



(19) **UA** (11) **75 051** (13) **C2**
 (51)МПК

МИНИСТЕРСТВО ОБРАЗОВАНИЯ И НАУКИ
 УКРАИНЫ

ГОСУДАРСТВЕННЫЙ ДЕПАРТАМЕНТ
 ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ УКРАИНЫ

(21), (22) Заявка: 2002042576, 01.09.2000

(24) Дата начала действия патента: 15.03.2006

(30) Приоритет: 03.09.1999 СН 1607/99

(46) Дата публикации: 15.03.2006C07D 211/70
 20060101AFI20051019ВНУА А01N
 43/40 20060101ALI20051019ВНУА

(86) Заявка РСТ:
 РСТ/EP00/08566, 20000901

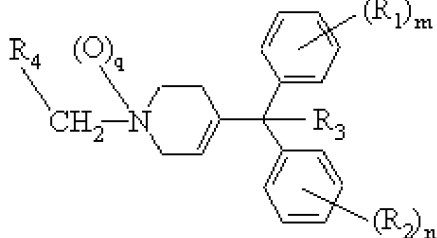
(72) Изобретатель:
 Трах Штефан, DE

(73) Патентовладелец:
 СИНГЕНТА ПАТИСИПЕЙШОНС АГ, СН

(54) ТЕТРАГИДРОПИРИДИНЫ КАК ПЕСТИЦИДЫ, КОМПОЗИЦИЯ, СПОСОБ ЕЕ ПРИГОТОВЛЕНИЯ И СПОСОБ БОРЬБЫ С ВРЕДИТЕЛЯМИ

(57) Реферат:

В заявке описаны соединения формулы (I)
 (I) в



которой R₁ и R₂ каждый независимо друг от друга означает, например, атом галогена, C₁-C₆алкил, C₃-C₆циклоалкил, гало-C₁-C₆алкил, гало-C₃-C₆циклоалкил, C₂-C₄алкенил, C₂-C₄алкинил, гало-C₂-C₄алкенил, гало-C₂-C₄алкинил, R³ означает водородный атом, OH, атом галогена, C₁-C₆алкокси или -O-C(=O)-C₁-C₆алкил; R₄ означает например, фенил, бензил, фенокси или бензилокси, который замещен заместителями, выбранными из ряда, который включает атомы галогена, циано, NO₂, C₁-C₆алкил, C₃-C₈циклоалкил, C₃-C₈циклоалкил-C₁-C₆алкил, гало-C₁-C₆алкил, C₁-C₆алкокси, C₃-C₈циклоалкокси, C₃-C₈циклоалкокси-C₁-C₆алкил, C₃-C₈циклоалкил-C₁-C₆алкокси,

гало-C₁-C₆алкокси, C₂-C₄алкенил, C₂-C₄алкинил, гало-C₂-C₄алкенил, гало-C₂-C₄алкинил, C₂-C₆алкенилокси, C₂-C₆алкинилокси, гало-C₂-C₆алкенилокси, гало-C₂-C₆алкинилокси, -NR₆-C(=O)-O-C₁-C₆алкил, -NR₆-C(=O)-O-гало-C₁-C₆алкил, -C(R₇)=N-W-R₈, фенил, бензил, фенокси, бензилокси, гетероцикл и гетероциклокси, каждый из двух R₅ независимо друг от друга означает водородный атом или C₁-C₆алкил; R₆ означает водородный атом, C₁-C₆алкил или бензил; R₇ означает, например, атом галогена или C₁-C₆алкил; R₈ означает, например, водородный атом или C₁-C₆алкил; m означает 1, 2, 3; n означает 1, 2, 3; p означает 0, 1 или 2; q означает 0 или 1; W означает O, NH или N-C₁-C₆алкил; применение этих соединений в пестицидной композиции, способы получения и применения этих композиций и способ борьбы с вредителями.

Официальный бюлетень "Промышленная собственность". Книга 1 "Изобретения, полезные модели, топографии интегральных микросхем", 2006, N 3, 15.03.2006. Государственный департамент интеллектуальной собственности Министерства образования и науки Украины.



(19) **UA** (11) **75 051** (13) **C2**

(51) Int. Cl.

MINISTRY OF EDUCATION AND SCIENCE OF
UKRAINE

STATE DEPARTMENT OF INTELLECTUAL
PROPERTY

(12) DESCRIPTION OF PATENT OF UKRAINE FOR INVENTION

(21), (22) Application: 2002042576, 01.09.2000

(24) Effective date for property rights: 15.03.2006

(30) Priority: 03.09.1999 CH 1607/99

(46) Publication date: 15.03.2006C07D 211/70
20060101AFI20051019BHUA A01N
43/40 20060101ALI20051019BHUA

(86) PCT application:
PCT/EP00/08566, 20000901

(72) Inventor:

Trah Stephan, DE

(73) Proprietor:

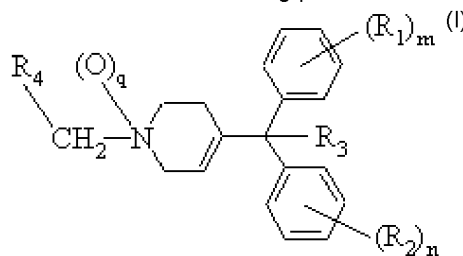
SYNGENTA PARTICIPATIONS AG, CH

(54) TETRAHYDROPIRIDINES AS PESTICIDES, A COMPOSITION, A METHOD FOR THE PREPARATION THEREOF AND A METHOD OF CONTROLLING PESTS

(57) Abstract:

Compounds of formula (I) are described, wherein R_1 and R_2 are for example, independently of each other, halogen, C_1 - C_6 -alkyl, C_3 - C_6 -cycloalkyl, halogen- C_1 - C_6 -alkyl, halogen- C_3 - C_6 -cycloalkyl, C_2 - C_4 -alkenyl, C_2 - C_4 -alkenyl, halogen- C_2 - C_4 -alkenyl and halogen- C_2 - C_4 -alkenyl; R_3 is hydrogen, OH, halogen, C_1 - C_6 -alkoxy, or -O-C(=O)- C_1 - C_6 -alkyl; R_4 is for example phenyl, benzyl, phenoxy or benzyloxy, which is substituted by substituents selected from the group consisting of halogen, cyano, NO_2 , C_1 - C_6 -alkyl, C_3 - C_6 -cycloalkyl, C_3 - C_6 -cycloalkyl- C_1 - C_6 -alkyl, halogen- C_1 - C_6 -alkyl, C_1 - C_6 -alkoxy, C_3 - C_6 -cycloalkoxy, C_3 - C_6 -cycloalkoxy- C_1 - C_6 -alkyl, C_3 - C_6 -cycloalkoxy- C_1 - C_6 -alkoxy, halogen- C_1 - C_6 -alkoxy, C_2 - C_4 -alkenyl, C_2 - C_4 -alkinyl, halogen- C_2 - C_4 -alkenyl, halogen- C_2 - C_4 -alkinyl, C_2 - C_6 -alkenyloxy, C_2 - C_6 -alkinyloxy, halogen- C_2 - C_6 -alkenyloxy, halogen- C_2 - C_6 -alkinyloxy, -NR₆-C(=O)-O- C_1 - C_6 -alkyl, -NR₆-C(=O)-O-halogen- C_1 - C_6 -alkyl, -C(R_7)=N-W- R_8 , phenyl, benzyl, phenoxy, benzyloxy, heterocyclyl and heterocycloxy; the two R_5 independently of one another, are hydrogen or C_1 - C_6 -alkyl; R_6 is

hydrogen, C_1 - C_6 -alkyl or benzyl; R_7 is for example halogen or C_1 - C_6 -alkyl; R_8 is for example hydrogen or C_1 - C_6 -alkyl; m is 0, 1, 2, 3, 4, or 5; n is 0, 1, 2, 3, 4, or 5; p is 0, 1 or 2; q is 0 or 1; W is 0 or NH or N- C_1 - C_6 -alkyl; a method of producing and the use of these compounds, pesticides whose active ingredient is selected from these compounds or from an agrochemically employable salt thereof, a method of producing and the use of these compositions, plant propagating material that has been treated with these " compositions and a method of controlling pests.



Official bulletin "Industrial property". Book 1 "Inventions, utility models, topographies of integrated circuits", 2006, N 3, 15.03.2006. State Department of Intellectual Property of the Ministry of Education and Science of Ukraine.



(19) **UA** (11) **75 051** (13) **C2**
 (51)МПК

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ І НАУКИ УКРАЇНИ

ДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
 ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ ВЛАСНОСТІ

(12) ОПИС ВІНАХОДУ ДО ПАТЕНТУ УКРАЇНИ

(21), (22) Дані стосовно заявки:
 2002042576, 01.09.2000

(24) Дата набуття чинності: 15.03.2006

(30) Дані стосовно пріоритету відповідно до Паризької конвенції : 03.09.1999 СН 1607/99

(46) Публікація відомостей про видачу патенту (деклараційного патенту): 15.03.2006С07D 211/70 20060101AFI20051019ВНUA А01N 43/40 20060101ALI20051019ВНUA

(86) Номер та дата подання міжнародної заявки відповідно до договору РСТ:
 РСТ/ЕР00/08566, 20000901

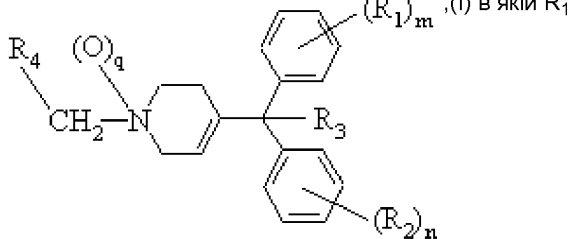
(72) Винахідник(и):
 Трах Штефан , DE

(73) Власник(и):
 СІНГЕНТА ПАТІСИПЕЙШОНС АГ, СН

(54) ТЕТРАГІДРОПІРИДИНИ ЯК ПЕСТИЦИДИ, КОМПОЗИЦІЯ, СПОСІБ ЇЇ ПРИГОТУВАННЯ ТА СПОСІБ БОРОТЬБИ ІЗ ШКІДНИКАМИ

(57) Реферат:

У заявці описані сполуки формули (I)
 , (I) в якій R₁



і R₂ кожен незалежно один від одного означає, наприклад, атом галогену, C₁-C₆алкіл, C₃-C₆циклоалкіл, гало-C₁-C₆алкіл, гало-C₃-C₆циклоалкіл, C₂-C₄алкеніл, C₂-C₄алкініл, гало-C₂-C₄алкеніл, гало-C₂-C₄алкініл, R³ означає водневий атом, ОН, атом галогену, C₁-C₆алкокси або -O-C(=O)-C₁-C₆алкіл; R₄ означає наприклад, феніл, бензил, фенокси або бензилокси, який заміщений замісниками, вибраними з ряду, який включає атоми галогену, ціано, NO₂, C₁-C₆алкіл, C₃-C₆циклоалкіл, C₃-C₆циклоалкіл-C₁-C₆алкіл,

гало-C₁-C₆алкіл, C₁-C₆алкокси, C₃-C₆циклоалкокси, C₃-C₆циклоалкокси-C₁-C₆алкіл, C₃-C₆циклоалкіл-C₁-C₆алкокси, гало-C₁-C₆алкокси, C₂-C₄алкеніл, C₂-C₄алкініл, гало-C₂-C₄алкеніл, гало-C₂-C₄алкініл, C₂-C₆алкенілокси, C₂-C₆алкінілокси, гало-C₂-C₆алкенілокси, гало-C₂-C₆алкінілокси, -NR₆-C(=O)-O-C₁-C₆алкіл, -NR₆-C(=O)-O-гало-C₁-C₆алкіл, -C(R₇)=N-W-R₈, феніл, бензил, фенокси, бензилокси, гетероцикл і гетероциклілокси, кожний із двох R₅ незалежно один від одного означає водневий атом або C₁-C₆алкіл; R₆ означає водневий атом, C₁-C₆алкіл або бензил; R₇ означає, наприклад, атом галогену або C₁-C₆алкіл; R₈ означає, наприклад, водневий атом або C₁-C₆алкіл; m означає 1, 2, 3; n означає 1, 2, 3; p означає 0, 1 або 2; q означає 0 або 1; W означає O, NH або N-C₁-C₆алкіл; застосування цих сполук у пестицидній композиції, способи одержання та застосування цих композицій та спосіб боротьби зі шкідниками.

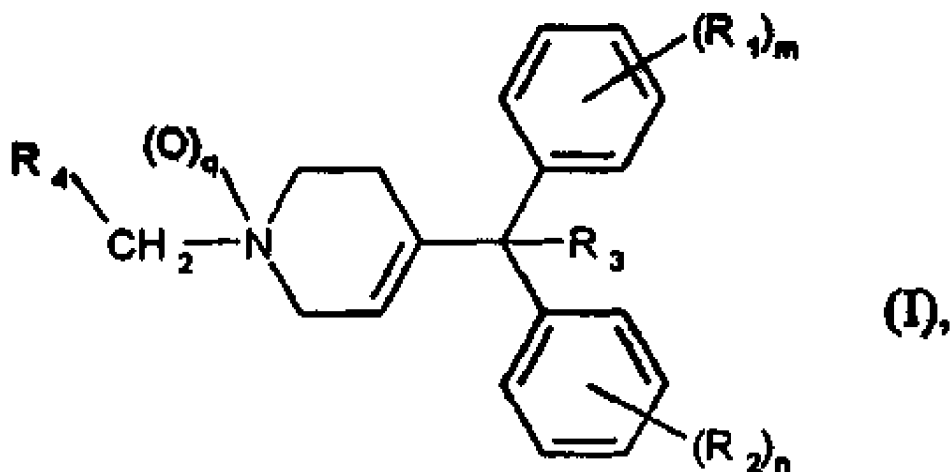
Опис винаходу

5

10

15

20



в якій

25

30

35

40

45

50

55

60

65

R_1 і R_2 кожен незалежно один від одного означають атом галогену, C_1 - C_6 алкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл, гало- C_1 - C_6 алкіл, гало- C_3 - C_6 циклоалкіл, C_2 - C_4 алкеніл; C_2 - C_4 алкініл, гало- C_2 - C_4 алкеніл, гало- C_2 - C_4 алкініл, C_1 - C_6 алкокси, гало- C_1 - C_6 алкокси, C_2 - C_6 алкенілокси, C_2 - C_6 алкінілокси, гало- C_2 - C_6 алкенілокси, гало- C_2 - C_6 алкінілокси, $-SF_5$, $-C(=O)N(R_5)_2$, $-O-C(=O)N(R_5)_2$, $-CN$, $-NO_2$, $-S(=O)_2N(R_5)_2$, $-S(=O)_p-C_1-C_6$ алкіл, $-S(=O)_p$ -гало- C_1-C_6 алкіл, $-O-S(=O)_p-C_1-C_6$ алкіл, $-O-S(=O)_p$ -гало- C_1-C_6 алкіл, феніл, бензил, фенокси або бензилокси, де кожний з фенільного, бензильного, фенокси- або бензилоксирадикалів або не заміщений, або незалежно один від одного від моно- до пентазаміщений в ароматичному кільці замісниками, вибраними з ряду, який включає атоми галогену, ціаногрупу, NO_2 , C_1 - C_6 алкіл, гало- C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 алкокси і гало- C_1 - C_6 алкокси;

R_3 означає водневий атом, OH , атом галогену, C_1 - C_6 алкокси або $-O-C(=O)-C_1-C_6$ алкіл;

R_4 означає C_1 - C_6 алкіл, гало- C_1 - C_6 алкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл, гало- C_3 - C_6 циклоалкіл, C_3 - C_6 циклоалкокси, гало- C_1 - C_6 алкокси, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, гало- C_2 - C_4 алкеніл, гало- C_2 - C_4 алкініл, C_1 - C_6 алкокси, гало- C_1 - C_6 алкокси, C_2 - C_6 алкенілокси, C_2 - C_6 алкінілокси, гало- C_2 - C_6 алкенілокси, гало- C_2 - C_6 алкінілокси, $-C(=O)-C_3-C_6$ алкіл (дискламація), $-C(=O)$ -гало- C_1-C_6 алкіл, $-C(=O)-O-C_1-C_6$ алкіл, $-C(=O)-O$ -гало- C_1-C_6 алкіл, $-NR_6-C(=O)-O-C_1-C_6$ алкіл, $-NR_6-C(O)-O$ -гало- C_1-C_6 алкіл, $-C(=O)N(R_5)_2$, $-O-C(O)N(R_5)_2$, $-CN$, $-NO_2$, $-S(=O)_2N(R_5)_2$, $-S(=O)_p-C_1-C_6$ алкіл, $-S(O)_p$ -гало- C_1-C_6 алкіл, $-O-S(=O)_p-C_1-C_6$ алкіл, $-O-S(=O)_p$ -гало- C_1-C_6 алкіл; бензил, фенокси, бензилокси; або феніл, бензил, фенокси або бензилокси, який незалежно від моно- до пентазаміщений замісниками, вибраними з ряду, який включає атоми галогену, ціано, NO_2 , C_1 - C_6 алкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл- C_1 - C_6 алкіл, гало- C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 алкокси, C_3 - C_6 циклоалкокси, C_3 - C_6 циклоалкокси- C_1 - C_6 алкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл- C_1 - C_6 алкокси, гало- C_1 - C_6 алкокси, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, гало- C_2 - C_4 алкеніл, гало- C_2 - C_4 алкініл, C_2 - C_6 алкенілокси, C_2 - C_6 алкінілокси, гало- C_2 - C_6 алкенілокси, гало- C_2 - C_6 алкінілокси, $-NR_6-C(O)-O-C_1-C_6$ алкіл, $-NR_6-C(O)-O-C_2-C_6$ алкеніл, $-NR_6-C(=O)-O$ -гало- C_1-C_6 алкіл, $-C(R_7)=N-W-R_8$, феніл, бензил, фенокси, бензилокси, гетероцикліл і гетероциклілокси, де залежно від можливості заміщення в кільці гетероцикліл і гетероциклілоксирадикали необов'язково від моно- до тризаміщені замісниками, вибраними з ряду, який включає атоми галогену, C_1 - C_6 алкіл, гало- C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 алкокси, гало- C_1 - C_6 алкокси, C_3 - C_6 циклоалкіл- C_1 - C_6 алкіл, ціано- C_1 - C_6 алкіл, C_3 - C_6 алкеніл, C_3 - C_6 алкініл, феніл або бензил; кожний із двох R_5 незалежно один від одного означає водневий атом або C_1 - C_6 алкіл;

R_6 означає водневий атом, C_1 - C_6 алкіл або бензил;

R_7 означає атом галогену, C_1 - C_6 алкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл- C_1 - C_6 алкіл, гало- C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 алкокси, C_3 - C_6 циклоалкокси, C_3 - C_6 циклоалкокси- C_1 - C_6 алкіл, гало- C_1 - C_6 алкокси, $-NH(C_1-C_6$ алкіл) або $-NH(C_1-C_6$ алкіл) $_2$;

R_8 означає водневий атом, C_1 - C_6 алкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл- C_1 - C_6 алкіл, гало- C_1 - C_6 алкіл або $-C(O)-C_1-C_6$ алкіл;

m означає 0, 1, 2, 3, 4 або 5;

n означає 0, 1, 2, 3, 4 або 5;

p означає 0, 1 або 2;

q означає 0 або 1;

W означає O , NH або $N-C_1-C_6$ алкіл;

i , якщо це прийнятно, її E/Z -ізомери, суміші E/Z -ізомерів i або

таутомерів, кожний з яких знаходиться у вільній формі або у формі солі;

спосіб одержання та застосування цих сполук, пестициди, діючий компонент яких вибирають з цих сполук або з її агрохімічно прийнятної солі, спосіб одержання та застосування композицій, які їх містять, матеріал для розмноження рослин, який оброблений цими композиціями, та спосіб боротьби із шкідниками.

У літературних джерелах як діючі компоненти пестицидів пропонується застосовувати деякі піперидинові похідні. Однак біологічні властивості цих відомих сполук не повністю задовольняють вимогам, які пред'являються до техніки боротьби зі шкідниками, внаслідок чого існує необхідність одержання інших сполук з пестицидними властивостями, головним чином для боротьби з комахами та представниками ряду Asarina. Цю проблему вирішують відповідно до винаходу завдяки створенню запропонованих сполук формули (I).

Сполуки формули (I) і, коли це прийнятно, їх таутомери здатні утворювати солі, наприклад кислотно-адитивні солі. Їх одержують, наприклад, з використанням неорганічних кислот, як правило мінеральних кислот, наприклад сірчаної кислоти, фосфорної кислоти або галоїдводневої кислоти, сильних органічних карбонових кислот, як правило C₁-C₄алканкарбонових кислот, заміщених, наприклад, коли прийнятно, атомом галогену, зокрема оцтової кислоти, таких, як небов'язково ненасичені дикарбонові кислоти, наприклад щавлева, малінова, малеїнова, фумарова або фталева кислоти, таких, як гідроксикарбонові кислоти, наприклад аскорбінова, молочна, яблучна, винна або лимонна кислоти, або бензойна кислота, або органічних сульфонових кислот, як правило C₁-C₄алкан- або арилсульфонових кислот, заміщених, наприклад, коли це прийнятно, атомом галогену, зокрема метан- або п-толуолсульфонові кислоти. У більш широкому значенні сполуки формули (I) із принаймні однією кислотою групою здатні з основами утворювати солі. Придатні солі з основами представляють собою, наприклад, солі металів, такі, як солі лужних і лужноземельних металів, наприклад солі натрію, калію або магнію, або солі з аміаком або органічним аміном, таким, як морфолін, піперидин, піролідин, моно-, ди- або три(нижчий)алкіламін, наприклад етил-, діетил-, триетил- або диметилпропіламін, або моно-, ди- або тригідрокси(нижчий)алкіламін, наприклад моно-, ди- або триетаноламін. Можуть також утворюватися, коли це прийнятно, відповідні внутрішні солі. З одного боку, переважна вільна форма. Із солей сполук формули (I) переважні агрохімічно ефективні солі. У вищевказаній частині даного опису і надалі поняття "вільні сполуки формули (I) або їх солі" використано як таке, що охоплює також, коли це доречно, відповідні солі або поняття "солі" використане як таке, що охоплює також вільні сполуки формули (I). Теж саме застосовується до таутомерів сполук формули (I) та їх солей.

В усіх випадках, якщо не вказано інше, у вищевказаній частині даного опису і надалі загальні поняття використані в значеннях, наведених нижче.

Під атомами галогену як групи або структурних елементів інших груп і сполук, таких, як галоалкіл, галоциклоалкіл, галоалкеніл, галоалкініл та алоалілокси, мають на увазі атоми фтору, хлору, бромі і йоду, зокрема фтору, хлору і бромі, головним чином фтору або хлору, особливо хлору.

В усіх випадках, якщо не вказане інше, кожна з вуглецевмісних груп і сполук містить від 1 до 20 включно, переважно від 1 до 8, зокрема від 1 до 10, переважно від 1 до 6, зокрема від 1 до 4, головним чином від 1 до 3, наприклад 1 або 2, вуглецевих атомів, причому особливо переважний метил.

Алкіл як власне група або структурний елемент інших груп і сполук, таких, як галоалкіл, алкокси, алкоксіалкіл, галоалкокси, алкоксикарбоніл, алкілтіо, галоалкілтіо, алкілсульфоніл і алкілсульфонілокси, є (у кожному випадку з відповідним урахуванням конкретної кількості вуглецевих атомів у розглянутій групі або сполуці) або прямоланцюговим, наприклад метил, етил, н-пропіл, н-бутил, н-гексил, н-октил, н-децил, н-додецил, н-гексадецил або н-октадецил, або розгалуженим, наприклад ізопропіл, ізобутил, втор-бутил, трет-бутил, ізопентил, неопентил або ізогексил.

Алкеніл і алкініл як власне групи або структурні елементи інших груп та сполук, таких, як галоалкеніл, галоалкініл, алкенілокси, галоалкенілокси, алкінілокси і галоалкінілокси є прямоланцюговими або розгалуженими і відповідно включають по два або, що переважно, по одному ненасиченому вуглець-вуглецевому зв'язку. Як приклади можуть бути згадані вініл, проп-2-ен-1-іл, метилпроп-2-ен-1-іл, бут-2-ен-1-іл, бут-3-ен-1-іл, проп-2-ин-1-іл, бут-2-ин-1-іл і бут-3-ин-1-іл.

Прикладами циклоалкілу як власне групи і як структурного елементу інших груп і сполук слугують циклопропіл, циклобутил, циклопентил, циклогексил, циклогептил і циклооктил. Циклопентил і циклогексил переважні, особливо циклопропіл.

Галозаміщені вуглецевмісні групи та сполуки, такі, як галоалкіл і галоалкокси, можуть бути частково галоїдованими або пергалоїдованими, причому у випадку пергалоїдування галозамісники можуть бути однаковими або різними. Прикладами галоалкілу як власне групи і як структурного елементу інших груп і сполук, таких, як галоалкокси, є метил, який від моно- до тризаміщений фтором, хлором і/або бромом, такий, як CHF₂, CF₃ або CH₂Cl, або етил, який від моно- до пентазаміщений фтором, хлором і/або бромом, такий, як CH₂CF₃, CF₂CF₃, CF₂CCl₃, CF₂CHCl₂, CF₂CHF₂, CF₂CFCl₂, CH₂CH₂Cl, CF₂CHBr₂, CF₂CHClF, CF₂CHBrF або CClFCHClF, пропіл або ізопропіл, який від моно- до гептазаміщений фтором, хлором і/або бромом, такий, як CH₂CHBrCH₂Br, CF₂CHFCF₃, CH₂CF₂CF₃, CF₂CF₂CF₃, CH(CF₃)₂ або CH₂CH₂CH₂Cl, і бутил або один з його ізомерів, який від моно- до ноназаміщений фтором, хлором і/або бромом, такий, як CF(CF₃)CHFCF₃, CF₂(CF₂)₂CF₃ або CH₂(CF₂)₂CF₃.

Під арилом мається на увазі переважно феніл або нафтил, переважно феніл.

Гетероциклілом позначають 5-7-членне насичене або ненасичені, переважно ароматичне кільце, яке містить від одного до чотирьох гетероатомів, вибраних з ряду, який включає N, O і S. Перевагу віддають ароматичним 5- і 6-членним кільцям, які як гетероатом містять по одному атому азоту і небов'язково по одному додатковому гетероатому, переважно атому азоту або сірки, переважно азоту. Переважними гетероциклічними радикалами є, наприклад, піролід, піразоліл, імідазоліл, 1,2,4-триазоліл, тетразоліл, піразиніл, піридил, піримідиніл, піридазиніл, тіазоліл, ізотіазоліл, ізоксазоліл, індолил, індазоліл, бензімідазоліл, бензотіазоліл, фураніл, тетрагідрофураніл і тієніл; тетразоліл переважний, особливо тетразоліл, який заміщений C₁-C₃залкілом, зокрема метил, етил, пропіл або ізопропіл, переважно етил.

Переважаючими варіантами, беручи до уваги винахід, є сполуки формули (I), у яких

а) R_1 і R_2 кожен незалежно один від одного означає атом галогену, C_1 - C_2 алкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл, гало- C_1 - C_2 алкіл, C_1 - C_2 алкокси, гало- C_1 - C_2 алкокси, $-C(O)N(CH_3)_2$, $-CN$ або $-NO_2$;

незалежно один від одного кожний означає переважно атом галогену, C_1 - C_2 алкіл, гало- C_1 - C_2 алкіл, C_1 - C_2 алкокси або гало- C_1 - C_2 алкокси;

зокрема, незалежно один від одного кожний означає атом фтору або хлору, метил, трифторметил, метокси або трифторметокси;

зокрема, незалежно один від одного кожний означає атом фтору, трифторметил або трифторметокси;

найбільш переважно, коли обидва замісники однакові, m і n кожен

означає 1, а R_1 і R_2 знаходяться в пара-положеннях;

б) R_3 означає водневий атом, OH , атом галогену або C_1 - C_6 алкокси; зокрема водневий атом, OH , атом фтору або метокси;

переважно водневий атом або OH , переважно OH ;

в) R_4 означає C_1 - C_2 алкіл, гало- C_1 - C_2 алкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл, C_3 - C_6 циклоалкокси, гало- C_1 - C_2 алкокси, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, C_1 - C_2 алкокси, $-C(O)-C_3-C_6$ алкіл (дискламація), $-C(O)$ -гало- C_1-C_2 алкіл,

$-C(O)-OC_1-C_2$ алкіл, $-C(O)-O$ -гало- C_1-C_2 алкіл, $-NH-C(O)-O-C_1-C_2$ алкіл, $-NH-C(O)-O$ -гало- C_1-C_2 алкіл, $-C(O)N(R_5)_2$, $-CN$, $-S(O)_2N(R_5)_2$, $-S(O)_p-C_1-C_2$ алкіл, $-S(O)_p$ -гало- C_1-C_2 -алкіл, $-O-S(O)_p-C_1-C_6$ алкіл,

$-O-S(O)_p$ -гало- C_1-C_6 алкіл; бензил, фенокси, бензилокси або феніл, бензил, фенокси або бензилокси, який незалежно від моно- до пентазаміщений замісниками, вибраними з ряду, який включає атом галогену, ціано,

C_1 - C_6 алкіл, C_3 - C_8 циклоалкіл, C_3 - C_8 циклоалкіл- C_1 - C_6 алкіл, гало- C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 алкокси, C_3 - C_8 циклоалкокси, C_3 - C_8 циклоалкокси- C_1 - C_6 алкіл,

C_3 - C_8 циклоалкіл- C_1 - C_6 алкокси, гало- C_1 - C_6 алкокси, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, C_2 - C_6 алкенілокси, C_2 - C_6 алкінілокси, $-NH-C(O)-O-C_1-C_6$ алкіл, $-NH-C(O)-O$ -гало- C_1-C_6 алкіл, $-C(R_7)=N-W-R_8$, феніл, бензил,

фенокси, бензилокси,

гетероциклілі і гетероциклілокси, де гетероциклілі- і гетероциклілоксирадикали необов'язково заміщені C_1 - C_4 -алкілом; головним чином де R_4 означає феніл, який незалежно моно- або дизаміщений, переважно

монозаміщений, переважно в пара-положенні, замісниками, вибраними з ряду, який включає атом фтору, C_1 - C_6 алкокси, C_3 - C_8 циклоалкокси, C_3 - C_8 циклоалкокси- C_1 - C_6 алкіл, C_3 - C_8 циклоалкіл- C_1 - C_6 алкокси,

гало- C_1 - C_6 алкокси, C_2 - C_6 алкенілокси, C_2 - C_6 алкінілокси, $-NH-C(O)-O-C_1-C_4$ алкіл, $-C(R_7)=N-W-R_8$, піридилокси, піридазинілокси і тетразоліл, де кожен тетразоліловий радикал заміщений C_1 - C_4 алкілом, гало- C_1 - C_4 алкілом або C_3 алкенілом;

г) R_5 означає C_1 - C_2 алкіл; переважно метил; д) R_6 означає водневий атом або C_1 - C_3 алкіл; переважно водневий атом;

д) m означає 1, 2 або 3; переважно 1 або 2; зокрема 1;

е) n означає 1, 2 або 3; переважно 1 або 2; зокрема 1;

ж) p означає 1 або 2; переважно 2; и) q означає 1;

з) R_7 означає атом галогену, C_1 - C_6 алкіл, C_3 - C_8 циклоалкіл, C_3 - C_8 циклоалкіл- C_1 - C_6 алкіл, гало- C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 алкокси, C_3 - C_8 циклоалкокси, C_3 - C_8 циклоалкокси- C_1 - C_6 алкіл, гало- C_1 - C_6 алкокси, $-NH(C_1-C_6$ алкіл) або

$-N(C_1-C_6$ алкіл) $_2$;

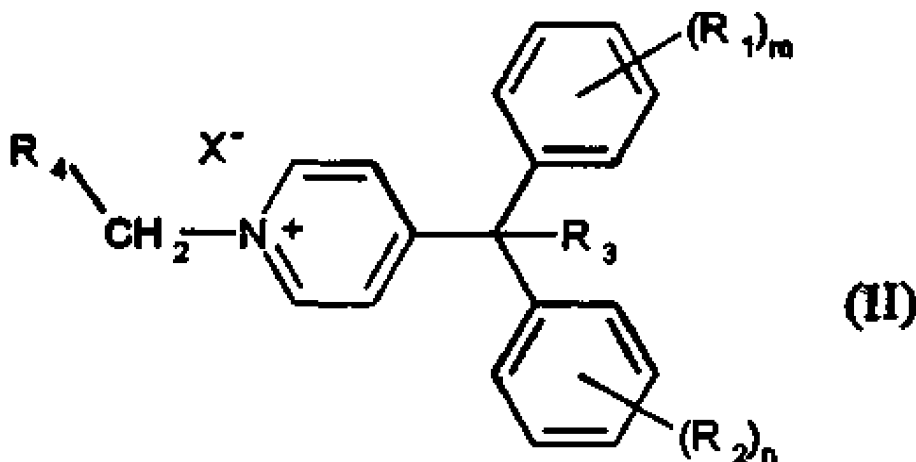
и) R_8 означає водневий атом, C_1 - C_2 алкіл, C_3 - C_8 циклоалкіл, C_1 - C_2 галоалкіл або $-C(O)-C_1-C_6$ алкіл;

к) W означає O або NH ; переважно O .

Особливо переважні, беручи до уваги винахід, сполуки формули (I), перераховані в таблиці 2.

Таким чином, іншим об'єктом винаходу є спосіб, який фахівцям у даній галузі техніки відомий, одержання нових сполук формули (I) або їх солей, який відрізняється тим, що

1) для одержання сполуки формули (I), у якій q означає O , сполуку формули



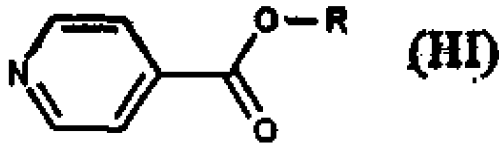
у якій $(R_1)_m$, $(R_2)_n$, R_4 мають значення, вказані вище в описі формули (I), а X означає іон протилежного заряду, такий, як атом галогену, сульфатний або фосфатний, і яка відомий або може бути одержана за відомим методом, обробляють відновником, наприклад $NaBH_4$, коли це прийнятно, у розчиннику, який у вибраних

реакційних умовах інертний, і

2) проводять необов'язкову реакцію одержаної в такий спосіб сполуки формули (I), у якій q означає 0, з окисником, переважно H_2O_2 .

Сполуки формули (II) можуть бути одержані наступними шляхом

3) коли $(R_1)_m$, і $(R_2)_n$ однакові, проводять реакцію сполуки формули



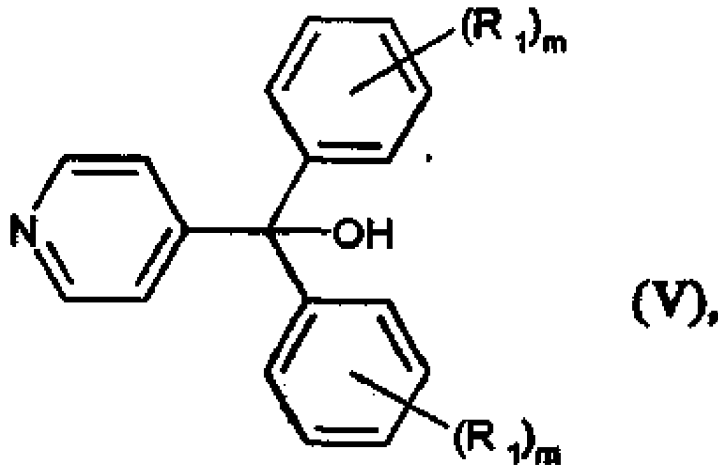
у якій R означає C_1 - C_{12} алкіл, із двома молями сполуки формули



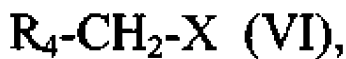
яка відома або може бути одержана за відомими способами і де

$(R_1)_m$ має значення, вказані вище в описі формули (I), у присутності магнію або н-бутиллітію; і

4) проводять реакцію одержаної в такий спосіб сполуки формули

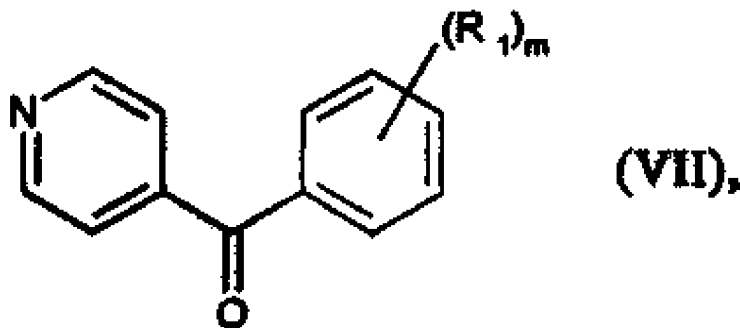


у якій R_1 і m мають значення, вказані в описі формули (I), із сполукою формули



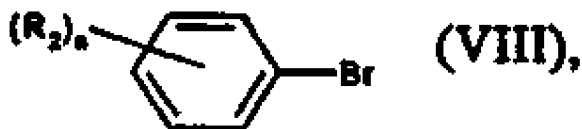
у якій R_4 має значення, вказані вище в описі формули (I), а X означає групу, що вилучається, переважно атом хлору або броду.

Ще одним об'єктом винаходу є спосіб одержання сполук формули (I) або їх солей, який відрізняється тим, що 5) для одержання сполуки формули (I), у якій $(R_1)_m$ і $(R_2)_n$ однакові або різні, а R_3 означає OH, проводять реакцію сполуки формули (IV) з ізонікотинонітрилом у присутності магнію або н-бутиллітію, а сполуку формули

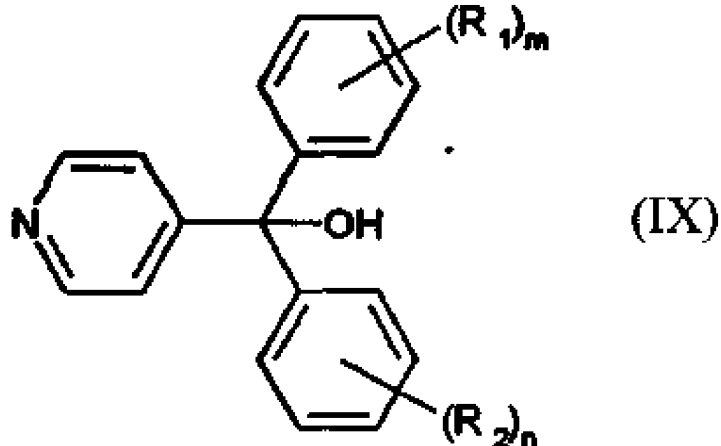


60 одержану після кислотного гідролізу, де $(R_1)_m$ має значення, наведені вище в описі формули (I), вводять у взаємодію з сполукою формули

65

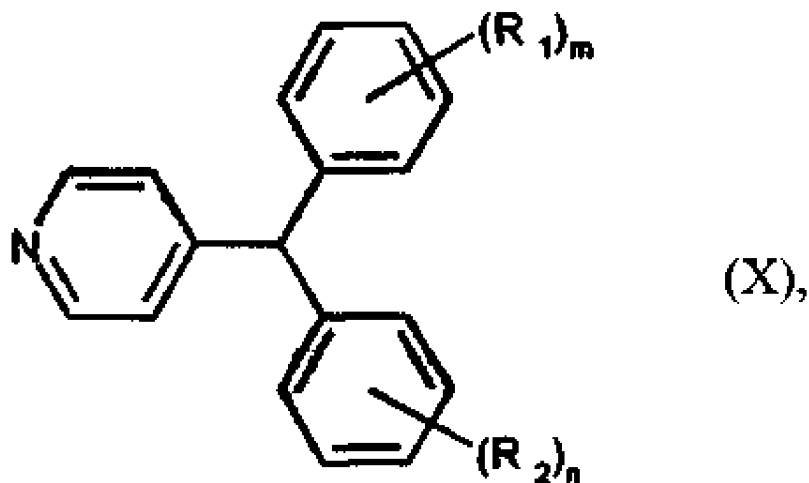


яка відома або може бути одержана за відомими способами, і де $(R_2)_n$ має значення, наведені вище в описі формули (I), у присутності магнію або н-бутиллітію; а одержану в такий спосіб сполуку формули



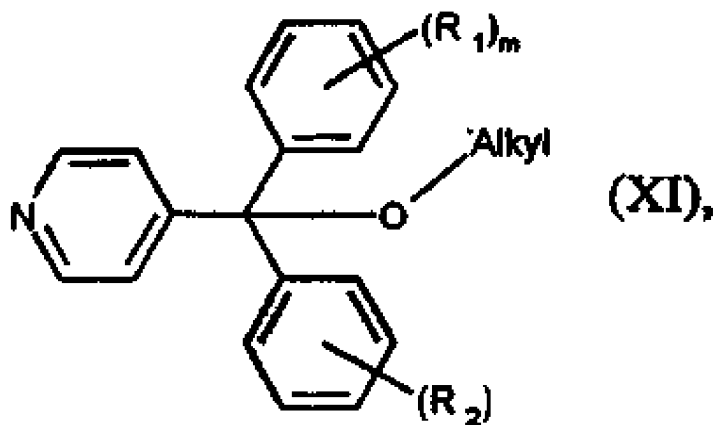
25 у якій $(R_1)_m$ і $(R_2)_n$ мають значення, вказані в описі формули (I), надалі вводять у взаємодію аналогічно до технологічних стадій 4), 1) і необов'язково 2) з одержанням сполуки формули (I).

6) Для одержання сполуки формули (I), у якій R_3 означає водневий атом, проводять реакцію сполуки формули (IX) з відновником, наприклад і триетилсиланом, у присутності трифтороцтової кислоти або трифторметансульфонової кислоти з одержанням сполуки формули



35 у якій $(R_1)_m$ і $(R_2)_n$ мають значення, вказані в описі формули (I), і надалі цю сполуку формули (X) вводять у взаємодію аналогічно до технологічних стадій 4), необов'язково 2).

50 7) Для одержання сполуки формули (I), у якій R_3 означає алкокси, проводять реакцію сполуки формули (IX) з алкілгалогенідом у присутності сильної основи, такої, як гідрид натрію, з одержанням сполуки формули



у якій $(R_1)_m$ і $(R_2)_n$ мають значення, вказані в описі формули (I), і надалі цю сполуку формули (XI) вводять у взаємодію аналогічно до технологічних стадій 4), і необов'язково 2) з одержанням сполуки формули (I)

і/або, якщо це необхідно, сполуку формули (I), яка може бути одержана відповідно до такого методу або за допомогою інших засобів, що знаходиться у вільній формі або у формі солі, перетворюють в іншу сполуку формули (I), суміш ізомерів, яка може бути одержана відповідно до такого методу, розділяють і виділяють цільовий ізомер і/або вільну сполуку формули (I), яка може бути одержана відповідно до таких методів або за допомогою інших засобів, перетворюють у сіль або ж сіль сполуки формули (I), яка може бути одержана відповідно до такого методу або за допомогою інших засобів, перетворюють у вільну сполуку формули (I) або в іншу сіль.

Перераховані вище та в подальшому вихідні матеріали формул (III), (IV), (VI), (VIII), які використовують для одержання сполук формули (I), у вільній формі або у формі солі відомі або можуть бути одержані за методами, які відомі. Сполуки формул (II), (V), (IX), (X) і (XI) частково відомі. Якщо вони є новими, то вони, отже, також становлять об'єкт винаходу.

Описані вище і надалі реакції проводять відомим шляхом, наприклад у відсутності, або, коли це прийнятно, у середовищі придатного розчинника або розріджувача, або їх суміші, підтримуючи необхідні умови пониженої температури, кімнатної температури або підвищеної температури, наприклад температури в інтервалі від приблизно -80°C до температури кипіння реакційного середовища, переважно від приблизно -20°C до приблизно $+150^{\circ}\text{C}$, і, коли це прийнятно, у закритій посудині під тиском, в атмосфері інертного газу і/або в безводних умовах. Особливо переважні реакційні умови описані в прикладах.

Під групами, що вилучаються, у попередній частині даного опису й у подальшому розуміють усі групи, що видаляються, які у хімічних реакціях є звичайними і відомими фахівцю в даній галузі техніки, зокрема атоми галогену, такі, як атоми фтору, хлору, бромю і йоду, $-\text{O}-\text{C}(=\text{O})-\text{A}$, $-\text{O}-\text{P}(=\text{O})(\text{W})_2$, $-\text{O}-\text{Si}(\text{C}_1-\text{C}_8)\text{алкіл}_3$, $-\text{O}-(\text{C}_1-\text{C}_8)\text{алкіл}$, $-\text{O}-\text{арил}$, $-\text{O}-\text{S}(=\text{O})_2\text{W}$, $-\text{S}-\text{P}(=\text{O})(\text{W})_2$, $-\text{S}-\text{P}(-\text{S})(\text{W})_2$, $-\text{S}-\text{S}-(\text{C}_1-\text{C}_8)\text{алкіл}$, $-\text{S}-\text{S}-\text{арил}$, $\text{S}-(\text{C}_1-\text{C}_8)\text{алкіл}$, $-\text{S}-\text{арил}$, $-\text{S}(-\text{O})\text{W}$ або $-\text{S}(=\text{O})_2\text{W}$, де радикал W необов'язково заміщений C_1-C_8 алкілом, C_2-C_8 алкенилом, C_2-C_8 алкінілом, необов'язково заміщеним арилом, необов'язково заміщеним бензилом, C_1-C_8 алкокси або ди(C_1-C_8 алкіл)аміном, у яких алкільні групи один від одного не залежать, NO_3 , NO_2 , або залишком сульфату, сульфїту, фосфату, фосфїту, карбоксилату, складного іміноєфіру, N_2 або залишком карбамату. Як групи, що вилучаються, особливо переважні атоми хлору і бромю, особливо хлору.

Як окисники використовують, наприклад, неорганічні пероксиди, такі, як перборат натрію, перманганат калію і пероксид водню, або мета-хлорпербензойну кислоту (МХПБК), органічні перкислоти, такі, як пербензойна кислота, пероцтова кислота та суміші органічних кислот з пероксидом водню, такі, як оцтова кислота/пероксид водню.

У переважному варіанті реакцію за способом 1) проводять у спиртах, таких, як метанол і етанол, у температурному інтервалі від 0°C до $+50^{\circ}\text{C}$, переважно при кімнатній температурі. Переважним відновником є боргїдрид натрію.

У варіанті способу 2) як переважні розчинники використовують спирти, такі, як метанол і етанол. Процес переважніше проводити при кімнатній температурі; особливо доцільними окисниками є H_2O_2 і перкислоти, зокрема H_2O_2 .

У варіанті способу 3) і 5) як переважний розчинник використовують діалкіловий ефір або тетрагідрофуран; процес проводять у температурному інтервалі від -70°C до кімнатної температури, а як металуючий агент застосовують магній або н-бутиллітій.

У варіанті способу 4) використовують інертні розчинники, такі, як бензол, толуол, ксилоли, ацетонїтрил, пропіонїтрил, етилацетат, пропілацетат, бутилацетат, ацетон, діетилкетон, метилетилкетон і метилізобутилкетон. Температурний інтервал становить від кімнатної температури до температури кипіння відповідного розчинника, причому температура кипіння переважна.

У варіанті способу 6) як переважний відновник використовують триетилсилан у присутності кислоти, такої, як трифтороцтова кислота або трифторметансульфонова кислота.

У варіанті способу 7) як розчинник прийнятний диметилформамід або тетрагідрофуран, переважно диметилформамід; переважною основою є гїдрид натрію.

Сполуки формули (I), які можуть бути одержані відповідно до такого методу або за допомогою інших засобів, за відомими методами, відповідно до винаходу можуть бути перетворені в інші сполуки формули (I) шляхом заміни відповідним чином одного або декількох замісників вихідної сполуки формули (I) іншим (іншими) замісником (замісниками).

Залежно від вибору відповідних реакційних умов та вихідних матеріалів відповідно до винаходу в одну реакційну стадію можлива заміна лише одного замісника іншим замісником або ж відповідно до винаходу на одній і тій же стадії можна замінювати декілька замісників іншими замісниками.

Солі сполук формули (I) можуть бути одержані за відомим методом. Так, наприклад, можна одержувати солі сполук формули (I) з основами обробленням вільної сполуки відповідною основою або відповідним іонообмінним реагентом.

Солі сполук формули (I) можуть бути перетворені у вільні сполуки формули (I) за звичайним методом, наприклад обробленням придатною кислотою або прийнятним іонообмінним реагентом.

Солі сполук формули (I) звичайним шляхом можуть бути перетворені в інші солі сполуки формули (I).

Сполуки формули (I) у вільній формі або у формі солі можуть існувати у вигляді ізомерів або їх суміші, наприклад залежно від кількості, абсолютної або відносної конфїгурації наявних у молекулі асиметричних вуглецевих атомів, і/або залежно від конфїгурації наявних у молекулі неароматичних подвійних зв'язків, у

5 вигляді чистих ізомерів, таких, як антиподи і/або діастереоізомери або у вигляді сумішей ізомерів, таких, як суміші енантіомерів, наприклад рацемати, суміші діастереоізомерів або суміші рацематів. Винахід стосується як чистих ізомерів, так і всіх можливих сумішей ізомерів і, отже, вищевикладене й подальше слід розуміти відповідним чином у всіх випадках, навіть якщо стереохімічні подробиці конкретно не згадані.

10 Залежно від вибору вихідних матеріалів і методів суміші діастереоізомерів, суміші рацематів і суміші ізомерів за конфігурацією подвійних зв'язків сполук формули (I) у вільній формі або у формі солі, які можуть бути одержані за даним методом або іншим шляхом, можуть бути розділені за відомим методом, заснованим на фізико-хімічних відмінностях їх компонентів, на чисті діастереоізомери або рацемати, наприклад фракційною кристалізацією, дистиляцією і/або хроматографією.

15 Одержувані відповідно суміші енантіомерів, таких як рацемати, можуть бути розділені на оптичні антиподи за відомими методами, наприклад перекристалізацією з оптично активного розчинника, хроматографією на хіральных адсорбентах, наприклад рідинною хроматографією під високим тиском на ацетилцелюлозі, за допомогою придатних мікроорганізмів, шляхом розщеплення з використанням особливих, іммобілізованих ферментів, за допомогою утворення сполук включення, наприклад з використанням краун-ефірів, завдяки чому в комплексоутворенні приймає участь лише один енантіомер, або шляхом перетворення в солі діастереоізомерів і розділення одержаної в такий спосіб суміші діастереоізомерів, наприклад ґрунтуючись на відмінності їх розчинностей, фракційною кристалізацією на діастереоізомери, з яких під дією відповідних агентів може бути виділений цільовий енантіомер.

20 Відповідно до винаходу на додаток до виділення відповідних сумішей ізомерів при одержанні чистих діастереоізомерів або енантіомерів можна також застосовувати загальновідомі методи діастереоселективного або енантіоселективного синтезу, наприклад здійсненням способу за винаходом з використанням виділених речовин і відповідно до прийнятої стереохімії.

25 Доцільно виділяти або синтезувати біологічно більш активний ізомер, наприклад енантіомер або діастереоізомер, або суміш ізомерів, наприклад суміш енантіомерів або суміш діастереоізомерів, за умови, що індивідуальні компоненти виявляють різну біологічну ефективність.

30 Сполуки формули (I) у вільній формі або у формі солі можуть бути також одержані у вигляді їх гідратів і/або можуть також включати інші розчинники, використовувані, наприклад, коли вони необхідні для кристалізації сполук, що знаходяться у твердому стані.

35 Винахід стосується також всіх тих варіантів способу, відповідно до якого виходять із сполуки, яка може бути одержана як вихідний матеріал або проміжний продукт на будь-якій стадії здійснення цього способу, і здійснюють усі або деякі з відсутніх стадій, або застосовують або (переважно в реакційних умовах) одержують вихідний матеріал у формі похідного або солі і/або її рацемату або енантіомеру.

40 У переважному варіанті способу за даним винаходом кожний з використовуваних вихідних матеріалів та проміжних продуктів у вільній формі або у формі солі представляє собою ту речовину, з якої одержують сполуку формули (I) або її сіль, представлену на початку опису як особливо ефективну.

Винахід стосується переважно способу одержання, описаному в прикладі П1.

45 Запропоновані відповідно до винаходу сполуки формули (I) є ефективними речовинами, які мають профілактичну дію і/або пригнічуючу шкідників дію, призначеними для боротьби із шкідниками і які проявляють навіть у низьких концентраціях поліпшений спектр біологічного дії при поліпшеній переносимості теплокровними тваринами, рибами та рослинами. Запропоновані відповідно до винаходу діючі компоненти виявляють ефективність проти тварин-шкідників на всіх або окремих стадіях їх розвитку, яким властива як нормальна сприйнятливність, так і резистентність, таких, як комахи і представники ряду Acarina. Інсектицидний або акарицидний ефект діючих сполук за винаходом здатний виявлятися безпосередньо, тобто знищення цих шкідників відбувається або відразу ж, або через деякий період часу, наприклад у період линяння, або непрямо, наприклад у зменшенні числа яєць, що відкладаються, і/або у швидкості вилуплення, причому хороша ефективність відповідає ступеню пестицидної дії (летальності) принаймні від 50 до 60%.

50 Такі тварини-шкідники включають, наприклад, ті, які згадані в заявці EP-A 736252. Таким чином, перераховані в ній шкідники як посилення включені в об'єкт даного винаходу. Запропоновані відповідно до даного винаходу діючі речовини особливо ефективні для боротьби з *Voorphilus microplus*, *Nilaparvata lugens* і *Tetrananychus urticae*, переважно для боротьби з цими шкідниками на овочевих, фруктових та рисових культурах.

55 З використанням діючих речовин за винаходом можна вести боротьбу (тобто пригнічувати або викоринювати) зі шкідниками згаданого типу, які зустрічаються на рослинах, головним чином на сільськогосподарських культурах і декоративних рослинах, культивованих у сільському господарстві, садівництві та лісовому господарстві, або на частинах рослин, таких, як плоди, квіти, листя, стебла, бульби і корені, причому такий захист зберігається на частинах деяких рослин доти, поки не відбувається їх подальший ріст.

60 Цільові сільськогосподарські культури включають головним чином зернові, такі, як пшениця, ячмінь, жито, овес, рис, кукурудза і сорго; буряк, такий, як буряк цукровий і буряк кормовий; плодови, наприклад насіннячкові, кісточкові і ягідні, такі, як яблуні, груші, сливи, персики, мигдальні дерева, вишні або ягоди, наприклад полуницю, малину та ожину; бобові рослини, такі, як боби, сочевиця, горох і соя культурна; олійні культури; такі, як рапс, гречиця, мак, маслини, соняшник, кокос, рицина звичайна, дерева какао й арахіс;

65 огіркові культури, такі, як гарбузи, огірки і дині; волокнисті рослини, такі, як бавовник, льон, коноплі і джут; цитрусові, такі, як апельсини, лимони, грейпфрути і мандарини; овочі, такі, як шпинат, салат латук, спаржа, капуста, морква, цибуля, томати, картопля і перець овочевий солодкий; *lauraceae*, такі, як авокадо, коричне дерево і камфорне дерево; а також тютюн, горіхи, кавове дерево, баклажани, цукровий очерет, чайний кущ, перець, виноградна лоза, хміль, банани, каучуконоси та декоративні рослини.

Іншими галузями застосування діючих речовин за винаходом є захист продуктів на зберіганні і запасів та матеріалу, а в секторі гігієни-головним чином захист домашніх тварин та худоби від шкідників згаданого типу.

Винахід стосується також пестицидів, таких, як емульгувальні концентрати, суспензійні концентрати, готові до розпилення й готові до розведення розчини, пасти для нанесення покрить, розведені емульсії, розпорозувані порошки, розчинні порошки, диспергувальні порошки, змочувані порошки, дуети, грануляти і інкапсульовані препарати в полімерних матеріалах (вибраних відповідно до передбаченої мети й переважаючими обставинами), які включають принаймні по одній діючій речовині за винаходом.

У цих композиціях діючу речовину використовують у чистому вигляді й у вигляді твердого діючого компонента, наприклад у вигляді частинок визначеного розміру, або, що переважно, разом із принаймні однією з добавок, які звичайно застосовують у технології приготування композиції, таких, як наповнювачі, наприклад розчинники або тверді носії, і поверхнево-активні речовини.

Добавками, які можуть бути використані для приготування композицій, є, наприклад, тверді носії, розчинники, стабілізатори, засоби "уповільнення вивільнення", барвники і, коли це прийнятно, поверхнево-активні речовини. Носіями та добавками можуть служити будь-які речовини, які звичайно застосовують у засобах захисту сільськогосподарських культур, головним чином у засобах боротьби з слизнями та равликами. Як добавки, такі, як розчинники, тверді наповнювачі, поверхнево-активні речовини, зокрема неіоногенні поверхнево-активні речовини, катіоноактивні речовини, аніоноактивні речовини, і інші добавки, у композиціях за винаходом можуть бути використані, наприклад, такі ж, як ті, які описані в EP-A 736252 і як

посилання включені в об'єкт даного винаходу. Як правило композиції включають від 0,1 до 99%, переважно від 0,1 до 95%, діючого компонента і від 1 до 99,9%, переважно від 5 до 99,9%, принаймні однієї твердої або рідкої добавки, причому як правило від 0 до 25%, переважно від 0,1 до 20%, цієї композиції може припадати на частку поверхнево-активних речовин (у кожному випадку % означає масовий відсоток). У той час як концентрованим композиціям перевагу віддають при приготуванні технічної продукції, кінцевий споживач як правило застосовує розведені композиції, яким властиво значно більш низький вміст діючого компонента. Переважні композиції готують, зокрема, у такий спосіб (% означає масовий відсоток):

Емульгувальні концентрати:

діючий компонент:	від 1 до 95%,	переважно від 5 до 20%
поверхнево-активна речовина:	від 1 до 30%,	переважно від 10 до 20%
розчинник:	від 5 до 98%,	переважно від 70 до 85%

Дусти:

діючий компонент:	від 0,1 до 10%	переважно від 0,1 до 1%
твердий носій:	від 99,9 до 90%,	переважно від 99,9 до 99%

Суспензійні концентрати:

діючий компонент:	від 5 до 75%,	переважно від 10 до 50%
вода:	від 94 до 24%,	переважно від 88 до 30%
поверхнево-активна речовина:	від 1 до 40%,	переважно від 2 до 30%

Змочувані порошки:

діючий компонент:	від 0,5 до 90%,	переважно від 1 до 80%
поверхнево-активна речовина:	від 0,5 до 20%,	переважно від 1 до 15%
твердий носій:	від 5 до 99%,	переважно від 15 до 98%

Грануляти:

діючий компонент:	від 0,5 до 30%,	переважно від 3 до 15%
твердий носій:	від 99,5 до 70%,	переважно від 97 до 85%

Діапазон активності композицій за винаходом можна істотно розширити та їх адаптувати до переважаючого обставинам додаванням інших інсектицидних речовин. Додатковими діючими речовинами є, наприклад, речовини таких класів: фосфорорганічні сполуки, нітрофеноли та їх похідні, формамідини, ацилсечовини, карбамати, піретроїди, нітроенаміни та їх похідні, піроли, тіосечовини та їх похідні, хлоровані вуглеводні та препарати *Bacillus thuringiensis*. Композиції за винаходом можуть також включати інші тверді та рідкі добавки, такі, як стабілізатори, наприклад рослинні олії, епоксидовані, коли це прийнятно (наприклад, епоксидована кокосова олія, рапсова олія або соєва олія), піногасники, наприклад силіконова олія, консерванти, модулятори в'язкості, в'язучі речовини і/або речовини для підвищення клейкості, а також добрива або інші діючі речовини для досягнення певних ефектів, наприклад акарициди, бактерициди, фунгіциди, нематоциди, молюскициди або селективні гербіциди.

Композиції за винаходом готують за відомими методами за відсутності добавок, наприклад подрібненням, просіюванням і/або роздавлюванням твердого діючого компонента або суміші діючих компонентів, зокрема до частинок певного розміру, і в присутності принаймні однієї добавки, наприклад гомогенним змішуванням і/або подрібненням діючого компонента або суміші діючих компонентів з добавкою (добавками). Такі методи приготування композицій за винаходом і застосування сполук формули (I) при приготуванні композицій також становлять об'єкт винаходу.

Методи застосування цих композицій, тобто методи боротьби із шкідниками згаданого типу, такі, як розпилення, дрібнодисперсне розбризкування, обпилення, нанесення покриття, протрукування, розкидання або полив, які вибирають відповідно до намічених цілей і переважаючих обставин, і застосування композицій для

боротьби зі шкідниками згаданого типу становлять додаткові об'єкти винаходу. Типова концентрація діючого компонента знаходиться в межах від 0,1 до 1000 част./млн, переважно в межах від 0,1 до 500 част./млн. Норми витрати звичайно становлять від 1 до 2000 г діючого компонента на гектар, переважно від 10 до 1000 г/га, переважно від 20 до 600 г/га.

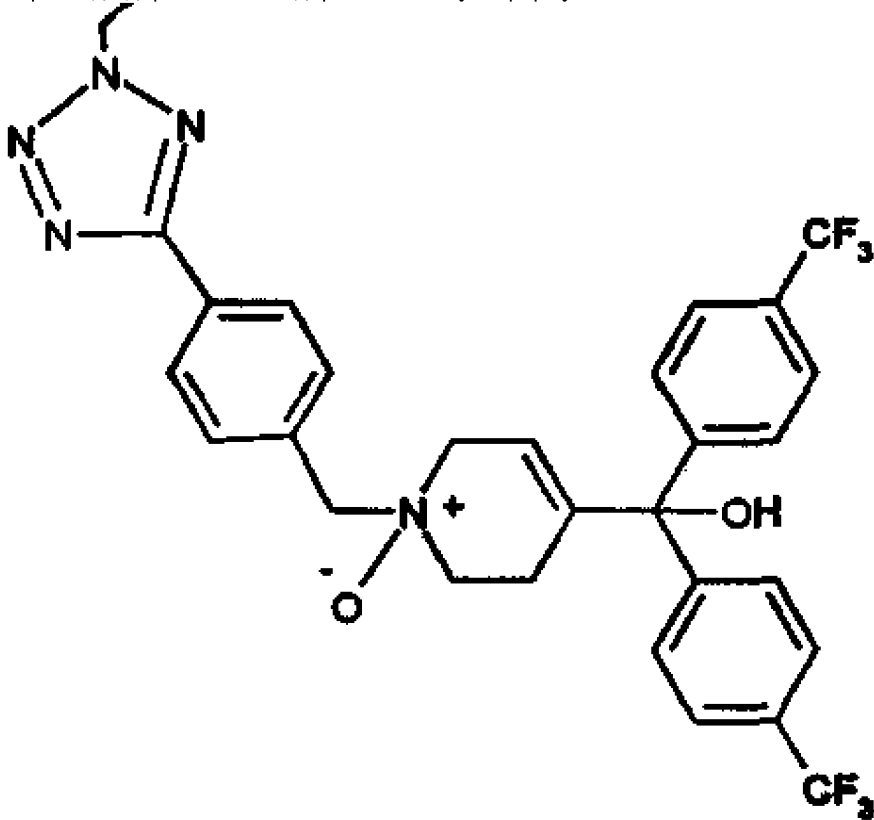
Переважний метод оброблення для захисту сільськогосподарської культури полягає в нанесенні діючого компонента на листки рослин (обробка листя), причому число оброблень та норма витрати залежить від ступеня інвазії шкідниками, про які йде мова. Однак діючі компоненти здатні також пенетрувати у рослину через корені (системна дія) при просочуванні місця виростання рослини рідкою композицією або при внесенні діючого компонента у твердій формі за місцем виростання рослини, наприклад у ґрунт, зокрема в гранульованому вигляді (оброблення ґрунту). У випадку рисівництва гранули можна дозувати в затоплюване рисове поле.

Композиції за винаходом можна також використовувати для захисту матеріалу для розведення рослин, включаючи генетично змінений матеріал для розведення, наприклад насіння, такі, як плоди, бульби і зерна, а також розсаду, від тварин-шкідників. Матеріал для розведення можна обробляти композицією перед початком культивування, причому, наприклад, насіння перед висівом протруюють. Діючі речовини за винаходом можна також наносити на насіння (нанесення покриття) або вимочуванням насіння у рідкій композиції, або нанесенням на них шару твердої композиції. Композицію можна також застосовувати, коли насіння висівають у насіннєву борозну. Методи оброблення матеріалу для розведення рослин і оброблений у такий спосіб матеріал для розведення становлять додаткові об'єкти винаходу.

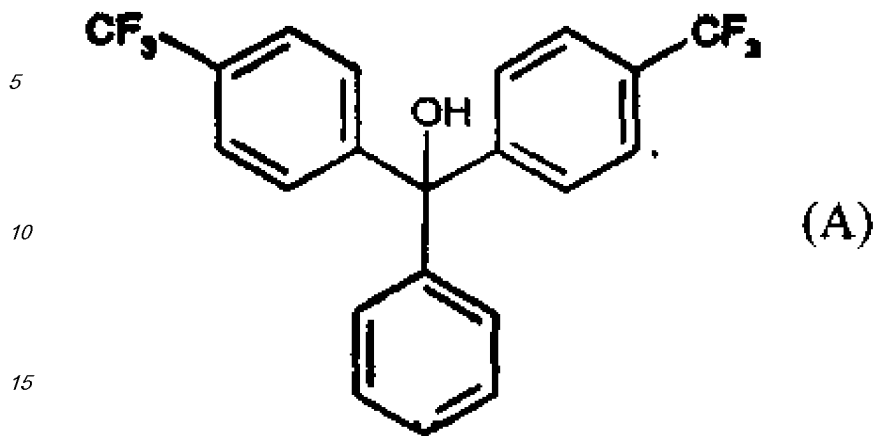
Винахід ілюструють такі приклади. Вони ні в якій мірі не обмежують обсяг винаходу. Температура наведена в градусах Цельсія, а пропорції розчинників у суміші вказані в об'ємних частинах.

Приклади одержання

Приклад одержання П1: одержання сполуки формули

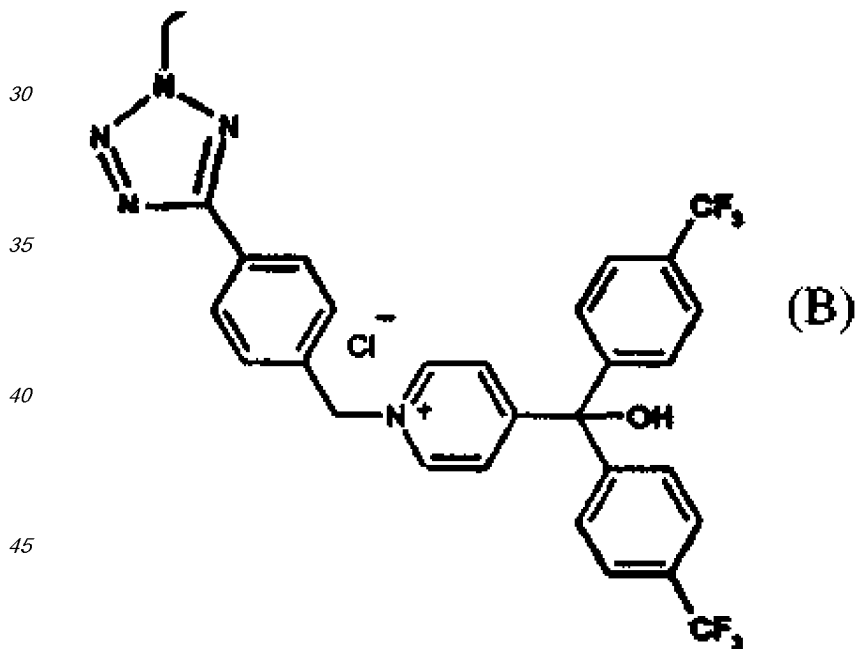


а) Одержання сполуки формули

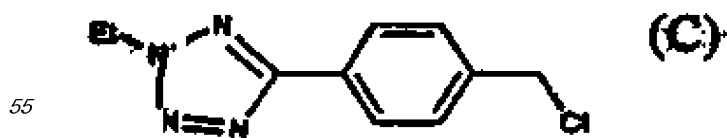


3,4г магнію покривають шаром з 20мл діетилового ефіру, а потім при перемішуванні повільно, по краплях додають 30,0г 4-бромбензотрифториду в 80мл діетилового ефіру. Після перемішування протягом 1год. повільно, по краплях додають 6,1мл етилового ефіру ізонікотинової кислоти в 40мл діетилового ефіру і перемішування продовжують протягом наступних 5год. Потім суміш обережно гідролізують розведеною оцтовою кислотою, двічі промивають водою й один раз розчином хлориду натрію, органічну фазу сушать над сульфатом натрію і під вакуумом концентрують. Залишок хроматографують на силікагелі за допомогою гексану/етилацетату (у співвідношенні 2:1). У вигляді жовтого масла одержують продукт, який кристалізують з діетилового ефіру/гексану у вигляді бежевих кристалів з $t_{пл}$ 161-163°C.

б) Одержання сполуки формули



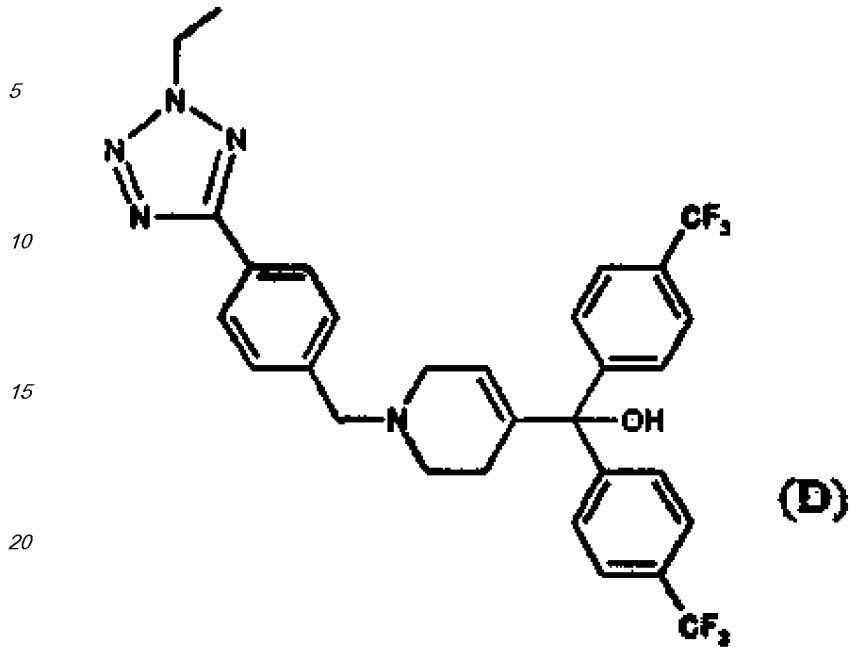
2,0г вищевказаної сполуки (A) і 1,4г сполуки формули



протягом 72год. витримують у 50мл толуолу при температурі кипіння із зворотним холодильником. Після охолодження реакційної суміші і додавання по краплях діетилового ефіру сполука (C) кристалізується у вигляді безбарвних кристалів з $t_{пл}$ 233-242°C.

в) Одержання сполуки формули

65



25 1,2г сполуки (Б) у 20мл метанолу у вигляді порцій змішують з 0,14г боргідриду натрію і перемішують протягом 1год. Після додавання 1мл ацетону реакційну суміш змішують з етилацетатом і двічі промивають водою й один раз розчином хлориду натрію, органічну фазу сушать над сульфатом натрію і концентрують під вакуумом. Сполуку (Г) одержують у вигляді безбарвної піни.

г) Одержання вказаної в заголовку сполуки

30 0,84г сполуки (Г) у 25мл метанолу перемішують протягом 48год. при кімнатній температурі разом з 2,8мл 30%-ного пероксиду водню. Реакційну суміш змішують з етилацетатом і двічі промивають водою й один раз розчином хлориду натрію, органічну фазу сушать над сульфатом натрію і концентрують під вакуумом. Сполуку кристалізують з дихлорметану/гексану, одержуючи безбарвні кристали з $t_{пл}$ 156-167°C.

35 Приклад П2: інші сполуки таблиць 1 та 2 можуть бути одержані аналогічно до вищевикладеного. У цих таблицях $t_{пл}$ позначена як точка плавлення в °С, Me означає метил, Et означає етил, ізо-проп. означає ізопропіл, ізо-бут. означає ізобутил, а ц-проп. означає циклопропіл.

Таблиця 1

Сполуки формули

40

45

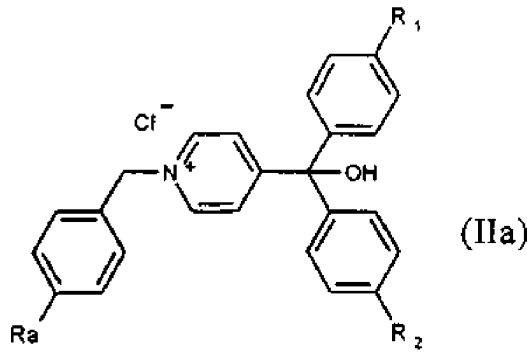
50

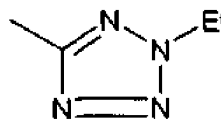
55

60

65

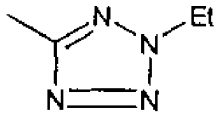
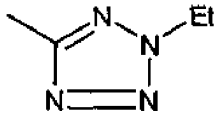
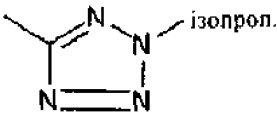
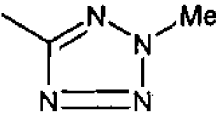
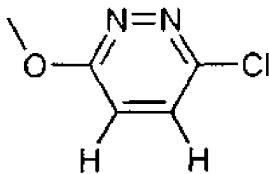
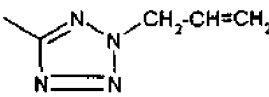
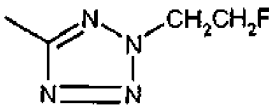
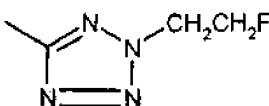
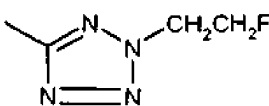
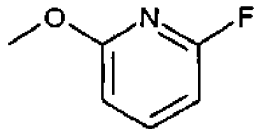
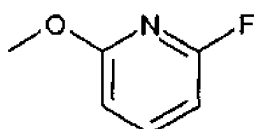
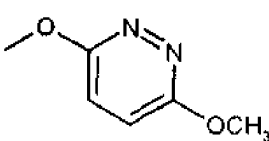
5
10
15
20
25
30
35
40
45
50
55
60
65



Прикл.№	R ₁	R ₂	R _a	Точка плавлення
1 1	OCF ₃	OCF ₃	n-пропокси	147-150
1 2	OCF ₃	OCF ₃	OMe	108-114
1 3	OCF ₃	OCF ₃	бензилокси	149-151
1 4	OCF ₃	OCF ₃	циклопентилокси	137-145
1 5	OCF ₃	CF ₃	ізопропілокси	76-84
1 6	OCF ₃	OMe	ізопропілокси	тверда речовина
1 7	OCF ₃	F	ізопропілокси	58-63
1 8	CF ₃	OMe	-O-CH ₂ -ц-проп	111-118
1 9	OCF ₃	CF ₃	2-піридилокси	83-90
1 10	OCF ₃	OCF ₃	NHCOOEt	135-143
1 11	CF ₃	CF ₃	NHCOOEt	238-240
1 12	CF ₃	F	NHCOOEt	тверда речовина
1 13	OCF ₃	OMe	NHCOOEt	179-184
1 14	OCF ₃	OCF ₃	NHCOO-ізопроп.	130-133
1 15	CF ₃	CF ₃	NHCOO-ізопроп.	239-241
1 16	CF ₃	CF ₃		233-242
1 17	Cl	Cl	NHCOO-ізобутил	150-153
1 18	CF ₃	CF ₃	NHCOO-ізобутил	145-147

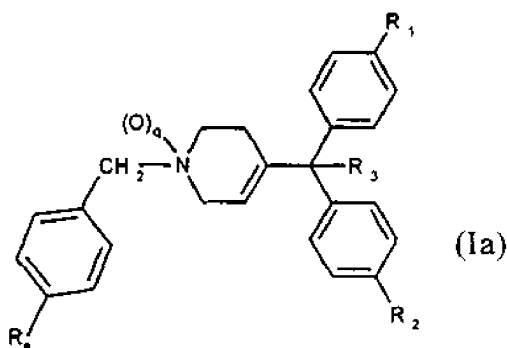
UA 7 5 0 5 1 C 2

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

1.19	OCF ₃	OCF ₃		206-208
1.20	OCF ₃	CF ₃		203-205
1.21	CF ₃	CF ₃		229-232
1.22	CF ₃	CF ₃		260-262
1.23	CF ₃	CF ₃		247-249
1.24	трет-бут	трет-бут	NHCOO-ізопрор.	190-197
1.25	CF ₃	CF ₃		135-140
1.26	CF ₃	CF ₃		224-227
1.27	OCF ₃	CF ₃		193-197
1.28	OCF ₃	OCF ₃		188-192
1.29	CF ₃	CF ₃	-C ₆ H ₅	160-165
1.30	CF ₃	CF ₃		210-212
1.31	OCF ₃	OCF ₃		116-120
1.32	CF ₃	CF ₃		195-200

Таблиця 2

Таблиця 2: сполуки формули



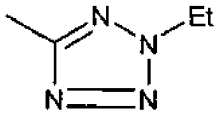
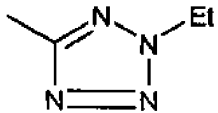
№	R ₁	R ₂	R _a	R ₃	q	фіз. дані
2.1	OCF ₃	OCF ₃	н-пропокси	ОН	0	у вигляді смоли
2.2	OCF ₃	OCF ₃	O-Et	ОН	0	у вигляді смоли
2.3	OCF ₃	OCF ₃	н-бутокси	ОН	0	у вигляді смоли
2.4	OCF ₃	OCF ₃	OMe	ОН	0	у вигляді смоли
2.5	OCF ₃	OCF ₃	н-пропокси	ОН	1	t _{пл} : 175
2.6	OCF ₃	OCF ₃	-O-CH ₂ -α-проп.	ОН	0	у вигляді піни
2.7	OCF ₃	OCF ₃	алілокси	ОН	0	у вигляді смоли
2.8	OCF ₃	OCF ₃	ізобутилокси	ОН	0	у вигляді піни
2.9	OCF ₃	OCF ₃	пропаргілокси	ОН	0	у вигляді масла
2.10	OCF ₃	OCF ₃	бензилокси	ОН	0	у вигляді смоли
2.11	OCF ₃	OCF ₃	втор-бутилокси	ОН	0	у вигляді смоли
2.12	OCF ₃	OCF ₃	ізопропілокси	ОН	0	у вигляді смоли
2.13	OCF ₃	OCF ₃	F	ОН	0	у вигляді смоли
2.14	CF ₃	CF ₃	н-пропокси	ОН	0	у вигляді піни
2.15	F	OMe	н-пропокси	ОН	0	у вигляді смоли
2.16	OCF ₃	OCF ₃	циклопентилокси	ОН	0	у вигляді піни
2.17	OCF ₃	OCF ₃	н-пропокси	ОН	0	у вигляді смоли
2.18	OCF ₃	F	н-пропокси	ОН	0	у вигляді смоли
2.19	CF ₃	OMe	н-пропокси	ОН	0	у вигляді смоли

U A 7 5 0 5 1 C 2

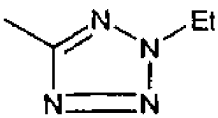
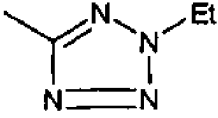
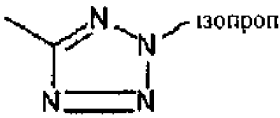
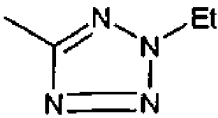
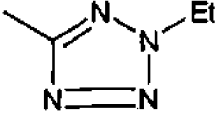
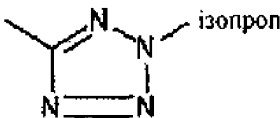
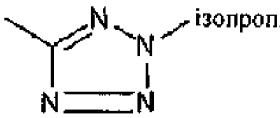
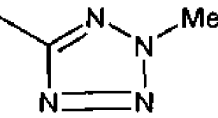
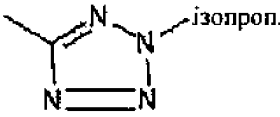
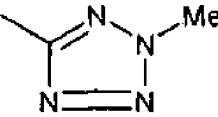
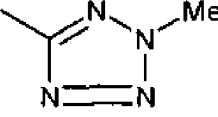
U A 7 5 0 5 1 C 2

	2.20	OCF ₃	OMe	OEt	ОН	0	у вигляді піни
5	2.21	OCF ₃	F	OEt	ОН	0	у вигляді піни
	2.22	OCF ₃	F	н-бутокс	ОН	0	у вигляді смоли
10	2.23	CF ₃	CF ₃	OEt	ОН	0	у вигляді піни
	2.24	CF ₃	CF ₃	н-бутокс	ОН	0	у вигляді піни
	2.25	OCF ₃	OMe	н-бутокс	ОН	0	у вигляді смоли
15	2.26	OCF ₃	CF ₃	н-бутокс	ОН	0	у вигляді піни
	2.27	OCF ₃	CF ₃	OEt	ОН	0	у вигляді піни
20	2.28	CF ₃	OCF ₃	-O-CH ₂ -ц-проп.	ОН	0	у вигляді піни
	2.29	OCF ₃	F	-O-CH ₂ -ц-проп.	ОН	0	у вигляді піни
25	2.30	OCF ₃	CF ₃	-O-CH ₂ -ц-проп.	ОН	0	у вигляді піни
	2.31	OCF ₃	OMe	-O-CH ₂ -ц-проп.	ОН	0	у вигляді піни
30	2.32	OCF ₃	OMe	алілокс	ОН	0	у вигляді смоли
	2.33	OCF ₃	CF ₃	алілокс	ОН	0	у вигляді масла
	2.34	OCF ₃	F	ізопропілокс	ОН	0	у вигляді піни
35	2.35	OCF ₃	OMe	ізопропілокс	ОН	0	у вигляді піни
	2.36	OCF ₃	CF ₃	ізопропілокс	ОН	0	у вигляді піни
40	2.37	OCF ₃	CF ₃	пропаргілокс	ОН	0	у вигляді смоли
	2.38	OCF ₃	OMe	пропаргілокс	ОН	0	у вигляді смоли
45	2.39	OCF ₃	F	пропаргілокс	ОН	0	у вигляді масла
	2.40	OCF ₃	F	алілокс	ОН	0	у вигляді смоли
50	2.41	CF ₃	OMe	н-бутокс	ОН	0	у вигляді смоли
	2.42	CF ₃	OMe	OEt	ОН	0	у вигляді піни
55	2.43	OCF ₃	OCF ₃	F	ОН	1	t _{пл} : 97-100
	2.44	CF ₃	OMe	алілокс	ОН	0	у вигляді смоли
	2.45	CF ₃	OMe	пропаргілокс	ОН	0	у вигляді смоли
60	2.46	CF ₃	OMe	-O-CH ₂ -ц-проп.	ОН	0	у вигляді піни
	2.47	OCF ₃	OCF ₃	пропаргілокс	ОН	1	t _{пл} : 98-102

	2.48	OCF ₃	CF ₃	алілокси	ОН	1	t _{пл} : 105-110
5	2.49	CF ₃	CF ₃	н-пропокси	ОН	1	t _{пл} : 135-140
	2.50	OCF ₃	CF ₃	н-бутокси	ОН	1	t _{пл} : 124-127
10	2.51	CF ₃	CF ₃	н-бутокси	ОН	1	t _{пл} : 167-172
	2.52	CF ₃	CF ₃	OEt	ОН	1	t _{пл} : 183-188
	2.53	OCF ₃	CF ₃	-O-CH ₂ -ц-проп.	ОН	1	t _{пл} : 181-184
15	2.54	CF ₃	CF ₃	-O-CH ₂ -ц-проп.	ОН	1	t _{пл} : 189-191
	2.55	OCF ₃	OCF ₃	циклопентилокси	ОН	1	у вигляді піни
20	2.56	CF ₃	F	н-пропокси	ОН	0	у вигляді смоли
	2.57	CF ₃	F	н-бутокси	ОН	0	у вигляді смоли
25	2.58	CF ₃	F	-O-CH ₂ -ц-проп.	ОН	0	у вигляді смоли
	2.59	CF ₃	F	алілокси	ОН	0	у вигляді смоли
30	2.60	CF ₃	F	пропаргілокси	ОН	0	у вигляді піни
	2.61	CF ₃	F	пропаргілокси	ОН	1	у вигляді піни
	2.62	CF ₃	F	н-пропокси	ОН	1	у вигляді піни
35	2.63	CF ₃	F	-O-CH ₂ -ц-проп.	ОН	1	у вигляді піни
	2.64	OCF ₃	F	-O-CH ₂ -ц-проп.	ОН	1	t _{пл} : 174-178
40	2.65	OCF ₃	OCF ₃	2-піридилокси	ОН	0	у вигляді піни
	2.66	CF ₃	OMe	2-піридилокси	ОН	0	у вигляді піни
45	2.67	OCF ₃	CF ₃	2-піридилокси	ОН	0	у вигляді піни
	2.68	OCF ₃	F	2-піридилокси	ОН	0	у вигляді піни
50	2.69	OCF ₃	OCF ₃	NHCOOMe	ОН	0	у вигляді піни
	2.70	OCF ₃	CF ₃	NHCOOMe	ОН	0	у вигляді піни
	2.71	OCF ₃	OMe	2-піридилокси	ОН	0	у вигляді піни
55	2.72	CF ₃	F	2-піридилокси	ОН	0	у вигляді піни
	2.73	CF ₃	CF ₃	2-піридилокси	ОН	0	у вигляді піни
60	2.74	CF ₃	CF ₃	NHCOOMe	ОН	0	у вигляді піни
	2.75	CF ₃	F	NHCOOMe	ОН	0	у вигляді піни

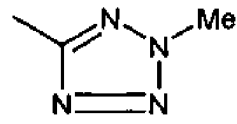
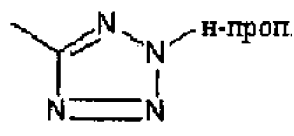
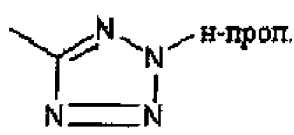
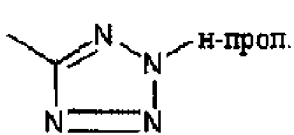
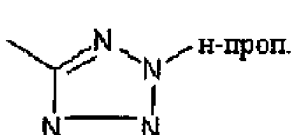
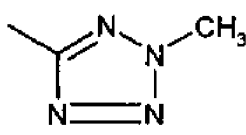
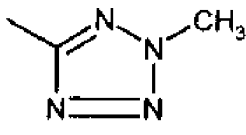
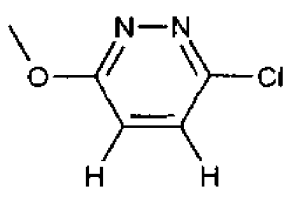
	2.76	OCF ₃	OMe	NHCOOMe	ОН	0	у вигляді піни
5	2.77	OCF ₃	CF ₃	NHCOOMe	ОН	1	t _{пл} : 159-161
	2.78	OCF ₃	OCF ₃	NHCOOMe	ОН	1	t _{пл} : 159-161
10	2.79	OCF ₃	OCF ₃	NHCOOEt	ОН	0	у вигляді піни
	2.80	OCF ₃	OMe	NHCOOEt	ОН	0	у вигляді піни
	2.81	OCF ₃	CF ₃	NHCOOEt	ОН	0	у вигляді піни
15	2.82	CF ₃	CF ₃	NHCOOEt	ОН	0	у вигляді піни
	2.83	CF ₃	F	NHCOOEt	ОН	0	у вигляді піни
20	2.84	OCF ₃	OCF ₃	NHCOOEt	ОН	1	t _{пл} : 148-151
	2.85	OCF ₃	CF ₃	NHCOOEt	ОН	1	t _{пл} : 130-134
25	2.86	CF ₃	CF ₃	NHCOOEt	ОН	1	t _{пл} : 154-157
	2.87	CF ₃	F	NHCOOEt	ОН	1	t _{пл} : 157-160
30	2.88	OCF ₃	OCF ₃	NHCOOMe	Н	0	у вигляді піни
	2.89	OCF ₃	OCF ₃	NHCOOMe	Н	1	t _{пл} : 147-150
35	2.90	OCF ₃	OCF ₃	NHCOOEt	OMe	0	у вигляді смоли
	2.91	OCF ₃	OCF ₃	NHCOOEt	OMe	1	t _{пл} : 113-117
	2.92	OCF ₃	OCF ₃	NHCOOEt	Н	0	у вигляді піни
40	2.93	OCF ₃	OCF ₃	NHCOOEt	Н	1	t _{пл} : 135-139
	2.94	CF ₃	CF ₃	NHCOOMe	ОН	1	t _{пл} : 163-167
45	2.95	CF ₃	CF ₃	NHCOO-ізопроп.	ОН	0	у вигляді піни
	2.96	OCF ₃	OCF ₃	NHCOO-ізопроп.	ОН	0	у вигляді піни
50	2.97	CF ₃	CF ₃		ОН	0	у вигляді піни
55	2.98	CF ₃	CF ₃		ОН	1	t _{пл} : 156-167
	2.99	CF ₃	CF ₃	NHCOO-ізопроп.	ОН	1	t _{пл} : 183-186
60	2.100	OCF ₃	OCF ₃	NHCOO-ізопроп.	ОН	1	t _{пл} : 181-184
	2.101	CF ₃	CF ₃	NHCOO-ізобутил	ОН	0	у вигляді піни

65

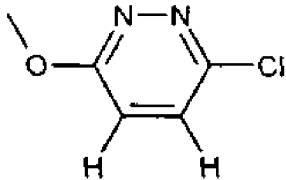
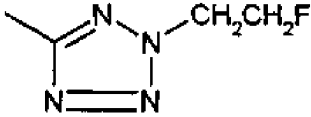
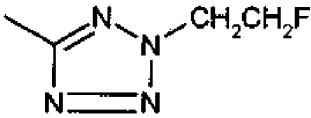
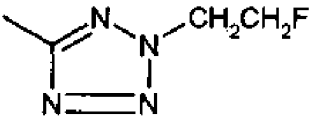
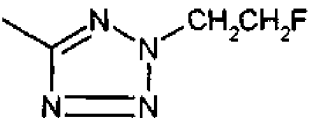
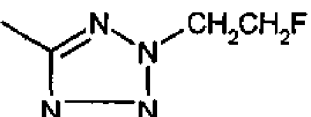
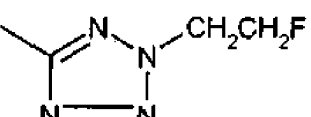
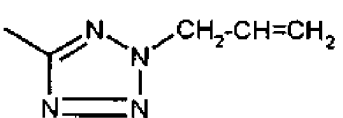
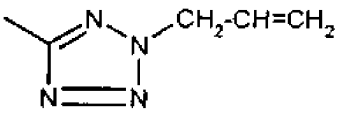
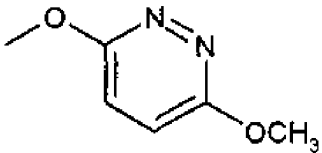
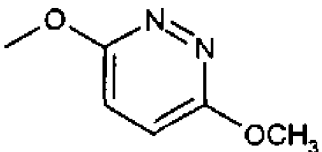
	2 102	Cl	Cl	NHCOO-ізобут.	ОН	0	у вигляді піни
5	2.103	OCF ₃	CF ₃		ОН	0	у вигляді піни
10	2.104	OCF ₃	OCF ₃		ОН	0	у вигляді піни
15	2.105	OCF ₃	OCF ₃		ОН	0	у вигляді піни
20	2.106	OCF ₃	OCF ₃		ОН	1	t _{пл} : 173-175
25	2.107	OCF ₃	CF ₃		ОН	1	t _{пл} : 70-75
30	2 108	Cl	Cl	NHCOO-ізобут.	ОН	1	t _{пл} : 177-179
	2.109	CF ₃	CF ₃	NHCOO-ізобут.	ОН	1	t _{пл} : 180-183
35	2.110	OCF ₃	OCF ₃		ОН	1	t _{пл} : 136-139
40	2 111	CF ₃	CF ₃		ОН	0	у вигляді піни
45	2.112	CF ₃	CF ₃		ОН	0	у вигляді піни
50	2.113	OCF ₃	OCF ₃	NHCOO-ізобут.	ОН	1	t _{пл} : 179-181
55	2.114	CF ₃	CF ₃		ОН	1	t _{пл} : 148-151
60	2 115	CF ₃	CF ₃		ОН	1	t _{пл} : 165-167
65	2 116	OCF ₃	OCF ₃		ОН	0	у вигляді піни

У
В
7
5
0
5
1
С
2

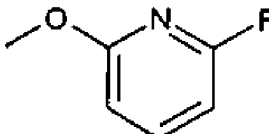
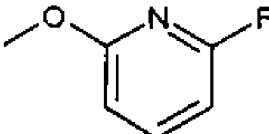
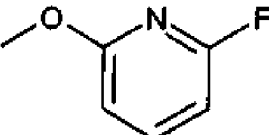
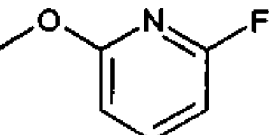
5
10
15
20
25
30
35
40
45
50
55
60
65

2.117	OCF ₃	OCF ₃		ОН	1	t _{пл} : 125-135
2.118	CF ₃	CF ₃		ОН	0	у вигляді піни
2.119	CF ₃	CF ₃		ОН	1	t _{пл} : 157-160
2.120	OCF ₃	OCF ₃		ОН	0	у вигляді смоли
2.121	OCF ₃	OCF ₃		ОН	1	у вигляді твердої речовини
2.122	CF ₃	F	NHCOO-ізопроп.	ОН	0	у вигляді піни
2.123	OCF ₃	CF ₃		ОН	0	у вигляді смоли
2.124	OCF ₃	CF ₃		ОН	1	t _{пл} : 155-162
2.125	CF ₃	CF ₃	-CH=NOCH ₃	ОН	0	у вигляді піни
2.126	CF ₃	CF ₃	-CH=NOC ₂ H ₅	ОН	0	у вигляді піни
2.127	OCF ₃	OCF ₃	-CH=NOC ₂ H ₅	ОН	0	у вигляді смоли
2.128	OCF ₃	CF ₃	-CH=NOC ₂ H ₅	ОН	0	у вигляді смоли
2.129	OCF ₃	CF ₃	-CH=NOCH ₃	ОН	0	у вигляді смоли
2.130	OCF ₃	CF ₃	-CH=NOC ₂ H ₅	ОН	1	у вигляді піни
2.131	OCF ₃	OCF ₃	-CH=NOC ₂ H ₅	ОН	1	у вигляді піни
2.132	CF ₃	CF ₃		ОН	0	у вигляді піни

U A 7 5 0 5 1 C 2

5	2.133	F ₃	CF ₃		ОН	1	t _{пл} : 159-163
10	2.134	трет-бут	трет-бут	NHCOO-ізопроп.	ОН	0	у вигляді піни
	2.135	трет-бут	трет-бут	NHCOO-ізопроп.	ОН	1	t _{пл} : 204-205
15	2.136	CF ₃	CF ₃		ОН	0	у вигляді піни
20	2.137	CF ₃	CF ₃		ОН	0	t _{пл} : 156-164
25	2.138	OCF ₃	CF ₃		ОН	0	у вигляді піни
30	2.139	OCF ₃	CF ₃		ОН	1	t _{пл} : 167-169
35	2.140	OCF ₃	OCF ₃		ОН	0	у вигляді піни
40	2.141	OCF ₃	OCF ₃		ОН	1	t _{пл} : 165-167
45	2.142	CF ₃	CF ₃		ОН	0	у вигляді смоли
50	2.143	CF ₃	CF ₃		ОН	1	у вигляді твердої речовини
55	2.144	CF ₃	CF ₃		ОН	0	у вигляді смоли
60	2.145	CF ₃	CF ₃		ОН	1	t _{пл} : 164

65

5	2.146	CF ₃	CF ₃		ОН	0	у вигляді смоли
10	2.147	CF ₃	CF ₃		ОН	1	t _{пл} : 145-149
15	2.148	OCF ₃	OCF ₃		ОН	0	у вигляді смоли
20	2.149	OCF ₃	OCF ₃		ОН	1	t _{пл} : 128-134
25	2.150	CF ₃	CF ₃	феніл	ОН	0	у вигляді піни
30	2.151	CF ₃	CF ₃	феніл	ОН	1	t _{пл} : 150-153

Приклади приготування композицій (% означає масовий відсоток)
 Приклад К1: емульсійні концентрати

35				а) б) в)
	діючий компонент			25% 40% 50%
	додецилбензолсульфонат кальцію	5%	8%	6%
	поліетиленгліколевий ефір	5%	-	-
	рицинової олії (36 молів ЕО)			
40	поліетиленгліколевий ефір	-	12%	4%
	трибути л фенолу (30 молів ЕО)			
	циклогексанон	-	5%	20%
	суміш ксилолів	65%	25%	20%

У результаті змішування тонкоподрібненого діючого компонента та добавок утворюється емульсійний концентрат, який розбавляють водою з одержанням емульсії цільової концентрації.
 Приклад К2: розчини

50				а) б) в) г)
	діючий компонент			80% 10% 5% 95%
	етиленглікольмонометилловий ефір	20%	-	-
	поліетиленгліколь (Mw 400)	-	70%	-
	N-метилпіролід-2-он	-	20%	-
	епоксидована кокосова олія	-	-	1% 5%
55	нафтопродукт (з межами кипіння від 160 до 190°)	-	-	94% -

У результаті змішування тонкоподрібненого діючого компонента і добавок утворюється розчин, який прийнятний для застосування у формі тонкодисперсних краплинок.
 Приклад К3: грануляти

60				а) б) в) г)	
	діючий компонент	5%	10%	8%	21%
	каолін	94%	-	79%	54%
	високодисперсна кремнієва кислота	1%	-	13%	7%
65	атапульгіт	-	90%	18%	

Діючий компонент розчиняють у дихлорметані, розчин розпилюють у масу суміші носіїв і під вакуумом

випарюють розчинник.

Біологічні приклади

Приклад Б1: дія на гусениць *Heliothis virescens*

5 Молоді паростки сої обприскують водною емульсійною сумішшю для розпилення, яка включає 400 част./млн. діючого компонента. Після висихання осаду від розпилення на паростках сої поселяють 10 гусениць *Heliothis virescens* першої вікової стадії і рослини поміщають у пластиковий контейнер. Через шість днів їх оглядають. Зіставленням числа загиблих гусениць і ступеня ушкоджень від поїдання оброблених рослин з тими ж показниками на необроблених рослинах визначають відсоткове зменшення популяції і відсоткове зменшення

10 ступеня ушкоджень від поїдання (чутливість у %).

У цьому тесті сполуки таблиці 2 демонструють хорошу ефективність проти *Heliothis virescens*. Зокрема, ефективність сполук 2.85, 2.86, 2.98, 2.99, 2.100 і 2.115 перевищує 80%.

Приклад Б2: дія на гусениць *Plutella xylostella*

15 Молоді паростки капусти обприскують водною емульсійною сумішшю для розпилення, яка включає 400 част./млн. діючого компонента. Після висихання осаду від розпилення на паростках капусти поселяють 10 гусениць *Plutella xylostella* третьої вікової стадії і рослини поміщають у пластиковий контейнер. Через три дні їх оглядають. Зіставленням числа загиблих гусениць і ступеня ушкоджень від поїдання оброблених рослин з тими ж показниками на необроблених рослинах визначають відсоткове зменшення популяції і відсоткове зменшення ступеня ушкоджень від поїдання (чутливість у %).

20 Сполуки таблиці 2 демонструють хорошу ефективність проти *Plutella xylostella*. Зокрема, ефективність сполук 2.85, 2.86, 2.94, 2.98, 2.99, 2.100 і 2.115 перевищує 80%.

Приклад Б3: дія на личинки *Diabrotica balteata*

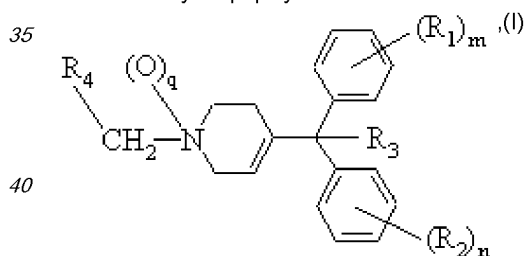
25 Кукурудзяну розсаду обприскують водною емульсійною сумішшю для розпилення, яка включає 400 част./млн. діючого компонента. Після висихання осаду від розпилення на кукурудзяній розсаді поселяють 10 личинок *Diabrotica balteata* другої вікової стадії і рослини поміщають у пластиковий контейнер. Через шість днів їх оглядають. Зіставленням числа загиблих личинок на оброблених рослинах з тим же показником на необроблених рослинах визначають відсоткове зменшення популяції (чутливість у %).

Сполуки таблиці 2 демонструють хорошу ефективність проти *Diabrotica balteata*. Зокрема, ефективність сполук 2.85, 2.86, 2.99, 2.100 перевищує 80%.

30

Формула винаходу

1. Сполука формули



в якій

45 R_1 і R_2 кожен незалежно один від одного означає атом галогену, C_1 - C_6 алкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл, гало- C_1 - C_6 алкіл, гало- C_3 - C_6 циклоалкіл, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, гало- C_2 - C_4 алкеніл, гало- C_2 - C_4 алкініл, C_1 - C_6 алкокси, гало- C_1 - C_6 алкокси, C_2 - C_6 алкенілокси, C_2 - C_6 алкінілокси, гало- C_2 - C_6 алкенілокси, гало- C_2 - C_6 алкінілокси, $-SF_5$, $-C(=O)N(R_5)_2$, $-O-C(=O)N(R_5)_2$, $-CN$, $-NO_2$, $-S(=O)_2N(R_5)_2$, $-S(=O)_p-C_1-C_6$ алкіл, $-S(=O)_p$ -гало- C_1-C_6 алкіл, $-O-S(=O)_p-C_1-C_6$ алкіл, $-O-S(=O)_p$ -гало- C_1-C_6 алкіл, феніл, бензил, фенокси або бензилокси, де кожний з фенільного, бензильного, фенокси- або бензилоксирадикалів або не заміщений, або незалежно один від одного від моно- до пентазаміщений в ароматичному кільці замісниками, вибраними з ряду, який включає атоми галогену, ціаногрупу, NO_2 , C_1 - C_6 алкіл, гало- C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 алкокси і гало- C_1 - C_6 алкокси;

R_3 означає водневий атом, OH , атом галогену, C_1 - C_6 алкокси або $-O-C(=O)-C_1-C_6$ алкіл;

55 R_4 означає C_1 - C_6 алкіл, гало- C_1 - C_6 алкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл, гало- C_3 - C_6 циклоалкіл, C_3 - C_6 циклоалкокси, гало- C_1 - C_6 алкокси, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, гало- C_2 - C_4 алкеніл, гало- C_2 - C_4 алкініл, C_1 - C_6 алкокси, C_2 - C_6 алкенілокси, C_2 - C_6 алкінілокси, гало- C_2 - C_6 алкенілокси, гало- C_2 - C_6 алкінілокси, $-C(=O)-C_3-C_6$ алкіл, $-C(=O)$ -гало- C_1-C_6 алкіл, $-C(=O)-OC_1-C_6$ алкіл, $-C(=O)-O$ -гало- C_1-C_6 алкіл, $-NR_6-C(=O)-O-C_1-C_6$ алкіл, $-NR_6-C(=O)-O$ -гало- C_1-C_6 алкіл, $-C(=O)N(R_5)_2$, $-O-C(=O)N(R_5)_2$, $-CN$, $-NO_2$, $-S(=O)_2N(R_5)_2$, $-S(=O)_p-C_1-C_6$ алкіл, $-S(=O)_p$ -гало- C_1-C_6 алкіл, $-O-S(=O)_p-C_1-C_6$ алкіл, $-O-S(=O)_p$ -гало- C_1-C_6 алкіл; бензил, фенокси, бензилокси; або феніл, бензил, фенокси або бензилокси, який незалежно від моно- до пентазаміщений замісниками, вибраними з

60 ряду, який включає атоми галогену, ціано, NO_2 , C_1 - C_6 алкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл- C_1 - C_6 алкіл, гало- C_1 - C_6 алкіл, C_1 - C_6 алкокси, C_3 - C_6 циклоалкокси, C_3 - C_6 циклоалкокси- C_1 - C_6 алкіл, C_3 - C_6 циклоалкіл- C_1 - C_6 алкокси, гало- C_1 - C_6 алкокси, C_2 - C_4 алкеніл, C_2 - C_4 алкініл, гало- C_2 - C_4 алкеніл, гало- C_2 - C_4 алкініл, C_2 - C_6 алкенілокси, C_2 - C_6 алкінілокси, гало- C_2 - C_6 алкенілокси, гало- C_2 - C_6 алкінілокси, $-NR_6-C(=O)-O-C_1-C_6$ алкіл, $-NR_6-C(=O)-O-C_2-C_6$ алкеніл, $-NR_6-C(=O)-O$ -гало- C_1-C_6 алкіл, $-C(R_7)=N-W-R_8$, феніл, бензил, фенокси, бензилокси, гетероциклілі і гетероциклілокси, де залежно від можливості заміщення в кільці

65

гетероциклі і гетероцикліоксирадикали необов'язково від моно- до тризаміщені замісниками, вибраними з ряду, який включає атоми галогену, C₁-C₆алкіл, гало-C₁-C₆алкіл, C₁-C₆алкокси, гало-C₁-C₆алкокси, C₃-C₈циклоалкіл-C₁-C₆алкіл, ціано-C₁-C₆алкіл, C₃-C₈алкеніл, C₃-C₈алкініл, феніл або бензил;

кожний із двох R₅ незалежно один від одного означає водневий атом або C₁-C₆алкіл;

R₆ означає водневий атом, C₁-C₆алкіл або бензил;

R₇ означає атом галогену, C₁-C₆алкіл, C₃-C₈циклоалкіл, C₃-C₈циклоалкіл-C₁-C₆алкіл, гало-C₁-C₆алкіл, C₁-C₆алкокси, C₃-C₈циклоалкокси, C₃-C₈циклоалкокси-C₁-C₆алкіл, гало-C₁-C₆алкокси, -NH(C₁-C₆алкіл) або -N(C₁-C₆алкіл)₂;

R₈ означає водневий атом, C₁-C₆алкіл, C₃-C₈циклоалкіл, C₃-C₈циклоалкіл-C₁-C₆алкіл, гало-C₁-C₆алкіл або -C(=O)-C₁-C₆алкіл;

m означає 1, 2 або 3;

n означає 1, 2 або 3;

p означає 0, 1 або 2;

q означає 0 або 1;

W означає O, NH або N-C₁-C₆алкіл;

і, якщо це прийнятно, її E/Z-ізомери, суміші E/Z-ізомерів і/або таутомери, у кожному випадку у вільній формі або у формі солі.

2. Сполука формули (I) за п. 1 у вільній формі.

3. Сполука формули (I) за будь-яким з пп. 1 або 2, де R₁ і R₂ кожен незалежно один від одного означає атом галогену, C₁-C₂алкіл, C₃-C₈циклоалкіл, гало-C₁-C₂алкіл, C₁-C₂алкокси, гало-C₁-C₂алкокси, -C(=O)N(CH₃)₂, -CN або -NO₂.

4. Сполука формули (I) за будь-яким з пп. 1-3, де R₃ означає водневий атом, OH, атом галогену або C₁-C₆алкокси.

5. Сполука формули (I) за будь-яким з пп. 1-4, де R₄ означає C₁-C₂алкіл, гало-C₁-C₂алкіл, C₃-C₈циклоалкіл, C₃-C₈циклоалкокси, гало-C₁-C₂алкокси, C₂-C₄алкеніл, C₂-C₄алкініл, C₁-C₂алкокси, -C(=O)-C₃-C₆алкіл, -C(=O)-гало-C₁-C₂алкіл, -C(=O)-OC₁-C₂алкіл, -C(=O)-O-гало-C₁-C₂алкіл, -NH-C(=O)-O-C₁-C₂алкіл, -NH-C(=O)-O-гало-C₁-C₂алкіл, -C(=O)N(R₅)₂, -CN, -S(=O)₂N(R₅)₂, -S(=O)_p-C₁-C₂алкіл, -S(=O)_p-гало-C₁-C₂алкіл, -O-S(=O)_p-C₁-C₆алкіл, -O-S(=O)_p-гало-C₁-C₆алкіл; бензил, фенокси, бензилокси; або

феніл, бензил, фенокси або бензилокси, який незалежно від моно- до пентазаміщений замісниками, вибраними з ряду, який включає атом галогену, ціано, C₁-C₆алкіл, C₃-C₈циклоалкіл, C₃-C₈циклоалкіл-C₁-C₆алкіл, гало-C₁-C₆алкіл, C₁-C₆алкокси, C₃-C₈циклоалкокси, C₃-C₈циклоалкокси-C₁-C₆алкіл, C₃-C₈циклоалкіл-C₁-C₆алкокси, гало-C₁-C₆алкокси, C₂-C₄алкеніл, C₂-C₄алкініл, C₂-C₆алкенілокси, C₂-C₆алкінілокси, -NH-C(=O)-O-C₁-C₆алкіл, -NH-C(=O)-O-гало-C₁-C₆алкіл, -C(R₇)=N-W-R₈, феніл, бензил, фенокси, бензилокси, гетероарил і гетероарилокси, де гетероарил- і гетероарилоксирадикали необов'язково

заміщені C₁-C₄-алкілом.

6. Пестицидна композиція, яка включає як діючий компонент принаймні одну сполуку формули (I) за п. 1 або у вільній формі, або у формі агрохімічно прийнятної солі та принаймні одну добавку.

7. Спосіб приготування композиції за п. 6, у якій діючий компонент гомогенно змішують з добавкою (добавками).

8. Спосіб боротьби зі шкідниками, у якому шкідників або місце їх проживання обробляють як діючим компонентом сполукою формули (I) за будь-яким з пп. 1-4 у вільній формі або у формі агрохімічно прийнятної солі.

9. Застосування сполуки формули (I) за будь-яким з пп. 1-4 у вільній формі або у формі агрохімічно прийнятної солі при приготуванні композиції за п. 6.

Офіційний бюлетень "Промислова власність". Книга 1 "Винаходи, корисні моделі, топографії інтегральних мікросхем", 2006, N 3, 15.03.2006. Державний департамент інтелектуальної власності Міністерства освіти і науки України.