



УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **123249** (13) **C2**
(51) МПК (2021.01)**C07D 471/04** (2006.01)**A01N 43/90** (2006.01)

A01P 5/00

A01P 7/02 (2006.01)

A01P 7/04 (2006.01)

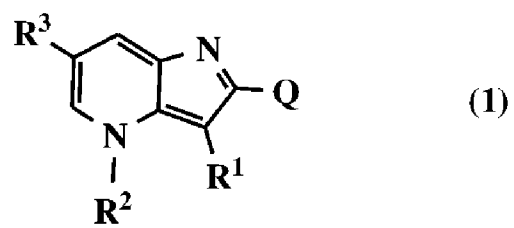
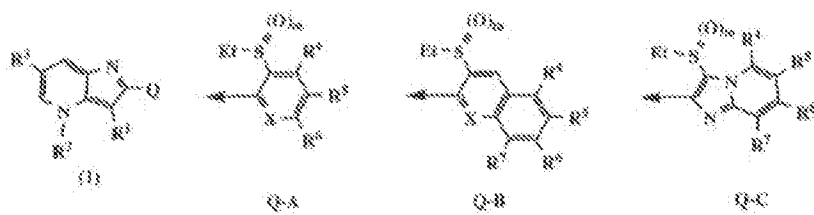
C07D 519/00НАЦІОНАЛЬНИЙ ОРГАН
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
ДЕРЖАВНЕ ПІДПРИЄМСТВО
"УКРАЇНСЬКИЙ ІНСТИТУТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ"**(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД**

(21) Номер заявки: а 2019 08516	(72) Винахідник(и): Йонемура Іккі (JP), Сано Юсуке (JP), Сімідзу Наото (JP), Міясака Акіхіро (JP), Сува Акіюкі (JP), Фудзіє Сунпей (JP), Танака Ріосукі (JP)
(22) Дата подання заявки: 26.12.2017	(73) Володілець (володільці): НІХОН НОХІЯКУ КО., ЛТД., 19-8, Kyobashi 1-chome, Chuo-ku, Tokyo 1048386, Japan (JP)
(24) Дата, з якої є чинними права інтелектуальної власності: 04.03.2021	(74) Представник: Кузьменко Сергій Юрійович, реєстр. №283
(31) Номер попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції: 2016-253629	(56) Перелік документів, взятих до уваги експертизою: WO 2014157600, A1, 02.10.2014 WO 2013018928, A1, 07.02.2013 EP 2 975 039, A1, 20.01.2016 WO 2013150115, A1, 10.10.2013 WO 1994029307, A1, 22.12.1994
(32) Дата подання попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції: 27.12.2016	
(33) Код держави-учасниці Паризької конвенції, до якої подано попередню заявку: JP	
(41) Публікація відомостей про заявку: 25.09.2019, Бюл.№ 18	
(46) Публікація відомостей про державну реєстрацію: 03.03.2021, Бюл.№ 9	
(86) Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору РСТ: РСТ/JP2017/046771, 26.12.2017	

(54) СПОЛУКА 4Н-ПІРОЛОПІРИДИНУ АБО ЇЇ СІЛЬ, СІЛЬСЬКОГОСПОДАРСЬКИЙ І САДІВНИЦЬКИЙ ІНСЕКТИЦИД, ЯКИЙ ВКЛЮЧАЄ ЗАЗНАЧЕНУ СПОЛУКУ АБО ЇЇ СІЛЬ, І СПОСІБ ЗАСТОСУВАННЯ ІНСЕКТИЦИДУ**(57) Реферат:**

Винахід стосується сільськогосподарського і садівницького інсектициду, який включає сполуку 4Н-піролопіридину, представлену загальною формулою (1), де R¹ являє собою атом галогену, кожний R² і R³ являє собою галогеналкільну групу, Q являє собою Q-A, Q-B або Q-C, X являє собою атом азоту, R⁴ і R⁷ кожний являє собою атом водню, кожний R² і R³ являє собою атом водню, галогеналкільну групу або заміщену фенільну групу, і m дорівнює 2, або її сіль як активний інгредієнт; і способу застосування зазначеного інсектициду.

UA 123249 C2



ГАЛУЗЬ ТЕХНІКИ, ДО ЯКОЇ НАЛЕЖИТЬ ВІНАХІД

[0001]

Даний винахід стосується визначеного виду сполуки 4Н-піролопіридину або її солі, сільськогосподарського і садівницького інсектициду, який містить зазначену сполуку або її сіль як активний інгредієнт, і способу застосування зазначеного інсектициду.

РІВЕНЬ ТЕХНІКИ

[0002]

Різні сполуки були досліджені на їх потенціал як сільськогосподарських і садівницьких інсектицидів, і повідомлялося, що серед них визначені види конденсованих гетероциклічних сполук можуть використовуватися як інсектициди (наприклад, див. Патентну літературу 1-7). Однак у літературі не розкрита яка-небудь конденсована гетероциклічна сполука, яка містить 4Н-піролопіридинове кільце.

СПИСОК ЦИТОВАНОЇ ЛІТЕРАТУРИ

Патентна література:

[0003]

Патентний документ 1: JP-A 2009-280574;

Патентний документ 2: JP-A 2010-275301;

Патентний документ 3: JP-A 2011-79774;

Патентний документ 4: JP-A 2012-131780;

Патентний документ 5: WO 2012/086848;

Патентний документ 6: WO 2013/018928;

Патентний документ 7: WO 2014/157600.

СУТЬ ВІНАХОДУ

ТЕХНІЧНА ЗАДАЧА

[0004]

Збиток, що завдається комахами-шкідниками і т. д. у рослинництві в галузі сільського господарства, садівництва і т. п., як і раніше величезний, і всезростаючою проблемою є поява комах-шкідників, резистентних до існуючих інсектицидів. Крім того, захист навколишнього середовища є глобальною проблемою, яка повинна вирішуватися у всіх галузях, включаючи сільське господарство і садівництво. Тому необхідна розробка нових сполук як сільськогосподарських і садівницьких інсектицидів, які не виявляють значного впливу на навколишнє середовище.

ВІРІШЕННЯ ЗАДАЧІ

[0005]

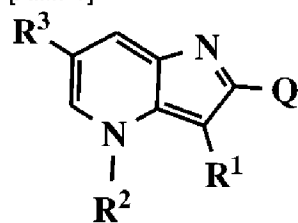
Автори даного винаходу провели великі дослідження для вирішення описаних вище проблем. У результаті автори даного винаходу виявили, що сполука 4Н-піролопіридину, представлена загальною формулою (1), і її сіль є високоефективними для контролю сільськогосподарських і садових шкідників і впливають на навколишнє середовище. На основі цього відкриття автори даного винаходу завершили даний винахід.

[0006]

Тобто даний винахід включає в себе наступні об'єкти.

[1] Сполука 4Н-піролопіридину, представлена загальною формулою (1):

[Хім. 1]



, (1)

де R¹ являє собою

(a1) атом водню;

(a2) атом галогену;

(a3) ціаногрупу;

(a4) (C₁-C₆)-алкільну групу;

(a5) (C₁-C₆)-алкоксигрупу;

(a6) (C₁-C₆)-алкілкарбонільну групу; або

(a7) (C₁-C₆)-алкоксикарбонільну групу;

R² являє собою

(b1) (C₁-C₆)-алкільну групу;

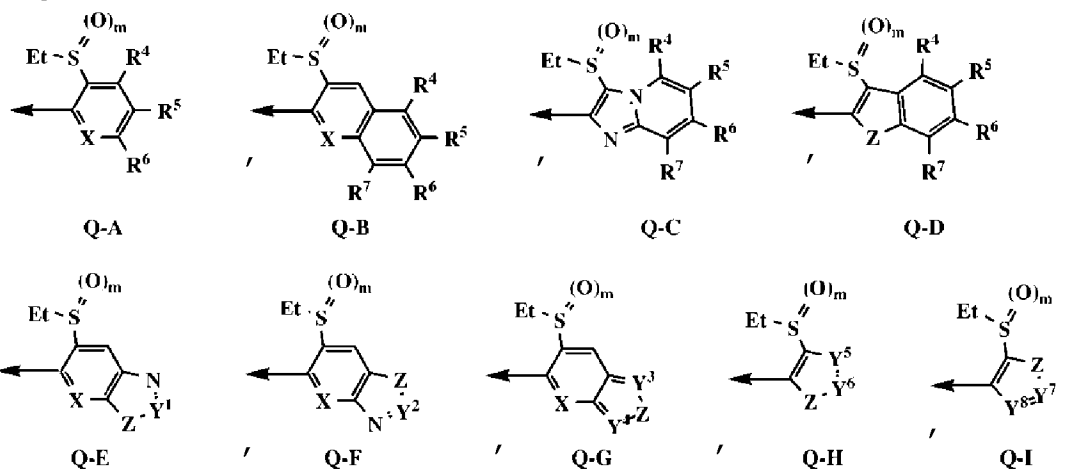
- (b2) ціано-(C₁-C₆)-алкільну групу;
 (b3) (C₂-C₆)-алкенільну групу;
 (b4) (C₂-C₆)-алкінільну групу;
 (b5) (C₁-C₆)-алкокси-(C₁-C₆)-алкільну групу;
 (b6) (C₁-C₆)-алкілтіо-(C₁-C₆)-алкільну групу; або
 (b7) галоген-(C₁-C₆)-алкільну групу;

R³ являє собою

- (c1) атом галогену;
 (c2) галоген-(C₁-C₆)-алкільну групу;
 (c3) галоген-(C₁-C₆)-алкоксигрупу;
 (c4) галоген-(C₁-C₆)-алкілтіогрупу;
 (c5) галоген-(C₁-C₆)-алкілсульфінільну групу; або
 (c6) галоген-(C₁-C₆)-алкілсульфонільну групу;

Q являє собою кільце, представлене будь-якою зі структурних формул Q-A, Q-B, Q-C, Q-D, Q-E, Q-F, Q-G, Q-H і Q-I:

[Xim. 2]



де

X являє собою групу CH або атом азоту,

R⁴, R⁵, R⁶ і R⁷ можуть бути однаковими або різними, і кожний являє собою

- (d1) атом водню;
 (d2) атом галогену;
 (d3) формільну групу;
 (d4) ціаногрупу;
 (d5) (C₁-C₆)-алкільну групу;
 (d6) (C₃-C₆)-циклоалкільну групу;
 (d7) (C₃-C₆)-циклоалкіл-(C₁-C₆)-алкільну групу;
 (d8) (C₁-C₆)-алкоксигрупу;
 (d9) галоген-(C₁-C₆)-алкільну групу;
 (d10) галоген-(C₁-C₆)-алкоксигрупу;
 (d11) галоген-(C₁-C₆)-алкілтіогрупу;
 (d12) галоген-(C₁-C₆)-алкілсульфінільну групу;
 (d13) галоген-(C₁-C₆)-алкілсульфонільну групу;

(d14) N(R²⁰)(R²¹) (де R²⁰ являє собою атом водню, (C₁-C₆)-алкільну групу, галоген-(C₁-C₆)-алкільну групу, (C₃-C₆)-циклоалкільну групу, галоген-(C₁-C₆)-алкільну групу, (C₁-C₆)-алкоксигрупу, (C₁-C₆)-алкілкарбонільну групу або (C₁-C₆)-алкоксикарбонільну групу, і R²¹ являє собою атом водню, (C₁-C₆)-алкільну групу, галоген-(C₁-C₆)-алкільну групу, (C₃-C₆)-циклоалкільну групу, галоген-(C₁-C₆)-алкільну групу, (C₁-C₆)-алкілкарбонільну групу або (C₁-C₆)-алкоксикарбонільну групу);

(d15) C(R²⁰)=NO(R²¹) (де R²⁰ і R²¹ приймають значення, визначені вище);

(d16) арильну групу;

(d17) арильну групу, що містить у кільці від 1 до 5 замісників, які можуть бути однаковими або різними і вибираються з (a) атома галогену, (b) ціаногрупи, (c) нітрогрупи, (d) формільної групи, (e) (C₁-C₆)-алкільної групи, (f) галоген-(C₁-C₆)-алкільної групи, (g) (C₁-C₆)-алкоксигрупи, (h) галоген-(C₁-C₆)-алкоксигрупи, (i) (C₃-C₆)-циклоалкіл-(C₁-C₆)-алкоксигрупи, (j) (C₁-C₆)-алкілтіогрупи, (k) галоген-(C₁-C₆)-алкілтіогрупи, (l) (C₁-C₆)-алкілсульфінільної групи, (m) галоген-

(C₁-C₆)-алкілсульфінільної групи, (n) (C₁-C₆)-алкілсульфонільної групи, (o) галоген-(C₁-C₆)-алкілсульфонільної групи, (p) (C₁-C₆)-алкілкарбонільної групи, (q) карбоксильної групи і (r) (C₁-C₆)-алкоксикарбонільної групи;

(d18) арил-(C₁-C₆)-алкоксигрупу;

5 (d19) арил-(C₁-C₆)-алкоксигрупу, що містить у кільці від 1 до 5 замісників, які можуть бути однаковими або різними і вибираються з (a) атома галогену, (b) ціаногрупи, (c) нітрогрупи, (d) формільної групи, (e) (C₁-C₆)-алкільної групи, (f) галоген-(C₁-C₆)-алкільної групи, (g) (C₁-C₆)-алкоксигрупи, (h) галоген-(C₁-C₆)-алкоксигрупи, (i) (C₃-C₆)-циклоалкіл-(C₁-C₆)-алкоксигрупи, (j) (C₁-C₆)-алкілтіогрупи, (k) галоген-(C₁-C₆)-алкілтіогрупи, (l) (C₁-C₆)-алкілсульфінільної групи, (m) галоген-(C₁-C₆)-алкілсульфінільної групи, (n) (C₁-C₆)-алкілсульфонільної групи, (o) галоген-(C₁-C₆)-алкілсульфонільної групи, (p) (C₁-C₆)-алкілкарбонільної групи, (q) карбоксильної групи і (r) (C₁-C₆)-алкоксикарбонільної групи;

(d20) гетероциклічну групу; або

15 (d21) гетероциклічну групу, що містить у кільці 1 або 2 замісники, які можуть бути однаковими або різними і вибираються з (a) атома галогену, (b) ціаногрупи, (c) нітрогрупи, (d) формільної групи, (e) (C₁-C₆)-алкільної групи, (f) галоген-(C₁-C₆)-алкільної групи, (g) (C₁-C₆)-алкоксигрупи, (h) галоген-(C₁-C₆)-алкоксигрупи, (i) (C₃-C₆)-циклоалкіл-(C₁-C₆)-алкоксигрупи, (j) (C₁-C₆)-алкілтіогрупи, (k) галоген-(C₁-C₆)-алкілтіогрупи, (l) (C₁-C₆)-алкілсульфінільної групи, (m) галоген-(C₁-C₆)-алкілсульфінільної групи, (n) (C₁-C₆)-алкілсульфонільної групи, (o) галоген-(C₁-C₆)-алкілсульфонільної групи, (p) (C₁-C₆)-алкілкарбонільної групи, (q) карбоксильної групи і (r) (C₁-C₆)-алкоксикарбонільної групи,

Z являє собою атом O, S або N-R⁸ (де R⁸ являє собою (e1) атом водню, (e2) (C₁-C₆)-алкільну групу, (e3) (C₃-C₆)-циклоалкільну групу або (e4) галоген-(C₁-C₆)-алкільну групу),

Y¹ являє собою C-R⁹ (де R⁹ являє собою (f1) атом водню, (f2) (C₁-C₆)-алкільну групу, (f3) (C₃-C₆)-циклоалкільну групу або (f4) галоген-(C₁-C₆)-алкільну групу),

25 Y² являє собою C-R¹⁰ (де R¹⁰ являє собою (g1) атом водню, (g2) (C₁-C₆)-алкільну групу, (g3) (C₃-C₆)-циклоалкільну групу або (g4) галоген-(C₁-C₆)-алкільну групу),

кожний Y³, Y⁴, Y⁵ і Y⁸ являє собою групу CH або N,

30 Y⁶ і Y⁷ можуть бути однаковими або різними, і кожний являє собою C-R¹¹ (де R¹¹ являє собою

(h1) атом галогену;

(h2) (C₁-C₆)-алкільну групу;

(h3) (C₃-C₆)-циклоалкільну групу;

(h4) галоген-(C₁-C₆)-алкільну групу;

35 (h5) арильну групу; або

(h6) арильну групу, що містить у кільці від 1 до 5 замісників, які можуть бути однаковими або різними і вибираються з (a) атома галогену, (b) ціаногрупи, (c) нітрогрупи, (d) формільної групи, (e) (C₁-C₆)-алкільної групи, (f) галоген-(C₁-C₆)-алкільної групи, (g) (C₁-C₆)-алкоксигрупи, (h) галоген-(C₁-C₆)-алкоксигрупи, (i) (C₃-C₆)-циклоалкіл-(C₁-C₆)-алкоксигрупи, (j) (C₁-C₆)-алкілтіогрупи, (k) галоген-(C₁-C₆)-алкілтіогрупи, (l) (C₁-C₆)-алкілсульфінільної групи, (m) галоген-(C₁-C₆)-алкілсульфінільної групи, (n) (C₁-C₆)-алкілсульфонільної групи, (o) галоген-(C₁-C₆)-алкілсульфонільної групи, (p) (C₁-C₆)-алкілкарбонільної групи, (q) карбоксильної групи і (r) (C₁-C₆)-алкоксикарбонільної групи),

кожна стрілка означає зв'язування з 4H-піролопіридиновим кільцем,

45 m дорівнює 0, 1 або 2; і

Et означає етильну групу,

або її сіль.

[2] Сполука 4H-піролопіридину або сіль за вищевказаним пунктом [1], де Q являє собою Q-A, Q-B або Q-C.

50 [3] Застосування сполуки 4H-піролопіридину або солі за вищевказаним пунктом [1] або [2] як сільськогосподарського і садівницького інсектициду.

[4] Спосіб застосування сільськогосподарського і садівницького інсектициду, який включає обробку рослин або ґрунту активним інгредієнтом сільськогосподарського і садівницького інсектициду, зазначеного в наведеному вище пункті [3].

55 [5] Спосіб контролю сільськогосподарських і садових шкідників, який включає обробку рослин або ґрунту ефективною кількістю сільськогосподарського і садівницького інсектициду, зазначеного в наведеному вище пункті [3].

[6] Засіб контролю ектопаразитів тварин, який включає сполуку 4H-піролопіридину або сіль за наведеним вище пунктом [1] або [2] як активний інгредієнт.

60 [7] Спосіб контролю ектопаразитів тварин, який включає обробку ектопаразитів тварин

ефективною кількістю засобу для контролю ектопаразитів тварин за наведеним вище пунктом [6].

КОРИСНІ ЕФЕКТИ ВИНАХОДУ

[0007]

- 5 Сполука 4Н-піролопіридину за даним винаходом або її сіль не тільки високоефективна як сільськогосподарський і садівницький інсектицид, але також ефективна для дезінфекції шкідників, які живуть на таких домашніх (кімнатних) тваринах як собаки і кішки, а також на таких свійських (сільськогосподарських) тваринах як велика рогата худоба і вівці.

ОПИС ВАРІАНТІВ ЗДІЙСНЕННЯ

10 [0008]

У визначеннях загальної формули (1), що представляє сполуку 4Н-піролопіридину за даним винаходом або її сіль, термін "галоген" стосується "атома галогену" і означає атом хлору, атом бром, атом йоду або атом фтору.

[0009]

- 15 Термін "(C₁-C₆)-алкільна груп" стосується алкільної групи з прямим або розгалуженим ланцюгом, що містить від 1 до 6 атомів вуглецю, наприклад метильної групи, етильної групи, н-пропільної групи, ізопропільної групи, н-бутильної групи, ізобутильної групи, втор-бутильної групи, трет-бутильної групи, н-пентильної групи, ізопентильної групи, трет-пентильної групи, неопентильної групи, 2,3-диметилпропільної групи, 1-етилпропільної групи, 1-метилбутильної групи, 2-метилбутильної групи, н-гексильної групи, ізогексильної групи, 2-гексильної групи, 3-гексильної групи, 2-метилпентильної групи, 3-метилпентильної групи, 1,1,2-триметилпропільної групи, 3,3-диметилбутильної групи або т. п.

- 20 Термін "(C₂-C₆)-алкенільна група" стосується алкенільної групи з прямим або розгалуженим ланцюгом, що містить від 2 до 6 атомів вуглецю, наприклад вінільної групи, алільної групи, ізопропенільної групи, 1-бутенільної групи, 2-бутенільної групи, 2-метил-2-пропенільної групи, 1-метил-2-пропенільної групи, 2-метил-1-пропенільної групи, пентенільної групи, 1-гексенільної групи, 3,3-диметил-1-бутенільної групи або т. п.

- 25 Термін "(C₂-C₆)-алкінільна група" стосується алкінільної групи з прямим або розгалуженим ланцюгом, що містить від 2 до 6 атомів вуглецю, наприклад етинільної групи, 1-пропінільної групи, 2-пропінільної групи, 1-бутинільної групи, 2-бутинільної групи, 3-бутинільної групи, 3-метил-1-пропінільної групи, 2-метил-3-пропінільної групи, пентинільної групи, 1-гексинільної групи, 3-метил-1-бутинільної групи, 3,3-диметил-1-бутинільної групи або т. п.

[0010]

- 35 Термін "(C₃-C₆)-циклоалкільна група" стосується циклічної алкільної групи, що містить від 3 до 6 атомів вуглецю, наприклад циклопропільної групи, циклобутильної групи, циклопентильної групи, циклогексильної групи або т. п. Термін "(C₁-C₆)-алкоксигрупа" стосується алкоксигрупи з прямим або розгалуженим ланцюгом, що містить від 1 до 6 атомів вуглецю, наприклад метоксигрупи, етоксигрупи, н-пропоксигрупи, ізопропоксигрупи, н-бутоксигрупи, втор-бутоксигрупи, трет-бутоксигрупи, н-пентилоксигрупи, ізопентилоксигрупи, трет-пентилоксигрупи, неопентилоксигрупи, 2,3-диметилпропілоксигрупи, 1-етилпропілоксигрупи, 1-метилбутилоксигрупи, н-гексилоксигрупи, ізогексилоксигрупи, 1,1,2-триметилпропілоксигрупи або т. п. Термін "(C₂-C₆)-алкенілоксигрупа" стосується алкенілоксигрупи з прямим або розгалуженим ланцюгом, що містить від 2 до 6 атомів вуглецю, наприклад пропенілоксигрупи, бутенілоксигрупи, пентенілоксигрупи, гексенілоксигрупи або т. п. Термін "(C₂-C₆)-алкінілоксигрупа" стосується алкінілоксигрупи з прямим або розгалуженим ланцюгом, що містить від 2 до 6 атомів вуглецю, наприклад пропінілоксигрупи, бутинілоксигрупи, пентинілоксигрупи, гексинілоксигрупи або т. п.

[0011]

- 50 Термін "(C₁-C₆)-алкілтіогрупа" стосується алкілтіогрупи з прямим або розгалуженим ланцюгом, що містить від 1 до 6 атомів вуглецю, наприклад метилтіогрупи, етилтіогрупи, н-пропілтіогрупи, ізопропілтіогрупи, н-бутилтіогрупи, втор-бутилтіогрупи, трет-бутилтіогрупи, н-пентилтіогрупи, ізопентилтіогрупи, трет-пентилтіогрупи, неопентилтіогрупи, 2,3-диметилпропілтіогрупи, 1-етилпропілтіогрупи, 1-метилбутилтіогрупи, н-гексилтіогрупи, ізогексилтіогрупи, 1,1,2-триметилпропілтіогрупи або т. п. Термін "(C₁-C₆)-алкілсульфінільна група" стосується алкілсульфінільної групи з прямим або розгалуженим ланцюгом, що містить від 1 до 6 атомів вуглецю, наприклад метилсульфінільної групи, етилсульфінільної групи, н-пропілсульфінільної групи, ізопропілсульфінільної групи, н-бутилсульфінільної групи, втор-бутилсульфінільної групи, трет-бутилсульфінільної групи, н-пентилсульфінільної групи, ізопентилсульфінільної групи, трет-пентилсульфінільної групи, неопентилсульфінільної групи, 2,3-диметилпропілсульфінільної групи, 1-етилпропілсульфінільної групи, 1-

метилбутилсульфінільної групи, н-гексилсульфінільної групи, ізогексилсульфінільної групи, 1,1,2-триметилпропілсульфінільної групи або т. п. Термін "(C₁-C₆)-алкілсульфонільна група" стосується алкілсульфонільної групи з прямим або розгалуженим ланцюгом, що містить від 1 до 6 атомів вуглецю, наприклад метилсульфонільної групи, етилсульфонільної групи, н-пропілсульфонільної групи, ізопропілсульфонільної групи, н-бутилсульфонільної групи, втор-бутилсульфонільної групи, трет-бутилсульфонільної групи, н-пентилсульфонільної групи, ізопентилсульфонільної групи, трет-пентилсульфонільної групи, неопентилсульфонільної групи, 2,3-диметилпропілсульфонільної групи, 1-метилбутилсульфонільної групи, н-гексилсульфонільної групи, ізогексилсульфонільної групи, 1,1,2-триметилпропілсульфонільної групи або т. п.

[0012]

Термін "(C₂-C₆)-алкенілтіогрупа" стосується алкенілтіогрупи з прямим або розгалуженим ланцюгом, що містить від 2 до 6 атомів вуглецю, наприклад пропенілтіогрупи, бутенілтіогрупи, пентенілтіогрупи, гексенілтіогрупи або т. п. Термін "(C₂-C₆)-алкінілтіогрупа" стосується алкінілтіогрупи з прямим або розгалуженим ланцюгом, що містить від 2 до 6 атомів вуглецю, наприклад пропінілтіогрупи, бутинілтіогрупи, пентинілтіогрупи, гексинілтіогрупи або т. п.

[0013]

Термін "(C₂-C₆)-алкенілсульфінільна група" стосується алкенілсульфінільної групи з прямим або розгалуженим ланцюгом, що містить від 2 до 6 атомів вуглецю, наприклад пропенілсульфінільної групи, бутенілсульфінільної групи, пентенілсульфінільної групи, гексенілсульфінільної групи або т. п. Термін "(C₂-C₆)-алкінілсульфінільна група" стосується алкінілсульфінільної групи з прямим або розгалуженим ланцюгом, що містить від 2 до 6 атомів вуглецю, наприклад пропінілсульфінільної групи, бутинілсульфінільної групи, пентинілсульфінільної групи, гексинілсульфінільної групи або т. п.

[0014]

Термін "(C₂-C₆)-алкенілсульфонільна група" стосується алкенілсульфонільної групи з прямим або розгалуженим ланцюгом, що містить від 2 до 6 атомів вуглецю, наприклад пропенілсульфонільної групи, бутенілсульфонільної групи, пентенілсульфонільної групи, гексенілсульфонільної групи або т. п. Термін "(C₂-C₆)-алкінілсульфонільна група" стосується алкінілсульфонільної групи з прямим або розгалуженим ланцюгом, що містить від 2 до 6 атомів вуглецю, наприклад пропінілсульфонільної групи, бутинілсульфонільної групи, пентинілсульфонільної групи, гексинілсульфонільної групи або т. п.

[0015]

Термін "(C₃-C₆)-циклоалкоксигрупа" стосується циклічної алкоксигрупи, що містить від 3 до 6 атомів вуглецю, наприклад циклопропоксигрупи, циклобутоксигрупи, циклопентилоксигрупи, циклогексилоксигрупи або т. п. Термін "(C₃-C₆)-циклоалкілтіогрупа" стосується циклічної алкілтіогрупи, що містить від 3 до 6 атомів вуглецю, наприклад циклопропілтіогрупи, циклобутилтіогрупи, циклопентилтіогрупи, циклогексилтіогрупи або т. п. Термін "(C₃-C₆)-циклоалкілсульфінільна група" стосується циклічної алкілсульфінільної групи, що містить від 3 до 6 атомів вуглецю, наприклад циклопропілсульфінільної групи, циклобутилсульфінільної групи, циклопентилсульфінільної групи, циклогексилсульфінільної групи або т. п. Термін "(C₃-C₆)-циклоалкілсульфонільна група" стосується циклічної алкілсульфонільної групи, що містить від 3 до 6 атомів вуглецю, наприклад циклопропілсульфонільної групи, циклобутилсульфонільної групи, циклопентилсульфонільної групи, циклогексилсульфонільної групи або т. п.

[0016]

Термін "(C₁-C₆)-алкілкарбонільна група" стосується алкілкарбонільної групи з прямим або розгалуженим ланцюгом, що містить від 1 до 6 атомів вуглецю, наприклад метилкарбонільної групи, етилкарбонільної групи, н-пропілкарбонільної групи, ізопропілкарбонільної групи, н-бутилкарбонільної групи, втор-бутилкарбонільної групи, трет-бутилкарбонільної групи, н-пентилкарбонільної групи, ізопентилкарбонільної групи, трет-пентилкарбонільної групи, неопентилкарбонільної групи, 2,3-диметилпропілкарбонільної групи, 1-етилпропілкарбонільної групи, 1-метилбутилкарбонільної групи, н-гексилкарбонільної групи, ізогексилкарбонільної групи, 1,1,2-триметилпропілкарбонільної групи або т. п. Термін "(C₁-C₆)-алкоксикарбонільна група" стосується алкоксикарбонільної групи з прямим або розгалуженим ланцюгом, що містить від 1 до 6 атомів вуглецю, наприклад метоксикарбонільної групи, етоксикарбонільної групи, н-пропоксикарбонільної групи, ізопроксикарбонільної групи, н-бутоксикарбонільної групи, втор-бутоксикарбонільної групи, трет-бутоксикарбонільної групи, н-пентоксикарбонільної групи, ізопентилоксикарбонільної групи, трет-пентилоксикарбонільної групи, неопентилоксикарбонільної групи, 2,3-диметилпропілоксикарбонільної групи, 1-

метилбутилоксикарбонільної групи, н-гексилоксикарбонільної групи, ізогексилоксикарбонільної групи, 1,1,2-триметилпропілоксикарбонільної групи або т. п.

[0017]

Вищезгадані "(C₁-C₆)-алкільна група", "(C₂-C₆)-алкенільна група", "(C₂-C₆)-алкінільна група", "(C₃-C₆)-циклоалкільна група", "(C₃-C₆)-циклоалкоксигрупа", "(C₁-C₆)-алкоксигрупа", "(C₂-C₆)-алкенілоксигрупа", "(C₂-C₆)-алкінілоксигрупа", "(C₁-C₆)-алкілтіогрупа", "(C₁-C₆)-алкілсульфінільна група", "(C₁-C₆)-алкілсульфонільна група", "(C₂-C₆)-алкенілтіогрупа", "(C₂-C₆)-алкінілтіогрупа", "(C₂-C₆)-алкенілсульфінільна група", "(C₂-C₆)-алкінілсульфінільна група", "(C₂-C₆)-алкенілсульфонільна група", "(C₂-C₆)-алкінілсульфонільна група", "(C₃-C₆)-циклоалкільна група", "(C₁-C₆)-алкоксигрупа", "(C₂-C₆)-алкенілоксигрупа", "(C₂-C₆)-алкінілоксигрупа", "(C₃-C₆)-циклоалкілтіогрупа", "(C₃-C₆)-циклоалкілсульфінільна група" і "(C₃-C₆)-циклоалкілсульфонільна група" можуть бути заміщеними одним або декількома атомами галогену в заміщуваному(их) положенні(ях) атома(ів) водню, і, у випадку, коли будь-яка з перерахованих вище груп заміщена двома або більше атомами галогену, атоми галогену можуть бути однаковими або різними.

[0018]

Вищезгадані "групи, заміщені одним або декількома атомами галогену" називають "галоген-(C₁-C₆)-алкільна група", "галоген-(C₂-C₆)-алкенільна група", "галоген-(C₂-C₆)-алкінільна група", "галоген-(C₃-C₆)-циклоалкільна група", "галоген-(C₃-C₆)-циклоалкоксигрупа", "галоген-(C₁-C₆)-алкоксигрупа", "галоген-(C₂-C₆)-алкенілоксигрупа", "галоген-(C₂-C₆)-алкінілоксигрупа", "галоген-(C₁-C₆)-алкілтіогрупа", "галоген-(C₁-C₆)-алкілсульфінільна група", "галоген-(C₁-C₆)-алкілсульфонільна група", "галоген-(C₂-C₆)-алкенілтіогрупа", "галоген-(C₂-C₆)-алкінілтіогрупа", "галоген-(C₂-C₆)-алкенілсульфінільна група", "галоген-(C₂-C₆)-алкінілсульфінільна група", "галоген-(C₂-C₆)-алкенілсульфонільна група", "галоген-(C₂-C₆)-алкінілсульфонільна група", "галоген-(C₃-C₆)-циклоалкільна група", "галоген-(C₁-C₆)-алкоксигрупа", "галоген-(C₂-C₆)-алкенілоксигрупа", "галоген-(C₂-C₆)-алкінілоксигрупа", "галоген-(C₃-C₆)-циклоалкілтіогрупа", "галоген-(C₃-C₆)-циклоалкілсульфінільна група" і "галоген-(C₃-C₆)-циклоалкілсульфонільна група".

[0019]

Кожний з виразів "(C₁-C₆)", "(C₂-C₆)", "(C₃-C₆)" і т. д. стосується інтервалу кількості атомів вуглецю в кожній групі. Те ж визначення правдиве для груп, у яких дві або більше з вищезгаданих груп зв'язані разом, і, наприклад, термін "(C₁-C₆)-алкоксі-(C₁-C₆)-алкільна група" означає, що лінійна або розгалужена алкоксигрупа, що містить від 1 до 6 атомів вуглецю, зв'язана з алкільною групою з прямим або розгалуженим ланцюгом, що містить від 1 до 6 атомів вуглецю.

[0020]

Термін "арильна група" стосується ароматичної вуглеводневої групи, що містить 6-10 атомів вуглецю, наприклад фенільної групи, 1-нафтильної групи, 2-нафтильної групи або т. п. Особливо переважна арильна група являє собою фенільну групу.

[0021]

Приклади "гетероциклічної групи" і "гетероциклічного кільця" включають 5- або 6-членну моноциклічну ароматичну або 4-6-членну моноциклічну неароматичну гетероциклічну групу, що містить у кільці один або декілька атомів вуглецю і від 1-4 гетероатомів, вибраних з атома кисню, атома сірки і атома азоту, а також включають конденсовану ароматичну гетероциклічну групу, утворену в результаті конденсації такого моноциклічного ароматичного гетероциклу з бензольним кільцем; і конденсовану ароматичну гетероциклічну групу, утворену в результаті конденсації такого моноциклічного ароматичного кільця з бензольним кільцем.

[0022]

Приклади "ароматичної гетероциклічної групи" включають моноциклічні ароматичні гетероциклічні групи, такі як фурил, тієніл, піридил, піримідиніл, піридазиніл, піразиніл, піроліл, імідазоліл, піразоліл, тіазоліл, ізотіазоліл, оксазоліл, ізоксазоліл, оксадіазоліл, тіадіазоліл, триазоліл, тетразоліл і триазиніл; і конденсовані ароматичні гетероциклічні групи, такі як хіноліл, ізохіноліл, хіназоліл, хіноксаліл, бензофураніл, бензотієніл, бензоксазоліл, бензізоксазоліл, бензотіазоліл, бензімідазоліл, бензотриазоліл, індолил, індазоліл, піролопіразиніл, імідазопіридиніл, імідазопіразиніл, піразолопіридиніл, піразолотієніл і піразолотриазиніл.

[0023]

Приклади "неароматичної гетероциклічної групи" включають моноциклічні неароматичні гетероциклічні групи, такі як оксетаніл, тіетаніл, азетидиніл, піролідиніл, піролідиніл-2-он, піперидиніл, морфолініл, тіоморфолініл, піперазиніл, гексаметиленімініл, оксазолідиніл, тіазолідиніл, імідазолідиніл, оксазолініл, тіазолініл, ізоксазолініл, імідазолініл, діоксоліл, діоксоланіл, дигідрооксадіазоліл, 2-оксопіролідин-1-іл, 2-оксо-1,3-оксазолідин-5-іл, 5-оксо-1,2,4-

оксадіазолін-3-іл, 1,3-діоксолан-2-іл, 1,3-діоксан-2-іл, 1,3-діоксепан-2-іл, піраніл, тетрагідропіраніл, тіопіраніл, тетрагідротіопіраніл, тетрагідротіопіранілу 1-оксид, тетрагідротіопіранілу 1,1-діоксид, тетрагідрофураніл, діоксаніл, піразолідиніл, піразолініл, тетрагідропіримідиніл, дигідротриазоліл і тетрагідротриазоліл.

5 [0024]

Переважні приклади "гетероциклічної групи" включають ізоксазоліл, піримідиніл, піразиніл, піридил, піразоліл, тiazоліл, тієніл, піроліл, бензімідазоліл, бензофураніл, бензотієніл і піролідиніл-2-он.

[0025]

10 Приклади солі сполуки 4Н-піролопіридину, представленої загальною формулою (1), за даним винаходом включають солі неорганічних кислот, такі як гідрохлориди, сульфати, нітрати і фосфати; солі органічних кислот, такі як ацетати, фумарати, малеати, оксалати, метансульфонати, бензолсульфонати і п-толуолсульфонати; і солі з неорганічною або органічною основою, такою як іон натрію, іон калію, іон кальцію і іон триметиламонію.

15 [0026]

Сполука 4Н-піролопіридину, представлена загальною формулою (1), за даним винаходом і її сіль можуть містити один або декілька хіральних центрів у структурній формулі і можуть існувати у вигляді двох або більше типів оптичних ізомерів або діастереомерів. Усі оптичні ізомери і суміші ізомерів у будь-якому співвідношенні також включені в даний винахід. Крім того, сполука, представлена загальною формулою (1), за даним винаходом і її сіль можуть існувати у вигляді двох видів геометричних ізомерів завдяки наявності подвійного вуглець-вуглецевого зв'язку або подвійного вуглець-азотного зв'язку в структурній формулі. Усі геометричні ізомери і суміші ізомерів у будь-якому співвідношенні також включені в даний винахід.

[0027]

25 У сполуці 4Н-піролопіридину, представленій загальною формулою (1), за даним винаходом або її солі:

R¹ переважно являє собою

(a1) атом водню;

(a2) атом галогену;

30 (a3) ціаногрупу;

(a4) (C₁-C₆)-алкільну групу;

(a5) (C₁-C₆)-алкоксигрупу;

(a6) (C₁-C₆)-алкілкарбонільну групу; або

(a7) (C₁-C₆)-алкоксикарбонільну групу,

35 R² переважно являє собою

(b1) (C₁-C₆)-алкільну групу;

(b2) ціано-(C₁-C₆)-алкільну групу;

(b3) (C₂-C₆)-алкенільну групу;

(b4) (C₂-C₆)-алкінільну групу;

40 (b5) (C₁-C₆)-алкокси-(C₁-C₆)-алкільну групу;

(b6) (C₁-C₆)-алкілтіо-(C₁-C₆)-алкільну групу; або

(b7) галоген-(C₁-C₆)-алкільну групу,

R³ переважно являє собою

(c1) атом галогену;

45 (c2) галоген-(C₁-C₆)-алкільну групу;

(c3) галоген-(C₁-C₆)-алкоксигрупу;

(c4) галоген-(C₁-C₆)-алкілтіогрупу;

(c5) галоген-(C₁-C₆)-алкілсульфінільну групу; або

(c6) галоген-(C₁-C₆)-алкілсульфонільну групу,

50 Q переважно являє собою Q-A, Q-B або Q-C,

X переважно являє собою групу СН або атом азоту,

R⁴, R⁵, R⁶ і R⁷ можуть бути однаковими або різними, і кожний переважно являє собою

(d1) атом водню;

(d2) атом галогену;

55 (d3) формільну групу;

(d4) ціаногрупу;

(d5) (C₁-C₆)-алкільну групу;

(d6) (C₃-C₆)-циклоалкільну групу;

(d7) (C₃-C₆)-циклоалкіл-(C₁-C₆)-алкільну групу;

60 (d8) (C₁-C₆)-алкоксигрупу;

- (d9) галоген-(C₁-C₆)-алкільну групу;
 (d10) галоген-(C₁-C₆)-алкоксигрупу;
 (d11) галоген-(C₁-C₆)-алкілтіогрупу;
 (d12) галоген-(C₁-C₆)-алкілсульфінільну групу;
 5 (d13) галоген-(C₁-C₆)-алкілсульфонільну групу;
 (d14) N(R²⁰)(R²¹) (де R²⁰ являє собою атом водню, (C₁-C₆)-алкільну групу, галоген-(C₁-C₆)-алкільну групу, (C₃-C₆)-циклоалкільну групу, галоген-(C₁-C₆)-алкільну групу, (C₁-C₆)-алкоксигрупу, (C₁-C₆)-алкілкарбонільну групу або (C₁-C₆)-алкоксикарбонільну групу, і R²¹ являє собою атом водню, (C₁-C₆)-алкільну групу, галоген-(C₁-C₆)-алкільну групу, (C₃-C₆)-циклоалкільну групу,
 10 галоген-(C₁-C₆)-алкільну групу, (C₁-C₆)-алкілкарбонільну групу або (C₁-C₆)-алкоксикарбонільну групу);
 (d15) C(R²⁰)=NO(R²¹) (де R²⁰ і R²¹ приймають значення, визначені вище);
 (d16) арильну групу;
 (d17) арильну групу, що містить у кільці від 1 до 5 замісників, які можуть бути однаковими
 15 або різними і вибираються з (a) атома галогену, (b) ціаногрупи, (c) нітрогрупи, (d) формільної групи, (e) (C₁-C₆)-алкільної групи, (f) галоген-(C₁-C₆)-алкільної групи, (g) (C₁-C₆)-алкоксигрупи, (h) галоген-(C₁-C₆)-алкоксигрупи, (i) (C₃-C₆)-циклоалкіл-(C₁-C₆)-алкоксигрупи, (j) (C₁-C₆)-алкілтіогрупи, (k) галоген-(C₁-C₆)-алкілтіогрупи, (l) (C₁-C₆)-алкілсульфінільної групи, (m) галоген-(C₁-C₆)-алкілсульфінільної групи, (n) (C₁-C₆)-алкілсульфонільної групи, (o) галоген-(C₁-C₆)-алкілсульфонільної групи, (p) (C₁-C₆)-алкілкарбонільної групи, (q) карбоксильної групи і (r) (C₁-C₆)-алкоксикарбонільної групи;
 20 (d18) арил-(C₁-C₆)-алкоксигрупу;
 (d19) арил-(C₁-C₆)-алкоксигрупу, що містить у кільці від 1 до 5 замісників, які можуть бути однаковими або різними і вибираються з (a) атома галогену, (b) ціаногрупи, (c) нітрогрупи, (d) формільної групи, (e) (C₁-C₆)-алкільної групи, (f) галоген-(C₁-C₆)-алкільної групи, (g) (C₁-C₆)-алкоксигрупи, (h) галоген-(C₁-C₆)-алкоксигрупи, (i) (C₃-C₆)-циклоалкіл-(C₁-C₆)-алкоксигрупи, (j) (C₁-C₆)-алкілтіогрупи, (k) галоген-(C₁-C₆)-алкілтіогрупи, (l) (C₁-C₆)-алкілсульфінільної групи, (m) галоген-(C₁-C₆)-алкілсульфінільної групи, (n) (C₁-C₆)-алкілсульфонільної групи, (o) галоген-(C₁-C₆)-алкілсульфонільної групи, (p) (C₁-C₆)-алкілкарбонільної групи, (q) карбоксильної групи і (r) (C₁-C₆)-алкоксикарбонільної групи;
 25 (d20) гетероциклічну групу; або
 (d21) гетероциклічну групу, що містить у кільці 1 або 2 замісники, які можуть бути однаковими або різними і вибираються з (a) атома галогену, (b) ціаногрупи, (c) нітрогрупи, (d) формільної групи, (e) (C₁-C₆)-алкільної групи, (f) галоген-(C₁-C₆)-алкільної групи, (g) (C₁-C₆)-алкоксигрупи, (h) галоген-(C₁-C₆)-алкоксигрупи, (i) (C₃-C₆)-циклоалкіл-(C₁-C₆)-алкоксигрупи, (j) (C₁-C₆)-алкілтіогрупи, (k) галоген-(C₁-C₆)-алкілтіогрупи, (l) (C₁-C₆)-алкілсульфінільної групи, (m) галоген-(C₁-C₆)-алкілсульфінільної групи, (n) (C₁-C₆)-алкілсульфонільної групи, (o) галоген-(C₁-C₆)-алкілсульфонільної групи, (p) (C₁-C₆)-алкілкарбонільної групи, (q) карбоксильної групи і (r) (C₁-C₆)-алкоксикарбонільної групи,
 30 Z переважно являє собою O, S або N-R⁸ (де R⁸ являє собою (e1) атом водню, (e2) (C₁-C₆)-алкільну групу, (e3) (C₃-C₆)-циклоалкільну групу або (e4) галоген-(C₁-C₆)-алкільну групу),
 Y¹ переважно являє собою C-R⁹ (де R⁹ являє собою (f1) атом водню, (f2) (C₁-C₆)-алкільну групу, (f3) (C₃-C₆)-циклоалкільну групу або (f4) галоген-(C₁-C₆)-алкільну групу),
 Y² переважно являє собою C-R¹⁰ (де R¹⁰ являє собою (g1) атом водню, (g2) (C₁-C₆)-алкільну
 35 групу, (g3) (C₃-C₆)-циклоалкільну групу або (g4) галоген-(C₁-C₆)-алкільну групу),
 кожний з Y³, Y⁴, Y⁵ і Y⁸ переважно являє собою групу СН або N,
 Y⁶ і Y⁷ можуть бути однаковими або різними, і кожний переважно являє собою C-R¹¹ (де R¹¹ являє собою
 40 (h1) атом галогену;
 50 (h2) (C₁-C₆)-алкільну групу;
 (h3) (C₃-C₆)-циклоалкільну групу;
 (h4) галоген-(C₁-C₆)-алкільну групу;
 (h5) арильну групу; або
 (h6) арильну групу, що містить у кільці від 1 до 5 замісників, які можуть бути однаковими або
 55 різними і вибираються з (a) атома галогену, (b) ціаногрупи, (c) нітрогрупи, (d) формільної групи, (e) (C₁-C₆)-алкільної групи, (f) галоген-(C₁-C₆)-алкільної групи, (g) (C₁-C₆)-алкоксигрупи, (h) галоген-(C₁-C₆)-алкоксигрупи, (i) (C₃-C₆)-циклоалкіл-(C₁-C₆)-алкоксигрупи, (j) (C₁-C₆)-алкілтіогрупи, (k) галоген-(C₁-C₆)-алкілтіогрупи, (l) (C₁-C₆)-алкілсульфінільної групи, (m) галоген-(C₁-C₆)-алкілсульфінільної групи, (n) (C₁-C₆)-алкілсульфонільної групи, (o) галоген-(C₁-C₆)-алкілсульфонільної групи, (p) (C₁-C₆)-алкілкарбонільної групи, (q) карбоксильної групи і (r) (C₁-
 60 алкілсульфонільної групи, (r) (C₁-C₆)-алкілкарбонільної групи, (q) карбоксильної групи і (r) (C₁-

C₆)-алкоксикарбонільної групи),

кожна стрілка позначає зв'язування з кільцем 4Н-піролопіридину, і m переважно дорівнює 0, 1 або 2.

Комбінації зазначених вище R¹, R², R³ і Q являють собою переважні приклади формули (1).

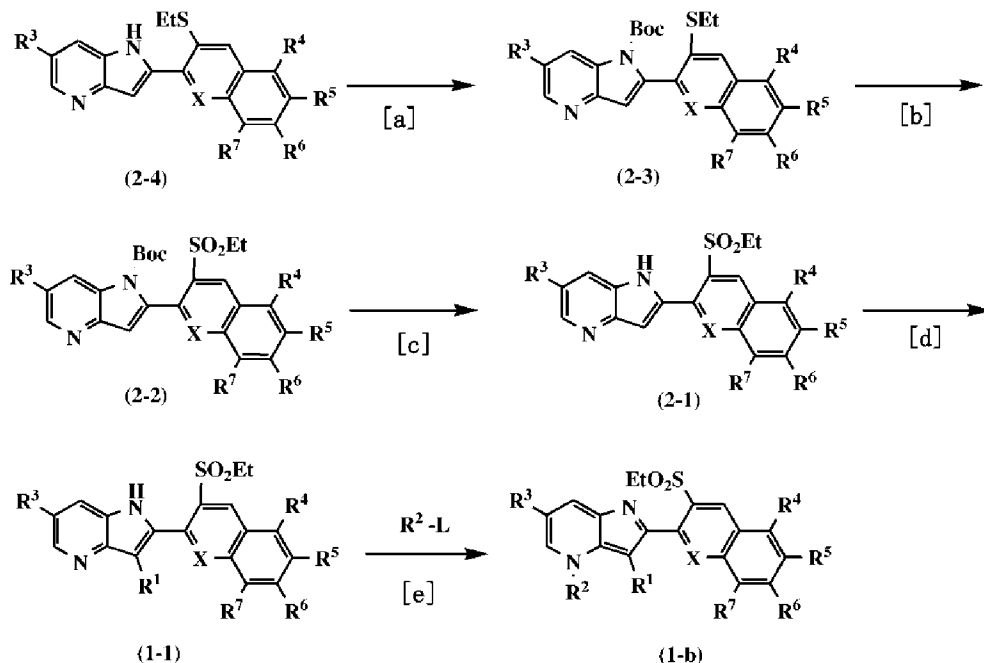
[0028]

Сполука 4Н-піролопіридину за даним винаходом або її сіль може бути одержана, наприклад, згідно зі способом одержання, описаним нижче, який є необмежувальним прикладом.

[0029]

Спосіб одержання 1 (випадок, коли Q являє собою Q-B)

[Хім. 3]



У формулах R¹, R², R³ і X приймають значення, визначені вище, Boc являє собою трет-бутоксикарбонільну групу, L представляє групу, що видаляється, таку як атом галогену.

[0030]

Спосіб одержання на стадії [a]

Сполука, представлена загальною формулою (2-3), може бути одержана зі сполуки, представлені загальною формулою (2-4), яку одержують згідно зі способом одержання проміжної сполуки, представленим нижче, або способом одержання, описаним в WO 2014/157600, згідно зі способом, описаним Greene T.W. у монографії Protective Groups in Organic Synthesis (John Wiley & Sons Inc.).

[0031]

Спосіб одержання на стадії [b]

Сполука, представлена загальною формулою (2-2), може бути одержана взаємодією сполуки, представлені загальною формулою (2-3), з окиснювачем в інертному розчиннику.

[0032]

Приклади окиснювача, використовуваного на цій стадії, включають пероксида, такі як розчин пероксиду водню, пербензойна кислота і м-хлорпероксибензойна кислота. Кількість використовуваного окиснювача вибирається відповідним чином в інтервалі від 2- до 5-кратної молярної кількості відносно сполуки, представлені загальною формулою (2-3).

[0033]

Інертний розчинник, використовуваний у цій реакції, може бути будь-яким розчинником, який суттєво не інгібує реакцію, і приклади такого розчинника включають ароматичні вуглеводні, такі як бензол, толуол і ксилол; галогеновані вуглеводні, такі як метиленхлорид і хлороформ; галогеновані ароматичні вуглеводні, такі як хлорбензол і дихлорбензол; нітрили, такі як ацетонітрил; складні ефіри, такі як етилацетат; органічні кислоти, такі як мурашина кислота і оцтова кислота; і полярні розчинники, такі як вода. Можна використовувати окремо один з цих інертних розчинників, і два або більше з них можна використовувати у вигляді суміші.

[0034]

Температура реакції придатним чином вибирається в інтервалі від -10 °C до температури

кипіння використовуваного інертного розчинника. Час реакції змінюється залежно від масштабу реакції, температури реакції і т. п. і не є однаковим у кожному випадку, але в основному вибирається як придатний в інтервалі від декількох хвилин до 48 годин. Після завершення реакції одержаний оксид виділяють з постреакційної суміші звичайним способом. При

5

необхідності для очищення сполуки, що представляє інтерес, можна використовувати перекристалізацію, колонкову хроматографію і т. д.

[0035]

Спосіб одержання на стадії [c]

10

Сполука, представлена загальною формулою (2-1), може бути одержана зі сполуки, представленої загальною формулою (2-2), згідно зі способом, описаним Greene T.W. у публікації Protective Groups in Organic Synthesis (John Wiley & Sons Inc.).

[0036]

Спосіб одержання на стадії [d]

15

Сполука, представлена загальною формулою (1-1), може бути одержана взаємодією сполуки, представленої загальною формулою (2-1), з галогенуючим агентом в інертному розчиннику.

[0037]

20

Приклади галогенуючого (хлоруючого, бромуючого або йодуючого) агента, використовуваного на цій стадії, включають молекули галогену, такі як молекули хлору, броду або йоду; галогенуючі агенти, такі як тіонілхлорид, сульфурилхлорид і трибромід фосфору; сукциніміди, такі як N-хлорсукцинімід (NCS), N-бромсукцинімід (NBS) і N-йодсукцинімід (NIS); і гідантоїни, такі як 1,3-дибром-5,5-диметилгідантоїн (DBH) і 1,3-дийод-5,5-диметилгідантоїн (DIH). Кількість використовуваного галогенуючого агента може бути вибрана відповідним чином в інтервалі від 1- до 5-кратної молярної кількості відносно сполуки, представленої загальною

25

формулою (2-1).

[0038]

30

Інертний розчинник, використовуваний при галогенуванні (хлоруванні, бромуванні або йодуванні), може являти собою будь-який розчинник, який суттєво не інгібує реакцію, і приклади такого розчинника включають ароматичні вуглеводні, такі як бензол, толуол і ксилол; галогеновані вуглеводні, такі як метиленхлорид і хлороформ; галогеновані ароматичні вуглеводні, такі як хлорбензол і дихлорбензол; нітрили, такі як ацетонітрил; складні ефіри, такі як етилацетат; органічні кислоти, такі як мурашина кислота і оцтова кислота; і полярні розчинники, такі як вода. Можна використовувати окремо один з цих інертних розчинників, і два або більше з них можна використовувати у вигляді суміші.

35

[0039]

40

Приклади фторууючого агента, який можна використовувати в цій реакції, включають біс(тетрафторборат) N-фтор-N'-(хлорметил)триетилендіаміну, Selectfluor, (PhSO₂)₂NF і трифлат N-фторпіридинію. Переважним є Selectfluor. Кількість використовуваного галогенуючого агента, такого як фторууючий реагент, звичайно становить від 1 до 5 молярних еквівалентів на 1 моль сполуки загальної формули (2-1), де R¹ являє собою атом йоду, атом броду або атом хлору.

[0040]

45

Приклади основи, яку можна використовувати в галогенуванні, такому як фторування, включають неорганічні основи, такі як гідроксид натрію, гідроксид калію, гідроксид кальцію, гідроксид барію, карбонат натрію, карбонат калію, гідрокарбонат калію, гідрокарбонат натрію і карбонат цезію; і аміни, такі як триетиламін, піридин і піперидин. Кількість використовуваної основи звичайно становить від 1 до 10 молярних еквівалентів на 1 моль сполуки, представленої загальною формулою (1-1).

[0041]

50

Органічний розчинник, використовуваний у галогенуванні, такому як фторування, конкретно не обмежений і може бути будь-яким органічним розчинником, інертним для реакції. Приклади органічного розчинника включають нітрильні розчинники, такі як ацетонітрил і бензонітрил; воду і суміш з двох або більше видів з них.

[0042]

55

Температура реакції при галогенуванні придатним чином вибирається в інтервалі від -10 °C до температури кипіння використовуваного інертного розчинника. Час реакції змінюється залежно від масштабу реакції, температури реакції і т. п. і не є однаковим у кожному випадку, але в основному вибирається як придатний в інтервалі від декількох хвилин до 48 годин. Після завершення реакції одержаний оксид виділяють з постреакційної суміші звичайним способом. При необхідності для очищення сполуки, що представляє інтерес, можна використовувати перекристалізацію, колонкову хроматографію і т. д.

60

[0043]

У випадку, коли R^1 у загальній формулі (1-1) являє собою атом фтору, бажана сполука також може бути одержана взаємодією сполуки загальної формули (1-1), де R^1 являє собою атом йоду, атом бромового або атом хлору, яку одержують на стадії d, з фторуючим агентом у присутності основи в інертному розчиннику звичайним способом, добре відомим фахівцям даної галузі техніки. У випадку, коли R^1 у загальній формулі (1-1) не є атомом галогену, тобто R^1 являє собою (a1) або будь-який з (a3)-(a7), бажана сполука може бути легко одержана відомим способом або методом, відомим per se.

[0044]

Спосіб одержання на стадії [e]

Сполука 4Н-піролопіридину, представлена загальною формулою (1-b), може бути одержана взаємодією сполуки, представленої загальною формулою (1-1), з R^2 -L у присутності основи в інертному розчиннику.

[0045]

Органічний розчинник, використовуваний у цій реакції, може бути будь-яким органічним розчинником, інертним для реакції. Приклади органічного розчинника включають ефірні розчинники, такі як діоксан, 1,2-диметоксіетан і тетрагідрофуран; ароматичні вуглеводневі розчинники, такі як толуол, бензол і ксилол; амідні розчинники, такі як N, N-диметилформамід, N, N-диметилацетамід і N-метилпіролідон; і суміш двох або більше видів з них.

[0046]

Приклади основи, яка може використовуватися у вищевказаній реакції, включають неорганічні основи, такі як гідроксид натрію, гідроксид калію, гідроксид кальцію, гідроксид барію, карбонат натрію, карбонат калію, гідрокарбонат калію, гідрокарбонат натрію, карбонат цезію і фосфат калію; алкокси, такі як трет-бутоксид калію, метоксид натрію і етоксид натрію; гідриди лужних металів, такі як гідрид натрію і гідрид калію; і аміни, такі як триетиламін, піридин і піперидин. Кількість використовуваної основи звичайно становить від 1 до 10 молярних еквівалентів на 1 моль сполуки, представленої загальною формулою (1-1).

[0047]

Оскільки ця реакція є еквімолярною реакцією реагентів, сполука, представлена загальною формулою (1-1), і R^2 -L використовуються в основному в еквімолярних кількостях, але будь-яке з них може використовуватися в надлишковій кількості.

[0048]

Температура реакції звичайно знаходиться в інтервалі від кімнатної температури до температури кипіння використовуваного розчинника. Час реакції звичайно становить від декількох хвилин до десятків годин. Реакцію переважно проводять в атмосфері інертного газу. Після завершення реакції сполуку, що представляє інтерес, виділяють з постреакційної суміші звичайним способом. При необхідності для очищення сполуки, що представляє інтерес, можна використовувати перекристалізацію, колонкову хроматографію і т. д.

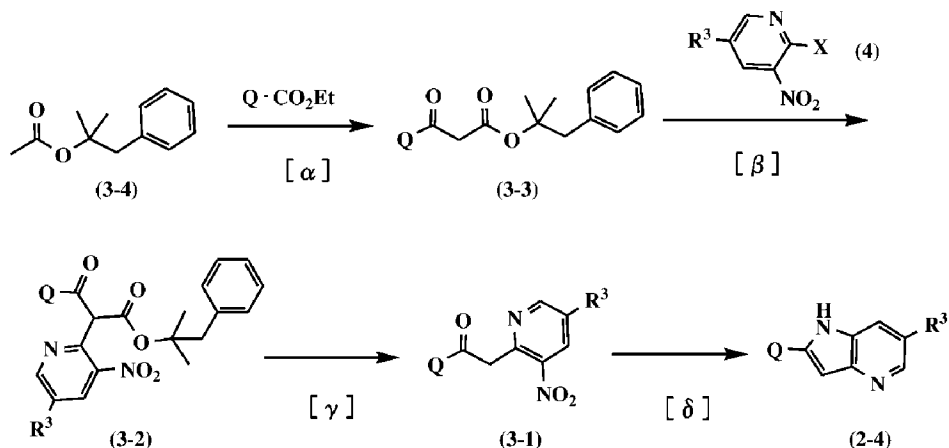
[0049]

Сполуки, які містять кільце, відмінне від кільця Q-B, можуть бути одержані за допомогою відомих реакцій або реакцій, відомих per se, чином, аналогічним способу одержання 1 вище.

[0050]

Спосіб одержання проміжної сполуки

[Хім. 4]



У формулах R^3 і Q приймають значення, визначені вище, і X представляє групу, що видаляється, таку як атом галогену.

[0051]]

Спосіб одержання на стадії $[\alpha]$

5 Сполука, представлена загальною формулою (3-3), може бути одержана реакцією конденсації Кляйзена (Org. React. 1942, 1, 266) сполуки, представленої загальною формулою (3-4), з похідним складного ефіру оцтової кислоти, представленого формулою $Q\text{-CO}_2\text{Et}$.

[0052]

Спосіб одержання на стадії $[\beta]$

10 Сполука, представлена загальною формулою (3-2), може бути одержана взаємодією β -кетоефіру, представленого загальною формулою (3-3), з нітросполукою, представленою загальною формулою (4), у присутності основи в інертному розчиннику.

[0053]

15 Органічний розчинник, використовуваний у цій реакції, конкретно не обмежений і може бути будь-яким органічним розчинником, інертним для реакції. Приклади органічного розчинника включають ефірні розчинники, такі як діоксан, 1,2-диметоксіетан і тетрагідрофуран; ароматичні вуглеводневі розчинники, такі як толуол, бензол і ксилол; амідні розчинники, такі як N , N -диметилформамід, N , N -диметилацетамід і N -метилпіролідон; і суміш двох або більше видів з них.

20 [0054]

Приклади основи, яка може використовуватися в цій реакції, включають неорганічні основи, такі як гідроксид натрію, гідроксид калію, гідроксид кальцію, гідроксид барію, карбонат натрію, карбонат калію, гідрокарбонат калію, гідрокарбонат натрію, карбонат цезію і фосфат калію; алкокси, такі як трет-бутоксид калію, метоксид натрію і етоксид натрію; гідриди лужних металів, такі як гідрид натрію і гідрид калію; і аміни, такі як триетиламін, піридин і піперидин. Кількість використовуваної основи звичайно становить від 1 до 10 молярних еквівалентів на 1 моль сполуки (3-3).

[0055]

30 Оскільки ця реакція є еквімолярною реакцією реагентів, сполука (3-3) і сполука (4) використовуються в основному в еквімолярних кількостях, але будь-яка з них може використовуватися в надлишковій кількості. Температура реакції звичайно знаходиться в інтервалі від кімнатної температури до температури кипіння використовуваного розчинника. Час реакції звичайно становить від декількох хвилин до десятків годин. Реакцію переважно проводять в атмосфері інертного газу. Після завершення реакції бажану сполуку (3-2) виділяють з постреакційної суміші звичайним способом. При необхідності для очищення бажаної сполуки можна використовувати перекристалізацію, колонкову хроматографію і т. д.

[0056]

Спосіб одержання на стадії $[\gamma]$

40 Сполука, представлена загальною формулою (3-1), може бути одержана обробкою кислотою сполуки, представленої загальною формулою (3-2), у присутності або за відсутності розчинника.

[0057]

45 Приклади кислоти, використовуваної в цій реакції, включають неорганічні кислоти, такі як соляна кислота, сірчана кислота і азотна кислота; органічні кислоти, такі як мурашина кислота, оцтова кислота, пропіонова кислота, трифтороцтова кислота і бензойна кислота; і сульфокислоти, такі як метансульфокислота і трифторметансульфокислота. Кількість використовуваної кислоти придатним чином вибирається в інтервалі від 1- до 10-кратної молярної кількості відносно складноефірної сполуки, представленої загальною формулою (3-2). У деяких випадках кислоту можна використовувати також як розчинник для цієї реакції.

50 [0058]

Інертний розчинник, використовуваний у цій реакції, може бути будь-яким розчинником, який суттєво не інгібує протікання реакції, і приклади такого розчинника включають ароматичні вуглеводні, такі як бензол, толуол і ксилол; галогеновані аліфатичні вуглеводні, такі як метиленхлорид, хлороформ і чотирихлористий вуглець; галогеновані ароматичні вуглеводні, такі як хлорбензол і дихлорбензол; амідні, такі як диметилформамід і диметилацетамід; кетони, такі як ацетон і метилетилкетон; і полярні розчинники, такі як 1,3-диметил-2-імідазолідинон. Можна використовувати окремо один з цих інертних розчинників, і два або більше з них можна використовувати у вигляді суміші. У випадку, коли кислота використовується також як розчинник, немає необхідності використовувати інший розчинник.

60 [0059]

Температура реакції може знаходитися в інтервалі від кімнатної температури до температури кипіння використовуваного інертного розчинника. Час реакції залежить від масштабу реакції і температури реакції, але в основному знаходиться в інтервалі від декількох хвилин до 48 годин.

Після завершення реакції бажану сполуку (3-1) виділяють з постреакційної суміші звичайним способом. При необхідності для очищення бажаної сполуки можна використовувати перекристалізацію, колонкову хроматографію і т. д.

[0060]

Спосіб одержання на стадії [δ]

Сполуку 4Н-піролопіридину, представлену загальною формулою (2-4), можна одержати відновленням і дегідратацією нітросполуки, представлені загальною формулою (3-1).

[0061]

Що стосується відновлення, можуть використовуватися умови відновлення нітрогруп, описані у відомій літературі (див. "New Lecture of Experimental Chemistry (Shin Jikken Kagaku Kouza)", vol. 15, Oxidation i Reduction II, 1977, edited by the Chemical Society of Japan, published by Maruzen).

[0062]

Приклади інертного розчинника, який може використовуватися в цій реакції, включають спирти, такі як метанол і етанол; прості ефіри, такі як тетрагідрофуран і діоксан; органічні кислоти, такі як мурашина кислота і оцтова кислота; і воду. Можна використовувати окремо один з цих інертних розчинників, і два або більше з них можна використовувати у вигляді суміші. Водний розчин кислоти, використовуваний як відновник в цій реакції, можна використовувати також як інертний розчинник для реакції.

[0063]

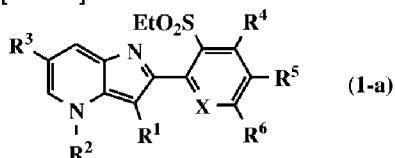
Приклади відновника, який може використовуватися в цій реакції, включають метал-кислоту і сіль металу. Приклади металу включають залізо, олово і цинк, приклади кислоти включають неорганічні кислоти, такі як соляна кислота і сірчана кислота, і органічні кислоти, такі як оцтова кислота, і приклади солі включають хлорид олова і хлорид амонію. Крім того, метал може бути комбінацією двох або більше з цих прикладів, і те ж саме стосується кислоти і солі. Що стосується кількості використовуваного відновника, то кількість металу відповідним чином вибирається в інтервалі приблизно від 1- до 10-кратної молярної кількості відносно нітросполуки, представлені загальною формулою (3-1), і кількість кислоти або солі відповідним чином вибирається в інтервалі приблизно від 0,05- до 10-кратної молярної кількості відносно нітросполуки, представлені загальною формулою (3-1). Температура реакції може бути вибрана в інтервалі від 0 до 150 °C. Час реакції міняється залежно від масштабу реакції, температури реакції і т. п., але в основному вибирається залежно від ситуації в інтервалі від декількох хвилин до приблизно 48 годин. Відновлення на цій стадії також можна проводити каталітичним гідруванням у присутності каталізатора. Приклади каталізатора включають паладій на вугіллі. Після завершення реакції бажану сполуку (2-4) виділяють з постреакційної суміші звичайним способом. При необхідності для очищення бажаної сполуки (2-4) можна використовувати перекристалізацію, дистиляцію, колонкову хроматографію і т. д. Сполуку 4Н-піролопіридину, представлену загальною формулою (2-4), одержану згідно зі схемою одержання, описаною вище, піддають взаємодії в способі одержання 1 з одержанням сполуки 4Н-піролопіридину, представлені загальною формулою (1). Проміжна сполука, використовувана для одержання сполуки, представлені загальною формулою (1), також може бути одержана згідно зі способом, описаним в WO 2014/157600.

[0064]

Конкретні приклади сполуки за даним винаходом наведені нижче. У наведених нижче таблицях "Me" означає метильну групу, "Et" означає етильну групу, "с-Pr" позначає циклопропильну групу, "Bn" означає бензильну групу, "Ph" означає фенільну групу, "піразол" означає піразольну групу, і "1,2,4-триазол" означає групу 1,2,4-триазолу. У стовпці "Фізична характеристика" показані температури плавлення (°C) або дані ЯМР. Дані ЯМР наведені в таблицях 17 і 18.

[0065]

[Xim. 5]



[0066]
[Таблиця 1]

Таблиця 1

Сполука №	R ¹	R ²	R ³	R ⁵	Фізична характеристика
1-1	Cl	Me	CF ₃	I	275-276
1-2	Cl	Et	CF ₃	I	
1-3	H	Me	CF ₃	I	297-299
1-4	H	Et	CF ₃	I	282-283
1-5	Cl	Me	CF ₃	c-Pr	289-290
1-6	Cl	Et	CF ₃	c-Pr	
1-7	Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CH=NOCH ₂ CF ₃	ЯМР
1-8	Cl	Me	CF ₃	OEt	290-291
1-9	Cl	Et	CF ₃	OEt	245-246
1-10	Cl	Me	CF ₃	OCH ₂ CF ₃	
1-11	Cl	Et	CF ₃	OCH ₂ CF ₃	154-156
1-12	H	Et	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	268-269
1-13	Cl	Me	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	268-269
1-14	Cl	Et	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	186-187
1-15	F	Me	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	273-274
1-16	F	Et	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	256-257
1-17	Cl	CH ₂ CN	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	ЯМР
1-18	Cl	CH ₂ C≡CH	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	ЯМР
1-19	Cl	n-Bu	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	ЯМР
1-20	Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	ЯМР
1-21	Cl	Me	CF ₃	4-F-Ph	293-294
1-22	Cl	Et	CF ₃	4-F-Ph	248-249
1-23	F	Me	CF ₃	4-F-Ph	282-283
1-24	F	Et	CF ₃	4-F-Ph	223-224
1-25	Br	Et	CF ₃	4-F-Ph	230-231

5 Кожний R⁴ і R⁶ являє собою атом водню, X являє собою атом азоту.

[0067]
[Таблиця 2]

Таблиця 2

Сполука №	R ¹	R ²	R ³	R ⁵	R ⁶	Фізична характеристика
1-26	H	Et	CF ₃	4-F-Ph	H	246-247
1-27	Me	Me	CF ₃	4-F-Ph	H	281-282
1-28	Me	Et	CF ₃	4-F-Ph	H	256-257
1-29	Cl	n-Pr	CF ₃	4-F-Ph	H	172-173
1-30	H	n-Pr	CF ₃	4-F-Ph	H	214-215
1-31	Cl	CH ₂ OMe	CF ₃	4-F-Ph	H	119-120
1-32	Cl	CH ₂ SMe	CF ₃	4-F-Ph	H	103-104
1-33	Cl	Et	CF ₃	3-CN-Ph	H	232-233
1-34	Cl	Et	CF ₃	4-CF ₃ -BnO	H	196-197
1-35	Cl	Et	CF ₃	3-CF ₃ -піразол-1-іл	H	246-247
1-36	H	Et	CF ₃	3-CF ₃ -піразол-1-іл	H	242-244
1-37	Cl	Me	CF ₃	H	1,2,4-триазол-1-іл	270-271
1-38	Cl	Et	CF ₃	H	1,2,4-триазол-1-іл	262-263
1-39	Cl	Me	CF ₃	H	3-CF ₃ -піразол-1-іл	
1-40	Cl	Et	CF ₃	H	3-CF ₃ -піразол-1-іл	
1-41	Cl	Me	CF ₃	H	піразол-1-іл	
1-42	Cl	Et	CF ₃	H	піразол-1-іл	

Таблиця 2

Сполука №	R ¹	R ²	R ³	R ⁵	R ⁶	Фізична характеристика
1-43	Cl	Me	CF ₃	3-OCF ₃ -Ph	H	237-238
1-44	Cl	Et	CF ₃	3-OCF ₃ -Ph	H	
1-45	Cl	Me	CF ₃	3-F-4-Cl-Ph	H	295-297
1-46	Cl	Et	CF ₃	3-F-4-Cl-Ph	H	264-265
1-47	Cl	Me	CF ₃	3-Cl-4-F-Ph	H	298-300
1-48	Cl	Et	CF ₃	3-Cl-4-F-Ph	H	266-267
1-49	Cl	Me	CF ₃	3,4-F ₂ -Ph	H	299-300
1-50	Cl	Et	CF ₃	3,4-F ₂ -Ph	H	

R⁴ являє собою атом водню, X являє собою атом азоту.

[0068]

[Таблиця 3]

5

Таблиця 3

Сполука №	R ¹	R ²	R ³	R ⁵	X	Фізична характеристика
1-51	Cl	Me	CF ₃	3,4,5-F ₃ -Ph	N	287-288
1-52	Cl	Et	CF ₃	3,4,5-F ₃ -Ph	N	
1-53	Cl	Me	CF ₃	3,5-F ₂ -Ph	N	
1-54	Cl	Et	CF ₃	3,5-F ₂ -Ph	N	
1-55	Cl	Me	CF ₃	3-Me-4-F-Ph	N	291-293
1-56	Cl	Et	CF ₃	3-Me-4-F-Ph	N	
1-57	Cl	Me	CF ₃	2-F-5-CF ₃ -Ph	N	290-292
1-58	Cl	Et	CF ₃	2-F-5-CF ₃ -Ph	N	276-277
1-59	Cl	Me	CF ₃	4-CN-Ph	N	
1-60	Cl	Et	CF ₃	4-CN-Ph	N	
1-61	Cl	Me	CF ₃	піразол-1-іл	N	
1-62	Cl	Et	CF ₃	піразол-1-іл	N	
1-63	Cl	Me	CF ₃	3-Br-піразол-1-іл	N	
1-64	Cl	Et	CF ₃	3-Br-піразол-1-іл	N	
1-65	Cl	Me	CF ₃	4-Cl-піразол-1-іл	N	
1-66	Cl	Et	CF ₃	4-Cl-піразол-1-іл	N	
1-67	Cl	Me	CF ₃	4-CF ₃ -піразол-1-іл	N	
1-68	Cl	Et	CF ₃	4-CF ₃ -піразол-1-іл	N	
1-69	Cl	Me	CF ₃	H	CH	
1-70	Cl	Me	CF ₃	I	CH	
1-71	Cl	Me	CF ₃	CF ₃	CH	
1-72	CN	Et	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	N	238-239
1-73	CN	Et	CF ₃	4-F-Ph	N	253-254
1-74	CN	Et	CF ₃	3-CN-Ph	N	273-274

Кожний R⁴ і R⁶ являє собою атом водню.

[0069]

[Таблиця 4]

10

Таблиця 4

Сполука №	R ¹	R ²	R ³	R ⁵	Фізична характеристика
1-75	Cl	CH ₂ OMe	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	ЯМР
1-76	Cl	Me	CF ₃	4-Et-Ph	277-279
1-77	Cl	Et	CF ₃	4-Et-Ph	272-274
1-78	Cl	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	235-237
1-79	F	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	230-232

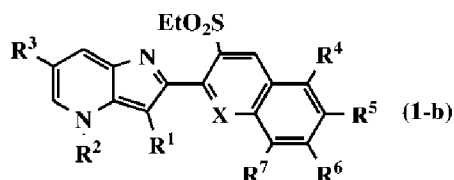
Таблиця 4

Сполука №	R ¹	R ²	R ³	R ⁵	Фізична характеристика
1-80	F	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	237-238
1-81	F	Аліл	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	224-225
1-82	F	CH ₂ OMe	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	155-156
1-83	F	CH ₂ OEt	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	171-172
1-84	F	CH ₂ -c-Pr	CF ₃	3-CF ₃ -Ph	202-203
1-85	F	CH ₂ OEt	CF ₃	c-Pr	132-134
1-86	F	CH ₂ CF ₃	CF ₃	c-Pr	70-71
1-87	F	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	c-Pr	139-140
1-88	F	CH ₂ C≡CH	CF ₃	c-Pr	52-53
1-89	F	Аліл	CF ₃	c-Pr	182-183
1-90	F	CH ₂ -c-Pr	CF ₃	c-Pr	187-188
1-91	F	CH ₂ OMe	CF ₃	c-Pr	174-175
1-92	Cl	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	c-Pr	207-208
1-93	Cl	CH ₂ OMe	CF ₃	c-Pr	198-199
1-94	F	Me	CF ₃	c-Pr	278-279
1-95	F	Et	CF ₃	c-Pr	252-253

Кожний R⁴ і R⁶ являє собою атом водню, X являє собою атом азоту.

[0070]

[Хім. 6]



5

[0071]

[Таблиця 5]

Таблиця 5

Сполука №	R ¹	R ²	R ³	R ⁵	R ⁶	Фізична характеристика
2-1	Cl	Me	CF ₃	H	H	
2-2	Cl	Me	CF ₃	Cl	H	
2-3	Cl	Me	CF ₃	H	Cl	
2-4	Cl	Me	CF ₃	Br	H	
2-5	Cl	Me	CF ₃	H	Br	ЯМР
2-6	Cl	Me	CF ₃	CF ₃	H	
2-7	Cl	Me	CF ₃	H	CF ₃	
2-8	Cl	Me	CF ₃	c-Pr	H	
2-9	Cl	Me	CF ₃	H	c-Pr	
2-10	Cl	Me	CF ₃	CN	H	
2-11	Cl	Me	CF ₃	H	CN	
2-12	Cl	Me	CF ₃	OCH ₂ CF ₃	H	
2-13	Cl	Me	CF ₃	H	OCH ₂ CF ₃	
2-14	Cl	Me	CF ₃	NHCOMe	H	
2-15	Cl	Me	CF ₃	H	NHCOMe	
2-16	Cl	Me	CF ₃	NHCO ₂ Et	H	
2-17	Cl	Me	CF ₃	H	NHCO ₂ Et	
2-18	Cl	Me	CF ₃	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	
2-19	Cl	Me	CF ₃	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	
2-20	Cl	Me	CF ₃	CHO	H	
2-21	Cl	Me	CF ₃	H	CHO	
2-22	Cl	Me	CF ₃	NH ₂	H	

Таблиця 5

Сполука №	R ¹	R ²	R ³	R ⁵	R ⁶	Фізична характеристика
2-23	Cl	Me	CF ₃	H	NH ₂	
2-24	F	Me	CF ₃	H	H	
2-25	F	Me	CF ₃	Cl	H	
2-26	F	Me	CF ₃	H	Cl	

Кожний R⁴ і R⁷ являє собою атом водню, X являє собою атом азоту.

[0072]

[Таблиця 6]

5

Таблиця 6

Сполука №	R ¹	R ²	R ³	R ⁵	R ⁶	Фізична характеристика
2-27	F	Me	CF ₃	Br	H	
2-28	F	Me	CF ₃	H	Br	
2-29	F	Me	CF ₃	CF ₃	H	
2-30	F	Me	CF ₃	H	CF ₃	
2-31	F	Me	CF ₃	c-Pr	H	
2-32	F	Me	CF ₃	H	c-Pr	
2-33	F	Me	CF ₃	CN	H	
2-34	F	Me	CF ₃	H	CN	
2-35	F	Me	CF ₃	OCH ₂ CF ₃	H	
2-36	F	Me	CF ₃	H	OCH ₂ CF ₃	
2-37	F	Me	CF ₃	NHCOMe	H	
2-38	F	Me	CF ₃	H	NHCOMe	
2-39	F	Me	CF ₃	NHCO ₂ Et	H	
2-40	F	Me	CF ₃	H	NHCO ₂ Et	
2-41	F	Me	CF ₃	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	
2-42	F	Me	CF ₃	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	
2-43	F	Me	CF ₃	CHO	H	
2-44	F	Me	CF ₃	H	CHO	
2-45	F	Me	CF ₃	NH ₂	H	
2-46	F	Me	CF ₃	H	NH ₂	
2-47	Cl	Et	CF ₃	H	H	
2-48	Cl	Et	CF ₃	H	H	
2-49	Cl	Et	CF ₃	Cl	H	
2-50	Cl	Et	CF ₃	H	Cl	
2-51	Cl	Et	CF ₃	Br	H	
2-52	Cl	Et	CF ₃	H	Br	ЯМР

Кожний R⁴ і R⁷ являє собою атом водню, і X являє собою атом азоту.

[0073]

[Таблиця 7]

10

Таблиця 7

Сполука №	R ¹	R ²	R ³	R ⁵	R ⁶	Фізична характеристика
2-53	Cl	Et	CF ₃	CF ₃	H	
2-54	Cl	Et	CF ₃	H	CF ₃	297-298
2-55	Cl	Et	CF ₃	c-Pr	H	
2-56	Cl	Et	CF ₃	H	c-Pr	
2-57	Cl	Et	CF ₃	CN	H	
2-58	Cl	Et	CF ₃	H	CN	
2-59	Cl	Et	CF ₃	OCH ₂ CF ₃	H	

Таблиця 7

Сполука №	R ¹	R ²	R ³	R ⁵	R ⁶	Фізична характеристика
2-60	Cl	Et	CF ₃	H	OCH ₂ CF ₃	
2-61	Cl	Et	CF ₃	NHCOMe	H	
2-62	Cl	Et	CF ₃	H	NHCOMe	
2-63	Cl	Et	CF ₃	NHCO ₂ Et	H	
2-64	Cl	Et	CF ₃	H	NHCO ₂ Et	
2-65	Cl	Et	CF ₃	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	
2-66	Cl	Et	CF ₃	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	
2-67	Cl	Et	CF ₃	CHO	H	
2-68	Cl	Et	CF ₃	H	CHO	
2-69	Cl	Et	CF ₃	NH ₂	H	
2-70	Cl	Et	CF ₃	H	NH ₂	
2-71	F	Et	CF ₃	H	H	
2-72	F	Et	CF ₃	H	H	
2-73	F	Et	CF ₃	Cl	H	
2-74	F	Et	CF ₃	H	Cl	
2-75	F	Et	CF ₃	Br	H	
2-76	F	Et	CF ₃	H	Br	ЯМР
2-77	F	Et	CF ₃	CF ₃	H	
2-78	F	Et	CF ₃	H	CF ₃	286-287

Кожний R⁴ і R⁷ являє собою атом водню, X являє собою атом азоту.

[0074]

[Таблиця 8]

5

Таблиця 8

Сполука №	R ¹	R ²	R ³	R ⁵	R ⁶	X	Фізична характеристика
2-79	F	Et	CF ₃	c-Pr	H	N	
2-80	F	Et	CF ₃	H	c-Pr	N	
2-81	F	Et	CF ₃	CN	H	N	
2-82	F	Et	CF ₃	H	CN	N	
2-83	F	Et	CF ₃	OCH ₂ CF ₃	H	N	
2-84	F	Et	CF ₃	H	OCH ₂ CF ₃	N	
2-85	F	Et	CF ₃	NHCOMe	H	N	
2-86	F	Et	CF ₃	H	NHCOMe	N	
2-87	F	Et	CF ₃	NHCO ₂ Et	H	N	
2-88	F	Et	CF ₃	H	NHCO ₂ Et	N	240-241
2-89	F	Et	CF ₃	CH=NOCH ₂ CF ₃	H	N	
2-90	F	Et	CF ₃	H	CH=NOCH ₂ CF ₃	N	
2-91	F	Et	CF ₃	CHO	H	N	
2-92	F	Et	CF ₃	H	CHO	N	
2-93	F	Et	CF ₃	NH ₂	H	N	
2-94	F	Et	CF ₃	H	NH ₂	N	
2-95	F	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CF ₃	H	N	
2-96	F	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	CF ₃	N	
2-97	F	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CN	H	N	
2-98	F	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	CN	N	
2-99	F	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Br	H	N	
2-100	F	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	Br	N	ЯМР
2-101	Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Br	H	N	
2-102	Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	Br	N	
2-103	Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CF ₃	H	N	
2-104	Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	CF ₃	N	

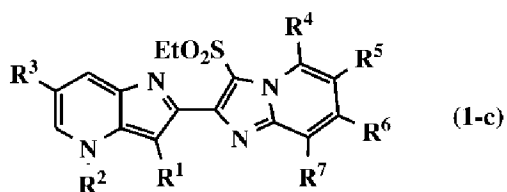
Таблиця 8

Сполука №	R ¹	R ²	R ³	R ⁵	R ⁶	X	Фізична характеристика
2-105	Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CN	H	N	
2-106	Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	CN	N	
2-107	Cl	Me	CF ₃	H	H	CH	
2-108	Cl	CH ₂ OMe	CF ₃	H	Br	N	119-120
2-109	Cl	CH ₂ -c-Pr	CF ₃	H	Br	N	150-151

Кожний R⁴ і R⁷ являє собою атом водню.

[0075]

[Хім. 7]



5

[0076]

[Таблиця 9]

Таблиця 9

Сполука №	R ¹	R ²	R ³	R ⁵	R ⁶	Фізична характеристика
3-1	Cl	Me	CF ₃	Cl	H	
3-2	Cl	Me	CF ₃	H	Cl	
3-3	Cl	Me	CF ₃	Br	H	
3-4	Cl	Me	CF ₃	H	Br	
3-5	Cl	Me	CF ₃	CF ₃	H	ЯМР
3-6	Cl	Me	CF ₃	H	CF ₃	ЯМР
3-7	Cl	Me	CF ₃	c-Pr	H	
3-8	Cl	Me	CF ₃	H	c-Pr	
3-9	F	Me	CF ₃	Cl	H	
3-10	F	Me	CF ₃	H	Cl	
3-11	F	Me	CF ₃	Br	H	
3-12	F	Me	CF ₃	H	Br	
3-13	F	Me	CF ₃	CF ₃	H	
3-14	F	Me	CF ₃	H	CF ₃	ЯМР
3-15	F	Me	CF ₃	c-Pr	H	
3-16	F	Me	CF ₃	H	c-Pr	
3-17	Cl	Et	CF ₃	Cl	H	
3-18	Cl	Et	CF ₃	H	Cl	ЯМР
3-19	Cl	Et	CF ₃	Br	H	ЯМР
3-20	Cl	Et	CF ₃	H	Br	
3-21	Cl	Et	CF ₃	CF ₃	H	ЯМР
3-22	Cl	Et	CF ₃	H	CF ₃	254-256
3-23	Cl	Et	CF ₃	c-Pr	H	ЯМР
3-24	Cl	Et	CF ₃	H	c-Pr	
3-25	F	Et	CF ₃	Cl	H	

10

Кожний R⁴ і R⁷ являє собою атом водню.

[0077]

[Таблиця 10]

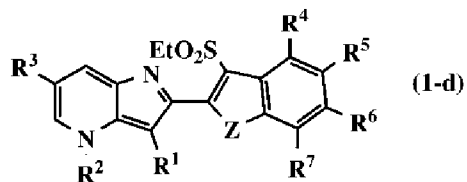
Таблиця 10

Сполука №	R ¹	R ²	R ³	R ⁵	R ⁶	Фізична характеристика
3-26	F	Et	CF ₃	H	Cl	
3-27	F	Et	CF ₃	Br	H	
3-28	F	Et	CF ₃	H	Br	
3-29	F	Et	CF ₃	CF ₃	H	ЯМР
3-30	F	Et	CF ₃	H	CF ₃	ЯМР
3-31	F	Et	CF ₃	c-Pr	H	
3-32	F	Et	CF ₃	H	c-Pr	
3-33	Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Br	H	
3-34	Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	Br	
3-35	Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CF ₃	H	
3-36	Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	CF ₃	ЯМР
3-37	Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CN	H	
3-38	Cl	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	CN	
3-39	F	CH ₂ CF ₃	CF ₃	Br	H	
3-40	F	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	Br	
3-41	F	CH ₂ CF ₃	CF ₃	CF ₃	H	
3-42	F	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	CF ₃	
3-43	H	Me	CF ₃	H	Br	ЯМР
3-44	Cl	n-Pr	CF ₃	H	CF ₃	212-214
3-45	H	Et	CF ₃	H	CF ₃	ЯМР
3-46	Br	Et	CF ₃	H	CF ₃	230-232

Кожний R⁴ і R⁷ являє собою атом водню.

[0078]

[Хім. 8]



5

[0079]

[Таблиця 11]

Таблиця 11

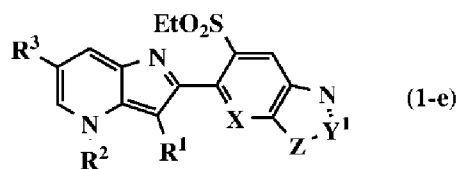
Сполука №	R ¹	R ²	R ³	R ⁵	R ⁶	Z	Фізична характеристика
4-1	Cl	Et	CF ₃	H	H	S	
4-2	Cl	Et	CF ₃	CF ₃	H	S	
4-3	Cl	Et	CF ₃	H	CF ₃	S	
4-4	Cl	Et	CF ₃	H	H	O	
4-5	Cl	Et	CF ₃	CF ₃	H	O	
4-6	Cl	Et	CF ₃	H	CF ₃	O	
4-7	Cl	Et	CF ₃	H	H	NMe	
4-8	Cl	Et	CF ₃	CF ₃	H	NMe	
4-9	Cl	Et	CF ₃	H	CF ₃	NMe	

10

Кожний R⁴ і R⁷ являє собою атом водню.

[0080]

[Хім. 9]



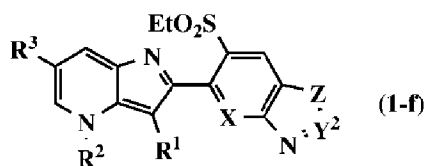
[0081]
[Таблиця 12]

Таблиця 12

Сполука №	R ¹	R ²	R ³	X	Y ¹	Z	Фізична характеристика
5-1	Cl	Et	CF ₃	CH	C-Me	O	
5-2	Cl	Et	CF ₃	CH	C-Me	S	
5-3	Cl	Et	CF ₃	CH	C-Me	NMe	
5-4	Cl	Et	CF ₃	CH	C-c-Pr	O	
5-5	Cl	Et	CF ₃	CH	C-c-Pr	S	
5-6	Cl	Et	CF ₃	CH	C-c-Pr	NMe	

5

[0082]
[Хім. 10]



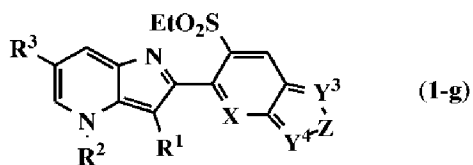
[0083]
[Таблиця 13]

10

Таблиця 13

Сполука №	R ¹	R ²	R ³	X	Y ²	Z	Фізична характеристика
6-1	Cl	Et	CF ₃	CH	C-Me	O	
6-2	Cl	Et	CF ₃	CH	C-Me	S	
6-3	Cl	Et	CF ₃	CH	C-Me	NMe	
6-4	Cl	Et	CF ₃	CH	C-c-Pr	O	
6-5	Cl	Et	CF ₃	CH	C-c-Pr	S	
6-6	Cl	Et	CF ₃	CH	C-c-Pr	NMe	

[0084]
[Хім. 11]



[0085]
[Таблиця 14]

15

Таблиця 14

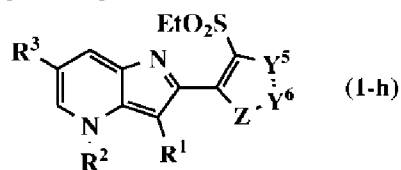
Сполука №	R ¹	R ²	R ³	X	Y ³	Y ⁴	Z	Фізична характеристика
7-1	Cl	Et	CF ₃	CH	CH	N	NMe	
7-2	Cl	Et	CF ₃	CH	CH	N	N-i-Pr	
7-3	Cl	Et	CF ₃	CH	CH	N	NCH ₂ CF ₃	

Таблиця 14

Сполука №	R ¹	R ²	R ³	X	Y ³	Y ⁴	Z	Фізична характеристика
7-4	Cl	Et	CF ₃	CH	CH	N	NCHF ₂	
7-5	Cl	Et	CF ₃	CH	CH	N	O	
7-6	Cl	Et	CF ₃	CH	N	CH	NMe	
7-7	Cl	Et	CF ₃	CH	N	CH	N-i-Pr	
7-8	Cl	Et	CF ₃	CH	N	CH	NCH ₂ CF ₃	
7-9	Cl	Et	CF ₃	CH	N	CH	NCHF ₂	
7-10	Cl	Et	CF ₃	CH	N	CH	O	

[0086]

[Хім. 12]



5

[0087]

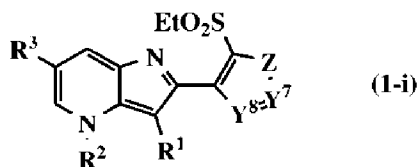
[Таблиця 15]

Таблиця 15

Сполука №	R ¹	R ²	R ³	Y ⁵	Y ⁶	Z	Фізична характеристика
8-1	Cl	Et	CF ₃	CH	CBr	S	
8-2	Cl	Et	CF ₃	CH	C-(3-CF ₃ -Ph)	S	
8-3	Cl	Et	CF ₃	CH	C-(4-F-Ph)	S	
8-4	Cl	Et	CF ₃	CH	CBr	O	
8-5	Cl	Et	CF ₃	CH	C-(3-CF ₃ -Ph)	O	
8-6	Cl	Et	CF ₃	CH	C-(4-F-Ph)	O	
8-7	Cl	Et	CF ₃	N	CBr	NMe	
8-8	Cl	Et	CF ₃	N	C-(3-CF ₃ -Ph)	NMe	
8-9	Cl	Et	CF ₃	N	C-(4-F-Ph)	NMe	
8-10	Cl	Et	CF ₃	N	CBr	S	
8-11	Cl	Et	CF ₃	N	C-(3-CF ₃ -Ph)	S	
8-12	Cl	Et	CF ₃	N	C-(4-F-Ph)	S	

[0088]

[Хім. 13]



10

[0089]

[Таблиця 16]

Таблиця 16

Сполука №	R ¹	R ²	R ³	Y ⁷	Y ⁸	Z	Фізична характеристика
9-1	Cl	Et	CF ₃	CBr	CH	S	
9-2	Cl	Et	CF ₃	C-(3-CF ₃ -Ph)	CH	S	
9-3	Cl	Et	CF ₃	C-(4-F-Ph)	CH	S	
9-4	Cl	Et	CF ₃	CBr	CH	O	

Таблиця 16

Сполука №	R ¹	R ²	R ³	Y ⁷	Y ⁸	Z	Фізична характеристика
9-5	Cl	Et	CF ₃	C-(3-CF ₃ -Ph)	CH	O	
9-6	Cl	Et	CF ₃	C-(4-F-Ph)	CH	O	
9-7	Cl	Et	CF ₃	CBr	N	NMe	
9-8	Cl	Et	CF ₃	C-(3-CF ₃ -Ph)	N	NMe	
9-9	Cl	Et	CF ₃	C-(4-F-Ph)	N	NMe	
9-10	Cl	Et	CF ₃	CBr	N	S	
9-11	Cl	Et	CF ₃	C-(3-CF ₃ -Ph)	N	S	
9-12	Cl	Et	CF ₃	C-(4-F-Ph)	N	S	

[0090]

[Таблиця 17]

Таблиця 17

Сполука №	Дані ¹ H-ЯМР (CDCl ₃)
1-7	9,20 (д, 1H), 8,76 (д, 1H), 8,36 (д, 1H), 8,34 (с, 1H), 8,01 (д, 1H), 5,51 (кв, 2H), 4,63 (кв, 2H), 4,36 (кв, 2H), 1,35 (т, 3H)
1-17	9,21 (д, 1H), 8,69 (д, 1H), 8,33 (д, 1H), 8,12 (д, 1H), 7,97 (д, 1H), 7,92 (дд, 1H), 7,79 (дд, 1H), 7,71 (дд, 1H), 3,92 (кв, 2H), 1,39 (т, 3H)
1-18	9,20 (д, 1H), 8,69 (д, 1H), 8,46 (д, 1H), 8,32 (д, 1H), 7,97 (д, 1H), 7,93 (дд, 1H), 7,78 (дд, 1H), 7,72 (дд, 1H), 5,81 (д, 2H), 3,94 (кв, 2H), 2,91 (т, 1H), 1,38 (т, 3H)
1-19	9,19 (д, 1H), 8,69 (д, 1H), 8,30 (д, 1H), 8,01 (д, 1H), 7,97 (д, 1H), 7,93 (дд, 1H), 7,78 (дд, 1H), 7,71 (дд, 1H), 4,85 (т, 2H), 3,94 (кв, 2H), 1,88 (м, 2H), 1,51 (м, 2H), 1,38 (т, 3H), 1,02 (т, 3H)
1-20	9,21 (д, 1H), 8,68 (д, 1H), 8,34 (д, 1H), 7,99 (д, 1H), 7,96 (д, 1H), 7,91 (дд, 1H), 7,78 (дд, 1H), 7,71 (дд, 1H), 5,52 (кв, 2H), 3,89 (кв, 2H), 1,35 (т, 3H)
2-5	9,02 (с, 1H), 8,47 (с, 1H), 8,30 (с, 1H), 7,95 (с, 1H), 7,94 (с, 1H), 7,84 (дд, 1H), 4,61 (с, 3H), 3,92 (кв, 2H), 1,35 (т, 3H)
2-52	9,02 (с, 1H), 8,48 (с, 1H), 8,30 (с, 1H), 8,00 (с, 1H), 7,94 (д, 1H), 7,85 (дд, 1H), 4,94 (кв, 2H), 3,90 (кв, 2H), 1,77 (т, 3H), 1,35 (т, 3H)
2-76	9,04 (с, 1H), 8,47 (с, 1H), 8,28 (с, 1H), 7,99 (с, 1H), 7,93 (д, 1H), 7,84 (дд, 1H), 4,70 (кв, 2H), 4,10 (кв, 2H), 1,79 (т, 3H), 1,40 (т, 3H)
2-100	9,04 (с, 1H), 8,47 (с, 1H), 8,31 (с, 1H), 7,96 (с, 1H), 7,94 (д, 1H), 7,85 (дд, 1H), 5,15 (кв, 2H), 4,28 (кв, 2H), 1,40 (т, 3H)

5

[0091]

[Таблиця 18]

Таблиця 18

Сполука №	Дані ¹ H-ЯМР (CDCl ₃)
3-5	9,61 (с, 1H), 8,35 (с, 1H), 7,95 (д, 1H), 7,92 (с, 1H), 7,64 (д, 1H), 4,63 (с, 3H), 4,05 (кв, 2H), 1,43 (т, 3H)
3-6	9,36 (д, 1H), 8,34 (с, 1H), 8,15 (с, 1H), 7,92 (с, 1H), 7,23 (д, 1H), 4,62 (с, 3H), 4,05 (кв, 2H), 1,42 (т, 3H)
3-14	9,43 (д, 1H), 8,33 (с, 1H), 8,13 (с, 1H), 7,92 (с, 1H), 7,22 (д, 1H), 4,44 (с, 3H), 4,22 (кв, 2H), 1,43 (т, 3H)
3-18	9,15 (д, 1H), 8,32 (с, 1H), 7,96 (с, 1H), 7,84 (с, 1H), 7,06 (д, 1H), 4,94 (кв, 2H), 4,01 (кв, 2H), 1,75 (т, 3H), 1,40 (т, 3H)
3-19	9,37 (с, 1H), 8,31 (с, 1H), 7,96 (с, 1H), 7,74 (д, 1H), 7,56 (д, 1H), 4,93 (кв, 2H), 4,01 (кв, 2H), 1,75 (т, 3H), 1,43 (т, 3H)
3-21	9,61 (с, 1H), 8,34 (с, 1H), 7,98 (д, 1H), 7,96 (с, 1H), 7,64 (д, 1H), 4,95 (кв, 2H), 4,07 (кв, 2H), 1,43 (т, 3H)

Сполука №	Дані ¹ H-ЯМР (CDCl ₃)
	2H), 1,76 (т, 3H), 1,44 (т, 3H)
3-23	8,98 (с, 1H), 8,29 (с, 1H), 7,94 (с, 1H), 7,73 (д, 1H), 7,18 (д, 1H), 4,92 (кв, 2H), 3,92 (кв, 2H), 2,01 (м, 1H), 1,74 (т, 3H), 1,413 (т, 3H), 1,07 (м, 2H), 0,78 (м, 2H)
3-29	9,71 (с, 1H), 8,33 (с, 1H), 7,97 (с, 1H), 7,95 (д, 1H), 7,63 (д, 1H), 4,70 (кв, 2H), 4,26 (кв, 2H), 1,76 (т, 3H), 1,45 (т, 3H)
3-30	9,45 (д, 1H), 8,33 (с, 1H), 8,14 (с, 1H), 7,97 (с, 1H), 7,22 (д, 1H), 4,70 (кв, 2H), 4,25 (кв, 2H), 1,76 (т, 3H), 1,43 (т, 3H)
3-36	9,36 (д, 1H), 8,33 (с, 1H), 8,14 (с, 1H), 7,97 (с, 1H), 7,22 (д, 1H), 4,70 (кв, 2H), 4,25 (кв, 2H), 1,76 (т, 3H), 1,43 (т, 3H)
3-43	9,23 (д, 1H), 8,39 (с, 1H), 7,967 (с, 1H), 7,96 (с, 1H), 7,29 (с, 1H), 7,12 (д, 1H), 4,27 (с, 3H), 4,16 (кв, 2H), 1,35 (т, 3H)
3-45	9,52 (д, 1H), 8,39 (с, 1H), 8,07 (с, 1H), 8,01 (с, 1H), 7,52 (с, 1H), 7,19 (д, 1H), 4,59 (кв, 2H), 4,27 (кв, 2H), 1,74 (т, 3H), 1,38 (т, 3H)

[0092]

- 5 Сільськогосподарський і садівницький інсектицид, який включає сполуку 4H-піролопіридину, представлену загальною формулою (1), за даним винаходом або її сіль як активний інгредієнт, придатний для контролю різних шкідників, які можуть пошкодити рис-падді, фруктові дерева, овочеві і інші культури і декоративні квітучі рослини. Цільовими шкідниками є, наприклад, сільськогосподарські і лісові шкідники, садові шкідники, шкідники зерна, що зберігається, санітарні шкідники, нематоди і т. д.

[0093]

- 10 Конкретні приклади шкідників, нематод і т. д. включають наступних шкідників:
 види ряду лускокрилих (Lepidoptera), такі як *Parasa consocia*, *Anomis mesogona*, *Papilio xuthus*, *Matsumuraeses azukivora*, *Ostrinia scapulalis*, *Spodoptera exempta*, *Hyphantria cunea*, *Ostrinia furnacalis*, *Pseudaletia separata*, *Tinea translucens*, *Bactra furfurana*, *Parnara guttata*, *Marasmia exigua*, *Parnara guttata*, *Sesamia inferens*, *Brachmia triannulella*, *Monema flavescens*,
 15 *Trichoplusia ni*, *Pleuroptia ruralis*, *Cystidia couaggaria*, *Lampides boeticus*, *Cephonodes hylas*, *Helicoverpa armigera*, *Phalerodonta manleyi*, *Eumeta japonica*, *Pieris brassicae*, *Malacosoma neustria testacea*, *Stathmopoda masinissa*, *Cuphodes diospyrosella*, *Archips xylosteanus*, *Agrotis segetum*, *Tetramoera schistaceana*, *Papilio machaon hippocrates*, *Endoclyta sinensis*, *Lyonetia prunifoliella*, *Phyllonorycter ringoneella*, *Cydia kurokoi*, *Eucoenogenes aestuosa*, *Lobesia botrana*,
 20 *Latoia sinica*, *Euzophora batangensis*, *Phalonidia mesotypa*, *Spilosoma imparilis*, *Glyphodes pyloalis*, *Olethreutes mori*, *Tineola bisselliella*, *Endoclyta excrescens*, *Nemapogon granellus*, *Synanthedon hector*, *Cydia pomonella*, *Plutella xylostella*, *Cnaphalocrocis medinalis*,

[0094]

- 25 *Sesamia calamistis*, *Scirpophaga incertulas*, *Pediasia teterrellus*, *Phthorimaea operculella*, *Stauropus fagi persimilis*, *Etiella zinckenella*, *Spodoptera exigua*, *Palpifer sexnotata*, *Spodoptera mauritia*, *Scirpophaga innotata*, *Xestia c-nigrum*, *Spodoptera depravata*, *Ephestia kuehniella*, *Angerona prunaria*, *Clostera anastomosis*, *Pseudoplusia includens*, *Matsumuraeses falcana*, *Helicoverpa assulta*, *Autographa nigrisigna*, *Agrotis ipsilon*, *Euproctis pseudoconspersa*, *Adoxophyes orana*, *Caloptilia theivora*, *Homona magnanima*, *Ephestia elutella*, *Eumeta minuscula*, *Clostera anachoreta*, *Heliiothis maritima*, *Sparganothis pilleriana*, *Busseola fusca*, *Euproctis subflava*, *Biston robustum*, *Heliiothis zea*, *Aedia leucomelas*, *Narosoideus flavidorsalis*, *Viminia rumicis*, *Bucculatrix pyrivorella*, *Grapholita molesta*, *Spulerina astaurota*, *Ectomyelois pyrivorella*, *Chilo suppressalis*, *Acrolepiopsis sapporensis*, *Plodia interpunctella*, *Hellula undalis*, *Sitotroga cerealella*, *Spodoptera litura*, види сімейства листовійок (Tortricidae) (*Eucosma aporema*), *Acleris comariana*, *Scopelodes contractus*, *Orgyia thyellina*, *Spodoptera frugiperda*, *Ostrinia zaguliaevi*, *Naranga aenescens*, *Andraca bipunctata*, *Paranthrene regalis*, *Acosmeryx castanea*, *Phyllocnistis toparcha*, *Endopiza viteana*, *Eupoecillia ambiguella*, *Anticarsia gemmatalis*, *Cnephasia cinereipalpana*,

[0095]

- 40 *Lymantria dispar*, *Dendrolimus spectabilis*, *Leguminivora glycinivorella*, *Maruca testulalis*, *Matsumuraeses phaseoli*, *Caloptilia soyella*, *Phyllocnistis citrella*, *Omiodes indicata*, *Archips fuscocupreanus*, *Acanthoplusia agnata*, *Bambalina* sp., *Carposina niponensis*, *Conogethes punctiferalis*, *Synanthedon* sp., *Lyonetia clerkella*, *Papilio helenus*, *Colias erate poliographus*, *Phalera flavescens*, види сімейства білянок (Pieridae), такі як *Pieris rapae crucivora* і *Pieris rapae*, *Euproctis similis*, *Acrolepiopsis suzukiella*, *Ostrinia nubilalis*, *Mamestra brassicae*, *Ascotis selenaria*,

Phtheochroides clandestina, *Hoshinoa adumbratana*, *Odonestis pruni japonensis*, *Triaena intermedia*, *Adoxophyes orana fasciata*, *Grapholita inopinata*, *Spilonota ocellana*, *Spilonota lechriaspis*, *Illiberis pruni*, *Argyresthia conjugella*, *Caloptilia zachrysa*, *Archips breviplicanus*, *Anomis flava*, *Pectinophora gossypiella*, *Notarcha derogata*, *Diaphania indica*, *Heliothis virescens* i *Earias cupreoviridis*;

5 [0096]

види ряду напівтвердокрилих або клопів (Hemiptera), такі як *Nezara antennata*, *Stenotus rubrovittatus*, *Graphosoma rubrolineatum*, *Trigonotylus coelestialium*, *Aeschynoteles maculatus*, *Creontiades pallidifer*, *Dysdercus cingulatus*, *Chrysomphalus ficus*, *Aonidiella aurantii*, *Graptosaltia nigrofusca*, *Blissus leucopterus*, *Icerya purchasi*, *Piezodorus hybneri*, *Lagynotomus elongatus*,
10 *Thaia subrufa*, *Scotinophara lurida*, *Sitobion ibarae*, *Stariodes iwasakii*, *Aspidiotus destructor*, *Tayloriylus pallidulus*, *Myzus mumecola*, *Pseudaulacaspis prunicola*, *Acyrtosiphon pisum*, *Anacanthocoris stricornis*, *Ectometopterus micantulus*, *Eysarcoris lewisi*, *Molipteryx fuliginosa*, *Cicadella viridis*, *Rhopalosiphum rufiabdominalis*, *Saissetia oleae*, *Trialeurodes vaporariorum*,

[0097]

15 *Aguriahana quercus*, *Lygus* spp., *Euceraphis punctipennis*, *Andaspis kashicola*, *Coccus pseudomagnoliarum*, *Cavelerius saccharivorus*, *Galeatus spinifrons*, *Macrosiphoniella sanborni*, *Aonidiella citrina*, *Halyomorpha mista*, *Stephanitis fasciicarina*, *Trioza camphorae*, *Leptocorisa chinensis*, *Trioza quercicola*, *Uhrerites latius*, *Erythroneura comes*, *Paromius exiguus*, *Duplaspidiotus claviger*, *Nephotettix nigropictus*, *Halticellus insularis*, *Perkinsiella saccharicida*, *Psylla malivorella*,
20 *Anomomeura mori*, *Pseudococcus longispinis*, *Pseudaulacaspis pentagona*, *Pulvinaria kuwacola*, *Apolygus lucorum*, *Togo hemipterus*, *Toxoptera aurantii*, *Saccharicoccus sacchari*, *Geocica lucifuga*, *Numata muii*, *Comstockaspis pernicio*, *Unaspis citri*, *Aulacorthum solani*, *Eysarcoris ventralis*, *Bemisia argentifolii*, *Cicadella spectra*, *Aspidiotus hederae*, *Liorhyssus hyalinus*, *Calophya nigradorsalis*, *Sogatella furcifera*, *Megoura crassicauda*,

25 [0098]

Brevicoryne brassicae, *Aphis glycines*, *Leptocorisa oratorius*, *Nephotettix virescens*, *Uroeucon formosanum*, *Cyrtopeltis tenuis*, *Bemisia tabaci*, *Lecanium persicae*, *Parlatoria theae*, *Pseudaonidia paeoniae*, *Empoasca onukii*, *Plautia stali*, *Dysaphis tulipae*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Stephanitis pyrioides*, *Ceroplastes ceriferus*, *Parlatoria camelliae*, *Apolygus spinolai*, *Nephotettix cincticeps*,
30 *Glaucias subpunctatus*, *Orthotylus flavosparsus*, *Rhopalosiphum maidis*, *Peregrinus maidis*, *Eysarcoris parvus*, *Cimex lectularius*, *Psylla abietis*, *Nilaparvata lugens*, *Psylla tobirae*,

[0099]

Eurydema rugosum, *Schizaphis piricola*, *Psylla pyricola*, *Parlatoreopsis pyri*, *Stephanitis nashi*, *Dysmicoccus wistariae*, *Lepholeucaspis japonica*, *Sappaphis piri*, *Lipaphis erysimi*, *Neotoxoptera formosana*, *Rhopalosiphum nymphaeae*, *Edwardsiana rosae*, *Pinnaspis aspidistrae*, *Psylla alni*,
35 *Speusotettix subfuscus*, *Alnetoidia alneti*, *Sogatella panicola*, *Adelphocoris lineolatus*, *Dysdercus poecilus*, *Parlatoria ziziphi*, *Uhrerites debile*, *Laodelphax striatellus*, *Eurydema pulchrum*, *Cletus trigonus*, *Clovium punctata*, *Empoasca* spp., *Coccus hesperidum*, *Pachybrachius luridus*, *Planococcus kraunhiae*, *Stenotus binotatus*, *Arboridia apicalis*, *Macrosteles fascifrons*, *Dolycoris baccarum*,
40 *Adelphocoris triannulatus*, *Viteus vitifolii*, *Acanthocoris sordidus*, *Leptocorisa acuta*, *Macropes obnubilus*, *Cletus punctiger*, *Riptortus clavatus*, *Paratrioza cockerelli*,

[0100]

Aphrophora costalis, *Lygus disponi*, *Lygus saundersi*, *Crisicoccus pini*, *Empoasca abietis*, *Crisicoccus matsumotoi*, *Aphis craccivora*, *Megacopta punctatissimum*, *Eysarcoris guttiger*,
45 *Lepidosaphes beekii*, *Diaphorina citri*, *Toxoptera citricidus*, *Planococcus citri*, *Dialeurodes citri*, *Aleurocanthus spiniferus*, *Pseudococcus citriculus*, *Zyginella citri*, *Pulvinaria citricola*, *Coccus discrepans*, *Pseudaonidia duplex*, *Pulvinaria aurantii*, *Lecanium corni*, *Nezara viridula*, *Stenodema calcaratum*, *Rhopalosiphum padi*, *Sitobion akebiae*, *Schizaphis graminum*, *Sorhoanus tritici*, *Brachycaudus helichrysi*, *Carpocoris purpureipennis*, *Myzus persicae*, *Hyalopterus pruni*, *Aphis farinosa yanagicola*, *Metasalis populi*, *Unaspis yanonensis*, *Mesohomotoma camphorae*, *Aphis spiraecola*, *Aphis pomi*, *Lepidosaphes ulmi*, *Psylla mali*, *Heterocordylus flavipes*, *Myzus malisuctus*,
50 *Aphidonuguis mali*, *Orientus ishidae*, *Ovatus malicolens*, *Eriosoma lanigerum*, *Ceroplastes rubens* i *Aphis gossypii*;

[0101]

55 види ряду твердокрилих (Coleoptera), такі як *Xystrocera globosa*, *Paederus fuscipes*, *Eucetonia roelofsi*, *Callosobruchus chinensis*, *Cylas formicarius*, *Hypera postica*, *Echinocnemus squameus*, *Oulema oryzae*, *Donacia provosti*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Colasposoma dauricum*, *Euscepes postfasciatus*, *Epilachna varivestis*, *Acanthoscelides obtectus*, *Diabrotica virgifera virgifera*, *Involvulus cupreus*, *Aulacophora femoralis*, *Bruchus pisorum*, *Epilachna vigintioctomaculata*, *Carpophilus dimidiatus*, *Cassida nebulosa*, *Luperomorpha tenebrosa*, *Phyllotreta striolata*, *Psacotha hilaris*,

60

Aeolesthes chrysothrix, *Curculio sikkimensis*, *Carpophilus hemipterus*, *Oxycetonia jucunda*, *Diabrotica* spp., *Mimela splendens*, *Sitophilus zeamais*, *Tribolium castaneum*, *Sitophilus oryzae*, *Palorus subdepressus*, *Melolontha japonica*, *Anoplophora malasiaca*, *Neatus picipes*, *Leptinotarsa decemlineata*,

5 [0102]

Diabrotica undecimpunctata howardi, *Sphenophorus venatus*, *Crioceris quatuordecimpunctata*, *Conotrachelus nenuphar*, *Ceuthorrhynchidius albosuturalis*, *Phaedon brassicae*, *Lasioderma serricornis*, *Sitona japonicus*, *Adoretus tenuimaculatus*, *Tenebrio molitor*, *Basilepta balyi*, *Hypera nigrirostris*, *Chaetocnema concinna*, *Anomala cuprea*, *Heptophylla picea*, *Epilachna*

10 *vigintioctopunctata*, *Diabrotica longicornis*, *Eucetonia pilifera*, *Agriotes* spp., *Attagenus unicolor japonicus*, *Pagria signata*, *Anomala rufocuprea*, *Palorus ratzeburgii*, *Alphitobius laevigatus*, *Anthrenus verbasci*, *Lyctus brunneus*, *Tribolium confusum*, *Medythia nigrobilineata*, *Xylotrechus pyrrhoderus*, *Epitrix cucumeris*, *Tomicus piniperda*, *Monochamus alternatus*, *Popillia japonica*, *Epicauta gorhami*, *Sitophilus zeamais*, *Rhynchites heros*, *Listroderes costirostris*, *Callosobruchus maculatus*, *Phyllobius armatus*, *Anthonomus pomorum*, *Linnaeaidea aenea* i *Anthonomus grandis*;

15 [0103]

види ряду двокрилих (Diptera), такі як *Culex pipiens pallens*, *Pegomya hyoscyami*, *Liriomyza huidobrensis*, *Musca domestica*, *Chlorops oryzae*, *Hydrellia sasakii*, *Agromyza oryzae*, *Hydrellia griseola*, *Hydrellia griseola*, *Ophiomyia phaseoli*, *Dacus cucurbitae*, *Drosophila suzukii*, *Rhagochlaena*

20 *japonica*, *Muscina stabulans*, види сімейства горбаток або форид (Phoridae), такі як *Megaselia spiracularis*, *Clogmia albipunctata*, *Tipula aino*, *Phormia regina*, *Culex tritaeniorhynchus*, *Anopheles sinensis*, *Hylemya brassicae*, *Asphondylia* sp., *Delia platura*, *Delia antiqua*, *Rhagoletis cerasi*, *Culex pipiens molestus* Forskal, *Ceratitis capitata*, *Bradysia agrestis*, *Pegomya cunicularia*, *Liriomyza sativae*, *Liriomyza bryoniae*, *Chromatomyia horticola*, *Liriomyza chinensis*, *Culex quinquefasciatus*,

25 *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Liriomyza trifolii*, *Liriomyza sativae*, *Dacus dorsalis*, *Dacus tsuneonis*, *Sitodiplosis mosellana*, *Meromuza nigriventris*, *Anastrepha ludens* i *Rhagoletis pomonella*;

[0104]

види ряду перетинчастокрилих (Hymenoptera), такі як *Pristomyrmex pungens*, види сімейства бетлід (Bethyidae), *Monomorium pharaonis*, *Pheidole noda*, *Athalia rosae*, *Dryocosmus kuriphilus*,

30 *Formica fusca japonica*, види підродини веспін (Vespinae), *Athalia infumata infumata*, *Arge pagana*, *Athalia japonica*, *Acromyrmex* spp., *Solenopsis* spp., *Arge mali* i *Ochetellus glaber*;

[0105]

види ряду прямокрилих (Orthoptera), такі як *Homorocoryphus lineosus*, *Gryllotalpa* sp., *Oxya hyla intricata*, *Oxya yezoensis*, *Locusta migratoria*, *Oxya japonica*, *Homorocoryphus jezoensis* i

35 *Teleogryllus emma*;

[0106]

види ряду пузиронігих або трипсів (Thysanoptera), такі як *Selenothrips rubrocinctus*, *Stenchaetothrips biformis*, *Haplothrips aculeatus*, *Ponticulothrips diospyrosi*, *Thrips flavus*, *Anaphothrips obscurus*, *Liothrips floridensis*, *Thrips simplex*, *Thrips nigropilosus*, *Heliothrips*

40 *haemorrhoidalis*, *Pseudodendrothrips mori*, *Microcephalothrips abdominalis*, *Leeuwenia pasanii*, *Litotetothrips pasaniae*, *Scirtothrips citri*, *Haplothrips chinensis*, *Mycterothrips glycines*, *Thrips setosus*, *Scirtothrips dorsalis*, *Dendrothrips minowai*, *Haplothrips niger*, *Thrips tabaci*, *Thrips alliorum*, *Thrips hawaiiensis*, *Haplothrips kurdjumovi*, *Chirothrips manicatus*, *Frankliniella intonsa*, *Thrips coloratus*, *Frankliniella occidentalis*, *Thrips palmi*, *Frankliniella lilivora* i *Liothrips vaneeckei*;

45 [0107]

види ряду кліщів (Acari), такі як *Leptotrombidium akamushi*, *Tetranychus ludeni*, *Dermacentor variabilis*, *Tetranychus truncatus*, *Ornithonyssus bacoti*, *Demodex canis*, *Tetranychus viennensis*, *Tetranychus kanzawai*, види сімейства іксових кліщів (Ixodidae), такі як *Rhipicephalus sanguineus*, *Cheyletus malaccensis*, *Tyrophagus putrescentiae*, *Dermatophagoides farinae*,

50 *Latrodectus hasseltii*, *Dermacentor taiwanensis*, *Acaphylla theavagrans*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Aculops lycopersici*, *Ornithonyssus sylvarum*, *Tetranychus urticae*, *Eriophyes chibaensis*, *Sarcoptes scabiei*, *Haemaphysalis longicornis*, *Ixodes scapularis*, *Tyrophagus similis*, *Cheyletus eruditus*, *Panonychus citri*, *Cheyletus moorei*, *Brevipalpus phoenicis*, *Octodectes cynotis*, *Dermatophagoides ptenyssus*, *Haemaphysalis flava*, *Ixodes ovatus*, *Phyllocoptruta citri*, *Aculus schlechtendali*,

55 *Panonychus ulmi*, *Amblyomma americanum*, *Dermanyssus gallinae*, *Rhyzoglyphus robini* i *Sancassania* sp.;

[0108]

види ряду термітів (Isoptera), такі як *Reticulitermes miyatakei*, *Incisitermes minor*, *Coptotermes formosanus*, *Hodotermopsis japonica*, *Reticulitermes* sp., *Reticulitermes flaviceps amamianus*,

60 *Glyptotermes kushimensis*, *Coptotermes quangzhoensis*, *Neotermes koshunensis*, *Glyptotermes*

kodamai, *Glyptotermes satsumensis*, *Cryptotermes domesticus*, *Odontotermes formosanus*, *Glyptotermes nakajimai*, *Pericapritermes nitobei* i *Reticulitermes speratus*;

[0109]

види ряду тарганових (Blattodea), такі як *Periplaneta fuliginosa*, *Blattella germanica*, *Blatta orientalis*, *Periplaneta brunnea*, *Blattella lituricollis*, *Periplaneta japonica* i *Periplaneta americana*;

[0110]

види ряду бліх (Siphonaptera), такі як *Pulex irritans*, *Ctenocephalides felis* i *Ceratophyllus gallinae*;

[0111]

10 види типу нематод або круглих черв'яків (phylum Nematoda), такі як *Nothotylenchus acris*, *Aphelenchoides besseyi*, *Pratylenchus penetrans*, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Globodera rostochiensis*, *Meloidogyne javanica*, *Heterodera glycines*, *Pratylenchus coffeae*, *Pratylenchus neglectus* i *Tylenchus semipenetrans*; i

[0112]

15 види типу молюсків (phylum Mollusca), такі як *Pomacea canaliculata*, *Achatina fulica*, *Meghimatium bilineatum*, *Lehmannina valentiana*, *Limax flavus* i *Acusta despecta sieboldiana*.

[0113]

Крім того, сільськогосподарський і садівницький інсектицид за даним винаходом також виявляє сильну інсектицидну дію на *Tuta absoluteta*.

20 [0114]

Крім того, кліщі, що паразитують на тваринах, також включені в число цільових шкідників, і їх приклади включають види сімейства іксодових кліщів (Ixodidae), такі як *Boophilus microplus*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Haemaphysalis longicornis*, *Haemaphysalis flava*, *Haemaphysalis campanulata*, *Haemaphysalis concinna*, *Haemaphysalis japonica*, *Haemaphysalis kitaokai*, 25 *Haemaphysalis ias*, *Ixodes ovatus*, *Ixodes nipponensis*, *Ixodes persulcatus*, *Amblyomma testudinarium*, *Haemaphysalis megaspinosa*, *Dermacentor reticulatus* i *Dermacentor taiwanensis*; *Dermanyssus gallinae*; види кліщів роду *Ornithonyssus*, такі як *Ornithonyssus sylvarum* i *Ornithonyssus bursa*; види кліщів сімейства Trombiculidae, такі як *Eutrombicula wichmanni*, *Leptotrombidium akamushi*, *Leptotrombidium pallidum*, *Leptotrombidium fuji*, *Leptotrombidium tosa*, 30 *Neotrombicula autumnalis*, *Eutrombicula alfreddugesi* i *Helenicula miyagawai*; види сімейства Cheyletidae, такі як *Cheyletiella yasguri*, *Cheyletiella parasitivorax* i *Cheyletiella blakei*; види кліщів надсімейства Sarcoptoidea, такі як *Psoroptes cuniculi*, *Chorioptes bovis*, *Otodectes cynotis*, *Sarcoptes scabiei* i *Notoedres cati*; i види сімейства Demodicidae, такі як *Demodex canis*.

[0115]

35 Інші цільові шкідники включають бліх, у тому числі ектопаразитичних безкрилих комах ряду Siphonaptera, точніше види сімейства Pulicidae i Ceratophyllidae. Приклади видів, що належать до сімейства Pulicidae, включають *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Echidnophaga gallinacea*, *Xenopsylla cheopis*, *Leptopsylla segnis*, *Nosopsyllus fasciatus* i *Monopsyllus anisus*.

40 [0116]

Інші цільові шкідники включають ектопаразитів, наприклад види підряду вошей (Anoplura), такі як *Haematopinus eurysternus*, *Haematopinus asini*, *Dalmalinia ovis*, *Linognathus vituli*, *Haematopinus suis*, *Phthirus pubis* i *Pediculus capitis*; види підряду пухойдів (Mallophaga), такі як *Trichodectes canis*; i гематофагові шкідники ряду двокрилих комах-шкідників, такі як *Tabanus trigonus*, *Culicoides schultzei* i *Simulium ornatum*. Крім того, приклади ендopаразитів включають 45 нематод, таких як легеневі нематоди, хлистовики, збудники езофагостоматозу, внутрішньошлункові паразитичні черв'яки, аскариди і філярії; цестоди, такі як *Spirometra erinacei*, *Diphylobothrium latum*, *Dipylidium caninum*, *Multiceps multiceps*, *Echinococcus granulosus* i *Echinococcus multilocularis*; трематоди, такі як *Schistosoma japonicum* i *Fasciola hepatica*; i 50 найпростіші, такі як кокцидія, *Plasmodium*, кишковий саркоцист (*Sarcocystis*), токсоплазма (*Toxoplasma*) i криптоспоридія (*Cryptosporidium*).

[0117]

Сільськогосподарський і садівницький інсектицид, який включає 4Н-піролопіридинову сполуку, представлену загальною формулою (1), за даним винаходом або її сіль як активний 55 інгредієнт, має значний ефект контролю описаних вище шкідників, які пошкоджують низинні культури, польові культури, фруктові дерева, овочеві і інші культури, декоративні квітучі рослини і т. д. Бажаний ефект може бути досягнутий, коли сільськогосподарський і садівницький інсектицид застосовується в розсадниках для саджанців, на рисових полях, на полях, на 60 фруктових деревах, овочевих і інших культурах, декоративних квітучих рослинах і т. д. і їх насінні, у воді рисових полів, листі, середовищах вирощування, таких як ґрунт або т. п., у період,

близький до передбачуваного часу зараження шкідниками, тобто до зараження або після підтвердження зараження. В особливо переважних варіантах здійснення даного винаходу для застосування сільськогосподарського і садівницького інсектициду використовується так зване проникнення і переміщення. Тобто ґрунт розсадника, ґрунт у посадкових ямках, ґрунт для рослин, поливну воду, воду для культивування в гідропоніці або т. п. обробляють сільськогосподарським і садівницьким інсектицидом, щоб дати можливість культурам, декоративним квітучим рослинам і т. д. поглинати сполуку за даним винаходом через коріння в ґрунті або іншим способом.

[0118]

Приклади корисних рослин, до яких може бути застосований сільськогосподарський і садівницький інсектицид за даним винаходом, включають, але без обмеження, зернові культури (наприклад, рис, ячмінь, пшениця, жито, овес, кукурудза і т. д.), бобові (наприклад, соєві боби, боби адзукі, кормові боби, зелений горошок, квасоля, арахіс і т. д.), фруктові дерева і фрукти (наприклад, яблука, цитрусові, груші, виноград, персики, сливи, вишні, волоські горіхи, каштани, мигдаль, банани і т. д.), листяні і плодові овочеві культури (наприклад, капуста, помідори, шпинат, броколі, салат, цибуля, зелена цибуля (зелена цибуля і цибуля-батун), зелений перець, баклажани, полуниця, перцеві культури, окра, цибуля пахуча і т. д.), овочеві коренеплоди (наприклад, морква, картопля, солодка картопля, таро, японський хрін, ріпа, коріння лотоса, коріння лопуха, часник, китайська цибуля-шалот і т. д.), сільськогосподарські культури для технологічної переробки (наприклад, бавовник, коноплі, буряк, хміль, цукрова тростина, цукровий буряк, оливки, каучук, кава, тютюн, чай і т. д.), баштанні культури (наприклад, японські гарбузи, огірки, кавуни, східні солодкі дині, дині і т. д.), пасовищні трави (наприклад, грястиця збірня, сорго, тимофіївка, конюшина, люцерна і т. д.), газонні трави (наприклад, корейська газонна трава, мітлиця і т. д.), пряні і ароматичні зернові і декоративні культури (наприклад, лаванда, розмарин, чебрець, петрушка, перець, імбир і т. д.), декоративні квітучі рослини (наприклад, хризантема, троянда, гвоздика, орхідея, тюльпан, лілія і т. д.), садові дерева (наприклад, дерева гінґо, вишня, японська аукуба і т. д.) і лісові дерева (наприклад, *Abies sachalinensis*, *Picea jezoensis*, сосна, жовтий кедр, японський кедр, кипарис хінокі, евкаліпт і т. д.).

[0119]

Вищезгаданий термін "рослини" також включає рослини з толерантністю до гербіцидів, забезпеченою класичним методом селекції або методом рекомбінації генів. Приклади такої толерантності до гербіцидів включають толерантність до інгібіторів HPPD, таких як ізоксафлутол; інгібіторів ALS, таких як імазетапір і тифенсульфурон-метил; інгібіторів синтази EPSP, таких як гліфосат; інгібіторів глутамінсинтетази, таких як глюфосинат; інгібіторів ацетил-КоА-карбоксилази, таких як сетоксидим; або інших гербіцидів, таких як бромоксиніл, дикамба і 2,4-D.

[0120]

Приклади рослин з толерантністю до гербіцидів, забезпеченою класичним методом селекції, включають сорти рапсу, пшениці, соняшника і рису, толерантні до сімейства імідазолінонових гербіцидів, інгібуючих ALS, таких як імазетапір, і такі рослини продаються під торговельною назвою Clearfield (зареєстрована торговельна марка). Приклади також включають сорти соєвих бобів з резистентністю до гербіцидів сімейства сульфонілсечовин, інгібуючих ALS, таких як тифенсульфурон-метил, одержані за класичною технологією селекції, і ці культури продаються під торговельною назвою STS soybean. Приклади також включають рослини з толерантністю, забезпеченою за класичною методикою селекції, до інгібіторів ацетил-КоА-карбоксилази, таких як гербіциди на основі тріонксиму і гербіциди на основі арилоксифеноксипропіонової кислоти, наприклад SR corn і т. п.

[0121]

Рослини з толерантністю до інгібіторів ацетил-КоА-карбоксилази описані в Proc. Natl. Acad. Sci. USA, 87, 7175-7179 (1990) і т. п. Крім того, рослини-мутанти ацетил-КоА-карбоксилази з резистентністю до інгібіторів ацетил-КоА-карбоксилази описані в Weed Science, 53, 728-746 (2005) і т. п., і одержані введенням у рослини гена такого мутанта ацетил-КоА-карбоксилази методом рекомбінації генів, або введення мутації резистентності в ацетил-КоА-карбоксилазу рослин дозволяє створювати рослини, резистентні до інгібіторів ацетил-КоА-карбоксилази. Альтернативно, введення нуклеїнової кислоти, що викликає основну мутацію заміщення в рослинних клітинах (типовим прикладом цього методу є метод химеропластики (Gura T. 1999. Repairing the Genome's Spelling Mistakes. Science 285:316-318.)), дозволяє методом генної інженерії одержати сайт-специфічну мутацію заміщення в амінокислотах, кодованих геном ацетил-КоА-карбоксилази, геном ALS або т. п., рослин, толерантних до інгібіторів ацетил-КоА-

карбоксилази, інгібіторів ALS і т. п. Сільськогосподарський і садівницький інсектицид за даним винаходом також може застосовуватися до цих рослин.

[0122]

Крім того, типові токсини, експресовані в генетично модифікованих рослинах, включають інсектицидні білки *Bacillus cereus* або *Bacillus popilliae*; δ -ендотоксини *Bacillus thuringiensis*, такі як Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1 і Cry9C, і інші інсектицидні білки, такі як VIP1, VIP2, VIP3 і VIP3A; нематодні інсектицидні білки; токсини, продуковані тваринами, такі як токсини скорпіонів, токсини павуків, бджолині токсини і специфічні для комах нейротоксини; токсини нитчастих грибів; рослинні лектини; аглютиніни; інгібітори протеаз, такі як інгібітори трипсину, інгібітори серинової протеази, інгібітори пататину, цистатину і папаїну; інактивуючі рибосоми білки (ribosome inactivating proteins-RIP), такі як рицин, RIP кукурудзи, абрин, луфін, сапорин і бріудин; ферменти, метаболізуючі стероїди, такі як 3-гідроксистероїдоксидаза, екдистероїд-УДФ-глюкозилтрансфераза і холестериноксидаза; інгібітори екдизону; ГМГ-КоА-редуктазу; інгібітори іонних каналів, такі як інгібітори натрієвих каналів і інгібітори кальцієвих каналів; естеразу ювенільного гормону; рецептори діуретичного гормону; стильбенсинтазу; бібензилсинтазу; хітиназу; і глюканазу.

[0123]

Приклади також включають гібридні токсини, частково дефіцитні токсини і модифіковані токсини, одержані з наступних білків: δ -ендотоксини, такі як Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1, Cry9C, Cry34Ab і Cry35Ab, і інші інсектицидні білки, такі як VIP1, VIP2, VIP3 і VIP3A. Гібридний токсин може бути одержаний за допомогою комбінування методом рекомбінації деяких доменів цих білків, яке відрізняється від вихідного природного комбінування. Як частково дефіцитний токсин відомий токсин Cry1Ab, у якому видалена частина амінокислотної послідовності. У модифікованому токсині заміщені одна або декілька амінокислот, які мають місце в природному токсині.

Приклади вищезгаданих токсинів і генетично модифікованих рослин, здатних синтезувати ці токсини, описані в EP-A-0 374 753, WO 93/07278, WO 95/34656, EP-A-0 427 529, EP-A-451 878, WO 03/052073 і т. д.

[0124]

Завдяки токсинам, що містяться в таких генетично модифікованих рослинах, рослини проявляють резистентність до шкідників, зокрема до комах-шкідників ряду твердокрилих (Coleopteran), комах-шкідників ряду напівтвердокрилих (Hemipteran), комах-шкідників ряду двокрилих (Dipteran), комах-шкідників ряду лускокрилих (Lepidopteran) і нематод. Описані вище технології і сільськогосподарський і садівницький інсектицид за даним винаходом можуть використовуватися в комбінації або використовуватися системно.

[0125]

Сільськогосподарський і садівницький інсектицид за даним винаходом для контролю цільових шкідників з відповідним розведенням або суспендуванням у воді і т. д. або без відповідного розведення або суспендування застосовується на рослинах, потенційно заражених цільовими комахами-шкідниками або нематодами, у кількості, ефективній для контролю комах-шкідників або нематод. Наприклад, для боротьби з комахами-шкідниками і нематодами, які можуть пошкодити сільськогосподарські рослини, такі як фруктові дерева, зернові і овочеві культури, можна проводити нанесення на листя і обробку насіння, таку як занурення, покривання дустом і покривання пероксидом кальцію. Крім того, обробка ґрунту або т. п. може проводитися, щоб дозволити рослинам поглинати арохімікати через коріння. Приклади такої обробки включають внесення в ґрунт у цілому, обробку міжряддя, обробку посадкового ряду, введення в ґрунт грядки, обробку сіянця з грудкою субстрату, обробку посадкової ямки, обробку під стовбур рослин, підживлення рослин, обробку ящиків для розсади рису-падді під водою. Крім того, може також застосовуватися нанесення в живильне середовище в гідропоніці, обробку димом, ін'єкції в стовбур і т. п.

Крім того, сільськогосподарський і садівницький інсектицид за даним винаходом з придатним розведенням або без придатного розведення або суспендування у воді і т. д. може наноситися на ділянки, потенційно заражені шкідниками, у кількості, ефективній для боротьби зі шкідниками. Наприклад, його можна безпосередньо наносити на шкідників зерна, що зберігається, домашніх шкідників, санітарних шкідників, лісових шкідників і т. д., а також використовувати для покривання матеріалів для будівництва житлових будинків, для окурювання або як препарат принади.

[0126]

Типові способи обробки насіння включають занурення насіння у розведену або нерозведену рідину рідкого або твердого препарату для проникнення арохімікатів у насіння; змішування

дусту з насінням, нанесення дусту на насіння або нанесення на насіння рідкого препарату для адгезії препарату на поверхні насіння; покривання насіння сумішшю агрохімічного препарату і адгезивного носія, такого як смоли і полімери; і нанесення твердого або рідкого препарату поблизу насіння одночасно з посівом.

5 Термін "насіння" в описаній вище обробці насіння стосується рослини, яка знаходиться на ранніх стадіях розвитку і використовується для розмноження рослин. Приклади зазначеного терміна включають, на доповнення до так званого насіння, частину організму рослини для вегетативного розмноження, таку як цибулина, бульба, насінна картопля, цибулинка (зубок), паросток, дискоїдне стебло і стебло, використовувані для зрізання.

10 Термін "ґрунт" або "середовище для вирощування" у способі за даним винаходом для застосування сільськогосподарського і садівницького інсектициду стосується субстрату (допоміжного середовища) для вирощування сільськогосподарських культур, зокрема субстрату, який дозволяє сільськогосподарським рослинам поширювати в них своє коріння, і матеріали особливо не обмежуються, якщо вони дозволяють рослинам рости. Приклади субстрату включають так звані ґрунти, мати для розсади і воду, і конкретні приклади матеріалів
15 включають пісок, пемзу, вермикуліт, діатоміт, агар, желатинові речовини, високомолекулярні речовини, кам'яну вату, скловату, деревну тріску і кору.

[0127]

20 Типові способи листяного застосування на сільськогосподарських культурах або шкідниках зерна, що зберігається, домашніх шкідників, санітарних шкідників, лісових шкідників і т. д. включають нанесення рідкого препарату, такого як емульгований концентрат і текучий препарат, або твердого препарату, такого як змочуваний порошок і дисперговані у воді гранули, після відповідного розведення у воді; обпудрювання і окурювання.

25 Типові способи ґрунтового застосування включають нанесення розведеного водою або нерозведеного рідкого препарату на нижню частину рослин, розсадні грядки для саджанців або т. п.; нанесення гранул на нижню частину рослин, розсадні грядки для саджанців або т. п.; нанесення дусту, змочуваного порошку, диспергованих у воді гранул, гранул або т. п. на ґрунт і наступне внесення препарату в ґрунт у цілому перед посівом або посадкою; і нанесення дусту, змочуваного порошку, диспергованих у воді гранул, гранул або т. п. на посадкові ямки, ряди для
30 посадки або т. п. перед посівом або посадкою.

[0128]

Наприклад, у ящиках для розсади рису-падді можна застосовувати дуст, дисперговані у воді гранули, гранули або т. п., хоча придатний препарат може змінюватися залежно від часу застосування, інакше кажучи залежно від стадії розвитку рослини, такої як час посіву, період
35 позеленіння і час висадження розсади. Препарат, такий як дуст, дисперговані у воді гранули і гранули, можна змішувати з ґрунтом розсадника. Наприклад, такий препарат вводять у ґрунт грядки, покривають їм ґрунт або вводяться в ґрунт у цілому. Тобто, ґрунт розсадника і такий препарат можуть укладатися шарами поперемінно.

40 При застосуванні на рисових полях твердий препарат, такий як великогабаритний вантаж, упаковка, гранули і дисперговані у воді гранули, або рідкий препарат, такий як текучий препарат і емульгований концентрат, звичайно наносять на затоплені рисові поля. У період посадки рису придатний препарат, як він є або після змішування з добривом, може наноситися на ґрунт або вводиться в ґрунт. Крім того, емульгований концентрат, текучий препарат або т. п. можна вносити в джерело подачі води для рисових полів, таке як водозабірник і іригаційний пристрій. У
45 цьому випадку обробка може здійснюватися з подачею води і, таким чином, досягається працевзбережувальним способом.

[0129]

У випадку польових культур їх насіння, живильні середовища поблизу рослин або т. п. можуть оброблятися в період посіву в середовище розсади. У випадку рослин, насіння яких
50 безпосередньо висівають у полі, на доповнення до прямої обробки насіння переважною є обробка ґрунту для вирощування під час культивування. Зокрема, обробка може виконуватися, наприклад, нанесенням гранул на ґрунт або просоченням ґрунту препаратом у розведений водою або нерозведений рідкій формі. Іншою переважною обробкою є введення гранул у середовище для вирощування перед посівом.

55 У випадку посадки культурних рослин, що підлягають пересадженню, переважні приклади обробки в період посіву в ґрунт для розсади включають, на доповнення до прямої обробки насіння, вологу обробку грядок розсадника для саджанців препаратом у рідкій формі; і нанесення гранул на посадкове місце для саджанців у розсаднику. Приклади також включають обробку посадкових ямок гранулами; і введення гранул у середовище для вирощування
60 поблизу точок посадки під час посадки на постійне місце вирощування.

Сільськогосподарський і садівницький інсектицид за даним винаходом звичайно використовується як препарат, зручний для застосування, який одержують звичайним способом одержання агрохімічних препаратів.

Тобто, конденсовану гетероциклічну сполуку, представлену загальною формулою (1) за даним винаходом, або її сіль і відповідний неактивний носій і, якщо необхідно, ад'ювант змішують у придатному співвідношенні і за допомогою розчинення, розділення, суспендування, змішування, імпрегнування, адсорбції і/або адгезії вводять у придатну форму для застосування, таку як суспензійний концентрат, емульгований концентрат, розчинний концентрат, змочуваний порошок, дисперговані у воді гранули, гранули, дуст, таблетка і упаковка.

[0130]

Композиція (сільськогосподарський і садівницький інсектицид або засіб контролю паразитів тварин) за даним винаходом може, крім активного інгредієнта, містити добавку, звичайно використовувану для агрохімічних препаратів або засобів контролю паразитів тварин. Приклади таких добавок включають носії, такі як тверді або рідкі носії, поверхнево-активні речовини, дисперсанти, змочувальні агенти, зв'язувальні речовини, речовини для підвищення налипання/розтікання, антифризи, загусники, барвники, розподільники, добавки для підвищення налипання/розтікання, антифризи, засоби проти спікання (злежування), добавки для дезінтеграції і стабілізуючі агенти. При необхідності як добавка можуть бути використані консерванти, фрагменти рослин і т. д. Одна з цих добавок може використовуватися окремо, а також дві або більше з них можуть використовуватися в комбінації.

[0131]

Приклади твердих носіїв включають природні мінерали, такі як кварц, глина, каолінит, пірофіліт, серицит, тальк, бентоніт, кислотна глина, атапульгіт, цеоліт і діатоміт; неорганічні солі, такі як карбонат кальцію, сульфат амонію, сульфат натрію і хлорид калію; органічні тверді носії, такі як синтетична кремнієва кислота, синтетичні силікати, крохмаль, целюлоза і рослинні порошки (наприклад, тирса, шкаралупа кокосового горіха, кукурудзяні качани, стебло тютюну і т. д.); полімерні матеріали, такі як поліетилен, поліпропілен і полівініліденхлорид; сечовину; порожнисті неорганічні матеріали; порожнисті полімерні матеріали і колоїдний діоксид кремнію (біла сажа). Може окремо використовуватися один з цих твердих носіїв, і два або більше з них можуть використовуватися в комбінації.

[0132]

Приклади рідких носіїв включають спирти, у тому числі одноатомні спирти, такі як метанол, етанол, пропанол, ізопропанол і бутанол, і багатоатомні спирти, такі як етиленгліколь, діетиленгліколь, пропіленгліколь, гексиленгліколь, поліетиленгліколь, поліпропіленгліколь і гліцерин; поліольні сполуки, такі як простий пропіленгліколевий ефір; кетони, такі як ацетон, метилетилкетон, метилізобутилкетон, діізобутилкетон і циклогексанон; прості ефіри, такі як етиловий ефір, діоксан, моноетиловий ефір етиленгліколю, дипропіловий ефір і тетрагідрофуран; аліфатичні вуглеводні, такі як парафін нормальної будови, нафтен, ізопарафін, гас і мінеральне масло; ароматичні вуглеводні, такі як бензол, толуол, ксилол, сольвент-нафта і алкілнафталін; галогеновані вуглеводні, такі як дихлорметан, хлороформ і чотирихлористий вуглець; складні ефіри, такі як етилацетат, діізопропілфталат, дибутилфталат, діоктилфталат і диметиладипат; лактони, γ-бутиролактон; амід, такі як диметилформамід, діетилформамід, диметилацетамід і N-алкілпіролідінон; нітрили, такі як ацетонітрил; сполуки сірки, такі як диметилсульфоксид; рослинні олії, такі як соєва олія, рапсова олія, бавовняна олія і касторова олія; і воду. Може окремо використовуватися один з цих рідких носіїв, а також два або більше з них можуть використовуватися в комбінації.

[0133]

Типові поверхнево-активні речовини, використовувані як дисперсант або змочувальний/розподільний агент, включають неіоногенні поверхнево-активні речовини, такі як складний ефір сорбітану і жирної кислоти, складний ефір поліоксіетиленсорбітанової жирної кислоти, складний ефір сахарози і жирної кислоти, складний ефір поліоксіетиленової жирної кислоти, складний ефір поліоксіетиленової смоли, складний діефір поліоксіетиленової жирної кислоти, поліоксіетиленалкіловий ефір, поліоксіетиленалкіларильовий ефір, поліоксіетиленалкілфеніловий ефір, поліоксіетилендіалкілфеніловий ефір, продукти реакції конденсації поліоксіетиленалкілфенілового ефіру і формальдегіду, блок-співполімери поліоксіетилену і поліоксипропілену, блок-співполімери полістиролу і поліоксіетилену, постій алкіловий ефір блок-співполімеру алкілполіоксіетилену і поліпропілену, поліоксіетиленалкіламін, амід поліоксіетиленжирної кислоти, біс(феніловий ефір) поліоксіетиленжирної кислоти, поліалкіленбензилфеніловий ефір, поліоксіалкіленстирилфеніловий ефір, ацетилендіол, продукт реакції приєднання

поліоксіалкілену і ацетилендіолу, силоксан поліоксіетилефірного типу, силоксан складноефірного типу, фторвмісні поверхнево-активні речовини, поліоксіетиленова касторова олія і поліоксіетиленгідрогенізована касторова олія; аніоногенні поверхнево-активні речовини, такі як алкілсульфати, сульфати поліоксіетиленаалкілового ефіру, сульфати поліоксіетиленаалкілфенілового ефіру, сульфати поліоксіетиленастирилфенілового ефіру, алкілбензолсульфонати, алкіларилсульфонати, лігносульфонати, алкілсульфосукцинати, нафталінсульфонати, алкілнафталінсульфонати, солі продуктів реакції конденсації нафталінсульфонової кислоти і формальдегіду, солі продуктів реакції конденсації алкілнафталінсульфокислот і формальдегіду, солі жирних кислот, солі полікарбонових кислот, поліакрилати, саркозинати N-метилжирних кислот, резинати, фосфати поліоксіетиленаалкілефірів і фосфати поліоксіетиленаалкілфенілефірів; катіоногенні поверхнево-активні речовини, включаючи алкіламініні солі, такі як гідрохлорид лауриламину, гідрохлорид стеариламину, гідрохлорид олеїламину, ацетат стеариламину, ацетат стеариламінопропіламину, хлорид алкілтриметиламонію і хлорид алкілдиметилбензалконію; і амфотерні поверхнево-активні речовини, такі як амфотерні поверхнево-активні речовини амінокислотного або бетаїнового типу. Може окремо використовуватися одна з цих поверхнево-активних речовин, а також дві або більше з них можуть використовуватися в комбінації.

[0134]

Приклади зв'язувальних речовин або речовин для підвищення клейкості включають карбоксиметилцелюлозу або її солі, декстрин, розчинний крохмаль, ксантанову камедь, гуарову камедь, сахарозу, полівінілпіролідон, гуміарабік, полівініловий спирт, полівінілацетат, поліакрилат натрію, поліетиленгліколі з середньою молекулярною масою від 6000 до 20000, поліетиленоксиди з середньою молекулярною масою від 100000 до 5000000, фосфоліпіди (наприклад, цефалін, лецитин і т. д.), порошкоподібну целюлозу, декстрин, модифікований крохмаль, хелатоутворюючі сполуки на основі поліамінокарбонової кислоти, зшитий полівінілпіролідон, співполімери малеїнової кислоти і стиролу, співполімери (мет)акрилової кислоти, напівефіри полімеру багатоатомного спирту і дикарбонового ангідриду, водорозчинні полістиролсульфонати, парафін, терпен, поліамідні смоли, поліакрилати, поліетиленоксиди, воски, полівінілалкіловий ефір, продукти реакції конденсації алкілфенолів і формальдегіду і емульсії синтетичних смол.

[0135]

Приклади загусників включають водорозчинні полімери, такі як ксантанова камедь, гуарова камедь, діутанова камедь, карбоксиметилцелюлоза, полівінілпіролідон, карбоксивінільні полімери, акрилові полімери, сполуки крохмалю і полісахариди; і неорганічні тонкі порошки, такі як бентоніт високої якості і колоїдний діоксид кремнію (біла сажа).

[0136]

Приклади барвників включають неорганічні пігменти, такі як оксид заліза, оксид титану і прусська синь; і органічні барвники, такі як алізаринові барвники, азобарвники і металеві фталоціанінові барвники.

[0137]

Приклади антифризів включають багатоатомні спирти, такі як етиленгліколь, діетиленгліколь, пропіленгліколь і гліцерин.

[0138]

Приклади ад'ювантів, що служать для попередження спікання або полегшення дезінтеграції, включають полісахариди (крохмаль, альгінову кислоту, манозу, галактозу і т. д.), полівінілпіролідон, колоїдний діоксид кремнію (білу сажу), складноефірну смолу, нафтову смолу, триполіфосфат натрію, гексаметафосфат натрію, стеарати металів, порошкоподібну целюлозу, декстрин, метакрилатні співполімери, полівінілпіролідон, хелатоутворюючі сполуки поліамінокарбонової кислоти, співполімери сульфонованого стиролу і ізобутиленмалеїнового ангідриду і прищеплені співполімери крохмалю і поліакрилонітрилу.

[0139]

Приклади стабілізуючих агентів включають десиканти, такі як цеоліт, негашене вапно і оксид магнію; антиоксиданти, такі як фенольні сполуки, амініні сполуки, сполуки сірки і сполуки фосфорної кислоти; і поглиначі ультрафіолетових променів, такі як сполуки саліцилової кислоти і сполуки бензофенону.

[0140]

Приклади консервантів включають сорбат калію і 1,2-бензотіазолін-3-он.

Крім того, при необхідності можуть також використовуватися інші ад'юванти, включаючи функціональні розподільні агенти, підсилювачі активності, такі як інгібітори метаболізму (піперонілбутоксид і т. д.), антифризи (пропіленгліколь і т. д.), антиоксиданти (BHT і т. д.) і

поглиначі ультрафіолетових променів.

[0141]

Кількість активного інгредієнта в сільськогосподарському і садівницькому інсектициді за даним винаходом може регулюватися в міру необхідності, і звичайна кількість активного інгредієнта відповідним чином вибирається в інтервалі від 0,01 до 90 частин по масі з розрахунку на 100 частин по масі сільськогосподарського і садівницького інсектициду. Наприклад, у випадку, коли сільськогосподарський і садівницький інсектицид являє собою дуст, гранули, емульгований концентрат або змочуваний порошок, доцільно, щоб кількість активного інгредієнта становила від 0,01 до 50 частин по масі (від 0,01 до 50 % по масі з розрахунку на загальну масу сільськогосподарського і садівницького інсектициду).

[0142]

Доза застосування сільськогосподарського і садівницького інсектициду за даним винаходом може змінюватися залежно від різних факторів, наприклад від задачі, цільового шкідника, умов вирощування сільськогосподарських культур, тенденції зараження шкідниками, погоди, умов навколишнього середовища, форми препарату, способу застосування, часу застосування і т. д., але в основному доза застосування активного інгредієнта відповідним чином вибирається в інтервалі від 0,001 г до 10 кг, переважно від 0,01 г до 1 кг, на 10 ар залежно від задачі.

Крім того, для розширення спектра цільових шкідників і придатного часу контролю шкідників або для зменшення дози можна використовувати сільськогосподарський і садівницький інсектицид за даним винаходом після змішування з іншими сільськогосподарськими і садівницькими інсектицидами, акарицидами, нематоцидами, мікробіцидами, біопестицидами і/або т. п. Крім того, сільськогосподарський і садівницький інсектицид можна використовувати після змішування з гербіцидами, регуляторами росту рослин, добривами і/або т. п. залежно від ситуації.

[0143]

Приклади таких додаткових сільськогосподарських і садівницьких інсектицидів, акарицидів і нематоцидів, використовуваних для вищезгаданих цілей, включають 3,5-ксилілметилкарбамат (ХМС), кристалічні білкові токсини, продуковані *Bacillus thuringiensis*, такі як *Bacillus thuringiensis aizawai*, *Bacillus thuringiensis israelensis*, *Bacillus thuringiensis japonensis*, *Bacillus thuringiensis kurstaki* і *Bacillus thuringiensis tenebrionis*, ВРМС, інсектицидні сполуки, одержані з токсину Bt, СРСБС (хлорфенсон), DCIP (дихлордіізопропіловий ефір), D-D (1,3-дихлорпропен), DDT, NAC, О-4-диметилсульфамойлфеніл-О, О-діетилфосфоротіоат, (DSP), О-етил-О-4-нітрофенілфенілфосфофонотіоат (EPN), трипропілізоціанурат (TPIC), акринатрин, азирахтин, азинфос-метил, ацеквіноцил, ацетаміприд, ацетопрол, ацефат, абамектин, авермектин-В, амідофлумет, амітраз, аланікарб, альдикарб, альдоксикарб, альдрин, альфа-ендосульфат, альфа-циперметрин, албендазол, алетрин, ісадофос, ісамідофос, ісоамідофос, ізоксатіон, ізофенфос, ізопрокарб (MIPC), івермектин, іміціафос, імідаклоприд, іміпротрин, індоксакарб, есфенвалерат, етіофенкарб, етіон, етипрол, етоксазол, етофенпрокс, етопрофос, етримфос, емаектин, емаектин-бензоат, ендосульфат, емпентрин,

[0144]

оксаміл, оксидетон-метил, оксидепрофос (ESP), оксибендазол, оксфендазол, олеат калію, олеат натрію, кадусафос, картап, карбарил, карбосульфат, карбофуран, гамма-цигалотрин, ксилілкарб, квіналфос, кінопрен, хінометіонат, клоетокарб, клотіанідин, клофентезин, хромафенозид, хлорантраніліпрол, хлоретоксифос, хлордимеформ, хлордан, хлорпірифос, хлорпірифос-метил, хлорфенапір, хлорфенсон, хлорфенвінфос, хлорфлуазурон, хлоробензилат, хлорбензоат, келтан (дикофол), салітін, ціанофос (CYAP), діафентіурон, діамідафос, ціантраніліпрол, тета-циперметрин, дієнохлор, цієнопірафен, діоксабензофос, діофенолан, сигма-циперметрин, дихлорфентіон (ECP), циклопротрин, дихлорвос (DDVP), дисульфотон, динотефуран, цигалотрин, цифенотрин, цифлутрин, дифлубензурон, цифлуметофен, дифловідазин, цигексатин, циперметрин, диметилвінфос, диметоат, димефлутрин, силафлуофен, циромазин, спінеторам, спіносад, спіродиклофен, спіротетрамат, спіромесифен, сульфлурамід, сульпрофос, фульфоксафлор, зета-циперметрин,

[0145]

діазинон, тау-флувалінат, дазомет, тіаклоприд, тіаметоксам, тіодикарб, тіоциклам, тіосултап, тіосултап-натрій, тіоназин, тіометон, діетилтолуамід (deet), діелдрин, тетрахлорвінфос, тетрадифон, тетраметилфлутрин, тетраметрин, тебупіримфос, тебуфенозид, тебуфенпірад, телфлутрин, тефлубензурон, диметон-С-метил, темефос, дельтаметрин, тербуфос, тралопірил, тралометрин, трансфлутрин, триазамат, триазурон, трихлорамід, трихлорфон (DEP), трифлумурон, толфенпірад, налед (BRP), нітіазин, нітенпірам, новалурон,

новіфлумурон, гідропрен, ваніліпрол, вамідотіон, паратіон, паратіон-метил, галфенпрокс, галофенозид,

[0146]

бістрифлурон, бісультап, гідраметилнон, гідроксипропілкрохмаль, бінапакрил, біфеназат, біфентрин, піметрозин, піраклофос, пірафлупрол, піридафентіон, піридабен, піридаліл, пірифлуквіназон, пірипрол, пірипроксифен, піримікарб, піримідифен, піриміфос-метил, піретрини, фіпроніл, феназаквін, фенаміфос, бромпропілат, фенітротіон (MEP), феноксикарб, фенотіокарб, фенотрин, фенобукарб, фенсульфотріон, фентіон (MPP), фентоат (PAP), фенвалерат, фенпіроксимат, фенпропатрин, фенбендазол, фостіазат, форметанат, бутатіофос, бупрофезин, фураціокарб, пралетрин, флуакрипірим, флуазином, флуазурон, флуенсульфон, флуциклоксурон, флуцитринат, флувалінат, флупіразофос, флуфенерим, флуфеноксурон, флуфензин, флуфенпрокс, флупроксифен, флуброцитринат, флубендіамід, флуметрин, флуримфен, протіофос, протрифенбут, флонікамід, пропафос, пропаргіт (BPPS), профенофос, профлутрин, пропоксур (PNC), бромпропілат,

[0147]

бета-цифлутрин, гексафлумурон, гекситіазокс, гептенофос, перметрин, бенклотіаз, бендіокарб, бенсултап, бензоксимат, бенфуракарб, фоксим, фосалон, фостіазат, фостіетан, фосфамідон, фосфокарб, фосмет (PMP), полінактини, форметанат, формотіон, форат,

[0148]

машинне масло, малатіон, мілбеміцин, мілбеміцин-А, мілбемектин, мекарбам, месульфанфос, метоміл, метальдегід, метафлумізон, метамідофос, метам-амоній, метам-натрій, метіокарб, метидатіон (DMTP), метилізотіоціанат, метилнеодиканамід, метилпаратіон, метоксідіазон, метоксихлор, метоксифенозид, метофлутрин, метопрен, метолкарб, меперфлутрин, мевінфос, монокротофос, моносультат, лямбда-цигалотрин, ріанодин, луфенурон, ресметрин, лепіметрин, ротенон, левамізол-гідрохлорид, фенбутатин-оксид, морантел-таратрат, метилбромід, трициклогексилолово-гідрохлорид (цигексатин), ціанамід кальцію, полісульфід кальцію, сірка і нікотинсульфат.

[0149]

Типові сільськогосподарські і садівницькі мікробіциди, використовувані для задач, які описані вище, включають ауреофунгін, азокназол, азитирам, аципетакс, ацибензолар, ацибензолар-S-метил, азоксистробін, анілазин, амісулбром, ампропілфос, аметоктрадин, аліловий спирт, алдиморф, амобам, ізотіаніл, ізоваледіон, ізопіразам, ізопротіолан, іпконазол, іпродіон, іпровалікарб, іпробенфос, імазаліл, іміноктадин, іміноктадин-албезилат, іміноктадин-триацетат, імібенконазол, уніконазол, уніконазол-P, ехлоромезол (echlomezole), едифенфос, етакназол, етабоксам, етиримол, етем, етоксиквін, етридіазол, енестроурин, епоксиконазол, оксидиксил, оксикарбоксин, оксинову мідь (8-хінолінолат міді), окситетрациклін, оксинат міді, окспоконазол, окспоконазол-фумарат, оксолінову кислоту, октилінон, офурас, орисастробін,

[0150]

метам-натрій, касугаміцин, карбаморф, карпропамід, карбендазим, карбоксин, карвон, квіназамід, квінацетол, квіноксифен, квінометіонат, каптафол, каптан, кіралаксил, квінконазол, квітозен, квіазатин, куфранеб, купробам, гліюдин, гризеофулвін, клімбазол, крезол, крезоксим-метил, хлосолінат, клодержазол, хлорентіазон, хлораніформетан, хлораніл, хлорквінокс, хлорпікрин, хлорфеназол, хлординітронафталін, хлороталоніл, хлоронеб, зариламід, саліциланілід, ціазофамід, діетилпірокарбонат, діетофенкарб, циклафурамід, диклоцимет, дихлозолін, диклобутразол, дихлофлуанід, циклогексимід, дикломезин, диклоран, дихлорофен, дихлон, дисульфідрам, диталіфос, дитіанон, диніконазол, диніконазол-M, цинеб, динокап, диноктон, диносальфон, динотербон, динобутон, динопентон, дипірітін, дифеніламін, дифенокназол, суфлуфенамід, дифлуметорим, ципроконазол, ципродиніл, ципрофурам, ципендазол, симеконазол, диметиримол, диметоморф, цимоксаніл, димоксистробін, метилбромід, цирам, силтіофам,

[0151]

стрептоміцин, спіроксамін, сультропен, седаксан, зоксамід, дазомет, тіадіазин, тіадиніл, тіадифлуор, тіабендазол, тіоксимід, тіохлорфенфім, тіофанат, тіофанат-метил, тіоціофен, тіоквінокс, хінометіонат, тіофлузамід, тирам, декафентин, текназен, теклофталам, текорам, тетраконазол, дебакарб, дегідрооцтову кислоту, тебуконазол, тебуфловкін, додизин, додин, додецилбензолсульфонат бісетилендіамін міді(II) (DBEDC), додеморф, дразоксолон, триадименол, триадимефон, триазбутил, триазоксид, триаміфос, триаримол, трихлорамід, трициклазол, тритіконазол, тридеморф, оксид трибутилолова, трифлумізол, трифлуксистробін, трифорин, толілфлуанід, толклофос-метил, натаміцин, набам, нітротал-ізопропіл, нітростирен, нуаримол, нонілфенолсульфонат міді, галакринат, валідаміцин, валіфеналат, гарпіновий білок,

[0152]

біксафен, пікоксистробін, пікобензамід, бітіонол, бітертанол, гідроксіізоксазол, гідроксіізоксазол-натрій, бінапакрил, біфеніл, піпералін, гімексазол, піраоксистробін, піракарболід, піраклостробін, піразофос, піраметостробін, піріофенон, піридинітрил, пірифенокс,
5 пірибенкарб, піриметаніл, піроксихлор, піроксифур, піроквілон, вінклозолін,

[0153]

фамоксадон, фенапаніл, фенамідон, фенаміносульф, фенаримол, фенітропан, феноксаніл, феримзон, фербам, фентин, фенпиклоніл, фенпіразамін, фенбуконазол, фенфурам, фенпропідин, фенпропіморф, фенгексамід, фталід, бутіобат, бутиламін, бупіримат,
10 фуберидазол, бластицидин-S, фураметпір, фуралаксил, флуакрипірим, флуазинам, флуоксастробін, флуодержазол, флуопіколід, флуопірам, флуороїмід, фуркарбаніл, флуксапіроксад, флуквіконазол, фурконазол, фурконазол-цис, флудіоксоніл, флусилазол, флусульфамід, флутіаніл, флутоланіл, флутриафол, фурфураль, фурмециклокс, флуметовер, флуморф, проквіназид, прохлораз, процимідон, протіокарб, протіоконазол, пропамокарб,
15 пропіконазол, пропінеб, фурофанат, пробеназол, бромуконазол,

[0154]

гексахлорбутадієн, гексаконазол, гексилтіофос, бетоксазин, беналаксил, беналаксил-М, беноданіл, беноміл, пефуразоат, бенвкінокс, пенконазол, бензаморф, пенцикурон, бензогідроксамову кислоту, бенталурон, бентіазол, бентіавалікарб-ізопропіл, пентіопірад,
20 пенфлуфен, боскалід, фосдифен, фосетил, фосетил-Al, поліюксини, поліюксорим, полікарбамат, фолпет, формальдегід, машинне масло, манеб, манкоцеб, мандипропамід, міклозолін, міклобутаніл, мілдіоміцин, мільнеб, мекарбінзид, метасульфокарб, метазоксолон, метам, метам-натрій, металаксил, металаксид-М, метирам, метилізотіоціанат, мептилдинокап, метконазол, метсульфовакс, метфуроксам, метоміностробін, метрафенон, мепаніпірим, мефеноксам, мептилдинокап, мепроніл, мебеніл, йодометан, рабензазол, хлорид бензалконію, основний хлорид міді, основний сульфат міді, неорганічні мікробіциди, такі як срібло, гіпохлорит натрію, гідроксид міді, змочувана сірка, полісульфід кальцію, гідрокарбонат калію, гідрокарбонат натрію, сірка, безводний сульфат міді, диметилдитіокарбамат нікелю, сполуки міді, такі як оксинова мідь (8-хінолінолат міді), сульфат цинку і пентагідрат сульфату міді.
30

[0155]

Типові гербіциди, використовувані для задач, зазначених вище, включають 1-нафтилацетамід, 2,4-РА, 2,3,6-ТВА, 2,4,5-Т, 2,4,5-ТВ, 2,4-D, 2,4-DB, 2,4-DEB, 2,4-DEP, 3,4-DA, 3,4-DB, 3,4-DP, 4-CPA, 4-CPB, 4-CPР, MCP, MCPA, MCPA-тіетил, MCPB, іюксиніл, аклоніфен, азафенідин, ацифлуорфен, азипротрин, азимсульфурон, асулам, ацетохлор, атразин, атратон, анізурон, анілофос, авігліцин, абсцизову кислоту, амікарбазон, амідосульфурон, амітрол, аміноциклопірахлор, амінопіралід, амібозин, аміпрофос-метил, аметридін, аметрин, алахлор, алідохлор, алоксидим, алорак, ізоурон, ізокарбамід, ізоксахлортол, ізоксапірифоп, ізоксафлутол, ізоксабен, ізоцил, ізонорурон, ізопротурон, ізопропалін, ізополінат, ізометіозин, інабенфід, іпазин, іпфенкарбазон, іпримідам, імазаквін, імазапик, імазапир, імазатемапир, імазаметабенз, імазаметабенз-метил, імазамокс, імазетапир, імазосульфурон, індазифлам, інданофан, індолілмасляну кислоту, уніконазол-Р, егліназин, еспрокарб, етаметсульфурон, етаметсульфурон-метил, еталфлуралін, етіолат, етихлорат-етил, етидимурон, етинофен, етефон, етоксисульфурон, етоксифен, етніпромід, етофумезат, етобензанід, епроназ, ербон, ендотал, оксадіазон, оксадіаргіл, оксазикломефон, оксасульфурон, оксапіразон, оксифлуорфен,
45 оризалін, ортосульфамурон, орбенкарб,

[0156]

кафенстрол, камбендихлор, карбасулам, карфентразон, карфентразон-етил, карбутилат, карбетамід, карбоксазол, квізалофоп, квізалофоп-Р, квізалофоп-етил, ксилахлор, квінокламін, квінонамід, квінклорак, квінмерак, кумілурун, кліюдинат, гліфосат, глюфосинат, глюфосинат-Р, кредазин, клетодим, клоксифонак, клодинафоп, клодинафоп-пропаргіл, хлоротолурон, клопіралід, клопроксидим, клопроп, хлорбромурон, клофоп, кломазон, хлометоксиніл, хлометоксифен, кломеппроп, хлоразифоп, хлоразин, клорансулам, хлоранокрил, хлорамбен, клорансулам-метил, хлоридазон, хлоримурон, хлоримурон-етил, хлорсульфурон, хлортал, хлортіамід, хлоротолурон, хлорнітрофен, хлорфенак, хлорфенпроп, хлорбуфам, хлорфлуразол, хлорфлуренол, хлорпрокарб, хлорпрофам, хлормекват, хлоретурон, хлороксиніл, хлороксурон, хлоропон,
50

[0157]

суфлуфенацил, ціаназин, ціанатрин, діалат, діурон, діетамкват, дикамбу, циклурун, циклоат, циклоксидим, диклосулам, циклосульфамурон, дихлорпроп, дихлорпроп-Р, дихлобеніл, диклофоп, диклофоп-метил, дихлормат, дихлоральсечовину, дикват, цисанілід, дисул, сидурон,
60

дитіопір, динітрамін, цинідон-етил, диносам, циносульфурон, диносеб, динотерб, динофенат, динопроп, цигалофоп-бутил, дифенамід, дифеноксурон, дифенопентен, дифенокват, цибутрин, ципразин, ципразол, дифлуфенікан, дифлуфензопір, дипропетрин, ципромід, циперкват, гіберелін, симазин, димексано, диметаклор, димідазон, диметаметрин, диметенамід, симетрин, симетон, димепіперат, димефурон, цинметилін, свеп, сулглікапін, сулкотріон, сульфалат, сульфентразон, сульфосульфурон, сульфометурон, сульфометурон-метил, сесбуметон, сетоксидим, себутилазин,

[0158]

тербацил, даімулон, дазомет, далапон, тіазафлурон, тіазопір, тіенкарбазон, тіенкарбазон-метил, тіокарбазил, тіоклорим, тіобенкарб, тидіазимін, тидіазурон, тифенсульфурон, тифенсульфурон-метил, дисмедифам, дисметрин, тетрафлурон, тенілхлор, тебутам, тебутіурон, тербуметон, тепралоксидим, тефурилтріон, темботріон, делахлор, тербацил, тербукарб, тербухлор, тербутилазин, тербутрин, топрамезон, тралкоксидим, триазифлам, триасульфурон, триалат, триетазин, трикамбу, триклопір, тридифан, тритак, тритосульфурон, трифлусульфурон, трифлусульфурон-метил, трифлуралін, трифлоркисульфурон, трипропіндан, трибенурон-метил, трибенурон, трифоп, трифлосим, триметурон, напталам, напроанлід, напропамід, нікосульфурон, нітралін, нітрофен, нітрофлуорфен, ніпіраклофен, небурон, норфлуразон, норурон,

[0159]

барбан, паклобутразол, паракват, парафлурон, галоксидин, галоксифоп, галоксифоп-Р, галоксифоп-метил, галосафен, галосульфурон, галосульфурон-метил, піклорам, піколінафен, біциклопірон, біспірибак, біспірибак-натрій, піданон, піноксаден, біфенокс, піперофос, гімексазол, піраклоніл, пірасульфотол, піразоксифен, піразосульфурон, піразосульфурон-етил, піразолат, біланафос, пірафлуфен-етил, піриклор, піридафол, піритіобак, піритіобак-натрій, піридат, пірифталід, пірибутикарб, пірибензоксим, піримісульфан, примісульфурон, піримінобак-метил, піроксасульфоп, піроксулам,

[0160]

фенасулам, фенізофам, фенурон, феноксасульфоп, феноксапроп, феноксапроп-Р, феноксапроп-етил, фенотіол, фенопроп, фенобунзурон, фентіапроп, фентеракол, фентразамід, фенмедифам, фенмедифам-етил, бутахлор, бутафенацил, бутаміфос, бутіурон, бутидазол, бутилат, бутурон, бутенахлор, бутроксидим, бутралін, флазасульфурон, флампроп, фурилоксифен, принахлор, примісульфурон-метил, флуазифоп, флуазифоп-Р, флуазифоп-бутил, флуазолат, флуороксіпір, флуотіурон, флуометурон, флуороглікофен, флуорохлоридон, флуородифен, флуоронітрофен, флуоромідин, флукарбазон, флукарбазон-натрій, флухлоралін, флуцетосульфурон, флутіацет, флутіацет-метил, флупірсульфурон, флуфенацет, флуфенікан, флуфенпір, флупропацил, флупропанат, флупоксам, флуміоксазин, флуміклорак, флуміклорак-пентил, флуміпропін, флумезин, флуометурон, флуметсулам, флуридон, флуртамон, флуороксіпір,

[0161]

претілахлор, проксан, прогліназин, проціазин, продіамін, просульфалін, просульфурон, просульфокарб, пропаквізафоп, пропахлор, пропазин, пропаніл, пропізамід, пропізохлор, прогідрожасмон, пропірсульфурон, профам, профлуазол, профлуралін, прогексадіон-кальцій, пропоксикарбазон, пропоксикарбазон-натрій, профоксидим, бромацил, бромпіразон, прометрин, прометон, бромоксиніл, бромфеноксим, бромобутид, бромобоніл, флорасулам,

[0162]

гексахлорацетон, гексазинон, петоксамід, беназолін, пеноксилам, пебулат, бефлубутамід, вернолат, перфлуїдон, бенкарбазон, бензадокс, бензипрам, бензиламінопури, бензтіазурон, бензфендизон, бенсулід, бенсульфурон-метил, бензоїлпроп, бензобіциклон, бензофенап, бензофлуор, бентазон, пентанохлор, бентіокарб, пендиметалін, пентоксазон, бенфлуралін, бенфуресат, фосамін, фомесафен, форамсульфурон, форхлорфенурон, малеїновий гідрозид, мекопроп, мекопроп-Р, мединотерб, мезосульфурон, мезосульфурон-метил, мезотріон, мезопразин, метопротрин, метазаклор, метазол, метазосульфурон, метабензтіазурон, метамітрон, метаміфоп, метам, металпропалін, метіурон, метіозолін, метіобенкарб, метилдимрон, метоксурон, метосулам, метсульфурон, метсульфурон-метил, метфлуразон, метобромурон, метобензурон, метометон, метолахлор, метрибузин, мепікват-хлорид, мефенацет, мефлуїдид, моналід, монісоурон, монурон, монохлороцтову кислоту, монолінулон, молінат, морфамкват, йодосульфурон, йодосульфурон-метил-натрій, йодобоніл, йодометан, лактофен, лінулон, римсульфурон, ленацил, родетаніл, пероксид кальцію і метилбромід.

[0163]

Типові біопестициди, використовувані для задач, зазначених вище, включають вірусні

препарати, такі як віруси ядерного поліедрозу (NPV), віруси гранульозу (GV), віруси цитоплазматичного поліедрозу (CPV) і віруси ентомопексу (EPV); мікробні пестициди, використовувані як інсектициди або нематоциди, такі як *Monacrosporium rhymatophagum*, *Steinernema carpocapsae*, *Steinernema kushidai* і *Pasteuria penetrans*; мікробні пестициди, використовувані як мікробіциди, такі як *Trichoderma lignorum*, *Agrobacterium radiobacter*, авірулентні *Erwinia carotovora* і *Bacillus subtilis*; і біопестициди, використовувані як гербіциди, такі як *Xanthomonas campestris*. Можна очікувати, що таке комбіноване застосування сільськогосподарського і садівницького інсектициду за даним винаходом з вищевказаним біопестицидом у вигляді суміші забезпечить той же ефект, що і зазначений вище.

[0164]

Інші приклади біопестицидів включають природних хижаків, таких як *Encarsia formosa*, *Aphidius colemani*, *Aphidoletes aphidimyza*, *Diglyphus isaea*, *Dacnusa sibirica*, *Phytoseiulus persimilis*, *Amblyseius cucumeris* і *Orius sauteri*; мікробні пестициди, такі як *Beauveria brongniartii*; і феромони, такі як (Z)-10-тетрадеценілацетат, (E, Z)-4,10-тетрадекадієнілацетат, (Z)-8-додеценілацетат, (Z)-11-тетрадеценілацетат, (Z)-13-ікозен-10-он і 14-метил-1-октадецен.

[0165]

Сполуки за даним винаходом мають чудові біологічні характеристики, які описані вище, а також впливають на навколишнє середовище, що підтверджується легкістю їх розкладання в навколишньому середовищі, і впливають на корисні організми, такі як бджоли.

[0166]

Сполуки за даним винаходом також придатні для дезінфекції паразитів, які живуть усередині організмів або на організмах тварин, таких як люди, свійські (сільськогосподарські) тварини і домашні (кімнатні) тварини.

Даний винахід також включає засіб для контролю ектопаразитів тварин, який включає сполуку за даним винаходом або її сіль як активний інгредієнт; і спосіб контролю ектопаразитів тварин, який включає обробку ектопаразитів тварин засобом контролю ектопаразитів тварин. Сполука за даним винаходом може застосовуватися точковим нанесенням або поливанням звичайно на одну ділянку або дві ділянки на шкірі тварини, такої як кішка або собака. Площа обробки звичайно становить від 5 до 10 см². Після застосування сполука за даним винаходом переважно дифундує по всьому тілу тварини і потім висихає без кристалізації або зміни зовнішнього вигляду або текстури. Переважна кількість використовуваної сполуки вибрана в інтервалі від 0,1 до 10 мл залежно від маси тіла тварини і, зокрема, становить від 0,5 до 1 мл для кішки і від 0,3 до 3 мл для собаки.

[0167]

Засіб контролю ектопаразитів за даним винаходом ефективний, наприклад, проти наступних ектопаразитів тварин. Паразити ряду бліх (*Siphonaptera*) включають види роду *Pulex*, такі як *Pulex allersani*; види роду *Ctenocephalides*, такі як *Ctenocephalides felis* і *Ctenocephalides canis*; види роду *Xenopsylla*, такі як *Xenopsylla cheopis*; види роду *Tunga*, такі як *Tunga penetrans*; види роду *Echidnophaga*, такі як *Echidnophaga gallinacea*; і види роду *Nosopsyllus*, такі як *Nosopsyllus fasciatus*.

[0168]

Паразити ряду вошей (*Siphunculata*) включають види роду *Pediculus*, такі як *Pediculus humanus capitis*; види роду *Pthirus*, такі як *Pthirus pubis*; види роду *Haematopinus*, такі як *Haematopinus eurysternus* і *Haematopinus suis*; види роду *Damalinia*, такі як *Damalinia ovis* і *Damalinia bovis*; види роду *Linognathus*, такі як *Linognathus vituli* і *Linognathus ovillus* (паразитують на тілі вівці); і види роду *Solenopotes*, такі як *Solenopotes capillatus*.

[0169]

Паразити ряду пуходів (*Mallophaga*) включають види роду *Menopon*, такі як *Menopon gallinae*; *Trimenopon* spp.; *Trinoton* spp.; види роду *Trichodectes*, такі як *Trichodectes canis*; види роду *Felicola*, такі як *Felicola subrostratus*; види роду *Bovicola*, такі як *Bovicola bovis*; види роду *Menacanthus*, такі як *Menacanthus stramineus*; *Werneckiella* spp.; і *Lepikentron* spp.

[0170]

Паразити ряду напівтвердокрилих (*Hemiptera*) включають види роду *Cimex*, такі як *Cimex lectularius* і *Cimex hemipterus*; види роду *Reduvius*, такі як *Reduvius senilis*; види роду *Arilus*, такі як *Arilus critatus*; види роду *Rhodnius*, такі як *Rhodnius prolixus*; види роду *Triatoma*, такі як *Triatoma rubrofasciata*; і *Panstrongylus* spp.

[0171]

Паразити ряду кліщів (*Acarina*) включають види роду *Amblyomma*, такі як *Amblyomma americanum* і *Amblyomma maculatum*; види роду *Boophilus*, такі як *Boophilus microplus* і *Boophilus annulatus*; види роду *Dermacentor*, такі як *Dermacentor variabilis*, *Dermacentor taiwanensis* і

Dermacentor andersoni; види роду Haemaphysalis, такі як Haemaphysalis longicornis, Haemaphysalis flava і Haemaphysalis campanulata; види роду Ixodes, такі як Ixodes ovatus, Ixodes persulcatus, Ixodes scapularis, Ixodes pacificus і Ixodes holocyclus; види роду Rhipicephalus, такі як Rhipicephalus sanguineus і Rhipicephalus appendiculatus; види роду Argas, такі як Argas persicus; види роду Ornithodoros, такі як Ornithodoros hermsi і Ornithodoros turicata; види роду Psoroptes, такі як Psoroptes ovis і Psoroptes equi; види роду Knemidocoptes, такі як Knemidocoptes mutans; види роду Notoedres, такі як Notoedres cati і Notoedres muris; види роду Sarcoptes, такі як Sarcoptes scabiei; види роду Otodectes, такі як Otodectes cynotis; види роду Listrophorus, такі як Listrophorus gibbus; Chorioptes spp.; Hypodectes spp.; Pterolichus spp.; Cytodites spp.; Laminosioptes spp.; види роду Dermanyssus, такі як Dermanyssus gallinae; види роду Ornithonyssus, такі як Ornithonyssus sylviae і Ornithonyssus bacoti; види роду Varroa, такі як Varroa jacobsoni; види роду Cheyletiella, такі як Cheyletiella yasguri і Cheyletiella blakei; Ornithocheyletia spp.; види роду Demodex, такі як Demodex canis і Demodex cati; Myobia spp.; Psorergates spp.; і види роду Trombicula, такі як Trombicula akamushi, Trombicula pallida і Trombicula scutellaris. Переважно, паразити являють собою паразитів ряду бліх (Siphonaptera), паразитів ряду вошей (Siphunculata) і паразитів ряду кліщів (Acarina).

[0172]

Тварини, яким вводять засіб для контролю еktopаразитів за даним винаходом, можуть бути тваринами-хазяїнами для вищезгаданих тварин-екtopаразитів. Такі тварини звичайно є гомеотермами і пойкилотермами, яких розводять як (сільськогосподарських) свійських тварин або (кімнатних) домашніх тварин. Такі гомеотерми включають ссавців, таких як велика рогата худоба, буйволи, вівці, кози, свині, верблюди, олені, лані, північні олені, коні, осли, собаки, кішки, кролики, тхори, миші, щури, хом'яки, білки і мавпи; хутряні звірі, такі як норки, шиншили і еноти; і птахи, такі як кури, гуси, індички, домашні качки, голуби, папуги і перепели. Вищезгадані пойкилотерми включають рептилій, таких як черепахи, морські черепахи, червоновухі черепахи, японські прісноводні черепахи, ящірки, ігуани, хамелеони, гекони, пітони, вужоподібні змії і кобри. Переважними є гомеотерми, більш переважними є ссавці, такі як собаки, кішки, велика рогата худоба, коні, свині, вівці і кози.

[0173]

Далі будуть більш докладно описані приклади одержання типових сполук за даним винаходом і проміжних сполук, але даний винахід не обмежується тільки цими прикладами.

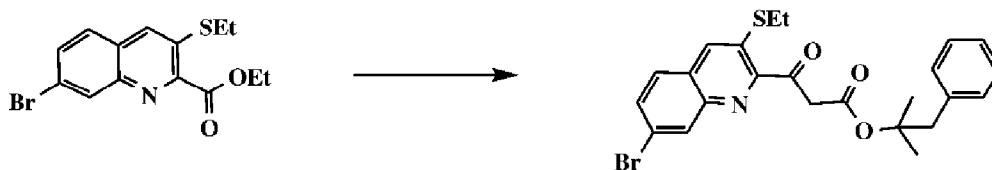
ПРИКЛАДИ

[0174]

Довідковий приклад 1

Спосіб одержання 1,1-диметил-2-фенілетилового ефіру 3-(7-бром-3-етилтіохінолін-2-іл)-3-оксипропіонової кислоти

[Хім. 14]



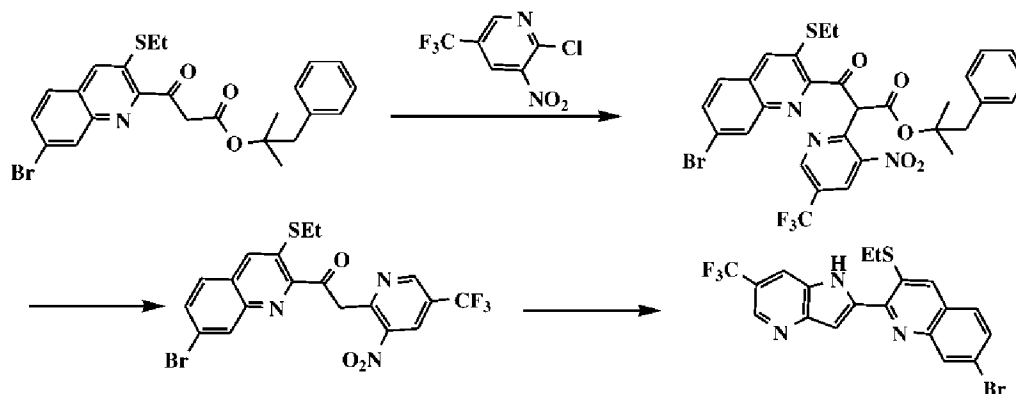
1,1-Диметил-2-фенілетиловий ефір оцтової кислоти (538 мг, 2,8 ммоль) розчиняють у тетрагідрофурані (ТГФ) (12 мл). В атмосфері аргону розчин охолоджують на бані з сухим ацетоном і додають діізопропіламід літію (2,6М розчин у ТГФ, 2,6 мл). Суміш перемішують протягом 30 хвилин і потім додають етиловий ефір 7-бром-3-етилтіохінолін-2-карбонової кислоти (808 мг, 2,4 ммоль), одержаний методом, описаним в WO 2016/091731. Суміш перемішують протягом 1,5 години, потім додають 3N соляну кислоту і нагрівають суміш до кімнатної температури. До реакційної суміші додають воду і екстрагують суміш етилацетатом. Органічний шар промивають насиченим водним розчином хлориду натрію. Органічний шар сушать над безводним сульфатом натрію і розчинник випарюють у вакуумі. Залишок очищають колонковою хроматографією з одержанням суміші (620 мг), що містить цільову сполуку.

[0175]

Довідковий приклад 2

Спосіб одержання 2-(7-бром-3-етилтіохінолін-2-іл)-6-трифторметил-1Н-піроло[3,2-б]піридину

[Хім. 15]

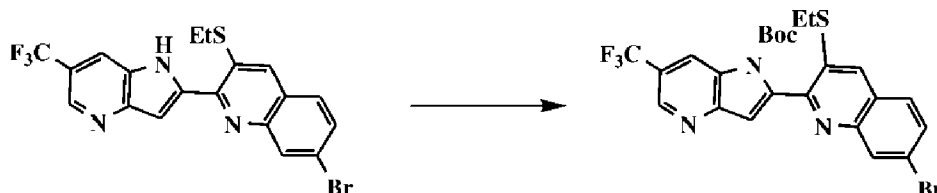


1,1-Дметил-2-фенілетиловий ефір 3-(7-бром-3-етилтіохінолін-2-іл)-3-оксипропіонової
кислоти (750 мг) розчиняють в N, N-диметилформаміді (ДМФА) (5 мл) і до одержаного розчину
додають гідрид натрію (136 мг). Суміш перемішують протягом 30 хвилин, потім додають 2-хлор-
3-нітро-5-трифторметилпіридин (462 мг) і перемішують одержану суміш протягом 2 годин. До
реакційної суміші послідовно додають воду і 3N соляну кислоту і екстрагують одержану суміш
етилацетатом. Органічний шар концентрують, до залишку додають трифтороцтову кислоту (5
мл) і перемішують одержану суміш при 50 °С протягом 1 години. До реакційної суміші додають
залізний порошок (500 мг) і перемішують одержану суміш при 80 °С протягом 2 годин. До
реакційної суміші додають воду і етилацетат і фільтрують суміш через целіт. Водний шар
екстрагують етилацетатом, органічний шар концентрують. Залишок очищають колонковою
хроматографією з одержанням цільової сполуки, тобто 2-(7-бром-3-етилтіохінолін-2-іл)-6-
трифторметил-1Н-піроло[3,2-б]піридину (446 мг).

[0176]

Довідковий приклад 3
Спосіб одержання 1-(трет-бутоксикарбоніл)-2-(7-бром-3-етилтіохінолін-2-іл)-6-
трифторметил-1Н-піроло[3,2-б]піридину

[Хім. 16]

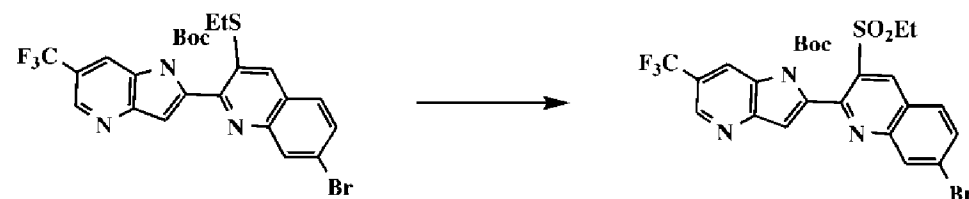


2-(7-Бром-3-етилтіохінолін-2-іл)-6-трифторметил-1Н-піроло[3,2-б]піридин (250 мг)
розчиняють у ТГФ (2 мл) і до розчину додають N, N-диметиламінопіридин (10 мг) і ди-трет-
бутилкарбонат (158 мг). Суміш перемішують протягом 30 хвилин, концентрують і залишок
очищають колонковою хроматографією з одержанням цільової сполуки, тобто 1-(трет-
бутоксикарбоніл)-2-(7-бром-3-етилтіохінолін-2-іл)-6-трифторметил-1Н-піроло[3,2-б]піридину (244
мг).

[0177]

Довідковий приклад 4
Спосіб одержання 1-(трет-бутоксикарбоніл)-2-(7-бром-3-етилсульфонілхінолін-2-іл)-6-
трифторметил-1Н-піроло[3,2-б]піридину

[Хім. 17]



1-(Трет-бутоксикарбоніл)-2-(7-бром-3-етилтіохінолін-2-іл)-6-трифторметил-1Н-піроло[3,2-
б]піридин (233 мг) розчиняють в етилацетаті (10 мл). До одержаного розчину додають мета-
хлорпербензойну кислоту (233 мг) і перемішують одержану суміш при кімнатній температурі
протягом 10 хвилин. Реакційну суміш концентрують і очищають залишок колонковою

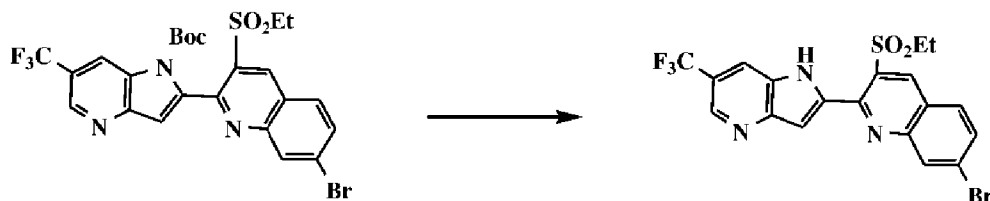
хроматографією з одержанням цільової сполуки, тобто 1-(трет-бутоксикарбоніл)-2-(7-бром-3-етилсульфонілхінолін-2-іл)-6-трифторметил-1Н-піроло[3,2-*b*]піридину (149 мг).

[0178]

Довідковий приклад 5

5 Спосіб одержання трифторацетату 2-(7-бром-3-етилсульфонілхінолін-2-іл)-6-трифторметил-1Н-піроло[3,2-*b*]піридину

[Хім. 18]



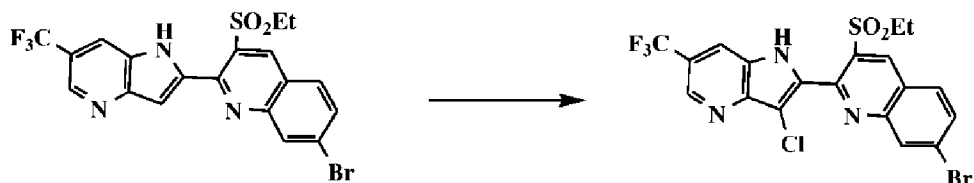
10 1-(Трет-бутоксикарбоніл)-2-(7-бром-3-етилсульфонілхінолін-2-іл)-6-трифторметил-1Н-піроло[3,2-*b*]піридин (135 мг) розчиняють у трифтороцтовій кислоті (2 мл) і перемішують одержаний розчин при кімнатній температурі протягом ночі. Реакційну суміш концентрують і очищують залишок колонковою хроматографією з одержанням цільової сполуки, тобто трифторацетату 2-(7-бром-3-етилсульфонілхінолін-2-іл)-6-трифторметил-1Н-піроло[3,2-*b*]піридину (144 мг).

[0179]

Довідковий приклад 6

15 Спосіб одержання 3-хлор-2-(7-бром-3-етилсульфонілхінолін-2-іл)-6-трифторметил-1Н-піроло[3,2-*b*]піридину

[Хім. 19]



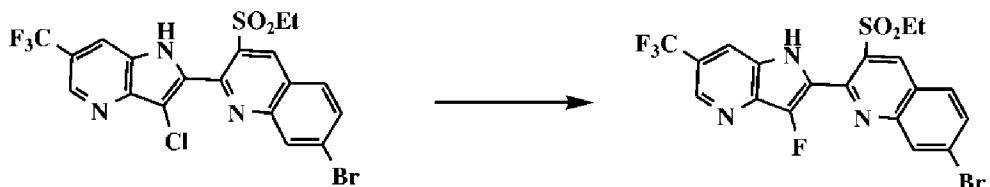
20 Трифторацетат 2-(7-бром-3-етилсульфонілхінолін-2-іл)-6-трифторметил-1Н-піроло[3,2-*b*]піридину (134 мг) розчиняють в ацетонітрилі (5 мл) і ДМФА (1 мл). До одержаного розчину додають сульфурилхлорид (1 мл) і перемішують одержану суміш при кімнатній температурі протягом 10 хвилин. До реакційної суміші додають насичений водний розчин бікарбонату натрію і насичений водний розчин тіосульфату натрію і перемішують одержану суміш протягом 30 хвилин. Водний шар екстрагують етилацетатом, органічний шар концентрують. Залишок очищують колонковою хроматографією з одержанням 3-хлор-2-(7-бром-3-етилсульфонілхінолін-2-іл)-6-трифторметил-1Н-піроло[3,2-*b*]піридину (104 мг).

[0180]

Довідковий приклад 7

30 Спосіб одержання 2-(7-бром-3-етилсульфонілхінолін-2-іл)-3-фтор-6-трифторметил-1Н-піроло[3,2-*b*]піридину

[Хім. 20]



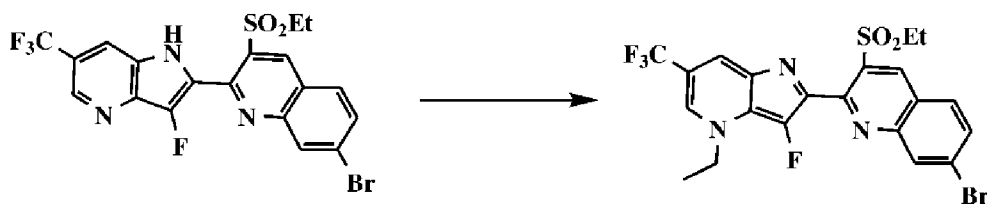
35 3-Хлор-2-(7-бром-3-етилсульфонілхінолін-2-іл)-6-трифторметил-1Н-піроло[3,2-*b*]піридин (74 мг) розчиняють в ацетонітрилі (5 мл). До одержаного розчину додають бікарбонат натрію (40 мг) і Selectfluor (160 мг) і перемішують одержану суміш при 60 °C протягом 1 години. До реакційної суміші додають насичений водний розчин тіосульфату натрію, суміш перемішують протягом 10 хвилин і потім суміші дають можливість остудитися до кімнатної температури. Водний шар екстрагують етилацетатом, органічний шар концентрують. Залишок очищують колонковою хроматографією з одержанням 2-(7-бром-3-етилсульфонілхінолін-2-іл)-3-фтор-6-трифторметил-1Н-піроло[3,2-*b*]піридину (25 мг).

[0181]

Приклад 1

Спосіб одержання 2-(7-бром-3-етилсульфонілхінолін-2-іл)-3-фтор-4-етил-6-трифторметил-4Н-піроло[3,2-б]піридину (сполука номер 2-76)

[Хім. 21]



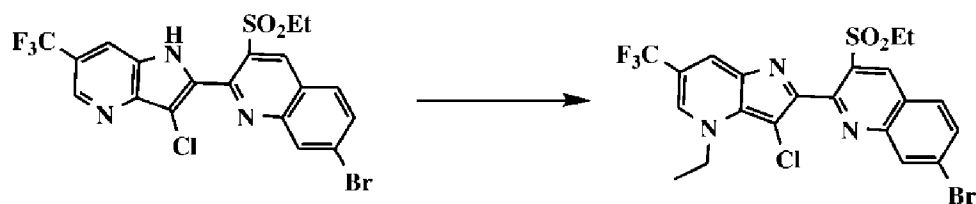
Етилийодид (0,3 мл) додають до розчину 2-(7-бром-3-етилсульфонілхінолін-2-іл)-3-фтор-6-трифторметил-1Н-піроло[3,2-б]піридину (10 мг, 0,02 ммоль) у ДМФА (0,3 мл) і перемішують одержану суміш при 80 °С протягом 2 годин. Після завершення реакції до суміші додають етилацетат і промивають органічний шар насиченим водним розчином хлориду натрію. Органічний шар сушать над безводним сульфатом натрію і розчинник випарюють у вакуумі. Залишок очищають колонковою хроматографією на силікагелі з одержанням 2-(7-бром-3-етилсульфонілхінолін-2-іл)-3-фтор-4-етил-6-трифторметил-4Н-піроло[3,2-б]піридину (5,1 мг, 47 %).

[0182]

Приклад 2

Спосіб одержання 2-(7-бром-3-етилсульфонілхінолін-2-іл)-3-хлор-4-етил-6-трифторметил-4Н-піроло[3,2-б]піридину (сполука номер 2-52)

[Хім. 22]



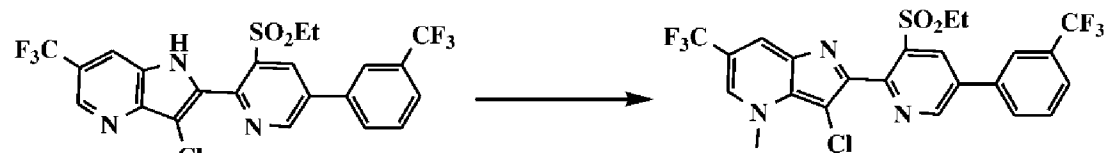
Етилийодид (0,3 мл) додають до розчину 3-хлор-2-(7-бром-3-етилсульфонілхінолін-2-іл)-6-трифторметил-1Н-піроло[3,2-б]піридину в ДМФА (0,3 мл) (10 мг, 0,02 ммоль) і перемішують одержану суміш при 80 °С протягом 2 годин. Після завершення реакції до суміші додають етилацетат і промивають органічний шар насиченим водним розчином хлориду натрію. Органічний шар сушать над безводним сульфатом натрію, розчинник випарюють у вакуумі. Залишок очищають колонковою хроматографією на силікагелі з одержанням 2-(7-бром-3-етилсульфонілхінолін-2-іл)-3-хлор-4-етил-6-трифторметил-4Н-піроло[3,2-б]піридину (7,2 мг, 64 %).

[0183]

Приклад 3

Спосіб одержання 2-(5-(3-трифторметилфеніл)-3-етилсульфонілпіридин-2-іл)-3-хлор-4-метил-6-трифторметил-4Н-піроло[3,2-б]піридину (сполука номер 1-13)

[Хім. 23]



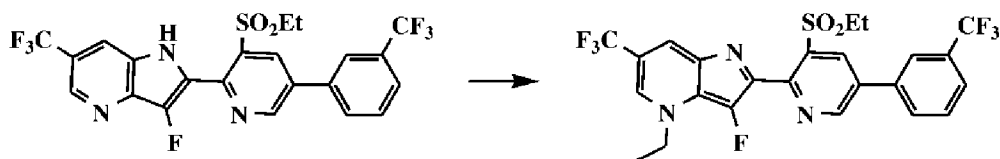
MeI (1 мл, 16 ммоль) додають до розчину 2-(5-(3-трифторметилфеніл)-3-етилсульфонілпіридин-2-іл)-3-хлор-6-трифторметил-1Н-піроло[3,2-б]піридину (0,05 г, 0,094 ммоль), одержаного згідно зі схемою, описаною в довідкових прикладах 1-6, у ДМФА (1 мл) і перемішують одержану суміш при 60 °С протягом 2 годин. Після завершення реакції до суміші додають насичений водний розчин гідрокарбонату натрію і екстрагують суміш етилацетатом. Органічний шар сушать над безводним сульфатом магнію і потім концентрують у вакуумі. Залишок очищають колонковою хроматографією на силікагелі з одержанням 2-(5-(3-трифторметилфеніл)-3-етилсульфонілпіридин-2-іл)-3-хлор-4-метил-6-трифторметил-4Н-піроло[3,2-б]піридину (0,031 г, 60 %).

[0184]

Приклад 4

Спосіб одержання 2-(5-(3-трифторметилфеніл)-3-етилсульфонілпіридин-2-іл)-3-фтор-4-етил-6-трифторметил-4Н-піроло[3,2-б]піридину (сполука номер 1-16)

[Хім. 24]



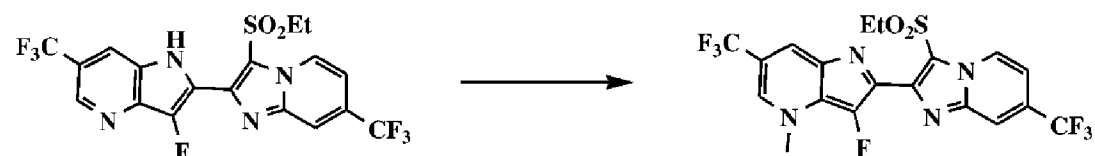
EtI (1 мл, 12,5 ммоль) додають до розчину в ДМФА (1 мл) 2-(5-(3-трифторметилфеніл)-3-етилсульфонілпіридин-2-іл)-3-фтор-6-трифторметил-1Н-піроло[3,2-б]піридину (0,04 г, 0,077 ммоль), одержаного згідно зі схемою, описаною в довідкових прикладах 1-7, і перемішують одержану суміш при 80 °С протягом 3 годин. Після завершення реакції до суміші додають насичений водний розчин гідрокарбонату натрію і екстрагують суміш етилацетатом. Органічний шар сушать над безводним сульфатом магнію і потім концентрують у вакуумі. Залишок очищують колонковою хроматографією на силікагелі з одержанням 2-(5-(3-трифторметилфеніл)-3-етилсульфонілпіридин-2-іл)-3-фтор-4-етил-6-трифторметил-4Н-піроло[3,2-б]піридину (0,029 г, 68 %).

[0185]

Приклад 5

Спосіб одержання 2-(3-етилсульфоніл-7-(трифторметил)-імідазо[1,2-а]піридин-2-іл)-3-фтор-4-метил-6-(трифторметил)-4Н-піроло[3,2-б]піридину (сполука номер 3-14)

[Хім. 25]



ДМФА (1 мл) і MeI (1 мл) додають до 3-етилсульфоніл-2-(3-фтор-6-(трифторметил)-1Н-піроло[3,2-б]піридин-2-іл)-7-(трифторметил)імідазо[1,2-а]піридину (13,0 мг, 0,0271 ммоль), одержаного згідно зі схемою, описаною в довідкових прикладах 1-7, і кип'яють суміш зі зворотним холодильником при перемішуванні протягом 4 годин. Після завершення реакції реакційну суміш розводять етилацетатом і промивають органічний шар послідовно водою і насиченим водним розчином хлориду натрію. Органічний шар сушать над безводним сульфатом натрію, фільтрують і фільтрат концентрують. Залишок очищують колонковою хроматографією на силікагелі з одержанням 2-(3-етилсульфоніл-7-(трифторметил)імідазо[1,2-а]піридин-2-іл)-3-фтор-4-метил-6-(трифторметил)-4Н-піроло[3,2-б]піридину (8,0 мг, 60 %).

[0186]

Далі представлені приклади препаратів, але даний винахід не обмежується представленими прикладами. У прикладах препаратів термін "частина" означає частина по масі.

[0187]

Приклад препарату 1

Сполука за даним винаходом	10 частин
Ксилол	70 частин
N-метилпіролідон	10 частин
Суміш поліоксіетиленнонілфенілового ефіру і алкілбензолсульфонату кальцію	10 частин

Зазначені вище інгредієнти ретельно змішують для розчинення з одержанням препарату у формі емульгованого концентрату.

[0188]

Приклад препарату 2

Сполука за даним винаходом	3 частини
Порошкоподібна глина	82 частини
Порошкоподібний діатоміт	15 частин

Зазначені вище інгредієнти ретельно змішують і потім розпиляють з одержанням препарату у формі дусту.

[0189]

5

Приклад препарату 3

Сполука за даним винаходом	5 частин
Суміш порошкоподібного бентоніту і порошкоподібної глини	90 частин
Лігносульфат кальцію	5 частин

Зазначені вище інгредієнти змішують до одержання однорідної суміші. До суміші додають придатний об'єм води, суміш замішують, гранулюють і сушать з одержанням препарату у формі гранул.

10

[0190]

Приклад препарату 4

Сполука за даним винаходом	20 частин
Каолін і синтетична високодисперсна кремнієва кислота	75 частин
Суміш поліоксіетиленнонілфенілового ефіру і алкілбензолсульфонату кальцію	5 частин

15

Зазначені вище інгредієнти ретельно змішують і потім розпиляють з одержанням препарату у формі змочуваного порошку.

[0191]

Далі представлені приклади біологічних випробувань сполук за даним винаходом, але даний винахід не обмежується представленими прикладами.

20

Приклад біологічного випробування 1

Тест ефективності контролю *Myzus persicae*

25

Рослини китайської капусти висаджують у пластикові горщики (діаметр: 8 см, висота: 8 см), на рослинах розводять попелицю персикову зелену (*Myzus persicae*) і підраховують кількість живих особин попелиці на рослині в кожному горщику. Конденсовані гетероциклічні сполуки, представлені загальною формулою (1), за даним винаходом або їх солі роздільно диспергують у воді і розводять до концентрації 500 м.ч. Агрохімічні дисперсії наносять на листя рослин китайської капусти в горщиках. Рослини сушать на повітрі і потім горщики поміщають у теплицю. Через 6 днів після нанесення препарату в кожному горщику на рослинах китайської капусти підраховують кількість особин попелиці персикової зеленої, що вижили, контрольний показник розраховують за формулою, представленою нижче, і ефективність контролю оцінюють відповідно до критеріїв, наведених нижче.

[0192]

[Матем. 1]

Показник контролю = $100 - \{(T \times Ca) / (Ta \times C)\} \times 100$.

35

[0193]

Ta: число живих особин на рослині до обробки листя в горщику, який піддають обробці.

T: число особин, що вижили, на рослині після обробки листя в горщику, який піддають обробці.

Ca: число живих особин на рослині до обробки листя в горщику, який не піддають обробці.

40

C: число особин, що вижили, на рослині після обробки листя в горщику, який не піддають обробці.

[0194]

Критерії оцінки

A: ефективність контролю становить 100 %.

45

B: ефективність контролю становить від 90 до 99 %.

C: ефективність контролю становить від 80 до 89 %.

D: ефективність контролю становить від 50 до 79 %.

[0195]

50

Результати тесту показують, що сполуки 1-1, 1-3, 1-4, 1-5, 1-7, 1-8, 1-9, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-16, 1-17, 1-18, 1-19, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-24, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 1-34, 1-35, 1-36, 1-37, 1-38, 1-43, 1-45, 1-46, 1-47, 1-48, 1-49, 1-51, 1-55, 1-57, 1-58, 1-72,

1-73, 1-74, 1-75, 1-76, 1-77, 1-78, 1-79, 1-80, 1-81, 1-82, 1-83, 1-84, 1-85, 1-86, 1-87, 1-88, 1-89, 1-90, 1-91, 1-92, 1-93, 1-94, 1-95, 2-5, 2-52, 2-54, 2-76, 2-78, 2-100, 2-108, 2-109, 3-5, 3-6, 3-14, 3-18, 3-19, 3-21, 3-22, 3-23, 3-29, 3-30, 3-36, 3-43, 3-44, 3-45 і 3-46 за даним винаходом проявляють активність, відповідну критерію А.

5 [0196]

Приклад біологічного випробування 2

Тест інсектицидної активності відносно цикадки темної *Laodelphax striatellus*

Конденсовані гетероциклічні сполуки, представлені загальною формулою (1), за даним винаходом або їх солі роздільно диспергують у воді і розводять до концентрації 500 м.ч. Саджанці рослин рису (сорт: Nihonbare) занурюють в агрохімічні дисперсії на 30 секунд. Після висушування на повітрі кожний саджанець поміщають в окрему скляну пробірку і інокують десятьма личинками *Laodelphax striatellus* 3-ої вікової стадії, після чого скляні пробірки закривають бавовняними пробками. Через 8 днів після інокуляції підраховують кількість личинок, що вижили, і мертвих личинок, розраховують скоректований коефіцієнт смертності за формулою, представленою нижче, і оцінюють інсектицидну ефективність відповідно до критеріїв, зазначених нижче.

[0197]

[Матем. 2]

Скоректований показник смертності (%) = $100 \times (\text{Вживаність у пробірці з необробленими рослинами} - \text{Вживаність у пробірці з обробленими рослинами}) / \text{Вживаність у пробірці з необробленими рослинами}$.

[0198]

Критерії оцінки ефективності

А: скоректований показник смертності становить 100 %.

В: скоректований показник смертності становить від 90 до 99 %.

С: скоректований показник смертності становить від 80 до 89 %.

Д: скоректований показник смертності становить від 50 до 79 %.

[0199]

Результати показують, що сполуки 1-1, 1-3, 1-4, 1-5, 1-7, 1-8, 1-9, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-16, 1-17, 1-18, 1-19, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-24, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 1-34, 1-35, 1-36, 1-37, 1-38, 1-43, 1-45, 1-46, 1-47, 1-48, 1-49, 1-51, 1-55, 1-57, 1-58, 1-72, 1-73, 1-74, 1-75, 1-76, 1-77, 1-78, 1-79, 1-80, 1-81, 1-82, 1-83, 1-84, 1-85, 1-86, 1-87, 1-88, 1-89, 1-90, 1-91, 1-92, 1-93, 1-94, 1-95, 2-5, 2-52, 2-54, 2-76, 2-78, 2-100, 2-108, 2-109, 3-5, 3-6, 3-14, 3-18, 3-19, 3-21, 3-22, 3-23, 3-29, 3-30, 3-36, 3-43, 3-44, 3-45 і 3-46 за даним винаходом проявляють активність, відповідну критерію А.

[0200]

Приклад біологічного випробування 3

Тест інсектицидної активності відносно молі капустяної *Plutella xylostella*

Дорослих особин молі капустяної *Plutella xylostella* випускають на саджанці капусти китайської і дають їм можливість відкласти на рослинах яйця. Через 2 дні після випускання дорослих особин саджанці капусти китайської з відкладеними яйцями опускають приблизно на 30 секунд в агрохімічні дисперсії, розведені до 500 м.ч., які містять різні конденсовані гетероциклічні сполуки, представлені загальною формулою (1), за даним винаходом як активний інгредієнт. Після сушіння на повітрі саджанці поміщають у термостатовану камеру з температурою 25 °С. Через 6 днів після обробки зануренням підраховують кількість личинок, що вилупилися, на ділянку, розраховують показник смертності відповідно до наведеної нижче формули, і відповідно до критеріїв прикладу біологічного випробування 2 оцінюють ефективність інсектицидної дії. Цей тест проводять у трьох повторях з використанням 10 дорослих особин молі капустяної *Plutella xylostella* на горщик.

[0201]

[Матем. 3]

Скоректований показник смертності (%) = $100 \times (\text{Число личинок, що вилупилися, у необробленому горщику} - \text{Число личинок, що вилупилися, в обробленому горщику}) / \text{Число личинок, що вилупилися, у необробленому горщику}$.

[0202]

Одержані результати показують, що сполуки 1-1, 1-3, 1-4, 1-5, 1-7, 1-8, 1-9, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-16, 1-17, 1-18, 1-19, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-24, 1-25, 1-26, 1-27, 1-28, 1-29, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 1-34, 1-35, 1-36, 1-37, 1-38, 1-43, 1-45, 1-46, 1-47, 1-48, 1-49, 1-51, 1-55, 1-57, 1-58, 1-72, 1-73, 1-74, 1-75, 1-76, 1-77, 1-78, 1-79, 1-80, 1-81, 1-82, 1-83, 1-84, 1-85, 1-86, 1-87, 1-88, 1-89, 1-90, 1-91, 1-92, 1-93, 1-94, 1-95, 2-5, 2-52, 2-54, 2-76, 2-78, 2-100, 2-108, 2-109, 3-5, 3-6, 3-14,

3-18, 3-19, 3-21, 3-22, 3-23, 3-29, 3-30, 3-36, 3-43, 3-44, 3-45 і 3-46 за даним винаходом проявляють активність, відповідну критерію А.

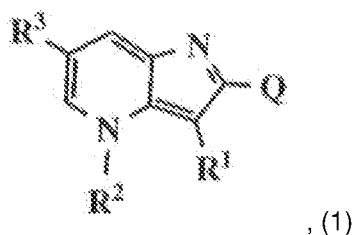
ПРОМИСЛОВА ЗАСТОСОВНІСТЬ

[0203]

- 5 Сполуки за даним винаходом є високоефективними для контролю широкого спектра сільськогосподарських і садових шкідників і, таким чином, є корисними.

ФОРМУЛА ВІНАХОДУ

- 10 1. Сполука 4Н-піролопіридину, представлена загальною формулою (1):

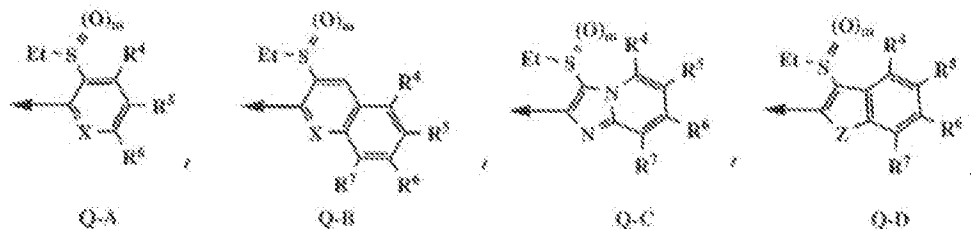


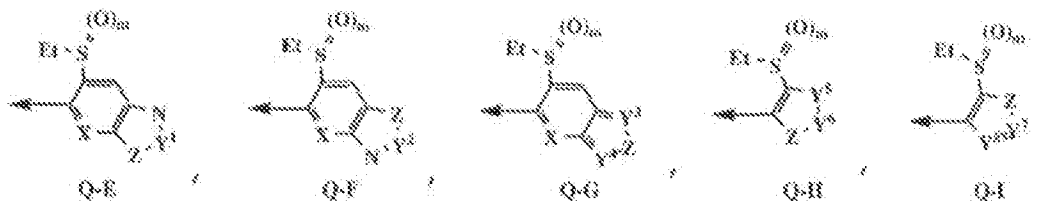
де R¹ являє собою:

- 15 (a1) атом водню;
 (a2) атом галогену;
 (a3) ціаногрупу;
 (a4) (C₁-C₆)-алкільну групу;
 (a5) (C₁-C₆)-алкоксигрупу;
 20 (a6) (C₁-C₆)-алкілкарбонільну групу; або
 (a7) (C₁-C₆)-алкоксикарбонільну групу;
 R² являє собою:
 (b1) (C₁-C₆)-алкільну групу;
 (b2) ціано-(C₁-C₆)-алкільну групу;
 25 (b3) (C₂-C₆)-алкенільну групу;
 (b4) (C₂-C₆)-алкінільну групу;
 (b5) (C₁-C₆)-алкокси-(C₁-C₆)-алкільну групу;
 (b6) (C₁-C₆)-алкілтіо-(C₁-C₆)-алкільну групу; або
 (b7) галоген-(C₁-C₆)-алкільну групу;

- 30 R³ являє собою:
 (c1) атом галогену;
 (c2) галоген-(C₁-C₆)-алкільну групу;
 (c3) галоген-(C₁-C₆)-алкоксигрупу;
 (c4) галоген-(C₁-C₆)-алкілтіогрупу;
 35 (c5) галоген-(C₁-C₆)-алкілсульфінільну групу; або
 (c6) галоген-(C₁-C₆)-алкілсульфонільну групу;

Q являє собою кільце, представлене будь-якою зі структурних формул Q-A, Q-B, Q-C, Q-D, Q-E, Q-F, Q-G, Q-H і Q-I, наведених нижче:





де

X являє собою групу СН або атом азоту,

5 R⁴, R⁵, R⁶ і R⁷ можуть бути однаковими або різними і кожний являє собою:

(d1) атом водню;

(d2) атом галогену;

(d3) формільну групу;

(d4) ціаногрупу;

10 (d5) (C₁-C₆)-алкільну групу;

(d6) (C₃-C₆)-циклоалкільну групу;

(d7) (C₃-C₆)-циклоалкіл-(C₁-C₆)-алкільну групу;

(d8) (C₁-C₆)-алкоксигрупу;

(d9) галоген-(C₁-C₆)-алкільну групу;

15 (d10) галоген-(C₁-C₆)-алкоксигрупу;

(d11) галоген-(C₁-C₆)-алкілтіогрупу;

(d12) галоген-(C₁-C₆)-алкілсульфінільну групу;

(d13) галоген-(C₁-C₆)-алкілсульфонільну групу;

20 (d14) N(R²⁰)(R²¹), де R²⁰ являє собою атом водню, (C₁-C₆)-алкільну групу, галоген-(C₁-C₆)-алкільну групу, (C₃-C₆)-циклоалкільну групу, галоген-(C₁-C₆)-алкільну групу, (C₁-C₆)-алкоксигрупу, (C₁-C₆)-алкілкарбонільну групу або (C₁-C₆)-алкоксикарбонільну групу, і

R²¹ являє собою атом водню, (C₁-C₆)-алкільну групу, галоген-(C₁-C₆)-алкільну групу, (C₃-C₆)-циклоалкільну групу, галоген-(C₁-C₆)-алкільну групу, (C₁-C₆)-алкілкарбонільну групу або (C₁-C₆)-алкоксикарбонільну групу;

25 (d15) C(R²⁰)=NO(R²¹), де R²⁰ і R²¹ приймають значення, визначені вище;

(d16) арильну групу;

(d17) арильну групу, що містить у кільці від 1 до 5 замісників, які можуть бути однаковими або різними і вибираються з: (а) атома галогену, (b) ціаногрупи, (c) нітрогрупи, (d) формільної групи, (e) (C₁-C₆)-алкільної групи, (f) галоген-(C₁-C₆)-алкільної групи, (g) (C₁-C₆)-алкоксигрупи, (h) галоген-(C₁-C₆)-алкоксигрупи, (i) (C₃-C₆)-циклоалкіл-(C₁-C₆)-алкоксигрупи, (j) (C₁-C₆)-алкілтіогрупи, (k) галоген-(C₁-C₆)-алкілтіогрупи, (l) (C₁-C₆)-алкілсульфінільної групи, (m) галоген-(C₁-C₆)-алкілсульфінільної групи, (n) (C₁-C₆)-алкілсульфонільної групи, (o) галоген-(C₁-C₆)-алкілсульфонільної групи, (p) (C₁-C₆)-алкілкарбонільної групи, (q) карбоксильної групи і (r) (C₁-C₆)-алкоксикарбонільної групи;

35 (d18) арил-(C₁-C₆)-алкоксигрупу;

(d19) арил-(C₁-C₆)-алкоксигрупу, що містить у кільці від 1 до 5 замісників, які можуть бути однаковими або різними і вибираються з: (а) атома галогену, (b) ціаногрупи, (c) нітрогрупи, (d) формільної групи, (e) (C₁-C₆)-алкільної групи, (f) галоген-(C₁-C₆)-алкільної групи, (g) (C₁-C₆)-алкоксигрупи, (h) галоген-(C₁-C₆)-алкоксигрупи, (i) (C₃-C₆)-циклоалкіл-(C₁-C₆)-алкоксигрупи, (j) (C₁-C₆)-алкілтіогрупи, (k) галоген-(C₁-C₆)-алкілтіогрупи, (l) (C₁-C₆)-алкілсульфінільної групи, (m) галоген-(C₁-C₆)-алкілсульфінільної групи, (n) (C₁-C₆)-алкілсульфонільної групи, (o) галоген-(C₁-C₆)-алкілсульфонільної групи, (p) (C₁-C₆)-алкілкарбонільної групи, (q) карбоксильної групи і (r) (C₁-C₆)-алкоксикарбонільної групи;

(d20) гетероциклічну групу; або

45 (d21) гетероциклічну групу, що містить у кільці 1 або 2 замісники, які можуть бути однаковими або різними і вибираються з: (а) атома галогену, (b) ціаногрупи, (c) нітрогрупи, (d) формільної групи, (e) (C₁-C₆)-алкільної групи, (f) галоген-(C₁-C₆)-алкільної групи, (g) (C₁-C₆)-алкоксигрупи, (h) галоген-(C₁-C₆)-алкоксигрупи, (i) (C₃-C₆)-циклоалкіл-(C₁-C₆)-алкоксигрупи, (j) (C₁-C₆)-алкілтіогрупи, (k) галоген-(C₁-C₆)-алкілтіогрупи, (l) (C₁-C₆)-алкілсульфінільної групи, (m) галоген-(C₁-C₆)-алкілсульфінільної групи, (n) (C₁-C₆)-алкілсульфонільної групи, (o) галоген-(C₁-C₆)-алкілсульфонільної групи, (p) (C₁-C₆)-алкілкарбонільної групи, (q) карбоксильної групи і (r) (C₁-C₆)-алкоксикарбонільної групи;

50 Z являє собою атом О, S або N-R⁸, де R⁸ являє собою (e1) атом водню, (e2) (C₁-C₆)-алкільну групу, (e3) (C₃-C₆)-циклоалкільну групу або (e4) галоген-(C₁-C₆)-алкільну групу,

- Y¹ являє собою C-R⁹, де R⁹ являє собою (f1) атом водню, (f2) (C₁-C₆)-алкільну групу, (f3) (C₃-C₆)-циклоалкільну групу або (f4) галоген-(C₁-C₆)-алкільну групу,
Y² являє собою C-R¹⁰, де R¹⁰ являє собою (g1) атом водню, (g2) (C₁-C₆)-алкільну групу, (g3) (C₃-C₆)-циклоалкільну групу або (g4) галоген-(C₁-C₆)-алкільну групу,
5 кожний Y³, Y⁴, Y⁵ і Y⁸ являє собою групу CH або N,
Y⁶ і Y⁷ можуть бути однаковими або різними, і кожний являє собою C-R¹¹, де R¹¹ являє собою:
(h1) атом галогену;
(h2) (C₁-C₆)-алкільну групу;
(h3) (C₃-C₆)-циклоалкільну групу;
10 (h4) галоген-(C₁-C₆)-алкільну групу;
(h5) арильну групу; або
(h6) арильну групу, що містить у кільці від 1 до 5 замісників, які можуть бути однаковими або різними і вибираються з: (a) атома галогену, (b) ціаногрупи, (c) нітрогрупи, (d) формільної групи, (e) (C₁-C₆)-алкільної групи, (f) галоген-(C₁-C₆)-алкільної групи, (g) (C₁-C₆)-алкоксигрупи, (h)
15 галоген-(C₁-C₆)-алкоксигрупи, (i) (C₃-C₆)-циклоалкіл- (C₁-C₆)-алкоксигрупи, (j) (C₁-C₆)-алкілтіогрупи, (k) галоген-(C₁-C₆)-алкілтіогрупи, (l) (C₁-C₆)-алкілсульфінільної групи, (m) галоген-(C₁-C₆)-алкілсульфінільної групи, (n) (C₁-C₆)-алкілсульфонільної групи, (o) галоген-(C₁-C₆)-алкілсульфонільної групи, (p) (C₁-C₆)-алкілкарбонільної групи, (q) карбоксильної групи і (r) (C₁-C₆)-алкоксикарбонільної групи),
20 кожна стрілка означає зв'язування з 4Н-піролопіридиновим кільцем,
m дорівнює 0, 1 або 2; і
Et означає етильну групу,
або її сіль.
2. Сполука 4Н-піролопіридину або її сіль за п. 1, де Q являє собою Q-A, Q-B або Q-C.
25 3. Застосування сполуки 4Н-піролопіридину або її солі за п. 1 або 2 як сільськогосподарського і садівницького інсектициду.
4. Спосіб застосування сільськогосподарського і садівницького інсектициду, який включає обробку рослин або ґрунту активним інгредієнтом сільськогосподарського і садівницького інсектициду за п. 3.
30 5. Спосіб контролю сільськогосподарських і садових шкідників, який включає обробку рослин або ґрунту ефективною кількістю сільськогосподарського і садівницького інсектициду за п. 3.
6. Засіб контролю ектопаразитів тварин, який включає сполуку 4Н-піролопіридину або її сіль за п. 1 або 2 як активний інгредієнт.
7. Спосіб контролю ектопаразитів тварин, який включає обробку ектопаразитів тварин
35 ефективною кількістю засобу для контролю ектопаразитів тварин за п. 6.