



(19) **UA** (11) **73 984** (13) **C2**
(51)МПК ⁷ **C 07C 69/757, C 07D 307/02, A**
01N 43/38, 43/12, 43/16

МИНИСТЕРСТВО ОБРАЗОВАНИЯ И НАУКИ
УКРАИНЫ

ГОСУДАРСТВЕННЫЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ УКРАИНЫ

(21), (22) Заявка: 2002118712, 21.03.2001

(24) Дата начала действия патента: 17.10.2005

(30) Приоритет: 03.04.2000 DE 100 16 544.3

(46) Дата публикации: 15.10.2005

(86) Заявка РСТ:
РСТ/EP01/03215, 20010321

(72) Изобретатель:

Рутер Михаэль, DE,
Хагеманн Херманн, DE,
Шнайдер Удо, DE,
Доллингер Маркус, DE,
Дамен Петер, DE,
Вахендорфф-Нойманн Ульрике, DE,
Фишер Райнер, DE,
Графф Алан, DE,
Бретшнайдер Томас, DE,
Эрделен Кристоф, DE,
Древес Марк Вильгельм, DE,
Фойхт Дитер, DE,
Либ Фолькер, DE

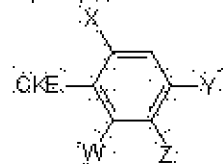
(73) Патентовладелец:

БАЕР АКЦИЕНГЕЗЕЛЛЬШАФТ, DE

(54) C₂-ФЕНИЛЗАМЕЩЕННЫЕ ЦИКЛИЧЕСКИЕ КЕТОЭНОЛЫ КАК ПЕСТИЦИДЫ И ГЕРБИЦИДЫ

(57) Реферат:

Представленное изобретение касается C₂-фенилзамещенных циклических кетоэнолов формулы (1), в которой W, X, Y, Z и СКЕ имеют значения, указанные в формуле как пестицидов и гербицидов.



Официальный бюллетень "Промышленная собственность". Книга 1 "Изобретения, полезные модели, топографии интегральных микросхем", 2005, N 10, 15.10.2005. Государственный департамент интеллектуальной собственности Министерства образования и науки Украины.



(19) **UA** (11) **73 984** (13) **C2**
(51) Int. Cl.⁷ **C 07C 69/757, C 07D 307/02,**
A 01N 43/38, 43/12, 43/16

MINISTRY OF EDUCATION AND SCIENCE OF
UKRAINE

STATE DEPARTMENT OF INTELLECTUAL
PROPERTY

(12) **DESCRIPTION OF PATENT OF UKRAINE FOR INVENTION**

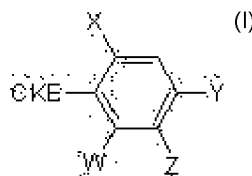
(21), (22) Application: 2002118712, 21.03.2001
(24) Effective date for property rights: 17.10.2005
(30) Priority: 03.04.2000 DE 100 16 544.3
(46) Publication date: 15.10.2005
(86) PCT application:
PCT/EP01/03215, 20010321

(72) Inventor:
Ruther Michael, DE,
Hagemann Hermann, DE,
Schneider Udo, DE,
Dollinger Markus, DE,
Dahmen Peter, DE,
Wachendorff-Neumann Ulrike, DE,
Fischer Reiner, DE,
Graff Alan, DE,
Bretschneider Thomas, DE,
Erdelen Christoph, DE,
Drewes Mark Wilhelm, DE,
Feucht Dieter, DE,
Lieb Folker, DE
(73) Proprietor:
BAYER AKTIENGESELLSCHAFT, DE

(54) **C₂-PHENYL- SUBSTITUTED CYCLIC KETO-ENOLS AS PESTICIDES AND HERBICIDES**

(57) Abstract:

The invention relates to novel C₂ phenyl-substituted cyclic keto-enols of formula (I), in which W, X, Y, Z and CKB have the meanings as cited in the description. The invention also relates to methods for producing said C₂ phenyl-substituted cyclic keto-enols and to their use as pesticides and herbicides.



Official bulletin "Industrial property". Book 1 "Inventions, utility models, topographies of integrated circuits", 2005, N 10, 15.10.2005. State Department of Intellectual Property of the Ministry of Education and Science of Ukraine.



(19) **UA** ⁽¹¹⁾ **73 984** ⁽¹³⁾ **C2**
(51)МПК ⁷ **C 07C 69/757, C 07D 307/02, A**
01N 43/38, 43/12, 43/16

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ І НАУКИ УКРАЇНИ

ДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ ВЛАСНОСТІ

(12) ОПИС ВІНАХОДУ ДО ПАТЕНТУ УКРАЇНИ

(21), (22) Дані стосовно заявки:
2002118712, 21.03.2001

(24) Дата набуття чинності: 17.10.2005

(30) Дані стосовно пріоритету відповідно до Паризької конвенції : 03.04.2000 DE 100 16 544.3

(46) Публікація відомостей про видачу патенту (деклараційного патенту): 15.10.2005

(86) Номер та дата подання міжнародної заявки відповідно до договору РСТ:
РСТ/EP01/03215, 20010321

(72) Винахідник(и):

Рутер Міхаель , DE,
Хагеманн Херманн , DE,
Шнайдер Удо , DE,
Доллінгер Маркус , DE,
Дамен Петер , DE,
Вахендорфф-Нойманн Ульріке , DE,
Фішер Райнер , DE,
Графф Алан , DE,
Бретшнайдер Томас , DE,
Ерделен Крістоф , DE,
Древес Марк Вільхельм , DE,
Фойхт Дітер , DE,
Ліб Фолькер , DE

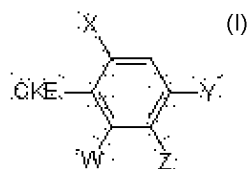
(73) Власник(и):

БАСР АКЦІЕНГЕЗЕЛЛЬШАФТ, DE

(54) C₂-ФЕНІЛЗАМІЩЕНІ ЦИКЛІЧНІ КЕТОЕНОЛИ ЯК ПЕСТИЦИДИ І ГЕРБІЦИДИ

(57) Реферат:

Представлений винахід стосується C₂-фенілзаміщених циклічних кетенолів формули (1), в якій W, X, Y, Z і СKE мають значення, вказані у формулі як пестицидів і гербіцидів.



Опис винаходу

Даний винахід стосується нових С₂-фенілзаміщених циклічних кетенолів, декількох способів їх одержання і застосування їх як пестицидів і гербіцидів.

Описано фармацевтичні властивості 3-ацил-піролідин-2,4-діонів (S. Suzuki et al. Chem. Pharm. Bull. 15 1120 (1967)). Дали R. Schmierer і H. Mildenberger синтезували N-фенілпіролідин-2,4-діон (Liebigs Ann. Chem. 1985, 1095). Біологічна активність цих сполук не описана.

У Європейській заявці на патент EP A 0262399 і в заявці на патент Великобританії GB A 2266888 приведені структурні аналоги сполук (3-арил-піролідин-2,4-діонів), при цьому їх гербіцидна, інсектицидна або акарицидна дія не описана. Відомими гербіцидами, інсектицидами або акарицидами є незаміщені біциклічні похідні 3-арил-піролідин-2,4-діону (Європейські заявки на патент EP A 355599 і EP A 415211), а також заміщені моноциклічні похідні 3-арил-піролідин-2,4-діону (Європейські заявки на патент EP A 377893 і EP A 442077).

Відомі поліциклічні похідні 3-арилпіролідин-2,4-діону (Європейська заявка на патент EP A 442073), а також похідне 1Н-арилпіролідин-діону (Європейські заявки на патент EP A 456063, EP A 521334, EP A 596298, EP A 613884, EP A 613885, EP A 0668267, Міжнародні заявки на патент WO 94/01997, WO 95/26954, WO 95/20572, WO 96/25395, WO 96/35664, WO 97/01535, WO 97/02243, WO 97/36868, WO 97/43275, WO 98/05638, WO 98/06721, WO 98/25928, WO 99/16748, WO 99/24437, WO 99/43649, WO 99/48869 і WO 99/55673).

Відомо, що деякі заміщені похідні Δ^3 -дигідрофуран-2-ону мають гербіцидні властивості (дивись німецьку заявку на патент DE A 4014420). Синтез використовуваних як вихідні сполук похідних тетронової кислоти (наприклад, 3-(2-метилфеніл)-4-гідрокси-5-(4-фторфеніл)- Δ^3 -дигідрофуранону-(2)) також описаний у німецькій заявці на патент DE A 4014420. Структурні аналоги сполук без указівки на їх інсектицидну і/або акарицидну активності описані Campbell et al., J. Chem. Soc. Perkin Trans. I, в 1985, (8), 1567-76. З Європейських заявок на патент EP A 528156, EP A 0647637 і міжнародних заявок на патент WO 95/26345, WO 96/20196, WO 96/25395, WO 96/35664, WO 97/01535, WO 97/02243, WO 97/36868, WO 98/05638, WO 98/25928, WO 99/16748, WO 99/43649, WO 99/48869 і WO 99/55673 відомі похідні 3-арил- Δ^3 -дигідрофуранону, що мають гербіцидні, акарицидні і інсектицидні властивості. Відомі також похідні 3-арил- Δ^3 -дигідротифенону (Міжнародні заявки на патент WO 95/26345, 96/25395, WO 97/01535, WO 97/02243, WO 97/36868, WO 98/05638, WO 98/25928, WO 99/16748, WO 99/43649, WO 99/48869, WO 99/55673).

Відомі незаміщені по фенільному кільці похідні фенілпірону (дивись A.M. Chirazi, T. Kappe und E. Ziegler, Arch. Pharm. 309, 558 (1976) і K.-H. Boltze und K. Heidenbluth, Chem. Ber. 91, 2849), причому їх можливе використання як пестицидів не зазначено. Заміщені по фенільному кільцю похідні фенілпірону, що мають гербіцидні, акарицидні і інсектицидні властивості, описані в Європейській заявці на патент EP A 588137, у міжнародних заявках на патент WO 96 725395, WO 96/35664, WO 97/01535, WO 97/02243, WO 97/16436, WO 97/19941, WO 97/36868, WO 98/05638, WO 99/43649, WO 99/48869 і WO 99/55673.

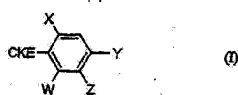
Відомі також незаміщені по фенільному кільцю похідні 5-феніл-1,3-тіазину (дивись E. Ziegler und E. Steiner, Monatsh. 95, 147 (1964), R. Ketcham, T. Kappe und E. Ziegler, J. Heterocycl. Chem. 10, 223 (1973)), причому можливе використання цих сполук як пестицидів не зазначено. У міжнародних заявках на патент WO 94/14785, WO 96/02539, WO 96/35664, WO 97/01535, WO 97/02243, WO 97/02243, WO 97/36868, WO 99/05638, WO 99/43649, WO 99/48869 і WO 99/55673 описані заміщені по фенільному кільцю похідні 5-феніл-1,3-тіазину, що мають гербіцидну, акарицидну і інсектицидну активність.

Відомо, що деякі заміщені 2-арилциклопентандіони мають гербіцидні і акарицидні властивості (дивись, наприклад, патенти США US-4283348; 4338122; 4436666; 4526723; 4551547; 4632698; міжнародні заявки на патент WO 96/01798; WO 96/03366, WO 97/14667, а також WO 98/39281, WO 99/43649, WO 99/48869, WO 99/55673). Крім того, відомі схожі заміщені похідні: 3-гідрокси-5,5-диметил-2-фенілциклопент-2-ен-1-он - з публікації Micklefield et al., Tetrahedron, (1992), 7519-26, а також природний матеріал інволютин (-)-цис-5-(3,4-дигідроксифеніл)-3,4-дигідрокси-2-(4-гідроксифеніл)циклопент-2-енон - з публікації Edwards et al., J. Chem. Soc. S, (1967), 405-9. Їх інсектицидна або акарицидна дія не описана. Крім того, з J. Economic Entomology, 66, (1973), 584 і викладеної заявці DE-A 2361084 відомий 2-(2,4,6-триметилфеніл)-1,3-індандіон із указівкою на його гербіцидну і акарицидну дію.

Відомо, що деякі заміщені 2-арилциклогександіони мають гербіцидні і акарицидні властивості (патенти США US-4175135, 4209432, 4256657, 4256658, 4256659, 4257858, 4283348, 4303669, 4351666, 4409153, 4436666, 4526723, 4613617, 4659372, німецька заявка на патент DE-A 2813341, а також Wheeler, T.N., J. Org. Chem. 44,4906 (1979)), міжнародні заявки на патент WO 99/43649, WO 99/48869, WO 99/55673).

Проте, ефективність і широта дії цих сполук не завжди є цілком задовільною, зокрема, при низькій концентрації і витраті. Крім того сумісність рослин з цими сполуками не завжди достатня.

Знайдено нові сполуки формули (I)



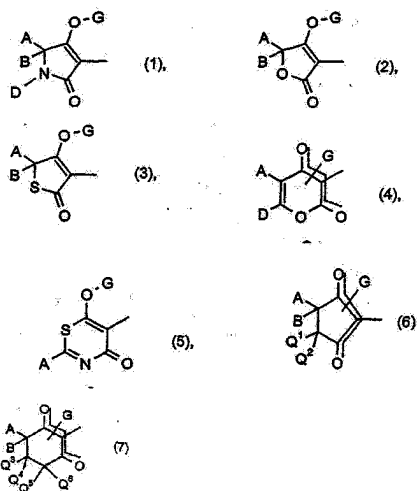
в якій

W відповідно означає водень, алкіл, алкеніл або алкініл, X означає алкіл, алкеніл або алкініл,

Y означає водень, метил, етил, ізопропіл, алкеніл або алкініл, Z означає водень, алкіл, алкеніл або алкініл,

за умови, що, принаймні, один із залишків W, X, Y або Z означає ланцюг з, принаймні, 2 атомами вуглецю,

СКЕ означає одну з груп



де

A означає водень; при необхідності, заміщений галогеном алкіл, алкеніл, алкоксиалкіл, алкілтіоалкіл; насичений або ненасичений, при необхідності, заміщений циклоалкіл, в якому, щонайменше, один атом кільця, при необхідності, заміщений гетероатомом; або, при необхідності, заміщений галогеном, алкілом, галогеналкілом, алкоксилем, галогеналкоксилем, ціано або нітро групою арил, алкіларил або гетероарил,

B означає водень, алкіл або алкоксиалкіл, або

A і B разом з атомом вуглецю, з яким вони зв'язані, утворюють насичений або ненасичений, заміщений або незаміщений цикл, що при необхідності містить, щонайменше, один гетероатом,

D означає водень або, при необхідності, заміщений залишок з ряду алкіл, алкеніл, алкіл, алкоксиалкіл, насичений або ненасичений циклоалкіл, в якому, при необхідності, одна або кілька ланок кільця замінені гетероатомом, алкіларил, арил, гетарилалкіл або гетарил, або

A і D разом з атомами, з якими вони зв'язані, утворюють насичений або ненасичений, заміщений або незаміщений у частині A, D цикл, що при необхідності містить, щонайменше, один гетероатом, або

A і Q¹ разом означають, що при необхідності заміщений, при необхідності, гідроксизаміщеним алкілом, алкоксилем, алкілтіо, циклоалкілом, бензилокси або арилом алкандііл або алкендііл,

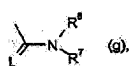
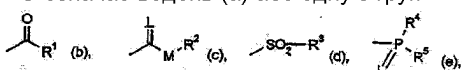
Q¹ означає водень або алкіл,

Q², Q⁴, Q⁵ і Q⁶ незалежно один від одного означають водень або алкіл,

Q³ означає водню, алкіл, алкоксиалкіл, алкілтіоалкіл, при необхідності, заміщений циклоалкіл (де, при необхідності, метиленова група замінена киснем або сіркою) або, при необхідності, заміщений феніл, або

Q³ і Q⁴ разом з атомом вуглецю, з яким вони зв'язані, утворюють насичений або ненасичений, заміщений або незаміщений, при необхідності, цикл, що містить гетероатом,

G означає водень (а) або одну з груп



E(f) або

де

E означає іона металу або іон амонію,

L означає кисень або сірку,

M означає кисень або сірку,

R¹ відповідно означає, при необхідності, галогензаміщений алкіл, алкеніл, алкоксиалкіл, алкілтіоалкіл, поліалкоксиалкіл; або при необхідності, заміщений галогеном, алкілом або алкоксилем циклоалкіл, що може бути перерваний, щонайменше, одним гетероатомом; при необхідності, заміщений феніл, фенілалкіл, гетарил, феноксиалкіл або гетарилоксиалкіл,

R² відповідно означає, при необхідності, галогензаміщений алкіл, алкеніл, алкоксиалкіл, поліалкоксиалкіл; або, при необхідності, заміщений циклоалкіл, феніл або бензил,

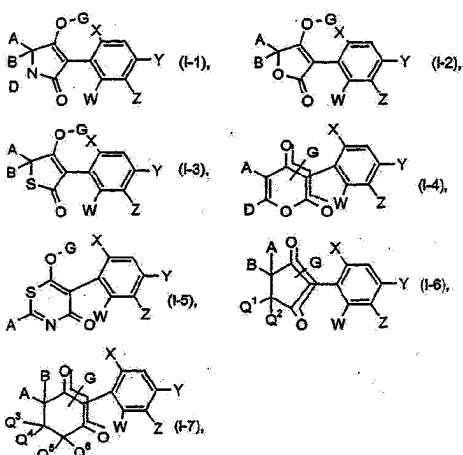
R³, R⁴ і R⁵ незалежно один від одного означають, при необхідності, заміщений галогеном алкіл, алкоксил, алкіламіно, діалкіламіно, алкілтіо, алкенілтіо, циклоалкілтіо; і, при необхідності, заміщений феніл, бензил, фенокси або фенілтіо,

R⁶ і R⁷ незалежно один від одного означають водень; відповідно, при необхідності, заміщений галогеном алкіл, циклоалкіл, алкеніл, алкокси, алкоксиалкіл; при необхідності, заміщений феніл; при необхідності, заміщений бензил; або разом з атомом азоту, з яким вони зв'язані, утворюють цикл, що при необхідності переривається киснем або сіркою.

Сполуки формули (I) можуть також у залежності від типу замісників існувати у виді геометричних і/або оптичних ізомерів або суміші ізомерів різного складу, що можуть бути розділені, при необхідності, звичайним

способом. Об'єктом даного винаходу є як чисті ізомери, так і суміші ізомерів, їх одержання і застосування, а також засіб, що їх засіб, що їх містить. Надалі завжди говориться просто про сполуки формули (I), але проте при цьому маються на увазі як чисті сполуки, так, при необхідності, і суміші з різними частками ізомерних сполук.

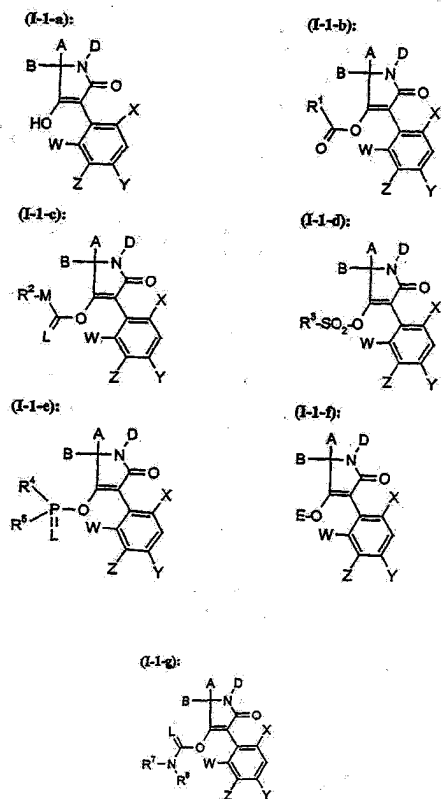
Коли група СКЕ має значення (1)-(7), утворюються наступні головні структури (I-1)-(I-7):



де

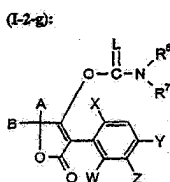
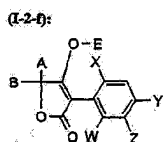
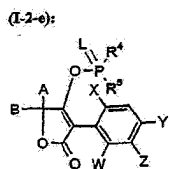
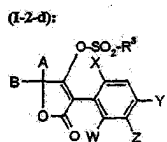
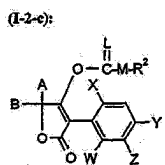
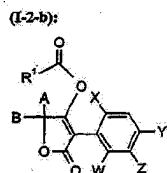
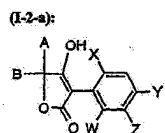
A, B, D, G, Q, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y і Z мають вказані вище значення.

Коли СКЕ означає групу (1), при різних значеннях (a), (b), (c), (d), (e), (f) і (g) групи G утворюються наступні головні структури (I-1-a)-(I-1-g),



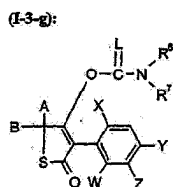
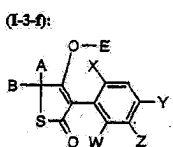
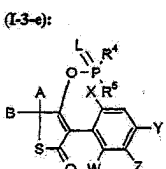
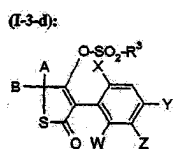
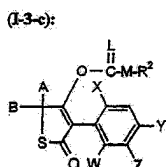
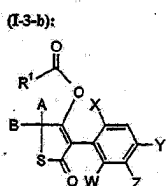
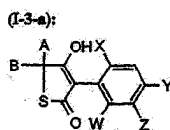
де

A, B, D, E, L, M, W, X, Y, Z, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ і R⁷ мають вказані вище значення. Коли СКЕ означає групу (2), при різних значеннях (a), (b), (c), (d), (e), (f) і (g) групи G утворюються наступні головні структури (I-2-a)-(I-2-g),



де

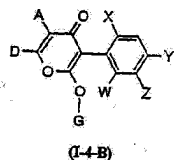
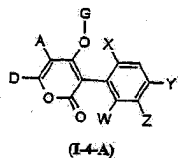
A, B, E, L, M, W, X, Y, Z, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ і R⁷ мають вказані вище значення. Коли СКЕ означає групу (3), при різних значеннях (a), (b), (c), (d), (e), (f) і (g) групи G утворюються наступні головні структури (I-3-a)-(I-3-g),



де

A, B, E, L, M, W, X, Y, Z, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ і R⁷ мають вказані вище значення. Сполуки формули (I-4) в залежності від положення замісника G можуть існувати в двох ізомерних формах (I-4-A) і (I-4-B),

5



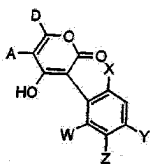
що виражається пунктирною лінією у формулі (I-4).

10 Сполуки формул (I-4-A) і (I-4-B) можуть існувати як у виді суміші, так і у формі чистих ізомерів. Суміші сполук формул (I-4-A) і (I-4-B) можна при необхідності розділити відомим фізичними методами, приміром, хроматографічно.

По причині кращої наочності надалі представлений відповідно тільки один з можливих ізомерів. Це не виключає того, що сполуки можуть існувати, при необхідності, у виді суміші ізомерів або у відповідно іншій ізомерній формі.

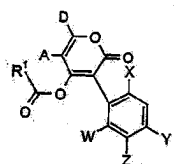
15 Коли СКЕ означає групу (4), при різних значеннях (a), (b), (c), (d), (e), (f) і (g) групи G утворюються наступні головні структури (I-4-a)-(I-4-g),

(I-4-a):



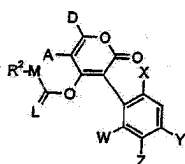
20

(I-4-b):



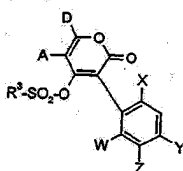
25

(I-4-c):



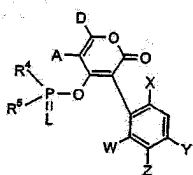
30

(I-4-d):



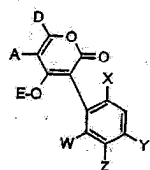
35

(I-4-e):



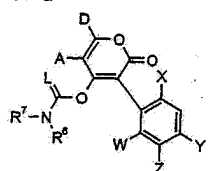
40

(I-4-f):



45

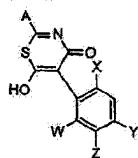
(I-4-g):



де

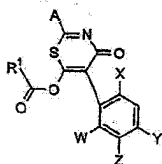
50 A, D, E, L, M, W, X, Y, Z, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ і R⁷ мають вказані вище значення. Коли СКЕ означає групу (5), при різних значеннях (a), (b), (c), (d), (e), (f) і (d) групи G утворюють наступні головні структури (I-5-a)-(I-5-g),

(I-5-a):



55

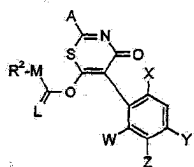
(I-5-b):



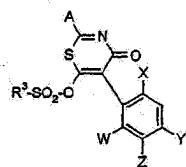
60

65

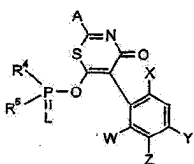
(I-5-c):



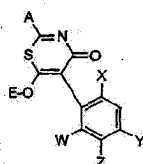
(I-5-d):



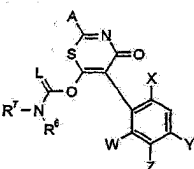
(I-5-e):



(I-5-f):

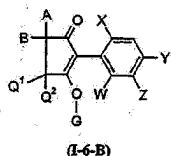
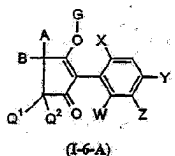


(I-5-g):



де

A, E, L, M, W, X, Y, Z, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ і R⁷ мають вказані вище значення. Сполуки формули (I-6) у залежності від положення замісника G можуть існувати в двох ізомерних формах (I-6-A) і (I-6-B),



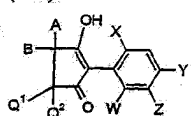
що виражається пунктирною лінією у формулі (I-6).

Сполуки формул (I-6-A) і (I-6-B) можуть існувати як у виді суміші, так і у формі чистих ізомерів. Суміші сполук формул (I-6-A) і (I-6-B) можна, при необхідності, розділити відомим фізичними методами, приміром, хроматографічно.

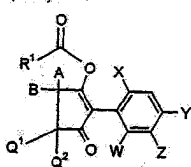
По причині кращої наочності надалі представлений відповідно тільки один з можливих ізомерів. Це не виключає того, що сполуки можуть існувати, при необхідності, у виді суміші ізомерів або у відповідно іншій ізомерній формі.

При різних значеннях (a), (b), (c), (d), (e), (f) і (g) групи G утворюють наступні головні структури (I-6-a)-(I-6-g):

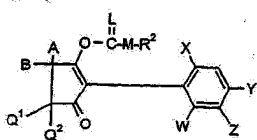
(I-6-a):



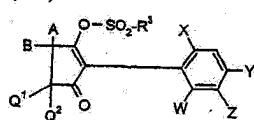
(I-6-b):



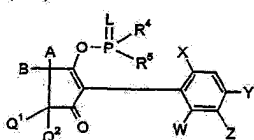
(I-6-c):



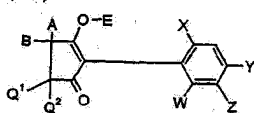
(I-6-d):



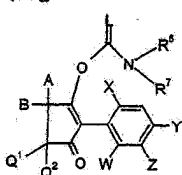
(I-6-e):



(I-6-f):



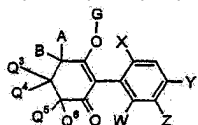
(I-6-g):



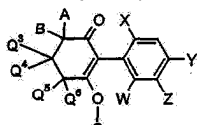
де

A, B, Q¹, Q², E, L, M, W, X, Y, Z, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ і R⁷ мають вказані вище значення.

Сполуки формули (I-7) в залежності від положення замісника G можуть існувати в двох ізомерних формах (I-7-A) або (I-7-B), що виражається пунктирною лінією у формулі (I-7):



(I-7-A)



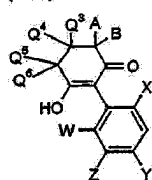
(I-7-B)

Сполуки формул (I-7-A) і (I-7-B) можуть існувати як у виді суміші, так і у формі чистих ізомерів. Суміші сполук формул (I-7-A) і (I-7-B) можна, при необхідності, розділити відомими фізичними методами, приміром, хроматографічно.

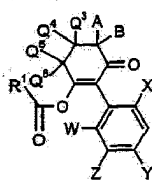
По причині кращої наочності надалі представлений відповідно тільки один з можливих ізомерів. Це не виключає того, що сполуки можуть існувати, при необхідності, у виді суміші ізомерів або у відповідно іншій ізомерній формі.

При різних значеннях (a), (b), (c), (d), (e), (f) і (g) групи G утворюють наступні головні структури від (I-7-a) до (I-7-g):

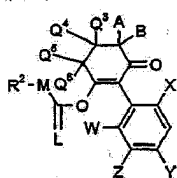
(I-7-a):



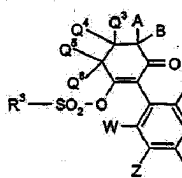
(I-7-b):



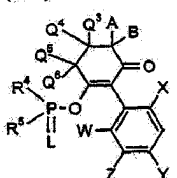
(I-7-c):



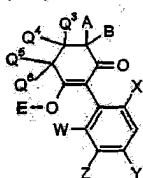
(I-7-d):



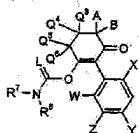
(I-7-e):



(I-7-f):



(I-7-g):

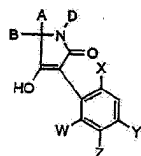


де

A, B, E, L, M, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y, Z, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ і R⁷ мають вказані вище значення.

Крім того знайдені способи одержання нових сполук формули (I) одним з приведених далі процесів:

(A) Заміщені 3-фенілпіролідін-2,4-діони або їх еноли формули (I-1-a)

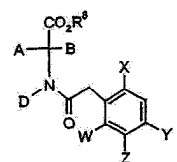


(I-1-a)

в якій

A, B, D, W, X, Y і Z мають вказані вище значення,

одержують шляхом внутрішньомолекулярної конденсації естеру N-ациламінокислоти формули (II)



(II)

в якій

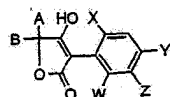
A, B, D, W, X, Y і Z мають вказані вище значення,

і

R⁸ означає алкіл (переважно алкіл з 1-6 атомами вуглецю),

у присутності розчинника і основи.

(B) Заміщене похідне 3-феніл-4-гідроксидигідрофуранону формули (I-2-a)



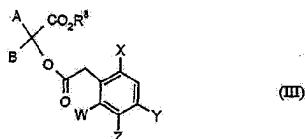
(I-2-a)

в якій

A, B, W, X, Y і Z мають вказані вище значення,

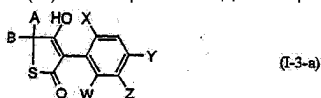
одержують шляхом внутрішньомолекулярної конденсації естеру карбонової кислоти формули (III)

5
10
15
20
25
30
35
40
45
50
55
60
65

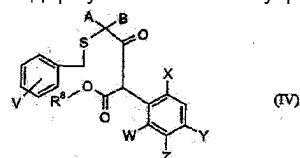


в якій
A, B, W, X, Y, Z і R⁸ мають вказані вище значення, у присутності розчинника і основи.

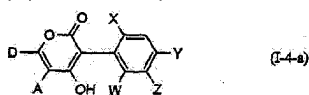
(C) Заміщене похідне 3-феніл-4-гідрокси-Δ³-дигідротіофенону формули (I-3-a)



в якій
A, B, W, X, Y і Z мають вказані вище значення,
одержують шляхом внутрішньомолекулярної циклізації естеру В-кетокарбонової кислоти формули (IV)



в якій
A, B, W, X, Y, Z і R⁸ мають вказані вище значення, і
V означає водень, галоген, алкіл (переважно алкіл з 1-6 атомами вуглецю) або алкоксил (переважно алкоксил з 1-8 атомами вуглецю),
у присутності кислоти і, при необхідності, у присутності розчинника.
(D) Нові заміщені похідні 3-фенілпірону формули (I-4-a)



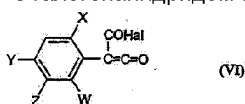
в якій
A, D, W, X, Y і Z мають вказані вище значення,
одержують шляхом взаємодії карбонільної сполуки формули (V)



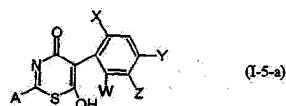
в якій
A і D мають вказані вище значення,
або її силілового естеру формули (Va)



в якій
A, D і R⁸ мають вказані вище значення,
с галогенангідридом кетенової кислоти формули (VI)



в якій
W, X, Y і Z мають вказані вище значення і Hal означає галоген (переважно хлор або бром),
при необхідності, у присутності розчинника і, при необхідності, у присутності засобу, що зв'язує кислоту.
Нове похідне заміщеного феніл-1,3-тіазину формули (I-5-a)

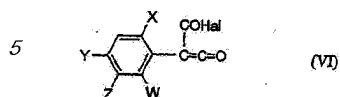


в якій
A, W, X, Y і Z мають вказані вище значення,
одержують взаємодією тіоаміду формули (VII)



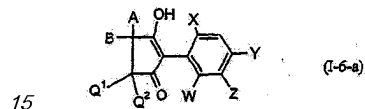
в якій

А має вищевказані значення,
с галогенангідридом кетенової кислоти формули (VI)



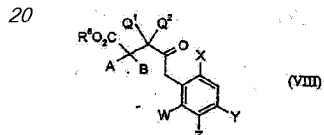
в якій

10 Hal, W, X, Y і Z мають вказані вище значення,
при необхідності, у присутності розчинника і при необхідності, у присутності засобу, що зв'язує кислоту.
(F) Сполуки формули (I-6-a)

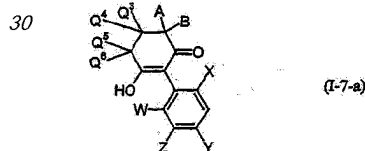


в якій

20 A, B, Q¹, Q², W, X, Y і Z мають вказані вище значення,
одержують шляхом внутрішньомолекулярної циклізації естеру кетокетенової кислоти формули (VIII) в якій

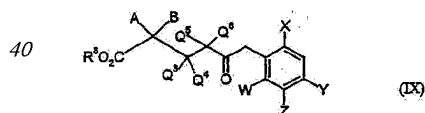


25 A, B, Q¹, Q², W, X Y і Z мають вказані вище значення, і
R⁸ означає алкіл (зокрема алкіл з 1-8 атомами вуглецю),
при необхідності, у присутності розчинника і у присутності основи.
(G) Сполуки формули (I-7-a)



35 в якій

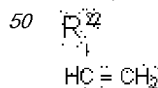
A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y і Z мають вказані вище значення, одержують шляхом внутрішньомолекулярної
конденсації естеру 6-арил-5-кетогексанової кислоти формули (IX)



в якій

45 A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y і Z мають вказані вище значення і
R⁸ означає алкіл (переважно алкіл з 1-6 атомами вуглецю), у присутності розчинника і основи;
(H) сполуки вищевказаних формул (I-1(a-g))-(I-7(a-g)), в яких A, B, D, G, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y і Z
мають вказані вище значення,

причому один, максимально два, залишку W, X, Y або Z означають R²²-C≡C- або



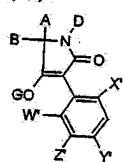
R²² означає водень або алкіл з 1-4 атомами вуглецю, переважно водень або алкіл з 1-2 атомами вуглецю, і
особливо переважно водень,

55 одержують взаємодією сполуки формули (I-1'(a-g))-(I-7'(a-g)),

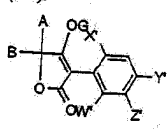
60

65

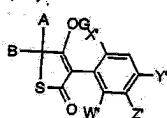
(I-1'):



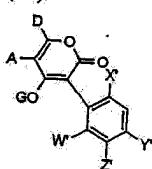
(I-2'):



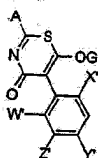
(I-3'):



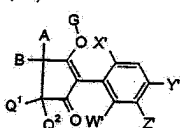
(I-4'):



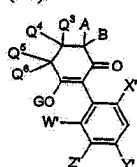
(I-5'):



(I-6'):



(I-7'):



в якій

A, B, D, G, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y і Z мають вказані вище значення, причому верхній штрих "" означає, що в цьому процесі один, максимально два, залишки W, X, Y і Z означають хлор, бром, йод, переважно бром, за умови, що інші залишки W, X, Y або Z не означають алкеніл або алкініл, з силілацетиленами формули (X-a) або вінілстананами формули (X-b)



в якій Alk переважно означає алкіл з 1-4 атомами вуглецю, і

R²¹ переважно означає алкіл з 1-4 атомами вуглецю або феніл,

R²² переважно означає водень або алкіл з 1-4 атомами вуглецю, особливо переважно водень або алкіл з 1-2 атомами вуглецю і виключно особливо переважно водень,

у присутності розчинника, при необхідності, у присутності основи і каталізатора, причому як каталізатор використовують, зокрема, комплекси паладію.

(I) Сполуки вищевказаних формул (I-1-b)-(I-7-b), в яких A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, R¹, W, X, Y і Z мають вказані вище значення, одержують взаємодією сполук вищевказаних формул (I-1-a)-(I-7-a), в яких A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y і Z відповідно мають вказані вище значення,

(α) з галогенангідридом кислоти формули (XI)



в якій

R¹ мають вказані вище значення, і

Hal означає галоген (зокрема хлор або бром)

або

(B) з англідами карбонових кислот формули (XII)



в якій

R¹ має вищевказані значення,

при необхідності, у присутності розчинника і, при необхідності, у присутності засобу, що зв'язує кислоту;

(J) сполуки формул (I-1-c)-(I-7-c), в яких A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, R², M, W, X, Y і Z мають вказані вище значення і L означає кисень,

одержують взаємодією сполук формул (I-1-a)-(I-7-a), в яких

A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y і Z мають вказані вище значення,

с естером хлормурашиної кислоти або тіоестером хлормурашиної кислоти формули (XIII)



в якій

R^2 і M мають вказані вище значення,

при необхідності, у присутності розчинника і, при необхідності, у присутності засобу, що зв'язує кислоту;

(К) Сполуки вищевказаних формул (I-1-с)-(I-7-с), в яких A , B , D , Q^1 , Q^2 , Q^3 , Q^4 , Q^5 , Q^6 , R^2 , M , W , X , Y і Z мають вказані вище значення і L означає сірку, одержують взаємодією сполук формул (I-1-а)-(I-7-а), в яких A , B , D , Q^1 , Q^2 , Q^3 , Q^4 , Q^5 , Q^6 , W , X , Y і Z мають вказані вище значення,

с естером хлормонотіооцтової кислоти або естером хлордитіооцтової кислоти формули (XIV)



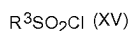
в якій

M і R^2 мають вказані вище значення,

при необхідності, у присутності розчинника і, при необхідності, у присутності засобу, що зв'язує кислоту, і

(L) сполуки загальних формул (I-1-d)-(I-7-d), в яких A , B , D , Q^1 , Q^2 , Q^3 , Q^4 , Q^5 , Q^6 , R^3 , W , X , Y і Z мають вказані вище значення, одержують взаємодією сполук формул (I-1-а)-(I-7-а), в яких A , B , D , Q^1 , Q^2 , Q^3 , Q^4 , Q^5 , Q^6 , W , X , Y і Z мають вказані вище значення,

с галогенангідридом сульфокислоти формули (XV)



в якій

R^3 як зазначено вище,

при необхідності, у присутності розчинника і, при необхідності, у присутності засобу, що зв'язує кислоту,

(М) сполуки загальних формул (I-1-е)-(I-7-е), в яких A , B , D , L , Q^1 , Q^2 , Q^3 , Q^4 , Q^5 , Q^6 , R^4 , R^5 , W , X , Y і Z мають вказані вище значення, одержують взаємодією сполук формул (I-1-а)-(I-7-а), в яких A , B , D , Q^1 , Q^2 , Q^3 , Q^4 , Q^5 , Q^6 , W , X , Y і Z мають вказані вище значення,

з сполуками фосфору формули (XVI)



в якій

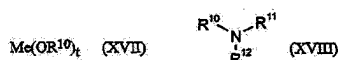
L , R^4 і R^5 мають вказані вище значення, і

Hal означає галоген (зокрема, хлор або бром),

при необхідності, у присутності розчинника і, при необхідності, у присутності засобу, що зв'язує кислоту,

(N) сполуки загальних формул (I-1-f)-(I-7-f), в яких A , B , D , E , Q^1 , Q^2 , Q^3 , Q^4 , Q^5 , Q^6 , W , X , Y і Z мають вказані вище значення, одержують взаємодією сполук формул (I-1-а) до (I-7-а), в яких A , B , D , Q^1 , Q^2 , Q^3 , Q^4 , Q^5 , Q^6 , W , X , Y і Z мають вказані вище значення,

з сполуками металу або амінами формул (XVII) або (XVIII)



в яких

Me означає одновалентний або двовалентний метал (переважно лужний або лужноземельний метал, такий як літій, натрій, калій, магній або кальцій),

t означає числа 1 або 2, і

R^{10} , R^{11} , R^{12} незалежно один від одного означають водень або алкіл (переважно алкіл з 1-8 атомами вуглецю),

при необхідності, у присутності розчинника,

(O) сполуки загальних формул (I-1-g) до (I-7-g), в яких A , B , D , L , Q^1 , Q^2 , Q^3 , Q^4 , Q^5 , Q^6 , R^6 , R^7 , W , X , Y і Z мають вказані вище значення, одержують взаємодією сполук формул (I-1-а) до (I-7-а), в яких A , B , D , Q^1 , Q^2 , Q^3 , Q^4 , Q^5 , Q^6 , W , X , Y і Z мають вказані вище значення,

(α) з ізоціанатами або ізотіоціанатами формули (XIX)



в якій R^6 і L мають вказані вище значення,

при необхідності, у присутності розчинника і, при необхідності, у присутності каталізатора, або

(В) із хлорангідами карбамінових або тіокарбамінових кислот формули (XX)



в якій

L, R⁶ і R⁷ мають вказані вище значення,

при необхідності, у присутності розріджувача і, при необхідності, у присутності засобу, що зв'язує кислоту.

Далі було знайдено, що нові сполуки формули (I) виявляють дуже гарну ефективність як засоби боротьби із шкідниками, переважно як інсектициди, акарициди і гербіциди.

Згідно з винаходом описуються сполуки загальної формули (I). Переважними замісниками у вище і нижче представлених формулах є вказані далі залишки:

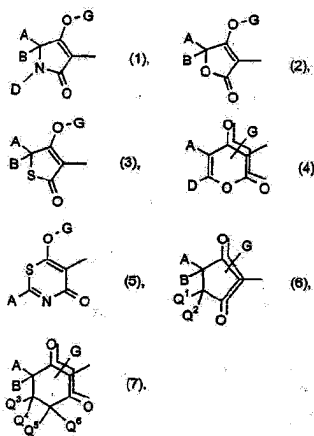
W переважно означає водень, алкіл з 1-6 атомами вуглецю, алкеніл з 2-6 атомами вуглецю або етиніл.

X переважно означає алкіл з 1-6 атомами вуглецю, алкеніл з 2-6 атомами вуглецю або етиніл.

Y переважно означає водень, метил, етил, ізопропіл, алкеніл з 2-6 атомами вуглецю або етиніл.

Z переважно означає водень, алкіл з 1-6 атомами вуглецю, алкеніл з 2-6 атомами вуглецю або етиніл, за умови, що, щонайменше, один із залишків W, X, Y або Z означає ланцюг з, щонайменше, двома атомами вуглецю.

SKE переважно означає одну з груп



A переважно означає водень або, при необхідності, заміщений галогеном алкіл з 1-12 атомами вуглецю, алкеніл з 3-8 атомами вуглецю, алкокси-алкіл з 1-10 атомами вуглецю в алкоксильній частині і з 1-8 атомами вуглецю в алкільній частині, алкілтіо-алкіл з 1-10 атомами вуглецю в частині алкілтіо-групи і з 1-6 атомами вуглецю в алкільній частині, при необхідності, заміщений галогеном, алкілом з 1-6 атомами вуглецю або алкоксилем з 1-6 атомами вуглецю циклоалкіл з 3-8 атомами вуглецю, в якому, при необхідності, один або два не сусідні атоми вуглецю кільця заміщені киснем і/або сіркою, або при необхідності, заміщений галогеном, алкілом з 1-6 атомами вуглецю, галогеналкілом з 1-6 атомами вуглецю, алкоксилем з 1-6 атомами вуглецю, галогеналкоксилем з 1-6 атомами вуглецю, ціано або нітро групою феніл або нафтил, гетарил з 5-6 кільцевими атомами (наприклад фураніл, піридил, імідазоліл, триазоліл, піразоліл, піримідил, тіазоліл або тієніл), феніл-алкіл з 1-6 атомами вуглецю в алкільній частині або нафтил-алкіл з 1-6 атомами вуглецю в алкільній частині.

B переважно означає водень, алкіл з 1-6 атомами вуглецю, алкокси-алкіл з 1-8 атомами вуглецю в алкоксильній частині і з 1-6 атомами вуглецю в алкільній частині, або

A, B и атом вуглецю, з яким вони зв'язані, переважно означають насичений циклоалкіл з 3-10 атомами вуглецю або ненасичений. циклоалкіл з 5-10 атомами вуглецю, де атом вуглецю кільця, при необхідності, заміщений киснем або сіркою, і які, при необхідності, однократно або дворазово заміщені алкілом з 1-8 атомами вуглецю, циклоалкілом з 3-10 атомами вуглецю, галогеналкілом з 1-8 атомами вуглецю, алкоксилем з 1-8 атомами вуглецю, алкілтіо з 1-8 атомами вуглецю, галогеном або фенілом, або

A, B і атом вуглецю, з яким вони зв'язані, переважно означають циклоалкіл з 3-6 атомами вуглецю, що, при необхідності, заміщений, при необхідності, заміщеної алкілом з 1-4 атомами вуглецю алклендіольною групою, що при необхідності містить один або два не сусідніх атоми кисню і/або сірки, алклендіоксильною або алклендитіонільною групою, що утворюють з атомом вуглецю, з яким вони зв'язані, інше 5-8 членне кільце, або

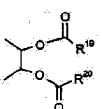
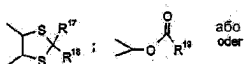
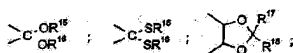
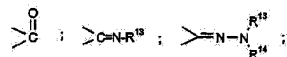
A, B і атом вуглецю, з яким вони зв'язані, переважно означають циклоалкіл з 3-8 атомами вуглецю або циклоалкеніл з 5-8 атомами вуглецю, в яких 2 замісника разом з атомами вуглецю, з якими вони зв'язані, утворюють, при необхідності, заміщений алкілом з 1-6 атомами вуглецю, алкоксилем з 1-6 атомами вуглецю або галогеном алкандііл з 2-6 атомами вуглецю, алкендііл з 2-6 атомами вуглецю або алкандієндііл з 4-6 атомами вуглецю, де метиленова група, при необхідності, може бути замінена киснем або сіркою.

D переважно означає водень, при необхідності, галогензаміщений алкіл з 1-12 атомами вуглецю, алкеніл з 3-8 атомами вуглецю, алкініл з 3-8 атомами вуглецю, алкокси-алкіл з 1-10 атомами вуглецю в алкоксильній частині і з 2-8 атомами вуглецю в алкільній частині, при необхідності, заміщений галогеном, алкілом з 1-4 атомами вуглецю, алкоксилем з 1-4 атомами вуглецю або галогеналкілом з 1-4 атомами вуглецю циклоалкіл з 3-8 атомами вуглецю, в якому атом вуглецю кільця, при необхідності, заміщений киснем або сіркою, або відповідно, при необхідності, заміщений галогеном, алкілом з 1-6 атомами вуглецю, галогеналкілом з 1-6 атомами вуглецю, алкоксилем з 1-6 атомами вуглецю, галогеналкоксилем з 1-6 атомами вуглецю, ціано або нітрогрупою феніл, гетарил з 5-6 кільцевими атомами (наприклад, фураніл, імідазоліл, піридил, тіазоліл, піразоліл, піримідил, піроліл, тієніл або триазоліл), феніл-алкіл з 1-6 атомами вуглецю в алкільній частині

або гетарил-алкіл з 5-6 кільцевими атомами в гетарильній частині (наприклад фураніл, імідазоліл, піридил, тіазоліл, піразоліл, піримідил, піролил, тієніл або триазоліл) і з 1-6 атомами вуглецю в алкільній частині, або

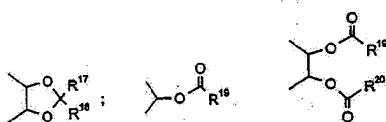
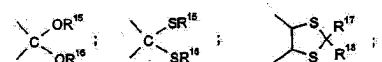
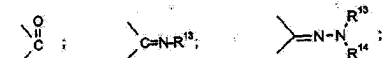
A і D разом переважно означають, при необхідності, заміщений алкандііл з 3-6 атомами вуглецю або алкендііл з 3-6 атомами вуглецю, де метиленова група, при необхідності, заміщена карбонільною групою, киснем або сіркою, і причому вищевказані замісники відповідно мають наступні значення:

галоген, гідрокси, меркапто; або відповідно, при необхідності, галогензаміщений алкіл з 1-10 атомами вуглецю, алкоксил з 1-6 атомами вуглецю, алкілтію з 1-6 атомами вуглецю, циклоалкіл з 3-7 атомами вуглецю, феніл або бензілокси; або група алкандііл з 3-6 атомами вуглецю, група алкендііл з 3-6 атомами вуглецю, група бутадієніл, що, при необхідності, заміщена алкілом з 1-6 атомами вуглецю, або в якій, при необхідності, два сусідніх замісники утворюють з атомами вуглецю, з якими вони зв'язані, інший насичений або ненасичений цикл із 5 або 6 атомами в кільці (у випадку сполук формули (I-1) A і D разом з атомами, з якими вони зв'язані, означають, наприклад, нижченаведені групи AD-1-AD-10), що може містити кисень або сірку, або який, при необхідності, може містити одну з наступних груп



або

A і Q¹ разом означають алкандііл з 3-6 атомами вуглецю або алкендііл з 4-6 атомами вуглецю, при необхідності, заміщені однократно або дворазово, однаковими або різними замісниками з ряду галоген або гідрокси, або, при необхідності, заміщені однократно - трикратно заміщеними галогеном, однаковими або різними замісниками з ряду алкіл з 1-10 атомами вуглецю, алкоксил з 1-6 атомами вуглецю, алкілтію з 1-6 атомами вуглецю, циклоалкіл з 3-7 атомами вуглецю; або заміщені відповідно однаковими або різними, при необхідності, однократно - трикратно заміщеними галогеном, алкілом з 1-6 атомами вуглецю, алкоксил з 1-6 атомами вуглецю бензілокси групою або фенілом, що, крім того, що при необхідності містить одну з нижченаведених груп



або зв'язані містковим зв'язком через алкандіільну групу з 1-2 атомами вуглецю або атомом кисню, або

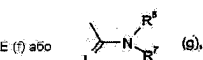
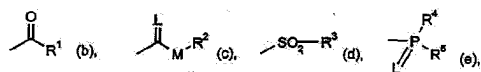
Q¹ переважно означає водень або алкіл з 1-4 атомами вуглецю.

Q², Q⁴, Q⁵ і Q⁶ незалежно один від одного переважно означають водень або алкіл з 1-4 атомами вуглецю.

Q³ переважно означає водень, алкіл з 1-6 атомами вуглецю, алкокси-алкіл з 1-6 атомами вуглецю в алкоксильній частині і з 1-2 атомами вуглецю в алкільній частині, алкілтію-алкіл з 1-6 атомами вуглецю в частині алкілтію і з 1-2 атомами вуглецю в алкільній частині, при необхідності, заміщений алкілом з 1-4 атомами вуглецю або алкоксил з 1-4 атомами вуглецю циклоалкіл з 3-8 атомами вуглецю, де метиленова група, при необхідності, замінена киснем або сіркою, або, при необхідності, заміщений галогеном, алкілом з 1-4 атомами вуглецю, алкоксил з 1-4 атомами вуглецю, галогеналкілом з 1-2 атомами вуглецю, галогеналкоксил з 1-2 атомами вуглецю, ціано- або нітрогрупою феніл, або

Q³ і Q⁴ разом з атомом вуглецю, з яким вони зв'язані, переважно означають, при необхідності, заміщений алкілом з 1-4 атомами вуглецю, алкоксил з 1-4 атомами вуглецю або галогеналкілом з 1-2 атомами вуглецю цикл з 3-7 атомами вуглецю, в якому атом вуглецю кільця, при необхідності, замінений киснем або сіркою.

G переважно означає водень (а) або одну з груп



особливо (a), (b), (c) або (g), в яких
Е означає іон металу або іон амонію,
L означає кисень або сірку, і
М означає кисень або сірку.

R¹ переважно означає, при необхідності, галогензаміщений алкіл з 1-20 атомами вуглецю, алкеніл з 2-20 атомами вуглецю, алкокси-алкіл з 1-8 атомами вуглецю в алкоксильній і алкільній частинах, алкілтїо-алкіл з 1-8 атомами вуглецю в частині алкілтїо і алкільній частині, поліалкоксиалкіл з 1-8 атомами вуглецю в алкоксильній і алкільній частинах, або, при необхідності, заміщений галогеном, алкілом з 1-6 атомами вуглецю або алкоксил з 1-6 атомами вуглецю циклоалкіл з 3-8 атомами вуглецю, в якому, при необхідності, один або декілька (переважно не більш двох) не сусідніх атомів вуглецю кільця замінені киснем і/або сіркою,

при необхідності, заміщений галогеном, ціано, нітро, алкілом з 1-6 атомами вуглецю, алкоксил з 1-6 атомами вуглецю, галогеналкілом з 1-6 атомами вуглецю, галогеналкоксил з 1-6 атомами вуглецю, алкілтїо з 1-6 атомами вуглецю або алкілсульфонілом з 1-6 атомами вуглецю феніл,

при необхідності, заміщений галогеном, ціано, нітро, алкілом з 1-6 атомами вуглецю, алкоксил з 1-6 атомами вуглецю, галогеналкілом з 1-6 атомами вуглецю, галогеналкоксил з 1-6 атомами вуглецю феніл-алкіл з 1-6 атомами вуглецю в алкільній частині,

при необхідності, заміщений галогеном або алкілом з 1-6 атомами вуглецю 5- або 6-членний гетарил (наприклад піразоліл, тіазоліл, піридил, піримідил, фураніл або тієніл),

при необхідності, заміщений галогеном або алкілом з 1-6 атомами вуглецю фенокси-алкіл з 1-6 атомами вуглецю в алкільній частині, або

при необхідності, заміщений галогеном, аміно або алкілом з 1-6 атомами вуглецю 5- або 6-членний гетарилокси-алкіл з 1-6 атомами вуглецю в алкільній частині (наприклад піридилокси-алкіл з 1-6 атомами вуглецю в алкільній частині, піримідилокси-алкіл з 1-6 атомами вуглецю в алкільній частині або тіазолілокси-алкіл з 1-6 атомами вуглецю в алкільній частині).

R² переважно означає, при необхідності, заміщений галогеном алкіл з 1-20 атомами вуглецю, алкеніл з 2-20 атомами вуглецю, алкокси-алкіл з 1-8 атомами вуглецю в алкоксильній частині і з 2-8 атомами вуглецю алкільній частині, поліалкоксиалкіл з 1-8 атомами вуглецю в алкоксильній частині і з 2-8 атомами вуглецю алкільній частині,

при необхідності, заміщений галогеном, алкілом з 1-6 атомами вуглецю або алкоксил з 1-6 атомами вуглецю циклоалкіл з 3-8 атомами вуглецю, або

при необхідності, заміщений галогеном, ціано, нітро, алкілом з 1-6 атомами вуглецю, алкоксил з 1-6 атомами вуглецю, галогеналкілом з 1-6 атомами вуглецю або галогеналкоксил з 1-6 атомами вуглецю феніл або бензил.

R³ переважно означає при необхідності, заміщений галогеном алкіл з 1-8 атомами вуглецю або, при необхідності, заміщений галогеном, алкілом з 1-6 атомами вуглецю, алкоксил з 1-6 атомами вуглецю, галогеналкілом з 1-4 атомами вуглецю, галогеналкоксил з 1-4 атомами вуглецю, ціано- або нітрогрупою феніл або бензил.

R⁴ і R⁵ незалежно один від одного переважно означають, при необхідності, заміщений галогеном алкіл з 1-8 атомами вуглецю, алкоксил з 1-8 атомами вуглецю, алкіламіно з 1-8 атомами вуглецю, діалкіламіно з 1-8 атомами вуглецю, алкілтїо з 1-8 атомами вуглецю, алкенілтїо з 2-8 атомами вуглецю, циклоалкілтїо з 3-7 атомами вуглецю або, при необхідності, заміщений галогеном, нітро, ціано, алкоксил з 1-4 атомами вуглецю, галогеналкоксил з 1-4 атомами вуглецю, алкілтїо з 1-4 атомами вуглецю, алкіл з 1-4 атомами вуглецю або галогеналкілом з 1-4 атомами вуглецю феніл, фенокси або фенілтїо.

R⁶ і R⁷ незалежно один від одного переважно означають водень, при необхідності, заміщений галогеном алкіл з 1-8 атомами вуглецю, циклоалкіл з 3-8 атомами вуглецю, алкоксил з 1-8 атомами вуглецю, алкеніл з 3-8 атомами вуглецю, алкокси-алкіл з 1-8 атомами вуглецю в алкоксильній і алкільній частинах, при необхідності, заміщений галогеном, галогеналкілом з 1-8 атомами вуглецю, алкілом з 1-8 атомами вуглецю або алкоксил з 1-8 атомами вуглецю феніл, при необхідності, заміщений галогеном, галогеналкілом з 1-8 атомами вуглецю, алкілом з 1-8 атомами вуглецю або алкоксил з 1-8 атомами вуглецю бензил або разом утворюють, при необхідності, заміщений алкілом з 1-4 атомами вуглецю алкіленовий залишок з 3-6 атомами вуглецю, в якому атом вуглецю, при необхідності, замінений киснем або сіркою.

R¹³ переважно означає водень, при необхідності, заміщений галогеном алкіл з 1-8 атомами вуглецю або алкоксил з 1-8 атомами вуглецю, при необхідності, заміщений галогеном, алкілом з 1-4 атомами вуглецю або алкоксил з 1-4 атомами вуглецю циклоалкіл з 3-8 атомами вуглецю, в якому метиленова група, при необхідності, замінена киснем або сіркою, або відповідно, при необхідності, заміщений галогеном, алкілом з 1-6 атомами вуглецю, алкоксил з 1-6 атомами вуглецю, галогеналкілом з 1-4 атомами вуглецю, галогеналкоксил з 1-4 атомами вуглецю, нітро або ціано феніл, феніл-алкіл з 1-4 атомами вуглецю в алкільній частині або феніл-алкоксил з 1-4 атомами вуглецю в алкоксильній частині.

R¹⁴ переважно означає водень або алкіл з 1-8 атомами вуглецю, або

R¹³ і R¹⁴ разом переважно означають алкандііл з 4-6 атомами вуглецю.

R¹⁵ і R¹⁶ можуть бути однаковими або різними і переважно означають алкіл з 1-6 атомами вуглецю, або

R¹⁵ і R¹⁶ разом переважно означають залишок алкандіілу з 2-4 атомами вуглецю, що, при необхідності, заміщений алкілом з 1-6 атомами вуглецю, галогеналкілом з 1-6 атомами вуглецю або, при необхідності,

заміщеним галогеном, галогеналкілом з 1-4 атомами вуглецю, алкоксилем з 1-6 атомами вуглецю, галогеналкоксилем з 1-4 атомами вуглецю, нітро- або ціаногрупою фенілом.

R^{17} і R^{18} незалежно один від одного переважно означають водень, при необхідності, заміщений галогеном алкіл з 1-8 атомами вуглецю або, при необхідності, заміщений галогеном, алкілом з 1-6 атомами вуглецю, алкоксилем з 1-6 атомами вуглецю, галогеналкілом з 1-4 атомами вуглецю, галогеналкоксилем з 1-4 атомами вуглецю, нітро- або ціаногрупою феніл, або

R^{17} і R^{18} разом з атомом вуглецю, з яким вони зв'язані, переважно означають карбонільну групу або, при необхідності, заміщений галогеном, алкілом з 1-4 атомами вуглецю або алкоксилем з 1-4 атомами вуглецю циклоалкіл з 5-7 атомами вуглецю, в якому метиленова група, при необхідності, замінена киснем або сіркою.

R^{19} і R^{20} незалежно один від одного переважно означають алкіл з 1-10 атомами вуглецю, алкеніл з 2-10 атомами вуглецю, алкокси з 1-10 атомами вуглецю, алкіламін з 1-10 атомами вуглецю, алкеніламіно з 3-10 атомами вуглецю, діалкіламіно з 1-10 атомами вуглецю або диалкеніламіно з 3-10 атомами вуглецю.

W особливо переважно означає водень, алкіл з 1-4 атомами вуглецю, алкеніл з 2-4 атомами вуглецю або етиніл,

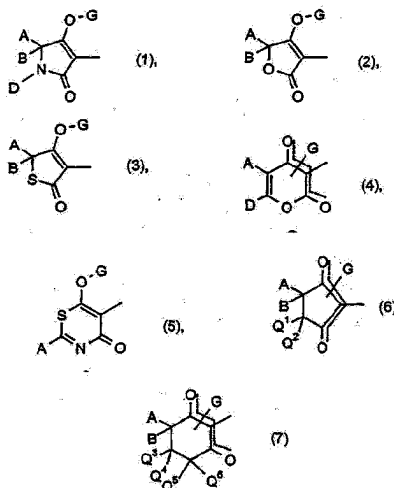
X особливо переважно означає алкіл з 1-4 атомами вуглецю, алкеніл з 2-4 атомами вуглецю або етиніл,

Y особливо переважно означає водень, метил, етил, ізопропіл, алкеніл з 2-4 атомами вуглецю або етиніл,

Z особливо переважно означає водень, алкіл з 1-4 атомами вуглецю, алкеніл з 2-4 атомами вуглецю або етиніл,

за умови, що, щонайменше, один із залишків W, X, Y або Z означає ланцюг з, щонайменше, 2 атомами вуглецю, причому максимально тільки один із залишків W, X, Y або Z може означати алкеніл з 2-4 атомами вуглецю або етиніл.

СКЕ особливо переважно означає одну з груп



A особливо переважно означає, при необхідності, заміщений фтором або хлором алкіл з 1-6 атомами вуглецю, алкокси-алкіл з 1-4 атомами вуглецю в алкоксильній частині і з 1-2 атомами вуглецю в алкільній частині, при необхідності, заміщений алкілом з 1-2 атомами вуглецю або алкоксилем з 1-2 атомами вуглецю циклоалкіл з 3-6 атомами вуглецю, або (але не у випадку сполук формул (I-4), (I-6) і (I-7)) при необхідності, заміщений фтором, хлором, бромом, алкілом з 1-4 атомами вуглецю, галогеналкілом з 1-2 атомами вуглецю, алкоксилем з 1-4 атомами вуглецю або галогеналкоксилем з 1-2 атомами вуглецю, ціано- або нітрогрупою феніл або бензил.

B особливо переважно означає водень або алкіл з 1-4 атомами вуглецю, або A, B і атом вуглецю, з яким вони зв'язані, означають циклоалкіл з 5-6 атомами вуглецю, що, при необхідності, заміщений, при необхідності, метил або етил заміщеною алкілендіільною групою, що при необхідності містить один або два не сусідніх атоми кисню і/або сірки, або алкілендіоксильною або алкілендитіонільною групою, що утворюють з атомом вуглецю, з яким вони зв'язані, інше 5-8 членне кільце, або

A, B і атом вуглецю, з яким вони зв'язані, особливо переважно означають циклоалкіл з 5-6 атомами вуглецю, що, при необхідності, заміщений, при необхідності, метил або етил заміщеною алкілендіільною групою, що при необхідності містить один або два не сусідніх атоми кисню і/або сірки, або алкілендіоксильною або алкілендитіонільною групою, що утворюють з атомом вуглецю, з яким вони зв'язані, наступне 5-8 членне кільце, або

A, B і атом вуглецю, з яким вони зв'язані, особливо переважно означають циклоалкіл з 3-6 атомами вуглецю або циклоалкеніл з 5-6 атомами вуглецю, в яких 2 замісника разом з атомами вуглецю, з якими вони зв'язані, утворюють, при необхідності, заміщений алкілом з 1-2 атомами вуглецю або алкоксилем з 1-2 атомами вуглецю алканділ з 2-4 атомами вуглецю, алкенділ з 2-4 атомами вуглецю або бутадієніл.

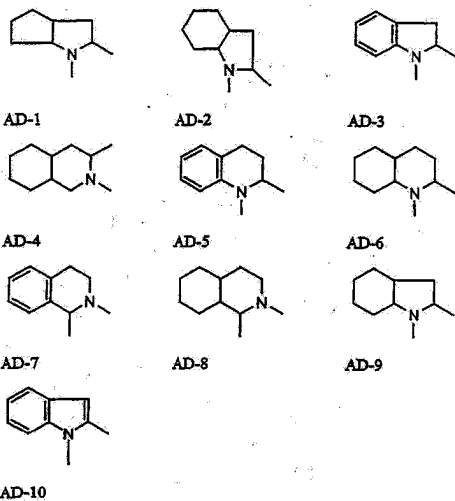
D особливо переважно означає водень, при необхідності, заміщений фтором алкіл з 1-6 атомами вуглецю, алкеніл з 3-6 атомами вуглецю, алкокси-алкіл з 1-4 атомами вуглецю в алкоксильній частині і з 2-3 атомами вуглецю в алкільній частині, при необхідності, заміщений алкілом з 1-4 атомами вуглецю, алкоксилем з 1-4 атомами вуглецю або галогеналкілом з 1-2 атомами вуглецю циклоалкіл з 3-6 атомами вуглецю, в якому

метиленова група, при необхідності, замінена киснем або (однак не у випадку сполук формул (1-1)) відповідно, при необхідності, одно- або дворазово заміщений фтором, хлором, бромом, алкілом з 1-4 атомами вуглецю, галогеналкілом з 1-4 атомами вуглецю, алкоксилем з 1-4 атомами вуглецю або галогеналкоксилем з 1-4 атомами вуглецю феніл або піридил, або

A і D разом особливо переважно означають, при необхідності, заміщений алкандііл з 3-5 атомами вуглецю, в якому метиленова група може бути замінена карбонільною групою (однак не у випадку сполук формул (1-1)), киснем або сіркою, причому як замісники маються на увазі алкіл з 1-2 атомами вуглецю, або

A і D (у випадку сполук формул (1-1)) разом з атомами, з якими вони зв'язані, утворюють одну з груп AD-1

- AD-10:



або

A і Q¹ разом означають алкандііл з 3-4 атомами вуглецю, при необхідності, однократно або дворазово заміщений однаковими або різними замісниками з групи алкіл з 1-2 атомами вуглецю або алкоксил з 1-2 атомами вуглецю, або

Q¹ особливо переважно означає водень.

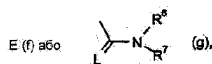
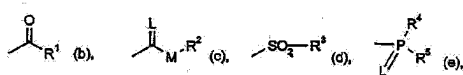
Q² особливо переважно означає водень.

Q⁴, Q⁵ і Q⁶ особливо переважно незалежно один від одного означають водень або алкіл з 1-3 атомами вуглецю.

Q³ особливо переважно означає водень, алкіл з 1-4 атомами вуглецю або, при необхідності, одно або двократно заміщений метилом або метоксилом циклоалкіл з 3-5 атомами вуглецю, або

Q³ і Q⁴ разом з атомом вуглецю, з яким вони зв'язані, особливо переважно означають, при необхідності, заміщений алкілом з 1-2 атомами вуглецю або алкоксилем з 1-2 атомами вуглецю насичений цикл із 5-6 атомами вуглецю, в якому атом вуглецю кільця, при необхідності, замінений киснем або сіркою.

G особливо переважно означає водень (a) або одну з груп



особливо (a), (b) або (c), в яких

E означає іон металу або іон амонію,

L означає кисень або сірку, і

M означає кисень або сірку.

R¹ особливо переважно означає, при необхідності, фтор- або хлорзаміщений алкіл з 1-8 атомами вуглецю, алкеніл з 2-8 атомами вуглецю, алкокси-алкіл з 1-4 атомами вуглецю в алкоксильній частині і з 1-2 атомами вуглецю в алкільній частині, алкілтію-алкіл з 1-4 атомами вуглецю в частині алкілтію і з 1-2 атомами вуглецю в алкільній частині; або, при необхідності, заміщений фтором, хлором, алкілом з 1-2 атомами вуглецю або алкоксилем з 1-2 атомами вуглецю циклоалкіл з 3-6 атомами вуглецю, в якому, при необхідності, один або два не сусідні атоми вуглецю кільця замінені киснем,

при необхідності, одно- або двократно заміщений фтором, хлором, бромом, ціано, нітро, алкілом з 1-4 атомами вуглецю, алкоксилем з 1-4 атомами вуглецю, галогеналкілом з 1-2 атомами вуглецю або галогеналкоксилем з 1-2 атомами вуглецю феніл,

R² особливо переважно означає, при необхідності, заміщений фтором алкіл з 1-8 атомами вуглецю, алкеніл з 2-8 атомами вуглецю або алкокси-алкіл з 1-4 атомами вуглецю в алкоксильній частині і з 2-4 атомами вуглецю в алкільній частині,

при необхідності, заміщений алкілом з 1-2 атомами вуглецю або алкоксилем з 1-2 атомами вуглецю циклоалкіл з 3-6 атомами вуглецю, або

при необхідності, заміщений фтором, хлором, бромом, ціано, нітро, алкілом з 1-4 атомами вуглецю, алкоксилем з 1-3 атомами вуглецю, трифторметилом або трифторметоксилем феніл або бензил.

R^3 особливо переважно означає, при необхідності, заміщений фтором алкіл з 1-6 атомами вуглецю або, при необхідності, заміщений фтором, хлором, бромом, алкілом з 1-4 атомами вуглецю, алкоксилем з 1-4 атомами вуглецю, трифторметилом, трифторметоксилем, ціано- або нітрогрупою феніл,

R^4 особливо переважно означає алкіл з 1-6 атомами вуглецю, алкоксил з 1-6 атомами вуглецю, алкіламіно з 1-6 атомами вуглецю, діалкіламіно з 1-6 атомами вуглецю, алкілтіо з 1-6 атомами вуглецю, алкенілтіо з 3-4 атомами вуглецю, циклоалкілтіо з 3-6 атомами вуглецю або, при необхідності, заміщений фтором, хлором, бромом, нітро, ціано, алкоксилем з 1-3 атомами вуглецю, галогеналкоксилем з 1-3 атомами вуглецю, алкілтіо з 1-3 атомами вуглецю, галогеналкілтіо з 1-3 атомами вуглецю, алкілом з 1-3 атомами вуглецю або трифторметилом феніл, фенокси або фенілтіо.

R^5 особливо переважно означає алкокси з 1-6 атомами вуглецю або алкілтіо з 1-6 атомами вуглецю,

R^6 особливо переважно означає водень, алкіл з 1-6 атомами вуглецю, циклоалкіл з 3-6 атомами вуглецю, алкоксил з 1-6 атомами вуглецю, алкеніл з 3-6 атомами вуглецю, алкокси-алкіл з 1-6 атомами вуглецю в алкоксильній частині і з 1-4 атомами вуглецю в алкілній частині, при необхідності, однократно заміщений фтором, хлором, бромом, трифторметилом, алкілом з 1-4 атомами вуглецю або алкоксилем з 1-4 атомами вуглецю феніл, при необхідності, однократно заміщений фтором, хлором, бромом, трифторметилом, алкілом з 1-4 атомами вуглецю або алкоксилем з 1-4 атомами вуглецю бензил.

R^7 особливо переважно означає алкіл з 1-6 атомами вуглецю, алкеніл з 3-6 атомами вуглецю або алкокси-алкіл з 1-6 атомами вуглецю в алкоксильній частині і з 1-4 атомами вуглецю в алкілній частині.

R^6 і R^7 разом особливо переважно означають при необхідності, заміщений метилом або етилом залишок алкілену з 5 атомами вуглецю, в якому метиленова група, при необхідності, замінена киснем або сіркою.

Особливо переважними згаданими галогенами є фтор, хлор, бром і йод, зокрема, фтор, хлор і бром.

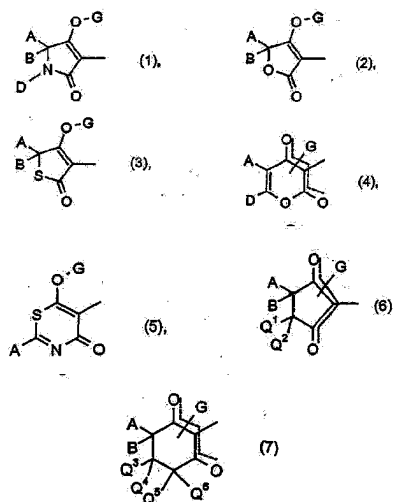
W виключно особливо переважно означає водень, метил, етил, ізопропіл, вініл або етиніл,

X виключно особливо переважно означає метил, етил, н-пропіл, ізопропіл, вініл або етиніл,

Y виключно особливо переважно означає водень, метил, етил, н-пропіл, ізопропіл, вініл або етиніл,

Z виключно особливо переважно означає водень, метил, етил, н-пропіл, ізопропіл, вініл або етиніл, за умови, що щонайменше, один із залишків W, X, Y або Z означає ланцюг з, щонайменше, 2 атомами вуглецю, причому максимально тільки один із залишків W, X, Y або Z може означати вініл або етиніл.

СКЕ виключно особливо переважно означає одну з груп



A виключно особливо переважно означає, при необхідності, заміщений фтором алкіл з 1-4 атомами вуглецю або алкокси-алкіл з 1-2 атомами вуглецю в алкоксильній і алкілній частинах, циклопропіл, циклопентил або циклогексил і тільки у випадку сполук формули (I-5), при необхідності, заміщений фтором, хлором, бромом, метилом, етилом, н-пропілом, ізопропілом, метокси, етокси, трифторметилом, трифторметокси, ціано- або нітрогрупою феніл.

B виключно особливо переважно означає водень, метил або етил, або

A, B і атом вуглецю, з яким вони зв'язані, виключно особливо переважно означають насичений циклоалкіл з 5-6 атомами вуглецю, де атом вуглецю кільця, при необхідності, замінений киснем або сіркою, і який, при необхідності, однократно заміщений метилом, етилом, пропілом, ізопропілом, трифторметилом, метокси, етокси, пропокси або бутокси, або

A, B і атом вуглецю, з яким вони зв'язані, виключно особливо переважно означають циклоалкіл з 6 атомами вуглецю, що заміщений алкілендіоксильною групою, що не містить два сусідніх атоми кисню,

A, B і атом вуглецю, з яким вони зв'язані, виключно особливо переважно означають циклоалкіл з 5-6 атомами вуглецю або циклоалкеніл з 5-6 атомами вуглецю, в яких 2 замісника разом з атомами вуглецю, з якими вони зв'язані, утворюють алкандііл з 2-4 атомами вуглецю або алкендііл з 2-4 атомами вуглецю або бутадієніл.

D виключно особливо переважно означає водень, при необхідності, заміщений фтором алкіл з 1-4 атомами вуглецю, алкеніл з 3-4 атомами вуглецю, алкокси-алкіл з 1-4 атомами вуглецю в алкоксильній частині і з 2-3 атомами вуглецю в алкільній частині, циклопропіл, циклопентил або циклогексил або (однак, не у випадку сполук формул (1-1)) відповідно, при необхідності, однократно заміщений фтором, хлором, метилом, етилом, н-пропілом, ізопропілом, метокси, етоксиди або трифторметилом феніл або піридил, або

A і D разом виключно особливо переважно означають, при необхідності, заміщений алкандііл з 3-4 атомами вуглецю, де атом вуглецю, при необхідності, замінений киснем або сіркою.

A і Q¹ разом виключно особливо переважно означають алкандііл з 3-4 атомами вуглецю, при необхідності, однократно або дворазово заміщений метилом або метокси, або

Q¹ виключно особливо переважно означає водень.

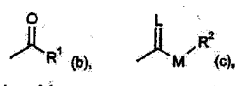
Q² виключно особливо переважно означає водень.

Q⁴, Q⁵ і Q⁶ виключно особливо переважно означають незалежно один від одного водень або метил.

Q³ виключно особливо переважно означає водень, метил, етил або пропіл, або

Q³ і Q⁴ виключно особливо переважно разом з вуглецем, з яким вони зв'язані, означає насичений цикл із 5-6 атомами вуглецю, при необхідності, однократно заміщений метилом або метокси.

G виключно особливо переважно означає водень (a) або одну з груп



в яких

L означає кисень або сірку і

M означає кисень або сірку.

R¹ виключно особливо переважно означає алкіл з 1-6 атомами вуглецю, алкеніл з 2-6 атомами вуглецю, алкокси-алкіл з 1-2 атомами вуглецю в алкоксильній частині і з 1 атомом вуглецю в алкільній частині, алкілтіо-алкіл з 1-2 атомами вуглецю в частині алкілтіо і з 1 атомом вуглецю в алкільній частині або, при необхідності, однократно заміщений фтором, хлором, метилом або метокси циклопропіл або циклогексил,

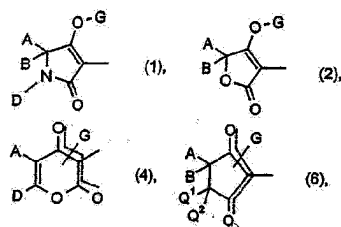
при необхідності, однократно заміщений фтором, хлором, бромом, ціано, нітро, метилом, метокси, трифторметилом або трифторметокси феніл,

R² виключно особливо переважно означає, при необхідності, заміщений фтором алкіл з 1-8 атомами вуглецю, алкеніл з 2-6 атомами вуглецю або алкокси-алкіл з 1-4 атомами вуглецю в алкоксильній частині і з 2-3 атомом вуглецю в алкільній частині, феніл або бензил.

W особливо переважно означає водень, метил, етил або ізопропіл, X особливо переважно означає метил, етил, ізопропіл або вініл, Y особливо переважно означає водень, метил, етил, ізопропіл, вініл або етиніл,

Z особливо переважно означає водень, метил, етил, н-пропіл або ізопропіл, за умови, що щонайменше, один із залишків W, X, Y або Z означає ланцюг з, щонайменше, 2 атомами вуглецю, причому максимально тільки один із залишків W, X, Y або Z може означати вініл або етиніл.

СКЕ особливо переважно означає одну з груп

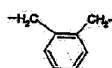


A особливо переважно означає метил,

B особливо переважно означає метил,

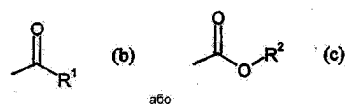
A, B і атом вуглецю, з яким вони зв'язані, особливо переважно означають насичений циклоалкіл з 5-6 атомами, в якому атом вуглецю кільця, при необхідності, замінений киснем, і який, при необхідності, однократно заміщений метилом, етилом, метокси, етоксиди.

A і B разом особливо означають



D особливо переважно означає водень або (однак, не у випадку сполук формули (I-1)) заміщений фтором феніл,

G особливо переважно означає водень (a) або одну з груп



R¹ особливо переважно означає алкіл з 1-6 атомами вуглецю, алкоксиметил з 1-2 атомами вуглецю,

R² особливо переважно означає алкіл з 1-4 атомами вуглецю.

СКЕ означає групу (6)

A і Q¹ разом особливо переважно означає алкіл з 3-4 атомами вуглецю і

B і Q² виключно особливо переважно, відповідно, означають водень.

Вище представлені загальні або переважні визначення і відповідні значення залишків можуть як завгодно взаємно комбінуватися. Це відповідно стосується кінцевих продуктів, прекурсорів і проміжних продуктів.

Згідно з винаходом переважними сполуками формули (I) є ті, в яких комбінуються вказані вище переважні значення.

Згідно з винаходом особливо переважними сполуками формули (I) є ті, в яких комбінуються вказані вище особливо переважні значення.

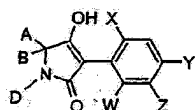
Згідно з винаходом виключно особливо переважними сполуками формули (I) є ті, в яких комбінуються вказані вище виключно особливо переважні значення.

Згідно з винаходом особливо переважними сполуками формули (I) є ті, в яких комбінуються вказані вище в особливо переважні значення.

Насичені або ненасичені вуглеводні залишки, такі як алкіл або алкеніл, можуть бути з'єднані з гетероатомами, як наприклад в алкокси, і можуть мати прямий або розгалужений ланцюг, в залежності від обставин.

У свою чергу замісні залишки можуть бути одно- або багаторазово заміщеними, якщо не вказане інше, причому при кількарязових заміщеннях замісники можуть бути однаковими або різними.

Зокрема, крім згаданих у прикладах одержання сполук, указуються наступні сполук формули (I-1-a):



Таблиця 1		
W означає CH ₃ , X означає CH ₃ , Y означає C≡CH, Z означає H.		
A	в	D
CH ₃	H	H
C ₂ H ₅	H	H
C ₃ H ₇	H	H
Iзо-C ₃ H ₇	H	H
C ₄ H ₉	H	H
Iзо-C ₄ H ₉	H	H
C ₄ H ₉	H	H
C ₄ H ₉	H	H
CH ₃	CH ₃	H
C ₂ H ₅	CH ₃	H
C ₃ H ₇	CH ₃	H
Iзо-C ₃ H ₇	CH ₃	H
C ₄ H ₉	CH ₃	H
Iзо-C ₄ H ₉	CH ₃	H
C ₄ H ₉	CH ₃	H
C ₄ H ₉	CH ₃	H

Продовження таблиці 1:

25

30

35

55

60

65

A	B	D
H	i-C ₃ H ₇	H
H		H
H		H
H		H
CH ₃	CH ₃	H
CH ₃	C ₂ H ₅	H
CH ₃	C ₃ H ₇	H
CH ₃	i-C ₃ H ₇	H
CH ₃		H
CH ₃		H
CH ₃		H
C ₂ H ₅	CH ₃	H
C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H

Таблиця 2: A, B і D як зазначено в таблиці 1

W означає CH₃, X означає CH₃, Y означає CH=CH₂, Z означає H.

Таблиця 3: A, B і D як зазначено в таблиці 1

W означає CH₃, X означає C₂H₅, Y означає CH₃, Z означає H.

Таблиця 4: A, B і D як зазначено в таблиці 1

W означає CH₃, X означає CH₃, Y означає C₂H₅, Z означає H.

Таблиця 5: A, B і D як зазначено в таблиці 1

W означає C₂H₅, X означає C₂H₅, Y означає CH₃, Z означає H.

Таблиця 6: A, B і D як зазначено в таблиці 1

W означає C₂H₅, X означає C₂H₅, Y означає C₂H₅, Z означає H.

Таблиця 7: A, B і D як зазначено в таблиці 1

W означає CH₃, X означає C≡CH, Y означає CH₃, Z означає H.

Таблиця 8: A, B і D як зазначено в таблиці 1

W означає CH₃, X означає C=CH₂, Y означає CH₃, Z означає H.

Таблиця 9: A, B і D як зазначено в таблиці 1

W означає CH₃, X означає C₂H₅, Y означає C₂H₅, Z означає H.

Таблиця 10: A, B і D як зазначено в таблиці 1

W означає H, X означає CH₃, Y означає C≡CH, Z означає H.

Таблиця 11: A, B і D як зазначено в таблиці 1

W означає H, X означає CH₃, Y означає C=CH₂, Z означає H.

Таблиця 12: A, B і D як зазначено в таблиці 1

W означає H, X означає C₂H₅, Y означає CH₃, Z означає H.

Таблиця 13: A, B і D як зазначено в таблиці 1

W означає H, X означає CH₃, Y означає C₂H₅, Z означає H.

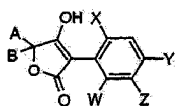
Таблиця 14: A, B і D як зазначено в таблиці 1

W означає H, X означає CH₃, Y означає H, Z означає C₂H₅.

Таблиця 15: A, B і D як зазначено в таблиці 1

W означає H, X означає CH₃, Y означає CH₃, Z означає C₂H₅.

Зокрема, крім згаданих у прикладах одержання сполук, указуються наступні сполуки формули (I-2-а):



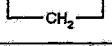
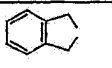
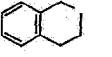
Таблиця 16	
W означає CH ₃ , X означає CH ₃ , Y означає C≡CH, Z означає H	
A	B
CH ₃	H
C ₂ H ₅	H
C ₃ H ₇	H
ізо-C ₃ H ₇	H
C ₄ H ₉	H
ізо-C ₄ H ₉	H
втор-C ₄ H ₉	H

трет-С ₄ H ₉	H
CH ₃	CH ₃
C ₂ H ₅	CH ₃
C ₃ H ₇	CH ₃
ізо-С ₃ H ₇	CH ₃
C ₄ H ₉	CH ₃
ізо-С ₄ H ₉	CH ₃
втор-С ₄ H ₉	CH ₃
трет-С ₄ H ₉	CH ₃

Продовження таблиці 16

A	B
C ₂ H ₅	C ₂ H ₅
C ₃ H ₇	C ₃ H ₇
	CH ₃
	CH ₃
	CH ₃
	CH ₃
	-(CH ₂) ₂ -
	-(CH ₂) ₄ -
	-(CH ₂) ₅ -
	-(CH ₂) ₆ -
	-(CH ₂) ₇ -
	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -
	-CH ₂ -O-(CH ₂) ₃ -
	-(CH ₂) ₂ -S-(CH ₂) ₂ -
	-CH ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₃ -
	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -
	(CH ₂) ₂ -CHC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -
	-(CH ₂) ₂ -CHC ₃ H ₇ -(CH ₂) ₂ -
	-(CH ₂) ₂ -CHC ₃ H ₇ -(CH ₂) ₂ -
	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -
	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -
	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₃ H ₇ -(CH ₂) ₂ -
	-(CH ₂) ₂ -CHC ₃ H ₇ -(CH ₂) ₂ -
	-(CH ₂) ₂ -C(CH ₃) ₂ -(CH ₂) ₂ -

Продовження таблиці 16

A	B
	-CH ₂ -(CHCH ₃) ₂ -(CH ₂) ₂ -
	-CH ₂ -CH-(CH ₂) ₂ -CH-
	
	-CH ₂ -CH-(CH ₂) ₄ -CH-
	-CH ₂ -CH-(CH ₂) ₆ -CH-
	
	

Таблиця 17: А і В як зазначено в таблиці 16

W означає CH₃, X означає CH₃, Y означає C=CH₂, Z означає H.

Таблиця 18: А і В як зазначено в таблиці 16

W означає CH₃, X означає C₂H₅, Y означає CH₃, Z означає H.

Таблиця 19: А і В як зазначено в таблиці 16

W означає CH₃, X означає CH₃, Y означає C₂H₅, Z означає H.

Таблиця 20: А і В як зазначено в таблиці 16

W означає C₂H₅, X означає C₂H₅, Y означає CH₃, Z означає H.

Таблиця 21: А і В як зазначено в таблиці 16

W означає C₂H₅, X означає C₂H₅, Y означає C₂H₅, Z означає H.

Таблиця 22: А і В як зазначено в таблиці 16

W означає CH₃, X означає C≡CH, Y означає CH₃, Z означає H.

Таблиця 23: А і В як зазначено в таблиці 16

W означає CH_3 , X означає $\text{C}=\text{CH}_2$, Y означає CH_3 , Z означає H.

Таблиця 24: А і В як зазначено в таблиці 16

W означає CH_3 , X означає C_2H_5 , Y означає C_2H_5 , Z означає H.

Таблиця 25: А і В як зазначено в таблиці 16

W означає H, X означає CH_3 , Y означає $\text{C}\equiv\text{CH}$, Z означає H.

Таблиця 26: А і В як зазначено в таблиці 16

W означає H, X означає CH_3 , Y означає $\text{C}=\text{CH}_2$, Z означає H.

Таблиця 27: А і В як зазначено в таблиці 16

W означає H, X означає C_2H_5 , Y означає CH_3 , Z означає H.

Таблиця 28: А і В як зазначено в таблиці 16

W означає H, X означає CH_3 , Y означає C_2H_5 , Z означає H.

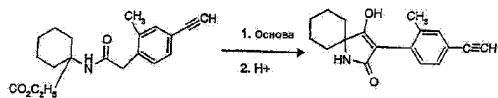
Таблиця 29: А і В як зазначено в таблиці 16

W означає H, X означає CH_3 , Y означає H, Z означає C_2H_5 .

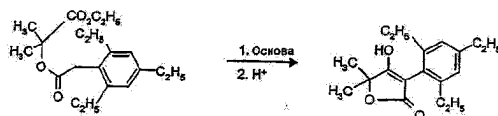
Таблиця 30: А і В як зазначено в таблиці 16

W означає H, X означає CH_3 , Y означає CH_3 , Z означає C_2H_5 .

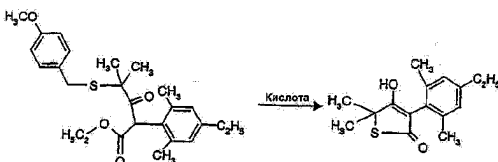
Якщо відповідно до способу (А) як вихідний продукт використовують етиловий естер N-(2-метил-4-етилфенілацетил)-1-аміноциклогексанкарбонової кислоти, то згідно з винаходом хід процесу може бути представлений наступною схемою реакції:



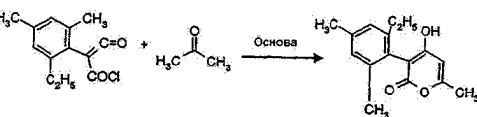
Якщо відповідно до способу (В) використовують етиловий естер О-(2,4,6-триетил-фенілацетил)-2-гідроксиізомасляної кислоти, то згідно з винаходом хід процесу може бути представлений наступною схемою реакції:



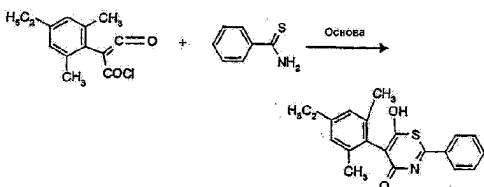
Якщо відповідно до способу (С) використовують етиловий естер 2-(2,6-диметил-4-етилфеніл)-4-(4-метокси)-бензилмеркапто-4-метил-3-оксвалеріанової кислоти, то згідно з винаходом хід процесу може бути представлений наступною схемою реакції:



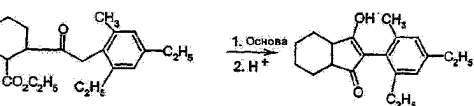
Якщо, наприклад, відповідно до способу (D) як вихідні продукти використовують (хлоркарбоніл)-2-(2-етил-4,6-диметил)феніл)кетен і ацетон, то згідно з винаходом хід процесу може бути представлений наступною схемою реакції:



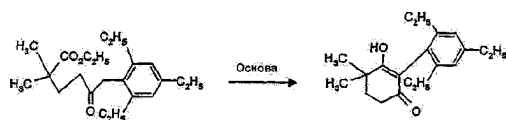
Якщо використовують, наприклад, відповідно до способу (Е) як вихідні сполуки (хлоркарбоніл)-2-(2,6-диметил-4-етилфеніл)кетен і тіобензамід, то згідно з винаходом хід процесу може бути представлений наступною схемою реакції:



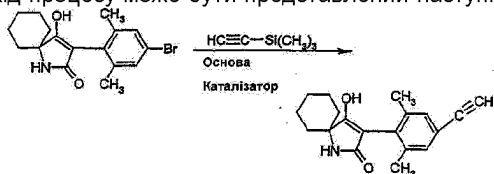
Якщо відповідно до способу (F) використовують етиловий естер 5-(2,4-діетил-6-метилфеніл)-2,3-тетраметил-4-оксвалеріанової кислоти, то згідно з винаходом хід процесу може бути представлений наступною схемою реакції:



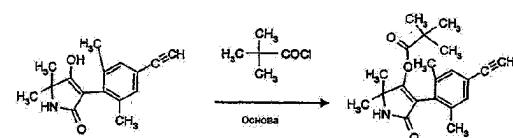
Якщо відповідно до способу (G) використовують етиловий естер 5-[(2,4-триетилфеніл)феніл]-2,2-диметил-5-оксогоксанової кислоти, то згідно з винаходом хід процесу може бути представлений наступною схемою реакції:



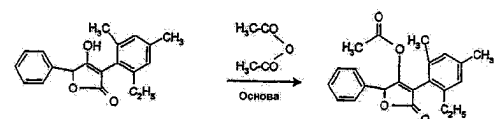
Якщо відповідно до способу (H) використовують 3-[(2,6-диметил-4-бром)феніл]-4,4-(пентаметилєн)піролідін-2,4-діон як вихідний продукт, то згідно з винаходом хід процесу може бути представлений наступною схемою реакції:



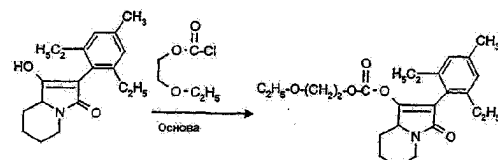
Якщо відповідно до способу (Iα) використовують 3-(2,6-диметил-4-етинілфеніл)-5,5-диметилпіролідін-2,4-діон і півалоїлхлорид як вихідні продукти, то згідно з винаходом хід процесу може бути представлений наступною схемою реакції:



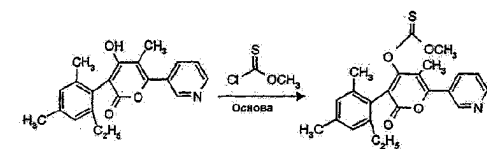
Якщо відповідно до способу (IB) використовують 3-(2-етил-4,6-диметилфеніл)-4-гідрокси-5-феніл-Δ³-дигідрофуран-2-он і ацетангідрид як вихідні продукти, то згідно з винаходом хід процесу може бути представлений наступною схемою реакції:



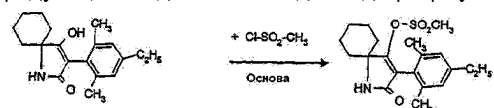
Якщо відповідно до способу (J) використовують 8-[(2,6-діетил-4-метил)феніл]-1-азабіцикло(4,3,0)нонан-7,9-діон і етоксietiловий естер хлормурашиної кислоти як вихідні продукти, то згідно з винаходом хід процесу може бути представлений наступною схемою реакції:



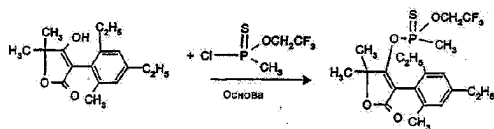
Якщо відповідно до способу (K) використовують 3-(2-етил-4,6-диметилфеніл)-4-гідрокси-5-метил-6-(3-піридил)пірон і метиловий естер хлормонотіомурашиної кислоти як вихідні продукти, то згідно з винаходом хід процесу може бути представлений наступною схемою реакції:



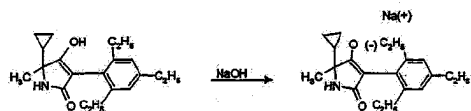
Якщо відповідно до способу (L) використовують 3-(2,6-диметил-4-етилфеніл)-5,5-пентаметилєнпіролідін-2,4-діон і хлорангідрид метансульфоїкислоти як вихідні продукти, то згідно з винаходом хід процесу може бути представлений наступною схемою реакції:



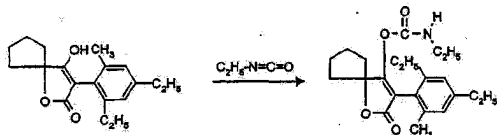
Якщо відповідно до способу (M) використовують 3-(2,4-діетил-6-метилфеніл)-4-гідрокси-5,5-диметил-Δ³-дигідрофуран-2-он і 2,2,2-трифторетиловий естер хлорангідриду метантіофосфонової кислоти як вихідні продукти, то згідно з винаходом хід процесу може бути представлений наступною схемою реакції:



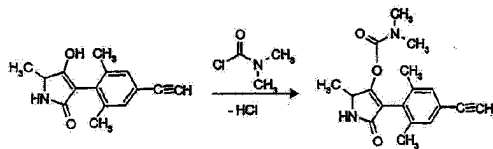
Якщо відповідно до процесу (N) використовують 3-(2,4,6-триетилфеніл)-5-циклопропіл-5-метилпіролідін-2,4-діон і NaOH як компоненти, то згідно з винаходом хід процесу може бути представлений наступною схемою реакції:



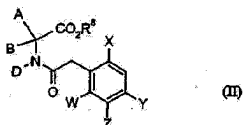
Якщо відповідно до процесу (O), варіант α використовують 3-(2,4-діетил-6-метилфеніл)-4-гідрокси-5-тетраметиле- Δ^3 -дигідрофуран-2-он і етилизоціанат як вихідні продукти, то згідно з винаходом хід процесу може бути представлений наступною схемою реакції:



Якщо відповідно до процесу (O), варіант B використовують 3-(4-етиніл-2,6-диметилфеніл)-5-метилпіролідін-2,4-діон і хлорангідрид диметилкарбамінової кислоти як вихідні продукти, то згідно з винаходом хід процесу може бути представлений наступною схемою реакції:



Згідно з винаходом необхідні для процесу (a) як вихідні матеріали сполуки формули (II)



в якій

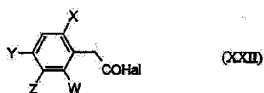
A, B, D, W, X, Y, Z і R^8 мають вказані вище значення, E новими сполуками.

Естери ациламінокислот формули (II) одержують, наприклад, ацилюванням похідного амінокислоти формули (XXI)



в якій

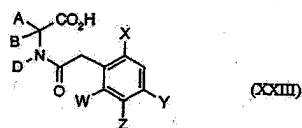
A, B, R^8 і D мають вказані вище значення, заміщеними галогенангідритами фенілоцтової кислоти формули (XXII)



в якій

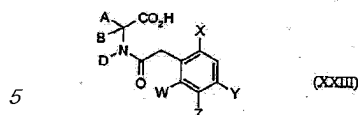
W, X, Y і Z мають вказані вище значення, і Hal означає хлор або бром

(Chem. Reviews 52, 237-416 (1953); Bhattacharya, Indian J. Chem. 6,341-5,1968), або естерифікуванням ациламінокислот формули (XXIII)



в якій

A, B, D, W, X, Y і Z мають вказані вище значення (Chem. Ind. (London) 1568 (1968)). Сполуки формули (XXIII)



в якій

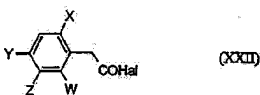
A, B, D, W, X, Y і Z мають вказані вище значення, є новими.

10 (XXIV) Сполуки формули (XXIII) одержують, наприклад, ацилюванням по Шотту-Брауну амінокислот формули



в якій A, B і D мають вказані вище значення,

15 заміщеними галогенангідрідами фенілоцтової кислоти формули (XXII)



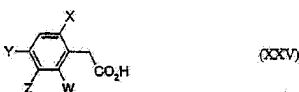
20 в якій

W, X, Y і Z мають вказані вище значення, і

Hal означає хлор або бром (Organikum, VEB Deutscher Verlag der Wissenschaften, Берлін 1977, S. 505).

Сполуки формули (XXII) є новими. Вони одержуються відомими способами (наприклад, Н. Henecka, Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, Bd. 8, S. 467-469 (1952)).

25 Сполуки формули (XXII) одержують, наприклад, взаємодією заміщених фенілоцтових кислот формули (XXV)



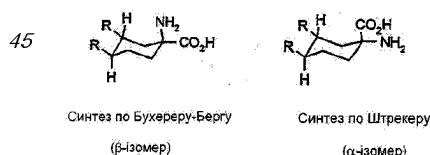
30 в якій

W, X, Y і Z мають вказані вище значення,

с галогенуючими засобами (наприклад, тіонілхлоридом, тіонілбромідом, оксалілхлоридом, фосгеном, трихлоридом фосфору, трибромідом фосфору або лентахлоридом фосфору), при необхідності, у присутності розріджувача (наприклад, при необхідності, хлорованого аліфатичного або ароматичного вуглеводню, такого як толуол або метиленхлорид) при температурі від -20°C до 150°C, переважно від -10°C до 100°C.

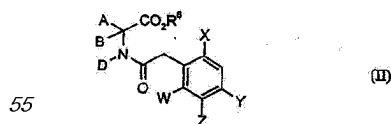
35 Сполуки формули (XXI) і (XXIV) частково відомі і/або можуть бути одержані відомими способами (дивись, наприклад, Compagnon, Miocque Ann. Chim. (Paris) [14] 5, S. 11-22, 23-27 (1970)).

40 Заміщені циклічні амінокарбонові кислоти формули (XXIV), в якій A і B утворюють кільце, одержують у загальному випадку доступними методами за допомогою реакції Бухерера-Берга або по методу Штрекера у відповідних різних ізомерних формах. Так в умовах реакції Бухерера-Берга одержують переважно ізомери (надалі для простоти згадуються як B-ізомери), в яких залишки R і карбоксильні групи розташовані екваторіально, у той час як в умовах синтезу по Штрекеру одержують переважно ізомери (надалі для простоти згадуються як α-ізомери), в яких аміногрупи і залишки R розташовані екваторіально.



50 (L Munday, J. Chem. Soc. 4372 (1961); J.T. Eward, C. Jitrangeri, Can. J. Chem. 53, 3339 (1975).

Далі, використовувані у вищезгаданому процесі (A) вихідні матеріали формули (II)



в якій

A, B, D, W, X, Y, Z і R⁸ мають вказані вище значення,

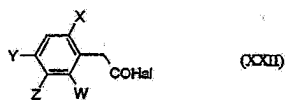
60 одержують взаємодією амініонітрилу формули (XXVI)



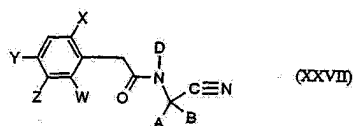
в якій

65 A, B і D мають вказані вище значення,

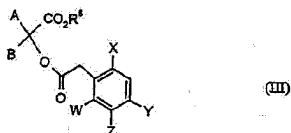
с заміщеними галогенангідрідами фенілоцтової кислоти формули (XXII)



5 в якій
W, X, Y, Z і Hal мають вказані вище значення,
с одержанням сполук формули (XXVII)



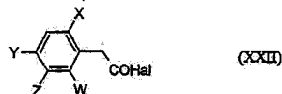
10 в якій A, B, D, W, X, Y і Z мають вказані вище значення,
і наступним кислим алкоголізмом.
15 Сполуки формули (XXVII) також є новими.
Згідно з винаходом використовувані в процесі (B) вихідні матеріали формули (III)



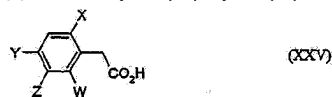
20 в якій
A, B, W, X, Y, Z і R⁸ мають вказані вище значення, також є новими.
25 Вони одержуються відомими методами.
Так одержання сполук формули (III) здійснюють, наприклад, ацилюванням естеру 2-гідроксикарбонової
кислоти формули (XXVIII)



30 в якій A, B і R⁸ мають вказані вище значення,
заміщеними галогенангідридами фенілоцтової кислоти формули (XXII)



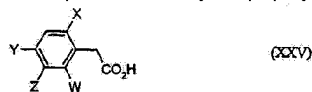
35 в якій
W, X, Y, Z і Hal мають вказані вище значення (Chem. Reviews 52,237-416 (1953)).
Далі, сполуки формули (III) одержують алкілюванням заміщених фенілоцтових кислот формули (XXV)



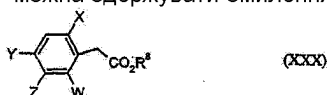
40 в якій
W, X, Y і Z мають вказані вище значення, естерами α-галогенкарбонових кислот формули (XXIX)



50 в якій A, B і R⁸ мають вказані вище значення і
Hal представляє хлор або бром.
Сполуки формули (XXV) також є новими.
Сполуки формули (XXIX) є у продажу.
Наприклад сполуки формули (XXV)

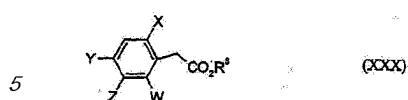


55 в якій
W, X, Y і Z мають вказані вище значення і Y крім того може означати -C≡C-Si(CH₃)₃,
60 можна одержувати омиленням естеру фенілоцтової кислоти формули (XXX)



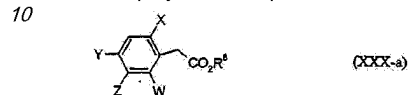
65 в якій W, X, Y, Z і R⁸ мають вказані вище значення,
у присутності кислоти або основи, у присутності розчинника при звичайних відомих стандартних умовах.

Сполуки формули (XXX) є новими. Сполук формули (XXX)



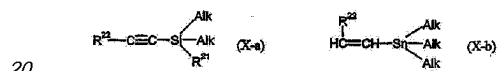
в якій W, X, Y, Z і R⁸ мають вказані вище значення,
і Y крім того може означати -C≡C-Si(CH₃)₃,

одержують, наприклад, взаємодією естеру фенілоцтової кислоти формули (XXX-a)



в якій R⁸, W, X, Y і Z мають вказані вище значення,

15 і один або 2 залишки, зокрема залишок W, X, Y або Z, означають хлор, бром або йод, зокрема бром, за умови, що інші залишки W, X, Y або Z не означають алкеніл або алкініл, с силілацетиленами формули (X-a) або вінілстананами формули (X-b)



в яких Alk переважно означає алкіл з 1-4 атомами вуглецю і

R²¹ переважно означає алкіл з 1-4 атомами вуглецю або феніл,

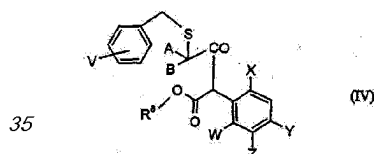
R²² має вказані вище значення,

25 у присутності розчинника, при необхідності, у присутності основи і каталізатора (переважно одного з вищезгаданих комплексів паладію).

Естери фенілоцтової кислоти формули (XXX-a) частково відомі з Міжнародних заявок WO 96/35664, WO 97/02243, WO 97/01535, WO 97/36868 або WO 98/05638 або їх можна одержати описаними там способами.

Одержання естерів фенілоцтової кислоти формули (XXX) можна здійснювати описаними далі способами (P) і (Q).

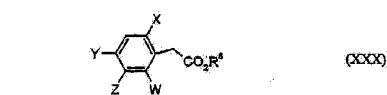
30 Використовувані у вищезгаданому процесі (C) вихідні матеріали формули (IV)



в якій

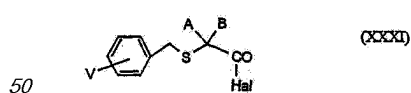
A, B, V, W, X, Y, Z і R⁸ мають вказані вище значення, є новими, їх одержують відомими методами.

40 Сполуки формули (IV) можна, наприклад, одержати ацилюванням естеру фенілоцтової кислоти формули (XXX)



в якій W, X, Y, Z і R⁸ мають вказані вище значення,

галогенангідридом 2-бензилтіо-карбонової кислоти формули (XXXI)



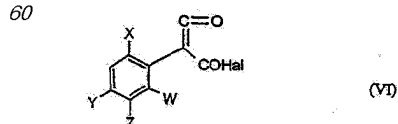
в якій A, B і V мають вказані вище значення, і

Hal означає галоген (зокрема, хлор або бром),

у присутності сильних основ (дивись M.S. Chambers, E.J.ThoMas, D.J.William, J. Chem. Soc. Chem. Commun., (1987), 1228).

55 Галогенангідриди бензилтіокарбонових кислот формули (XXXI) частково відомі і/або їх можна одержати відомими способами (J.Antibiotics (1983), 26, 1589).

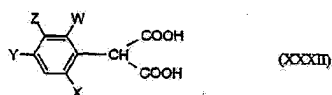
Використовувані у вищезгаданих процесях (D) і (E) як вихідні матеріали галогенкарбонілкетени формули (VI) є новими сполуками. їх одержують відомими простими методами (дивися, наприклад, Org. Prep. Proced. Int, 7, (4), 155-158, 1975 і німецьку заявку на патент DE 1945703). Так, сполуки формули (VI)



65 в якій W, X, Y і Z мають вказані вище значення і

Hal означає хлор або бром,

одержують взаємодією заміщених фенілмалонових кислот формули (XXXII)

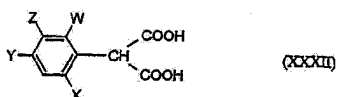


в якій W, X, Y і Z мають вказані вище значення,

с галогенангідридами кислот, як наприклад, тіонілхлоридом, хлоридом фосфору (V), хлоридом фосфору (III), оксалілхлоридом, фосгеном або тіонілбромидом, при необхідності, у присутності каталізаторів, як наприклад, диметилформаміду, метилстерилформаміду або трифенілфосфіну і, при необхідності, у присутності основ, як наприклад, піридину або триетиламіну.

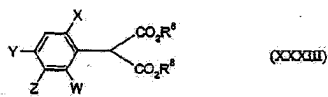
Заміщені фенілмалонові кислоти формули (XXXII) є новими сполуками. їх можна одержати простим способом за допомогою відомих методів (дивися, наприклад, Organikum, VEB Deutschler Verlag der Wissenschaften, Berlin 1977, S. 517, Європейську заявку на патент EP A 528 156, Міжнародні заявки WO 96/35664, WO 97/02243, WO 97/01535, WO 97/36868 і WO 98/05638).

Так, фенілмалонові кислоти формули (XXXII)



в якій W, X, Y і Z мають вказані вище значення,

одержують омиленням естерів фенілмалонової кислоти формули (XXXIII)

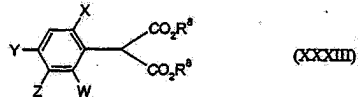


в якій

W, X, Y, Z і R⁸ мають вказані вище значення,

спочатку в присутності основи і розчинника з наступним обережним підкисленням (європейська заявка EP-528 156, міжнародні заявки WO 96/35664, WO 97/02243).

Естери малонової кислоти формули (XXXIII)



в якій

W, X, Y, Z і R⁸ мають вказані вище значення, є частково відомими сполуками.

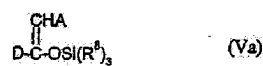
їх можна одержати звичайними відомими методами органічної хімії (дивись Tetrahedron Lett. 27, 2763 (1986), Organikum, VEB Deutschler Verlag der Wissenschaften, Berlin 1977, S. 587 ff, Міжнародні заявки WO 96/35664, WO 97/02243, WO 97/01535, WO 97/36868, WO 98/05638 і WO 99/47525).

Необхідні згідно з винаходом для процесу (D) як вихідні матеріали карбонільні похідні формули (V)



в якій

A і D мають вказані вище значення, або їх силільні естери формули (Va)



в якій

A, D і R⁸ мають вказані вище значення,

є відомими наявними в продажу сполуками або можуть бути одержані відомими методами.

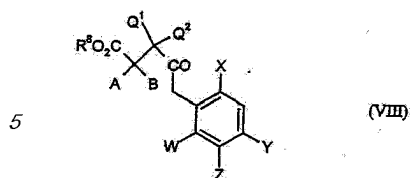
Необхідні згідно з винаходом для проведення процесу (E), як вихідні матеріали, хлорангідриди кетенокислот формули (VI) вже описані вище. Необхідні згідно з винаходом для проведення процесу (E) тіоаміди формули (VI)



в якій

A мають вказані вище значення, є відомими в органічній хімії сполуками.

Необхідні згідно з винаходом для проведення вищезгаданого процесу (F) як вихідні матеріали сполуки формули (VIII)

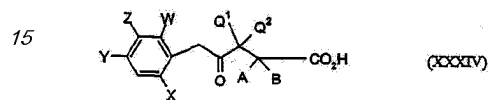


в якій

A, B, Q¹, Q², W, X, Y, Z і R⁸ мають вказані вище значення, є новими сполуками.

Вони можуть бути одержані відомими методами.

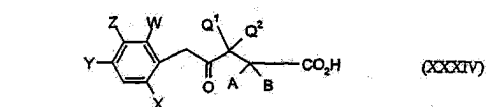
Естери 5-арил-4-кетокарбонових кислот формули (VIII), наприклад, одержують естерифікацією (дивись, наприклад, Organikum, 15. Auflag, Berlin, 1977, Seite 499) або алкілуванням (дивись приклад виготовлення) 5-арил-4-кетокарбонових кислот формули (XXXIV)



в якій

W, X, Y, Z, A, B, Q¹ і Q² мають вказані вище значення.

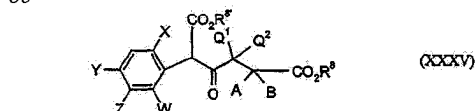
5-арил-4-кетокарбонові кислоти формули (XXXIV)



в якій

A, B, Q¹, Q², W, X, Y і Z мають вказані вище значення, є новими сполуками. Однак, вони можуть бути одержані в принципі відомими методами (дивись приклад виготовлення).

5-арил-4-кетокарбонові кислоти формули (XXXIV) одержують, наприклад, декарбоксилюванням естеру 2-феніл-3-оксоадипінової кислоти формули (XXXV)



в якій

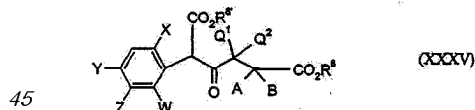
A, B, D¹, D², W, X, Y і Z мають вказані вище значення і

R⁸ і R⁸ⁱ означає алкіл (зокрема, алкіл з 1-8 атомами вуглецю) і

при використанні сполук формули (XXXVII) R⁸ означає водень,

при необхідності, у присутності розріджувача і, при необхідності, у присутності основи або кислоти (дивись, наприклад, Organikum, 15. Auflag, Berlin, 1977, Seite 519-521).

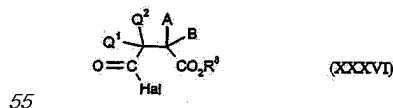
Сполуки формули (XXXV)



в якій

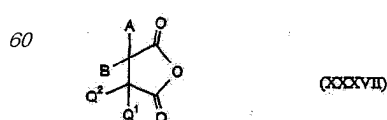
A, B, D¹, D², W, X, Y, Z, R⁸, R⁸ⁱ мають вказані вище значення і при використанні сполук формули (XXXVII) R⁸ означає водень, є новими сполуками.

Сполуки формули (XXXV) одержують наприклад ацилюванням хлорангідриду напівестеу карбонової кислоти формули (XXXVI)



в якій

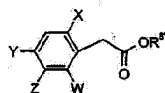
A, B, Q¹, Q² і R⁸ мають вказані вище значення, і Hal означає хлор або бром, або ангідриду карбонової формули (XXXVII)



в якій

A, B, Q¹ і Q² мають вказані вище значення,

естером фенолоцтової кислоти формули (XXX)

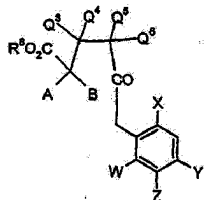


(XXX)

в якій W, X, Y, Z і R⁸ мають вказані вище значення,
у присутності розріджувача і основи (дивись MS. Chambers, E. J. Thomas, D.J.Williams, J. Chem. Soc. Chem. Commun., (1987), 1228, а також приклади виготовлення).

Сполуки формул (XXXVI) і (XXXVII) частково відомі з органічної хімії і/або можуть бути одержані відомими простими методами.

Необхідні відповідно з винаходом для проведення вищезгаданого процесу (G) як вихідні матеріали сполуки формули (IX)



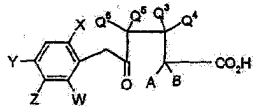
(IX)

в якій

A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y, Z і R⁸ мають вказані вище значення, є новими сполуками.

їх одержують у принципі відомими методами.

Естери 6-арил-5-кетокарбонових кислот формули (IX) одержують, наприклад, естерифікацією 6-арил-5-кетокарбонових кислот формули (XXXVIII)

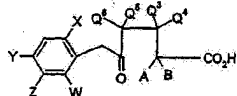


(XXXVIII)

в якій

A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y і Z мають вказані вище значення (дивися, наприклад, Organikum, 15. Auflag, Berlin, 1977, Seite 499).

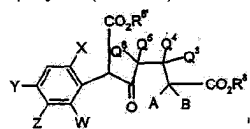
6-арил-5-кетокарбонові кислоти формули (XXXVIII)



(XXXVIII)

в якій

A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y і Z мають вказані вище значення, є новими. їх одержують у принципі відомими методами, наприклад, омиленням і декарбоксилюванням заміщених естерів 2-феніл-3-оксогептанових дикислот формули (XXXIX)



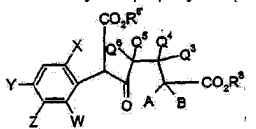
(XXXIX)

в якій

A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y і Z мають вказані вище значення і

R⁸ і R⁸ означає алкіл (зокрема, алкіл з 1-6 атомами вуглецю), при необхідності, у присутності розріджувача і, при необхідності, у присутності основи або кислоти (дивися, наприклад, Organikum, 15. Auflag, Berlin, 1977, Seite 519-521).

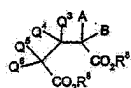
Сполуки формули (XXXIX)



(XXXIX)

в якій

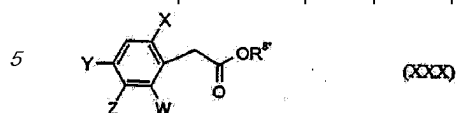
A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y, Z, R⁸ і R⁸ мають вказані вище значення є новими і можуть бути одержані конденсацією естерів дикарбонових кислот формули (XLI)



(XLI)

в якій

A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶ і R⁸ мають вказані вище значення
з заміщеними естерами фенілоцтової кислоти формули (XXX)

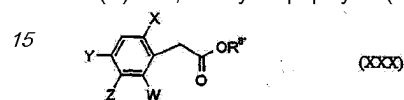


в якій

10 W, X Y, Z і R⁸ мають вказані вище значення в присутності розріджувача і у присутності основи.
Сполуки формули (XLI) частково відомі і/або можуть бути отримані відомими методами.

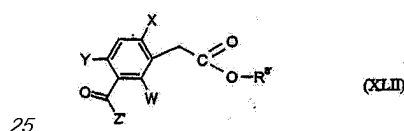
Сполуки формули (XXX) вже описувались на перших стадіях процесу (B) або описані як приклади в наступних процесах (P) і (Q).

(P) Так, сполуки формули (XXX)



в якій

20 W, X Y, Z і R⁸ мають вказані вище значення,
одержують відновленням естерів ацилфенілфенілоцтової кислоти формули (XLII)

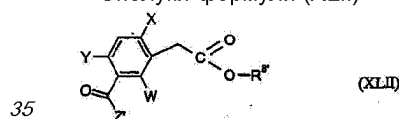


в якій

W, X, Y і R⁸ мають вказані вище значення і Z' означає алкіл,
при необхідності, у присутності розчинника відповідними реагентами (як наприклад Zn/HCl,
водень/каталізатор, гідазин/основа).

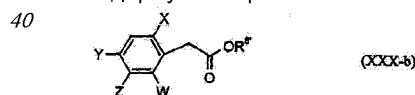
30 Сполуки формули (XLII) є новими.

Сполуки формули (XLII)



в якій

W, X, Y, Z' і R⁸ мають вказані вище значення,
одержують ацилюванням по Фриделю-Крафтцу естерів фенілоцтової кислоти формули (XXX-b)

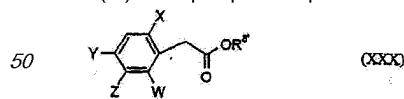


в якій W, X, Y і R⁸ мають вказані вище значення і Z означає водень,

45 при необхідності, у присутності розчинника ангідридом або хлорангідридом карбонової кислоти в присутності
кислоти або кислоти Л'юїса (наприклад, хлориду алюмінію, броміду заліза (III)).

Сполуки (XXX-b) відомі або можуть бути одержані описаними в процитованій літературі методами.

(Q) Естери фенілоцтової кислоти формули (XXX)



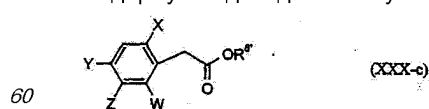
в якій

X означає алкіл,

55 W, Y і Z означає водень або алкіл, і

R⁸ означає алкіл,

одержують далі дегалогенуванням естерів фенілоцтової кислоти формули (XXX-c),



в якій

X означає алкіл,

R⁸ означає алкіл, і

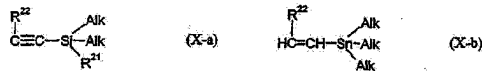
65 W, Y і Z можуть поряд з воднем і алкілом означати також хлор або бром,
у присутності розчинника і відновника (наприклад, водню в присутності каталізатора на основі благородного

металу, наприклад, паладію або платини).

Сполуки формули (XXX-c) відомі з процитованих вище заявок на патент або їх можна одержати описаними в них методами.

Необхідні для вищезгаданого процесу (H) як вихідні матеріали сполуки формул (I-I'-a)-(I-8'-a), в яких A, B, D, Q¹, Q², Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X', Y' і Z' мають вказані вище значення, частково відомі (міжнародні заявки на патент WO 96/35664, WO 97/02243, WO 97/01535, WO 97/36868, WO 98/05638) або можуть бути одержані описаними там методами.

Агенти конденсації формул (X-a) і (X-b)



в яких Alk, R²¹ і R²² мають вказані вище значення,

частково продаються або їх можна одержати простими відомими способами.

Крім того, необхідні згідно з винаходом для проведення процесів (I), (J), (K), (L), (M), (N) і (O) як вихідні матеріали галогенангідриди кислот формули (XI), ангідриди карбонових кислот формули (XII), естери хлорурашиної кислоти або тіоестери хлорурашиної кислоти формули (XIII), естери хлормонотіомурашиної кислоти або естери хлордитіомурашиної кислоти формули (XIV), хлорангідриди сульфонові кислоти формули (XV), сполуки фосфору формули (XVI) і гідроксиди металів, алкоксиди металів або аміни формули (XVII) і (XVIII) і ізоціанати формули (XIX) і хлорангідриди карбамідових кислот формули (XX) є відомими з органічної і відповідно неорганічної хімії сполуками.

Виходячи з цього, сполуки формул (V), (VII), від (XI) до (XX), (XXI), (XXIV), (XXVI), (XXVIII), (XXIX), (XXXI), (XXXVI), (XXXVII) і (XLI) відомі з приведених вище заявок на патент і/або їх можна одержати зазначеними там методами.

Спосіб (A) характеризується тим, що сполуки формули (II), в якій A, B, D, W, X, Y, Z і R⁸ мають вказані вище значення, піддають внутрішньомолекулярній конденсації в присутності основи.

Як розріджувачі в способі (A) згідно з винаходом можуть використовуватися всі інертні органічні розчинники. Переважно використовують вуглеводні, такі як толуол і ксилол, далі етери, такі як дибутиловий етер, тетрагідрофуран, діоксан, диметиловий етер гліколю і диметиловий етер дигліколю, крім того, полярні розчинники, такі як диметилсульфоксид, сульфолан, диметилформамід і N-метилпіролідон, а також спирти, такі як метанол, етанол, пропанол, ізопропанол, бутанол, ізобутанол і трет-бутанол.

Згідно з винаходом при проведенні процесу (A) як основи (депротонізуючих засобах) можуть використовуватися всі звичайні акцептори протонів. Переважно використовують оксиди лужних і лужноземельних металів, гідроксиди і карбонати, як наприклад гідроксид натрію, гідроксид калію, оксид магнію, оксид кальцію, карбонат натрію, карбонат калію і карбонат кальцію, також у присутності каталізаторів міжфазового переносу, таких як триетилбензиламонійхлорид, тетрабутиламонійбромід, Adogen 464 (метилтриалкіл(C₈-C₁₀)амонійхлорид) або TDA I (трис(метоксиетоксиетил)амін). Далі використовуються лужні метали, такі як натрій або калій. Далі використовуються аміді і гідриди лужних і лужноземельних металів, такі як амід натрію, гідрид натрію і гідрид кальцію, і, крім того, також алкоголяти лужних металів, такі як метилат натрію, етилат натрію і трет-бутилат калію.

При проведенні процесу (A) згідно з винаходом температура реакції може варіюватися в широкому діапазоні. В основному працюють при температурі від 0°C до 250°C, переважно від 50°C до 150°C.

Згідно з винаходом процес (A) проводиться в основному при нормальному тиску.

При проведенні процесу (A) згідно з винаходом реакційні компоненти формули (II) і депротонізуючі основи в основному беруться приблизно в подвійних еквімолярних кількостях. Проте, також можливо використовувати один або інший компонент у надлишку (до 3 моль).

Процес (B) характеризується тим, що сполуки формули (III), в якій A, B, W, X, Y, Z і R⁸ мають вказані вище значення, піддають внутрішньомолекулярній конденсації в присутності розріджувача і основи.

Як розріджувачі в способі (B) згідно з винаходом можуть використовуватися всі інертні органічні розчинники. Переважно використовують вуглеводні, такі як толуол і ксилол, далі етери, такі як дибутиловий етер, тетрагідрофуран, діоксан, диметиловий етер гліколю і диметиловий етер дигліколю, крім того, полярні розчинники, такі як диметилсульфоксид, сульфолан, диметилформамід і N-метилпіролідон, а також спирти, такі як метанол, етанол, пропанол, ізопропанол, бутанол, ізобутанол і трет-бутанол.

Згідно з винаходом при проведенні процесу (B) як основи (депротонізуючі засоби) можуть використовуватися всі звичайні акцептори протонів. Переважно використовують оксиди лужних і лужноземельних металів, гідроксиди і карбонати, як наприклад гідроксид натрію, гідроксид калію, оксид магнію, оксид кальцію, карбонат натрію, карбонат калію і карбонат кальцію, також у присутності каталізаторів міжфазового переносу, таких як триетилбензиламонійхлорид, тетрабутиламонійбромід, Adogen 464 (метилтриалкіл(C₈-C₁₀)амонійхлорид) або TDA I (трис(метоксиетоксиетил)амін). Далі використовуються лужні метали, такі як натрій або калій. Далі використовуються аміді і гідриди лужних і лужноземельних металів, такі як амід натрію, гідрид натрію і гідрид кальцію, і, крім того, також алкоголяти лужного металу, такі як метилат натрію, етилат натрію і трет-бутилат калію.

При проведенні процесу (B) згідно з винаходом температура реакції може варіюватися в широкому діапазоні. В основному працюють при температурі від 0°C до 250°C, переважно від 50°C до 150°C.

Згідно з винаходом процес (B) проводять в основному при нормальному тиску. При проведенні процесу (B)

згідно з винаходом реакційні компоненти формули (III) і депротонізуючі основи в основному беруться приблизно в еквімолярних кількостях. Проте, також можливо використовувати один або інший компонент у надлишку (до 3 моль).

Процес (C) характеризується тим, що сполуки формули (IV), в якій A, B, V, W, X, Y, Z і R⁸ мають вказані вище значення, піддають внутрішньомолекулярній циклізації в присутності розріджувача і кислоти.

Як розріджувачі в способі (C) згідно з винаходом можуть використовуватися всі інертні органічні розчинники. Переважно використовують вуглеводні, такі як толуол і ксилол, далі галогеновані вуглеводні, такі як дихлорметан, хлороформ, етиленхлорид, хлорбензол, дихлорбензол, крім того, полярні розчинники, такі як диметилсульфоксид, сульфолан, диметилформамід і N-метилпіролідон, а також спирти, такі як метанол, етанол, пропанол, ізопропанол, бутанол, ізобутанол і трет-бутанол.

При необхідності як розріджувач також можна використовувати кислоту. Як кислоти згідно з винаходом в способі (C) можна використовувати всі звичайні неорганічні або органічні кислоти як, наприклад, галогенводневу кислоту, сірчану кислоту, алкіл-, арил- і галогеналкілсульфо кислоти, зокрема, галогеновані алкілкарбонові кислоти, як наприклад, трифтороцтова кислота.

При проведенні процесу (C) згідно з винаходом температура реакції може варіюватися в широкому діапазоні. В основному працюють при температурі від 0°C до 250°C, переважно від 50°C до 150°C.

Згідно з винаходом процес (C) проводять в основному при нормальному тиску. При проведенні процесу (C) згідно з винаходом реакційні компоненти формули (IV) і кислота в основному беруться в еквімолярних кількостях. Проте, при необхідності також можливо використовувати кислоту як розчинник або як каталізатор.

Згідно з винаходом процес (D) характеризується тим, що карбонільні сполук формули (V) або їх енолові етери формули (V-a) піддають взаємодії з галогенангідридами кетенокислот формули (VI) у присутності розріджувача і, при необхідності, у присутності засобу, що зв'язує кислоту.

Як розріджувачі в способі (D) згідно з винаходом можуть використовуватися всі інертні органічні розчинники. Переважно використовують вуглеводні, такі як толуол і ксилол, далі етери, такі як дибутиловий етер, диметилловий етер гліколю і диметилловий етер дигліколю, крім того, полярні розчинники, такі як диметилсульфоксид, сульфолан, диметилформамід і N-метилпіролідон.

В якості засобу, що зв'язує кислоту згідно з винаходом можуть використовуватися при проведенні варіанта процесу (D) усі звичайні акцептори кислоти.

Переважають використовують третинні аміни, такі як триетиламін, піридин, діазабіциклооктан (DABCO), діазабіциклоундекан (DBU), діазабіциклононен (DBN), основа Хюніга і N, N-диметиламілін.

При проведенні процесу (D) згідно з винаходом температура реакції може варіюватися в широкому діапазоні. В основному працюють при температурі від 0°C до 250°C, переважно від 50°C до 220°C.

Згідно з винаходом процес (D) проводять в основному при нормальному тиску. При проведенні процесу (D) згідно з винаходом реакційні компоненти формул (V) і (VI), в яких A, D, W, X, Y і Z мають вказані вище значення і Hal означає галоген, і, при необхідності, акцептори кислоти в основному беруться в еквімолярних кількостях, проте, також можливо використовувати один або інший компонент у надлишку (до 5 моль).

Згідно з винаходом процес (E) характеризується тим, що тіоаміди формули (VII) піддають взаємодії з галогенангідридами кетенокислот формули (VI) у присутності розріджувача і, при необхідності, у присутності акцептора кислоти.

Як розріджувачі в способі (E) згідно з винаходом можуть використовуватися всі інертні органічні розчинники. Переважно використовують вуглеводні, такі як толуол і ксилол, далі етери, такі як дибутиловий етер, диметилловий етер гліколю і диметилловий етер дигліколю, крім того, полярні розчинники, такі як диметилсульфоксид, сульфолан, диметилформамід і N-метилпіролідон.

Як акцептор кислоти згідно з винаходом можуть використовуватися при проведенні процесу (E) усі звичайні акцептори кислоти.

Переважають використовують третинні аміни, такі як триетиламін, піридин, діазабіциклооктан (DABCO), діазабіциклоундекан (DBU), діазабіциклононен (DBN), основа Хюніга і N, N-диметиламілін.

При проведенні процесу (E) згідно з винаходом температура реакції може варіюватися в широкому діапазоні. В основному працюють при температурі від 0°C до 250°C, переважно від 50°C до 220°C.

Згідно з винаходом процес (E) проводять в основному при нормальному тиску.

При проведенні процесу (E) згідно з винаходом реакційні компоненти формул (VII) і (VI), в яких A, W, X, Y і Z мають вказані вище значення і Hal означає галоген, і, при необхідності, акцептори кислоти в основному беруться в еквімолярних кількостях. Проте, також можливо використовувати один або інший компонент у надлишку (до 5 моль).

Процес (F) характеризується тим, що сполуки формули (VIII), в якій A, B, Q¹, Q², W, X, Y, Z і R⁸ мають вказані вище значення, піддають внутрішньомолекулярній конденсації в присутності основи.

Як розріджувачі в способі (F) згідно з винаходом можуть використовуватися всі інертні стосовно реагентів органічні розчинники. Переважно використовують, вуглеводні, такі як толуол і ксилол, далі етери, такі як дибутиловий етер, тетрагідрофуран, діоксан, диметилловий етер гліколю і диметилловий етер дигліколю, крім того, полярні розчинники, такі як диметилсульфоксид, сульфолан, диметилформамід і N-метилпіролідон, а також спирти, такі як метанол, етанол, пропанол, ізопропанол, бутанол, ізобутанол і трет-бутанол.

Згідно з винаходом при проведенні процесу (F) як основи (депротонізуючі засоби) можуть використовуватися всі звичайні акцептори протонів. Переважно використовують оксиди, гідроксиди і карбонати лужних і лужноземельних металів, як наприклад гідроксид натрію, гідроксид калію, оксид магнію, оксид кальцію, карбонат натрію, карбонат калію і карбонат кальцію, а також у присутності каталізаторів міжфазового переносу, таких як

триетилбензиламонійхлорид, тетрабутиламонійбромид, Adogen 464 (метилтриалкіл(C₈-C₁₀)амонійхлорид) або TDA I (трис(метоксиетоксиетил)амін). Далі використовуються лужні метали, такі як натрій або калій. Далі використовуються аміді і гідриди лужних і лужноземельних металів, такі як амід натрію, гідрид натрію і гідрид кальцію, і, крім того, також алкоголяти лужного металу, такі як метилат натрію, етилат натрію і трет-бутилат калію.

При проведенні процесу (F) згідно з винаходом температура реакції може варіюватися в широкому діапазоні. В основному працюють при температурі від -75°C до 250°C, переважно від -50°C до 150°C.

Згідно з винаходом процес (F) проводять в основному при нормальному тиску. При проведенні процесу (F) згідно з винаходом реакційні компоненти формули (VIII) і депротонізуючі основи в основному беруться приблизно в еквімолярних кількостях. Проте, також можливо використовувати один або інший компонент у надлишку (до 3 моль).

Процес (G) характеризується тим, що сполуки формули (IX), в якій A, B, Q³, Q⁴, Q⁵, Q⁶, W, X, Y, Z і R^S мають вказані вище значення піддають внутрішньомолекулярній конденсації в присутності основи.

Як розріджувачі в способі (G) згідно з винаходом можуть використовуватися всі інертні стосовно реагентів органічні розчинники. Переважно використовують вуглеводні, такі як толуол і ксилол, далі етери, такі як дибутиловий етер, тетрагідрофуран, діоксан, диметилловий етер гліколю і диметилловий етер дигліколю, крім того, полярні розчинники, такі як диметилсульфоксид, сульфолан, диметилформамід і N-метилпіролідон, а також спирти, такі як метанол, етанол, пропанол, ізопропанол, бутанол, ізобутанол і трет-бутанол.

Згідно з винаходом при проведенні процесу (G) як основи (депротонізуючі засоби) можуть використовуватися всі звичайні акцептори протонів.

Переважаю використовують оксиди, гідроксиди і карбонати лужних і лужноземельних металів, як наприклад гідроксид натрію, гідроксид калію, оксид магнію, оксид кальцію, карбонат натрію, карбонат калію і карбонат кальцію, а гідроксиди і карбонати, також у присутності каталізаторів міжфазового переносу, таких як триетилбензиламонійхлорид, тетрабутиламонійбромид, Adogen 464 (метилтриалкіл(C₈-C₁₀)амонійхлорид) або TDA I (трис(метоксиетоксиетил)амін). Далі використовуються лужні метали, такі як натрій або калій. Далі використовуються аміді і гідриди лужних і лужноземельних металів, такі як амід натрію, гідрид натрію і гідрид кальцію, і, крім того, також алкоголяти лужного металу, такі як метилат натрію, етилат натрію і трет-бутилат калію.

При проведенні процесу (G) згідно з винаходом температура реакції може варіюватися в широкому діапазоні. В основному працюють при температурі від 0°C до 250°C, переважно від 50°C до 150°C.

Згідно з винаходом процес (G) проводять в основному при нормальному тиску.

При проведенні процесу (G) згідно з винаходом реакційні компоненти формули (IX) і депротонізуючі основи в основному беруться приблизно в еквімолярних кількостях. Проте, також можливо використовувати один або інший компонент у надлишку (до 3 моль).

Згідно з винаходом при проведенні процесу (H) як каталізатор використовують комплекси паладію (0). Переважними є, наприклад, тетракіс(трифенілфосфін)паладію або біс(трифенілфосфін)паладію дихлорид/трифенілфосфін.

Згідно з винаходом як акцептор кислоти для проведення процесу (H) використовуються неорганічні або органічні основи. До них належать переважно гідроксиди, ацетати, карбонати або гідрокарбонати лужних або лужноземельних металів, як наприклад, гідроксиди натрію, калію, барію або амонію, ацетати натрію, калію, кальцію або амонію, карбонати натрію, калію або амонію, гідрокарбонати натрію або калію, лужні фториди, як наприклад, фторид цезію, а також третинні аміни, такі як триметиламін, триетиламін, трибутиламін, N,N-диметиламінін, N,N-диметилбензиламін, піридин, N-метилпіперидин, N-метилморфолін, N,N-диметиламінопіридин, діазабіциклооктан (DABCO), діазабіциклононен (DBN) або діазабіциклоундецен (DBU).

Як розріджувачі згідно з винаходом для проведення процесу (H) використовують воду, органічні розчинники і будь-якої їх суміші. Як приклади можна назвати: аліфатичні, аlicиклічні або ароматичні вуглеводні, як наприклад, петролейний ефір, гексан, гептан, циклогексан, метилциклогексан, бензол, толуол, ксилол або декалін; галогеновані вуглеводні, як наприклад, хлорбензол, дихлорбензол, метилхлорид, хлороформ, тетрахлорметан, дихлор-, трихлоретан або тетрахлоретилен; етери, такі як діетиловий етер, діізопропіловий етер, метил-трет-бутиловий етер, метил-трет-аміловий етер, діоксан, тетрагідрофуран, 1,2-диметоксиетан, 1,2-діетоксиетан, диметилловий етер діетиленгліколю або анізол; спирти, такі як метанол, етанол, n- або ізо-пропанол, n-, ізо-, або трет-бутанол, етандіол, пропан-1,2-діол, етоксietанол, метоксietанол, монометилловий етер діетиленгліколю, монометилетиловий етер діетиленгліколю; вода.

Згідно з винаходом температура реакції в способі (H) може варіюватися в широких межах. В основному працюють при температурі між 0°C і +140°C, переважно від 50°C до 100°C.

При проведенні процесу (H) згідно з винаходом реакційні компоненти формули (X-a) або (X-b) і сполуки формул (I-1'-a) до (I-8'-a) в основному беруться в молярному співвідношенні від 1:1 до 5:1, переважно від 1:1 до 2:1. Каталізатор використовують в основному в кількості від 0,005 до 0,5 моль, переважно від 0,01 моль до 0,1 моль на моль сполуки формул (I-1'-a) до (I-8'-a). Основу використовують в основному в надлишку.

Згідно з винаходом процес (1-α) характеризується тим, що сполуки формул (I-1-a)-(I-7-a) відповідно піддають взаємодії з галогенангідрідами карбонових кислот формули (XI), при необхідності, у присутності розріджувача і, при необхідності, у присутності засобу, що зв'язує кислоту.

Як розріджувачі згідно з винаходом для проведення процесу (I- α) використовують інертні стосовно

галогенангідридів кислот розчинники. Переважно використовують вуглеводні, як наприклад, бензин, бензол, толуол, ксилол або тетралін, галогенвуглеводні, як наприклад, метиленхлорид, хлороформ, тетрахлорид вуглецю, хлорбензол і о-дихлорбензол, крім того кетони, такі як ацетон і метилизопропілкетон, далі етери, такі як діетиловий етер, тетрагідрофуран і діоксан, понад цього естери карбонових кислот, такі як етилацетат, а також сильно полярні розчинники, такі як диметилсульфоксид і сульфолан. Якщо гідролітична стабільність галогенангідридів кислот допускає це, то взаємодія може проводитися також у присутності води.

Згідно з винаходом в якості засобу, що зв'язує кислоту в способі (I- α) використовують звичайні акцептори кислоти. Переважно третинні аміни, такі як триетиламін, піридин, діазабіциклооктан (DABCO), діазабіциклоундецен (DBU), діазабіциклононен (DBN), основа Хюніга і N,N-диметиланілін, далі оксиди лужноземельних металів, такі як, оксид магнію і оксид кальцію, карбонати лужних або лужноземельних металів, як наприклад, карбонат натрію, карбонат калію і карбонат кальцію і також лужні гідроксиди, такі як гідроксид натрію і гідроксид калію.

Згідно з винаходом температура реакції в способі (I- α) може варіюватися в широких межах. В основному працюють при температурі від -20°C до +150°C, переважно від 0°C до 100°C.

При проведенні процесу (I- α) згідно з винаходом вихідні речовини формул (I-1-a)-(I-7-a) і галогенангідриди карбонових кислот формули (XI) в основному беруться в еквімолярних співвідношеннях. Також можна використовувати галогенангідрид карбонової кислоти в надлишку (до 5 моль). Переробку здійснюють звичайними методами.

Згідно з винаходом процес (I-B) характеризується тим, що сполуки формул (I-1-a)-(I-7-a), відповідно, піддають взаємодії з галогенангідридами карбонових кислот формули (XII) при необхідності, у присутності розріджувача і, при необхідності, у присутності засобу, що зв'язує кислоту.

Згідно з винаходом як розріджувач у способі (I-B) можуть використовуватися переважно ті розріджувачі, що переважно використовувалися при застосуванні галогенангідридів кислот. Утім, використовуваний у надлишку ангідрид карбонової кислоти також може діяти одночасно як розріджувач.

У якості засобу, що зв'язує кислоту у способі (I-B) переважно використовують засоби, що зв'язують кислоту, що переважно використовуються при застосуванні галогенангідридів кислот.

Температура реакції в способі (I-B) згідно з винаходом може варіюватися в широких межах. В основному працюють при температурі від -20°C до +150°C, переважно від 0°C до 100°C.

При проведенні згідно з винаходом процесу (I-B) вихідні матеріали формул (I-1-a)-(I-7-a) і ангідрид карбонової кислоти формули (XII) використовують в основному в еквівалентних кількостях. Також можна використовувати ангідрид карбонової кислоти в надлишку (до 5 моль). Переробку здійснюють звичайними методами.

В основному розріджувач і присутній у надлишку ангідрид карбонової кислоти а також карбонову кислоту, що утворюється, видаляють дистиляцією або промиванням органічним розчинником або водою.

Спосіб (J) характеризується тим, що здійснюють взаємодію сполук формул (I-1-a)-(I-7-a) з естером хлормурашиної кислоти або тіоестером хлормурашиної кислоти формули (XIII), при необхідності, у присутності розріджувача і, при необхідності, у присутності засобу, що зв'язує кислоту.

Згідно з винаходом при здійсненні способу (J) у якості засобу, що зв'язує кислоту використовують усі звичайні акцептори кислоти. Переважно використовують третинні аміни, як триетиламін, піридин, DABCO, DBU, DBA, основа Хюніга і N,N-диметиланілін, далі оксиди лужноземельних металів, такі як оксид магнію і оксид кальцію, карбонати лужних і лужноземельних металів, як наприклад, карбонат натрію, карбонат калію і карбонат кальцію і також лужні гідроксиди, такі як гідроксид натрію і гідроксид калію.

Як розріджувачі згідно з винаходом для проведення процесу (J) використовують інертні стосовно естерів хлормурашиної кислоти і, відповідно, тіоестерів хлормурашиної кислоти розчинники. Переважно використовують вуглеводні, як наприклад, бензин, бензол, толуол, ксилол або тетралін, галогенвуглеводні, як наприклад, метиленхлорид, хлороформ, тетрахлорид вуглецю, хлорбензол і о-дихлорбензол, крім того кетони, такі як ацетон і метилизопропілкетон, далі етери, такі як діетиловий етер, тетрагідрофуран і діоксан, понад цього естери карбонових кислот, такі як етилацетат, а також сильно полярні розчинники, такі як диметилсульфоксид і сульфолан.

Температура реакції при проведенні процесу (J) згідно з винаходом може варіюватися в широкій межі. Якщо працюють у присутності розріджувача і засобу, що зв'язує кислоту, то температуру реакції підтримують від -20°C до +100°C, переважно від 0°C до 50°C.

Згідно з винаходом процес (J) проводять в основному при нормальному тиску. При проведенні згідно з винаходом процесу (J) вихідні матеріали формул (I-1-a)-(I-7-a) і відповідний естер хлормурашиної кислоти і відповідно тіоестер хлормурашиної кислоти формули (XIII) використовують в основному в еквівалентних кількостях. Також можна використовувати один або інший компонент у надлишку (до 2 моль). Переробку здійснюють звичайними методами. В основному відокремлюють сіль, що випадає, і реакційну суміш, що залишилась, відокремлюють від розріджувача.

Спосіб (K) характеризується тим, що здійснюють взаємодію сполук формул (I-1-a)-(I-7-a) відповідно з сполуками формули (XIV) у присутності розріджувача і при необхідності в присутності засобу, що зв'язує кислоту.

При методі способу (K) на моль вихідної сполуки формул (I-1-a)-(I-7-a) використовують близько 1 моль естеру хлормонотіомурашиної кислоти і відповідно естеру хлордитіомурашиної кислоти формули (XIV) при від 0 до 120°C, переважно при від 20 до 60°C.

При необхідності, у якості розчинників використовують всі інертні полярні органічні розчинники, як етери,

аміди, сульфони, сульфоксиди, а також галогеналкани.

Переважаю використовують диметилсульфоксид, тетрагідрофуран, диметилформамід або метиленхлорид.

У випадку додавання до енолятних солей (I-1-a)-(I-7-a) у переважному варіанті здійснення додаткових сильних депротонуючих засобів, як наприклад гідрид натрію або трет-бутилат калію, можна відмовитися від подальшого використання засобів, що зв'язують кислоту.

Якщо вводять засіб, що зв'язує кислоту, то використовують звичайні неорганічні або органічні основи, наприклад гідроксид натрію, карбонат натрію, карбонат калію, піридин, триетиламін.

Реакція може проводитися при нормальному тиску або при підвищеному тиску, переважно працюють при нормальному тиску. Доробку здійснюють звичайними методами. Згідно з винаходом спосіб (L) характеризується тим, що здійснюють взаємодію сполук формул (I-1-a)-(I-7-a), відповідно, з хлорангідридом сульфокислоти формули (XV), при необхідності, у присутності розріджувача і, при необхідності, в присутності засобу, що зв'язує кислоту.

При методі способу (L) на моль вихідних сполук формул (I-1-a)-(I-7-a) використовують приблизно 1 моль хлорангідриду сульфокислоти формули (XV) при від -20 до 150°C, переважно при від 20 до 70°C.

При необхідності, у якості розчинників використовують всі інертні полярні органічні розчинники, як етери, аміди, нітрили, сульфони, сульфоксиди або галогенвуглеводні, такі як метиленхлорид.

Переважаю використовують диметилсульфоксид, тетрагідрофуран, диметилформамід або метиленхлорид.

У випадку додавання до енолятних солей (I-1-a)-(I-7-a) у переважному варіанті здійснення додаткових сильних депротонуючих засобів, як наприклад гідрид натрію або трет-бутилат калію, можна відмовитися від подальшого використання засобів, що зв'язують кислоту.

Якщо вводять засіб, що зв'язує кислоту, то використовують звичайні неорганічні або органічні основи, наприклад, гідроксид натрію, карбонат натрію, карбонат калію, піридин, триетиламін.

Реакція може проводитися при нормальному тиску або при підвищеному тиску, переважно працюють при нормальному тиску. Доробку здійснюють звичайними методами.

Згідно з винаходом спосіб (M) характеризується тим, що здійснюють взаємодію сполук формул (I-1-a) до (I-7-a) відповідно з сполуками фосфору формули (XVI), при необхідності, у присутності розріджувача і, при необхідності, у присутності засобу, що зв'язує кислоту.

У відповідності із способом (M) при одержанні сполук формул (I-1-e)-(I-7-e) на 1 моль сполук (I-1-a)-(I-7-a) використовують від 1 до 2, переважно від 1 до 1,3 моль сполук фосфору формули (XVI) при температурі від -40 до 150°C, переважно від -10 до 110°C.

При необхідності, в якості розчинників використовують всі інертні полярні органічні розчинники, як етери, аміди, нітрили, спирти, сульфіді, сульфони, сульфоксиди і так далі.

Переважаю використовують ацетонітрил, диметилсульфоксид, тетрагідрофуран, диметилформамід або метиленхлорид.

Якщо вводять засіб, що зв'язує кислоту, то використовують звичайні неорганічні або органічні основи, наприклад, гідроксиди, карбонати або аміни. Прикладами є гідроксид натрію, карбонат натрію, карбонат калію, піридин, триетиламін.

Реакція може проводитися при нормальному тиску або при підвищеному тиску, переважно працюють при нормальному тиску. Доробку здійснюють звичайними, відомими з органічної хімії методами. Очищення кінцевих продуктів здійснюють переважно кристалізацією, хроматографічним очищенням або так званою відгонкою, тобто видаленням летких компонентів у вакуумі.

Згідно з винаходом спосіб (N) характеризується тим, що здійснюють взаємодію сполук формул (I-1-a)-(I-7-a) з гідроксидом металу або відповідно алкоксидом металу формули (XVII) або аміном формули (XVIII), при необхідності, у присутності розріджувача. Як розчинники згідно з винаходом в способі (N) переважно використовують етери, як тетрагідрофуран, діоксан, діетиловий етер, або спирти, такі як метанол, етанол, ізопропанол, а також воду.

Згідно з винаходом спосіб (N) проводиться в основному при нормальному тиску. Температура реакції становить в основному від -20°C до 100°C, переважно від 0°C до 50°C.

Згідно з винаходом процес (O) характеризується тим, що сполуки формул (I-1-a)-(I-7-a) при варіанті (O-α), відповідно, піддають взаємодії з сполуками формули (XIX), при необхідності, у присутності розріджувача і, при необхідності, каталізатора або при варіанті (O-B) із сполуками формули (XX), при необхідності, у присутності розріджувача і, при необхідності, у присутності засобу, що зв'язує кислоту.

При методі виготовлення (O-α) на моль вихідних сполук формул (I-1-a)-(I-7-a) використовують приблизно 1 моль ізоціанату формули (XIX) при від 0 до 100°C, переважно при від 20 до 50°C.

При необхідності, в якості розчинника використовують всі інертні органічні розчинники, такі як етери, аміди, нітрили, сульфони, сульфоксиди.

При необхідності, для прискорення реакції можуть додаватися катаризатори. Як катаризатори дуже вигідно використовувати оловоорганічні сполуки, як наприклад, дилаурат дибутилолова. Працюють переважно при нормальному тиску.

При методі виготовлення (O-B) на моль вихідних сполук формул (I-1-a)-(I-7-a) використовують приблизно 1 моль хлорангідриду карбамінової кислоти формули (XX) при від -20 до 150°C, переважно від 0 до 70°C.

При необхідності, в якості розчинників використовують всі інертні полярні органічні розчинники, такі як етери, аміди, сульфони, сульфоксиди або галогенвуглеводні.

Переважаю використовують диметилсульфоксид, тетрагідрофуран, диметилформамід або метиленхлорид.

У випадку додавання до енолятих солей (I-1-a)-(I-7-a), у переважному варіанті здійснення, додавання сильних депротонуючих засобів (як наприклад гідрид натрію або трет-бутилату калію) можна відмовитися від подальшого використання засобів, що зв'язують кислоти.

Якщо вводять засіб, що зв'язує кислоту, то використовують звичайні неорганічні або органічні основи, наприклад гідроксиди, карбонати або аміни. Прикладами є гідроксид натрію, карбонат натрію, карбонат калію, піридин, триетиламін.

Реакція може проводитися при нормальному тиску або при підвищеному тиску, переважно працюють при нормальному тиску. Переробку здійснюють звичайними відомими з органічної хімії методами.

Активні речовини придатні, при гарній сумісності з рослинами і сприятливій токсичності для квіток, для боротьби з тваринними шкідниками, зокрема, з комахами, павуками і нематодами в сільському господарстві, у лісгосподарстві, для захисту запасів і матеріалів, а також в області санітарії. Переважно вони можуть використовуватися як засоби захисту рослин. Вони ефективні проти нормально чутливих і витривалих видів, а також на всіх або окремих стадіях розвитку. До вищезгаданих шкідників відносяться:

3 ряду Isopoda, наприклад, *Oniscus asellus*, *Armadillidium vulgare*, *Porcellio scaber*.

3 ряду Diplopoda, наприклад, *Blaniulus guttulatus*.

3 ряду, Chlopoda, наприклад, *Geophilus carpophagus*, *Scutigera* spp.

3 ряду Symphyla, наприклад, *Scutigera* spp.

3 ряду Thysanura, наприклад, *Lepisma saccharina*.

3 ряду Collembola, наприклад, *Onychiurus armatus*.

3 ряду Orthoptera, наприклад, *Acheta domesticus*, *Grylotalpa* spp., *Locusta migratoria migratorioides*, *Melanoplus* spp., *Schistocerca gregaria*.

3 ряду Blattaria, наприклад, *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Leucophaea maderae*, *Blattella germanica*.

3 ряду Dermaptera, наприклад, *Forficula auricularia*.

3 ряду Isoptera, наприклад, *Reticulitermes* spp.

3 ряду Phthiraptera, наприклад, *Pediculus humanus corporis*, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Trichodectes* spp., *Damalinia* spp.

3 ряду Thysanoptera, наприклад, *Hercinothrips femoralis*, *Thrips tabaci*, *Thrips palmi*, *Frankliniella occidentalis*.

3 ряду Heteroptera, наприклад, *Eurygaster* spp., *Dysdercus intermedius*, *Piesma quadrata*, *Cimex lectularius*, *Rhodnius prolixus*, *Triatoma* spp.

3 ряду Homoptera, наприклад, *Aleurodes brassicae*, *Bemisia tabaci*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Aphis gossypii*, *Brevicoryne brassicae*, *Cryptomyzus ribis*, *Aphis fabae*, *Aphis poti*, *Eriosoma lanigerum*, *Hyalopterus arundinis*, *Phylloxera vastatrix*, *Pemphigus* spp., *Macrosiphum avenae*, *Myzus* spp., *Phorodon humuli*, *Rhopalosiphum padi*, *Empoasca* spp., *Escalis bilobatus*, *Nephotettix cincticeps*, *Lecanium coti*, *Saissetia oleae*, *Laodelphax striatellus*, *Nilaparvata lugens*, *Aonidiella aurantii*, *Aspidiotus hederae*, *Pseudococcus* spp., *Psylla* spp.

3 ряду Lepidoptera, наприклад, *Pectinophora gossypiella*, *Bupalus piniarius*, *Cheimatobia brumata*, *Lithocolletis blancardella*, *Hyponomeuta padella*, *Plutella xylostella*, *Malacosoma neustria*, *Euproctis chrysorrhoea*, *Lymantria* spp., *Bucculatrix thurberiella*, *Phyllocnistis citrella*, *Agrotis* spp., *Euxoa* spp., *Feltia* spp., *Earias insulana*, *Heliothis* spp., *Mamestra brassicae*, *Panous flammea*, *Spodoptera* spp., *Trichoplusia ni*, *Carpocapsa pomonella*, *Pieris* spp., *Chilo* spp., *Pyrausta nubilalis*, *Ephestia kuehniella*, *Galleria mellonella*, *Tineola bisselliella*, *Tinea pellionella*, *Hofmannophila pseudospretella*, *Cacoecia podana*, *Capua reticulana*, *Choristoneura fumiferana*, *Clysia ambiguella*, *Homona magnanima*, *Tortrix viridana*, *Cnaphalocerus* spp., *Oulema oryzae*.

3 ряду Coleoptera, наприклад, *Anobium punctatum*, *Rhizopertha dominica*, *Bruchidius obtectus*, *Acanthoscelides obtectus*, *Hylotrupes bajulus*, *Agelastica alni*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Phaedon cochleariae*, *Diabrotica* spp., *Psylliodes chrysocephala*, *Epilachna varivestis*, *Atomaria* spp., *Oryzaephilus surinamensis*, *Anthonomus* spp., *Sitophilus* spp., *Otiorynchus sulcatus*, *Cosmopolites sordidus*, *Ceuthorrhynchus assimilis*, *Hypera postica*, *Dermestes* spp., *Trogoderma* spp., *Anthrenus* spp., *Attagenus* spp., *Lyctus* spp., *Meligethes aeneus*, *Ptinus* spp., *Niptus hololeucus*, *Gibbium psyllioides*, *Tribolium* spp., *Tenebrio molitor*, *Agriotes* spp., *Conoderus* spp., *Melolontha melolontha*, *Amphimallon solstitialis*, *Costelytra zealandica*, *Lissorhynchus oryzophilus*.

3 ряду Hymenoptera, наприклад, *Diprion* spp., *Hoplocampa* spp., *Lasius* spp., *Monomorium pharaonis*, *Vespa* spp.

3 ряду Diptera, наприклад, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Drosophila melanogaster*, *Musca* spp., *Fannia* spp., *Calliphora erythrocephala*, *Lucilia* spp., *Chrysomya* spp., *Cuterebra* spp., *Gastrophilus* spp., *Hyppobosca* spp., *Stomoxys* spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Tabanus* spp., *Tannia* spp., *Bibio hortulanus*, *Oscinella nit*, *Phorbia* spp., *Pegomyia hyoscyami*, *Ceratitis capitata*, *Dacus oleae*, *Tipula paludosa*, *Hylemyia* spp., *Liriomyza* spp.

3 роду Siphonaptera, наприклад, *Xenopsylla cheopis*, *Ceratophyllus* spp.

3 класу Arachnida, наприклад, *Scorpio maurus*, *Latrodectus mactans*, *Acarus siro*, *Argas* spp., *Omithodoros* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Eriophyes ribis*, *Phyllocoptruta oleivora*, *Boophilus* spp., *Rhipicephalus* spp., *Amblyomma* spp., *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Sarcoptes* spp., *Tarsonemus* spp., *Bryobia praetiosa*, *Panonychus* spp., *Tetranychus* spp., *Hemitarsonemus* spp., *Brevipalpus* spp.

До нематодів, що паразитують на рослинах, належать, наприклад, *Pratylenchus* spp., *Radopholus similis*, *Ditylenchus dipsaci*, *Tylenchulus semipenetrans*, *Heterodera* spp., *Globodera* spp., *Meloidogyne* spp., *Aphelenchoides* spp., *Longidorus* spp., *Xiphinema* spp., *Trichodorus* spp., *Bursaphelenchus* spp.

У відповідності з винаходом сполуки можуть використовуватися також як гербіциди і бактерициди у

визначених концентраціях і видаткових кількостях, наприклад, як фунгіциди, протигрибкові засоби і бактерициди. Вони можуть також використовуватись як проміжні продукти або прекурсори для синтезу інших активних речовин.

Активні речовини можуть бути переведені в звичайні препаративні форми, такі як розчини, емульсії, порошки, що змочуються, суспензії, порошки, засоби, що розпорошуються, пасти, розчинні порошки, грануляти, суспензійно-емульсійні концентрати, просочені активною речовиною природні і синтетичні матеріали, а також тонкоінкапсульовані в полімерних матеріалах форми.

Ці препаративні форми роблять відомими способами, наприклад, змішуванням активних речовин з наповнювачами, такими як рідкі розчинники і/або тверді носії, при використанні, при необхідності, поверхнево-активних речовин, таких як емульгатори і/або диспергатори і/або піноутворювачі.

У випадку використання води як наповнювача можна, наприклад, використовувати органічні розчинники як допоміжні розчинники. Як рідкі розчинники можна використовувати: ароматичні сполуки, такі як ксилол, толуол, або алкілнафталіни, хлоровані ароматичні сполуки і хлоровані аліфатичні вуглеводні, такі як хлорбензол, хлоретилен або метиленхлорид, аліфатичні вуглеводні, такі як циклогексан або парафіни, наприклад, фракції нафти, мінеральні і рослинні олії, спирти, такі як бутанол або гліколь, а також їх етери і етери, кетони, такі як ацетон, метилетилкетон, метилізобутилкетон або циклогексанон, сильно полярні розчинники, як диметилформамід і диметилсульфоксид, а також воду.

Як тверді носії використовують:

наприклад, солі амонію і природне кам'яне борошно, таке як каолін, глина, тальк, крейда, кварц, атапульгіт, монтморилоніт або діатомна земля і синтетичне кам'яне борошно, таке як високодисперсна кремнієва кислота, оксид алюмінію і силікат, як тверді носії у гранулятах використовують: наприклад, здрібнені і фракціоновані природні гірські породи, такі як кальцит, мармур, пемза, сепіоліт, доломіт, а також синтетичні грануляти з неорганічного і органічного борошна, а також грануляти з органічного матеріалу, такого як тирса, шкарлупа кокосового горіха, початки кукурудзи і стебла тютюну; у якості емульгаторів і/або піноутворювачів використовують: наприклад, неіонні і аніонні емульгатори, такі як естери поліоксиетиленжирних кислот, етери поліоксиетиленжирних спиртів, наприклад, алкіларилполігліколевий етер, алкілсульфонат, алкілсульфат, арилсульфонат, а також їх гідролізати; у якості диспергаторів використовують, наприклад, лігнінсульфонат натрію і метилцелюлозу.

У препаративних формах можуть використовуватися засоби, що покращують прилипания, такі як карбоксиметилцелюлозу, природні і синтетичні порошокві, зернисті або латексоутворюючі полімери, такі як гуміарабік, полівініловий спирт, полівінілацетат, а також природні фосфоліпіди, такі як кефалін і лецитин, і синтетичні фосфоліпіди. Наступними добавками можуть бути мінеральні і рослинні олії.

Як барвники можуть бути використані як неорганічні пігменти, наприклад, оксид заліза, оксид титану, берлінська лазур і органічні барвники, такі як алізаринові, азо- і металфталоціанінові барвники і живильні мікроелементи, такі як солі заліза, марганцю, бору, міді, кобальту, молібдену і цинку.

Препаративні форми містять в основному 0,1-95мас.% активної речовини, переважно 0,5-90%.

Згідно з винаходом активна речовина може міститися в стандартних препаративних формах, а також у приготівлених з цих форм прикладних формах у суміші з іншими активними речовинами, такими як інсектициди, розрихлювачі, стерилізатори, бактерициди, акарициди, нематодциди, фунгіциди, регулятори росту або гербіциди. Наприклад, естери фосфорної кислоти, карбамати, естери карбонових кислот, хлоровані вуглеводні, фенілсечовина, вироблені мікроорганізмами речовини і інсектициди.

Особливо сприятливими партнерами є, наприклад, наступні:

Фунгіциди

Алдиморф, Ампропілфос, Ампропілфос-калій, Андоприм, Анілазин, Азакназол, Азоксистробін, Беналаксил, Беноданил, Беномил, Бензамакрил, Бензамакрил-ізобутил, Биалафос, Бинаракрил, Бифеніл, Битертанол, Бластицидин-S, Бромукназол, Бупиримат, Битіобат, Полісульфід кальцію, Капсиміцин, Каптафол, Каптан, Карбендазим, Карбоксин, Карвон, Хінометіонат, Хлорбентіазон, Хлорфеназол, Хлоронеб, Хлоропикрин, Хлороталоніл, Хлохолінат, Хлозилаккон, Куфранеб, Кумоксаніл, Купроконазол, Купродиніл, Купрофурам, Дебакарб, Дихлорофен, Диклбутразол, Диклофлуанід, Дикломезин, Диклоран, Діетофенкарб, Дифенокназол, Диметиримол, Диметоморф, Диніконазол, Диніконазол-М, Динокар, Дифеніламін, Дипіритіон, Диталімфос, Дитіанон, Додеморф, Дидин, Дразоксолон, Едифенфос, Епоксиконазол, Етаконазол, Етиримол, Етридіазол, Фамоксадон, Фенапаніл, Фенаримол, Фенбуконазол, Фенфурам, Фенітропан, Фенпиклоніл, Фенпропідин, Фенпропіморф, Фентинацетат, Фентингідроксид, Фербам, Феримзон, Флуазинам, Флуметовен, Флуоромід, Флуквінканазол, Флурпрмідол, Флусилазол, Флусуламід, Флутоланил, Флутриафол, Фолпет, Фозетил-Алюміній, Фозетил-натрій, Фталід, Фуберидазол, Фуралаксил, Фураметпир, Фуркарбоніл, Фурконазол, Фурконазол-цис, Фурмециклокс,

Гуазарин, Гексахлорбензол, Гексакназол, Гимексазол, Імазаліл, Імібенконазол, Іміноктадин, Іміноктадиналбезилат, Іміноктадинтриацетат, Йодокарб, ірконазол, Іпробенфос (ІВР), Іпродіон, Ірумаміцин, Ізопротіолан, Ізоваледіон, Казугаміцин, Крезоксим-метил, препарати міді, такі як: Гідроксид міді, Нафтенат міді, Оксихлорид міді, Сульфат міді, Оксид міді, Оксин-міді і Бордоска суміш,

Манкоппер, Манкозеб, Манеб, Меферимзон, Мепаніпирим, Мепроніл, Металаксил, Метконазол, Метасульфокارب, Метфуросам, Метирам, Мемеклам, Месульфовакс, Милдіоміцин, Миклобутаніл, Миклозолін, Нікель-диметилдитіокарбамат, Нітротал-ізопропіл, Нуаримол, 5 Офурац, Оксадиксил, Оксамокарб, Оксолінікацид, Оксикарбоксим, Оксифентіін, Паклобутразол, Пефуразоат, Пенконазол, Пенцикурон, Фосдифен, Пімарицин, Піпералін, Поліоксин, Поліоксорим, Пробеназол, Прохлорорац, Процимидон, Пропамокарб, Пропанозин-натрій, Пропіконазол, Пропінеб, Піразофос, Пірифенокс, Піриметаніл, Піроквінол, Піроксифур, Хінконазол, Хінтозен (PCNB), 10 Сірка і препарати сірі, Тебуконазол, Теклофталам, Текназен, Тетциклацис, Тетраконазол, Табендазол, Тициофен, Тифлузамід, Тіофанат-метил, Тирам, Тіоксимід, Толклофос-метил, Толілфлуанід, Триадимефон, Триадименол, Триазбутил, Триазоксид, Трихламід, Трициклазол, Тридеморф, Трифлумізол, Трифорин, Тритиконазол, Уніконазол, 15 Валідаміцин А, Винклозолін, Виніконазол, Зариламід, Зинеб, Зирам, а також Даггер G, ОК-8705, ОК-8801, 20 α -(1,1-диметилфеніл)- β -(2-феноксietил)-1H-1,2,4-триазол-1-етанол, α -(2,4-дихлорфеніл)- β -фтор-b-пропіл-1H-1,2,4-триазол-1-етанол, α -(2,4-дихлорфеніл)- β -метокси-а-метил-1H-1,2,4-триазол-1-етанол, α -(5-метил-1,3-діоксан-5-іл)- β -[[4-(трифторметил)феніл]метилен]-1H-1,2,4-триазол-1-етанол, (5RS,6RS)-6-гідрокси-2,2,7,7-тетраметил-5-(1H-1,2,4-триазол-1-іл)-3-октанол, 25 (E)-а-(метоксиіміно)-N-метил-2-фенокси-фенілацетамід, 1-ізопропіловий естер {2-метил-1-[[[1-(4-метилфеніл)етил]аміно]карбоніл]пропіл]-карбамінової кислоти, 1-(2,4-дихлорфеніл)-2-(1H-1,2,4-триазол-1-іл)етанон-О-(фенілметил)оксим, 1-(2-метил-1-нафталеніл)-1H-пірол-2,5-діон, 1-(3,5-дихлорфеніл)-3-(2-пропеніл)-2,5-піролідиндіон, 30 1-[(дийодметил)сульфоніл]-4-метилбензол, 1-[[2-(2,4-дихлорфеніл)-1,3-диоксолан-2-ил]метил]-1H-імідазол, 1-[[2-(4-хлорфеніл)-3-фенілоксираніл]метил]-1H-1,2,4-триазол, 1-[1-[2-[(2,4-дихлорфеніл)метокси]феніл]етеніл]-1H-імідазол, 1-метил-5-ноніл-2-(фенілметил)-3-піролідінол, 35 2',6'-дибром-2-метил-4'-трифторметокси-4'-трифторметил-1,3-тіазол-5-карбоксанілід, 2,2-дихлор-N-[1-(4-хлорфеніл)етил]-1-етил-3-метилциклопропанкарбоксамід, 2,6-дихлор-5-(метилтію)-4-піримідинілітіоціанат, 2,6-дихлор-N-(4-трифторметилбензил)бензаміт, 2,6-дихлор-N-[[4-(трифторметил)феніл]метил]бензамід, 40 2-(2,3,3-трийод-2-пропеніл)-2H-тетразол, 2-[(1-метилетил)сульфоніл]-5-(трихлорметил)-1,3,4-тіадіазол, 2-[[6-діокси-4-О-(4-О-метил- β -О-глікопіранозил)-а-О-глюкопіранозил]аміно]-4-метокси-1H-піроло[2,3-d]піримідин-5-карбонітрил, 2-амінобутан, 45 2-бром-2-(бромметил)пентандинітрил, 2-хлор-N-(2,3-дигідро-1,1,3-триметил-1H-інден-4-ил)-3-піридинкарбоксамід, 2-хлор-N-(2,6-диметилфеніл)-N-(ізотіоціанатометил)ацетамід, 2-фенілфенол(OPP), 3,4-дихлор-1-[4-(дифторметокси)-феніл]-1H-пірол-1,2,5-діон, 50 3,5-дилор-N-[ціано[(1-метил-2-пропініл)окси]метил]бензамід, 3-(1,1-диметилпропіл-1-оксо-1H-інден-2-карбонітрил, 3-[2-(4-хлорфеніл)-5-етокси-3-ізоксазолідиніл]піридин, 4-хлор-2-ціан-N,N-диметил-5-(4-метилфеніл)-1H-імідазол-1-сульфонамід,4-метил-тетразол[1,5-a]хіназолін-5(4H)-он, 55 8-(1,1-диметилетил)-N-етил-N-пропіл-1,4-діоксаспіро[4.5]декан-2-метанамін,8-гідроксигінолінсульфат, 2-[(феніламіно)-карбоніл]гідразид9H-ксантен-9-карбоновікислоти, біс-(1-метилетил)-3-метил-4-[(3-метилбензоіл)окси]-2,5-тіофендикарбоксилат, цис-1-(4-хлорфеніл)-2-(1H-1,2,4-триазол-1-іл)циклогептанол, цис-4-[3-[4-(1,1-диметилпропіл)феніл]-2-метилпропіл]-2,6-диметилморфолінгідрохлорид, 60 етил[(4-хлорфеніл)азо]ціаноацетат, гідрокарбонаткалію, натрієвасільметантетратриолу, метил 1-(2,3-дигідро-2,2-диметил-1H-інден-1-ил)-1H-імідазол-5-карбоксилат, метил N-(2,6-диметилфеніл)-N-(5-ізоксазолілкарбоніл)-DL-аланінат, 65 метил N-(хлорацетил)-N-(2,6-диметилфеніл)-DL-аланінат, N-(2,3-дихлор-4-гідроксифеніл)-1-метилциклогексанкарбоксамід,

- N-(2,6-диметилфеніл)-2-метокси-N-(тетрагідро-2-оксо-3-фурант)ацетамід,
N-(2,6-диметилфеніл)-2-метокси-N-(тетрагідро-2-оксо-3-тієніл)ацетамід,
N-(2-хлор-4-нітрофеніл)-4-метил-3-нітро-бензолсульфонамід,
5 N-(4-циклогексилфеніл)-1,4,5,6-тетрагідро-2-піримідинамін,
N-(4-гексилфеніл)-1,4,5,6-тетрагідро-2-піримідинамін,
N-(5-хлор-2-метилфеніл)-2-метокси-N-(2-оксо-3-оксазолідиніл)ацетамід,
N-(6-метокси)-3-піридиніл)иклопропанкарбоксамід,
N-[2,2,2-трихлор-1-[(хлорацетил)аміно]етил]бензамід,
10 N-[3-хлор-4,5-біс-(2-пропінілокси)феніл]-N'-метоксиметанімідамід,
натрієва сіль N-форміл-N-гідрокси-DL-аланіну,
О,О-діетил-[2-(дипропіламіно)-2-оксоетил]етилфосфорамідотіоат,
О-метил-3-феніл-фенілпропілфосфорамідотіоат,
S-метил-1,2,3-бензотіадіазол-7-карботіоат,
15 спіро[2Н]-1-бензопіран-2,1'(3'Н)-ізобензофуран]-3'-он,
Бактерициди
Бронопол, дихлорофен, нітрапірин, диметилдитіокарбамат нікелю, казугаміцин, октилінон, фуранкарбонова
кислота, окситетрациклін, пробеназол, стрептоміцин, теклофталам, сульфат міді і інші препарати міді.
Інсектициди/акаріциди/нематоциди
20 Абаментин, Ацефат, Ацетаміприл, Акринатрин, Аланікарб, Алдикарб, Алдоксикарб, Альфа-циперметрин,
Альфа-метрин, Амітрац, Авермектин, AZ 60541, Азадирахтин, Азаметифос, Азинфос А, Азинфос М,
Азоциклотин,
Bacillus popilliae, Bacillus sphaericus, Bacillus subtilis, Bacillus thuringiensis, Бакуловирен, Beauveria
bassiana, Beauveria tenella, Бендіокарб, Бенфуракарб, Бенсультап, Бензоксимат, Бетацифлутрин, Бифеназат,
25 Бифентрин, Біотанометрин, Біоперметрин, ВРМС, Бромфос А, Буфенкарб, Бупрофезин, Бутатіофос,
Бутокарбоксим, Бутилпіридабен,
Кадузафос, Карбарил, Карбофуран, Карбофенотіон, Карбосульфат, Картап, Хлоетокарб, Хлоретоксифос,
Хлорфенапір, Хлорфенвінфос, Хлорфлуазурон, Хлормефос, Хлорпірифос, Хлорпірифос М, Хловапортрин,
цис-Ресметрин, цис-Перметрин, Клоцитрин, Клоетокарб, Клофентезин, Ціанофос, Циклопрен, Циклопротрин,
30 Цифлутрин, Цигалотрин, Цигексатин, Циперметрин, Циромазин, Дельтаметрин, Деметон М, Деметон S,
Деметон-S-метил, Діафентіурон, Діазинон, Дихлорвос, Дифлубензурон, Диметоат, Диметилвінфос, Діофенолан,
Дисульфотон, Докузат-натрій, Дофеналін,
Ефлузіланат, Емаментин, Емфентрин, Ендосульфат, Entomophthora spp., Есфенвалерат, Етіофенкарб, Етіон,
Етопрофос, Етофенпрокс, Етоксазол, Етримфос, Фенамифос, Феназаквін, Фенбутатин оксид, Фенітротіон,
35 Фенотіокарб, Феноксакрим, Феноксикарб, Фенпропатрин, Фенпірад, Фенпіритрин, Фенпіроксимат, Фенвалерат,
Фіпроніл, Флуазинам, Флуазурон, Флуброцитринат, Флуциклокурон, Флуцитринат, Флуфеноксурон, Флутензин,
Флувалінат, Фонофос, Фосметилан, Фостіазат, Фубфенпрокс, Фуратіокарб,
Галофенозид, НСН, Гептенофос, Гексафлумурон, Гекситіазокс, Гідропрен,
Імідаклопрід, Ізазофос, Ізофенфос, Ізоксатіон, Івермектин,
40 Лямбда-цигалотрин, Луфенурон
Малатіон, Мекарбам, Метальдегід, Метамідофос, Metharhizium anisopliae, Metharhizium flavoviride,
Метидатіон, Метіокарб, Метоміл, Метоксифенозид, Метолкарб, Метоксадіазон, Мевінфос, Милбемектин,
Монокротофос, Налед, Нітенпірам, Нитіазин, Новалурон
Ометоат, Оксамил, Оксидеметон М
45 Raecilomyces fumosoroseus, Паратіон А, Паратіон М, Перметрин, Фентоат,
Форат, Фозалон, Фосмет, Фосфамідон, Фоксим,
Піримікарб, Піриміфос А, Піриміфос М, Профенофос, Промекарб, Пропоксур, Протіофос, Протоат,
Піметрозин, Піраклофос, Піресметрин, Піретрум, Піридабен, Піридатіон, Піримідифен, Пірипроксифен,
Квіналфос,
50 Рибавірин,
Салітін, Себуфос, Силафлуофен, Спіносад, Сульфотеп, Сульпрофос,
Тау-флувалінат, Тебуфенозид, Тебуфенпірад, Тебупіриміфос, Тефлубензурон,
Тефлутрин, Темефос, Темівінфос, Тербуфос, Тетрахлорвінфос, Тетациперметрин, Тіаметоксам,
Тіапроніл, Тіатрифос, Тіоциклам гідрооксалат, Тіодикарб, Тіофанокс, Турінгінзин, Тралоцитрин, Тралометрин,
55 Триаратен, Триазамаат, Триазафос, Триаурон, Трихлорфенідин, Трихлорфон, Трифлумурон, Триметакарб,
Вамідотіон, Ваниліпрол, Verticillium lecanii
Y15302
Зета-циперметрин, Золапрофос
(1R-цис)-[5-(фенілметил)-3-фураніл]метил
60 3-[(дигідро-2-оксо-3(2Н)-фураніліден)-метил]-2,2-диметилциклопропанкарбоксилат,
(3-феноксифеніл)метил 2,2,3,3-тетраметилциклопропанкарбоксилат,
1-[(2-хлор-5-тіазоліл)метил]тетрагідро-3,5-диметил-N-нітро-1,3,5-триазин-2(1Н)-імін,
2-(2-хлор-6-фторфеніл)-4-[4-(1,1-диметилетил)феніл]-4,5-дигідрооксазол,
2-(ацетилокси)-3-додецил-1,4-нафталіндіон,
2-хлор-N-[[[4-(1-фенілетокси)феніл]аміно]карбоніл]бензамід,
65 2-хлор-N-[[[4-(2,2-дихлор-1,1-дифторетокси)феніл]аміно]карбоніл]бензамід,

3-метилфенілпропілкарбамат,
4-[4-(4-етоксифеніл)-4-метилфеніл]-1-фтор-2-феноксibenзол,
4-хлор-2-(1,1-диметилетил)-5-[[2-(2,6-диметил-4-феноксифенокси)етил]тіо]-3(2H)-піридазинон,
4-хлор-2-(2-хлор-2-метилпропіл)-5-[(6-йод-3-піридиніл)метокси]-3(2H)-піридазинон,
4-хлор-5-[(6-хлор-3-піридиніл)метокси]-2-(3,4-дихлорфеніл)-3(2H)-піридазинон,
Bacillus thuringiensis штам EG-2348,
гідразид [2-бензоіл-1-(1,1-диметилетил)бензойної кислоти,
2,2-диметил-3-(2,4-дихлорфеніл)-2-оксо-1-оксаспиро[4.5]дец-3-ен-4-іловий естер бутанової кислоти,
[3-[(6-хлор-3-піридиніл)метил]-2-тіазолидинилиден]ціанамід,
дигідро-2-(нітрометилен)-2H-1,3-тіазин-3(4H)-карбоксальдегід,
етил [2-[[1,6-дигідро-6-оксо-1-(фенілметил)-4-піридазиніл]окси]етил]карбамат,
N-(3,4,4-трифтор-1-оксо-3-бутенил)гліцин,
N-(4-хлорфеніл)-3-[4-(диформетокси)феніл]-4,5-дигідро-4-феніл-1H-піразол-1-карбоксамід,
N-[(2-хлор-5-тіазоліл)метил]-N'-метил-N'-нітрогуанідин,
N-метил-N'-(1-метил-2-пропеніл)-1,2-гідразиндикарботіоамід,
N-метил-N'-2-пропеніл-1,2-гідразиндикарботіоамід,
O,O-діетил-[2-(дипропіламіно)-2-оксоетил]-етилфосфорамідотіоат.

Можлива також суміш з іншими відомими активними речовинами, такими як гербіциди, або мінеральними добривами і регуляторами росту.

Згідно з винаходом активні речовини можуть застосовуватися як інсектициди в стандартних препаративних формах, а також у одержанні з цих форм прикладних форм у суміші із синергістами. Синергісти - це сполуки, що збільшують дію активних речовин, при цьому сам доданий синергіст не повинен бути активним.

Вміст активної речовини в приготівлених із стандартних препаративних форм прикладних формах може варіюватися в широких межах. Концентрація активної речовини в прикладних формах може становити від 0,0000001 до 95мас.% активної речовини, переважно від 0,0001 до 1мас.%.

Приготовлені прикладні форми застосовують звичайним способом. При застосуванні проти шкідників у санітарії і при збереженні запасів активні речовини виявляють високу залишкову ефективність на деревині і глині, а також гарну лужну стабільність на вапнованих підкладках і основах.

Згідно з винаходом активні речовини діють не тільки проти шкідників рослин, у санітарії і при збереженні запасів, але і ефективні у ветеринарії проти зовнішніх паразитів тварин (ектопаразити), таких як лускокрилі кліщі, шкірні кліщі, коростяві кліщі, кліщі, що бігають, мухи (що жалять і що лижуть), личинки мух, що паразитують, волосяні і пір'яні воші, і блохи. До цих паразитів належать:

З ряду Anoplurida, наприклад, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phtirus* spp., *Solenopotes* spp.

З ряду Mallophagida і підряду Amblycerina а також Ischnocerina, наприклад, *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Damalina* spp., *Trichodectes* spp., *Felicola* spp.

З ряду Diptera і підзагону Nematocera а також Brachycera, наприклад, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Simulium* spp., *Eusimulium* spp., *Phlebotomus* spp., *Lutzomyia* spp., *Culicoides* spp., *Chrysops* spp., *Hybomitra* spp., *Atylotus* spp., *Tabanus* spp., *Haematopota* spp., *Philipomyia* spp., *Braula* spp., *Musca* spp., *Hydrotaea* spp., *Stomoxys* spp., *Haematobia* spp., *Morellia* spp., *Fannia* spp., *Glossina* spp., *Calliphora* spp., *Lucilia* spp., *Chrysomya* spp., *Wohlfahrtia* spp., *Sarcophaga* spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Gasterophilus* spp., *Hippobosca* spp., *Lipoptena* spp., *Melophagus* spp.

З ряду Siphonaptera, наприклад, *Pulex* spp., *Ctenocephalides* spp., *Xenopsylla* spp., *Ceratophyllus* spp.

З ряду Heteropterida, наприклад, *Citex* spp., *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus* spp.

З ряду Blattaria, наприклад, *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blattella germanica*, *Supella* spp.

З підкласу Acaria (Acarida) і ряду, Meta- а також Mesostigmata, наприклад, *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Otobius* spp., *Ixodes* spp., *Amblyomma* spp., *Boophilus* spp., *Dermacentor* spp., *Haemophysalis* spp., *Hyalomma* spp., *Rhipicephalus* spp., *Dermanyssus* spp., *Raillietia* spp., *Pneumonyssus* spp., *Sternostoma* spp., *Varroa* spp.

З ряду Actinieda (Prostigmata) і Acaridida (Astigmata), наприклад, *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Ornithocheyletiella* spp., *Myobia* spp., *Psorergates* spp., *Demodex* spp., *Trombicula* spp., *Listrophorus* spp., *Acarus* spp., *Tyrophagus* spp., *Caloglyphus* spp., *Hypodectes* spp., *Pterolichus* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Otodectes* spp., *Sarcoptes* spp., *Notoedres* spp., *Knemidocoptes* spp., *Cytodites* spp., *Lamlnosioptes* spp.

Згідно з винаходом активні речовини придатні також для боротьби з членистоногими, що нападають на сільськогосподарських корисних тваринах, як наприклад, велику рогату худобу, овець, кіз, коней, свиней, ослів, верблюдів, буйволів, кроликів, курок, індичок, вуток, гусаків, бджіл, інших домашніх тварин, як наприклад, собак, кішок, птахів, акваріумних кімнатних риб, а також так званих піддослідних тварин, як наприклад, хом'яки, морські свинки, пацюки і миші. При застосуванні активних речовин представленого винаходу зменшуються випадки смерті і зменшення продуктивності (по м'ясу, молоку, вовні, шкірі, яйцям, медові і так далі) за рахунок боротьби з цими членистоногими, що робить утримання тварин більш економічним і простим.

Активні речовини представленого винаходу застосовують у ветеринарії відомими способами шляхом їх ентерального введення у формі, наприклад, таблеток, капсул, пійла, киселів, гранулятів, паст, болісців, через харчування, супозиторіїв, паретеральне введення, як наприклад, ін'єкція (внутрішньом'язово, підшкірно, внутрішньовенно, внутрішньобрюшинно і так далі), імплантатів, назально, трансдермально, наприклад шляхом занурення або ванн (занурення у рідину), обприскування (аерозоль), настоянки (для обливання і нанесення плям), миття, опудрення, а також за допомогою формованих тіл, що містять активну речовину, таких як наміста,- вушні

і хвостові клейма, окови або бандажі для кінцівок, недоуздки, маркіруючи пристрої і так далі.

При застосуванні для худоби, домашніх птахів, домашніх тварин і так далі, активні речовини у виді препаративних форм (приміром, порошки, емульсії, засоби, що поліпшують плинність), що містять активні речовини в кількості від 1 до 80мас.%, їх можна застосовувати безпосередньо або після від 100 до 10000-кратного розведення або використовувати їх у виді хімічних ванн.

Крім того, було знайдено, що сполуки представленого винаходу мають високу інсектицидну дію проти комах, що руйнують технічні матеріали.

Як переважні приклади, що не обмежує представлений винахід, можна вказати наступних комах:

Жуки, такі як

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

Перетинчастокрилі, такі як

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

Терміти, такі як

Kaloterms flavicollis, *Cryptoterms brevis*, *Heteroterms indicola*, *Reticuliterms flavipes*, *Reticuliterms santonensis*, *Reticuliterms lucifugus*, *Mastoterms darwiniensis*, *Zootermopsis nevadensis*, *Coptoterms formosanus*.

Щетинохвостки, такі як *Lepisma saccharina*.

Під технічними матеріалами варто розуміти переважно синтетичні матеріали, адгезиви, клеї, папір і картон, шкіру, деревину, продукти деревообробки і фарби.

При захисті матеріалів від поразки комахами особливо переважно мова йде про захист деревини і продуктів деревообробки.

Під деревиною і продуктами деревообробки, - що можуть захищатися засобами представленого винаходу і відповідно сумішам, що їх містять, потрібно розуміти приблизно наступне:

стройовий ліс, дерев'яний брус, залізничні шпали, мостові частини, причали, човни, дерев'яні транспортні засоби, шухляди, палітри, контейнери, телефонні щогли, дерев'яні панелі, дерев'яні вікна і дерев'яні двері, дерев'яні загородження, тирса, столярні роботи або дерев'яна продукція, що знаходить загальне застосування, при будівництві домів або в будівельній столярній майстерні.

Активні речовини можуть застосовуватися як самі по собі, у формі концентратів або в звичайних препаративних формах, таких як порошки, грануляти, розчини, суспензії, емульсії або пасти.

Згадані форми можуть вироблятися відомими способами, наприклад, змішуванням активних речовин із щонайменше, одним розчинником і відповідно розріджувачем, емульгатором, диспергатором і/або зв'язуючим або фіксуючим засобом, репелентом від води, при необхідності, сикативом і УФ-стабілізаторами і, при необхідності барвниками і пігментами, а також іншими допоміжними засобами.

Згідно з винаходом при використанні для захисту деревини і дерев'яних матеріалів інсектицидними засобами або концентратами, що їх містять, концентрація активної речовини становить від 0,0001 до 95мас.%, зокрема, від 0,001 до 60мас.%.

Кількість призначених засобів і відповідно концентратів залежить від виду і наявності комах а також від середовища. Оптимальну кількість можна встановити рядом відповідних іспитів. Проте, в основному досить від 0,0001 до 20мас.%, переважно від 0,001 до 10мас.%, активної речовини стосовно матеріалу, що захищається.

Як розчинники і/або розріджувачі використовують органічні хімічні розчинники або суміш розчинників, і/або маслянисті або низькомаслянисті важко леткі органічні хімічні розчинники або суміш розчинників, і/або полярні органічні хімічні розчинники або суміш розчинників, і/або воду і, при необхідності, емульгатор і/або змочувальний засіб.

У якості органічних хімічних розчинників використовують маслянисті або низькомаслянисті розчинники з числом випару більше 35 і температурою спалаху переважно вище 30°C, переважно понад 45°C. В якості таких важко летких, водонерозчинних, маслянистих і низькомаслянистих розчинників використовують відповідні мінеральні олії або фракції ароматичних сполук або мінеральнонафтові суміші розчинників, переважно уайт-спирит, гас і/або алкілбензол.

Вигідно використовувати мінеральні олії з межею кипіння від 170 до 220°C, уайт-спирит з межею кипіння від 170 до 220°C, веретенну олію з межею кипіння від 250 до 350°C, гас і відповідно ароматичні сполуки з межею кипіння від 160 до 280°C, скипидар і інші.

У кращій формі виконання використовують рідкі аліфатичні вуглеводні з температурою кипіння від 180 до 210°C, або висококиплячі суміші ароматичних і аліфатичних вуглеводнів з температурою кипіння від 180 до 220°C, і/або веретенну олію, і/або монохлорнафталін, переважно α -монохлорнафталін.

Органічні важколеткі маслянисті або низько маслянисті розчинники з числом випару більше 35 і температурою спалаху вище 30°C, переважно вище 45°C, частково можуть замінюватись легко або середньолетким хімічним органічним розчинником, за умови, що суміш розчинників має число випару також більш 35 і температуру спалаху вище 30°C, переважно вище 45°C, і що інсектицидно-фунгіцидна суміш здатна розчинятись або утворювати емульсію в цій суміші розчинників.

У переважному виконанні частина хімічного органічного розчинника або суміші розчинників, або аліфатичного

полярного хімічного органічного розчинника або суміші розчинників замінюється. Переважно використовуються аліфатичні хімічні органічні розчинники, що містять гідрокси-, і/або естерні, і/або еерні групи, наприклад гліколевий етер, естер і інші.

В якості хімічного органічного зв'язуючого у рамках даного винаходу використовують водорозчинні або здатні до диспергування і відповідно здатні до емульгування в зазначених органічно-хімічних розчинниках синтетичні смоли, і/або обов'язкові олії, що висихають, зокрема, що зв'язують, що складається з або містить акрилатні смоли, вінільні смоли, наприклад, полівінілацетат, поліетерні смоли, поліконденсаційні або ступінчасто полімеризовані смоли, поліуретанові смоли, алкідні смоли і відповідно модифіковані алкідні смоли, фенольні смоли, вуглеводні смоли, такі як інден-кумаронова смола, силіконові смоли, що висихають, рослинні і/або тверді олії, що висихають, і/або фізичні зв'язуючі, що висихають, на основі натуральної і/або синтетичної смоли.

Використовувана в якості зв'язуючого синтетична смола може використовуватися у формі емульсії, дисперсії або розчину. Як зв'язуюче можна також використовувати бітум або до 10мас.% бітумної субстанції. Додатково можуть використовуватися відомі барвники, пігменти, водовідштовхувальні засоби, коригенти запаху, інгібітори, антикорозійні засоби і інші.

Переважає згідно з винаходом засіб або концентрат в якості хімічного органічного зв'язуючого містить, щонайменше, одну алкідну смолу або модифіковану алкідну смолу і/або рослинну олію, що висихає. Переважає згідно з винаходом використовують алкідні смоли з вмістом смоли від більш ніж 45мас.%, переважно від 50 до 68мас.%.

Згадане зв'язуюче може замінюватися цілком або частково фіксуємим засобом (сумішшю) або пластифікатором (сумішшю). Ці добавки повинні запобігати випаровуванню активних речовин, а також відповідно їхній кристалізації. Переважає вони попереджають відшкодовують від 0,01 до 30% зв'язуючого (по відношенню до 100% призначеного зв'язуючого).

Пластифікатори вибирають з хімічних сполук: естерів фталевої кислоти, таких як дибутил-, діоктил- або бензилбутилфталат, естерів фосфорної кислоти, таких як трибутилфосфат, естерів адипінової кислоти, як ди-(2-етилгексил)адипат, стеаратів, таких як бутилстеарат або амілстеарат, олеатів, як бутилолеатів, етерів гліцерину або вичмолекулярних гліколевих етерів, естерів гліцерину, а також естерів п-толуолсульфокислоти.

Фіксуємі засоби на основі полівінілалкілових етерів, як наприклад, полівінілметиловий етер, або кетонів, як бензофенон, етиленбензофенон.

Як розчинник або розріджувач використовують воду, при необхідності, у суміші з одним або декількома вищезгаданими хімічними органічними розчинниками і відповідно розріджувачами, емульгаторами і диспергаторами.

Особливо ефективний захист деревини досягається високотехнічними способами просочення, наприклад, під вакуумом, подвійним вакуумом або під тиском.

Готові до застосування засоби можуть містити, при необхідності, інші інсектициди і, при необхідності, ще один або кілька фунгіцидів.

Як додаткові компоненти приймаються до уваги переважно описані в Міжнародній заявці WO 94/29268 інсектициди і фунгіциди. Згадані в цьому документі сполуки є складовою частиною даної заявки.

Виключно особливо переважними додатковими компонентами можуть бути інсектициди, як Хлорпірифос, Фоксим, Силафлуофін, Альфаметрин, Цифлутрин, Циперметрин, Дельтаметрин, Перметрин, Імадаклопід, NI-25, Флуфеноксурон, Гексафлумурон, Трансфлутрин, Тіаклопід, Метоксифеноксид і Трифлумурон,

а також фунгіциди, як Епоксиконазол, Гексаконазол, Азаконазол, Пропіконазол, Тебуконазол, Ципроконазол, Метконазол, Імазалил, Дихлорфлуанід, Толілфлуанід, 3-Йод-2-пропілбутилкарбамат, N-Октил-ізотіазолін-3-он і 4,5-дихлор-N-октилізотіазолін-3-он.

Одночасно сполуки винаходу можуть використовуватися для захисту від орання предметів, зокрема, корпусів кораблів, сит і фільтрів, міток, споруджень, причальних споруджень і сигнальних пристроїв, що стикаються з морською або жорсткою водою.

Обростання сидячими малоцетинковими хробаками, такими як вапняні трубчасті хробаки, а також раковинами і різновидами групи Ledamorpha (морські уточки), такими як різні Lepas- і Scalpellum - види, або різновидами групи Balanomorpha (морські жолуді), такими як Balanus- або Pollicipes-види, підвищує тертя опору кораблів і веде, у результаті, до підвищеного споживання енергії і, виходячи з цього, частому перебуванню в сухому доці і росту витрат виробництва.

Поряд із заростанням водоростями, приміром, Ectocarpus sp. і Ceramium sp., велике значення має заростання, зокрема, сидячими групами Entomostraken, що об'єднані під назвою Cirripedia (усонорі) (усонорі ракоподібні).

Несподівано було знайдено, що описувані в представленому винаході сполуки мають самі по собі або в комбінації з іншими активними речовинами чудову дію по запобіганню обростанню.

Уведення сполук представленої винаходу самостійно або в комбінації з іншими активними речовинами дозволяє відмовитися від використання сполук важких металів, таких як сульфід біс(триалкілолова), лаурат три-н-бутилолова, хлорид три-н-бутилолова, оксид міді (I), триетиловохлорид, три-н-бутил(2-феніл-4-хлорфеноксид)олово, оксид трибутилолова, дисульфід молібдену, оксид сурми, полімер бутилтитанату, феніл(биспіридин)хлорид вісмуту, фторид три-н-бутилолова, етиленбістіокарбамат марганцю, цинкдиметилдітіокарбамат, цинкетиленбістіокарбамат, цинкові і мідні солі 2-піридинтіол-1-оксиду, бісдиметилдітіо-карбамоїлцинкетиленбістіокарбамат, оксид цинку, етиленбісдітіокарбамат міді (I), тіоціанат міді, нафтенат міді і трибутиловогалогенід, або значно знизити їх концентрацію.

Готові до застосування барвники, що використовуються для запобігання обростанню, при необхідності, можуть містити інші активні речовини, переважно альгіциди (проти обростання водоростями), фунгіциди, гербіциди, моллюскоциди і відповідно інші активні речовини, що використовуються для запобігання обростанню.

Як партнери в комбінації згідно з винаходом в якості засобів, що використовуються для запобігання обростанню, переважно підходять:

Альгіциди, такі як

2-трет-бутиламіно-4-циклопропіламіно-6-метилтіо-1,3,5-триазин, дихлофен, діурон, Ендотал, Фентинацетат, Ізопротурон, Метабензтіазурон, Оксифлуорфен, Хінокламін і Тербутрин;

Фунгіциди, такі як

Циклогексиламід 8,3-діоксидбензо[б]тіофенкарбонової кислоти, Дихлорфлуамід, Флуорфолпет, 3-йод-2-пропініл-бутилкарбамат, Толілфлуанід і азоли, такі як

Азаконазол, Ципроконазол, Епоксиконазол, Гексаконазол, Метконазол, Пропіконазол і Тебуконазол; Моллюскоциди, такі як

Фентинацетат, Метальдегід, Метіокарб, Никлозамід, Тіодикарб і Триметакарб; або звичайні активні речовини, що використовуються для запобігання обростанню, такі як

4,5-дихлор-2-октил-4-ізотіазолін-3-он, Дийодметилпаратрилсульфон,

2-(N,N-диметилтіокарбамоїлтію)-5-нітротіазил, калієва, мідна, натрієва і цинкова солі 2-піридинтіол-1-оксиду, піридинтрифенілборану, тетрабутилдистановсан, 2,3,5,6-тетрахлор-4-(метилсульфоніл)піридин,

2,4,5,6-тетрахлорізофталонітріл, тетраметилтіурамдисульфід і 2,4,6-трихлорфенілмалеїнімід.

Використовувані засоби, що використовуються для запобігання обростанню, містять згідно з винаходом активні речовини представленого винаходу в концентрації від 0,001 до 50мас.%, зокрема, від 0,01 до 20мас.%. Згідно з винаходом засоби, що використовуються для запобігання обростанню, містять далі звичайні компоненти, як наприклад описані в *lingerer, Chem. Ind. 1985, 37, 730-732* і *Williams, Antifouling Marine Coatings, Noyes, Park Ridge, 1973*.

Фарби, що використовуються для запобігання обростанню, містять, поряд з альгіцидами, фунгіцидами, моллюскоцидами і інсектицидними активними речовинами представленого винаходу, зокрема, зв'язуюче.

Прикладами визнаних зв'язуючих є полівінілхлорид у системі розчинників, хлорований каучук у системі розчинників, акрилова смола в системі розчинників, зокрема, у водній системі, співполімерна система вінілхлорид/вінілацетат у формі водної дисперсії або у формі системи органічних розчинників, бутадіон/стирол/акрилонітрильний каучук, олії, що висихають, такі як олія льону, етерні смоли або модифіковані тверді смоли в комбінації з дьогтем або бітумом, асфальт, а також епоксидні сполуки, незначні кількості хлоркаучуку, хлорований поліпропілен і вінільні смоли.

При необхідності, фарби містять також неорганічні пігменти, органічні пігменти або барвники, що переважно не розчинні в морській воді. Далі, фарби можуть містити матеріали, такі як каніфоль, що забезпечують регульоване вивільнення активних речовин. Далі фарби можуть містити пластифікатор, модифікатори, що впливають на реологічні властивості, а також інші звичайні компоненти. Сполуки представленого винаходу або вищезгаданих сумішей можуть вводитися в само полірувальні системи, що запобігають біологічному обростанню.

Активні речовини придатні також для боротьби зі шкідниками тварин, зокрема, з комахами, паукоподібними і кліщами, що, крім всього іншого, живуть у закритих приміщеннях, як наприклад, квартири, заводські цехи, офіси, кабінки транспортних засобів. Вони можуть використовуватися для боротьби з цими шкідниками самі по собі або в комбінації з іншими активними речовинами і допоміжними матеріалами. Вони ефективні проти чутливих і витривалих видів, а також проти всіх стадій їхнього розвитку. До цих шкідників належать:

3 ряду *Scorpionidea*, наприклад, *Buthus occitanus*.

3 ряду *Acarina*, наприклад, *Argas persicus*, *Argas reflexus*, *Bryobia ssp.*, *Dermanyssus gallinae*, *Glyciphagus domesticus*, *Ornithodoros moubat*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Trombicula alfreddugesi*, *Neutrombicula autumnalis*, *Dermatophagoides pteronissimus*, *Dermatophagoides forinae*.

3 ряду *Araneae*, наприклад, *Aviculariidae*, *Araneidae*.

3 ряду *Opiliones*, наприклад, *Pseudoscorpiones chelifer*, *Pseudoscorpiones cheiridium*, *Opiliones phalangium*.

3 ряду *Isopoda*, наприклад, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*

3 ряду *Diplopoda*, наприклад, *Blaniulus guttulatus*, *Polydesmus spp.*

3 ряду *Chilopoda*, наприклад, *Geophilus spp.*

3 ряду *Zygentoma*, наприклад, *Ctenolepisma spp.*, *Lepisma saccharina*, *Lepismodes inquilinus*.

3 ряду *Blattaria*, наприклад, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Blattella asahinai*, *Leucophaea maderae*, *Panchlora spp.*, *Parcoblatta spp.*, *Periplaneta australasiae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Supella longipalpa*.

3 ряду *Sanatoria*, наприклад, *Acheta domesticus*.

3 ряду *Dermaptera*, наприклад, *Forficula auricularia*.

3 ряду *Isoptera*, наприклад, *Kaloterms spp.*, *Reticuliterms spp.*

3 ряду *Psocoptera*, наприклад, *Lepinatus spp.*, *Liposcelis spp.*

3 ряду *Coleptera*, наприклад, *Anthrenus spp.*, *Attagenus spp.*, *Dermestes spp.*, *Latheticus oryzae*, *Necrobia spp.*, *Ptinus spp.*, *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus granarius*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Stegobium paniceum*.

3 ряду *Diptera*, наприклад, *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes taeniorhynchus*, *Anopheles spp.*, *Calliphora erythrocephala*, *Chrysozona pluvialis*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex pipiens*, *Culex tarsalis*,

Drosophila spp., *Fannia canicularis*, *Musca domestica*, *Phlebotomus* spp., *Sarcophaga carnaria*, *Simulium* spp., *Stomoxys calcitrans*, *Tipula paludosa*.

3 ряду *Lepidoptera*, наприклад, *Achroia grisella*, *Galleria mellonella*, *Plodia interpunctella*, *Tinea cloacella*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*.

3 ряду *Siphonaptera*, наприклад, *Ctenocephalides cam's*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, *Xenopsylla cheopis*.

3 ряду *Hymenoptera*, наприклад, *Camponotus herculeanus*, *Lasius fuliginosus*, *Lasius niger*, *Lasius umbratus*, *Monomorium pharaonis*, *Paravespula* spp., *Tetramorium caespitum*.

3 ряду *Anoplura*, наприклад, *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Phthirus pubis*.

3 ряду *Heteroptera*, наприклад, *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Rhodinus prolixus*, *Triatoma infestans*.

У домашнім господарстві інсектициди застосовують самі по собі або в комбінації з іншими активними речовинами, такими як естери фосфорних кислот, карбамати, піретроїди, регулятори росту або активні речовини інших відомих класів інсектицидів.

Застосування здійснюють у формі аерозолі, мілкокрапельного обприскування без тиску, наприклад, розпилення за допомогою насоса і пульверизатора, автоматичного тумана, туманів, пін, гелів, випару за допомогою випарних пластинок з целюлози або пластмаси, рідинних випарників, гелевих і мембранних випарників, пропелерних випарників, неенергійних, наприклад пасивних систем випару, паперу для молі, мішечків для молі і гелів для молі, у виді гранулятів або пилу в приманюючих підстилках, або приманюючих станціях.

Активні, речовини представленого винаходу можуть використовуватися як дефоліанти, десиканти, засобу, що знищують трави, і, зокрема, що знищують бур'яни. Під бур'янами в самому широкому змісті потрібно розуміти всі рослини, що виростають у місцях, де вони небажані. Дія речовини представленого винаходу як тотального або селективного гербіциду залежить, власне кажучи, від застосовуваних кількостей.

Активні речовини представленого винаходу можуть використовуватися, наприклад, для наступних рослин:

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

Дводольні культури видів: *Arachis*, *Beta*, *Brassica*, *Cucumis*, *Cucurbita*, *Helianthus*, *Daucus*, *Glycine*, *Gossypium*, *Ipomoea*, *Lactuca*, *Linum*, *Lycopersicon*, *Nicotiana*, *Phaseolus*, *Pisum*, *Solanum*, *Vicia*.

Однодольні бур'яни видів: *Aegilops*, *Agropyron*, *Agrostis*, *Alopecurus*, *Apera*, *Avena*, *Brachiaria*, *Bromus*, *Cenchrus*, *Commelina*, *Cynodon*, *Cyperus*, *Dactyloctenium*, *Digitaria*, *Echinochloa*, *Eleocharis*, *Eleusine*, *Eragrostis*, *Eriochloa*, *Festuca*, *Fimbristylis*, *Heteranthera*, *Imperata*, *Ischaemum*, *Leptochloa*, *Lolium*, *Monochoria*, *Panicum*, *Paspalum*, *Phalaris*, *Phleum*, *Poa*, *Rotlboellia*, *Sagittaria*, *Scirpus*, *Setaria*, *Sorghum*.

Дводольні культури видів: *Allium*, *Ananas*, *Asparagus*, *Avena*, *Hordeum*, *Oryza*, *Panicum*, *Saccharum*, *Secale*, *Sorghum*, *Triticale*, *Triticum*, *Zea*.

Проте, застосування активних речовин представленого винаходу ні в якому разі не обмежено цими видами, а простирається рівним способом також і на інші рослини.

Активні речовини представленого винаходу підходять, у залежності від концентрації, для тотальної боротьби з бур'янами, наприклад, на промислових спорудах і рейкових шляхах, на дорогах і площах з і без деревної рослинності. Так само активні речовини даного винаходу можуть використовуватися для боротьби з бур'янами багаторічних культур, наприклад таких, як ліс, декоративні і фруктові дерева, виноградники, цитрусові культури, горіх, банани, кава, чай, каучуконоси, олійні пальми, какао, ягоди і хміль, на декоративних і спортивних газонах і пасовищах, а також для селективної боротьби з бур'янами однолітніх культур.

Сполуки представленого винаходу виявляють високу гербіцидну ефективність і широкий спектр дії при застосуванні на ґрунті і на надземних частинах рослин. У визначеному обсязі вони підходять також для селективної боротьби з однодольними і дводольними бур'янами однодольних і дводольних культур як для досиховної, так і для післясиховної обробки.

Активні речовини представленого винаходу можуть використовуватися у визначених концентраціях і відповідних видаткових кількостях також для боротьби зі шкідниками тварин і грибковими або бактеріальними хворобами рослин. Їх можна також використовувати, при необхідності, як проміжні продукти або прекурсори при синтезі інших активних речовин.

Згідно з винаходом можна обробляти всю рослину або частини рослин. При цьому під рослинами розуміються всі рослини і популяції рослин, як бажані, так і небажані дикі рослини або культурні рослини (включаючи, звичайно, випадкові культурні рослини). Культурні рослини можуть бути отриманими звичайними методами селекції і оптимізації або біотехнологічними і генно-інженерними методами або комбінаціями цих методів, включаючи трансгенні рослини і включаючи сорти рослин що захищаються або що не захищаються. Під частинами рослин повинні розумітися всі надземні і підземні частини і органи рослин, такі як парості, листя, суцвіття і корені, наприклад листя, голки, стебла, стовбури, квіти, плодові тіла, плоди і насіння, а також корені, бульби і кореневища. До частин рослин належить також врожай, а також вегетативний і генеративний матеріал розмноження, приміром, черешки, бульби, кореневища, відгалуження і насіння.

Згідно з винаходом обробку рослин і частин рослин активними речовинами здійснюють безпосередньо або впливом на навколишнє їхнє середовище, життєвий простір або місця збереження після звичайних методів

обробки, наприклад, зануренням, розбризкуванням, випаром, розпиленням, розсіюванням, змазуванням і, у випадку матеріалу для розмноження, зокрема, для насіння, одношаровим або багатшаровим обволіканням або укутуванням.

Як вже вказувалось вище, відповідно до винаходу, можна обробляти всю рослину і її частини. У кращому варіанті здійснення проводять обробку отриманих або культивованих звичайними біологічними методами, таким як схрещування або гібридизація, або отриманих злиттям протопластів видів і сортів рослин, а також їх частин. У подальшій кращій формі здійснення обробляють трансгенні рослини і сорти рослин, що отримані генно-інженерними методами, при необхідності, у комбінації зі звичайними методами, (Genetic Modified Organisms) і їх частини. Поняття "частина" і відповідно "частина рослин" або "рослинні частини" роз'яснялося вище.

Особливо переважно згідно з винаходом обробляти звичайно застосовувані або, що знаходяться у вживанні, сорти рослин.

У залежності від видів рослин і відповідно сортів рослин, місцезнаходження і умов росту (ґрунт, клімат, вегетативний період, харчування) при обробці згідно з представленим винаходом можна досягти синергічного ефекту. У такий спосіб можливо досягти, наприклад, зниження використовуваних кількостей, і/або розширення спектра дії, і/або посилення дії застосовуваних згідно з винаходом матеріалів і засобів, поліпшення росту рослин, підвищення толерантності стосовно високих або низьких температур, підвищення толерантності стосовно посухи або вологості і відповідно вмісту солей в ґрунті, підвищеного цвітіння, полегшеного збирання врожаю, прискорення визрівання, підвищення врожайності, підвищення якості і/або продовольчої цінності продуктів врожаю, підвищення зберігаємості і/або оброблюваності продуктів врожаю, що перевищують власні очікувані ефекти.

До переважних оброблюваних згідно з винаходом трансгенних (одержаних методами генної інженерії) рослин і відповідно сортам рослин належать усі рослини, що одержали за допомогою генноінженерної модифікації генетичного матеріалу, що дає цим рослинам особливо вигідні якості ("ознаки"). Прикладами таких якостей є поліпшений ріст рослин, підвищена толерантність стосовно високих або низьких температур, підвищена толерантність (стійкість) до посухи або вологості і відповідно вмісту солей в ґрунті, підвищення цвітіння, полегшення збирання врожаю, прискорення визрівання, підвищення врожайності, підвищення якості і/або продовольчої цінності продуктів врожаю, підвищення зберігаємості і/або оброблюваності продуктів врожаю. Наступними прикладами таких якостей, що підкреслюються особливо, є підвищений захист рослин від тваринних і мікробних шкідників, таких як комахи, кліщі, фітопатогенні гриби, бактерії і/або віруси, а також підвищена толерантність рослин проти визначених речовин із гербіцидною активністю. Як приклади трансгенних рослин особливо підкреслюються важливі культурні рослини, такі як зернові (пшениця, рис), кукурудза, соя, картопля, бавовна, рапс, а також фруктові рослини (плодові - яблука, груші, цитрусові і виноград), причому кукурудза, соя, картопля, бавовна і рапс особливо. Як цінні якості ("ознаки") особливо підкреслюються підвищений захист рослин від комах токсинами, що виникають у рослинах, зокрема, що продукуються в рослинах генетичним матеріалом (наприклад продукуються генами CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb і CryIF, а також їх комбінаціями) (надалі "Bt рослини"). Як цінні якості ("ознаки") особливо підкреслюються далі підвищена толерантність рослин стосовно визначених речовин з гербіцидною активністю, наприклад, імідазолинонам, сульфонілсечовинам, глифозату або фосфінотрицину (наприклад, "PAT"-ген). Відповідно передаються бажані якості ("ознаки") гени можуть також зустрічатися в комбінаціях один з одним у трансгенних рослинах. Як приклади "Bt рослини" вказуються сорти кукурудзи, сорти бавовни, сорти сої і сорти картоплі, що реалізуються під торговельними назвами YIELD GARD® (наприклад, кукурудза, бавовна, соя), KnockOut® (наприклад, кукурудза), StarLink® (наприклад, кукурудза), Bollgard® (бавовна), Nucleon® (бавовна) і NewLeaf® (картопля). Прикладами толерантних стосовно гербіцидів рослин є сорти кукурудзи, сорти бавовни і сорти сої, що реалізуються під торговельними назвами Roundup Ready® (толрантність стосовно глифозату, наприклад, кукурудза, бавовна, соя), Liberty Link® (толрантність стосовно фосфінотрицину, наприклад, рапс), IMI® (толрантність стосовно імідазолинону) і STS® (толрантність стосовно сульфонілсечовини, наприклад, кукурудза). У якості резистентних стосовно гербіциду (звичайно культивуємих на гербіцидну толрантність) рослин згадуються також сорти, що реалізуються під назвами Clearfield® (наприклад, кукурудза). Усе сказане природно поширюється також і на сорти рослин з генетичними якостями ("ознаками"), що будуть розроблені в майбутньому і відповідно надійдуть у майбутньому на ринок.

Представлені рослини особливо переважно обробляти сполуками представленого винаходу формули (I). Кращою областю дії вищевказаних активних речовин вважається обробка рослин. Особливо підкреслюється обробка рослин спеціально представленими в даному тексті сумішами.

Активні речовини можуть переводитися в звичайні препаративні форми, такі як розчини, емульсії, порошки, що змочуються, суспензії, порошки, пилоподібні препарати, пасти, розчинні порошки, грануляти, суспензійно-емульсійні концентрати, просочені активною речовиною природні і синтетичні матеріали, а також тонкоінкапсульовані в полімерних матеріалах форми.

Ці препаративні форми роблять відомими способами, наприклад, змішуванням активних речовин з наповнювачами, такими як рідкі розчинники і/або тверді носії, при використанні, при необхідності, поверхнево-активних речовин, таких як емульгатори і/або диспергатори і/або піноутворювачі.

У випадку використання води, як наповнювача, можна наприклад використовувати, як допоміжні розчинники, органічні розчинники. Як рідкі розчинники можна використовувати: ароматичні сполуки, такі як ксилол, толуол, або алкілнафталіни, хлоровані ароматичні сполуки і хлоровані аліфатичні вуглеводні, такі як хлорбензол, хлоретилен або метиленхлорид, аліфатичні вуглеводні, такі як циклогексан або парафіни, наприклад, фракції

нафти, мінеральні і рослинні олії, спирти, такі як бутанол або гліколь, а також їх етери і естери, кетони, такі як ацетон, метилетилкетон, метилізобутилкетон або циклогексанон, сильно полярні розчинники, як диметилформамід і диметилсульфоксид, а також воду.

Як тверді носії використовують, наприклад, солі амонію і природне кам'яне борошно, таке як каолін, глина, тальк, крейда, кварц, атапульгіт, монтмориллоніт або діатомова земля і синтетичне кам'яне борошно, таке як високодисперсна кремнієва кислота, оксид алюмінію і силікат, як тверді носії у гранулятах використовують: наприклад, подрібнені і фракціоновані природні гірські породи, як кальцит, мармур, пемза, сепіоліт, доломіт, а також синтетичні грануляти з неорганічного і органічного борошна, а також грануляти з органічного матеріалу, такого як тирса, шкарлупа кокосового горіха, початки кукурудзи і стебла тютюну; у якості емульгаторів і/або пеноутворювачів використовують: наприклад, неіонні і аніонні емульгатори, такі як естери поліоксietenжирних кислот, етери поліоксietenжирних спиртів, наприклад, алкіларилполігліколевий етер, алкілсульфонат, алкілсульфат, арилсульфонат, а також їх гідролізати; в якості диспергаторів використовують, наприклад, лігнінсульфат натрію і метилцелюлозу.

У препаративних формах можуть використовуватися засоби, що сприяють прилипанню, такі як карбоксиметилцелюлоза, природні і синтетичні порошкові, зернисті або латексоутворюючі полімери, такі як гумміарабік, полівініловий спирт, полівінілацетат, а також природні фосфоліпіди, як кефалін і лецитин, і синтетичні фосфоліпіди. Наступними добавками можуть бути мінеральні і рослинні олії.

Як барвники можуть бути використані як неорганічні пігменти, наприклад, окис заліза, оксид титану, Берлінська лазур і органічні барвники, такі як алізаринові, азо- і металфталоціанінові барвники і живильні мікроелементи, такі як солі заліза, марганцю, бору, міді, кобальту, молібдену і цинку.

Препаративні форми містять в основному 0,1-95мас.% активної речовини, переважно 0,5-90%.

Згідно з винаходом активні речовини можуть використовуватися самостійно або в їх препаративних формах, а також у суміші з відомими гербіцидами і/або матеріалами, що поліпшують сумісність культурних рослин при боротьбі з бур'янами, причому можна використовувати готові препаративні форми або приготовлені суміші. Можливі також суміші з гербіцидними засобами, що містять один або кілька відомих гербіцидів і антидот. Прикладами використовуваних для сумішей відомих гербіцидів є Ацетохлор, Актифлуофен (-натрій), Аклоніфен, Алахлор, Аллоксидим (-натрій), Аметрин, Амікарбазон, Амідохлор, Амідосульфурон, Анілофос, Азулам, Атразин, Азафенідин, Азимсульфурон, BAS-662H, Бефлбутамід, Беназолін (-етил), Бенферизат, Бенсульфурон (-метил), Бентазон, Бензфендізон, Бензобіциклон, Бензофенап, Бензоілпроп (-етил), Біалафос, Біфенокс, Біспирибак (-натрій), Бромобутид, Бромовеноксим, Бромоксиніл, Бутахлор, Бутафенацил (-аліл), Бутроксидим, Бутилат, Кафенстрол, Калоксидим, Карбетамід, Карфентразон (-етил), Хлометоксифен, Хлорамбен, Хлорідазон, Хлорімурон (-етил), Хлорнітрофен, Хлорсульфурон, Хлортолурун, Цинідон (-етил), Цинметилін, Циносульфурон, Клефоксидим, Клетодим, Клодинафоп (-пропаргіл), Кломазон, Кломепроп, Клопиралід, Клопирасульфурон (-метил), Клорансулам (-метил), Кумулурун, Ціаназин, Цибутрин, Циклоат, Циклосульфамурун, Циклоксидим, Цигалофоп (-бутил), 2,4-D, 2,4-DB, Десмедифам, Діаллат, Дикамба, Дихлорпроп (-Р), Диклофоп (-метил), Диклосулам, Діетатил (-етил), Дифензокват, Дифлуфенікан, Дифлуфензопір, Димефурон, Димепіперат, Диметахлор, Диметаметрин, Диметенамід, Димексифлам, Динітрамін, Дифенамід, Дикват, Дитіопір, Діурун, Епроподан, ЕРТС, Еспрокарб, Еталфлуралін, Етаметсульфурон (-метил), Етофумесат, Етоксифен, Етоксисульфурон, Етобензанід, Феноксапроб (-Р-етил), Фентразамід, Флампроп (-ізопропіл, -ізопропіл-L, -метил), Флазасульфурон, Флорасулам, Флуазифоп (-Р-бутил), Флуазоат, Флукарбазон (-натрій), Флуфенацет, Флуметсулам, Флуміклолак (-пентил), Флуміоксазин, Флуміпропін, Флуметсулам, Флуметурон, Флуорохлоридон, Флуороглікофен, (-етил), Флуорксам, Флупропацил, Флурпірсульфурон (-метил, -натрій), Флуренол (-бутил), Флуридон, Флуорксіпір (-бутоксіпропіл, -гептил), Флурпримідол, Флуртамон, Флутіацет (-метил), Флутіамід, Фомесафен, Форамсульфурон, Глюфозинат (-амоній), Гліфосад (-ізопропіламоній), Галосафен, Галоксифоп (-етоксіетил, -Р-метил), Гексазинон, Імазаметабенз (-метил), Імазаметатіп, Імазамокс, Імазапек, Імазапек, Імазаквін, Імазетатіп, Імазосульфурон, Йодосульфурон (-метил, -натрій), Іоксиніл, Ізопропалін, Ізопротурон, Ізоурун, Ізоксабен, Ізоксахлортол, Ізоксафлутол, Ізоксапірифоп, Лактофен, Ленацил, Лінурун, МСРА, Мекопроп, Мефенацет, Мезотрион, Метамітрон, Матазахлор, Метабензтіаурун, Метобензурун, Метобромурон, (альфа-) Метолахлор, Метосулам, Метоксурун, Метрибурун, Метсульфурон (-метил), Молінат, Монолінурун, Напроанілід, Напропамід, Небурун, Нікосульфурон, Норфлуразон, Орбенкар, Оризалін, Оксадіаргіл, Оксадіазон, Оксасульфурон, Оксакцикломефоп, Оксифлуорфен, Паракват, Пеларгонова кислота, Пендиметалін, Пендралін, Пентоксазон, Фенмедифам, Піколінафен, Піперофос, Претілахлор, Примісульфурон (-метил), Профлуазол, Прометрин, Пропахлор, Пропаніл, Пропаквізафоп, Пропізохлор, Пропоксикарбазон (-натрій), Пропізамід, Просульфокарб, Просульфурон, Прафлуфен(-етил), Піразоліл, Піразолат, Піразосульфурон (-етил), Піразоксифен, Пірибензоксим, Пірибутикарб, Піридат, Піридатол, Пірифталід, Піримінобак (-метил), Піритіобак (-натрій), Квінхлорак, Квінменрак, Квінокламін, Квізалофоп (-Р-етил, -Р-тефурил), Римсульфурон, Сетоксидим, Симазин, Симетрин, Сулькотрион, Сульфентразон, Сульфометурон (-метил), Сульфосад, Сульфосульфурон, Тебутам, Тебутіурун, Тепралоксидим, Тербутилазин, Тербутрин, Теніхлор, Тіафлуамід, Тіазопір, Тидіазимін, Тифенсульфурон (-метил), Тіобенкарб, Тіокарбазил, Тралоксидим, Тріалат, Тріасульфурон, Трібенурун (-метил), Тріклопір, Трідифан, Тріфлуралін, Тріфлорксісульфурон, трифлусульфурон (-метил), Тритосульфурон.

Також можлива суміш з іншими відомими активними речовинами, як фунгіцидами, інсектицидами, акарицидами, нематоцидами, речовинами, що захищають від птахів, живильними для рослин речовинами і засобами, що поліпшують структуру ґрунту.

Активні речовини можуть використовуватися як такі, у виді їх препаративних форм, або приготовлених з них

подальшим розведенням прикладних форм, таких як придатні до вживання розчини, суспензії, емульсії, порошки, пасти і грануляти. Застосування відбувається звичайним способом, наприклад, поливанням, обприскуванням, розпиленням, мілкокрапельним розбризкуванням, розкиданням.

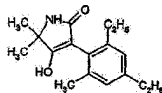
Активні речовини представленого винаходу можуть застосовуватися як перед, так і після появи сходів рослин. Вони можуть також вводитися в ґрунт перед посівом.

Видаткова кількість активної речовини може мінятися в широкому діапазоні. Воно залежить власне кажучи від виду бажаного ефекту. В основному- використовувана кількість становить від 1г до 10кг активної речовини на гектар земельної площі, переважно від 5г до 5кг на гектар.

Одержання і застосування активних речовин представленого винаходу ілюструється наступними прикладами.

Приклади виготовлення

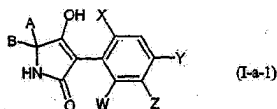
Приклад I-1-a-1



До 6,5г трет-бутилату калію в 25мл безводного диметилформаміду (ДМФА) прикапують при 60°C 7,4г сполуки відповідно до прикладу II-I, розчиненої в 1мл безводного ДМФА і далі перемішують, котнролюючи хід реакції за допомогою тонкошарової хроматографії. Після закінчення реакції додають 170мл води з льодом, підкисляють концентрованою соляною кислотою при від 0°C до 10°C до pH 2, потім відсмоктують і промивають водою з льодом. Залишок очищають за допомогою хроматографії на силікагелі з метиленхлорид/метанол 9:1 як розчинник.

Вихід: 3,90г (≈58,00% від теорії), Т.пл. 199°C

За аналогією з прикладом (I-1-a-1) і відповідно до загальних вказівок до способу одержання одержують наступні сполуки формули (I-a-1)

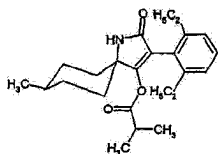


Bsp.-№.	W	X	Y	Z	A	B	Fp.°C	Isomer
I-1-a-2	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂		154	β
I-1-a-3	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCCH ₃ -(CH ₂) ₂		225	β
I-1-a-4	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	200	-
I-1-a-5	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂		115	β
I-1-a-6	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCCH ₃ -(CH ₂) ₂		222	β
I-1-a-7	i-C ₃ H ₇	i-C ₃ H ₇	i-C ₃ H ₇	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCCH ₃ -(CH ₂) ₂		>230	β
I-1-a-8	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	>220	-

Bsp.-№.	W	X	Y	Z	A	B	Fp.°C	Isomer
I-1-a-9	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂		114	β
I-1-a-10	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂		>220	β
I-1-a-11	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂		>220	-
I-1-a-12	CH ₃	C ₂ H ₅	H	H	CH ₃	CH ₃	109	-
I-1-a-13	CH ₃	C ₂ H ₅	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂		216	β
I-1-a-14	H	CH ₃	H	i-C ₄ H ₉	CH ₃	CH ₃	160	-
I-1-a-15	H	CH ₃	H	C ₃ H ₇	-(CH ₂) ₂ -CHOCCH ₃ -(CH ₂) ₂		197	β
I-1-a-16	H	CH ₃	H	C ₃ H ₇	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂		193	β
I-1-a-17	H	CH ₃	H	i-C ₄ H ₉	-(CH ₂) ₂ -CHOCCH ₃ -(CH ₂) ₂		233	β
I-1-a-18	H	CH ₃	H	i-C ₄ H ₉	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂		184	β
I-1-a-19	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	-(CH ₂) ₂ -CHOCCH ₃ -(CH ₂) ₂		156	β
I-1-a-20	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂		168	β
I-1-a-21	CH ₃	CH ₃	-OCH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCCH ₃ -(CH ₂) ₂		127	β
I-1-a-22	H	CH ₃	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂		211	β
I-1-a-23	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂		210	β
I-1-a-24	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂		>220	-
I-1-a-25	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	192	-
I-1-a-26	H	CH ₃	H	C ₂ H ₅	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂		181	β
I-1-a-27	H	CH ₃	H	C ₂ H ₅	-(CH ₂) ₂ -CHOCCH ₃ -(CH ₂) ₂		222	β
I-1-a-28	CH ₃	CH ₃	CH=CH ₂	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCCH ₃ -(CH ₂) ₂		278	β
I-1-a-29	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCCH ₃ -(CH ₂) ₂		268	β
I-1-a-30	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCCH ₃ -(CH ₂) ₂		248	α

При цьому у вищевказаних і наступних таблицях позначення мають наступні значення: Bsp.-№ - Приклад №; Fp.°C - T_{пл}°C; Isomer - Ізомер; Öl - масло;

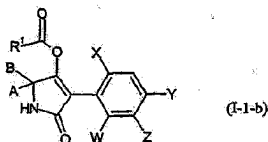
Приклад I-1-b-1



2,5г сполуки I-1-a-10 у 50мл безводного етилового естеру оцтової кислоти нагрівають з 1,7мл триетиламіну при перемішуванні із зворотнім холодильником і прикапують при перемішуванні 1,3мл хлорангідриду ізомасляної кислоти в 5мл безводного етилацетату, контролюючи хід реакції за допомогою тонкошарової хроматографії. Розчинник відганяють, залишок поглинають метиленхлоридом, промивають 50мл 0,5 N NaOH, сушать і упарюють на роторному випарнику. Потім залишок перекристалізують із системи метил-трет.-бутиловий етер (МТБ-етер)/н-гексан.

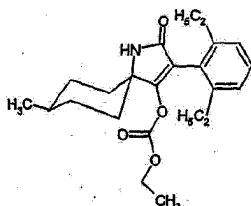
Вихід: 2г ($\approx 65\%$ від теорії), Т.пл. 209°C

За аналогією з прикладом (I-1-b-1) і відповідно до загальних вказівок до способу одержання одержують наступні сполуки формули (I-1-b)



Всп.-Nr.	W	X	Y	Z	A	B	R ¹	Рр.°С	Isomer
I-1-b-2	CH ₃	C ₂ H ₅	H	H	CH ₃	CH ₃	i-C ₃ H ₇	145	-
I-1-b-3	CH ₃	C ₂ H ₅	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		H ₃ C ₂ -O-CH ₂ -	135	Б
I-1-b-4	CH ₃	C ₂ H ₅	H	H	CH ₃	CH ₃	H ₃ C ₂ -O-CH ₂ -	76	-
I-1-b-5	H	CH ₃	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		i-C ₃ H ₇	201	Б
I-1-b-6	H	CH ₃	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		i-C ₄ H ₉	215	Б
I-1-b-7	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		i-C ₃ H ₇	190	-

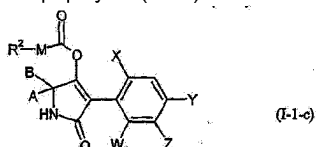
Приклад I-1-c-1



Беруть 2,51г сполуки формули I-1-a-10 і 1,2мл триетиламіну. При від 0 до 10°C прикапують 0,8мл етилового естеру хлормурашиної кислоти в 5мл безводного дихлорметану і перемішують при кімнатній температурі, контролюючи хід реакції за допомогою тонкошарової хроматографії. Промивають 0,5N NaOH, сушать і відганяють розчинник. Залишок перекристалізують із системи метил-трет.-бутиловий етер/н-гексан.

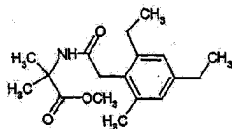
Вихід: 1,1г ($\approx 30\%$ від теорії), Т.пл. 178°C

За аналогією з прикладом (I-1-c-1) і відповідно до загальних вказівок до способу одержання одержують наступні сполуки формули (I-1-c)



Всп.-Nr.	W	X	Y	Z	A	B	M	R ²	Рр.°С	Isomer
I-1-c-2	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		O	C ₂ H ₅	194	Б
I-1-c-3	CH ₃	C ₂ H ₅	H	H	CH ₃	CH ₃	O	C ₂ H ₅	119	-
I-1-c-4	CH ₃	CH ₃	O=CH	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		O	C ₂ H ₅	171	Б
I-1-c-5	H	CH ₃	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		O	i-C ₄ H ₉	155	Б
I-1-c-6	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -		O	C ₂ H ₅	215	-
I-1-c-7	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	-(CH ₂) ₂ -CHOCCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		O	C ₂ H ₅	137	Б
I-1-c-8	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -		O	C ₂ H ₅	168	Б

Приклад II-1

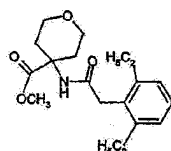


7,5г 2,4-диметил-6-метилфенілоцтової кислоти і 92мл тіонілхлориду перемішують при 80°C доти, поки не припиниться утворення газу. Зайвий тіонілхлорид відганяють і залишок розводять у 30мл сухого ТГФ. Цей розчин прикапують при від 0 до 10°C до 12,3г метилового естеру 2-аміно-2-метилпропанової кислоти в 320мл сухого ТГФ, куди додані 24,6мл триетиламіну, і 1 годину перемішують при кімнатній температурі. Цей розчин упарюють на роторному випарнику, розводять метиленхлоридом і 1 N HCl, екстрагують, сушать і упарюють на

роторному випарнику. Залишок перекристалізують з МТБ-етер/н-гексан.

Вихід: 8,07г ($\approx 66\%$ теорії), Т.пл. 120-122°C

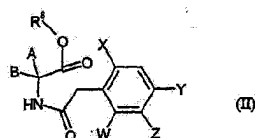
Приклад II-11



До 16,9г концентрованої сірчаної кислоти додають 10,3г сполуки відповідно до прикладу XXVII-1 у виді суспензії в 110мл метиленхлориду при внутрішній температурі від 30 до 40°C і перемішують 2 години. Прикапують 23мл сухого метанолу і перемішують при від 40 до 70°C 6 годин. Розчин виливають на 0,18кг льоду, екстрагують метиленхлоридом і промивають розчином NaHCO_3 . Сушать, упарюють на роторному випарнику і залишок кристалізують з МТБ-етер/н-гексан.

Вихід: 8,7г (76% теорії), Т.пл. 137°C

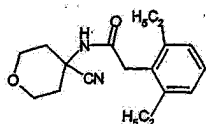
За аналогією з прикладом (II-1) і відповідно до загальних вказівок до способу одержання одержують наступні сполуки формули (II)



Вар.- Nr.	W	X	Y	Z	A	B	R ¹	Рр.°С	Isomer
II-2	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	CH ₃	CH ₃	169	Б
II-3	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	CH ₃	CH ₃	94	Б
II-4	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	109	-
II-5	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	CH ₃	CH ₃	141	Б
II-6	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	CH ₃	CH ₃	165	Б
II-7	i-C ₃ H ₇	i-C ₃ H ₇	i-C ₃ H ₇	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	CH ₃	CH ₃	112	Б
II-8	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	126	-
II-9	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	CH ₃	CH ₃	101	Б
II-10	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	CH ₃	CH ₃	108	Б
II-11	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -	CH ₃	CH ₃	137	-
II-12	CH ₃	C ₂ H ₅	H	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	102	-
II-13	CH ₃	C ₂ H ₅	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	CH ₃	CH ₃	169	Б
II-14	H	CH ₃	H	i-C ₄ H ₉	CH ₃	CH ₃	CH ₃	95	-
II-15	H	CH ₃	H	C ₃ H ₇	-(CH ₂) ₂ -CHOCCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	CH ₃	CH ₃	112	Б
II-16	H	CH ₃	H	C ₃ H ₇	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -	CH ₃	CH ₃	71	Б
II-17	H	CH ₃	H	i-C ₄ H ₉	-(CH ₂) ₂ -CHOCCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	CH ₃	CH ₃	69	Б
II-18	H	CH ₃	H	i-C ₄ H ₉	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -	CH ₃	CH ₃	61	Б
II-19	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	-(CH ₂) ₂ -CHOCCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	CH ₃	CH ₃	151	Б
II-20	H	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -	CH ₃	CH ₃	123	Б
II-21	CH ₃	CH ₃	-OCH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	CH ₃	CH ₃	141	Б
II-22	H	CH ₃	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	CH ₃	CH ₃	98	Б
II-23	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	CH ₃	CH ₃	149	Б
II-24	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -	CH ₃	CH ₃	164	-
II-25	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	141	-

Вар.- Nr.	W	X	Y	Z	A	B	R ¹	Рр.°С	Isomer
II-26	H	CH ₃	H	C ₂ H ₅	-(CH ₂) ₂ -CHOC ₂ H ₅ -(CH ₂) ₂ -	CH ₃	CH ₃	103	Б
II-27	H	CH ₃	H	C ₂ H ₅	-(CH ₂) ₂ -CHOCCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	CH ₃	CH ₃	111	Б
II-28	CH ₃	CH ₃	CH=CH ₂	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	CH ₃	CH ₃	234	Б
II-29	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	CH ₃	CH ₃	140	Б

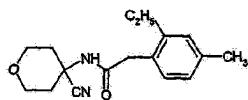
Приклад XXVII-1



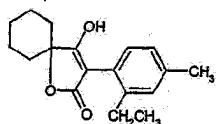
7,68г 2,4-діетил-6-метилфенілоцтової кислоти перемішують з 9,1мл тіонілхлориду при 80°C доти, поки не закінчиться утворення газу. Зайвий тіонілхлорид відганяють і залишок розводять 40мл сухого толуолу. Цей розчин прикапують при від 0 до 10°C до 9г 4-аміно-4-ціанотетрагідрофурану в 80мл сухого ТГФ, куди додано 6,2мл триетиламіну, і 1 годину перемішують при кімнатній температурі. Цей розчин упарюють на роторному випарнику, розводять 1 N HCl у метиленхлориді, сушать і упарюють на роторному випарнику. Залишок перекристалізують з МТБ-етер/н-гексан.

Вихід: 10,3г ($\approx 85\%$ теорії), Т.пл. 155°C

За аналогією з прикладом XXVII-1 одержують сполуку прикладу XXVII-2 з Т.пл. 142°C



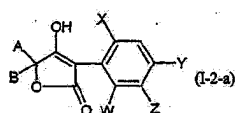
Приклад I-2-a-I



До 8,4г трет.-бутилату калію в 50мл безводного ДМФА при від 0 до 10°C прикапують 16,6г сполуки відповідно до прикладу ІМ, розчиненої в 50мл безводного ДМФА і перемішують 8 годин при кімнатній температурі. Після закінчення реакції прикапують при охолодженні льодом до 1000мл 1 N HCl і перемішують 30хв. Осад, що випав, відфільтровують, промивають, сушать у вакуумі.

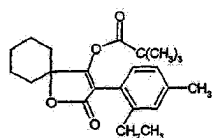
Вихід: 11,5г (≅80% теорії), Т.пл. 135°C

За аналогією з прикладом (I-2-a-I) і згідно до загальних вказівок до способу одержання одержують наступні сполуки формули (I-2-a)



Всп.-№г.	W	X	Y	Z	A	B	Фр.°С
I-2-a-2	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	Оі	
I-2-a-3	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-(CH ₂) ₅ -		223-225
I-2-a-4	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		175-178
I-2-a-5	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -	Оі	

Приклад I-2-b-1

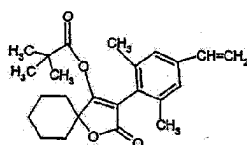


До 2,86г сполуки відповідно до прикладу I-2-a-I, розчиненої в 40мл сухого метилехлориду (CH₂Cl₂) додають 2,08мл триетиламіну. При 0-10°C додають 1,5г півалої лхлориду в 10мл CH₂Cl₂ і перемішують 20 годин при кімнатній температурі.

Реакційний розчин промивають спочатку 10 %-ною лимонною кислотою і потім 1 N NaOH, сушать, упарюють на роторному випарнику і залишок перемішують з петролейним ефіром.

Вихід: 2,2г (≅60% від теорії), Т.пл. 110-112°C.

Приклад I-2-b-2

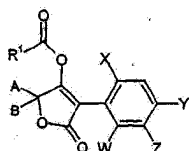


1,2г (2,76 ммоль) сполуки відповідно до прикладу I-2-b-2 з WO97/02243 розводять в 20мл толуолу, додають 3,5г (11 ммоль) трибутилвінілолова, 133мг (0,11 ммоль) Pd(PPh₃)₄ і 2 кристалики 2,6-ди-трет.-бутил-4-метилкрезолу, суміш кип'ятять протягом ночі зі зворотним холодильником і потім сушать.

Неочищену суміш очищають хроматографуванням на силікагелі, причому спочатку за допомогою циклогексану елюють зайві сполуки олова і потім заміняючи розчинник на циклогексан/етилацетат (2:1) елюють цим розчинником продукт. Подальше очищення здійснюють розтиранням з петролейним ефіром.

Вихід: 0,46г (44% від теорії) безбарвні кристали з Т.пл. 152-155°C.

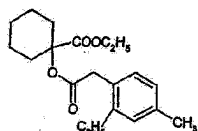
За аналогією з прикладами (I-2-b-I) і (I-2-b-2) і відповідно до загальних вказівок до способу одержання одержують наступні сполуки формули (I-2-b)



(I-2-b)

Бер.-№	W	X	Y	Z	A	B	R ¹	Рр.°С
1-2-b-3	H	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-(CH ₂) ₅ -		t-C ₄ H ₉ -CH ₂	162-164
1-2-b-4	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		t-C ₄ H ₉	Оі
1-2-b-5	CH ₃	CH ₃	CH=CH ₂	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		t-C ₄ H ₉	158-160
1-2-b-6	CH ₃	CH ₃	CH=CH ₂	H	-(CH ₂) ₂ -CHCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		t-C ₄ H ₉	143-145
1-2-b-7	CH ₃	CH ₃	CH=CH ₂	H	-H ₃ C-  -CH ₂ -		t-C ₄ H ₉	155-157
1-2-b-8	CH ₃	CH=CH ₂	CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		t-C ₄ H ₉	145
1-2-b-9	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-(CH ₂) ₅ -		t-C ₄ H ₉	96-98
1-2-b-10	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		t-C ₄ H ₉	90-93
1-2-b-11	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		H ₅ C ₂ -CHCH ₃ -	Оі
1-2-b-12	H	CH ₃	CH=CH ₂	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		n-C ₄ H ₉	Оі
1-2-b-13	H	CH=CH ₂	CH ₃	CH ₃	-(CH ₂) ₂ -CHOCH ₃ -(CH ₂) ₂ -		i-C ₄ H ₇	Оі

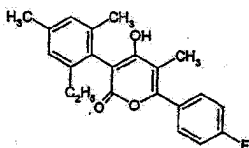
Приклад III-1



8,9г 2-етил-4-метилфеноцтової кислоти в 50мл сухого толуолу і 7,3мл тіонілхлориду нагрівали при 80°С доти, поки не закінчиться утворення газу. Зайвий тіонілхлорид відганяють і залишок розводять у 30мл сухого толуолу. Цей розчин прикапують при від 0 до 10°С до 8,6г етилового естеру 1-гідроксициклогексанкарбонної кислоти в 50мл сухого толуолу і 8 годин перемішують зі зворотним холодильником. Потім цей розчин упарюють на роторному випарнику. Вихід: 16,6г (≅99% теорії)

Залишок без подальшого очищення використовують у реакції конденсації в прикладі I-2-a-1

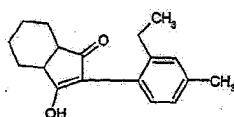
Приклад I-4-a-I



2,4г 2-етил-4,6-диметил-2-фенілхлоркарбонілкетену розводять у 30мл абс. ксилолу і прикапують 1,5г 4-фторпропиофенону в 20мл абс. ксилолу. Нагрівають 8 годин із зворотним холодильником. Промивають ксиольний розчин водою, сушать над сульфатом натрію і випарюють у вакуумі. Хроматографування здійснюють на силікагелі за допомогою суміші толуол/етанол 20:1 у якості елюенту.

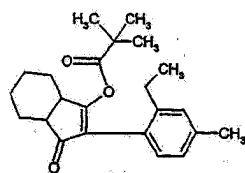
Вихід: 1г (≅28% теорії) Т.пл. 161-162°С.

Приклад I-6-a-I



5,3г сполуки відповідно до прикладу VIII-1 розводять у 50мл сухого ДМФА, додають 2,95г трет.-бутилату калію і нагрівають 1 годину при 60°С. Реакційний розчин змішують з 100мл 1 N HCl, екстрагують CH₂Cl₂, органічну фазу сушать і концентрують. Залишок очищують за допомогою колоночної хроматографії (циклогексан:етилацетат 5:1). Вихід: 2,35г (49% від теорії), Т.пл. 148°С.

Приклад I-6-b-I

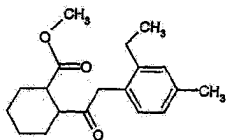


1г сполуки відповідно до прикладу I-6-a-I розводять 20мл сухого метиленхлориду, додають 0,77мл триетиламіну. Прикапують при охолодженні льодом 0,68мл півалоїлхлориду, розчиненого в 1мл метиленхлориду, і перемішують 2 години при кімнатній температурі. Реакційний розчин двічі екстрагують 10% розчином лимонної кислоти, органічну фазу двічі промивають 1 N NaOH, сушать і концентрують.

Вихід: 1,2г (92% від теорії) масла.

$^1\text{H-NMR}$ (500 МГц, CDCl_3): $\delta=1,1$ (с, 9H, $-\text{C}(\text{CH}_3)_3$), 2,31 (с, 3H, Ar-CH_3); 2,45 (к, 2H, $\text{Ar-CH}_2\text{CH}_3$)м.ч.

Приклад VIII-1



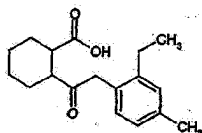
22,8г вихідного продукту прикладу XXXIV-1, розведеного 200мл сухого ацетону, змішують з 10,9г карбонату калію і прикапують 33,6г (14,75 мол) метилйодиду. Перемішують 16 годин зі зворотним холодильником.

Відганяють розчинник і залишок очищають на хроматографічній колонці (метиленхлорид/петролейний ефір:8:1).

Вихід: 3,5г (30% від теорії), масло

Продукт безпосередньо використовується в циклізації за прикладом I-6-a-I

Приклад XXXIV-1



11,2г монометилового естеру циклогександикарбонової кислоти нагрівають з 5,3мл тіонілхлориду і прикапують ДМФА в 50мл сухого толуолу при нагріванні до 100°C , доти поки не закінчиться утворення газу. Відганяють розчинник.

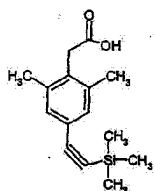
До розчину з 50мл LDA у 100мл сухого ТГФ прикапують при -15°C розчин 17,3г метилового естеру 2-етил-4-метил-фенілоцтової кислоти в 20мл сухого ТГФ і 30хв. перемішують при цій температурі.

Потім прикапують при -15°C розчин вище описаного свіжеодержаного хлорангідриду кислоти в 15мл сухого ТГФ.

Вихідну суміш перемішують одну годину при кімнатній температурі, потім додають 150мл води і 40г хлориду амонію. Проміжний продукт екстрагують ефіром, розчин концентрують. Залишок кип'ятять з 100г КОН і 330мл води 2 дні із зворотним холодильником.

Вихід: 23,70г (91% від теорії), масло

Приклад XXV-1



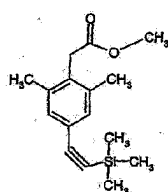
До 26г сполуки відповідно до прикладу XXX-1 в 120мл ТГФ при кімнатній температурі прикапують 4,7г гідроксиду літію, розчиненого в 120мл води, і 8 годин перемішують при кімнатній температурі.

Реакційний розчин упарюють на роторному випарнику, додають воду і екстрагують метил-трет-бутиловим етером.

Водну фазу доводять концентрованою соляною кислотою до pH 2 і осад, що випадає, відокремлюють і сушать.

Вихід: 14г (59% від теорії), Т.пл: $156,3^\circ\text{C}$

Приклад XXX-1



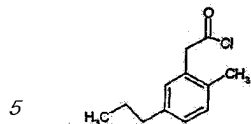
До розчину 7,32г метилового естеру 2,6-диметил-4-бромфенілоцтової кислоти (відповідно до прикладу XXVI-1 з WO 97/02243) в 70мл триетиламіну при перемішуванні в атмосфері аргону при кімнатній температурі додають 0,27г йодиду міді (I), 0,745г трифенілфосфіну, 1г дихлориду біс(трифенілфосфін)паладію і потім прикапують 19,7мл триметилсилілацетилену.

За перетворенням стежать за допомогою газової хроматографії.

Очищення ведуть на хроматографічній колонці із силікагелем, використовуючи петролейний ефір/етилацетат, 20:1 в якості елюенту.

Вихід: 6г (73% від теорії)

Приклад XXII-1

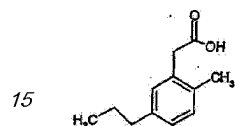


39г сполуки відповідно до прикладу XXV-2 перемішують з 300мл тіонілхлориду при 50°C до припинення утворення газу.

Зайвий тіонілхлорид відганяють, залишок розводять 30мл сухого толуолу і переганяють.

10 Вихід: 37г (87% від теорії), Т.пл.: 90-92°C (0,05 мбар)

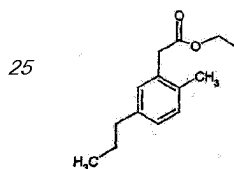
Приклад XXV-2



До 50г сполуки відповідно до прикладу XXX-2 додають 60мл етанолу, 30мл води, 25г гідроокису натрію і нагрівають 5 годин зі зворотним холодильником.

20 Після закінчення реакції розчинник відганяють, залишок розчиняють у воді і підкислюють до кислої реакції концентрованою соляною кислотою. Осад, що випав, відокремлюють, промивають і сушать. Вихід: 41г (93% від теорії)

Приклад XXX-2 (Спосіб P)



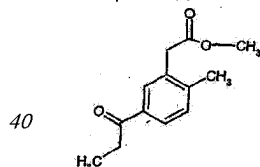
30 60г сполуки відповідно до прикладу XLII-1 розчиняють у 600мл етанолу, змішують з 50мл концентрованої соляної кислоти і додають 5г 10 % Pd/C.

При 120°C і 150 бар у реакційну суміш подають водень.

По закінченні реакційну суміш фільтрують, розчинник відганяють, залишок розчиняють в 300мл метиленхлориду і промивають 300мл води, сушать і концентрують.

35 Вихід: 51г (91% від теорії)

Приклад XLII-1 (Спосіб P)



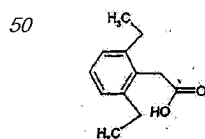
Змішують 200г мл сірковуглецю і 86,7г хлориду алюмінію. При 0°C прикапують 50г метилового естеру 2-метилфенілоцтової кислоти і 28,2г хлорангідриду пропіонової кислоти. Розчин перемішують 4 години зі зворотним холодильником.

45 Потім розчин виливають на 1 кілограм води з льодом і екстрагують 500мл метиленхлориду.

Органічну фазу промивають 10% соляною кислотою, потім розчином соди, сушать і концентрують.

Вихід: 60г (91% від теорії)

Приклад XXV-3

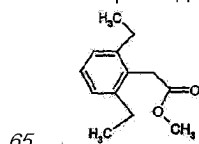


55 До 30г сполуки відповідно до прикладу XXX-3 у 32мл метанолу і 16мл води додають 12,2г гідроксиду калію і перемішують 5 годин зі зворотним холодильником.

Розчин концентрують і залишок розводять у воді, промивають етилацетатом і доводять pH водної фази до 1 використовуючи концентровану соляну кислоту. Осад, що випадає, відокремлюють, промивають і сушать.

Вихід: 25г (99% від теорії), Т.пл. 55-56°C

60 Приклад XXX-3 (Спосіб Q)



20,8г метилового естеру 2,6-диметил-4-бром-фенілоцтової кислоти (відповідно до прикладу XXVI-6 з WO 97/02243) розчиняють в 100мл метанолу. Додають 7,2г ацетату натрію і 2г гідроксиду паладію. Потім гідрують воднем під тиском.

Після закінчення реакції розчин фільтрують і концентрують. Залишок розводять метиленхлоридом, промивають водою, сушать і концентрують.

Вихід: 12г (77% від теорії)

Приклади використання

Приклад А

Тест на Myzus

Розчинник: 7 масових частин диметилформаміду

Емульгатор: 1 масова частина алкіларилового етеру полігліколю

Для одержання оптимального препарату активної речовини 1 масову частину активної речовини змішують із зазначеними кількостями розчинника і емульгатора і розбавляють концентрат водою, що містить емульгатор, до бажаної концентрації.

Листви капусти (*Brassica oleracea*), що піддалися сильному нападу персиколісної воші (*Myzus persicae*), обробляють зануренням у приготовлений препарат активної речовини бажаної концентрації.

Через визначений час визначають загинув у %. 100% означає, що всі персиколісні воші загинули; 0% означає, що жодна персиколісна воша не загинула.

У цьому тесті сполуки прикладів I-2-a-4, I-2-b-5, I-2-b-6, I-1-a-6, I-1-c-4, I-4-a-1 при приблизній концентрації активної речовини від 1000м.ч. проявляють 100% загинув через 6 днів.

Приклад В

Тест на Nephrotettix

Розчинник: 7 масових частин диметилформаміду

Емульгатор: 1 масова частина алкіларилового етеру полігліколю

Для одержання оптимального препарату активної речовини 1 масову частину активної речовини змішують із зазначеними кількостями розчинника і емульгатора і розбавляють концентрат водою, що містить емульгатор, до бажаної концентрації.

Зародки рису (*Oryza sativa*) обробляють зануренням у приготовлений препарат активної речовини бажаної концентрації і засаджують зеленою рисовою цикадою доти поки листя ще вологе.

Через визначений час визначають загинув у %. 100% означає, що всі цикади загинули; 0% означає, що жодна цикада не загинула.

У цьому тесті сполук прикладів I-2-a-4, I-2-b-9, I-1-a-9, I-1-a-8, I-1-a-2, I-1-a-1, I-1-a-3, I-4-a-1 і приблизній концентрації активної речовини від 1000м.ч. показують 100% загинув через 6 днів.

Приклад С

Тест на личинки Phaedon

Розчинник: 7 масових частин диметилформаміду

Емульгатор: 1 масова частина алкіларилового етеру полігліколю

Для одержання оптимального препарату активної речовини 1 масову частину активної речовини змішують із зазначеними кількостями розчинника і емульгатора і розбавляють концентрат водою, що містить емульгатор, до бажаної концентрації.

Листви капусти (*Brassica oleracea*) обробляють зануренням у приготовлений препарат активної речовини бажаної концентрації і заражають личинками морквих жуків (*Phaedon cochleariae*), доти поки листя ще вологе.

Через визначений час визначають загинув у %. 100% означає, що усі личинки жука загинули; 0% означає, що жодна личинка жука не загинула.

У цьому тесті сполуки прикладів I-2-a-3, I-2-b-8, I-2-b-6, I-1-a-2, I-1-a-3, I-1-a-21, I-4-a-1 і приблизній концентрації активної речовини від 1000м.ч. показують 100% загинув через 7 днів.

Приклад D

Тест на Plutella

Розчинник: 7 масових частин диметилформаміду

Емульгатор: 1 масова частина алкіларилового етеру полігліколю

Для одержання оптимального препарату активної речовини 1 масову частину активної речовини змішують із зазначеними кількостями розчинника і емульгатора і розбавляють концентрат водою, що містить емульгатор, до бажаної концентрації.

Листви капусти (*Brassica oleracea*) обробляють зануренням у приготовлений препарат активної речовини бажаної концентрації і засаджують гусеницями капустяного таргана (*Plutella xylostella*), доти поки листя ще вологе.

Через визначений час визначають загинув у %. 100% означає, що всі гусениці загинули; 0% означає, що жодна гусениця не загинула.

У цьому тесті сполуки прикладів I-1-a-8, I-4-a-1 і приблизній концентрації активної речовини від 1000м.ч. показують 100% загинув через 7 днів.

Приклад E

Тест на Spodoptera fragiperda

Розчинник: 7 масових частин диметилформаміду

Емульгатор: 1 масова частина алкіларилового етеру полігліколю

Для одержання оптимального препарату активної речовини 1 масову частину активної речовини змішують із

зазначеними кількостями розчинника і емульгатора і розбавляють концентрат водою, що містить емульгатор, до бажаної концентрації.

Листи капусти (*Brassica oleracea*) обробляють зануренням у приготовлений препарат активної речовини бажаної концентрації і засаджують гусеницями *Heerwurms* (*Spodoptera rugiperda*), доти поки листя ще вологе.

Через визначений час визначають загинь у %. 100% означає, що всі гусениці агинули; 0% означає, що жодна гусениця не загинула.

У цьому тесті сполука прикладу I-2-a-3 і приблизній концентрації активної речовини від 1000м.ч. показує 100% загинь через 7 днів.

Приклад F

Тест на *Tetranychus* (ОР-резистентність/обробка зануренням)

Розчинник: 7 масових частин диметилформаміду

Емульгатор: 1 масова частина алкіларилового етеру полігліколю

Для одержання оптимального препарату активної речовини 1 масову частину активної речовини змішують із зазначеними кількостями розчинника і емульгатора і розбавляють концентрат водою, що містить емульгатор, до бажаної концентрації.

Бобові рослини (*Phaseolus vulgaris*), що зазнали сильного нападу звичайного павутинного кліщика (*Tetranychus urticae*), занурюють у приготовлений препарат активної речовини бажаної концентрації.

Через визначений час визначають загинь у %. 100% означає, що всі павутинні кліщики загинули; 0% означає, що жоден павутинний кліщик не загинув.

У цьому тесті сполуки прикладів I-2-a-4, I-2-b-10, I-2-b-11, I-2-b-8, I-2-b-2, I-1-a-3, I-1-a-21, I-1-c-4, I-1-d-4-a-1 і приблизній концентрації активної речовини від 1000м.ч. показують 100% загинь через 7 днів.

Приклад G

Тест на *Bemisia*

Розчинник: 7 масових частин диметилформаміду

Емульгатор: 1 масова частина алкіларилового етеру полігліколю

Для одержання оптимального препарату активної речовини 1 масову частину активної речовини змішують із зазначеними кількостями розчинника і емульгатора і розбавляють концентрат водою, що містить емульгатор, до бажаної концентрації.

Рослини бавовни (*Gossypium hirsutum*), що зазнали сильного нападу яєць, личинок і пупаріїв (хибний кокон) білої мухи (*Bemisia tabaci*), занурюють у приготовлений препарат активної речовини бажаної концентрації.

Через визначений час визначають загинь у %. 100% означає, що усі тварини загинули; 0% означає, що жодна тварина не загинула.

У цьому тесті сполуки прикладів I-2-b-9, I-2-a-4, I-2-b-10 і приблизній концентрації активної речовини від 1000м.ч. показують 100% загинь через 10 днів.

Приклад H

Післясходовий тест

Розчинник: 5 масових частин ацетону

Емульгатор: 1 масова частина алкіларилового етеру полігліколю

Для одержання оптимального препарату активної речовини 1 масову частину активної речовини змішують із зазначеними кількостями розчинника і емульгатора і розбавляють концентрат водою, що містить емульгатор, до бажаної концентрації.

Тестові рослини, що мають висоту від 5 до 15см, обприскують оптимальними препаратами активної речовини таким чином, щоб на квадратну одиницю площі попадала бажана кількість активної речовини. Концентрація розчину для обприскування вибирається таким чином, щоб з 1000л води/гектар попадала відповідна необхідна кількість активної речовини.

Через 3 тижні оцінюється ступінь ушкодження рослин у % ушкодження в порівнянні з розвитком контрольних рослин, що не зазнали обробки.

Це означає:

0%=ніякої дії (як контрольні, що не зазнали обробки)

100%=тотальне знищення

Приклад I

Досходовий тест

Розчинник: 5 масових частин ацетону

Емульгатор: 1 масова частина алкіларилового етеру полігліколю

Для одержання оптимального препарату активної речовини 1 масову частину активної речовини змішують із зазначеними кількостями розчинника і емульгатора і розбавляють концентрат водою, що містить емульгатор, до бажаної концентрації.

Насіння тестових рослин вносять у нормальний ґрунт. Приблизно через 24 години фунт обприскують оптимальними препаратами активної речовини таким чином, щоб на квадратну одиницю площі попадала бажана кількість активної речовини. Концентрації розчину для обприскування вибирається таким чином, щоб з 1000л води/гектар попадала відповідна необхідна кількість активної речовини.

Через 3 тижні оцінюється ступінь ушкодження рослин у % ушкодження у порівнянні з розвитком контрольних рослин, що не зазнали обробки.

Це означає:

0%=ніякої дії (як контрольні, що не зазнали обробки)

100%=тотальне знищення

5

Післясходова	г/га	Пшениця	Бавовна	Alopecurus	Avena fatua	Lolium	Copro
Пр. І-2-а-4	60	0	0	95	80	95	80

10

Післясходова	viva	Цукровий буряк	Alopecurus	Avena fatua	Digitaria	Lolium	Setaria	Ipomoea	Polygonum
Пр. І-1-а-21	125	-	100	90	100	95	99	70	-
Пр. І-1-с-4	60	10	90	90	95	-	100	-	70

15

Післясходова	г/га	Соя	Digitaria	Lolium	Setaria	Copro	Galium
Пр. І-1-а-5	125	10	90	-	100	95	80
Пр. І-1-а-3	125	-	80	70	90	-	80

20

Післясходова	г/га	Цукровий буряк	Pane	Digitaria	Lolium	Setaria	Copro	Galium
Пр. І-1-а-2	125	0	0	80	70	95	80	80

25

Післясходова	г/га	Цукровий буряк	Бавовна	Alopecurus	Avena tatua	uigitaria	betana
Пр. І-1-а-9	15	10	0	100	95	95	100

30

Післясходова	г/га	Digitaria	Lolium	Sotaria	Copro
Пр. І-1-а-6	125	95	80	95	100

35

Післясходова	г/га	Пшениця	Соя	Бавовна	Digitaria	Lolium	Setaria
Пр. І-2-б-12	125	-	0	0	95	90	95
Пр. І-2-б-13	125	10	0	0	80	70	95

40

Післясходова	г/га	Пшениця	Цукровий буряк	Бавовна	Digitaria	Echinochloa	Setaria	Copro
Пр. І-4-а-1	125	20	0	0	100	90	95	90

45

Післясходова	г/га	Пшениця	Lolium	Cassia	Solarium	Viola
Пр. І-2-б-10	125	10	80	95	80	90

50

Досходова	г/га	Пшениця	Кукуруза	Цукровий буряк	Соя	Alopecurus	Avena fatua	Bromus	Lolium	Setaria
Пр. І-2-а-4	125	-	5	0	0	100	80	70	100	100
Пр. І-1-а-8	60	0	10	0	0	100	90	100	100	100

55

Досходова	г/га	Alopecurus	Avena fatua	Digitaria	Echinochloa	Lolium	Setaria
Пр. І-1-а-3	125	100	95	100	100	100	100

60

Досходова	г/га	Alopecurus	Avena fatua	Echinochloa
Пр. І-1-а-6	60	90	80	90

65

Досходова	г/га	Цукровий буряк	Соя	Alopecurus	Digitaria	Lolium	Setaria	Veronica
Пр. І-4-3-1	125	0	0	100	100	100	100	95
Пр. І-1-3-21	125	0	0	100	100	100	100	95
Пр. І-1-3-9	125	0	0	100	100	100	100	90

Досходова	г/га	Пшениця	Соя	Alopecurus	Echinochloa	Lolium	Setaria	Chenopodium
Пр. І-1-а-5	60	0	0	100	100	100	100	70

Досходова	г/га	Соя	Alopecurus	Bromus	Cyperus	Digitaria	Lolium	Setaria	Abutilo
-----------	------	-----	------------	--------	---------	-----------	--------	---------	---------

Приклад J

Тест гранична концентрація/наземні комахи - обробка трансгенних рослин

Тестова комаха: *Diabrotica balteata* - личинки в ґрунті

Розчинник: 7 масових частин

Емульгатор: 1 масова частина алкіларилового етеру полігліколю

Для одержання оптимального препарату активної речовини 1 масову частину активної речовини змішують із зазначеними кількостями розчинника і емульгатора і розбавляють концентрат водою, що містить емульгатор, до бажаної концентрації.

Ґрунт поливають препаратами активної речовини. При цьому концентрація активної речовини в препараті практично не грає ніякої ролі, важлива тільки кількість активної речовини на одиниці об'єму фунту, що вказується в м.ч. (мг/л). Наповняють ґрунтом 0,25л горщики і залишають їх при 20°C.

Поміщають 5 попередньо пророслих кукурудзяних зерен сорту YIELD GUARD (товарний знак Monsanto Corp., США) на горщик. Через 2 дні в оброблений ґрунт вносять відповідні тестові комахи. Через 7 днів визначають ступінь ефективності активної речовини підраховуючи кількості паростків кукурудзи (1 рослина=20% дії).

Приклад K

Heliothis virescens - тест - обробка трансгенних рослин

Розчинник: 7 масових частин

Емульгатор: 1 масова частина алкіларилового етеру полігліколю

Для одержання оптимального препарату активної речовини 1 масову частину активної речовини змішують із зазначеними кількостями розчинника і емульгатора і розбавляють концентрат водою, що містить емульгатор, до бажаної концентрації.

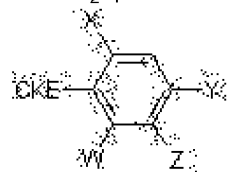
Пагони сої (*Glycine max*) сорту Roundup Ready (товарний знак Monsanto Corp. США) обробляють зануренням у приготовлений препарат активної речовини бажаної концентрації і засаджують гусеницями *Heliothis virescens*, доти поки листя ще вологе.

Через визначений час визначають загибель комах.

Формула винаходу

1. C₂-фенілзаміщені циклічні кетоеноли загальної формули (I)

, (I)



в якій

W означає водень, алкіл з 1-6 атомами вуглецю,

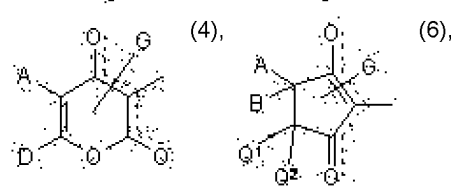
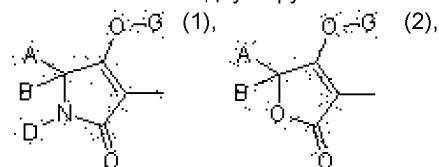
X означає алкіл з 1-6 атомами вуглецю, алкеніл з 2-6 атомами вуглецю,

Y означає водень, метил, етил, ізопропіл, алкеніл з 2-6 атомами вуглецю або етиніл,

Z означає водень, алкіл з 1-6 атомами вуглецю,

за умови, що щонайменше один із залишків W, X, Y або Z означає ланцюг з щонайменше 2 атомами вуглецю, причому тільки один із залишків X та Y може означати алкеніл з 2-6 атомами вуглецю,

SKE означає одну з груп



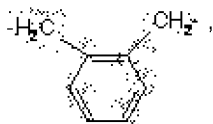
де

A означає водень, алкіл з 1-6 атомами вуглецю,

B означає алкіл з 1-6 атомами вуглецю, або

A і B разом з атомом вуглецю, з яким вони зв'язані, утворюють циклоалкіл з 5-6 атомами вуглецю, в якому атом вуглецю кільця може бути замінений киснем, і який може бути заміщений алкілом з 1-6 атомами вуглецю або алкоксиллом з 1-6 атомами вуглецю, або

A і B разом означають групу



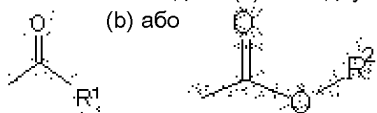
5

в якій D означає водень або заміщений фтором феніл, якщо СКЕ означають групу формули (2), (4) і (6),

G означає водень (a) або одну з груп

(b) або (c)

10



R¹ означає алкіл з 1-6 атомами вуглецю, алкоксиметил з 1-2 атомами вуглецю,

R² означає алкіл з 1-4 атомами вуглецю,

15

A і Q¹ разом означають алкандііл з 3-4 атомами вуглецю і

B і Q² означають, відповідно, водень.

20

Офіційний бюлетень "Промислова власність". Книга 1 "Винаходи, корисні моделі, топографії інтегральних мікросхем", 2005, N 10, 15.10.2005. Державний департамент інтелектуальної власності Міністерства освіти і науки України.

25

30

35

40

45

50

55

60

65

U
A
7
3
9
8
4
C
2

U
A
7
3
9
8
4
C
2