *Dermatophagoides farinae*.

50 Из отряда Araneae, например, *Aviculariidae*, *Araneidae*.

Из отряда Opiliones, например, *Pseudoscorpiones chelifer*, *Pseudoscorpiones cheiridium*, *Opiliones phalangium*.

5

Из отряда Isopoda, например, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*.

10

Из отряда Diplopoda, например, *Blaniulus guttulatus*, *Polydesmus* spp..

15

Из отряда Chilopoda, например, *Geophilus* spp..

20

Из отряда Zygentoma, например, *Ctenolepisma* spp., *Lepisma saccharina*, *Lepismodes inquinilus*.

25

Из отряда Blattaria, например, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Blattella asahinai*, *Leucophaea maderae*, *Panchlora* spp., *Parcoblatta* spp., *Periplaneta australasiae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Supella longipalpa*.

30

35

Из отряда Saltatoria, например, *Acheta domesticus*.

40

Из отряда Dermaptera, например, *Forficula auricularia*.

45

Из отряда Isoptera, например, *Kaloterme* spp., *Reticuliterme* spp..

50

Из отряда Psocoptera, например, *Lepinatus* spp., *Liposcelis* spp..

5

Из отряда Coleoptera, например, *Anthrenus* spp., *Attagenus* spp., *Dermestes* spp.,
Latheecicus oryzae, *Necrobia* spp., *Ptinus* spp., *Rhizoperta dominica*, *Sitophilus gra-*
narius, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Stegobium paniceum*.

10

15

Из отряда Diptera, например, *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes taenio-*
rhynchus, *Anopheles* spp., *Calliphora erythrocephala*, *Chrysozona pluvialis*, *Culex*
quinquefasciatus, *Culex pipiens*, *Culex tarsalis*, *Drosophila* spp., *Fannia canicularis*,
Musca domestica, *Phlebotomus* spp., *Sarcophaga carnaria*, *Simulium* spp., *Stomoxys*
calcitrans, *Tipula paludosa*.

20

25

Из отряда Lepidoptera, например, *Achroia grisella*, *Galleria melonella*, *Plodia inter-*
punctella, *Tinea cloacella*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*.

30

35

Из отряда Siphonaptera, например, *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*,
Pulex irritans, *Tunga penetrans*, *Xenopsylla cheopis*.

40

Из отряда Hymenoptera, например, *Camponotus herculeanus*, *Lasius fuliginosus*,
Lasius niger, *Lasius umbratus*, *Monomorium pharaonis*, *Paravespula* spp., *Tetramo-*
rium caespitum.

45

50

Из отряда Anoplura, например, *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Phthirus pubis*.

5

Из отряда Heteroptera, например, *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Rhodinus prolixus*, *Triatoma infestans*.

10

Применение в области ходяйственных инсектицидов осуществляется отдельно или в комбинации с другими пригодными активными началами, такими, как сложные эфиры фосфорной кислоты, карбаматы, пиретроиды, регуляторы роста, или активными началами из других известных классов инсектицидов.

15

20

Применение проводится в виде аэрозолей, разбрызгиваемых без давления средств, например, перекачиваемых и распыляемых жидкостей при помощи аппаратов для распыливания до тумана, в виде пены, геля, испаряемых средств с пластинками из целлюлозы или пластмассы, при помощи жидкостных испарителей, испарителей для геля и мембранных испарителей, а также испарителей с пропеллерным приводом, а также работающих без подачи энергии испарителей или пассивных испарительных систем, кроме того, бумаг, мешков и геля для борьбы с молью, кроме того, средство может применяться в виде гранулятов или пылей, при помощи разбрасываемых приманочных средств или станций приманочных средств.

25

30

35

40

45

Активные начала по изобретению можно применять в качестве дефолианта, десиканта, средства умерщвления сорняков и, в частности, средства уничтожения сорняков. Под сорняками в широком смысле следует понимать все ра-

50

стения, растущие в местах, где они являются нежелательными. Активность предлагаемых веществ, то есть, их действие или в качестве гербицидов полного действия или селективных гербицидов, зависит в основном от применяемого количества.

Активные начала по изобретению можно применять, например, в борьбе со следующими растениями:

Дикотильные сорняки родов: Abutilon, Amaranthus, Ambrosia, Anoda, Anthemis, Aphanes, Atriplex, Bellis, Bidens, Capsella, Carduus, Cassia, Centaurea, Chenopodium, Cirsium, Convolvulus, Datura, Desmodium, Emex, Erysimum, Euphorbia, Galeopsis, Galinsoga, Galium, Hibiscus, Ipomoea, Kochia, Lamium, Lepidium, Lindernia, Matricaria, Mentha, Mercurialis, Mullugo, Myosotis, Papaver, Pharbitis, Plantago, Polygonum, Portulaca, Ranunculus, Raphanus, Rorippa, Rotala, Rumex, Salso-
la, Senecio, Sesbania, Sida, Sinapis, Solanum, Sonchus, Sphenoclea, Stellaria, Taraxacum, Thlaspi, Trifolium, Urtica, Veronica, Viola, Xanthium.

Дикотильные культуры родов: Arachis, Beta, Brassica, Cucumis, Cucurbita, Helianthus, Daucus, Glycine, Gossypium, Ipomoea, Lactuca, Linum, Lycopersicon, Nicotiana, Phaseolus, Pisum, Solanum, Vicia.

Монокотильные сорняки родов: Aegilops, Agropyron, Agrostis, Alopecurus, Apera, Avena, Brachiaria, Bromus, Cenchrus, Commelina, Cynodon, Cyperus, Dactyloctenium, Digitaria, Echinochloa, Eleocharis, Eleusine, Eragrostis, Eriochloa, Festuca, Fimbristylis, Heteranthera, Imperata, Ischaemum, Leptochloa, Lolium, Monochoria, Pani-

cum, Paspalum, Phalaris, Phleum, Poa, Rottboellia, Sagittaria, Scirpus, Setaria, Sorghum.

5

Монокотильные культуры родов: Allium, Ananas, Asparagus, Avena, Hordeum, Oryza, Panicum, Saccharum, Secale, Sorghum, Triticale, Triticum, Zea.

10

Однако, применение активных начал по изобретению не ограничивается этими родами, но распространяется таким же образом и на другие растения.

15

20

В зависимости от их концентрации предлагаемые соединения пригодны для полной борьбы с сорной растительностью, имеющейся, например, на площади промышленных установок или рельсовых путей, на дорогах и площадях с деревьями или без деревьев. Соединения могут также применяться для борьбы с сорной растительностью во многолетних культурах, таких, как, например, лесоводство, декоративные деревянистые культуры, плодовые культуры, виноградники, цитрусовые и ореховые культуры, банановые, кофейные, чайные, каучуковые плантации, культуры масляных пальм, какао-плантации, ягодные культуры и хмельники; кроме того, они могут применяться для борьбы с сорной растительностью на декоративном и спортивном дернах и на пастбищной площади, а также для селективной борьбы с сорной растительностью в однолетних культурах.

25

30

35

40

45

Предлагаемые соединения формулы (I) обладают сильной гербицидной активностью и широким спектром действия при применении на почве и на надземных частях растений. Они также пригодны для селективной борьбы с монокотиль-

50

ными и дикотильными сорняками в монокотильных и дикотильных культурах как путем довсходового нанесения, так и путем послевсходового нанесения.

5

Активные начала по изобретению могут применяться в определенных концентра-
циях или применяемых количествах также для борьбы с животными вредителями
и грибковыми или бактериальными болезнями растений. При необходимости, их
можно также использовать в качестве промежуточных или предварительных про-
дуктов для синтеза дальнейших активных начал.

15

20

Активные начала могут быть переведены в обычные препаративные формы,
например, растворы, эмульсии, опрыскиваемые порошки, суспензии, порошки,
опыливаемые средства, пасты, растворимые порошки, грануляты, концентраты в
виде суспензии и эмульсии, пропитанные активным началом натуральные и син-
тетические вещества, а также тонкоинкапсулированные в полимерных веществах
формы.

25

30

35

Эти составы получают известным способом, например, смешиванием активного
начала с наполнителями, т.е. жидкими растворителями и/или твердыми носи-
телями, при необходимости, с применением поверхностноактивных средств, т.е.
эмульгаторов и/или диспергаторов и/или пенообразователей.

40

45

В случае использования воды в качестве наполнителя могут также использо-
ваться в качестве вспомогательного средства, например, органические раствори-
тели. В качестве жидкого растворителя используются в основном ароматические
углеводороды, например, ксилол, толуол или алкилнафталины, хлорированные

50

ароматические или хлорированные алифатические углеводороды, например, хлорбензол, хлористый этилен или хлористый метилен, алифатические углеводороды, например, циклогексан или парафины, например, нефтяные фракции, минеральные и растительные масла, спирты, например, бутанол или гликоль, а также их простые и сложные эфиры, кетоны, например, ацетон, метилэтилкетон, метилизобутилкетон или циклогексанон, высокополярные растворители, например, диметилформамид и диметилсульфоксид, а также вода.

В качестве твердых носителей используют: например, соли аммониевого основания и помолы натуральных горных пород, например, каолин, глинозем, тальк, мел, кварц, аттапульгит, монтмориллонит или диатомовую землю и помолы синтетических горных пород, например, высокодисперсную кремневую кислоту, окись алюминия и силикаты. В качестве твердых носителей для гранулятов используют размельченные и фракционированные натуральные горные породы, например, кальцит, мрамор, пемзу, сепиолит, доломит, а также синтетические грануляты из неорганических и органических помолов, а также грануляты из органических материалов, например, опилок, кокосовой шелухи, кукурузных початков и стеблей табака. В качестве эмульгирующих и пенообразующих средств используют, например, неионогенные и анионные эмульгаторы, например, сложные эфиры полиоксиэтилена и жирных кислот, простые эфиры полиоксиэтилена и жирных спиртов, например, алкиларилполигликолевый простой эфир, алкилсульфонаты, алкилсульфаты, арилсульфонаты, а также белковые гидролизаты. В качестве диспергатора используют, например, лигнинсульфитный щелок и метилцеллюлозу.

В составах также могут использоваться связующие, например, карбоксиметил-
целлюлоза, натуральные и синтетические порошкообразные, зернистые или ла-
тексные полимеры, например, гуммиарабик, поливиниловый спирт, поливинил-
ацетат, а также природные фосфолипиды, например, кефалины и лецитины, и
синтетические фосфолипиды. Другими добавками могут быть минеральные и
растительные масла.

Могут также использоваться красители, такие, как неорганические пигменты, на-
пример, окись железа, окись титана, ферроциановый голубой, и органические
красители, например, ализариновый, азо- и металлфталоцианиновые красители,
и микроэлементы в виде солей железа, марганца, бора, меди, кобальта, молиб-
дена и цинка.

Составы содержат обычно от 0,1 до 95 вес. % активного начала, предпочтительно
от 0,5 до 90 %.

Предлагаемые активные начала могут применяться для борьбы с сорняками как
таковые или в их составах также в смеси с известными гербицидами и/или веще-
ствами (антидотами), улучшающими переносимость культурными растениями,
при этом могут применяться готовый к употреблению состав или препарат, при-
готовляемый в баках непосредственно перед употреблением. Следовательно,
также возможны смеси со средствами для борьбы с сорной растительностью,
содержащими один или много известных гербицидов и антидот.

В качестве добавляемых к смеси веществ используют известные гербициды, например,

5

ацетохлор, ацифлуорфен (-содий), аклонифен, алахлор, аллоксидим (-содий),
10 аметрин, амикарбазон, амидохлор, амидосульфурон, анилофос, асулам, атразин, азафенидин, азимсульфурон, бефлубутамид, беназолин (-этил), бенфурезат, бенсульфурон (-метил), бентазон, бензфендизон, бензобициклон, бензофен-
15 ап, бензоилпроп (-этил), биалафос, бифенокс, биспирибак (-содий), бромобутид, бромофеноксим, бромоксинил, бутахлор, бутафенацил (-аллил), бутроксидим, бутилат, кафенстрол, калоксидим, карбетамид, карфентразон (-этил), кломет-
20 оксифен, хлорамбен, хлоридазон, хлоримурон (-этил), хлорнитрофен, хлорсульфурон, хлортолурон, цинидон (-этил), цинметилин, циноссульфурон, клеф-
25 оксидим, клетодим, клодинафоп (-пропаргил), кломазон, кломепроп, клопиралид, клопирасульфурон (-метил), клорансулам (-метил), кумилурон, цианазин, цибу-
30 трин, циклоат, циклосульфамурон, циклоксидим, цигалофоп (-бутил), 2,4-D, 2,4-DB, десмедифам, диаллат, дикамба, дихлорпроп (-P), диклофоп (-метил), ди-
35 клосулам, диэтатил (-этил), дифензокват, дифлуфеницан, дифлуфензопир, димефурон, димепиперат, диметахлор, диметаметрин, диметенамид, димексифлам, динитрамин, диффенамид, дикват, дитиопир, диурон, димрон, эпопродан,
40 ЕРТС, эспрокарб, эталфлуралин, этаметсульфурон (-метил), этофумезат, эт-оксифен, этоксисульфурон, этобензанид, феноксапроп (-P-этил), фентразамид, флампроп (-изопропил), флампроп (-изопропил-L), флампроп (-метил), флаза-
45 сульфурон, флорасулам, флуазипоп (-P-бутил), флуазолат, флукарбазон (-содий), флуфенацет, флуметсулам, флумиклорак (-пентил), флумиоксазин, флуми-
50 пропин, флуметсулам, флуометурон, фторохлоридон, фторогликофен (-этил), флупоксам, флупропацил, флурпирсульфурон (-метил, содий), флуренол (-бу-

тил), флуридон, флуороксибир (-бутокси), флуороксибир (-пропил), флуороксибир (-
 метил), флурпримидол, флуртамон, флутиацет (-метил), флутиамид, фомеса-
 5 фен, форамсульфурон, глюфозинат (-аммоний), глюфозат (-изопропиламмоний),
 галозафен, галоксифоп (-этоксиэтил), галоксифоп (-Р-метил), гексазион, имаза-
 10 метабенз (-метил), имазаметапир, имазамокс, имазапик, имазапир, имазаквин,
 имазетапир, имазосульфурон, йодосульфурон (-метил, -содий), иоксинил, изо-
 пропалин, изопротурон, изоурон, изоксабен, изоксахлортол, изоксафлутол, из-
 15 оксапирифоп, лактофен, ленацил, линурон, МСРА, мекопроп, мефенацет, мезо-
 трион, метамитрон, метазахлор, метабензтиазурон, метобензурон, метобром-
 урон, (алфа-) метолахлор, метосулам, метоксурон, метрибуцин, метсульфурон(-
 20 метил), молинат, монолинурон, напроанилид, напропамид, небурон, никосульф-
 урон, норфлуразон, орбенкарб, оризалин, оксациаргил, оксациазон, оксасульф-
 25 урон, оксацикломефон, оксифторфен, паракват, пеларгоновая кислота, пенди-
 металин, пендралин, пентоксазон, фенмедифам, пиперофос, претилахлор, при-
 мисульфурон (-метил), профлуазол, прометрин, пропахлор, пропанил, пропакви-
 30 зафоп, пропизохлор, пропоксикарбазон (-содий), пропизамид, просульфокарб,
 просульфурон, пирафлуфен (-этил), пиразогил, пиразолат, пиразосульфурон (-
 35 этил), пиразоксифен, пирибензоксим, пирибутикарб, пиридат, пиридатол, пири-
 фталид, пириминобак (-метил), пиритиобак (-содий), квинхлорак, квинмерац,
 квинокламин, квизалофоп (-Р-этил), квизалофоп (-Р-тефурил), римсульфурон,
 40 сетоксидим, симацин, симетрин, сулькотрион, сульфентразон, сульфометурон (-
 метил), сульфозат, сульфосульфурон, тебутам, тебутиурон, тепралоксидим, тер-
 45 бутилазин, тербутрин, тенилхлор, тиафлуамид, тиазопир, тиадиазимин, тифен-
 сульфурон (-метил), тиобенкарб, тиокарбазил, тралькоксидим, триаллат, триа-
 сульфурон, трибенурон (-метил), триклопир, тридифан, трифлуралин, трифлок-
 50 сисульфурон, трифлусульфурон (-метил), тритосульфурон.

В качестве добавляемых к смеси веществ могут использоваться, кроме того, известные антидоты, например:

AD-67, BAS-145138, беноксакор, флоквинтоцет (-мексил), циометринил, 2,4-D, DKA-24, дихлормид, димрон, фенклорим, фенхлоразол (-этил), флуразол, флукс-офеним, фурилазол, изоксадифен (-этил), МСРА, мекопроп (-Р), мефенпир (-ди-этил), MG-191, оксабенитрил, PPG-1292, R-29148.

Также возможно смешивание с другими известными активными началами, такими как фунгициды, инсектициды, акарициды, нематодциды, вещества для защиты от птиц, питательные вещества растений и средства для улучшения структуры почвы.

Активные вещества могут применяться как таковые, в виде их составов или в виде приготовляемых из них путем дальнейшего разбавления форм для применения, как то готовые к употреблению растворы, суспензии, эмульсии, порошки, пасты и грануляты. Применение происходит обычным образом, например, поливом, опрыскиванием, разбрасыванием, рассеиванием.

Также возможно наносить предлагаемые активные вещества как до всхода, так и после всхода растений. Их можно также вносить в почву до посева.

Применяемое количество активного начала может варьироваться в широком интервале. Оно в основном зависит от вида желаемого эффекта. Обычно приме-

яемые количества составляют от 1 г до 10 кг активного начала на гектар поверхности почвы, предпочтительно от 5 г до 5 кг/га.

5

Предлагаемые вещества обладают сильным микробицидным действием, и могут применяться для борьбы с нежелательными микроорганизмами, такими, как грибки и бактерии, в областях защиты растений и защиты материалов.

15

Фунгициды можно применять в области защиты растений для борьбы с *Plasmodiophoromycetes*, *Oomycetes*, *Chytridiomycetes*, *Zygomycetes*, *Ascomycetes*, *Basidiomycetes* и *Deuteromycetes*.

25

Бактерициды можно применять в области защиты растений для борьбы с *Pseudomonadaceae*, *Rhizobiaceae*, *Enterobacteriaceae* *Streptomycetaceae*.

30

Например, но без ограничения, можно назвать несколько возбудителей грибковых и бактериальных болезней, относящихся к названным выше родовым понятиям:

40

виды *Xanthomonas*, например, *Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*;

виды *Pseudomonas*, например, *Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*;

45

виды *Erwinia*, например, *Erwinia amylovora*;

50

виды *Pythium*, например, *Pythium ultimum*;

виды *Phytophthora*, например, *Phytophthora infestans*;

виды *Pseudoperonospora*, например, *Pseudoperonospora humuli* или *Pseudoperonospora cubensis*;

5

виды *Plasmopara*, например, *Plasmopara viticola*;

10

виды *Bremia*, например, *Bremia lactucae*;

виды *Peronospora*, например, *Peronospora pisi* или *Peronospora brassicae*;

15

виды *Erysiphe*, например, *Erysiphe graminis*;

виды *Sphaeroteca*, например, *Sphaeroteca fuliginea*;

20

виды *Podosphaera*, например, *Podosphaera leucotricha*;

виды *Venturia*, например, *Venturia inaequalis*;

25

виды *Pyrenophora*, например, *Pyrenophora teres* или *P. graminea*;

30

(форма конидий: *Drechslera*, син.: *Helminthosporium*);

виды *Cochliobolus*, например, *Cochliobolus sativus*;

35

(форма конидий: *Drechslera*, син.: *Helminthosporium*);

виды *Uromyces*, например, *Uromyces appendiculatus*;

40

виды *Puccinia*, например, *Puccinia recondita*;

виды *Sclerotinia*, например, *Sclerotinia sclerotiorum*;

45

виды *Tilletia*, например, *Tilletia caries*;

50

виды *Ustilago*, например, *Ustilago nuda* или *Ustilago avenae*;

виды *Pellicularia*, например, *Pellicularia sasakii*;

виды *Pyricularia*, например, *Pyricularia oryzae*;

виды *Fusarium*, например, *Fusarium culmorum*;

виды *Botrytis*, например, *Botrytis cinerea*;

виды *Septoria*, например, *Septoria nodorum*;

виды *Leptosphaeria*, например, *Leptosphaeria nodorum*;

виды *Cercospora*, например, *Cercospora canescens*;

виды *Alternaria*, например, *Alternaria brassicae*;

виды *Pseudocesporella*, например, *Pseudocesporella herpotrichoides*.

Активные начала согласно изобретению также обладают сильным усилующим действием в растениях. Поэтому они пригодны для мобилизации свойственной растениям способности защиты от поражения нежелательными микроорганизмами.

Под усиливающими растения (индуцирующими устойчивость) веществами следует в данном случае понимать вещества, способные к стимуляции защитной системы растений так, что у обработанных растений при последующей инокуляции нежелательными микроорганизмами развивается широкая устойчивость.

Под нежелательными микроорганизмами в данном случае понимают фитопатогенные грибки, бактерии и вирусы. Следовательно, предлагаемые вещества могут применяться с тем, чтобы растения за определённый период времени после

обработки защищать от поражения указанными вредными возбудителями. Период времени для достижения защиты обычно составляет от 1 до 10 дней, предпочтительно от 1 до 7 дней после обработки растений активными началами.

Хорошая переносимость растениями активных начал в необходимых для борьбы с болезнями растений концентрациях позволяет проводить обработку надземных частей растений, рассады, семян и почвы.

Предлагаемые активные начала также пригодны для повышения урожайности. Они являются, кроме того, малотоксичными и обладают хорошей переносимостью растениями.

Активные вещества могут в определенной концентрации и применяемом количестве также использоваться, при необходимости, в качестве гербицидов, с целью влияния на рост растений, а также для борьбы с животными вредителями. Они могут, при необходимости, также применяться в качестве промежуточных и предварительных продуктов для синтеза дальнейших активных начал.

В области защиты материалов предлагаемые вещества могут применяться для защиты технических материалов от поражения и разрушения нежелательными микроорганизмами.

Под техническими материалами в данной связи следует понимать неживые материалы, приготовленные для применения в технике. Техническими материалами,

защищаемыми от микробного изменения или разрушения, могут быть, например, клеи, адгезивы, бумага и картон, текстильные материалы, кожа, дерево, лакокрасочные материалы и пластмассовые изделия, смазочно-охлаждающие средства и другие материалы, которые могут подвергаться поражению или разложению микроорганизмами. В качестве защищаемых материалов можно также назвать части производственных установок например, циркуляционные контуры водяного охлаждения, которым может повредить размножение микроорганизмов. В рамках настоящего изобретения можно назвать в качестве технических материалов предпочтительно клеи, адгезивы, бумага и картон, кожа, дерево, лакокрасочные материалы, смазочно-охлаждающие средства и жидкости-теплоносители, особенно предпочтительно дерево.

В качестве микроорганизмов, которые могут вызвать разложение или изменение технических материалов, можно назвать, например, бактерии, грибки, дрожжи, водоросли и слизистые организмы. Предлагаемые активные начала обладают активностью предпочтительно против грибков, в частности, плесневых грибков, изменяющих цвет древесины и разрушающих древесину грибков (*Basidiomyceten*), а также против слизистых организмов и водорослей.

Например, можно назвать микроорганизмы следующих родов:

Alternaria, например, *Alternaria tenuis*,

Aspergillus, например, *Aspergillus niger*,

Chaetomium, например, *Chaetomium globosum*,

Coniophora, например, *Coniophora puetana*,

Lentinus, например, *Lentinus tigrinus*,

Penicillium, например, *Penicillium glaucum*,

Polyporus, например, *Polyporus versicolor*,

Aureobasidium, например, *Aureobasidium pullulans*,

Sclerophoma, например, *Sclerophoma pityophila*,

Trichoderma, например, *Trichoderma viride*,

Escherichia, например, *Escherichia coli*,

Pseudomonas, например, *Pseudomonas aeruginosa*,

Staphylococcus, например, *Staphylococcus aureus*.

Активные вещества в зависимости от их физических и/или химических свойств могут быть переведены в обычные препаративные формы, например, растворы, эмульсии, суспензии, порошки, пены, пасты, грануляты, аэрозоли, тонкоинкапсулированные в полимерных веществах формы и в заключенные в оболочку массы для посевного материала, а также в препараты для ультранизкообъемного распыления холодным и горячим способом.

Эти составы получают известным способом, например, смешиванием активного вещества с наполнителями, т.е. жидкими растворителями, находящимися под давлением газами и/или твердыми носителями, при необходимости с применением поверхностноактивных средств, т. е. эмульгаторов и/или диспергаторов

и/или пенообразователей. В случае использования воды в качестве наполнителя могут также использоваться в качестве вспомогательного средства, например, органические растворители. В качестве жидкого растворителя используются в основном ароматические углеводороды, например, ксилол, толуол или алкилнафталины, хлорированные ароматические или хлорированные алифатические углеводороды, например, хлорбензол, хлористый этилен или хлористый метилен, алифатические углеводороды, например, циклогексан или парафины, например, нефтяные фракции, спирты, например, бутанол или гликоль, а также их простые и сложные эфиры, кетоны, например, ацетон, метилэтилкетон, метилизобутилкетон или циклогексанон, высокополярные растворители, например, диметилформамид и диметилсульфоксид, а также вода. Под сжиженными газообразными наполнителями или носителями понимают такие жидкости, которые при нормальной температуре и нормальном давлении являются газообразными, например, рабочие газы для аэрозолей, например, галогенированные углеводороды, а также бутан, пропан, азот и двуокись углерода. В качестве твердых носителей используют помолы натуральных горных пород, например, каолин, глинозем, тальк, мел, кварц, аттапульгит, монтмориллонит или диатомовую землю и помолы синтетических горных пород, например, высокодисперсную кремневую кислоту, окись алюминия и силикаты. В качестве твердых носителей для гранулятов используют размельченные и фракционированные натуральные горные породы, например, кальцит, мрамор, пемзу, сепиолит, доломит, а также синтетические грануляты из неорганических и органических помолов, а также грануляты из органических материалов, например, опилок, кокосовой шелухи, кукурузных початков и стеблей табака. В качестве эмульгирующих и/или пенообразующих средств используют, например, неионогенные и анионные эмульгаторы, например, сложные эфиры полиоксиэтилена и жирных кислот, простые эфиры по-

лиоксиэтилена и жирных спиртов, например, алкиларилполиглицоловый простой эфир, алкилсульфонаты, алкилсульфаты, арилсульфонаты и белковые гидролизаты. В качестве диспергатора используют, например, лигнинсульфитный щелок и метилцеллюлозу.

В составах также могут использоваться связующие, например, карбоксиметилцеллюлоза, натуральные и синтетические порошкообразные, зернистые или латексные полимеры, например, гуммиарабик, поливиниловый спирт, поливинилацетат, а также природные фосфолипиды, например, кефалины и лецитины, и синтетические фосфолипиды. Другими добавками могут быть минеральные и растительные масла.

Могут также использоваться красители, такие как неорганические пигменты, например, окись железа, окись титана, ферроциановый голубой, и органические красители, например, ализариновый, азо- и металлфталоцианиновые красители, и микроэлементы в виде солей железа, марганца, бора, меди, кобальта, молибдена и цинка.

Составы содержат обычно от 0,1 до 95 вес.% активного вещества, предпочтительно от 0,5 до 90 %.

Активные вещества согласно изобретению могут применяться как таковые или в виде составов в смеси с известными фунгицидами, бактерицидами, акарицидами, нематицидами или инсектицидами для того, чтобы расширить спектр действия или для предотвращения развития резистенции. При этом во многих слу-

чаях получают синергистические эффекты, т.е. активность смеси превышает активность отдельных соединений.

5

Добавляемыми веществами являются, например, следующие соединения:

10

Фунгициды:

15

альдиморф, ампропилфос, ампропилфос-калий, андоприм, анилазин, азаконазол, азоксистробин,

20

беналаксил, беноданил, беномил, бензамакрил, бензамакрил-изобутил, биалафос, бинапакрил, бифенил, битертанол, бластицидин-S, бромконазол, бупиримат, бутиобат,

25

полисульфид кальция, капсимыцин, каптафол, каптан, карбендазим, карбоксин, карвон, хинометионат (квинометионат), хлобентиазон, хлорфеназол, хлоронеб, хлоропикрин, хлороталонил, хлзолинат, хлоцилакон, куфранеб, кимоксанил, кiproконазол, кипродинил, кiproфурам,

30

35

дебакарб, дихлорофен, диклобутразол, диклофлуанид, дикломезин, диклоран, диэтофенкарб, дифеноконазол, диметиримол, диметоморф, диниконазол, диниконазол-M, динокап, дифениламин, дипиритион, диталимфос, дитианон, додеморф, додин, дразоксолон,

40

45

эдифенфос, эпоксиконазол, этаконазол, этиримол, этридиазол,

фамоксадон, фенапанил, фенаримол, фенбуконазол, фенфурам, фенитропан, фенпиклонил, фенпропидин, фенпропиморф, фентинацетат, фентингидроксид, фербам, феримзон, флазуинам, флуметовер, флуоромид, флуквинконазол, флу-

50

рпримидол, флузилазол, флусульфамид, флутоланил, флутриафол, фолпет, фозетил-алюминий, фозетил-натрий, фталид, фуберидазол, фуралаксил, фурамет-
 5 пир, фуркарбонил, фурконазол, фурконазол-цис, фурмециклокс,

гуазатин,

10 гексахлоробензол, гексаконазол, гимексазол,

имазалил, имибенконазол, иминоктадин, иминоктадин-албезилат, иминоктадин-
 15 триацетат, йодокарб, ипконазол, ипробенфос (IBP), ипродион, ирумамицин, изо-
 протиолан, изоваледион,

20 казугамуцин, крезоксим-метил, композиции на основе меди, такие, как: гидро-
 окись меди, нафтенат меди, оксихлорид меди, сульфат меди, окись меди, оксин -
 25 медь и смесь -бордо,

манкоппер, манкоцеб, манеб, меферимзон, мепанипирим, мепронил, металаксил,
 30 метконазол, метасульфокارب, метфуроксам, метирам, метомеклам, метсульфо-
 вакс, милдиомицин, миклобутанил, миклозолин,

35 диметилдитиокарбамат никеля, нитротал-изопропил, нуаримол,

офурак, оксадиксил, оксамокарб, оксолиникацид, оксикарбоксин, оксифентиин,

40 паклобутразол, пефуразоат, пенконазол, пенцикурон, фосдифен, пикоксистро-
 бин, пимарицин, пипералин, полиоксин, полиоксорим, пробеназол, прохлораз,
 45 прокимидон, пропамокарб, пропанозин-натрий, пропиконазол, пропинеб, пира-
 клостробин, пиразофос, пирифенокс, пириметанил, пироквилон, пироксифур,

квинконазол, квинтоцен (PCNB),

50 сера и композиции на ее основе,

тебуконазол, теклофталам, текназен, теткиклазис, тетраконазол, тиабендазол,
 тикиофен, тифлузамид, тиофанат-метил, тирам, тиоксимид, толклофос-метил,
 5 толилфлуанид, триадимефон, триадименол, триазбутил, триазоксид, трикламид,
 трициклазол, тридеморф, трифлуксистробин, трифлумизол, трифорин, тритико-
 10 назол,

униконазол,

15 валидамицин А, винклозолин, виниконазол,

цариламид, цинеб, цирам, а также

20 Даггер G,

ОК-8705,

25 ОК-8801,

30 α -(1,1-диметилэтил)- β -(феноксиэтил)-1H-1,2,4-триазол-1-этанол,

α -(2,4-дихлорфенил)- β -фтор-*b*-пропил-1H-1,2,4-триазол-1-этанол,

35 α -(2,4-дихлорфенил)- β -метокси-*a*-метил-1H-1,2,4-триазол-1-этанол,

40 α -(5-метил-1,3-диоксан-5-ил)-*b*-[[4-трифторметил]-фенил]-метиле-
 н-1H-1,2,4-триазол-1-этанол,

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

45 (E)-*a*-(метоксиимино)-N-метил-2-фенокси-фенилацетамид,

50 сложный 1-изопропиловый эфир {2-метил-1-[[[1-(4-метилфенил)этил]амино]кар-
 бонил]пропил-карбаминовой кислоты,

1-(2,4-дихлорфенил)-2-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)этанон-O-(фенилметил)-оксим,

1-(2-метил-1-нафталинил)-1H-пиррол-2,5-дион,

1,(3,5-(дихлорфенил)-3-(2-пропенил)-2,5-пирролидиндион,

1-[(дийодметил)-сульфонил]-4-метил-бензол,

1-[[2-(2,4-дихлорфенил)-1,3-диоксолан-2-ил]-метил]-1H-имидазол,

1-[[2-(4-хлорфенил)-3-фенилоксиранил]-метил]-1H-1,2,4-триазол,

1-[1-[2-[(2,4-дихлорфенил)-метокси]-фенил]-этинил]-1H-имидазол,

1-метил-5-нонил-2-(фенилметил)-3-пирролидинол,

2',6'-дибром-2-метил-4'-трифторметокси-4'-трифтор-метил-1,3-тиазол-5-карбокс-
анилид,

2,2-дихлор-N-[1-(4-хлорфенил)этил]-1-этил-3-метил-циклопропананкарбоксамид,

2,6-дихлор-5-(метилтио)-4-пиримидинил-тиоцианат,

2,6-дихлор-N-(4-трифторметилбензил)-бензамид,

2,6-дихлор-N-[[4-(трифторметил)-фенил]-метил]-бензамид,

2-(2,3,3-трийод-2-пропенил)-2H-тетразол,

2-[(1-метилэтил)сульфонил]-5-(трихлорметил)-1,3,4-тиадиазол,

2-[[6-деокси-4-O-(4-O-метил-β-D-глюкопиранозил)-α-D-глюкопиранозил]-амино]-4-
метокси-1H-пирроло[2,3-d]пиримидин-5-карбонитрил,

2-аминобутан,

2-бром-2-(бромметил)-пентандинитрил,

2-хлор-N-(2,3-дигидро-1,1,3-триметил-1H-инден-4-ил)-3-пиридинкарбоксамид,

2-хлор-N-(2,6-диметилфенил)-N-(изотиоцианатометил)-ацетамид,

2-фенилфенол (OPP),

3,4-дихлор-1-[4-(дифторметокси)-фенил]-1H-пиррол-2,5-дион,

3,5-дихлор-N-[циан[(1-метил-2-пропинил)-окси]-метил]-бензамид,

3-(1,1-диметилпропил-1-оксо-1H-инден-2-карбонитрил,

3-[2-(4-хлорфенил)-5-этокси-3-изоксазолидинил]-пиридин,

4-хлор-2-циан-N,N-диметил-5-(4-метилфенил)-1H-имидазол-1-сульфонамид,

4-метил-тетразоло[1,5-a]квиназолин-5(4H)-он,

8-(1,1-диметилэтил)-N-этил-N-пропил-1,4-диоксаспиро[4.5]декан-2-метанамин,

8-гидроксихинолинсульфат,

2-[(фениламино)-карбонил]-гидразид 9H-ксантен-9-карбоновой кислоты,

бис-(1-метилэтил-3-метил-4-[(3-метилбензоил)-окси]-2,5-тиофендикарбоксилат,

цис-1-(4-хлорфенил)-2-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)-циклогептанол,

цис-4-[3-[4-(1,1-диметилпропил)-фенил-2-метилпропил]-2,6-диметил-морфолин-
гидрохлорид,

этил-[(4-хлорфенил)-азо]-цианоацетат,

гидрокарбонат калия,

метантетратиол-натриевая соль,

метил-1-(2,3-дигидро-2,2-диметил-1H-инден-1-ил)-1H-имидазол-5-карбоксилат,

метил-N-(2,6-диметилфенил)-N-(5-изоксазолилкарбонил)-DL-аланинат,

метил-N-(хлорацетил)-N-(2,6-диметилфенил)-DL-аланинат,

N-(2,3-дихлор-4-гидроксифенил)-1-метил-циклогексанкарбоксамида,

N-(2,6-диметилфенил)-2-метокси-N-(тетрагидро-2-оксо-3-фуранил)-ацетамид,

N-(2,6-диметилфенил)-2-метокси-N-(тетрагидро-2-оксо-3-тиенил)-ацетамид,

N-(2-хлор-4-нитрофенил)-4-метил-3-нитро-бензолсульфонамида,

N-(4-циклогексилфенил)-1,4,5,6-тетрагидро-2-пиримидинамин,

N-(4-гексилфенил)-1,4,5,6-тетрагидро-2-пиримидинамин,

N-(5-хлор-2-метилфенил)-2-метокси-N-(2-оксо-3-оксазолидинил)-ацетамид,

N-(6-метокси)-3-пиридинил)-циклопропанкарбоксамида,

N-[2,2,2-трихлор-1-[(хлорацетил)-амино]-этил]-бензамид,

N-[3-хлор-4,5-бис(2-пропилилокси)-фенил]-N'-метокси-метанимидамида,

N-формил-N-гидрокси-DL-аланин-натриевая соль,

O,O-диэтил-[2-(дипропиламино)-2-оксоэтил]-этилфосфориамидотиоат,

O-метил-S-фенил-фенилпропилфосфориамидотиоат,

S-метил-1,2,3-бензотиадиазол-7-карботиоат,

спиро[2H]-1-бензопиран-2,1'(3'H)-изобензофуран]-3'-он,

4-[(3,4-диметоксифенил)-3-(4-фторфенил)-акрилоил]-морфолин.

Бактерициды:

бромопол, дихлорофен, нитрапирин, диметилдитиокарбамат никеля, касугамицин, октилинон, фуранкарбоновая кислота, окситетрациклин, пробеназол, стрептомицин, теклофталам, сульфат меди и другие составы на основе меди.

Инсектициды / акарициды / нематициды:

абамектин, ацефат, ацетамиприд, акринатрин, аланикарб, альдикарб, альдоксикарб, альфаметрин, амитраз, авермектин, AZ 60541, азадирахтин, азаметифос, азинфос А, ацинфос М, азоциклотин,

Bacillus popilliae, Bacillus sphaericus, Bacillus subtilis, Bacillus thuringiensis, Baculoviren, Beauveria bassiana, Beauveria tenella, бендиокарб, бенфуракарб, бенсултап, бензоксимат, бетацифлутрин, бифеназат, бифентрин, биоэтанометрин, биоперметрин, бистрифлурон, ВРМС, бромофос А, буфенкарб, бупрофецин, бутатиофос, бутокарбоксин, бутилпиридабен,

кадусафос, карбарил, карбофуран, карбофенотион, карбосульфат, картап, клоэтокарб, хлоретоксифос, хлорфенапир, хлорфенвинфос, хлорфлуазурон, хлормефос, хлорпирифос, хлорпирифос М, кловапортрин, хромафенозид, цисресметрин, цисперметрин, клоцитрин, клоэтокарб, клофентезин, клотианидин, цианофос, циклопрен, циклопротрин, цифлутрин, цигалотрин, цигексатин, циперметрин, циромазин,

дельтаметрин, деметон М, деметон S, деметон-S-метил, диафентиурон, диа-
 зинон, дихлорфос, дикофол, дифлубензурон, диметоат, диметилвинфос, дио-
 5 фенолан, дисульфотон, докусат-содий, дофенапин, диоксатион,

эфлусиланат, эмабектин, эмпентрин, эндосульфат, *Entomopftthora* spp., эсфен-
 10 валерат, этиофенкарб, этион, этопрофос, этофенпрокс, этоксазол, этримфос,

фенамифос, феназаквин, фенбутатиноксид, фенитротион, фенотиокарб, фен-
 15 оксакрим, феноксикарб, фенпропатрин, фенпирад, фенпиритрин, фенпирок-
 симат, фенвалерат, фипронил, флуазилам, флуазурон, флуброцитринат, флу-
 циклоксурон, флуцитринат, флуфеноксурон, флуметрин, флутензин, флували-
 20 нат, фонофос, фосметилан, фостиазат, фубфенпрокс, фуратиокарб,

вирусы амилозы

25 галофенозид, HCN, гептенофос, гексафлумурон, гекситиазокс, гидропрен,

30 имидаклоприд, индоксакарб, изазофос, изофенфос, изоксатион, ивермектин,

вирусы полиэдроза

35 лямбда-цигалотрин, луфенурон,

малатион, мекарбам, метальдегид, метамидофос, *Metharhizium anisopliae*, *Met-*
 40 *harhizium flavoviride*, метидатион, метиокарб, метопрен, метомил, метокси-
 фенозид, метолкарб, метоксидиазон, мервинфос, мильбемектин, мильбемицин,
 45 монохротофос,

налед, нитенпирам, нитиазин, новалурон,

50 ометоат, оксамил, оксидеметон М,

Paecilomyces fumosoroseus, паратион А, паратион М, перметрин, фентоат, форат,
 фозалон, фосмет, фосфамидон, фоксим, пиримикарб, пиримифос А, пиримифос
 5 М, профенофос, промекарб, пропарнит, пропоксур, протиофос, протоат,
 пиметрозин, пирахлофос, пиресметрин, пиретрум, пиридабен, пиридатион, пири-
 мидифен, пирипроксифен,

10 квинальфос,

15 рибавирин,

салитион, себуфос, силафлуофен, сриносад, спиродиклофен, сульфотеп, суль-
 20 профос,

тау-флувалинат, тебуфенозид, тебуфенпирад, тебупиримифос, тефлубензурон,
 25 тефлутрин, темефос, темивинфос, тербуфос, тетрахлорвинфос, тетрадифон, те-
 тациперметрин, тиаклоприд, тиаметоксам, тиапронил, тиатрифос, тиоциклам гид-
 роген оксалат, тиодикарб, тиофанокс, турингиензин, тралоцитрин, тралометрин,
 30 триаратен, триазамат, триазофос, триазурон, триклофенидин, трихлорфон, три-
 флумурон, триметакарб,

35 вамидотион, ванилипрол, *Verticillium lecanii*,

YI 5302

40 зета-циперметрин, золапрофос,

45 (1R-цис)-[5-(фенилметил)-3-фуранил]-метил-3-[(дигидро-2-оксо-3(2H)-фуранили-
 ден)-метил]-2,2-диметилциклопропанкарбоксилат,

50 (3-феноксифенил)-метил-2,2,3,3-тетраметилциклопропанкарбоксилат,

1-[(2-хлор-5-тиазолил)метил]тетрагидро-3,5-диметил-N-нитро-1,3,5-триазин-2(1H)

-имин,

5

2-(2-хлор-6-фторфенил)-4-[4-(1,1-диметилэтил)фенил]-4,5-дигидро-оксазол,

2-(ацетилокси)-3-додецил-1,4-нафталиндион,

10

2-хлор-N-[[[4-(1-фенилэтоксифенил)-амино]-карбонил]-бензамид,

15

2-хлор-N-[[[4-(2,2-дихлор-1,1-дифторэтоксифенил)-амино]-карбонил]-бензамид,

3-метилфенил-пропилкарбамат,

20

4-[4-(4-этоксифенил)-4-метилфенил]-1-фтор-2-фенокси-бензол,

4-хлор-2-(1,1-диметилэтил)-5-[[2-(2,6-диметил-4-феноксифенокси)этил]тио]-3(2H)

25

-пиридазинон,

4-хлор-2-(2-хлор-2-метилпропил)-5-[(6-йод-3-пиридинил)метокси]-3(2H)-пирида-

30

зион,

4-хлор-5-[(6-хлор-3-пиридинил)метокси]-2-(3,4-дихлорфенил)-3(2H)-пиридазинон,

35

Bacillus thuringiensis strain EG-2348,

[2-бензоил-1-(1,1-диметилэтил)-гидразид бензойной кислоты,

40

сложный эфир 2,2-диметил-3-(2,4-дихлорфенил)-2-оксо-1-оксаспиро[4,5]дец-3-ен-

4-ил бутановой кислоты,

45

[3-[(6-хлор-3-пиридинил)метил]-2-тиазолидинилиден]-цианамид,

дигидро-2-(нитрометил)-2H-1,3-тиазин-3(4H)-карбоксальдегид,

50

этил-[2-[[1,6-дигидро-6-оксо-1-(фенилметил)-4-пиридазинил]окси]этил]-карбамат,

N-(3,3,4-трифтор-1-оксо-3-бутенил)-глицин,

N-(4-хлорфенил)-3-[4-(дифторметокси)фенил]-4,5-дигидро-4-фенил-1Н-пиразол-
1-карбоксамид,

N-[(2-хлор-5-тиазолил)метил]-N'-метил-N''-нитро-гуанидин,

N-метил-N'-(1-метил-2-пропенил)-1,2-гидразиндикарботиоамид,

N-метил-N'-2-пропенил-1,2-гидразиндикарботиоамид,

О,О-диэтил-[2-(дипропиламино)-2-оксоэтил]-этилфосфорамидотиоат,

N-цианометил-4-трифторметил-никотинамид,

3,5-дихлор-1-(3,3-дихлор-2-пропенилокси)-4-[3-(5-трифторметилпиридин-2-илок-
си)-пропокси]-бензол.

Также возможно смешивание с другими известными веществами, такими, как гер-
бициды, или с удобрениями и регуляторами роста.

Сверх этого, предлагаемые соединения формулы (I) обладают также очень хоро-
шей противогрибковой активностью. Они имеют очень широкий спектр против-
грибкового действия, в частности, против дерматофитов и ростковых грибов,
плесени и двухфазовых грибов (например, против видов *Candida*, например,
Candida albicans, *Candida glabrata*), а также *Epidermophyton floccosum*, видов *As-*
pergillus, например, *Aspergillus niger* и *Aspergillus fumigatus*, видов *Trichophyton*,
например, *Trichophyton mentanagrophytes*, видов *Microsporon*, например, *Micro-*
sporos canis и *audouinii*. Перечисление этих грибов никоим образом не означает

ограничение охватываемого грибкового спектра, но служит только для пояснения.

5

Активные вещества могут применяться как таковые, в виде составов или в виде
10 приготовляемых из них форм для применения, как то готовые к употреблению
растворы, суспензии, порошки для опрыскивания, пасты, растворимые порошки,
препараты для опыливания и грануляты. Применение происходит обычным обра-
15 зом, например, поливом, опрыскиванием, разбрасыванием, распылением, вспе-
ниванием, намазыванием и т. д.. Также возможно наносить активные вещества
20 ультранизкообъемным методом, или композицию с активным началом или само
активное вещество вносить в почву. Также можно обрабатывать посевной ма-
териал.

25

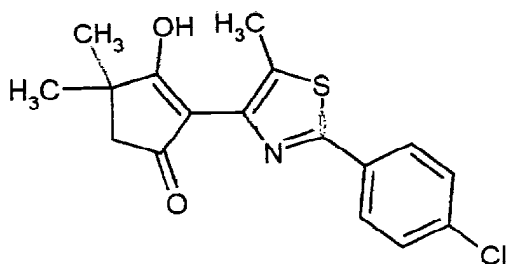
В случае использования предлагаемых активных начал в качестве фунгицидов
30 применяемые количества в зависимости от вида применения могут варьировать-
ся в широких пределах.

35

При обработке частей растений применяемые количества активного вещества
обычно составляют от 0,1 до 10.000 г/га, предпочтительно от 10 до 1.000 г/га.
40 При обработке посевного материала применяемое количество активного веще-
ства составляет обычно от 0,001 до 50 г на кг семян, предпочтительно от 0,01 до
45 10 г на кг семян. При обработке почвы применяемые количества активного ве-
щества обычно составляют от 0,1 до 10.000 г/га, предпочтительно от 1 до 5.000
г/га.

50

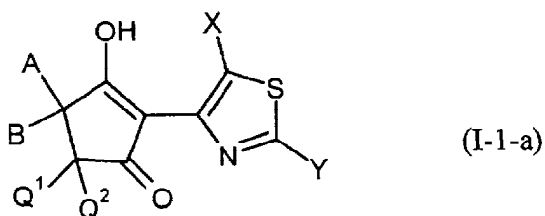
Получение и применение активных начал по изобретению поясняются в ниже-
следующих примерах.

Примеры получения**Пример I-1-a1**

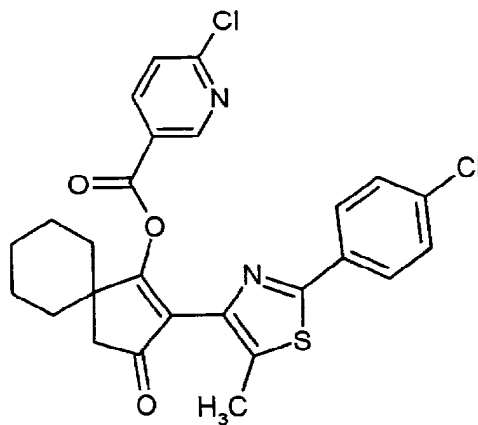
1,65 г (14,4 ммоль) трет.бутилата калия в 30 мл безводного диметилформамида подают в реактор, затем прикапывают 3,5 г (9,6 ммоль соединения по примеру (II-1) в 10 мл безводного диметилформамида. Перемешивают при 50 °С в течение 3 часов. После этого в реакционную смесь подают 100 мл ледяной воды. Эту смесь подают в 600 мл холодного раствора 1 н. соляной кислоты. Осадок отсасывают и сушат.

Выход: 2,9 г (90 % теории), точка плавления 139 – 141 °С

Аналогично примеру (I-1-a-1) и согласно общим указаниям по получению получают следующие соединения формулы (I-1-a):



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

Пример I-1-б-1

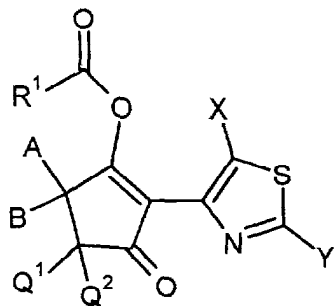
500 мг (1,33 ммоль) соединения по примеру I-1-а-2 в 5 мл абсолютного дихлорметана подают в реактор, затем добавляют 0,27 мл (2,0 ммоль) триэтиламина. При 0 °С прибавляют 0,30 г (1,74 ммоль) 6-хлорникотинилхлорида и перемешивают при комнатной температуре в течение 2 часов. После этого прибавляют дальнейшие 0,15 г хлорникотинилхлорида и 0,13 мл триэтиламина.

Реакционную смесь промывают 10 %-ным раствором лимонной кислоты, водную фазу экстрагируют дихлорметаном, затем органическую фазу промывают 1 н. раствором гидроокиси натрия, а водную фазу экстрагируют дихлорметаном.

Органическую фазу сушат и растворитель отгоняют. Остаток размешивают с петролейным эфиром, фильтруют и затем сушат.

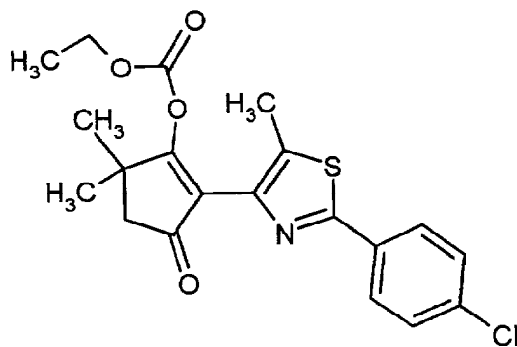
Выход: 0,7 г (100 % теории), точка плавления 133 – 134 °С

Аналогично примеру (I-1-б-1) и согласно общим указаниям по получению получают следующие соединения формулы (I-1-б):



(I-1-6)

Пример №	X	Y	B	A	Q ¹	Q ²	R ¹	Точка пл. °С
I-1-6-2	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	H ₅ C ₂ -O-CH ₂ -	135
I-1-6-3	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	i-C ₃ H ₇	масло
I-1-6-4	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	4-Cl-C ₆ H ₄	129-130
I-1-6-5	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H		масло

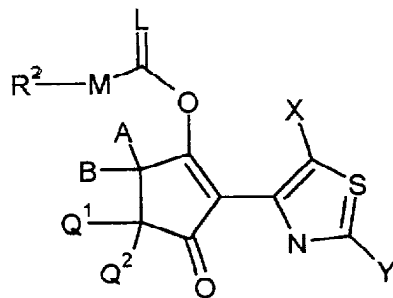
Пример I-1-в-1

500 мг (1,5 ммоль) соединения согласно примеру (I-1-а-1) в 5 мл абсолютного дихлорметана подают в реактор, затем добавляют 0,3 мл (2,25 ммоль) триэтиламина. При 0 °С прибавляют 0,225 г (1,95 ммоль) сложного этилового эфира хлормуравьиной кислоты и перемешивают при комнатной температуре в течение 2 часов.

Реакционный раствор промывают 10 %-ной лимонной кислотой, водную фазу экстрагируют дихлорметаном (CH₂Cl₂). Органическую фазу промывают 1 н. раствором гидроокиси натрия, сушат и сгущают.

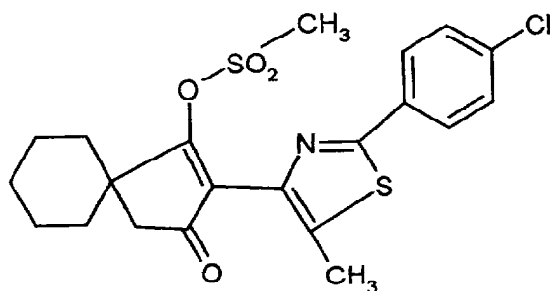
Выход: 0,45 г (75 % теории), точка плавления 132 – 134 °С

Аналогично примеру (I-1-в-1) и согласно общим указаниям по получению получают следующие соединения формулы (I-1-в):



(I-1-B)

Пример №	X	Y	A	B	Q ¹	Q ²	L	M	R ²	Точка пл. °С
I-1-B-2	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	O	O	C ₂ H ₅	масло
I-1-B-3	C ₂ H ₅	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	O	O	C ₂ H ₅	масло
I-1-B-4	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	O	O	C ₆ H ₅	139-140
I-1-B-5	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	O	S	C ₆ H ₅ - CH ₂	144
I-1-B-6	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	O	O	C ₆ H ₅ - CH ₂	137

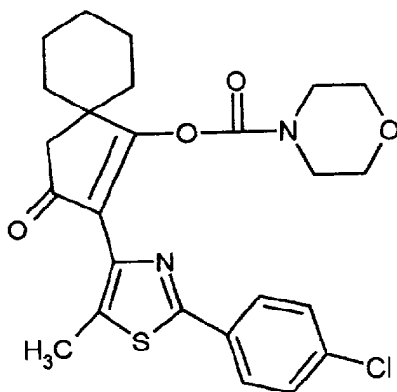
Пример I-1-г-1

0,5 г (1,33 ммоль) соединения согласно примеру (I-1-а-2) в 5 мл безводного дихлорметана подают в реактор, затем добавляют 0,27 мл (2,0 ммоль) триэтиламина. При охлаждении льдом прибавляют 0,135 мл (1,74 ммоль) хлорангидрида метансульфокислоты. Перемешивают при комнатной температуре в течение 2 часов.

Реакционную смесь экстрагируют 10 %-ной лимонной кислотой, водную фазу промывают дихлорметаном. Органическую фазу экстрагируют 1 н. раствором гидроксида натрия, а водную фазу промывают дихлорметаном, сушат и сгущают.

Выход: 0,6 г (100 % теории), точка плавления 134 °С .

¹H-ЯМР (d₆-ДМСО, 400 мгц): δ = 1,02 – 1,75 (м, 10H, цик-гексил-CH₂), 2,30 (с, 3H, тиазолил-CH₃), 3.05 (с, 2H, CH₂-CO), 3,61 (с, 3H, SO₂-CH₃), 7,54 (д, 2H, Ar-H), 7,86 (д, 2H, Ar-H) млн. дол..

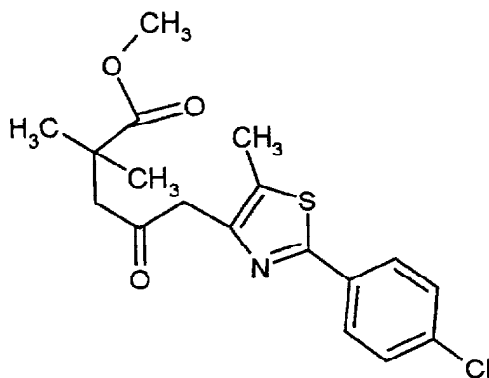
Пример I-1-ж-1

0,5 г (1,33 ммоль) соединения согласно примеру (I-1-а-2) и 0,27 мл (2,0 ммоль) триэтиламино растворяют в 5 мл безводного дихлорметана, при охлаждении льдом прибавляют 0,26 г (1,73 ммоль) хлорангидрида морфолин-н.-карбоновой кислоты. Перемешивают при комнатной температуре в течение 2 ночи.

Реакционную смесь экстрагируют 10 %-ной лимонной кислотой, водную фазу промывают дихлорметаном. Органическую фазу экстрагируют 1 н. раствором гидроксида натрия, водную фазу промывают дихлорметаном, сушат и сгущают.

Выход: 0,69 г (93 % теории), воск.

^1H -ЯМР (d_6 -ДМСО, 400 мгц): δ = 1,02 – 1,74 (м, 10H, цик-гексил- CH_2), 2,30 (с, 3H, тиазолил- CH_3), 3,01 (с, 2H, $\text{CH}_2\text{-CO}$), 3,05 – 3,79 (м, 8H, морфолин- CH_2), 7,54 (д, 2H, Ar-H), 7,85 (д, 2H, Ar-H) млн. дол..

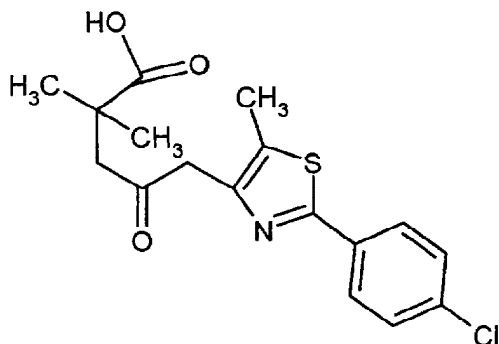
Пример II-1

17,3 г (30 ммоль) соединения согласно примеру XIV-1 в 200 мл безводного ацетона подают в реактор, затем прибавляют 6,8 г (49 ммоль) карбоната калия и 20,5 г (147 ммоль) метилйодида. Перемешивают с обратным холодильником в течение 16 часов.

Раствор фильтруют, растворитель отгоняют, затем очищают путем колоночной хроматографии на силикагеле с применением в качестве элюента смеси дихлорметана и петролейного эфира в соотношении 4 : 1 → дихлорметана → смеси дихлорметана и сложного этилового эфира уксусной кислоты в соотношении 30 : 1 → 10 : 1.

Выход: 3,5 г (31 % теории), масло.

^1H -ЯМР (d_6 -ДМСО, 400 мгц): δ = 1,11 (с, 6H, 2-CH₃-C-алиф.), 2,31 (с, 3H, CH₃-C-гетероаром.), 3,50 (с, 3H, CH₃-O), 7,50 (д, 2H, 2-CH-аром.), 7,84 (д, 2H, 2-CH-аром.) млн. дол..

Пример XIV-1

К раствору 25 мл двухмолярного диизопропиламида лития в 50 мл безводного тетрагидрофурана прикапывают при -15°C раствор 12,7 г (45 ммоль) сложного метилового эфира 4-[2-(4-хлорфенил)-5-метил]-тиазолил-уксусной кислоты в 15 мл тетрагидрофурана, затем перемешивают при 0°C в течение 60 минут.

Затем при -15°C прикапывают раствор 3,8 г (30 ммоль) ангидрида 2,2-диметил-янтарной кислоты в 10 мл безводного тетрагидрофурана.

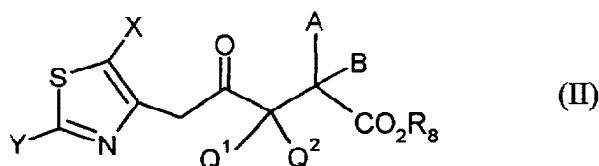
Раствор перемешивают при комнатной температуре в течение двух часов, затем добавляют 75 мл воды и 20 г хлористого аммония, после этого концентрированной соляной кислотой доводят до кислого раствора.

Промежуточный продукт экстрагируют простым эфиром и растворитель отгоняют. Остаток с 25 г гидроокиси калия и 170 мл воды кипятят с обратным холодильником в течение 24 часов.

Затем охлаждают, подкисляют концентрированной соляной кислотой и экстрагируют простым эфиром. Сырой продукт без дальнейшего определения и очистки непосредственно переводят в соединение II-1.

Выход: 17,5 г (100 % теории), масло.

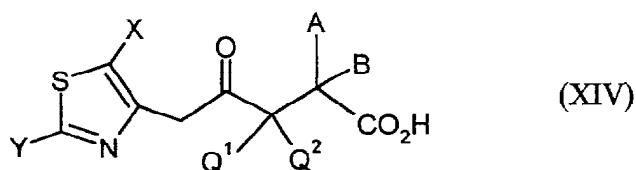
Аналогично примеру (II-1) и согласно общим указаниям по получению получают следующие соединения формулы (II):



При- мер №	X	Y	B	A	Q ¹	Q ²	R ⁸	Точ- ка пл. °C
II-2	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	CH ₃	масло
II-3	C ₂ H ₅	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	CH ₃	масло
II-4	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		H	H	CH ₃	масло
II-5	CH ₃	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	CH ₃	масло
II-6	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₄ -		H	CH ₃	масло
II-7	CH ₃	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	CH ₃	масло
II-8	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄ -O- C ₆ H ₄ .	-(CH ₂) ₅ -		H	H	CH ₃	масло
II-9	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		H	H	CH ₃	масло
II-10	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ - (CH ₂) ₂ -		H	H	CH ₃	масло
II-11	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	C ₆ H ₅ -	H	H	CH ₃	масло
II-12	C ₂ H ₅	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		H	H	CH ₃	масло

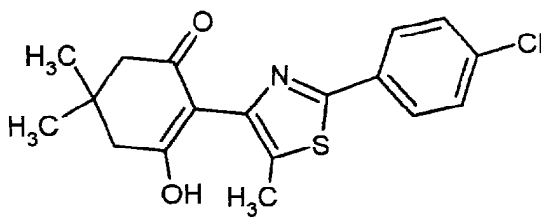
При- мер №	X	Y	B	A	Q ¹	Q ²	R ⁸	Точ- ка пл. °C
5 П-13	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	C ₆ H ₁₁	H	H	CH ₃	масло
П-14	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₂ -CH-C ₃ H ₇ - (CH ₂) ₂ -		H	H	CH ₃	масло
10 П-15	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₂ -CH-t-C ₄ H ₉ - (CH ₂) ₂ -		H	H	CH ₃	масло
П-16	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₂ -CH-C ₂ H ₅ - (CH ₂) ₂ -		H	H	CH ₃	масло
15 П-17	H	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	CH ₃	масло

Аналогично примеру (XIV-1) и согласно общим указаниям по получению полу-
чают следующие соединения формулы (XIV):



При- мер №	X	Y	B	A	Q ¹	Q ²	Точка пл. °C
35 XIV-2	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	воск
XIV-3	C ₂ H ₅	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	воск
40 XIV-4	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		H	H	масло
XIV-5	CH ₃	4-CF ₃ -C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	масло
XIV-6	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	-(CH ₂) ₄ -	H		масло
45 XIV-7	CH ₃	4-CH ₃ -C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	масло
XIV-8	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄ -O- C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	масло
50 XIV-9	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		H	H	масло

	XIV-9	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		H	H	масло
	XIV-10	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		H	H	масло
5	XIV-11	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	C ₆ H ₅ -	H	H	масло
	XIV-12	C ₂ H ₅	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		H	H	масло
	XIV-13	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	C ₆ H ₁₁ -	H	H	масло
10	XIV-14	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₂ -CH-C ₃ H ₇ -(CH ₂) ₂ -		H	H	масло
	XIV-15	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₂ -CH-t-C ₄ H ₉ -(CH ₂) ₂ -		H	H	масло
	XIV-16	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₂ -CH-C ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -		H	H	масло
15	XIV-17	H	4-Cl-C ₆ H ₄	-(CH ₂) ₅ -		H	H	масло

Пример I-2-a-1

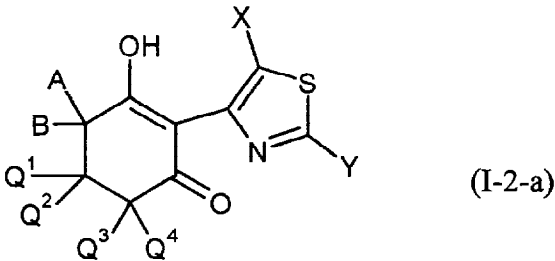
2,16 г (18,1 ммоль) трет.бутилата калия в 20 мл безводного диметилформамида подают в реактор, затем прикапывают 4,6 г (12,1 ммоль) соединения согласно примеру III-1 в 2 мл безводного диметилформамида.

Перемешивают при 50 °С в течение 2 часов.

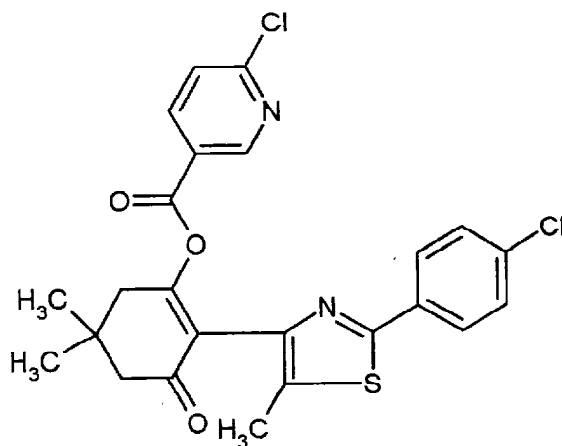
Реакционный раствор подают в 100 мл ледяной воды, затем примешивают к 500 мл холодного раствора 1 н. соляной кислоты. Остаток отсасывают и подают в дихлорметан. После отгонки растворителя остаток очищают путем колоночной хроматографии на силикагеле (с применением в качестве элюента смеси циклогексана и сложного этилового эфира уксусной кислоты в соотношении 5 : 1).

Выход: 1,4 г (13 % теории), точка плавления 165 – 167 °С.

Аналогично примеру (I-2-a-1) и согласно общим указаниям по получению получают следующие соединения формулы (I-2-a):



Пример №	X	Y	A	B	Q ¹	Q ²	Q ³	Q ⁴	Точка пл. °С
I-2-a-2	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	H	H	H	H	H	106
I-2-a-3	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	масло
I-2-a-4	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	H	-(CH ₂) ₄ -		H	H	122
I-2-a-5	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	H	4-Cl-C ₆ H ₄	H	H	H	195-197

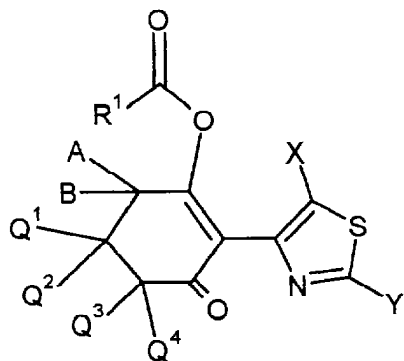
Пример I-2-б-1

К 500 мл (1,44 ммоль) соединения согласно примеру I-2-а-1 в 5 мл безводного дихлорметана добавляют 0,29 мл (2,16 ммоль) триэтиламина. При 0 °С прибавляют 0,33 г (1,87 ммоль) 6-хлорникотинилхлорида, затем перемешивают при комнатной температуре в течение 2 часов.

Реакционную смесь экстрагируют 10 %-ной лимонной кислотой, водную фазу промывают дихлорметаном, органическую фазу экстрагируют 1 н. раствором гидроксида натрия и водную фазу промывают дихлорметаном, затем ее сушат и сгущают.

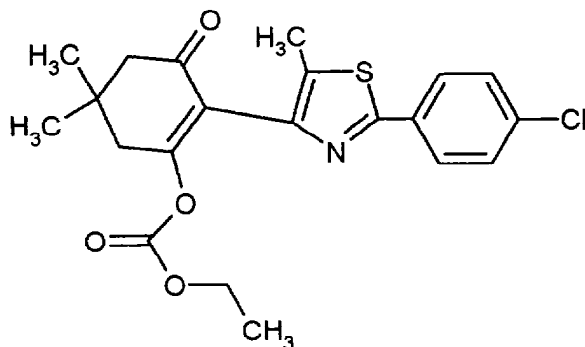
Выход: 0,7 г (100 % теории), точка плавления 127 – 130 °С.

Аналогично примеру (I-2-б-1) и согласно общим указаниям по получению получают следующие соединения формулы (I-2-б):



(I-2-6)

Пример №	X	Y	A	B	Q ¹	Q ²	Q ³	Q ⁴	R ¹	Точка пл. °C
I-2-6-2	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	i-C ₃ H ₇ -	96
I-2-6-3	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H ₅ C ₂ -O-CH ₂ -	142
I-2-6-4	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	4-Cl-C ₆ H ₄	123-125
I-2-6-5	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H		128

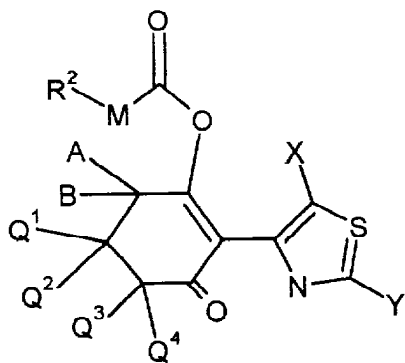
Пример I-2-в-1

К 600 мг (1,7 ммоль) соединения согласно примеру I-2-а-1 в 5 мл безводного дихлорметана добавляют 0,35 мл (2,60 ммоль) триэтиламина. При 0 °С прибавляют 0,255 г (2,21 ммоль) сложного этилового эфира хлормуравьиной кислоты, затем перемешивают при комнатной температуре в течение 2 часов.

Раствор промывают 10 %-ной лимонной кислотой, водную фазу экстрагируют дихлорметаном. Органическую фазу промывают 1 н. раствором гидроокиси натрия, сушат и сгущают.

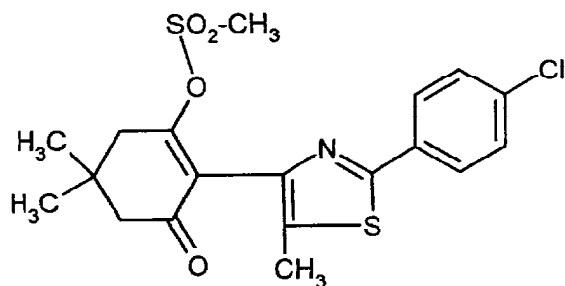
Выход: 0,62 г (87 % теории), точка плавления 82 – 86 °С.

Аналогично примеру (I-2-в-1) и согласно общим указаниям по получению получают следующие соединения формулы (I-2-в):



(I-2-B)

Пример №	X	Y	A	B	Q ¹	Q ²	Q ³	Q ⁴	M	R ²	Точка пл. °C
I-2-в-2	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	O	C ₆ H ₅ -	123-125
I-2-в-3	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	O	C ₆ H ₅ -CH ₂	129-131
I-2-в-4	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	S	C ₆ H ₅ -CH ₂	94

Пример I-2-г-1

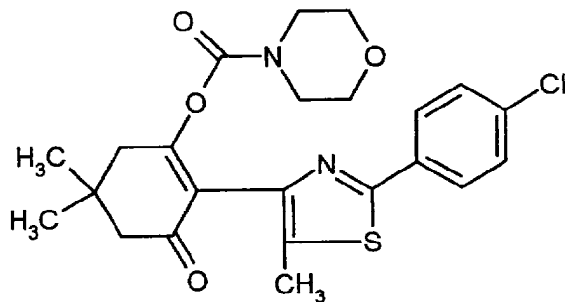
К 500 мг (1,44 ммоль) соединения согласно примеру I-2-а-1 в 5 мл безводного дихлорметана добавляют 0,29 мл (2,16 ммоль) триэтиламина. При 0 °С прибавляют 0,22 г (1,87 ммоль) хлорангидрида метилсульфоновой кислоты, затем перемешивают при комнатной температуре в течение 2 часов.

Раствор экстрагируют 10 %-ной лимонной кислотой, водную фазу промывают дихлорметаном, органическую фазу экстрагируют 1 н. гидроокисью натрия, а водную фазу промывают дихлорметаном, сушат и сгущают.

Выход: 0,65 г (100 % теории), воск.

¹H-ЯМР (d₆-ДМСО, 400 мгц):

δ = 1,17 – 1,74 (с, 6H, цик-гексил-CH₃, 2,25 (с, 3H, тиазолил-CH₃), 2,48 (с, 2H, цик-гексил-CH₂), 2,86 (с, 2H, цик-гексил-CH₂), 3,21 (с, 3H, SO₂-CH₃), 7,52 (д, 2H, Ar-H), 7,83 (д, 2H, Ar-H) млн. дол..

Пример I-2-ж-1

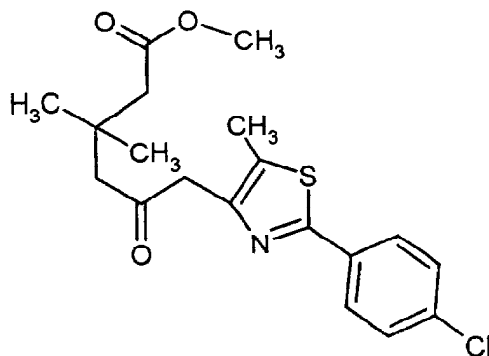
К 500 мг (1,44 ммоль) соединения согласно примеру I-2-а-1 в 5 мл безводного дихлорметана добавляют 0,29 мл (2,16 ммоль) триэтиламина. При 0 °С прибавляют 0,27 г (1,87 ммоль) хлорангидрида морфолинкарбоновой кислоты, перемешивают при комнатной температуре в течение 2 часов.

Реакционную смесь экстрагируют 10 %-ной лимонной кислотой, водную фазу промывают дихлорметаном, органическую фазу экстрагируют 1 н. раствором гидроокиси натрия, а водную фазу промывают дихлорметаном, сушат и сгущают.

Выход: 0,65 г (100 % теории), точка плавления 128 °С

¹H-ЯМР (d₆-ДМСО, 400 мгц):

δ = 1,13 – 1,74 (с, 6Н, цик-гексил-CH₃), 2,21 (с, 3Н, тиазолил-CH₃), 2,46 (с, 2Н, цик-гексил-CH₂), 2,71 (с, 2Н, цик-гексил-CH₂), 3,06 – 3,80 (м, 8Н, морфолин-CH₂), 7,53 (д, 2Н, Ar-H), 7,84 (д, 2Н, Ar-H) млн. дол..

Пример III-1

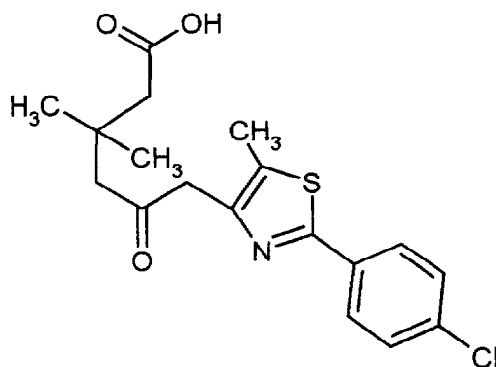
К 17,0 г (30 ммоль) соединения согласно примеру XIV-1 в 200 мл безводного ацетона прибавляют 6,42 г (46,5 ммоль) карбоната калия и 29,5 г (139,5 ммоль) метилйодида. Перемешивают с обратным холодильником в течение 16 часов.

Затем фильтруют и сгущают. Остаток очищают путем колоночной хроматографии на силикагеле с применением в качестве элюента смеси дихлорметана и петролейного эфира в соотношении 4 : 1 → дихлорметана → смеси дихлорметана и сложного этилового эфира уксусной кислоты в соотношении 30 : 1 → 10 : 1.

Выход: 4,6 г (16 % теории), масло.

^1H -ЯМР (d_6 -ДМСО, 400 мгц):

$\delta = 1,03$ (с, 6H, 2-CH₃-C-алиф.), 2,32 (с, 3H, CH₃-C-аром.), 7,50 (д, 2H, 2-CH-Ar-H), 7,81 (д, 2H, Ar-H) млн. дол..

Пример XIX-1

К раствору 25 мл двухмолярного диизопропиламида лития в 50 мл безводного тетрагидрофурана прикапывают при -15°C раствор 12,7 г (45 ммоль) сложного метилового эфира 4-[2-(4-хлорфенил)-5-метил]-тиазолил-уксусной кислоты в 15 мл тетрагидрофурана, затем перемешивают при 0°C в течение 60 минут.

Затем при -15°C прикапывают раствор 4,26 г (30 ммоль) ангидрида 3,3-диметил-глутаровой кислоты в 10 мл тетрагидрофурана.

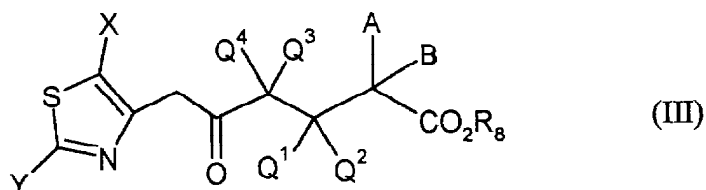
Раствор перемешивают при комнатной температуре в течение двух часов, затем добавляют 75 мл воды и 20 г хлористого аммония, после этого концентрированной соляной кислотой доводят до кислого раствора.

Промежуточный продукт экстрагируют простым эфиром и растворитель отгоняют. Остаток с 25 г гидроокиси калия и 170 мл воды кипятят с обратным холодильником в течение 24 часов.

Затем охлаждают, подкисляют концентрированной соляной кислотой и экстрагируют простым эфиром. Сырой продукт непосредственно без очистки подвергают дальнейшей реакции.

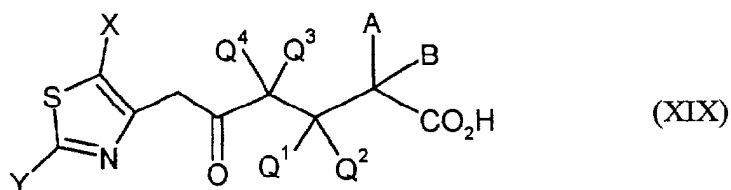
Выход: 17 г (100 % теории), масло.

Аналогично примеру (III-1) и согласно общим указаниям по получению получают следующие соединения формулы (III):



При- мер №	X	Y	A	B	Q ¹	Q ²	Q ³	Q ⁴	R ⁸	Точка пл. °С
III-2	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	H	H	H	H	H	CH ₃	масло
III-3	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	CH ₃	масло
III-4	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	H	-(CH ₂) ₄ -		H	H	CH ₃	масло
III-5	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	H	4-Cl-C ₆ H ₄	H	H	H	CH ₃	масло

Аналогично примеру (XIX-1) и согласно общим указаниям по получению получают следующие соединения формулы (XIX):



При- мер №	X	Y	A	B	Q ¹	Q ²	Q ³	Q ⁴	Точка пл. °C
XIX-2	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	H	H	H	H	H	масло
XIX-3	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	масло
XIX-4	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	H	-(CH ₂) ₄ -		H	H	масло
XIX-5	CH ₃	4-Cl-C ₆ H ₄	H	H	4-Cl-C ₆ H ₄	H	H	H	масло

Примеры применения

5

Пример А

10

Опыт с *Meloidogyne*

15

Растворитель: 30 вес. частей диметилформамида

Эмульгатор: 1 вес. часть простого алкиларилполиглицевого эфира

20

Для получения целесообразного препарата смешивают 1 вес. часть активного вещества или смеси активных веществ с указанными количествами растворителя и эмульгатора и концентрат разбавляют водой до желаемой концентрации.

25

30

Горшки заполняют песком, раствором активного начала, суспензией яиц и личинок *Meloidogyne incognita* и семенами салата. Семена салата всходят и растения развиваются. На корнях развиваются галлы.

35

40

По истечении желаемой времени определяют степень нематцидного действия в %. При этом степень действия, равная 100 %, означает, что галлов не было найдено, 0 % означает, что число галлов у обработанных растений соответствует числу у необработанного контрольного растения).

45

50

При этом опыте, например, следующие соединения примеров получения проявляют хорошую активность:

5

10

Активные начала	Концентрация активных начал в млн.дол.	Степень умерщвления в % по истечении 14 дней
Пример I-1-в-3	20	100
Пример I-1-а-1	20	95

15

20

25

30

35

40

45

50

Пример Б

5

Опыт с Myzus (системное действие)

10

Растворитель: 7 вес. частей диметилформамида

Эмульгатор: 2 вес. части простого алкиларилполиглицевого эфира

15

20

Для получения целесообразного препарата смешивают 1 вес. часть активного вещества или смеси активных веществ с указанными количествами растворителя и эмульгатора и концентрат разбавляют содержащей эмульгатор водой до желаемой концентрации.

25

30

На почву с растениями капусты савойской (*Brassica oleracea*), сильно пораженными тлю табачной (*Myzus persicae*), наливают по 10 мл препарата активного вещества так, что препарат проникает в почву без смачивания побега растения. Активное вещество воспринимается корнями и подается дальше в побег.

35

40

По истечении желаемой времени определяют степень умерщвления в %. При этом степень действия, равная 100 %, означает, что умерщвлены все зли; 0 % означает, что умерщвления злей не наблюдается.

45

50

При этом опыте, например, следующие соединения примеров получения проявляют хорошую активность:

5

10

Активные начала	Концентрация активных начал в млн.дол.	Степень умерщвления в % по истечении 10 дней
Пример I-1-в-2	20	95

15

20

25

30

35

40

45

50

Пример В

5

Опыт с личинками *Phaedon*

10

Растворитель: 7 вес. частей диметилформамида

Эмульгатор: 2 вес. части простого алкиларилполигликолевого эфира

15

20

Для получения целесообразного препарата смешивают 1 вес. часть активного вещества или смеси активных веществ с указанными количествами растворителя и эмульгатора и концентрат разбавляют содержащей эмульгатор водой до желаемой концентрации.

25

30

Листья капусты (*Brassica oleracea*) обрабатывают путем погружения в препарат активного вещества желаемой концентрации, затем на листья еще до их высыхания помещают личинок листоеда хренового (*Phaedon cochleariae*).

35

40

По истечении желаемой времени определяют степень умерщвления в %. При этом степень умерщвления, равная 100 %, означает, что все личинки умерщвлены; 0 % означает, что умерщвления личинок не наблюдается.

45

При этом опыте, например, следующие соединения примеров получения проявляют хорошую активность:

50

Активные начала	Концентрация активных начал в млн.дол.	Степень умерщвления в % по истечении 7 дней
Пример I-1-в-1	500	100
Пример I-2-в-1	500	100

5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

Пример Г

5

Опыт с *Spodoptera frugiperda*

10

Растворитель: 7 вес. частей диметилформамида

Эмульгатор: 2 вес. части простого алкиларилполигликолевого эфира

15

Для получения целесообразного препарата смешивают 1 вес. часть активного вещества или смеси активных веществ с указанными количествами растворителя и эмульгатора и концентрат разбавляют содержащей эмульгатор водой до желаемой концентрации.

25

Листья капусты (*Brassica oleracea*) обрабатывают путем погружения в препарат активного вещества желаемой концентрации, затем на листья еще до их высыхания помещают гусеницы (*Spodoptera frugiperda*).

30

35

По истечении желаемой времени определяют степень умерщвления в %. При этом степень умерщвления, равная 100 %, означает, что все гусеницы умерщвлены; 0 % означает, что умерщвления гусениц не наблюдается.

40

45

При этом опыте, например, следующие соединения примеров получения проявляют хорошую активность:

50

Активные начала	Концентрация активных начал в млн.дол.	Степень умерщвления в % по истечении 7 дней
Пример I-1-а-2	500	100
Пример I-2-а-1	500	100
Пример I-1-в-1	500	100
Пример I-2-в-1	500	100

Пример Д

5

Опыт с *Tetranychus* (устойчивы к ОР / обработка погружением)

10

Растворитель: 30 вес. частей диметилформамида

Эмульгатор: 1 вес. часть простого алкиларилполиглицевого эфира

15

20

Для получения целесообразного препарата смешивают 1 вес. часть активного вещества или смеси активных веществ с указанными количествами растворителя и эмульгатора и концентрат разбавляют содержащей эмульгатор водой до желаемой концентрации.

25

30

Растения фасоли (*Phaseolus vulgaris*), сильно пораженные всеми стадиями развития клеща паутинного (*Tetranychus urticae*), погружают в препарат активного вещества желаемой концентрации.

35

40

По истечении желаемой времени определяют степень умерщвления в %. При этом степень умерщвления, равная 100 %, означает, что все клещи паутинные умерщвлены; 0 % означает, что умерщвления клещей не наблюдается.

45

При этом опыте, например, следующие соединения примеров получения проявляют хорошую активность:

50

Активные начала	Концентрация активных начал в млн.дол.	Степень умерщвления в % по истечении 7 дней
Пример I-1-в-3	100	98
Пример I-1-а-1	100	100
Пример I-2-а-2	100	99
Пример I-2-а-1	100	98
Пример I-1-в-2	100	95
Пример I-2-в-1	100	100

Пример Е1**Послевсходовой опыт**

Растворитель: 5 вес. частей ацетона

Эмульгатор: 1 вес. часть простого алкиларилполиглицолевого эфира

Для получения целесообразного препарата смешивают 1 вес. часть активного начала с указанным количеством растворителя, добавляют указанное количество эмульгатора и концентрат разбавляют водой до желаемой концентрации.

Растения, достигшие высоту от 5 до 15 см, опрыскивают препаратом так, что наносится желаемое количество активного начала на единицу поверхности. При этом концентрацию жидкости для опрыскивания выбирают так, что каждое желаемое количество активного вещества применяют в 1000 л воды/га.

По истечении трех недель определяют степень повреждения в % по сравнению с развитием необработанного контрольного растения. При этом

0 % = действия не наблюдается (соответствует степени действия у необработанного контрольного растения)

100 % = полное уничтожение

Пример Е2**Довсходовой опыт**

Растворитель: 5 вес. частей ацетона

Эмульгатор: 1 вес. часть простого алкиларилполигликолевого эфира

Для получения целесообразного препарата смешивают 1 вес. часть активного начала с указанным количеством растворителя, добавляют указанное количество эмульгатора и концентрат разбавляют водой до желаемой концентрации.

Семена контрольных растений высевают в нормальную почву. По истечении 24 часов почву опрыскивают препаратом так, что применяется равномерное количество активного начала на единицу поверхности. При этом концентрацию жидкости для опрыскивания выбирают так, что каждое желаемое количество активного вещества применяют в 1000 л воды/га.

По истечении трех недель определяют степень повреждения в % по сравнению с развитием необработанного контрольного растения. При этом

0 % = действия не наблюдается (соответствует степени действия у необработанного контрольного растения)

100 % = полное уничтожение

Послевсходовой опыт / теплица	Концен- трация активного вещества в г/га	Alopecurus	Avena fatua	Setaria	Sinapis
I-1-a-2	250	90	100	100	80
I-1-a-3	250	90	100	100	80
I-1-b-3	250	100	100	100	80
I-1-a-1	250	100	100	100	70

Послевсходовой опыт / теплица	Концен- трация активног о вещества в г/га	свекло	Alopecurus	Avena fatua	Echinochloa	Setaria
I-2-a-1	250	0	90	95	100	100

Послевсходовой опыт / теплица	Концен- трация активног о вещества в г/га	свекло	Avena fatua	Echinochloa	Setaria	Sinapis
I-1-b-1	250	0	90	100	100	70

Послевсходовой Опыт / теплица	Концен- трация активног о вещества в г/га	Alopecurus	Avena fatua	Setaria	Galium
I-2-b-1	250	90	100	100	80

Довсходовой Опыт / теплица	Концен- трация активног о вещества в г/га	пшени- ца	Soja	Digitari a	Lolium	Setaria	Matricaria
I-1-a-2	60	0	0	100	100	100	95

Довсходовой Опыт / теплица	Концен- трация активног о вещества в г/га	свекло	Alopecurus	Avena fatua	Digitaria	Polygonum
I-1-a-3	125	0	95	100	100	100

Довсходовой Опыт / теплица	Концен- трация активног о вещества в г/га	рапс	Alopecurus	Digitaria	Lolium	Stellaria
I-1-b-2	125	0	95	100	100	100

Довсходовой Опыт / теплица	Концен- трация активног о вещества в г/га	пшени- ца	Soja	Alope- curus	Lolium	Setaria	Stellaria
I-1-b-3	125	10	0	95	100	100	70

Довсходовой Опыт / теплица	Концен- трация активног о вещества в г/га	соя	Lolium	Setaria	Matricaria	Stellaria
I-1-a-1	125	0	100	100	100	100

Довсходовой Опыт / теплица	Концен- трация активног о вещества в г/га	соя	Bromus	Lolium	Setaria	Abutilon
I-2-a-1	125	0	95	100	100	70

Пример Ж

Опыт *in vitro* для определения ЭД₅₀ у микроорганизмов

5

В углубления микротитровальных пластинок пипетируют смешанный с эмульгатором PS16 метанольный раствор испытуемого активного начала. После испарения растворителя в полости добавляют по 200 μ л среды картофельной декстрозы.

10

15

Ещё до этого к среде прибавляют пригодную концентрацию спор или мицелиев контролируемого грибка.

20

В результате концентрации активного начала составляют 0,1, 1, 10 и 100 млн.дол., а концентрация эмульгатора составляет 300 млн.дол..

25

30

После этого пластинки инкубируют на вибрационной основе при 22 °С в течение 3 – 5 дней, пока не наблюдается в необработанной контрольной среде достаточный рост.

35

40

Оценка осуществляется фотометрическим путем при длине волны 620 нм. Из данных измерения различных концентраций рассчитают дозу активного начала, которая приводит к 50 %-ному торможению роста грибков по сравнению с необработанной контрольной средой (ЭД₅₀).

45

50

Активное начало	Микроорганизм	Значение ЭД ₅₀
Пример I-1-a-2	Pyricularia oryzae	< 0,1
	Septoria tritici	< 0,1
	Ustilago avenae	< 0,1
Пример I-2-a-2	Pyricularia oryzae	1,96
	Septoria tritici	< 0,1
	Ustilago avenae	< 0,1
Пример I-2-a-3	Pyricularia oryzae	< 0,1
	Septoria tritici	< 0,1
	Ustilago avenae	0,1

Пример 3

5 Опыт с *Sphaerotheca* (огурец) / защитное действие

10 Растворитель: 24,5 вес. частей ацетона

24,5 вес. частей диметилацетамида

15 Эмульгатор: 1 вес. часть простого алкиларилполигликолевого эфира

20 Для получения целесообразного препарата смешивают 1 вес. часть активного
вещества с указанными количествами растворителя и эмульгатора и концентрат
25 разбавляют водой до желаемой концентрации.

30 Для испытания защитного действия молодые растения опрыскивают препаратом
активного вещества, при этом активное вещество применяют в нижеуказанном
количестве. После присыхания препарата растения инокулируют водной
35 суспензией спор *Sphaerotheca fuliginea*. После этого растения помещают в
теплице при температуре около 23°C и относительной влажности воздуха около
40 70 %.

45 7 дней после инокуляции проводят оценку. При этом 0 % означает степень дей-
ствия, которая соответствует степени действия, достигаемой в контрольном опы-
те, в то время как степень действия, равная 100 %, означает, что поражения не
50 наблюдается.

Активное начало	Применяемое количество активного начала в г/га	Степень действия в %
Пример I-1-a-2	100	100

5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

Пример И

5 Опыт с *Venturia* (яблоко) / защитное действие

10 Растворитель: 24,5 вес. частей ацетона

24,5 вес. частей диметилацетамида

15 Эмульгатор: 1 вес. часть простого алкиларилполиглицевого эфира

20 Для получения целесообразного препарата смешивают 1 вес. часть активного вещества с указанными количествами растворителя и эмульгатора и концентрат разбавляют водой до желаемой концентрации.

25

30 Для испытания защитного действия молодые растения опрыскивают препаратом активного вещества, при этом активное вещество применяют в нижеуказанном количестве. После присыхания препарата растения инокулируют водной суспензией конидий возбудителя яблочного струпа *Venturia inaequalis*, после чего их помещают в инкубационной камере при температуре около 20 °C и относительной

35 влажности воздуха 100 % в течение 24 часов.

40

После этого растения помещают в теплице при температуре около 21°C и относительной

45 влажности воздуха около 90 %.

50 10 дней после инокуляции проводят оценку. При этом 0 % означает степень действия, которая соответствует степени действия, достигаемой в контрольном опы-

те, в то время как степень действия, равная 100 %, означает, что поражения не наблюдается.

5

10

Активное начало	Применяемое количество активного начала в г/га	Степень действия в %
Пример I-1-a-2	100	91

15

20

25

30

35

40

45

50

Пример Й

5

Опыт с *Alternaria* (помидор) / защитное действие

10

Растворитель: 24,5 вес. частей ацетона

24,5 вес. частей диметилацетамида

15

Эмульгатор: 1 вес. часть простого алкиларилполиглицевого эфира

20

Для получения целесообразного препарата смешивают 1 вес. часть активного вещества с указанными количествами растворителя и эмульгатора и концентрат разбавляют водой до желаемой концентрации

25

30

Для испытания защитного действия молодые растения опрыскивают препаратом активного вещества, при этом препарат применяют в указанном количестве.

35

После присыхания препарата растения инокулируют водной суспензией спор *Alternaria solani*. Затем растения помещают в инкубационной камере при температуре около 20 °C и относительной влажности воздуха около 100 %.

40

3 дня после инокуляции проводят оценку. При этом 0 % означает степень действия, которая соответствует степени действия, достигаемой в контрольном опыте, в то время как степень действия, равная 100 %, означает, что поражения не наблюдается.

50

Активное начало	Применяемое количество активного начала в г/га	Степень действия в %
Пример I-1-a-2	100	93

Пример К

5 Опыт с *Botrytis* (боба) / защитное действие

10 Растворитель: 24,5 вес. частей ацетона
24,5 вес. частей диметилацетамида

15 Эмульгатор: 1 вес. часть простого алкиларилполиглицолевого эфира

20 Для получения целесообразного препарата смешивают 1 вес. часть активного вещества с указанными количествами растворителя и эмульгатора и концентрат разбавляют водой до желаемой концентрации.

25

Для испытания защитного действия молодые растения опрыскивают препаратом
30 активного вещества, при этом препарат применяют в указанном количестве. После присыхания препарата на каждый лист растения насаживают по 2 маленьких
35 обращенных *Botrytis cinerea* агаровых кусков. Затем инокулированные растения помещают в затемненной камере при температуре около 20 °C и относительной
влажности воздуха 100 %.

40

2 дня после инокуляции проводят оценку размера пятен поражения на листьях.
45 При этом 0 % означает степень действия, которая соответствует степени действия, достигаемой в контрольном опыте, в то время как степень действия, равная 100 %, означает, что поражения не наблюдается.

50

Активное начало	Применяемое количество активного начала в г/га	Степень действия в %
Пример I-1-a-2	500	92

Пример Л

5 Опыт по отношению к предельной концентрации / почвенные насекомые – обработка трансгенных растений

10 Контрольное насекомое: *Diabrotica balteata* - личинки в почве

Растворитель: 7 вес. частей ацетона

15 Эмульгатор: 1 вес. часть простого алкиларилполиглицевого эфира

20 Для получения целесообразного препарата смешивают 1 вес. часть активного вещества с указанными количествами растворителя, добавляют указанное количество эмульгатора и разбавляют концентрат водой до желаемой концентрации.

30 Препарат активного вещества наливают на почву. При этом концентрация активного начала в препарате практически не играет никакой роли, решающее значение имеет исключительно весовое количество активного начала на объемную единицу почвы, которое указывается в ч/мил (мг/л). Почву заполняют в горшки емкостью 0,25 л, которые дают стоять при температуре около 20 °C.

40 Затем в каждый горшок помещают по 5 пророщенных кукурузных зерна сорта YIELD GUARD (товарный знак фирмы Монсанто комп., США). 2 дня спустя в обработанную почву помещают соответствующих контрольных насекомых. По истечении дальнейших 7 дней определяют степень активности, которая рассчитывается из числа проросших кукурузных растений (1 растение = 20 % действия).

Пример М

5

Опыт с *Heliothis virescens* – обработка трансгенных растений

10

Растворитель: 7 вес. частей ацетона

Эмульгатор: 1 вес. часть простого алкиларилполигликолевого эфира

15

Для получения целесообразного препарата смешивают 1 вес. часть активного вещества с указанными количествами растворителя, добавляют указанное количество эмульгатора и разбавляют концентрат водой до желаемой концентрации.

25

Побеги сои (*Glycine max*) сорта Roundup Ready (товарный знак фирмы Монсанто комп., США) обрабатывают путем погружения в препарат активного начала желаемой концентрации, затем на листья еще до их высыхания помещают гусеницы *Heliothis virescens*.

35

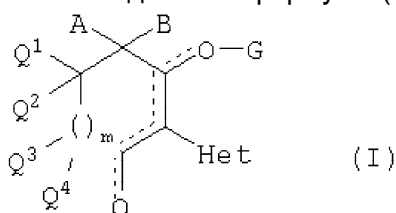
По истечении желаемого времени определяют степень умерщвления насекомых.

Формула изобретения

40

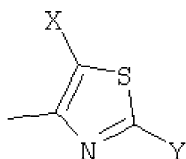
1. Соединения формулы (I)

45



где Het означает группу

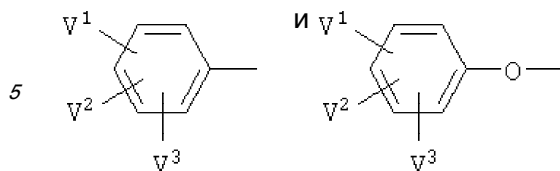
50



m означает числа 0 или 1,

X означает водород или алкил с 1-6 атомами углерода,

Y означает группы



V¹ означает галоген, алкил с 1-12 атомами углерода или галогеналкил с 1-4 атомами углерода,

V² и V³ означают водород,

V¹ и V² означают вместе с атомом углерода, с которым они связаны, незамещенный или замещенный алкилом с 1-4 атомами углерода или галогеном 5- или 6-членный цикл, в котором, при необходимости, один до двух атомов углерода могут быть заменены кислородом, серой или азотом,

A означает водород, незамещенные алкил с 1-12 атомами углерода, циклоалкил с 3-8 атомами углерода или арил,

B означает водород или алкил с 1-6 атомами углерода, A, B и атом углерода, с которым они связаны, означают насыщенный циклоалкил с 3-10 атомами углерода, в котором, при необходимости, одно кольцевое звено заменено кислородом,

A и Q¹ вместе означают незамещенный алкандиол с 3-6 атомами углерода, в котором два атома углерода, не находящиеся в непосредственном соседстве друг к другу, образуют, при необходимости, дальнейший незамещенный цикл,

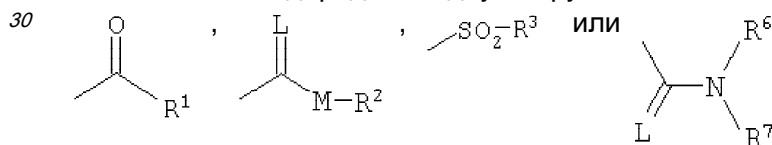
Q¹ означает водород, алкил с 1-6 атомами углерода или фенил, замещенный галогеном,

Q² означает водород или алкил с 1-4 атомами углерода,

Q³, Q⁴ означают водород,

Q¹ и Q² означают вместе с атомом углерода, с которым они связаны, означают циклоалкил,

G означает водород или одну из групп



где L означает кислород,

M означает кислород или серу,

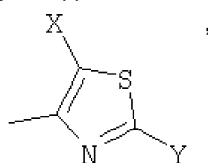
R¹ означает незамещенные алкил с 1-20 атомами углерода, или алкоксиалкил с 1-8 атомами углерода в алкоксильной части и 1-8 атомами углерода в алкильной части, или незамещенный или замещенный галогеном циклоалкил с 3-8 атомами углерода, или замещенные галогеном фенил или гетарил,

R² означает незамещенный алкил с 1-20 атомами углерода, фенил или бензил,

R³ означает незамещенный алкил с 1-8 атомами углерода, R⁶ и R⁷ означают вместе с атомом азота, с которым они связаны, незамещенный алкиленовый радикал с 3-6 атомами углерода, в котором, при необходимости, один атом углерода заменен кислородом.

2. Соединения формулы (I) по п.1, в которой

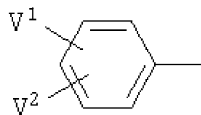
Het означает группу



m означает числа 0 или 1,

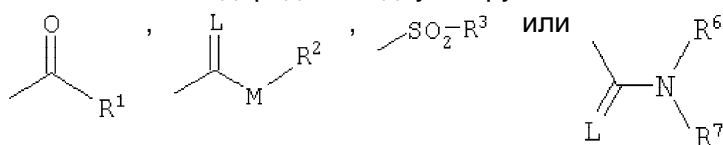
X означает водород или алкил с 1-4 атомами углерода,

Y означает группу



- 5 V^1 означает фтор, хлор, алкил с 1-6 атомами углерода, или галогеналкил с 1-2 атомами углерода,
 V^2 означает водород,
 V^1 и V^2 вместе с атомом углерода, с которым они связаны, означают незамещенный или
замещенный фтором или метилом 5- или 6-членный цикл, в котором, при необходимости,
10 один или два атома углерода могут быть заменены кислородом,
А означает водород, незамещенные алкил с 1-8 атомами углерода, циклоалкил с 5-6 атомами углерода или фенил,
В означает водород или алкил с 1-4 атомами углерода,
А, В и атом углерода, с которым они связаны, означают насыщенный циклоалкил с 5-6
15 атомами углерода, в котором, при необходимости, одно кольцевое звено заменено кислородом, при условии, что в этом случае Q^1 означает лишь водород или алкил с 1-4 атомами углерода,
А и Q^1 вместе означают алкандиол с 3-4 атомами углерода,
 Q^1 означает водород, алкил с 1-4 атомами углерода или замещенный галогеном фенил,
20 Q^2 означает водород, метил или этил,
 Q^3 и Q^4 означают водород,
 Q^1 и Q^2 означают вместе с атомом углерода, с которым они связаны, циклоалкил с 3-7 атомами углерода,

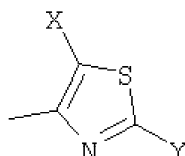
- 25 G означает водород или одну из групп



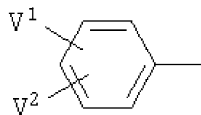
- 30 где L означает кислород,
M означает кислород или серу,
 R^1 означает незамещенные алкил с 1-16 атомами углерода, алкоксиалкил с 1-4 атомами углерода в алкоксильной части и 1-2 атомами углерода в алкильной части, незамещенный
или одно- до двухкратно замещенный фтором, хлором, циклоалкил с 3-6 атомами углерода,
35 фенил, одно- до двухкратно замещенный остатками из группы, включающей фтор, хлор, бром, пиридил или тиенил, однократно замещенные остатками из группы, включающей фтор, хлор, бром,
 R^2 означает незамещенный алкил с 1-16 атомами углерода, фенил или бензил,
 R^3 означает незамещенный алкил с 1-4 атомами углерода,
40 R^6 и R^7 означают вместе с атомом азота, с которым они связаны, незамещенный алкиленовый радикал с 5-6 атомами углерода, в котором, при необходимости, одна метиленовая группа заменена кислородом.

3. Соединения формулы (I) по п.1, в которой

- 45 Het означает группу



- 50 m означает числа 0 или 1,
X означает водород, метил, этил, н.-пропил или изопропил,
Y означает группу



5 V^1 означает водород, фтор, хлор, бром, метил, этил, н.-пропил, изопропил, н.-бутил, изобутил, трет.бутил или трифторметил,

V^2 означает водород,

A означает водород, метил, этил, н.-пропил, изопропил, н.-бутил, изобутил, третбутил, фенил или циклогексил,

10 B означает водород, метил или этил,

A, B и атом углерода, с которым они связаны, означают насыщенный циклоалкил с 5-6 атомами углерода, в котором, при необходимости, одно кольцевое звено заменено кислородом, при условии, что в этом случае Q^1 означает лишь водород,

A и Q^1 вместе означают незамещенный алкандиол с 3-4 атомами углерода,

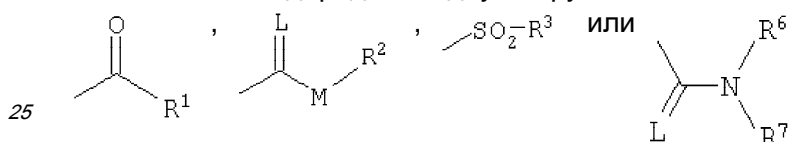
15 Q^1 означает водород, метил, этил, н.-пропил, изопропил или 4-хлорфенил,

Q^2 означает водород, метил или этил,

Q^3 и Q^4 означают водород,

20 Q^1 и Q^2 означают вместе с атомом углерода, с которым они связаны, насыщенный циклоалкил с 5-6 атомами углерода, при условии, что в этом случае A означает лишь водород,

G означает водород или одну из групп



где L означает кислород, и

M означает кислород или серу,

30 R^1 означает незамещенные алкил с 1-8 атомами углерода, алкоксиалкил с 1-2 атомами углерода в алкоксильной части и 1-2 атомами углерода в алкильной части, циклопропил или циклогексил, незамещенные или однократно замещенные остатками из группы, включающей фтор, хлор, фенил, однократно замещенный остатком из группы, включающей фтор, хлор, бром, тиенил или пиридил, однократно замещенные остатками из группы, включающей фтор, хлор и бром,

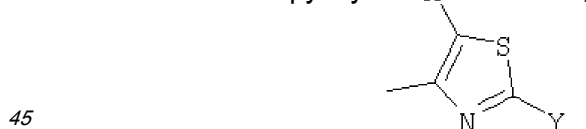
35 R^2 означает алкил с 1-8 атомами углерода, фенил или бензил,

R^3 означает метил или этил,

R^6 и R^7 означают вместе с атомом азота, с которым они связаны, алкиленовый радикал с 5 атомами углерода, в котором, при необходимости, одна метиленовая группа заменена кислородом.

40 4. Соединения формулы (I) по п.1, в которой

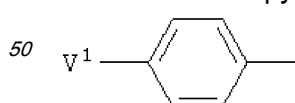
Het означает группу



m означает числа 0 или 1,

X означает водород, метил или этил,

Y означает группу



V^1 означает водород, хлор, метил, этил, н.-пропил, изопропил, н.-бутил, изобутил,

третбутил, трифторметил,

А означает водород, метил, этил, н.-пропил, изопропил, н.-бутил, изобутил, фенил или циклогексил,

В означает водород, метил или этил,

5 А, В и атом углерода, с которым они связаны, означают насыщенный циклоалкил с 5-6 атомами углерода, в котором, при необходимости, одно кольцевое звено заменено кислородом, при условии, что в этом случае Q^1 означает лишь водород,

А и Q^1 вместе означают алкандиол с 3-4 атомами углерода,

10 Q^1 означает водород, метил, этил, н.-пропил, изопропил или 4-хлорфенил,

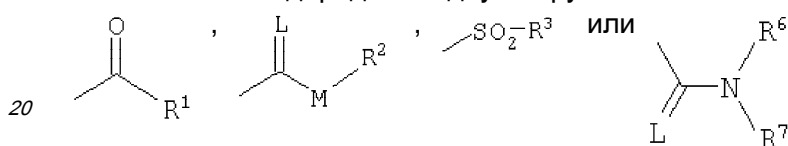
Q^2 означает водород, метил или этил,

Q^3 означает водород,

Q^4 означает водород,

15 Q^1 и Q^2 означают вместе с атомом углерода, с которым они связаны, насыщенный циклоалкил с 5-6 атомами углерода, при условии, что в этом случае А означает лишь водород,

Г означает водород или одну из групп



где L означает кислород, и

M означает кислород или серу,

25 R^1 означает алкил с 1-8 атомами углерода, алкоксиалкил с 1-2 атомами углерода в алкоксильной части и 1-2 атомами углерода в алкильной части, или незамещенный или однократно замещенный хлором циклопропил, однократно замещенный хлором фенил или однократно замещенный хлором пиридил,

R^2 означает алкил с 1-8 атомами углерода, фенил или бензил,

30 R^3 означает метил или этил,

R^6 и R^7 означают вместе с атомом азота, с которым они связаны, алкиленовый радикал с 5 атомами углерода, в котором, при необходимости, одна метиленовая группа заменена кислородом.