(19) Евразийское патентное ведомство

(21) 202091929 (13) A1

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ

(43) Дата публикации заявки
2020.11.12

(22) Дата подачи заявки
2019.02.01

(51) Int. Cl. ***C07D 413/10*** (2006.01)
A01N 43/80 (2006.01)
C07D 261/04 (2006.01)
C07D 407/10 (2006.01)
C07D 409/10 (2006.01)
C07D 417/10 (2006.01)

(54) НАФТАЛИНИЗОКСАЗОЛИНОВЫЕ СОЕДИНЕНИЯ ДЛЯ БОРЬБЫ С БЕСПОЗВОНОЧНЫМИ ВРЕДИТЕЛЯМИ

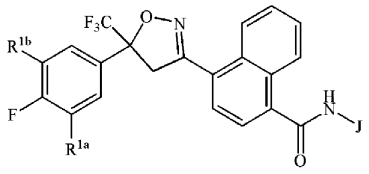
(31) **62/629,154; 62/631,665; 62/657,647**
(32) **2018.02.12; 2018.02.17; 2018.04.13**
(33) **US**
(86) **PCT/US2019/016260**
(87) **WO 2019/156903 2019.08.15**

(71) Заявитель:
ФМК КОРПОРЕЙШН (US)

(72) Изобретатель:
Сюй Мин, Лэм Джордж Филип, Лонг Джеффри Кит (US)

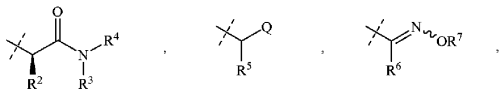
(74) Представитель:
Медведев В.Н. (RU)

(57) Раскрыты соединения формулы 1

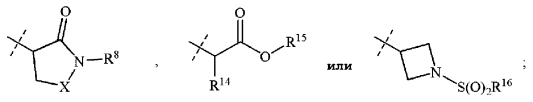


1

где J представляет собой



J-1 J-2 J-3



J-4 J-5 или J-6

и R^{1a}, R^{1b}, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6, R^7, R^8, R^{14}, R^{15}, R^{16}, Q и X определены в изобретении. Кроме того, раскрыты композиции, содержащие соединения формулы 1, и способы борьбы с беспозвоночным вредителем, включающие контактирование беспозвоночного вредителя или среды его обитания с биологически эффективным количеством соединения или композиции по изобретению.

202091929 A1

202091929 A1

ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ

2420-564387EA/026

НАФТАЛИНИЗОКСАЗОЛИНОВЫЕ СОЕДИНЕНИЯ ДЛЯ БОРЬБЫ С БЕСПОЗВОНОЧНЫМИ ВРЕДИТЕЛЯМИ

ОБЛАСТЬ ТЕХНИКИ, К КОТОРОЙ ОТНОСИТСЯ ИЗОБРЕТЕНИЕ

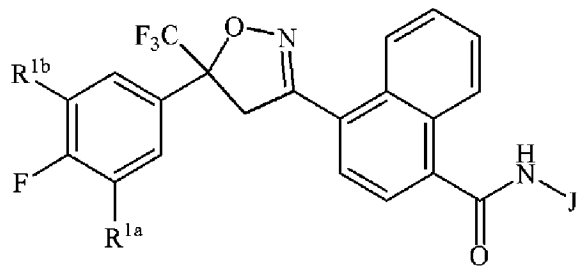
Это изобретение относится к конкретным соединениям изоксазолина и к композициям, которые могут применяться с агротехнической и неагротехнической целью, и к способам их применения для борьбы с беспозвоночными вредителями, такими как членистоногие, как в агротехнических, так и в неагротехнических средах.

УРОВЕНЬ ТЕХНИКИ

Борьба с беспозвоночными вредителями представляет собой чрезвычайно важную задачу, решение которой позволяет достигать высокой урожайности сельскохозяйственных культур. Поражение, наносимое беспозвоночными вредителями сельскохозяйственным культурам в процессе их выращивания и хранения, может приводить к значительному снижению эффективности сельскохозяйственного производства и, вследствие этого, к повышению расходов для потребителя. Кроме того, также является важной борьба с беспозвоночными вредители в лесоводстве, при выращивании тепличных сельскохозяйственных культур, декоративных растений, при выращивании растений в питомниках, при хранении пищевых и содержащих пищевые волокна продуктов, в домашнем хозяйстве, при уходе за газонами, для сохранности лесоматериалов и для здоровья людей. Промышленностью выпускается много продуктов для этих целей, но все еще существует потребность в новых соединениях, которые были бы более эффективными, более дешевыми, менее токсичными, безопасными для окружающей среды или имели бы различные места воздействия.

СУЩНОСТЬ ИЗОБРЕТЕНИЯ

Это изобретение относится к соединениям формулы **1**, к содержащим их композициям и к их применению для борьбы с беспозвоночными вредителями:

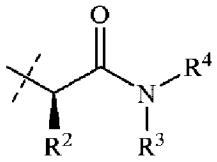


1

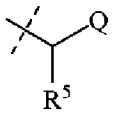
где

J представляет собой C2-C4 алкил, замещенный с помощью одной цианогруппы; -CH2(циклопропил), замещенный с помощью одной цианогруппы; или циклопропил, незамещенный или замещенный с помощью одной цианогруппы или одной группы C(O)NHR17; или

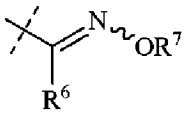
J представляет собой



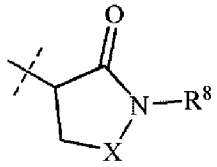
J-1



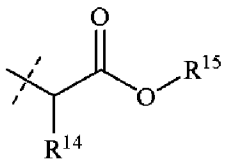
J-2



J-3

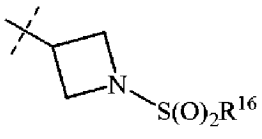


J-4



J-5

или



J-6

R1a представляет собой Cl или CF3;

R1b представляет собой H или Cl;

R2 представляет собой C1-C4 алкил, незамещенный или замещенный с помощью заместителей, выбранных из циано, нитро, OR9, S(O)nR10, CO2R11 и C(O)NR12R13;

R3 представляет собой H или C1-C4 алкил, незамещенный или замещенный с помощью заместителей, выбранных из циано, нитро, OR9, S(O)nR10, CO2R11 и C(O)NR12R13;

R4 представляет собой H, C1-C4 алкил или C1-C4 галогеналкил;

R5 представляет собой H или C1-C4 алкил;

R6 представляет собой H или C1-C4 алкил;

R7 представляет собой H, C1-C4 алкил или C1-C4 галогеналкил;

X представляет собой -O- или -C(O)-;

R8 представляет собой H, C1-C4 алкил, C1-C4 галогеналкил или C3-C6 циклоалкил;

каждый R9, R10, R11, R12 и R13 представляет собой независимо H или C1-C4 алкил;

R14 представляет собой H или C1-C4 алкил, незамещенный или замещенный с помощью заместителей, выбранных из циано, нитро, OR9, S(O)nR10, CO2R11 и C(O)NR12R13;

R15 представляет собой H, C1-C4 алкил или C1-C4 галогеналкил;

R16 представляет собой фтор, C1-C4 алкил, C1-C4 галогеналкил, C1-C6 алкокси, C1-C6 галогеналкокси, амино или C1-C6 алкиламино;

R17 представляет собой H, C1-C4 алкил, C1-C4 галогеналкил или C3-C6 циклоалкил;

Q представляет собой пиридинил, пиримидинил, пиразинил, пиридазинил, 1,2,4-триазинил, 1,3,5-триазинил, фуранил, тиенил, пирролил, пиразолил, имидазолил, 1,2,3-

триазолил, 1,2,4-триазолил, тетразолил, оксазолил, тиазолил, изоксазолил, изотиазолил, 1,2,3-оксадиазолил, 1,2,4-оксадиазолил, 1,3,4-оксадиазолил, 1,2,3-тиадиазолил, 1,2,4-тиадиазолил или 1,3,4-тиадиазолил, каждый из которых не замещен или замещен с помощью заместителей, независимо выбранных из циано, нитро, галогена, C1-C4 алкила, C1-C4 галогеналкила, C1-C4 алкокси, C1-C4 галогеналкокси, C1-C4 алкилтио, C1-C4 галогеналкилтио, C1-C4 алкилсульфинил, C1-C4 галогеналкилсульфинил, C1-C4 алкилсульфонил, C1-C4 галогеналкилсульфонил, C2-C5 алкоксикарбонил, C2-C5 алкиламинокарбонил и C3-C5 диалкиламинокарбонил; и

каждый n представляет собой независимо 0, 1 или 2.

Кроме того, в настоящем изобретении предлагается композиция, включающая соединение формулы **1** и, по меньшей мере, один дополнительный компонент, выбранный из группы, состоящей из поверхностно-активных веществ, твердых разбавителей и жидких разбавителей. В одном варианте осуществления, в настоящем изобретении также предлагается композиция для борьбы с беспозвоночным вредителем, включающая соединение формулы **1** и, по меньшей мере, один дополнительный компонент, выбранный из группы, состоящей из поверхностно-активных веществ, твердых разбавителей и жидких разбавителей, где указанная композиция необязательно дополнительно включает, по меньшей мере, одно дополнительное биологически активное соединение или средство.

В настоящем изобретении предлагается способ борьбы с беспозвоночным вредителем, включающий контактирование беспозвоночного вредителя или его среды обитания с биологически эффективным количеством соединения формулы **1** (например, в форме описанной в изобретении композиции). Кроме того, настоящее изобретение также относится к такому способу, где беспозвоночного вредителя или его среду обитания подвергают контактированию с композицией, включающей биологически эффективное количество соединения формулы **1** и, по меньшей мере, один дополнительный компонент, выбранный из группы, состоящей из поверхностно-активных веществ, твердых разбавителей и жидких разбавителей, где указанная композиция, необязательно, дополнительно включает биологически эффективное количество, по меньшей мере, одного дополнительного биологически активного соединения или средства.

В настоящем изобретении также предлагается способ защиты семян от беспозвоночного вредителя, включающий контактирование семян с биологически эффективным количеством соединения формулы **1** (например, в форме описанной в изобретении композиции). Нестоящее изобретение также относится к подвергнутым обработке семенам.

В настоящем изобретении также предлагается способ увеличения силы роста сельскохозяйственной культуры, включающий контактирование сельскохозяйственной культуры, семян, из которых выращивают сельскохозяйственную культуру, или местоположения (например, среды выращивания) сельскохозяйственной культуры с биологически эффективным количеством соединения формулы **1** (например, в форме описанной в изобретении композиции).

ПОДРОБНОЕ ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ

Предполагается, что используемые в изобретении термины "составляет", "составляющий", "включает", "включающий", "имеет", "имеющий", "содержит", "содержащий", "характеризуется" или любой другой их вариант обозначают неисчерпывающее включение, в отношении которого устанавливаются любой четко указанное ограничение. Например, композиция, смесь, процесс или способ, который включает перечень элементов, не обязательно ограничиваются только этими элементами, но могут включать другие элементы, которые не перечислены в явном виде или присущи такой композиции, смеси, процессу или способу.

Переходная фраза "состоящий из" исключает любой не указанный элемент, стадию, или ингредиент. Если это фраза используется в пункте формулы изобретения, то такой пункт формулы будет закрыт для включения материалов, которые не перечислены в нем, за исключением примесей, которые обычно сопутствуют перечисленным в пункте формулы изобретения материалам. В случае, когда фраза "состоящий из" присутствует в предложении основной части пункта формулы изобретения, а не сразу после преамбулы, то эта фраза накладывает ограничение только на элемент, указанный в этом предложении; другие элементы в целом не исключаются из этого пункта формулы изобретения.

Переходная фраза "состоящий в основном из" используется для определения композиции или способа, которые включают материалы, стадии, признаки, компоненты или элементы помимо тех, которые в явном виде описаны, при условии, что эти дополнительные материалы, стадии, признаки, компоненты или элементы существенно не влияют на основную и новую характеристику (характеристики) заявленного изобретения. Термин "состоящий в основном из" занимает промежуточное значение между "состоящий" и "состоящий из".

В случае, когда авторы изобретения определяли изобретение или его часть с помощью неограничивающего термина, такого как "содержащий", то следует иметь в виду (если не заявлено иное), что подразумевается, что при описании такого изобретения могут также использоваться термины "состоящий в основном из" или "состоящий из".

Кроме того, если в явном виде не указано иное, то "или" относится к включающему "или", а не к исключающему "или". Например, условие A или B удовлетворяется любым из следующих условий: A является истинным (или присутствует), а B является ложным (или отсутствует), A является ложным (или отсутствует) и B является истинным (или присутствует), и оба A и B верны (или присутствуют).

Кроме того, предполагается, что форма единственного числа для элемента или компонента изобретения является неограничивающей относительно числа примеров (то есть наличия) элемента или компонента. Поэтому, следует иметь в виду, что форма единственного числа, указывающая на один или, по меньшей мере, один элемент или компонент, также включает множество элементов или компонентов, если только эта форма единственного числа однозначно не обозначает один элемент или компонент.

Используемый в настоящем изобретении термин "беспозвоночный вредитель" включает в качестве сельскохозяйственных вредителей артроподов, гастроподов, нематодов и гельминтов. Термин "артропод" включает насекомых, клещей, пауков, скорпионов, многоножек, двупарноногих, мокриц и сидячебрюхих. Термин "гастропод" включает улиток, брюхоногих моллюсков и других стебельчатоглазых. Термин "нематод" включает представителей типа немотодов.

Применительно к настоящему изобретению, "борьба с беспозвоночным вредителем" означает угнетение развития беспозвоночного вредителя (в том числе смертность, уменьшение корма и/или дезориентацию самцов), и связанные с ней выражения определяются аналогично.

Термин "агротехнический" относится к производству полевых культур например, для использования в пищу или в качестве волокон, и он включает выращивание кукурузы или пшеницы, сои и других бобовых растений, риса, зерновой культуры (например, пшеницы, овса, ячменя, ржи и риса), листовых овощей (например, салата, капусты, и других капустных культур), плодоносящих овощей (например, томатов, перца, баклажана, крестоцветных и тыквенных), картофеля, сладкого картофеля, винограда, хлопка, плодовых деревьев (например, яблонь, косточковых и цитрусовых), кустовых плодовых растений (например, ягод и вишен) и других специальных культур (например, канолы, подсолнечника и маслин).

Термин "неагротехнический" относится к культурам, которые не являются полевыми культурами, таким как садовые культуры (например, тепличные растения, саженцы или декоративные растения, не выращиваемые в поле), к жилым, сельскохозяйственным, коммерческим и промышленным сооружениям, к газонам (например, выращиванию дерна, к пастбищам, полю для гольфа, лужайке, спортивному полю, и так далее), к лесоматериалам, хранению продуктов, агролесомелиорации и контролю за растительностью, и к областям применения, связанных с состоянием здоровья населения.

Термин "мощность развития культуры" относится с скорости роста или накопления биомассы сельскохозяйственной культуры. "Повышение мощности развития" относится к увеличению роста или накопления биомассы сельскохозяйственной культуры по сравнению с контрольной сельскохозяйственной культурой, не подвергавшейся обработке. Термин "урожайность" относится к выходу выращенного сельскохозяйственного материала, как с точки зрения количества, так и качества, полученному после сбора урожая сельскохозяйственной культуры. "Увеличение урожайности" относится к увеличению урожайности по сравнению с контрольной сельскохозяйственной культурой, не подвергавшейся обработке.

Термин "биологически эффективное количество" относится к количеству биологически активного соединения (например, соединение формулы **1**), достаточному для достижения требуемого биологического действия при нанесении (то есть при контакте) на беспозвоночного вредителя, против которого проводится борьба, или на

среду его обитания, или на растение, семена, из которых выращивают растение, или на местоположение растения (например, среду для выращивания) для защиты растения от повреждения беспозвоночным вредителем или для достижения другого требуемого эффекта (например, повышения мощности развития растения).

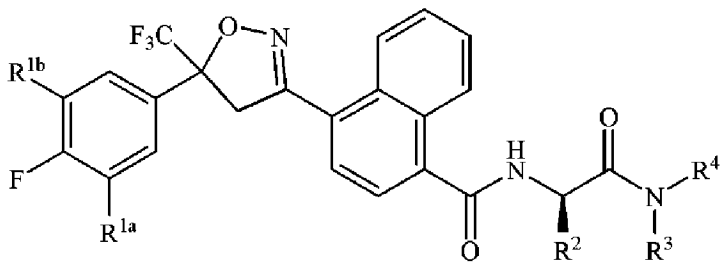
В приведенных выше перечислениях, термин "алкил", используемый либо отдельно, либо в сложных словах, таких как "алкилтио" или "галогеналкил", включает в себя линейный или разветвленный алкил, такой как, метил, этил, н-пропил, изопропил, и различные изомеры бутила, пентила или гексила.

"Алкокси" включает, например, метокси, этокси, н-пропилокси, изопропилокси и различные изомеры бутокси, пентокси и гексилокси. "Алкилтио" включает разветвленные и линейные алкилтиофрагменты, такие как метилтио, этилтио, и различные изомеры пропилтио, бутилтио, пентилтио и гексилтио.

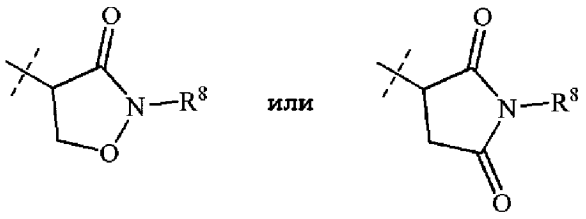
Термин "галоген", либо отдельно, либо в сложных словах, таких как "галогеналкил", или при использовании в описаниях, таких как "алкил, замещенный с помощью галогена", включает фтор, хлор, бром или йод. Кроме того, при использовании в сложных словах, таких как "галогеналкил", или при использовании в описаниях, таких как "алкил, замещенный с помощью галогена", указанный алкил может быть частично или полностью замещен с помощью атомов галогена, которые могут быть одинаковыми или различными. Примеры "галогеналкил" или "алкил, замещенный с помощью галогена" включают F3C-, ClCH2-, CF3CH2- и CF3CCl2-.

Используемые в изобретении химические обозначения S(O) и S(=O) представляют сульфинильный фрагмент. Используемые в изобретении химические обозначения SO2, S(O)2 и S(=O)2 представляют сульфонильный фрагмент. Используемые в изобретении химические обозначения C(O) и C(=O) представляют карбонильный фрагмент. Используемые в изобретении химические обозначения CO2, C(O)O и C(=O)O представляют оксикарбонильный фрагмент.

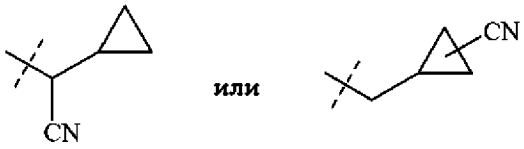
Пунктирная линия в фрагменте структуры обозначает точку присоединения фрагмента к оставшейся части молекулы. Например, когда переменная J в формуле **1** определяется как J-1, пунктирная линия в структуре J-1 означает, что J-1 присоединен к оставшейся части структуры формулы **1** в том положении, как показано ниже.



Переменная X в J-4 определяется как -O- или -C(O)-, и это означает, что J-4 представляет собой фрагмент, показанный ниже.



Когда переменная J определяется как -CH2(циклопропил), замещенный с помощью одной цианогруппы, это означает, что J представляет собой фрагмент, показанный ниже (то есть цианогруппа может быть присоединена либо к метиленовой группе, либо к любому углеродному атому циклопропильного кольца).



Суммарное число углеродных атомов в замещающей группе указывается с помощью префикса "Ci-Cj". Например, C1-C4 алкил обозначает метил, этил и различные изомеры пропила и бутила.

Когда соединение замещено с помощью заместителя, несущего подстрочный индекс, в котором обозначено, что число указанных заместителей может превышать 1, указанные заместители (когда их число превышает 1) независимо выбирают из группы определенных заместителей. Кроме того, когда подстрочный индекс указывает диапазон, например (R)i-j, то тогда число заместителей может быть выбрано из целых чисел между i и j включительно. Когда группа содержит заместитель, который может представлять собой водород, то тогда этот заместитель принимают за водород, и считают, что это эквивалентно тому, что указанная группа является незамещенной. Когда указывают, что одно или более положений в группе являются "не замещаемыми" или "незамещенными", то тогда присоединяют атомы водорода для насыщения любой свободной валентности.

Когда заместитель представляет собой 5- или 6-членное азотсодержащее гетероциклическое кольцо, от может быть присоединен к остальной части соединения формулы **1** через любой доступный кольцевой атом углерода или азота, если не описано иное.

Известно большое разнообразие методов синтеза для получения ароматических и неароматических гетероциклических колец и кольцевых систем; для ознакомления с более подробной информацией смотрите восьмой том Comprehensive Heterocyclic Chemistry, A. R. Katritzky and C. W. Rees editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1984 и двенадцатый том Comprehensive Heterocyclic Chemistry II, A. R. Katritzky, C. W. Rees and E. F. V. Scriven editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1996.

Соединения по этому изобретению могут существовать в форме одного или более стереоизомеров. Стереоизомеры представляют собой изомеры с одинаковым химическим строением, но отличающиеся расположением их атомов в пространстве, и они включают энантиомеры, диастереомеры, цис-транс изомеры (также известные как геометрические

изомеры) и атропоизомеры. Атропоизомеры возникают в результате ограниченного вращения вокруг одинарных связей, когда вращательный барьер является достаточно высоким, для того чтобы было возможно осуществить выделение изомерных соединений. Для специалиста в данной области является очевидным, что один стереоизомер может быть более активным и/или может проявлять положительные эффекты при его обогащении по сравнению с другим стереоизомером (стереоизомерами) или при отделении от другого стереоизомера (стереоизомеров). Кроме того, квалифицированному специалисту известно, как разделять, обогащать и/или селективно получать указанные стереоизомеры. Всестороннее обсуждение всех аспектов стереоизомерии приводится в монографии Ernest L. Eliel and Samuel H. Wilen, Stereochemistry of Organic Соединениеs, John Wiley & Sons, 1994.

Соединения, выбранные из соединений формулы **1,** обычно существуют в более чем одной форме, и, следовательно, соединение формулы **1** включает все кристаллические и некристаллические формы соединений, которые представляет формула **1**. Некристаллические формы включают варианты осуществления, которые представляют собой твердые вещества, такие как воски и смолы, а также варианты осуществления, которые представляют собой жидкости, такие как растворы и расплавы. Кристаллические формы включают варианты осуществления, которые представляют по существу тип монокристаллов, и варианты осуществления, которые представляют смесь полиморфов (то есть различных кристаллических типов). Термин "полиморф" относится к конкретной кристаллической форме химического соединения, которое может кристаллизоваться в различных кристаллических формах, при этом эти формы имеют различные расположения и/или конформации молекул в кристаллической решетке. Хотя полиморфы могут иметь один и тот же химический состав, тем не менее, они могут также отличаться по составу вследствие присутствия или отсутствия сокристаллизационной воды или других молекул, которые могут быть слабо или сильно связаны в решетке. Полиморфы могут различаться по таким химическим, физическим и биологическим свойствам, как форма кристалла, плотность, твердость, цвет, химическая стабильность, температура плавления, гигроскопичность, суспензированность, скорость растворения и биодоступность. Для специалиста в данной области является очевидным, что полиморф соединения, представленного формулой **1,** может проявлять положительные эффекты (например, пригодность для приготовления подходящих лекарственных форм, улучшенная биологическая характеристика) по сравнению с другим полиморфом или смесью полиморфов одного и того же соединения, представленного формулой **1**. Получение и выделение конкретного полиморфа соединения, представленного формулой **1,** может быть осуществлено методами, известными специалистам в данной области, включающими, например, кристаллизацию с использованием выбранных растворителей и температур. Соединения по этому изобретению могут существовать в форме одного или более кристаллических полиморфов. Это изобретение включает как индивидуальные полиморфы, так и смеси полиморфов, в том числе смеси, обогащенные одним

полиморфом относительно других полиморфов. Подробное обсуждение явления полиморфизма приведено в монографии R. Hilfiker, Ed., Polymorphism In the Pharmaceutical Industry, Wiley-VCH, Weinheim, 2006.

Варианты осуществления настоящего изобретения, описанные в разделе "Сущность изобретения" включают варианты осуществления, описанные ниже. В приведенных далее вариантах осуществления, ссылка на "соединение формулы **1**" включает определения заместителей, указанных в разделе "Сущность изобретения", если их далее не определяют в вариантах осуществления.

Вариант осуществления 1. Соединение формулы **1,** где J представляет собой J-1.

Вариант осуществления 1a. Соединение по варианту осуществления 1, где R2 представляет собой C1-C4 алкил, незамещенный или замещенный с помощью заместителей, выбранных из OMe, SMe, S(O)Me и SO2Me.

Вариант осуществления 1b. Соединение по варианту осуществления 1a, где R2 представляет собой C1-C4 алкил, замещенный с помощью OMe, SMe, S(O)Me или SO2Me.

Вариант осуществления 1c. Соединение по варианту осуществления 1a, где R2 представляет собой C1-C4 алкил.

Вариант осуществления 1d. Соединение по варианту осуществления 1c, где R2 представляет собой метил.

Вариант осуществления 1e. Соединение по любому из вариантов осуществления 1-1d, где R3 представляет собой H или метил.

Вариант осуществления 1f. Соединение по любому из вариантов осуществления 1-1d, где R4 представляет собой H, C1-C2 алкил или C1-C2 галогеналкил.

Вариант осуществления 2. Соединение формулы **1,** где J представляет собой J-2.

Вариант осуществления 2a. Соединение по варианту осуществления 2 или 2a, где R5 представляет собой H или метил.

Вариант осуществления 2b. Соединение по варианту осуществления 2a, где R5 представляет собой метил.

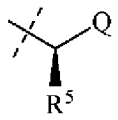
Вариант осуществления 2c. Соединение по варианту осуществления 2a, где R5 представляет собой H.

Вариант осуществления 2d. Соединение по любому из вариантов осуществления 2-2c, где Q представляет собой пиридинил или пиримидинил.

Вариант осуществления 2e. Соединение по варианту осуществления 2d, где Q представляет собой пиридинил.

Вариант осуществления 2f. Соединение по варианту осуществления 2d, где Q представляет собой пиримидинил.

Вариант осуществления 2g. Соединение по любому из вариантов осуществления 2-2f, где J-2 представляет собой



J-2a

Вариант осуществления 3. Композиция, состоящая из соединения формулы **1,** где J представляет собой J-2a, и соединение формулы **1,** где J представляет собой J-2b

J-2a J-2b ,

где отношение соединения формулы **1,** где J представляет собой J-2a, к соединению формулы **1,** где J представляет собой J-2b, составляет больше чем 60:40.

Вариант осуществления 3a. Композиция по варианту осуществления 3, где отношение соединения формулы **1,** где J представляет собой J-2a, к соединению формулы **1,** где J представляет собой J-2b, составляет больше чем 80:20.

Вариант осуществления 3b. Композиция по варианту осуществления 3, где отношение соединения формулы **1,** где J представляет собой J-2a, к соединению формулы **1,** где J представляет собой J-2b, составляет больше чем 90:10.

Вариант осуществления 3c. Композиция по варианту осуществления 3, где отношение соединения формулы **1,** где J представляет собой J-2a, к соединению формулы **1,** где J представляет собой J-2b, составляет больше чем 95:5.

Вариант осуществления 3d. Композиция по варианту осуществления 3, где отношение соединения формулы **1,** где J представляет собой J-2a, к соединению формулы **1,** где J представляет собой J-2b, составляет больше чем 99:1.

Вариант осуществления 3e. Композиция, состоящая из соединения формулы **1,** где J представляет собой J-2a, и соединения формулы **1,** где J представляет собой J-2b

J-2a J-2b ,

и R5 представляет собой метил;

где отношение соединения формулы 1, где J представляет собой J-2a, к соединению формулы 1, где J представляет собой J-2b, составляет больше чем 60:40.

Вариант осуществления 3f. Композиция по варианту осуществления 3e, где отношение соединения формулы 1, где J представляет собой J-2a, к соединению формулы 1, где J представляет собой J-2b, составляет больше чем 80:20.

Вариант осуществления 3g. Композиция по варианту осуществления 3e, где отношение соединения формулы 1, где J представляет собой J-2a, к соединению формулы 1, где J представляет собой J-2b, составляет больше чем 90:10.

Вариант осуществления 3h. Композиция по варианту осуществления 3e, где отношение соединения формулы 1, где J представляет собой J-2a, к соединению формулы 1, где J представляет собой J-2b, составляет больше чем 95:5.

Вариант осуществления 3i. Композиция по варианту осуществления 3e, где отношение соединения формулы 1, где J представляет собой J-2a, к соединению формулы 1, где J представляет собой J-2b, составляет больше чем 99:1.

Вариант осуществления 3j. Композиция, состоящая из соединения формулы 1, где J представляет собой J-2a, и соединения формулы 1, где J представляет собой J-2b

J-2a J-2b , и

Q представляет собой пиридинил;

где отношение соединения формулы 1, где J представляет собой J-2a, к соединению формулы 1, где J представляет собой J-2b, составляет больше чем 60:40.

Вариант осуществления 3k. Композиция по варианту осуществления 3j где отношение соединения формулы 1, где J представляет собой J-2a, к соединению формулы 1, где J представляет собой J-2b, составляет больше чем 80:20.

Вариант осуществления 3l. Композиция по варианту осуществления 3j где отношение соединения формулы 1, где J представляет собой J-2a, к соединению формулы 1, где J представляет собой J-2b, составляет больше чем 90:10.

Вариант осуществления 3m. Композиция по варианту осуществления 3j где отношение соединения формулы 1, где J представляет собой J-2a, к соединению формулы 1, где J представляет собой J-2b, составляет больше чем 95:5.

Вариант осуществления 3n. Композиция по варианту осуществления 3j где отношение соединения формулы 1, где J представляет собой J-2a, к соединению формулы 1, где J представляет собой J-2b, составляет больше чем 99:1.

Вариант осуществления 3o. Композиция, состоящая из соединения формулы 1, где J представляет собой J-2a, и соединения формулы 1, где J представляет собой J-2b

J-2a J-2b ,

и Q представляет собой пиримидинил;

где отношение соединения формулы 1, где J представляет собой J-2a, к соединению формулы 1, где J представляет собой J-2b, составляет больше чем 60:40.

Вариант осуществления 3p. Композиция по варианту осуществления 3o, где отношение соединения формулы 1, где J представляет собой J-2a, к соединению формулы 1, где J представляет собой J-2b, составляет больше чем 80:20.

Вариант осуществления 3q. Композиция по варианту осуществления 3o, где отношение соединения формулы 1, где J представляет собой J-2a, к соединению формулы 1, где J представляет собой J-2b, составляет больше чем 90:10.

Вариант осуществления 3r. Композиция по варианту осуществления 3o, где отношение соединения формулы 1, где J представляет собой J-2a, к соединению формулы 1, где J представляет собой J-2b, составляет больше чем 95:5.

Вариант осуществления 3s. Композиция по варианту осуществления 3o, где отношение соединения формулы 1, где J представляет собой J-2a, к соединению формулы 1, где J представляет собой J-2b, составляет больше чем 99:1.

Вариант осуществления 4. Соединение формулы **1,** где J представляет собой J-3.

Вариант осуществления 4a. Соединение по варианту осуществления 4, где R6 представляет собой H.

Вариант осуществления 4b. Соединение по варианту осуществления 4, где R7 представляет собой C1-C4 алкил.

Вариант осуществления 4c. Соединение по варианту осуществления 4b, где R7 представляет собой метил или этил.

Вариант осуществления 4d. Соединение по варианту осуществления 4c, где R7 представляет собой метил.

Вариант осуществления 5. Соединение формулы **1** или вариант осуществления 1, где J представляет собой J-4.

Вариант осуществления 5a. Соединение по варианту осуществления 5, где X представляет собой -O-.

Вариант осуществления 5b. Соединение по варианту осуществления 5, где X представляет собой -C(O)-.

Вариант осуществления 5c. Соединение по варианту осуществления 5, 5a или 5b где R8 представляет собой C1-C2 алкил или C1-C2 галогеналкил.

Вариант осуществления 5d. Соединение по варианту осуществления 5c, где R8 представляет собой метил или этил.

Вариант осуществления 5e. Соединение по варианту осуществления 5d, где R8 представляет собой метил.

Вариант осуществления 6. Соединение формулы **1,** где J представляет собой J-5.

Вариант осуществления 6a. Соединение по варианту осуществления 6, где R14 представляет собой C1-C4 алкил.

Вариант осуществления 6b. Соединение по варианту осуществления 6a, где R14 представляет собой метил или этил.

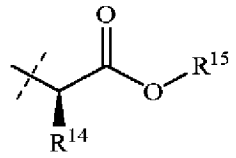
Вариант осуществления 6c. Соединение по варианту осуществления 6b, где R14 представляет собой метил.

Вариант осуществления 6d. Соединение по любому из вариантов осуществления 6-6c, где R15 представляет собой C1-C4 алкил.

Вариант осуществления 6e. Соединение по варианту осуществления 6d, где R14 представляет собой метил или этил.

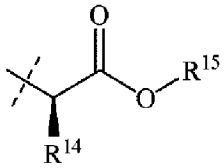
Вариант осуществления 6f. Соединение по варианту осуществления 6e, где R14 представляет собой метил.

Вариант осуществления 6g. Соединение по любому из вариантов осуществления 6-6f, где J-5 представляет собой

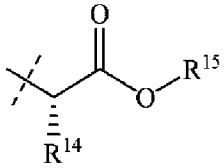


J-5a

Вариант осуществления 7. Композиция, состоящая из соединения формулы 1, где J представляет собой J-5a, и соединения формулы 1, где J представляет собой J-5b



J-5a



J-5b

где отношение соединения формулы 1, где J представляет собой J-5a, к соединению формулы 1, где J представляет собой J-5b, составляет больше чем 60:40.

Вариант осуществления 7a. Композиция по варианту осуществления 7, где отношение соединения формулы 1, где J представляет собой J-5a, к соединению формулы 1, где J представляет собой J-5b, составляет больше чем 80:20.

Вариант осуществления 7b. Композиция по варианту осуществления 7, где отношение соединения формулы 1, где J представляет собой J-5a, к соединению формулы 1, где J представляет собой J-5b, составляет больше чем 90:10.

Вариант осуществления 7c. Композиция по варианту осуществления 7, где отношение соединения формулы 1, где J представляет собой J-5a, к соединению формулы 1, где J представляет собой J-5b, составляет больше чем 95:5.

Вариант осуществления 7b. Композиция по варианту осуществления 7, где отношение соединения формулы 1, где J представляет собой J-5a, к соединению формулы 1, где J представляет собой J-5b, составляет больше чем 99:1.

Вариант осуществления 8. Соединение формулы **1,** где J представляет собой J-6.

Вариант осуществления 8a. Соединение по варианту осуществления 8, где R16 представляет собой F, метил или амино.

Вариант осуществления 8b. Соединение по варианту осуществления 8a, где R16 представляет собой метил.

Вариант осуществления 9. Соединение формулы **1,** где J представляет собой C2-C4 алкил, замещенный с помощью одной цианогруппы.

Вариант осуществления 9a. Соединение по варианту осуществления 9, где J представляет собой этил, замещенный с помощью одной цианогруппы.

Вариант осуществления 9b. Соединение по варианту осуществления 9a, где J представляет собой -CH(CN)CH3.

Вариант осуществления 10. Соединение формулы **1,** где J представляет собой -CH2(циклопропил), замещенный с помощью одной цианогруппы.

Вариант осуществления 10a. Соединение по варианту осуществления 10, где J представляет собой -CH(CN)(циклопропил).

Вариант осуществления 11. Соединение формулы **1,** где J представляет собой циклопропил, незамещенный или замещенный с помощью одной цианогруппы или одной группы C(O)NHR17.

Вариант осуществления 11a. Соединение по варианту осуществления 11, где J представляет собой циклопропил.

Вариант осуществления 11b. Соединение по варианту осуществления 11, где J представляет собой 1-(циано)циклопропил.

Вариант осуществления 11c. Соединение формулы **1,** где J представляет собой C2-C4 алкил, замещенный с помощью одной цианогруппы; или циклопропил.

Вариант осуществления 12. Соединение формулы **1** или любой из вариантов осуществления 1-11c, где R1a представляет собой Cl.

Вариант осуществления 12a. Соединение формулы **1** или любой из вариантов осуществления 1-11c, где R1a представляет собой CF3.

Вариант осуществления 13. Соединение формулы **1** или любой из вариантов осуществления 1-12a, где R1b представляет собой H.

Вариант осуществления 13a. Соединение формулы **1** или любой из вариантов осуществления 1-12a, где R1b представляет собой Cl.

Вариант осуществления 14. Соединение формулы **1** или любой из вариантов осуществления 1-11c, где R1a представляет собой H, и R1b представляет собой CF3.

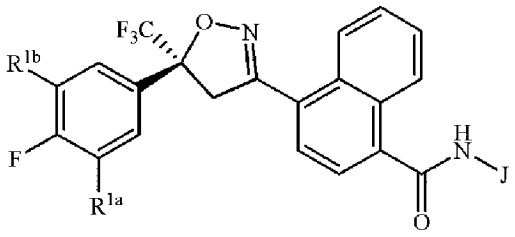
Вариант осуществления 15. Соединение формулы **1** или любой из вариантов осуществления 1-11c, где R1a представляет собой Cl, и R1b представляет собой Cl.

Вариант осуществления 16. Соединение формулы **1** или любой из вариантов осуществления 1-11c, где R1a представляет собой Cl, и R1b представляет собой CF3.

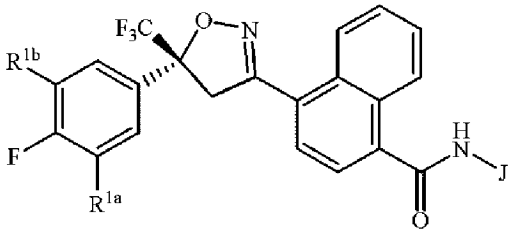
Вариант осуществления 17. Соединение формулы **1** или любой из вариантов осуществления 1-11c, где R1a представляет собой H, и R1b представляет собой CF3, или R1a представляет собой Cl, и R1b представляет собой Cl, или R1a представляет собой Cl, и R1b представляет собой CF3.

Вариант осуществления 17a. Соединение формулы **1** или любой из вариантов осуществления 1-11c, где R1a представляет собой H, и R1b представляет собой CF3, или R1a представляет собой Cl, и R1b представляет собой Cl.

Вариант осуществления 18. Композиция, состоящая из соединения формулы 1-1S и соединения формулы 1-1R



1-1S



1-1R

,

где отношение соединения формулы 1-1S к соединению формулы 1-1R составляет больше чем 60:40.

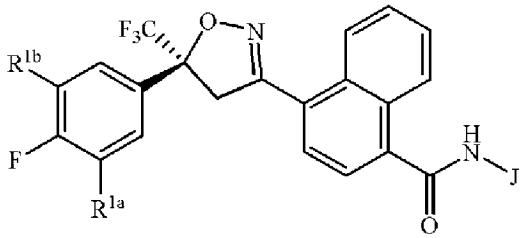
Вариант осуществления 18a. Композиция по варианту осуществления 18, где отношение соединения формулы 1-1S к соединению формулы 1-1R составляет больше чем 80:20.

Вариант осуществления 18b. Композиция по варианту осуществления 18, где отношение соединения формулы 1-1S к соединению формулы 1-1R составляет больше чем 90:10.

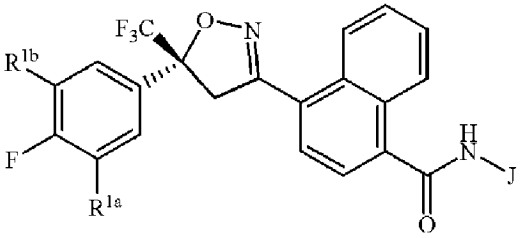
Вариант осуществления 18c. Композиция по варианту осуществления 18, где отношение соединения формулы 1-1S к соединению формулы 1-1R составляет больше чем 95:5.

Вариант осуществления 18d. Композиция по варианту осуществления 18, где отношение соединения формулы 1-1S к соединению формулы 1-1R составляет больше чем 99:1.

Вариант осуществления 19. Композиция, состоящая из соединения формулы 1-1S и соединения формулы 1-1R



1-1S



1-1R

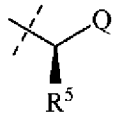
,

где отношение соединения формулы 1-1S к соединению формулы 1-1R составляет больше чем 60:40.

Вариант осуществления 19a. Композиция по варианту осуществления 19, где J представляет собой J-1.

Вариант осуществления 19b. Композиция по варианту осуществления 19, где J представляет собой J-2.

Вариант осуществления 19c. Композиция по варианту осуществления 19b, где J представляет собой J-2a



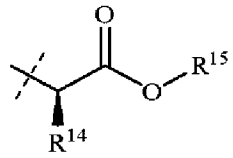
J-2a .

Вариант осуществления 19d. Композиция по варианту осуществления 19, где J представляет собой J-3.

Вариант осуществления 19e. Композиция по варианту осуществления 19, где J представляет собой J-4.

Вариант осуществления 19f. Композиция по варианту осуществления 19, где J представляет собой J-5.

Вариант осуществления 19g. Композиция по варианту осуществления 19f, где J представляет собой J-5a



J-5a .

Вариант осуществления 19h. Композиция по варианту осуществления 19, где J представляет собой J-6.

Вариант осуществления 19i. Композиция по варианту осуществления 19, где J представляет собой C2-C4 алкил, замещенный с помощью одной цианогруппы.

Вариант осуществления 19j. Композиция по варианту осуществления 19, где J представляет собой -CH2(циклопропил), замещенный с помощью одной цианогруппы.

Вариант осуществления 19k. Композиция по варианту осуществления 19, где J представляет собой циклопропил, незамещенный или замещенный с помощью одной цианогруппы или одной группы C(O)NHR17.

Варианты осуществления 20-20k идентичны вариантам осуществления 19-19k, за исключением того, что отношение соединения формулы 1-1S к соединению формулы 1-1R составляет больше чем 80:20.

Варианты осуществления 21-21k идентичны вариантам осуществления 19-19k, за исключением того, что отношение соединения формулы 1-1S к соединению формулы 1-1R составляет больше чем 90:10.

Варианты осуществления 22-22k идентичны вариантам осуществления 19-19k, за исключением того, что отношение соединения формулы 1-1S к соединению формулы 1-1R составляет больше чем 95:5.

Варианты осуществления 23-23k идентичны вариантам осуществления 19-19k, за исключением того, что отношение соединения формулы 1-1S к соединению формулы 1-1R составляет больше чем 99:1.

Варианты осуществления этого изобретения, включая приведенные выше варианты осуществления 1-23k, а также любые другие описанные в изобретении варианты осуществления, могут быть объединены любым способом, и описания переменных в вариантах осуществления относится не только к соединениям формулы **1,** но также к исходным соединениям и промежуточным соединениям, применяемым для получения соединений формулы **1**. Кроме того, варианты осуществления этого изобретения, включая приведенные выше варианты осуществления 1-23k, а также любые другие описанные в изобретении варианты осуществления, и любая их комбинация относятся к композициям и способам по настоящему изобретению.

Иллюстрациями комбинаций вариантов осуществления 1-23k являются следующие комбинации.

Вариант осуществления A. Соединение формулы **1,** где J представляет собой J-1, J-2 или J-5.

Вариант осуществления B. Соединение по варианту осуществления A, где J представляет собой J-1.

Вариант осуществления C. Соединение по варианту осуществления B, где R2 представляет собой C1-C4 алкил.

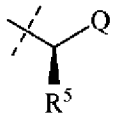
Вариант осуществления D. Соединение по варианту осуществления C, где R2 представляет собой метил.

Вариант осуществления E. Соединение по варианту осуществления A, где J представляет собой J-2.

Вариант осуществления F. Соединение по варианту осуществления E, где R5 представляет собой H или метил.

Вариант осуществления G. Соединение по варианту осуществления F, где Q представляет собой пиридинил или пиримидинил.

Вариант осуществления H. Соединение по любому одному из вариантов осуществления E, F или G, где J-2 представляет собой

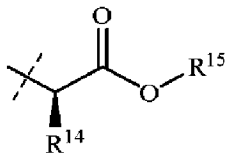


J-2a .

Вариант осуществления I. Соединение по варианту осуществления A, где J представляет собой J-5.

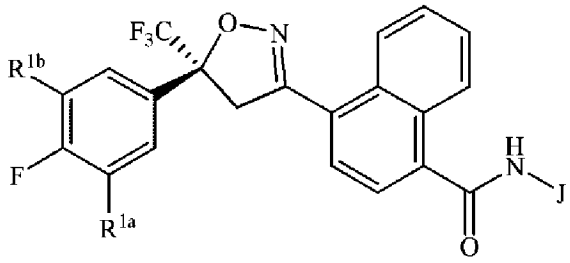
Вариант осуществления J. Соединение по варианту осуществления I, где R14 представляет собой C1-C4 алкил.

Вариант осуществления K. Соединение по любому одному из вариантов осуществления I или J, где J-5 представляет собой



J-5a

Вариант осуществления L. Соединение по любому одному из вариантов осуществления A-K, где соединение формулы **1** представляет собой соединение формулы **1-1S**



1-1S

Вариант осуществления M. Соединение формулы **1,** где J представляет собой C2-C4 алкил, замещенный с помощью одной цианогруппы; -CH2(циклопропил), замещенный с помощью одной цианогруппы; или циклопропил, незамещенный или замещенный с помощью одной цианогруппы или одной группы C(O)NHR17; или J-1, J-2 или J-5.

Вариант осуществления N. Соединение по варианту осуществления M, где R1a представляет собой Cl, и R1b представляет собой Cl; или R1a представляет собой CF3, и R1b представляет собой H.

Вариант осуществления O. Соединение по варианту осуществления N, где J представляет собой C2-C4 алкил, замещенный с помощью одной цианогруппы; или циклопропил.

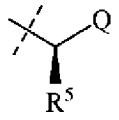
Вариант осуществления P. Соединение по варианту осуществления N, где J представляет собой J-1.

Вариант осуществления Q. Соединение по варианту осуществления P, где R2 the соединение of Formula метил; R3 представляет собой H или метил; и R4 представляет собой H или метил.

Вариант осуществления R. Соединение по варианту осуществления N, где J представляет собой J-2.

Вариант осуществления S. Соединение по варианту осуществления R, где R5 представляет собой H или метил; и Q представляет собой пиридинил или пиримидинил.

Вариант осуществления T. Соединение по варианту осуществления S, где J-2 представляет собой

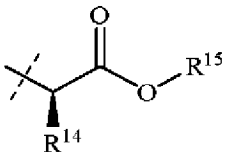


J-2a

Вариант осуществления U. Соединение по варианту осуществления N, где J представляет собой J-5.

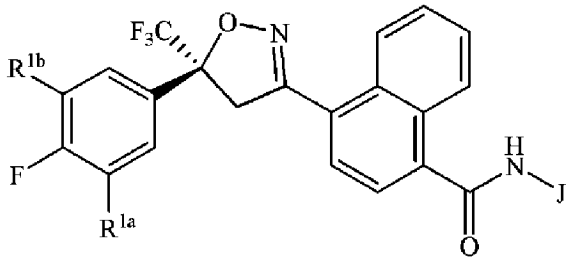
Вариант осуществления V. Соединение по варианту осуществления U, где R14 представляет собой H или метил; и R15 представляет собой C1-C4 алкил.

Вариант осуществления W. Соединение по варианту осуществления V, где J-5 представляет собой



J-5a

Вариант осуществления L-1. Соединение формулы **1-1S**



1-1S

Вариант осуществления L-2. Соединение формулы **1-1S,** где J представляет собой C2-C4 алкил, замещенный с помощью одной цианогруппы; -CH2(циклопропил), замещенный с помощью одной цианогруппы; или циклопропил, незамещенный или замещенный с помощью одной цианогруппы или одной группы C(O)NHR17; или J-1, J-2 или J-5.

Вариант осуществления L-3. Соединение по варианту осуществления L-2, где R1a представляет собой Cl, и R1b представляет собой Cl; или R1a представляет собой CF3, и R1b представляет собой H.

Вариант осуществления L-4. Соединение по варианту осуществления L-3, где J представляет собой C2-C4 алкил, замещенный с помощью одной цианогруппы; или циклопропил.

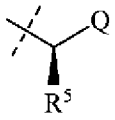
Вариант осуществления L-5. Соединение по варианту осуществления L-3, где J представляет собой J-1.

Вариант осуществления L-6. Соединение по варианту осуществления L-5, где R2 представляет собой метил; R3 представляет собой H или метил; и R4 представляет собой H или метил.

Вариант осуществления L-7. Соединение по варианту осуществления L-3, где J представляет собой J-2.

Вариант осуществления L-8. Соединение по варианту осуществления L-7, где R5 представляет собой H или метил; и Q представляет собой пиридинил или пиримидинил.

Вариант осуществления L-9. Соединение по варианту осуществления L-8, где J-2 представляет собой

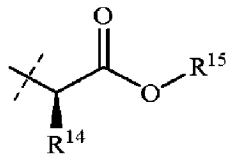


J-2a .

Вариант осуществления L-10. Соединение по варианту осуществления L-3, где J представляет собой J-5.

Вариант осуществления L-11. Соединение по варианту осуществления L-10, где R14 представляет собой H или метил; и R15 представляет собой C1-C4 алкил.

Вариант осуществления L-12. Соединение по варианту осуществления U, где J-5 представляет собой



J-5a .

Конкретные варианты осуществления включают соединения формулы **1,** выбранные из группы, состоящей из соединений 1, 3, 8, 10, 11, 19, 20, 33, 34, 39, 50, 61, 67, 69, 70 и 71. Номера соединений приведены в таблицах показателей. Таким образом, конкретные варианты осуществления включают соединения формулы **1,** выбранные из группы, состоящей из соединения формулы **1,** где R1a представляет собой Cl, R1b представляет собой Cl, J представляет собой J-1, R2 представляет метил, R3 представляет собой H, и R4 представляет собой H (соединение 1); соединение формулы **1,** где R1a представляет собой Cl, R1b представляет собой Cl, J представляет собой J-1, R2 представляет метил, R3 представляет собой H, и R4 представляет метил (соединение 3); соединение формулы **1,** где R1a представляет собой Cl, R1b представляет собой Cl, J представляет собой J-2, R5 представляет собой H, и Q представляет собой 2-пиримидинил (соединение 10); соединение формулы **1,** где R1a представляет собой CF3, R1b представляет собой Cl, J представляет собой J-2, R5 представляет собой H, и Q представляет собой 2-пиримидинил (соединение 11); соединение формулы **1,** где R1a представляет собой Cl, R1b представляет собой Cl, J представляет собой J-2, R5 представляет метил, и Q представляет собой 2-пиримидинил (соединение 19); соединение формулы **1,** где R1a представляет собой Cl, R1b представляет собой Cl, J представляет собой J-2a, R5 представляет метил, и Q представляет собой 2-пиридинил (соединение 20);

соединение формулы **1,** где R1a представляет собой Cl, R1b представляет собой Cl, J представляет собой J-3, R6 представляет собой H, и R7 представляет метил (соединение 33); соединение формулы **1,** где R1a представляет собой Cl, R1b представляет собой Cl, J представляет собой J-4, X представляет O, и R8 представляет этил (соединение 34); соединение формулы **1,** где R1a представляет собой Cl, R1b представляет собой Cl, J представляет собой J-5a, R14 представляет метил, и R15 представляет метил (соединение 39); соединение формулы **1,** где R1a представляет собой CF3, R1b представляет собой H, J представляет собой J-2, R5 представляет собой H, и Q представляет собой 2-пиримидинил (соединение 50); соединение формулы **1,** где R1a представляет собой CF3, R1b представляет собой H, и J представляет собой циклопропил (соединение 67); соединение формулы **1,** где R1a представляет собой CF3, R1b представляет собой H, и J представляет собой 1-(циано)этил (соединение 69); соединение формулы **1,** где R1a представляет собой Cl, R1b представляет собой Cl, и J представляет собой циклопропил (соединение 70); соединение формулы **1,** где R1a представляет собой Cl, R1b представляет собой Cl, и J представляет собой 1-(циано)этил (соединение 71); соединение формулы **1-1S,** где R1a представляет собой Cl, R1b представляет собой Cl, J представляет собой J-1, R2 представляет собой метил, R3 представляет собой H, и R4 представляет собой H (соединение 8); и соединение формулы **1-1S,** где R1a представляет собой Cl, R1b представляет собой Cl, J представляет собой J-2, R5 представляет собой H, и Q представляет собой 2-пиримидинил (соединение 61).

Следует отметить, что соединения по этому изобретению характеризуются благоприятными метаболическими характеристиками и/или свойствами стойкости в почве и проявляют активность при борьбе с широким спектром агротехнических и неагротехнических беспозвоночных вредителей.

Особенно следует отметить варианты осуществления изобретения, относящиеся к борьбе с широким спектром беспозвоночных вредителей и ее экономической значимости, к защите сельскохозяйственных культур от ущерба или повреждения, вызванных беспозвоночными вредители. Соединения по этому изобретению, вследствие их благоприятных свойств, связанных со способностью передвигаться в растениях, и их системного действия, также защищают листву или другие части растений, которые непосредственно не находятся в контакте с соединением формулы **1** или содержащей соединение композицией.

Биоаккумуляция пестицидов в нецелевых организмах является важной проблемой при обеспечении безопасности, и часто является желательным ограничение системного воздействия и/или накопления пестицидов и/или их метаболитов в нецелевых организмах. Например, если планируется применение соединения в качестве инсектицида на сельскохозяйственных культурах, то желательно, чтобы соединение не накапливалось в плазме или жире позвоночных животных.

Соединения формулы **1** могут характеризоваться благоприятными фармакокинетическими свойствами при попадании в организм позвоночных животных. В

частности, было обнаружено, что соединения формулы 1 характеризуются быстрым выведением из плазмы/крови позвоночного животного и низким распределением в жировой ткани позвоночного животного, благодаря чему уменьшается вероятность нежелательной биоаккумуляции. Следует обратить внимание на атом фтора в 4-положении фенильного кольца, присоединенного в 5-положении изоксазолинового кольца.

Фармакокинетические свойства соединений формулы **1** могут быть определены, используя разнообразные методы анализа, известные в фармакологии. В одном иллюстративном методе, в котором используют разовую пероральную дозу, трем самцам и трем самкам крыс принудительно вводят через зонд разовую дозу испытуемого вещества. Собирают кровь из хвостовой вены через 0,25, 0,5, 1, 2, 4, 8, 12 и 24 часа, и затем через каждые 24 часа вплоть до момента умерщвления. Для получения образцов плазмы, кровь собирают в пробирки, содержащие этилендиаминтетрауксусную кислоту (EDTA), и центрифугируют при приблизительно 3000 об/мин для отделения плазмы от эритроцитов. В качестве варианта, кровь собирают, используя микрокапилляры, и переносят в пробирки, содержащие смесь EDTA : вода (1:1, по объему). Кроме того, при умерщвлении собирают жир, гомогенизируют и подвергают экстракции для определения концентрации соединения формулы **1**. Плазму или кровь и жир анализируют на содержание соединения формулы **1** и/или метаболитов, например, методом высокоэффективной жидкостной хроматографии (HPLC) с детекцией методом тандемной масс-спектрометрии (LC/MS/MS) с определением концентрации испытуемого соединения. Фармакокинетические данные для плазмы или крови анализируют с использованием компьютерной программа для нелинейного моделирования (например, Phoenix® WinNonlin®, Pharsight-A Certara™ Company, St. Louis, MO, U.S.A.) для определения периода полувыведения соединение формулы **1** из плазмы/крови, времени после введения, когда достигается максимальная концентрация в плазме/крови (Tmax), максимальной концентрации в плазме/крови (Cmax), и площади под кривой концентрации в плазме/крови (AUC). Так как анализ жира требует умерщвления крысы, то данные по жиру получают в единственный момент времени (то есть в момент времени умерщвления крысы). Затем определяют отношение концентраций соединения формулы **1** жир:плазма или жир:кровь.

Также заслуживают внимания в качестве вариантов осуществления настоящего изобретения композиции, включающие соединение по любому из предшествующих вариантов осуществления, а также по любым другим вариантам осуществления, описанным в изобретении, и по любым их комбинациям, и, по меньшей мере, один дополнительный компонент, выбранный из группы, состоящей из поверхностно-активного вещества, твердого разбавителя и жидкого разбавителя, где указанные композиции, необязательно, дополнительно включают, по меньшей мере, одно дополнительное биологически активное соединение или средство.

Кроме того, также заслуживают внимания в качестве вариантов осуществления настоящего изобретения композиции для борьбы с беспозвоночным вредителем, включающие соединения по любому из предшествующих вариантов осуществления, а также по любым другим вариантам осуществления, описанным в изобретении, и по любым их комбинациям, и, по меньшей мере, один дополнительный компонент, выбранный из группы, состоящей из поверхностно-активного вещества, твердого разбавителя и жидкого разбавителя, где указанные композиции, необязательно, дополнительно включают, по меньшей мере, одно дополнительное биологически активное соединение или средство. Варианты осуществления изобретения дополнительно включают способы борьбы с беспозвоночным вредителем, включающие контактирование беспозвоночного вредителя или среды его обитания с биологически эффективным количеством соединения по любому из предшествующих вариантов осуществления (например, в форме описанной в изобретении композиции).

Варианты осуществления изобретения также включают композицию, содержащую соединение по любому из предшествующих вариантов осуществления, в форме жидкого препарата для пропитки почвы. Варианты осуществления изобретения дополнительно включают способы борьбы с беспозвоночным вредителем, включающие контактирование почвы с жидкой композицией в форме пропитки для почвы, включающей биологически эффективное количество соединение по любому из предшествующих вариантов осуществления.

Варианты осуществления изобретения также включают распыляемую композицию для борьбы с беспозвоночным вредителем, включающую биологически эффективное количество соединения по любому из предшествующих вариантов осуществления и пропеллент. Кроме того, варианты осуществления изобретения включают композицию для приманки для борьбы с беспозвоночным вредителем, включающую биологически эффективное количество соединения по любому из предшествующих вариантов осуществления, одно или более пищевых веществ, необязательно, аттрактант, и, необязательно, увлажнитель. Варианты осуществления изобретения также включают устройство для борьбы с беспозвоночным вредителем, включающее указанную композицию для приманки и корпус, приспособленный для загрузки в него указанной композиции для приманки, где корпус имеет, по меньшей мере, одно отверстие, размер которого позволяет проходить беспозвоночному вредителю через отверстие, в результате чего беспозвоночный вредитель может получать доступ к указанной композиции для приманки из его места нахождения снаружи корпуса, и где корпус дополнительно приспособлен для размещения в месте или рядом с местом потенциальной или известной активности беспозвоночного вредителя.

Варианты осуществления изобретения также включают способы защиты семян от беспозвоночного вредителя, включающие контактирование семян с биологически эффективным количеством соединения по любому из предшествующих вариантов осуществления.

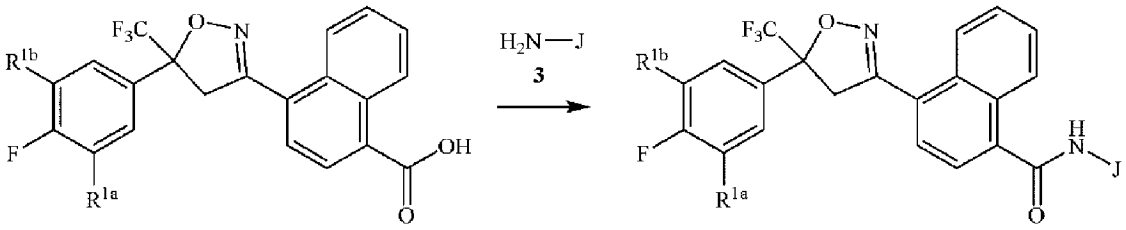
Варианты осуществления изобретения также включают способы борьбы с беспозвоночным вредителем, включающие контактирование беспозвоночного вредителя или среды его обитания с биологически эффективным количеством соединения формулы **1** (например, в форме описанной в изобретении композиции), при условии, что способы не являются способами терапевтического лечения организма человека.

Это изобретение также относится к таким способам, в которых беспозвоночный вредитель или его среда обитания подвергается контактированию с композицией, включающей биологически эффективное количество соединения формулы **1**, и, по меньшей мере, один дополнительный компонент, выбранный из группы, состоящей из поверхностно-активных веществ, твердых разбавителей и жидких разбавителей, где указанная композиция необязательно дополнительно включает биологически эффективное количество, по меньшей мере, оодного дополнительного биологически активного соединения или средства, при условии, что способы не являются способами терапевтического лечения организма человека.

Соединения формулы **1** могут быть получены одним или более из следующих методов и из вариантов, описанных на схемах 1-11. Определения заместителей в соединения формул **1**-**15** ниже являются такими же, как приведенные выше определения в разделе "Сущность изобретения", если не указано иное. Соединения формул **1a** и **1b** представляют собой подгруппы соединений формулы **1**, и все заместители для формул **1a** и **1b** определены выше для формулы **1**. Могут быть использованы следующие условные сокращенные обозначения: DMF обозначает N, N-диметилформамид, и DBU обозначает 1,8-диазабицикло[5,4,0]ундец-7-ен.

Соединения формулы **1a** (формула **1,** где J представляет собой J-1, J-2, J-4, J-5 или J-6) могут быть получены из соединений формулы **2** с помощью метода, представленного на схеме 1. В этом методе, карбоновую кислоту формулы **2** подвергают реакции сочетания с соединением амина формулы **3** (где J представляет собой J-1, J-2, J-4, J-5 или J-6), как правило, в присутствии дегидратирующего реагента для проведения реакции сочетания. Реагенты для проведения реакции сочетания, которые могут применяться в этом методе, включают дициклогексилкарбодиимид, 1-(3-диметиламинопропил)-3-этилкарбодиимид и карбонилдиимидазол. Дополнительные реагенты для проведения реакции сочетания, которые могут применяться в этом методе, включают циклический ангидрид 1-пропанфосфоновой кислоты, 1-[бис(диметиламино)метилен]-1H-1,2,3-триазоло[4,5-b]пиридиния 3-оксида гексафторфосфат и N-[(диметиламино)-1H-1,2,3-триазоло-[4,5-b]пиридин-1-илметилен]-N-метилметанаминия гексафторфосфата N-оксид; эти реагенты для проведения реакции сочетания обычно используют в присутствии основания, такого как триэтиламин, пиридин, 4-(диметиламино)пиридин или N, N-диизопропилэтиламин. Типичные условия проведения реакции включают безводный апротонный растворитель, такой как дихлорметан, тетрагидрофуран или DMF, и температуру реакции от комнатной температуры до 70°C.

Схема 1



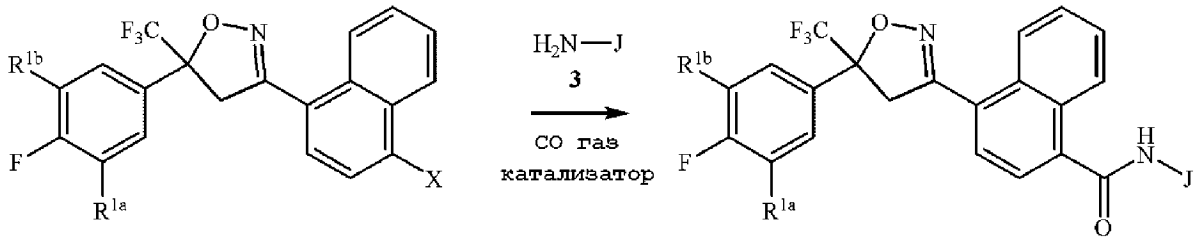
2 **1a**

J is J-1, J-2, J-4, J-5 or J-6

Соединения формулы **1a** могут быть также получены путем превращения карбоновых кислот формулы **2** в их соответствующие хлорангидриды и затем проведения реакции сочетания хлорангидридов с аминами формулы **3**. Метод на схеме 1 проиллюстрирован на стадии C примера синтеза 1 и примерах синтеза 2 и 4.

Соединения формулы **1a** (формулы **1,** где J представляет собой J-1, J-2, J-4, J-5 или J-6) могут быть также получены методом, представленным на схеме 2. В этом методе, арилбромид или арилйодид формулы **4** карбонилируют и подвергают реакции сочетания с соединение амина формулы **3** (где J представляет собой J-1, J-2, J-4, J-5 или J-6).

Схема 2



4 X = Br или I **1a**

Этот метод аминокарбонилирования обычно включает обработку арилбромида формулы **4** (где X представляет собой Br или I) с помощью амина формулы **3** в присутствии палладиевого катализатора в атмосфере CO (монооксида углерода). Палладиевые катализаторы, применяемые в этом методе, обычно включают палладий в формальной степени окисления либо 0 (то есть Pd(0)), либо 2 (то есть Pd(II)). Примеры палладийсодержащих соединений и комплексов, применяемых в качестве катализаторов в этом методе, включают PdCl2(PPh3)2 (бис(трифенилфосфин)палладия(II) дихлорид), Pd(PPh3)4 (тетракис(трифенилфосфин)палладий(0)), Pd(C5H7O2)2 (ацетилацетонат палладия(II)), Pd2(dba)3 (трис(дибензилиденацетон)дипалладий(0)), и [1,1'-бис(дифенилфосфино)ферроцен]дихлорпалладий(II). Метод по схеме 2 обычно проводят в жидкой фазе, используя палладиевый катализатор, имеющий хорошую растворимость в жидкой фазе. Используемые в качестве жидкой фазы растворители включают эфиры, такие как 1,2-диметоксиэтан, амиды, такие как N, N-диметилацетамид, и негалогенированные ароматические углеводороды, такие как толуол.

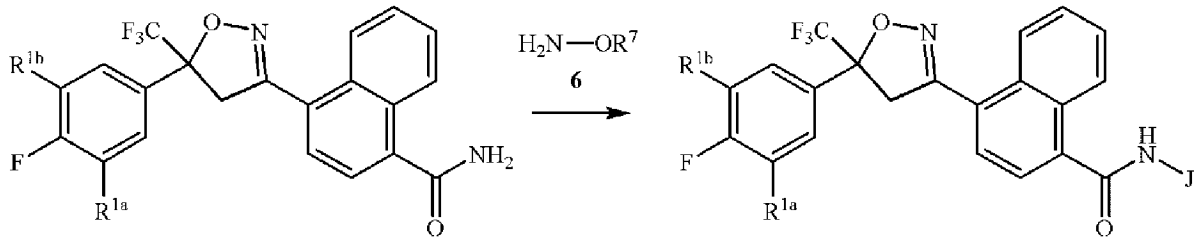
Метод по схеме 2 может быть проведен в широком диапазоне температур от приблизительно 25 до приблизительно 150°C. Предпочтительными являются температуры от приблизительно 60 до приблизительно 110°C, которые обычно обеспечивают более

высокие скорости реакции и более высокие выходы. Примеры публикаций, в которых описаны методы аминокарбонилирования, включают публикации H. Horino et al., Synthesis **1989**, 715; и J. J. Li, G. W. Gribble, editors, Palladium in Heterocyclic Chemistry: A Guide for the Synthetic Chemist, **2000**. Метод по схеме 2 иллюстрируется на стадии B примера синтеза 5.

Соединения формулы **1,** где J представляет собой (i) C2-C4 алкил, замещенный с помощью одной цианогруппы, (ii) -CH2(циклопропил), замещенный с помощью одной цианогруппы, или (iii) циклопропил, незамещенный или замещенный с помощью одной цианогруппы или одной группы C(O)NHR17, могут быть получены методами, аналогичными методам, описанным на схемах и 1 и 2.

Соединения формулы **1b** (формулы **1,** где J представляет собой J-3) могут быть получены из соединений формулы **5** с помощью метода, представленного на схеме 3. В этом методе, амид формулы **5** подвергают обработке соответственно замещенным амином формулы **6**.

Схема 3



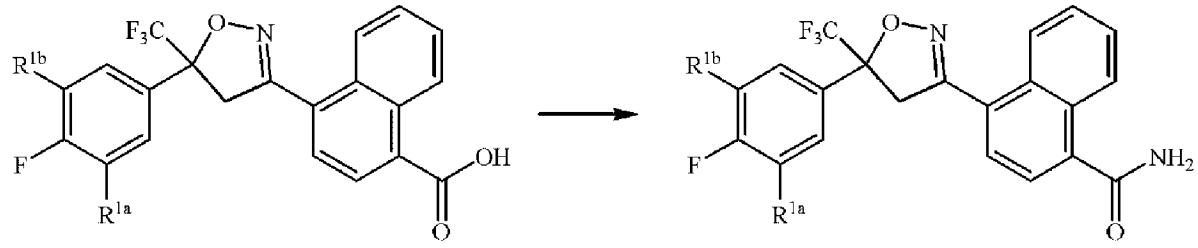
5 **1b**

J is J-3

Метод по схеме 3 может быть проведен путем обработки амида формулы **5** с помощью DMF-DMA в диапазоне температур от приблизительно 25 до приблизительно 110 °C, затем проведения реакции сочетания с амином формулы **6** или с его соответствующей солью. Соединения формулы **1b** могут быть также получены за одну стадию путем обработки амида формулы **5** с помощью триэтилортоформиата и амина формулы **6** или его соответствующей соли в толуоле. Примеры публикаций, в которых описан этот метод, включают публикации T. Mita et al., WO 2009/005015; W. Zhao et al., Org. Lett. **2011**, 5160; и Y. Kusuoka et al., WO 2014/126208. Метод по схеме 3 проиллюстрирован на стадии B примера синтеза 3.

Соединения формулы **5** могут быть получены из соответствующих карбоновых кислот формулы 2, как это показано в методе по схеме 4.

Схема 4

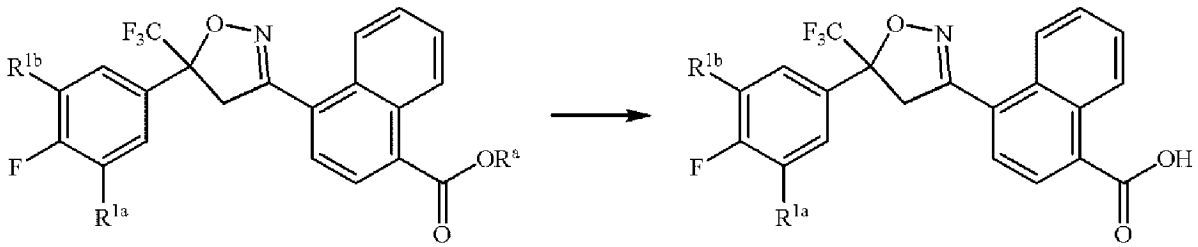


2 5

Превращение, представленное в общем виде на схеме 4, подробно описано в литературе и включает реакцию сочетания карбоновых кислот с источниками аммиака, такими как и карбонат аммония, через соответствующие хлорангидриды. В качестве варианта, реакция сочетания может быть непосредственно проведена в присутствии реагентов для реакции сочетания, таких как HBTU, в растворителях, таких как THF или диоксаны. Метод по схеме 4 проиллюстрирован на стадии A примера синтеза 3.

Соединения формулы **2** могут быть получены гидролизом эфиров формулы **7** (где Ra представляет собой метил или этил), как это показано в методе по схеме 5.

Схема 5



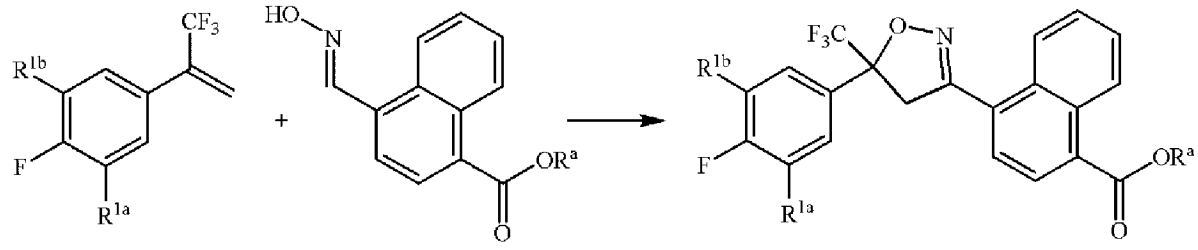
7 2

R^a = метил или этил

В этом методе, эфир формулы **7** превращают в соответствующую карбоновую кислоту формулы **2** в соответствии с хорошо известными методиками. Например, обработка эфира формулы **7** водным раствором гидроксида лития в тетрагидрофуране с последующим подкислением дает соответствующую карбоновую кислоту формулы **2.** Метод по схеме 5 проиллюстрирован на стадии B примера синтеза 1.

Соединения формулы **7** могут быть получены путем 1,3-диполярного присоединения стиролов формулы **8** к нитрилоксидам, образованным из оксимов формулы **9,** как это показано в методе по схеме 6.

Схема 6



8 9 7

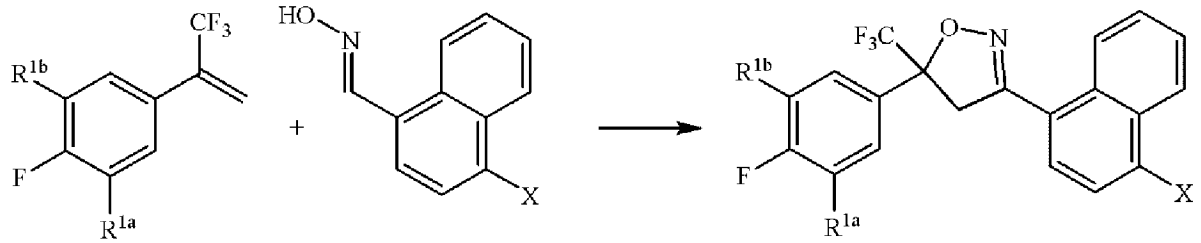
R^a = метил или этил

Этот метод обычно включает хлорирование оксима формулы **9** и последующее дегидрохлорирование с получением образовавшегося in situ нитрилоксида, который затем подвергается 1,3-диполярному присоединению стиролов формулы **8** с получением соединения формулы **7**. В типичной методике, хлорирующий реагент, такой как гипохлорит натрия, N-хлорсукцинимид или хлорамин-Т, подвергают взаимодействию с оксимом формулы **9** в присутствии стирола формулы **8**. В зависимости от условий проведения реакции, для облегчения протекания реакции дегидрохлорирования, может быть необходимо присутствие аминного основания, такого как пиридин или триэтиламин. Растворители, применяемые в этом методе, включают тетрагидрофуран, диэтиловый эфир, метиленхлорид, диоксан и толуол. Температуры реакции изменяются от комнатной температуры до температуры кипения растворителя. Общие методики циклоприсоединения нитрилоксидов и олефинов описаны в публикациях Lee, Synthesis, 1982, 6, 508-509; Kanemasa et al., Tetrahedron, 2000, 56, 1057-1064; EP 1538138 A1, а также в цитированной в этих публикация литературе. Метод по схеме 6 проиллюстрирован на стадии А примера синтеза 1.

Соединения формул **8** и **9** выпускаются промышленностью или являются хорошо известными соединениями, смотрите, например, T. Mita et al., US 7951828, и G. Lahm et al., WO 2007/079162.

Соединения формулы **4** могут быть получены 1,3-диполярным присоединением стиролов формулы **8** к нитрилоксидам, образованным оксимами формулы **10,** как показано в методе по схеме 7.

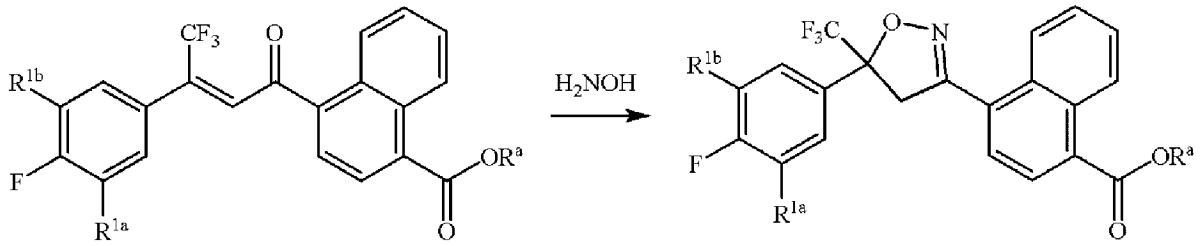
Схема 7



Метод по схеме 7 аналогичен методу по схеме 6. Оксимы формулы **10** производятся промышленностью или являются хорошо известными соединениями; смотрите, например, G. Lahm et al., WO 2007/079162. Метод по схеме 7 проиллюстрирован на стадии А примера синтеза 5.

Соединения формулы **7** могут быть также получены циклизацией соединений формулы **11** с гидроксиламином, как показано в методе по схеме 8.

Схема 8

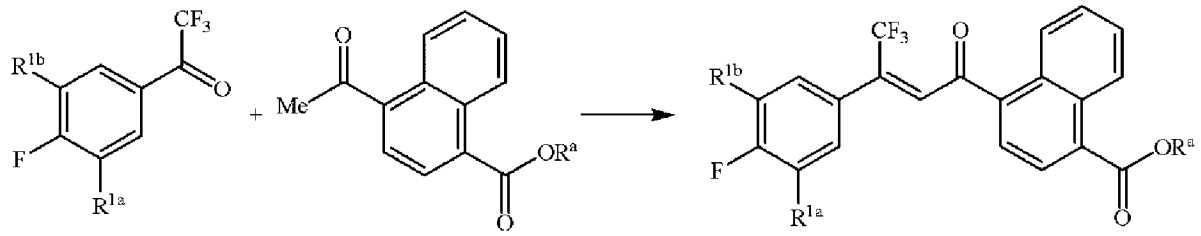


11 R^a= **метил или этил** **7**

В этом методе, изоксазолины формулы **7** могут быть получены путем обработки кетонов формулы **11** гидроксиламином или его солью в присутствии водного раствора основания, такого как NaOH, Cs2CO3 или K2CO3, в растворителе, таком как дихлорэтан, хлороформ или THF. Примеры этого метода описаны в публикациях G. Annis, WO 2009/126668; и K. Matoba et al., Angew. Chem. Int. Ed. **2010**, 49(33), 5762.

Соединения формулы **11** могут быть получены реакцией конденсации соединений формулы **12** с нафталинкетонами формулы **13,** как показано в методе по схеме 9.

Схема 9



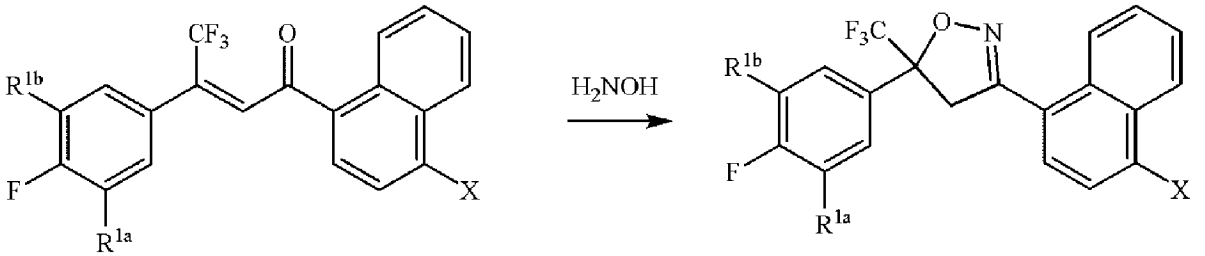
12 **13** R^a= **метил или этил** **11**

Этот метод включает реакцию соединении формул **12** и **13** в присутствии основания, такого как Ca(OH)2, K2CO3, CsCO3, в растворителе, таком как толуол, DMF, MTBE, трифторметилбензол или ацетонитрил, или в смеси таких растворителей. Типичные температуры проведения реакции находятся в диапазоне от приблизительно 60 до приблизительно 130°C. Пример этого метода описан в публикации G. Annis, WO 2009/126668.

Соединения формул **12** и **13** выпускаются промышленностью или являются хорошо известными соединениями; смотрите, например, публикации Chunhua Yang et al., WO 2017/176948; D. Leysen et al., WO 2005/082236; и F. Cohen et al., WO 2006/069063.

Соединения формулы **4** могут быть также получены путем циклизации соединений формулы **14** с гидроксиламином, как показано в методе по схеме 10.

Схема 10

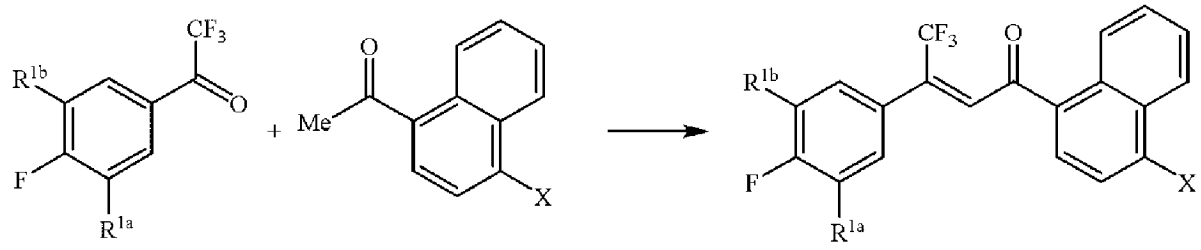


14 X= **Br или I** **4**

Этот метод является аналогичным методу, описанному на схеме 8. Аналогичная обработка соединений формулы **14** гидроксиламином дает изоксазолины формулы **4**.

Соединения формулы **14** могут быть получены реакцией конденсации соединений формулы **12** и нафталинкетонов формулы **15,** как это показано в методе по схеме 11.

Схема 11



12 15 X = Br или I 14

Этот метод является аналогичным методу, описанному на схеме 9. Аналогичная обработка соединений формулы **12** и нафталинкетонов формулы **15** основанием дает соединения формулы **14**. Соединения формул **12** и **15** производятся промышленностью or are known in the artили являются хорошо известными соединениями; смотрите, например, публикации D. Leysen et al., WO 2005/082236; и F. Cohen et al., WO 2006/069063.

Следует иметь в виду, что некоторые описанные выше реагенты и условия реакции для получения соединений формулы **1** могут быть несовместимыми с конкретными функциональными группами, присутствующими в промежуточных соединениях. В этих случаях, при получении требуемых продуктов эта проблема может быть решена путем использования в синтетических последовательностях реакций установления защитной группы/удаления защитной группы или взаимопревращений функциональной группы. Для специалиста в области химического синтеза является хорошо известным использование и выбор защитных групп (смотрите, например, монографию Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. Protective Groups in Organic Synthesis, 2nd ed.; Wiley: New York, 1991). Для специалиста в данной области является очевидным, что в некоторых случаях, после введения реагентов, изображенных на индивидуальных схемах, может потребоваться проведение дополнительных стандартных стадий синтеза, которые подробно не описаны, с целью завершения синтеза соединения формулы 1. Для специалиста в данной области является очевидным, что может возникнуть необходимость в проведении комбинации стадий, проиллюстрированных на приведенных выше схемах, в порядке, который будет отличаться от того порядка, который предполагается конкретной реакционной последовательностью, представленной для получения соединений формулы 1.

Для специалиста в данной области является также очевидным, что описанные в изобретении соединения формулы **1** и промежуточные соединения могут быть подвергнуты различным электрофильным, нуклеофильным, радикальным, металлоорганическим реакциям, реакциям окисления и восстановления для добавления заместителей или модификации существующих заместителей.

Предполагается, что специалист в данной области, используя представленное выше описание, может без проведения дополнительного исследования использовать настоящее изобретение в его самом полном объеме. В силу этого, представленные далее примеры синтеза следует истолковывать только как иллюстрации, и никоим образом их не следует считать в качестве ограничений для изобретения. Стадии в приведенных далее примерах синтеза иллюстрируют методику для каждой стадии в общем процессе химического превращения, и исходный материал для каждой стадии может необязательно быть получен путем проведения конкретного препаративного синтеза, методика которого описана в других примерах или стадиях. Данные, выраженные в процентах, приводятся по массе, за исключением смесей хроматографических растворителей, или если указано иное. Данные для смесей хроматографических растворителей, выраженные в частях и процентах, приводятся по объему, если не указано иное. Спектры ^{1}H ЯМР регистрируются в ppm (частей на миллион) относительно тетраметилсилана; "с" обозначает синглет, "д" обозначает дублет, "т" обозначает триплет, "кв" обозначает квартет, "м" обозначает мультиплет, "дд" обозначает дублет дублетов, "де" обозначает дублет триплетов, "уш.с" обозначает уширенный синглет. DMF обозначает N, N-диметилформамид. Номера соединений обозначены в таблицах показателей A-G.

ПРИМЕР СИНТЕЗА 1

Получение N-[(1R)-2-амино-1-метил-2-эксоэтил]-4-[5-(3,5-дихлор-4-фторфенил)-4,5-дигидро-5-(трифторметил)-3-изоксазолил]-1-нафталинкарбоксамида (соединение 1)

Стадия A. Получение метил 4-[5-(3,5-дихлор-4-фторфенил)-4,5-дигидро-5-(трифторметил)-3-изоксазолил]-1-нафталин-карбоксилата

К перемешиваемому раствору метил 4-[(гидроксиимино)метил]-1-нафталинкарбоксилата (1,50 г, 6,55 ммоль) в N, N-диметилформамиде (4,0 мл) добавляли N-хлорсукцинимид (1,05 г, 7,86 ммоль). Эту смесь перемешивали в течение 1,5 часов при комнатной температуре, и затем добавляли раствор 1,3-дихлор-4-фтор-5-[1-(трифторметил)-этенил]бензола (2,04 г, 7,86 ммоль) и триэтиламина (1,38 мл, 9,83 ммоль) в N, N-диметилформамиде (10,0 мл). После перемешивания в течение еще 2 часов при комнатной температуре, реакционную смесь разбавляли водой и экстрагировали этилацетатом. Органический слой промывали солевым раствором, сушили (Na2SO4) и концентрировали при пониженном давлении. Остаток очищали хроматографией на силикагеле, используя в качестве элюента гексаны/этилацетат, с получением названного соединения в виде белого твердого вещества (1,30 г, 43% выход). 1H ЯМР (CDCl3): 8,87 (м, 1H), 8,78 (м, 1H), 8,08 (д, 1H), 7,67 (м, 2H), 7,63 (д, 2H), 7,52 (д, 1H), 4,27 (д, 1H), 4,02 (с, 3H), 3,89 (д, 1H).

Стадия B. Получение 4-[5-(3,5-дихлор-4-фторфенил)-4,5-дигидро-5-(трифторметил)-3-изоксазолил]-1-нафталинкарбоновой кислоты

К перемешиваемому раствору метил 4-[5-(3,5-дихлор-4-фтор-фенил)-4,5-дигидро-5-(трифторметил)-3-изоксазолил]-1-нафталин-карбоксилат (то есть продукта со стадии A) (1,20 г, 2,47 ммоль) в тетрагидрофуране (10 мл) добавляли раствор моногидрата

гидроксида лития (0,31 г, 7,41 ммоль) в воде (10 мл). Полученную смесь перемешивали в течение ночи при комнатной температуре. Реакционную смесь распределяли между водой и диэтиловым эфиром. Затем водный слой подкисляли 6 N водным раствором хлористоводородной кислоты до pH 2 и экстрагировали этилацетатом. Объединенные органические слои промывали солевым раствором, сушили и концентрировали с получением названного соединения в виде белого твердого вещества (1,10 г, 94% выход).

1H ЯМР (DMSO-d6): 13,52 (уш.с, 1H), 8,83 (м, 1H), 8,77 (м, 1H), 8,12 (д, 1H), 7,92 (д, 1H), 7,88 (д, 2H), 7,73 (м, 2H), 4,56 (с, 2H).

Стадия C. Получение N-[(1R)-2-амино-1-метил-2-эксоэтил]-4-[5-(3,5-дихлор-4-фторфенил)-4,5-дигидро-5-(трифторметил)-3-изоксазолил]-1-нафталинкарбоксамида

Смесь 4-[5-(3,5-дихлор-4-фторфенил)-4,5-дигидро-5-(трифтор-метил)-3-изоксазолил]-1-нафталинкарбоновой кислоты (то есть продукта со стадии B) (190 мг, 0,40 ммоль), (R)-2-аминопропанамида гидрохлорида (97 мг, 0,80 ммоль), триэтиламина (0,17 мл, 1,20 ммоль) и 1-[бис(диметиламино)метилен-1H-1,2,3-триазоло[4,5-b]пиридиния 3-оксида гексафторфосфата (HATU, 182 мг, 0,48 ммоль) в DMF (3 мл) перемешивали при комнатной температуре в течение ночи. Реакционную смесь затем распределяли между этилацетатом и водой, фазы разделяли, и водную фазу экстрагировали этилацетатом. Объединенные органические слои промывали солевым раствором, сушили и концентрировали. Полученный остаток очищали колоночной хроматографией на силикагеле, используя в качестве элюента гексаны/этилацетат, с получением названного продукта, соединения по настоящему изобретению, в виде белого твердого вещества (180 мг, 83% выход). 1H ЯМР (DMSO-d6): 8,77 (д, 1H), 8,72 (д, 1H), 8,30 (д, 1H), 7,88 (м, 3H), 7,63-7,72 (м, 3H), 7,46 (уш.с, 1H), 7,05 (уш.с, 1H), 4,54 (с, 2H), 4,50 (м, 1H), 1,36 (д, 3H).

ПРИМЕР СИНТЕЗА 2

Получение 4-[5-(3,5-дихлор-4-фторфенил)-4,5-дигидро-5-(трифторметил)-3-изоксазолил]-N-(2-пиридинилметил)-1-нафталин-карбоксамида (соединение 15)

Смесь 4-[5-(3,5-дихлор-4-фторфенил)-4,5-дигидро-5-(трифтор-метил)-3-изоксазолил]-1-нафталинкарбоновой кислоты (200 мг , 0,42 ммоль), 2-пиридилметанамина (92 мг, 0,84 ммоль), триэтиламина (0,18 мл, 1,26 ммоль) и 1-[бис(диметиламино)метилен-1H-1,2,3-триазоло[4,5-b]пиридиния 3-оксида гексафторфосфата (HATU, 240 мг, 0,64 ммоль) в DMF (3 мл) перемешивали при комнатной температуре в течение ночи. Реакционную смесь затем распределяли между этилацетатом и водой. Фазы разделяли, и водную фазу экстрагировали этилацетатом. Объединенные органические слои промывали солевым раствором, сушили и концентрировали. Полученный остаток очищали колоночной хроматографией на силикагеле, используя в качестве элюента гексаны/этилацетат, с получением названного продукта, соединения по настоящему изобретению, в виде белого твердого вещества (132 мг, 56% выход). 1H ЯМР (CDCl3): 8,80 (д, 1H), 8,50 (д, 1H), 8,36 (д, 1H), 7,71 (ддд, 1H), 7,58-7,66 (м, 5H), 7,49 (с, 1H), 7,48 (с, 1H), 7,36 (д, 1H), 7,22 (дд, 1H), 4,84 (д, 2H), 4,25 (д, 1H), 3,89 (д, 1H).

ПРИМЕР СИНТЕЗА 3

Получение 4-[5-(3,5-дихлор-4-фторфенил)-4,5-дигидро-5-(три-фторметил)-3-изоксазолил]-N-[(метоксиимино)метил]-1-нафталин-карбоксамида (соединение 33)

Стадия А. Получение 4-[5-(3,5-дихлор-4-фторфенил)-4,5-дигидро-5-(трифторметил)-3-изоксазолил]-1-нафталинкарбоксамида

К суспензии 4-[5-(3,5-дихлор-4-фторфенил)-4,5-дигидро-5-(трифторметил)-3-изоксазолил]-1-нафталинкарбоновой кислоты (500 мг, 1,06 ммоль) в дихлорметане (20 мл), добавляли оксалилхлорид (269 мг, 2,12 ммоль) и 1 каплю DMF. Смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 1 часа, затем концентрировали и отгоняли с толуолом при пониженном давлении. Остаток растворяли в THF (5 мл) и добавляли водный раствор гидроксида аммония (3 мл, 14,8 М). Реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 4 часов, и затем распределяли между этилацетатом и водой. Слои разделяли, и водный слой экстрагировали этилацетатом. Объединенные органические слои промывали солевым раствором, сушили и концентрировали с получением первичного амида в виде белого твердого вещества (490 мг). Неочищенный амид непосредственно использовали на следующей стадии без дополнительной очистки.

Стадия В. Получение 4-[5-(3,5-дихлор-4-фторфенил)-4,5-дигидро-5-(трифторметил)-3-изоксазолил]-N-[(метоксиимино)метил]-1-нафталинкарбоксамида

Смесь 4-[5-(3,5-дихлор-4-фторфенил)-4,5-дигидро-5-(трифтор-метил)-3-изоксазолил]-1-нафталинкарбоксамида (490 мг), метоксиамина гидрохлорида (266 мг, 3,18 ммоль) и триэтилортоформиата (2 мл, 12 ммоль) в толуоле (20 мл) перемешивали при 70°С в течение 24 часов. Реакционную смесь охлаждали и распределяли между этилацетатом и водой. Слои разделяли, и водный слой экстрагировали этилацетатом. Объединенные органические слои промывали солевым раствором, сушили, концентрировали, и остаток очищали колоночной хроматографией на силикагеле, используя в качестве элюента гексаны/этилацетат, с получением названного продукта, соединения по настоящему изобретению, в виде белого твердого вещества (402 мг, 72% выход за две стадии). 1Н ЯМР (CDCl3): 8,83 (д, 1Н), 8,66 (д, 1Н), 8,34 (д, 1Н), 7,89 (д, 1Н), 7,69 (м, 3Н), 7,64 (д, 2Н), 7,54 (д, 1Н), 4,27 (д, 1Н), 3,90 (д, 1Н), 3,89 (с, 3Н).

ПРИМЕР СИНТЕЗА 4

Получение 4-[5-(3,5-дихлор-4-фторфенил)-4,5-дигидро-5-(три-фторметил)-3-изоксазолил]-N-(2-пиридинилметил)-N-[(4R)-2-этил-3-оксо-4-изоазолидинил]-1-нафталинкарбоксамида (соединение 34)

К суспензии 4-[5-(3,5-дихлор-4-фторфенил)-4,5-дигидро-5-(трифторметил)-3-изоксазолил]-1-нафталинкарбоновой кислоты (200 мг, 0,42 ммоль) в дихлорметане (10 мл) добавляли оксалилхлорид (107 мг, 0,84 ммоль) и 1 каплю DMF. Смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 1 часа, затем концентрировали и отгоняли с толуолом при пониженном давлении. Остаток растворяли в 2 мл дихлорметана и медленно добавляли к суспензии (4R)-4-амино-2-этилизоксазолидин-3-она гидрохлорида (210 мг, 1,26 ммоль) и триэтиламина (170 мг, 1,68 ммоль) в дихлорметане (5 мл) при комнатной температуре. Реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение

ночи, затем концентрировали, и остаток очищали колоночной хроматографией на силикагеле, используя в качестве элюента гексаны/этилацетат, с получением названного соединения в виде белого твердого вещества (196 мг, 79% выход). 1H ЯМР (CDCl3): 8,81 (д, 1H), 8,30 (д, 1H), 7,60-7,67 (м, 5H), 7,45 (д, 1H), 6,85 (уш.с, 1H), 5,00 (м, 2H), 4,26 (д, 1H), 4,13 (дд, 1H), 3,89 (д, 1H), 3,65 (м, 2H), 1,26 (т, 3H).

ПРИМЕР СИНТЕЗА 5

Получение метилового эфира N-[[4-[5-(3,5-дихлор-4-фторфенил)-4,5-дигидро-5-(трифторметил)-3-изоксазолил]-1-нафталинил]карбонил]глицина (соединение 35)

Стадия А. Получение 3-(4-бром-1-нафталинил)-5-(3,5-дихлор-4-фторфенил)-4,5-дигидро-5-(трифторметил)изоксазола

К перемешиваемому раствору 4-бром-1-нафталинкарбоксилата оксима (1,00 г, 4,0 ммоль) в N, N-диметилформамиде (12,0 мл) добавляли N-хлорсукцинимид (0,64 г, 4,8 ммоль). Реакционную смесь перемешивали в течение 1 часа при комнатной температуре, и затем добавляли раствор 1,3-дихлор-4-фтор-5-[1-(трифторметил)этенил]-бензола (1,24 г, 4,8 ммоль) и триэтиламина (1,68 мл, 12,0 ммоль) в N, N-диметилформамиде (12,0 мл). После перемешивания в течение еще 2 часов при комнатной температуре, реакционную смесь разбавляли водой и экстрагировали этилацетатом. Органический слой промывали солевым раствором, сушили (Na2SO4) и концентрировали при пониженном давлении. Остаток очищали колоночной хроматографией на силикагеле, используя в качестве элюента гексаны/этилацетат, с получением названного соединения в виде белого твердого вещества (1,60 г, 76% выход). 1H ЯМР (CDCl3): 8,88 (м, 1H), 8,35 (м, 1H), 7,82 (д, 1H), 7,69 (м, 2H), 7,64 (д, 2H), 7,36 (д, 1H), 4,27 (д, 1H), 3,88 (д, 1H).

Стадия В. Получение метилового эфира N-[[4-[5-(3,5-дихлор-4-фторфенил)-4,5-дигидро-5-(трифторметил)-3-изоксазолил]-1-нафталинил]карбонил]-глицина

Смесь 3-(4-бром-1-нафталинил)-5-(3,5-дихлор-4-фторфенил)-4,5-дигидро-5-(трифторметил)изоксазола (1000 мг, 1,97 ммоль), [1,1'-бис(дифенилфосфино)-ферроцен]дихлорпалладия(II) (PdCl2(dppf)) (146 мг, 0,20 ммоль), гидрохлорида метилового эфира глицина (371 мг, 2,96 ммоль) и триэтиламина (2,76 мл, 19,7 ммоль) в толуоле (20 мл) продували монооксидом углерода в течение 15 минут. Реакционную смесь перемешивали при 70°C в атмосфере монооксида углерода в течение ночи. Смесь охлаждали до комнатной температуры, фильтровали через невысокий слой целита®, порошка для фильтрования из диатомита, и споласкивали небольшим количеством этилацетата. Фильтрат концентрировали, и остаток очищали колоночной хроматографией на силикагеле, используя в качестве элюента гексаны/этилацетат, с получением названного продукта, соединения по настоящему изобретению, в виде белого твердого вещества (600 мг, 56% выход). 1H ЯМР (DMSO-d6): 9,13 (т, 1H), 8,78 (д, 1H), 8,32 (д, 1H), 7,90 (м, 3H), 7,70 (м, 3H), 4,53 (с, 2H), 4,11 (д, 2H), 4,74 (с, 3H).

Приведенный выше пример синтеза 1 является примером получения соединения формулы 1, где J представляет собой J-1.

Приведенный выше пример синтеза 2 является примером получения соединения формулы 1, где J представляет собой J-2.

Приведенный выше пример синтеза 3 является примером получения соединения формулы 1, где J представляет собой J-3.

Приведенный выше пример синтеза 4 является примером получения соединения формулы 1, где J представляет собой J-4.

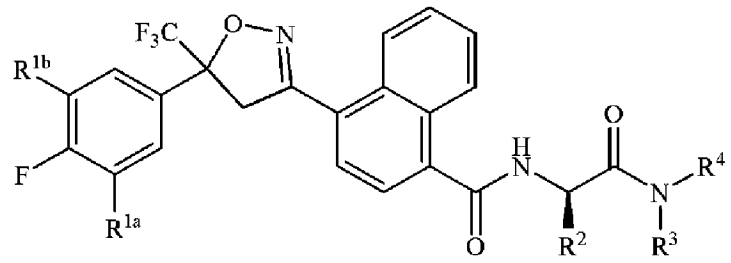
Приведенный выше пример синтеза 5 является примером получения соединения формулы 1, где J представляет собой J-5.

Соединения формулы **1,** где J представляет собой J-6, могут быть получены с помощью методик, аналогичных методикам, описанным выше в примерах синтеза 1, 2, 4 и 5.

Соединения формулы **1,** где J представляет собой (i) C2-C4 алкил, замещенный с помощью одной цианогруппы, (ii) -CH2(циклопропил), замещенный с помощью одной цианогруппы, или (iii) циклопропил, незамещенный или замещенный с помощью одной цианогруппы или одной группы C(O)NHR17, могут быть получены с помощью методик, аналогичных методикам, описанным выше в примерах синтеза 1, 2, 4 и 5.

С помощью описанных в изобретении методик вместе с хорошо известными методами могут быть получены соединения, приведенные далее в таблицах 1-1-7-2. В приведенных далее таблицах используются условные сокращенные обозначения, которые обозначают следующее: Me обозначает метил, Et обозначает этил, i-Pr обозначает изопропил, i-Bu обозначает изобутил, и OMe обозначает метокси.

ТАБЛИЦА 1-1



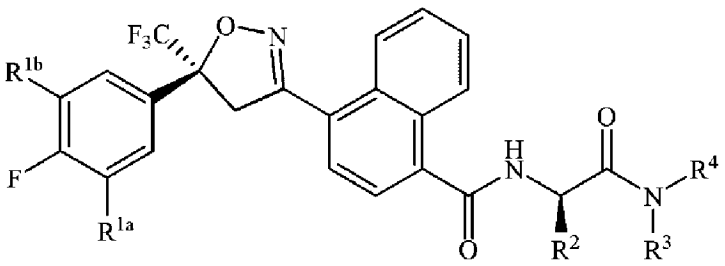
R1a	R1b	R2	R3	R4	R1a	R1b	R2	R3	R4
Cl	Cl	Me	H	H	CF3	H	Me	H	H
Cl	Cl	Cl	H	Me	CF3	H	Me	H	Me
Cl	Cl	Me	H	Et	CF3	H	Me	H	Et
Cl	Cl	Me	H	i-Pr	CF3	H	Me	H	i-Pr
Cl	Cl	Me	H	CH2CF3	CF3	H	Me	H	CH2CF3
Cl	Cl	Me	Me	H	CF3	H	Me	Me	H
Cl	Cl	Me	Me	Me	CF3	H	Me	Me	Me
Cl	Cl	Me	Me	Et	CF3	H	Me	Me	Et
Cl	Cl	Me	Me	i-Pr	CF3	H	Me	Me	i-Pr

Cl	Cl	Me	Me	CH2CF3		CF3	H	Me	Me	CH2CF3
Cl	Cl	Et	H	H		CF3	H	Et	H	H
Cl	Cl	Et	H	Me		CF3	H	Et	H	Me
Cl	Cl	Et	H	Et		CF3	H	Et	H	Et
Cl	Cl	Et	H	i-Pr		CF3	H	Et	H	i-Pr
Cl	Cl	Et	H	CH2CF3		CF3	H	Et	H	CH2CF3
Cl	Cl	Et	Me	H		CF3	H	Et	Me	H
Cl	Cl	Et	Me	Me		CF3	H	Et	Me	Me
Cl	Cl	Et	Me	Et		CF3	H	Et	Me	Et
Cl	Cl	Et	Me	i-Pr		CF3	H	Et	Me	i-Pr
Cl	Cl	Et	Me	CH2CF3		CF3	H	Et	Me	CH2CF3
Cl	Cl	i-Pr	H	H		CF3	H	i-Pr	H	H
Cl	Cl	i-Pr	H	Me		CF3	H	i-Pr	H	Me
Cl	Cl	i-Pr	H	Et		CF3	H	i-Pr	H	Et
Cl	Cl	i-Pr	H	i-Pr		CF3	H	i-Pr	H	i-Pr
Cl	Cl	i-Pr	H	CH2CF3		CF3	H	i-Pr	H	CH2CF3
Cl	Cl	i-Pr	Me	H		CF3	H	i-Pr	Me	H
Cl	Cl	i-Pr	Me	Me		CF3	H	i-Pr	Me	Me
Cl	Cl	i-Pr	Me	Et		CF3	H	i-Pr	Me	Et
Cl	Cl	i-Pr	Me	i-Pr		CF3	H	i-Pr	Me	i-Pr
Cl	Cl	i-Pr	Me	CH2CF3		CF3	H	i-Pr	Me	CH2CF3
Cl	Cl	i-Bu	H	H		CF3	H	i-Bu	H	H
Cl	Cl	i-Bu	H	Me		CF3	H	i-Bu	H	Me
Cl	Cl	i-Bu	H	Et		CF3	H	i-Bu	H	Et
Cl	Cl	i-Bu	H	i-Pr		CF3	H	i-Bu	H	i-Pr
Cl	Cl	i-Bu	H	CH2CF3		CF3	H	i-Bu	H	CH2CF3
Cl	Cl	i-Bu	Me	H		CF3	H	i-Bu	Me	H
Cl	Cl	i-Bu	Me	Me		CF3	H	i-Bu	Me	Me
Cl	Cl	i-Bu	Me	Et		CF3	H	i-Bu	Me	Et
Cl	Cl	i-Bu	Me	i-Pr		CF3	H	i-Bu	Me	i-Pr
Cl	Cl	i-Bu	Me	CH2CF3		CF3	H	i-Bu	Me	CH2CF3
Cl	Cl	CH2OH	H	H		CF3	H	CH2OH	H	H
Cl	Cl	CH2OH	H	Me		CF3	H	CH2OH	H	Me
Cl	Cl	CH2OH	H	Et		CF3	H	CH2OH	H	Et

Cl	Cl	CH2OH	H	i-Pr		CF3	H	CH2OH	H	i-Pr
Cl	Cl	CH2OH	H	CH2CF3		CF3	H	CH2OH	H	CH2CF3
Cl	Cl	CH2OH	Me	H		CF3	H	CH2OH	Me	H
Cl	Cl	CH2OH	Me	Me		CF3	H	CH2OH	Me	Me
Cl	Cl	CH2OH	Me	Et		CF3	H	CH2OH	Me	Et
Cl	Cl	CH2OH	Me	i-Pr		CF3	H	CH2OH	Me	i-Pr
Cl	Cl	CH2OH	Me	CH2CF3		CF3	H	CH2OH	Me	CH2CF3
Cl	Cl	CH2OMe	H	H		CF3	H	CH2OMe	H	H
Cl	Cl	CH2OMe	H	Me		CF3	H	CH2OMe	H	Me
Cl	Cl	CH2OMe	H	Et		CF3	H	CH2OMe	H	Et
Cl	Cl	CH2OMe	H	i-Pr		CF3	H	CH2OMe	H	i-Pr
Cl	Cl	CH2OMe	H	CH2CF3		CF3	H	CH2OMe	H	CH2CF3
Cl	Cl	CH2OMe	Me	H		CF3	H	CH2OMe	Me	H
Cl	Cl	CH2OMe	Me	Me		CF3	H	CH2OMe	Me	Me
Cl	Cl	CH2OMe	Me	Et		CF3	H	CH2OMe	Me	Et
Cl	Cl	CH2OMe	Me	i-Pr		CF3	H	CH2OMe	Me	i-Pr
Cl	Cl	CH2OMe	Me	CH2CF3		CF3	H	CH2OMe	Me	CH2CF3
CF3	Cl	Me	H	H		CF3	Cl	i-Bu	H	H
CF3	Cl	Me	H	Me		CF3	Cl	i-Bu	H	Me
CF3	Cl	Me	H	Et		CF3	Cl	i-Bu	H	Et
CF3	Cl	Me	H	i-Pr		CF3	Cl	i-Bu	H	i-Pr
CF3	Cl	Me	H	CH2CF3		CF3	Cl	i-Bu	H	CH2CF3
CF3	Cl	Me	Me	H		CF3	Cl	i-Bu	Me	H
CF3	Cl	Me	Me	Me		CF3	Cl	i-Bu	Me	Me

CF3	Cl	Me	Me	Et		CF3	Cl	i-Bu	Me	Et
CF3	Cl	Me	Me	i-Pr		CF3	Cl	i-Bu	Me	i-Pr
CF3	Cl	Me	Me	CH2CF3		CF3	Cl	i-Bu	Me	CH2CF3
CF3	Cl	Et	H	H		CF3	Cl	CH2OH	H	H
CF3	Cl	Et	H	Me		CF3	Cl	CH2OH	H	Me
CF3	Cl	Et	H	Et		CF3	Cl	CH2OH	H	Et
CF3	Cl	Et	H	i-Pr		CF3	Cl	CH2OH	H	i-Pr
CF3	Cl	Et	H	CH2CF3		CF3	Cl	CH2OH	H	CH2CF3
CF3	Cl	Et	Me	H		CF3	Cl	CH2OH	Me	H
CF3	Cl	Et	Me	Me		CF3	Cl	CH2OH	Me	Me
CF3	Cl	Et	Me	Et		CF3	Cl	CH2OH	Me	Et
CF3	Cl	Et	Me	i-Pr		CF3	Cl	CH2OH	Me	i-Pr
CF3	Cl	Et	Me	CH2CF3		CF3	Cl	CH2OH	Me	CH2CF3
CF3	Cl	i-Pr	H	H		CF3	Cl	CH2OMe	H	H
CF3	Cl	i-Pr	H	Me		CF3	Cl	CH2OMe	H	Me
CF3	Cl	i-Pr	H	Et		CF3	Cl	CH2OMe	H	Et
CF3	Cl	i-Pr	H	i-Pr		CF3	Cl	CH2OMe	H	i-Pr
CF3	Cl	i-Pr	H	CH2CF3		CF3	Cl	CH2OMe	H	CH2CF3
CF3	Cl	i-Pr	Me	H		CF3	Cl	CH2OMe	Me	H
CF3	Cl	i-Pr	Me	Me		CF3	Cl	CH2OMe	Me	Me
CF3	Cl	i-Pr	Me	Et		CF3	Cl	CH2OMe	Me	Et
CF3	Cl	i-Pr	Me	i-Pr		CF3	Cl	CH2OMe	Me	i-Pr
CF3	Cl	i-Pr	Me	CH2CF3		CF3	Cl	CH2OMe	Me	CH2CF3

ТАБЛИЦА 1-2



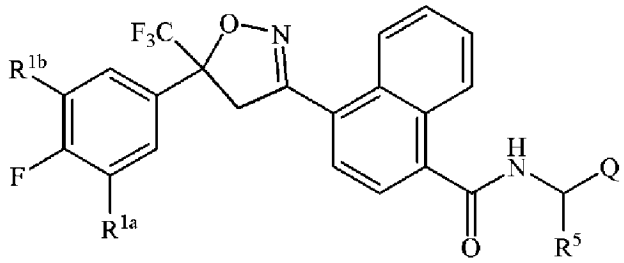
R1a	R1b	R2	R3	R4		R1a	R1b	R2	R3	R4
Cl	Cl	Me	H	H		CF3	H	Me	H	H
Cl	Cl	Cl	H	Me		CF3	H	Me	H	Me
Cl	Cl	Me	H	Et		CF3	H	Me	H	Et
Cl	Cl	Me	H	i-Pr		CF3	H	Me	H	i-Pr
Cl	Cl	Me	H	CH2CF3		CF3	H	Me	H	CH2CF3
Cl	Cl	Me	Me	H		CF3	H	Me	Me	H
Cl	Cl	Me	Me	Me		CF3	H	Me	Me	Me
Cl	Cl	Me	Me	Et		CF3	H	Me	Me	Et
Cl	Cl	Me	Me	i-Pr		CF3	H	Me	Me	i-Pr
Cl	Cl	Me	Me	CH2CF3		CF3	H	Me	Me	CH2CF3
Cl	Cl	Et	H	H		CF3	H	Et	H	H
Cl	Cl	Et	H	Me		CF3	H	Et	H	Me
Cl	Cl	Et	H	Et		CF3	H	Et	H	Et
Cl	Cl	Et	H	i-Pr		CF3	H	Et	H	i-Pr
Cl	Cl	Et	H	CH2CF3		CF3	H	Et	H	CH2CF3
Cl	Cl	Et	Me	H		CF3	H	Et	Me	H
Cl	Cl	Et	Me	Me		CF3	H	Et	Me	Me
Cl	Cl	Et	Me	Et		CF3	H	Et	Me	Et
Cl	Cl	Et	Me	i-Pr		CF3	H	Et	Me	i-Pr
Cl	Cl	Et	Me	CH2CF3		CF3	H	Et	Me	CH2CF3
Cl	Cl	i-Pr	H	H		CF3	H	i-Pr	H	H
Cl	Cl	i-Pr	H	Me		CF3	H	i-Pr	H	Me
Cl	Cl	i-Pr	H	Et		CF3	H	i-Pr	H	Et
Cl	Cl	i-Pr	H	i-Pr		CF3	H	i-Pr	H	i-Pr
Cl	Cl	i-Pr	H	CH2CF3		CF3	H	i-Pr	H	CH2CF3
Cl	Cl	i-Pr	Me	H		CF3	H	i-Pr	Me	H
Cl	Cl	i-Pr	Me	Me		CF3	H	i-Pr	Me	Me
Cl	Cl	i-Pr	Me	Et		CF3	H	i-Pr	Me	Et

Cl	Cl	i-Pr	Me	i-Pr		CF3	H	i-Pr	Me	i-Pr
Cl	Cl	i-Pr	Me	CH2CF3		CF3	H	i-Pr	Me	CH2CF3
Cl	Cl	i-Bu	H	H		CF3	H	i-Bu	H	H
Cl	Cl	i-Bu	H	Me		CF3	H	i-Bu	H	Me
Cl	Cl	i-Bu	H	Et		CF3	H	i-Bu	H	Et
Cl	Cl	i-Bu	H	i-Pr		CF3	H	i-Bu	H	i-Pr
Cl	Cl	i-Bu	H	CH2CF3		CF3	H	i-Bu	H	CH2CF3
Cl	Cl	i-Bu	Me	H		CF3	H	i-Bu	Me	H
Cl	Cl	i-Bu	Me	Me		CF3	H	i-Bu	Me	Me
Cl	Cl	i-Bu	Me	Et		CF3	H	i-Bu	Me	Et
Cl	Cl	i-Bu	Me	i-Pr		CF3	H	i-Bu	Me	i-Pr
Cl	Cl	i-Bu	Me	CH2CF3		CF3	H	i-Bu	Me	CH2CF3
Cl	Cl	CH2OH	H	H		CF3	H	CH2OH	H	H
Cl	Cl	CH2OH	H	Me		CF3	H	CH2OH	H	Me
Cl	Cl	CH2OH	H	Et		CF3	H	CH2OH	H	Et
Cl	Cl	CH2OH	H	i-Pr		CF3	H	CH2OH	H	i-Pr
Cl	Cl	CH2OH	H	CH2CF3		CF3	H	CH2OH	H	CH2CF3
Cl	Cl	CH2OH	Me	H		CF3	H	CH2OH	Me	H
Cl	Cl	CH2OH	Me	Me		CF3	H	CH2OH	Me	Me
Cl	Cl	CH2OH	Me	Et		CF3	H	CH2OH	Me	Et
Cl	Cl	CH2OH	Me	i-Pr		CF3	H	CH2OH	Me	i-Pr
Cl	Cl	CH2OH	Me	CH2CF3		CF3	H	CH2OH	Me	CH2CF3
Cl	Cl	CH2OMe	H	H		CF3	H	CH2OMe	H	H
Cl	Cl	CH2OMe	H	Me		CF3	H	CH2OMe	H	Me
Cl	Cl	CH2OMe	H	Et		CF3	H	CH2OMe	H	Et
Cl	Cl	CH2OMe	H	i-Pr		CF3	H	CH2OMe	H	i-Pr
Cl	Cl	CH2OMe	H	CH2CF3		CF3	H	CH2OMe	H	CH2CF3
Cl	Cl	CH2OMe	Me	H		CF3	H	CH2OMe	Me	H

Cl	Cl	CH2OMe	Me	Me		CF3	H	CH2OMe	Me	Me
Cl	Cl	CH2OMe	Me	Et		CF3	H	CH2OMe	Me	Et
Cl	Cl	CH2OMe	Me	i-Pr		CF3	H	CH2OMe	Me	i-Pr
Cl	Cl	CH2OMe	Me	CH2CF3		CF3	H	CH2OMe	Me	CH2CF3
CF3	Cl	Me	H	H		CF3	Cl	i-Bu	H	H
CF3	Cl	Me	H	Me		CF3	Cl	i-Bu	H	Me
CF3	Cl	Me	H	Et		CF3	Cl	i-Bu	H	Et
CF3	Cl	Me	H	i-Pr		CF3	Cl	i-Bu	H	i-Pr
CF3	Cl	Me	H	CH2CF3		CF3	Cl	i-Bu	H	CH2CF3
CF3	Cl	Me	Me	H		CF3	Cl	i-Bu	Me	H
CF3	Cl	Me	Me	Me		CF3	Cl	i-Bu	Me	Me
CF3	Cl	Me	Me	Et		CF3	Cl	i-Bu	Me	Et
CF3	Cl	Me	Me	i-Pr		CF3	Cl	i-Bu	Me	i-Pr
CF3	Cl	Me	Me	CH2CF3		CF3	Cl	i-Bu	Me	CH2CF3
CF3	Cl	Et	H	H		CF3	Cl	CH2OH	H	H
CF3	Cl	Et	H	Me		CF3	Cl	CH2OH	H	Me
CF3	Cl	Et	H	Et		CF3	Cl	CH2OH	H	Et
CF3	Cl	Et	H	i-Pr		CF3	Cl	CH2OH	H	i-Pr
CF3	Cl	Et	H	CH2CF3		CF3	Cl	CH2OH	H	CH2CF3
CF3	Cl	Et	Me	H		CF3	Cl	CH2OH	Me	H
CF3	Cl	Et	Me	Me		CF3	Cl	CH2OH	Me	Me
CF3	Cl	Et	Me	Et		CF3	Cl	CH2OH	Me	Et
CF3	Cl	Et	Me	i-Pr		CF3	Cl	CH2OH	Me	i-Pr
CF3	Cl	Et	Me	CH2CF3		CF3	Cl	CH2OH	Me	CH2CF3
CF3	Cl	i-Pr	H	H		CF3	Cl	CH2OMe	H	H
CF3	Cl	i-Pr	H	Me		CF3	Cl	CH2OMe	H	Me
CF3	Cl	i-Pr	H	Et		CF3	Cl	CH2OMe	H	Et

CF3	Cl	i-Pr	H	i-Pr		CF3	Cl	CH2OMe	H	i-Pr
CF3	Cl	i-Pr	H	CH2CF3		CF3	Cl	CH2OMe	H	CH2CF3
CF3	Cl	i-Pr	Me	H		CF3	Cl	CH2OMe	Me	H
CF3	Cl	i-Pr	Me	Me		CF3	Cl	CH2OMe	Me	Me
CF3	Cl	i-Pr	Me	Et		CF3	Cl	CH2OMe	Me	Et
CF3	Cl	i-Pr	Me	i-Pr		CF3	Cl	CH2OMe	Me	i-Pr
CF3	Cl	i-Pr	Me	CH2CF3		CF3	Cl	CH2OMe	Me	CH2CF3

ТАБЛИЦА 2-1



R1a представляет собой Cl, R1b представляет собой Cl, R5 представляет собой H

Q	Q	Q	Q
2-пиридинил	3-пиридинил	4-пиридинил	2-пиримидинил
4-пиримидинил	5-пиримидинил	2-пиразинил	3-пиразинил
3-пиридазинил	4-пиридазинил	3-(1,2,4-триазинил)	5-(1,2,4-триазинил)
6-(1,2,4-триазинил)	2-(1,3,5-триазинил)	2-фуранил	3-фуранил
2-тиенил	3-тиенил	2-пирролил	3-пирролил
1-Me-2-пирролил	1-Me-3-пирролил	3-пиразолил	4-пиразолил
5-пиразолил	1-Me-3-пиразолил	1-Me-4-пиразолил	1-Me-5-пиразолил
2-имидазолил	4-имидазолил	1-Me-2-имидазолил	1-Me-4-имидазолил
1-Me-5-имидазолил	1,2,3-триазолил	1-Me-4-(1,2,3-триазолил)	1-Me-5-(1,2,3-триазолил)
1,2,4-триазолил	1-Me-3-(1,2,4-триазолил)	1-Me-5-(1,2,4-триазолил)	2-Me-3-(1,2,4-триазолил)

2-Me-5-(1,2,4-триазолил)	4-Me-3-(1,2,4-триазолил)	тетразолил	1-Me-5-(тетразолил)
2-Me-5-(тетразолил)	2-оксазолил	4-оксазолил	5-оксазолил
2-тиазолил	4-тиазолил	5-тиазолил	3-изоксазолил
4-изоксазолил	5-изоксазолил	3-изотиазолил	4-изотиазолил
5-изотиазолил	4-(1,2,3-оксадиазолил)	5-(1,2,3-оксадиазолил)	3-(1,2,4-оксадиазолил)
5-(1,2,4-оксадиазолил)	1,3,4-оксадиазолил	4-(1,2,3-тиадиазолил)	5-(1,2,3-тиадиазолил)
3-(1,2,4-тиадиазолил)	5-(1,2,4-тиадиазолил)	1,3,4-тиадиазолил	

R1a представляет собой CF3, R1b представляет собой H, R5 представляет собой H

Q	Q	Q	Q
2-пиридинил	3-пиридинил	4-пиридинил	2-пиримидинил
4-пиримидинил	5-пиримидинил	2-пиразинил	3-пиразинил
3-пиридазинил	4-пиридазинил	3-(1,2,4-триазинил)	5-(1,2,4-триазинил)
6-(1,2,4-триазинил)	2-(1,3,5-триазинил)	2-фуранил	3-фуранил
2-тиенил	3-тиенил	2-пирролил	3-пирролил
1-Me-2-пирролил	1-Me-3-пирролил	3-пиразолил	4-пиразолил
5-пиразолил	1-Me-3-пиразолил	1-Me-4-пиразолил	1-Me-5-пиразолил
2-имидазолил	4-имидазолил	1-Me-2-имидазолил	1-Me-4-имидазолил
1-Me-5-имидазолил	1,2,3-триазолил	1-Me-4-(1,2,3-триазолил)	1-Me-5-(1,2,3-триазолил)
1,2,4-триазолил	1-Me-3-(1,2,4-триазолил)	1-Me-5-(1,2,4-триазолил)	2-Me-3-(1,2,4-триазолил)
2-Me-5-(1,2,4-триазолил)	4-Me-3-(1,2,4-триазолил)	тетразолил	1-Me-5-(тетразолил)
2-Me-5-(тетразолил)	2-оксазолил	4-оксазолил	5-оксазолил
2-тиазолил	4-тиазолил	5-тиазолил	3-изоксазолил
4-изоксазолил	5-изоксазолил	3-изотиазолил	4-изотиазолил
5-изотиазолил	4-(1,2,3-оксадиазолил)	5-(1,2,3-оксадиазолил)	3-(1,2,4-оксадиазолил)
5-(1,2,4-оксадиазолил)	1,3,4-оксадиазолил	4-(1,2,3-тиадиазолил)	5-(1,2,3-тиадиазолил)

3-(1,2,4-тиадиазолил)	5-(1,2,4-тиадиазолил)	1,3,4-тиадиазолил	

R1a представляет собой CF3, R1b представляет собой Cl, R5 представляет собой H

Q	Q	Q	Q
2-пиридинил	3-пиридинил	4-пиридинил	2-пиримидинил
4-пиримидинил	5-пиримидинил	2-пиразинил	3-пиразинил
3-пиридазинил	4-пиридазинил	3-(1,2,4-триазинил)	5-(1,2,4-триазинил)
6-(1,2,4-триазинил)	2-(1,3,5-триазинил)	2-фуранил	3-фуранил
2-тиенил	3-тиенил	2-пирролил	3-пирролил
1-Me-2-пирролил	1-Me-3-пирролил	3-пиразолил	4-пиразолил
5-пиразолил	1-Me-3-пиразолил	1-Me-4-пиразолил	1-Me-5-пиразолил
2-имидазолил	4-имидазолил	1-Me-2-имидазолил	1-Me-4-имидазолил
1-Me-5-имидазолил	1,2,3-триазолил	1-Me-4-(1,2,3-триазолил)	1-Me-5-(1,2,3-триазолил)
1,2,4-триазолил	1-Me-3-(1,2,4-триазолил)	1-Me-5-(1,2,4-триазолил)	2-Me-3-(1,2,4-триазолил)
2-Me-5-(1,2,4-триазолил)	4-Me-3-(1,2,4-триазолил)	тетразолил	1-Me-5-(тетразолил)
2-Me-5-(тетразолил)	2-оксазолил	4-оксазолил	5-оксазолил
2-тиазолил	4-тиазолил	5-тиазолил	3-изоксазолил
4-изоксазолил	5-изоксазолил	3-изотиазолил	4-изотиазолил
5-изотиазолил	4-(1,2,3-оксадиазолил)	5-(1,2,3-оксадиазолил)	3-(1,2,4-оксадиазолил)
5-(1,2,4-оксадиазолил)	1,3,4-оксадиазолил	4-(1,2,3-тиадиазолил)	5-(1,2,3-тиадиазолил)
3-(1,2,4-тиадиазолил)	5-(1,2,4-тиадиазолил)	1,3,4-тиадиазолил	

R1a представляет собой Cl, R1b представляет собой Cl, R5 представляет собой Me

Q	Q	Q	Q
2-пиридинил	3-пиридинил	4-пиридинил	2-пиримидинил
4-пиримидинил	5-пиримидинил	2-пиразинил	3-пиразинил
3-пиридазинил	4-пиридазинил	3-(1,2,4-триазинил)	5-(1,2,4-триазинил)
6-(1,2,4-триазинил)	2-(1,3,5-триазинил)	2-фуранил	3-фуранил
2-тиенил	3-тиенил	2-пирролил	3-пирролил

1-Me-2-пирролил	1-Me-3-пирролил	3-пиразолил	4-пиразолил
5-пиразолил	1-Me-3-пиразолил	1-Me-4-пиразолил	1-Me-5-пиразолил
2-имидазолил	4-имидазолил	1-Me-2-имидазолил	1-Me-4-имидазолил
1-Me-5-имидазолил	1,2,3-триазолил	1-Me-4-(1,2,3-триазолил)	1-Me-5-(1,2,3-триазолил)
1,2,4-триазолил	1-Me-3-(1,2,4-триазолил)	1-Me-5-(1,2,4-триазолил)	2-Me-3-(1,2,4-триазолил)
2-Me-5-(1,2,4-триазолил)	4-Me-3-(1,2,4-триазолил)	тетразолил	1-Me-5-(тетразолил)
2-Me-5-(тетразолил)	2-оксазолил	4-оксазолил	5-оксазолил
2-тиазолил	4-тиазолил	5-тиазолил	3-изоксазолил
4-изоксазолил	5-изоксазолил	3-изотиазолил	4-изотиазолил
5-изотиазолил	4-(1,2,3-оксадиазолил)	5-(1,2,3-оксадиазолил)	3-(1,2,4-оксадиазолил)
5-(1,2,4-оксадиазолил)	1,3,4-оксадиазолил	4-(1,2,3-тиадиазолил)	5-(1,2,3-тиадиазолил)
3-(1,2,4-тиадиазолил)	5-(1,2,4-тиадиазолил)	1,3,4-тиадиазолил	

R1a представляет собой CF3, R1b представляет собой H, R5 представляет собой Me

Q	Q	Q	Q
2-пиридинил	3-пиридинил	4-пиридинил	2-пиримидинил
4-пиримидинил	5-пиримидинил	2-пиразинил	3-пиразинил
3-пиридазинил	4-пиридазинил	3-(1,2,4-триазинил)	5-(1,2,4-триазинил)
6-(1,2,4-триазинил)	2-(1,3,5-триазинил)	2-фуранил	3-фуранил
2-тиенил	3-тиенил	2-пирролил	3-пирролил
1-Me-2-пирролил	1-Me-3-пирролил	3-пиразолил	4-пиразолил
5-пиразолил	1-Me-3-пиразолил	1-Me-4-пиразолил	1-Me-5-пиразолил
2-имидазолил	4-имидазолил	1-Me-2-имидазолил	1-Me-4-имидазолил
1-Me-5-имидазолил	1,2,3-триазолил	1-Me-4-(1,2,3-триазолил)	1-Me-5-(1,2,3-триазолил)
1,2,4-триазолил	1-Me-3-(1,2,4-триазолил)	1-Me-5-(1,2,4-триазолил)	2-Me-3-(1,2,4-триазолил)
2-Me-5-(1,2,4-триазолил)	4-Me-3-(1,2,4-триазолил)	тетразолил	1-Me-5-(тетразолил)

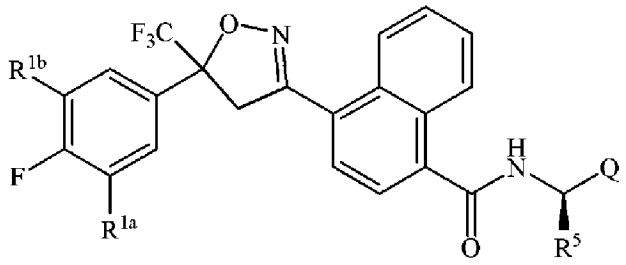
2-Me-5-(тетразолил)	2-оксазолил	4-оксазолил	5-оксазолил
2-тиазолил	4-тиазолил	5-тиазолил	3-изоксазолил
4-изоксазолил	5-изоксазолил	3-изотиазолил	4-изотиазолил
5-изотиазолил	4-(1,2,3-оксадиазолил)	5-(1,2,3-оксадиазолил)	3-(1,2,4-оксадиазолил)
5-(1,2,4-оксадиазолил)	1,3,4-оксадиазолил	4-(1,2,3-тиадиазолил)	5-(1,2,3-тиадиазолил)
3-(1,2,4-тиадиазолил)	5-(1,2,4-тиадиазолил)	1,3,4-тиадиазолил	

R1a представляет собой CF3, R1b представляет собой Cl, R5 представляет собой Me

Q	Q	Q	Q
2-пиридинил	3-пиридинил	4-пиридинил	2-пиримидинил
4-пиримидинил	5-пиримидинил	2-пиразинил	3-пиразинил
3-пиридазинил	4-пиридазинил	3-(1,2,4-триазинил)	5-(1,2,4-триазинил)
6-(1,2,4-триазинил)	2-(1,3,5-триазинил)	2-фуранил	3-фуранил
2-тиенил	3-тиенил	2-пирролил	3-пирролил
1-Me-2-пирролил	1-Me-3-пирролил	3-пиразолил	4-пиразолил
5-пиразолил	1-Me-3-пиразолил	1-Me-4-пиразолил	1-Me-5-пиразолил
2-имидазолил	4-имидазолил	1-Me-2-имидазолил	1-Me-4-имидазолил
1-Me-5-имидазолил	1,2,3-триазолил	1-Me-4-(1,2,3-триазолил)	1-Me-5-(1,2,3-триазолил)
1,2,4-триазолил	1-Me-3-(1,2,4-триазолил)	1-Me-5-(1,2,4-триазолил)	2-Me-3-(1,2,4-триазолил)
2-Me-5-(1,2,4-триазолил)	4-Me-3-(1,2,4-триазолил)	тетразолил	1-Me-5-(тетразолил)
2-Me-5-(тетразолил)	2-оксазолил	4-оксазолил	5-оксазолил
2-тиазолил	4-тиазолил	5-тиазолил	3-изоксазолил
4-изоксазолил	5-изоксазолил	3-изотиазолил	4-изотиазолил
5-изотиазолил	4-(1,2,3-оксадиазолил)	5-(1,2,3-оксадиазолил)	3-(1,2,4-оксадиазолил)
5-(1,2,4-оксадиазолил)	1,3,4-оксадиазолил	4-(1,2,3-тиадиазолил)	5-(1,2,3-тиадиазолил)
3-(1,2,4-	5-(1,2,4-	1,3,4-тиадиазолил	

тиадиазолил)	тиадиазолил)		

ТАБЛИЦА 2-2



R1a представляет собой Cl, R1b представляет собой Cl, R5 представляет собой Me

Q	Q	Q	Q
2-пиридинил	3-пиридинил	4-пиридинил	2-пиримидинил
4-пиримидинил	5-пиримидинил	2-пиразинил	3-пиразинил
3-пиридазинил	4-пиридазинил	3-(1,2,4-триазинил)	5-(1,2,4-триазинил)
6-(1,2,4-триазинил)	2-(1,3,5-триазинил)	2-фуранил	3-фуранил
2-тиенил	3-тиенил	2-пирролил	3-пирролил
1-Me-2-пирролил	1-Me-3-пирролил	3-пиразолил	4-пиразолил
5-пиразолил	1-Me-3-пиразолил	1-Me-4-пиразолил	1-Me-5-пиразолил
2-имидазолил	4-имидазолил	1-Me-2-имидазолил	1-Me-4-имидазолил
1-Me-5-имидазолил	1,2,3-триазолил	1-Me-4-(1,2,3-триазолил)	1-Me-5-(1,2,3-триазолил)
1,2,4-триазолил	1-Me-3-(1,2,4-триазолил)	1-Me-5-(1,2,4-триазолил)	2-Me-3-(1,2,4-триазолил)
2-Me-5-(1,2,4-триазолил)	4-Me-3-(1,2,4-триазолил)	тетразолил	1-Me-5-(тетразолил)
2-Me-5-(тетразолил)	2-оксазолил	4-оксазолил	5-оксазолил
2-тиазолил	4-тиазолил	5-тиазолил	3-изоксазолил
4-изоксазолил	5-изоксазолил	3-изотиазолил	4-изотиазолил
5-изотиазолил	4-(1,2,3-оксадиазолил)	5-(1,2,3-оксадиазолил)	3-(1,2,4-оксадиазолил)
5-(1,2,4-оксадиазолил)	1,3,4-оксадиазолил	4-(1,2,3-тиадиазолил)	5-(1,2,3-тиадиазолил)
3-(1,2,4-тиадиазолил)	5-(1,2,4-тиадиазолил)	1,3,4-тиадиазолил	

R1a представляет собой CF3, R1b представляет собой H, R5 представляет собой Me

Q	Q	Q	Q

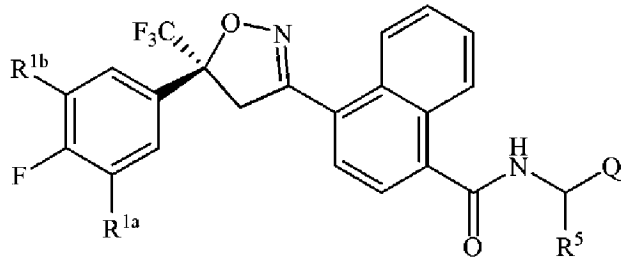
2-пиридинил	3-пиридинил	4-пиридинил	2-пиримидинил
4-пиримидинил	5-пиримидинил	2-пиразинил	3-пиразинил
3-пиридазинил	4-пиридазинил	3-(1,2,4-триазинил)	5-(1,2,4-триазинил)
6-(1,2,4-триазинил)	2-(1,3,5-триазинил)	2-фуранил	3-фуранил
2-тиенил	3-тиенил	2-пирролил	3-пирролил
1-Me-2-пирролил	1-Me-3-пирролил	3-пиразолил	4-пиразолил
5-пиразолил	1-Me-3-пиразолил	1-Me-4-пиразолил	1-Me-5-пиразолил
2-имидазолил	4-имидазолил	1-Me-2-имидазолил	1-Me-4-имидазолил
1-Me-5-имидазолил	1,2,3-триазолил	1-Me-4-(1,2,3-триазолил)	1-Me-5-(1,2,3-триазолил)
1,2,4-триазолил	1-Me-3-(1,2,4-триазолил)	1-Me-5-(1,2,4-триазолил)	2-Me-3-(1,2,4-триазолил)
2-Me-5-(1,2,4-триазолил)	4-Me-3-(1,2,4-триазолил)	тетразолил	1-Me-5-(тетразолил)
2-Me-5-(тетразолил)	2-оксазолил	4-оксазолил	5-оксазолил
2-тиазолил	4-тиазолил	5-тиазолил	3-изоксазолил
4-изоксазолил	5-изоксазолил	3-изотиазолил	4-изотиазолил
5-изотиазолил	4-(1,2,3-оксадиазолил)	5-(1,2,3-оксадиазолил)	3-(1,2,4-оксадиазолил)
5-(1,2,4-оксадиазолил)	1,3,4-оксадиазолил	4-(1,2,3-тиадиазолил)	5-(1,2,3-тиадиазолил)
3-(1,2,4-тиадиазолил)	5-(1,2,4-тиадиазолил)	1,3,4-тиадиазолил	

R1a представляет собой CF3, R1b представляет собой Cl, R5 представляет собой Me

Q	Q	Q	Q
2-пиридинил	3-пиридинил	4-пиридинил	2-пиримидинил
4-пиримидинил	5-пиримидинил	2-пиразинил	3-пиразинил
3-пиридазинил	4-пиридазинил	3-(1,2,4-триазинил)	5-(1,2,4-триазинил)
6-(1,2,4-триазинил)	2-(1,3,5-триазинил)	2-фуранил	3-фуранил
2-тиенил	3-тиенил	2-пирролил	3-пирролил
1-Me-2-пирролил	1-Me-3-пирролил	3-пиразолил	4-пиразолил
5-пиразолил	1-Me-3-пиразолил	1-Me-4-пиразолил	1-Me-5-пиразолил
2-имидазолил	4-имидазолил	1-Me-2-имидазолил	1-Me-4-имидазолил

1-Me-5-имидазолил	1,2,3-триазолил	1-Me-4-(1,2,3-триазолил)	1-Me-5-(1,2,3-триазолил)
1,2,4-триазолил	1-Me-3-(1,2,4-триазолил)	1-Me-5-(1,2,4-триазолил)	2-Me-3-(1,2,4-триазолил)
2-Me-5-(1,2,4-триазолил)	4-Me-3-(1,2,4-триазолил)	тетразолил	1-Me-5-(тетразолил)
2-Me-5-(тетразолил)	2-оксазолил	4-оксазолил	5-оксазолил
2-тиазолил	4-тиазолил	5-тиазолил	3-изоксазолил
4-изоксазолил	5-изоксазолил	3-изотиазолил	4-изотиазолил
5-изотиазолил	4-(1,2,3-оксадиазолил)	5-(1,2,3-оксадиазолил)	3-(1,2,4-оксадиазолил)
5-(1,2,4-оксадиазолил)	1,3,4-оксадиазолил	4-(1,2,3-тиадиазолил)	5-(1,2,3-тиадиазолил)
3-(1,2,4-тиадиазолил)	5-(1,2,4-тиадиазолил)	1,3,4-тиадиазолил	

ТАБЛИЦА 2-3



R1a представляет собой Cl, R1b представляет собой Cl, R5 представляет собой H

Q	Q	Q	Q
2-пиридинил	3-пиридинил	4-пиридинил	2-пиримидинил
4-пиримидинил	5-пиримидинил	2-пиразинил	3-пиразинил
3-пиридазинил	4-пиридазинил	3-(1,2,4-триазинил)	5-(1,2,4-триазинил)
6-(1,2,4-триазинил)	2-(1,3,5-триазинил)	2-фуранил	3-фуранил
2-тиенил	3-тиенил	2-пирролил	3-пирролил
1-Me-2-пирролил	1-Me-3-пирролил	3-пиразолил	4-пиразолил
5-пиразолил	1-Me-3-пиразолил	1-Me-4-пиразолил	1-Me-5-пиразолил
2-имидазолил	4-имидазолил	1-Me-2-имидазолил	1-Me-4-имидазолил
1-Me-5-имидазолил	1,2,3-триазолил	1-Me-4-(1,2,3-триазолил)	1-Me-5-(1,2,3-триазолил)
1,2,4-триазолил	1-Me-3-(1,2,4-	1-Me-5-(1,2,4-	2-Me-3-(1,2,4-

	триазолил)	триазолил)	триазолил)
2-Me-5-(1,2,4-триазолил)	4-Me-3-(1,2,4-триазолил)	тетразолил	1-Me-5-(тетразолил)
2-Me-5-(тетразолил)	2-оксазолил	4-оксазолил	5-оксазолил
2-тиазолил	4-тиазолил	5-тиазолил	3-изоксазолил
4-изоксазолил	5-изоксазолил	3-изотиазолил	4-изотиазолил
5-изотиазолил	4-(1,2,3-оксадиазолил)	5-(1,2,3-оксадиазолил)	3-(1,2,4-оксадиазолил)
5-(1,2,4-оксадиазолил)	1,3,4-оксадиазолил	4-(1,2,3-тиадиазолил)	5-(1,2,3-тиадиазолил)
3-(1,2,4-тиадиазолил)	5-(1,2,4-тиадиазолил)	1,3,4-тиадиазолил	

R1a представляет собой CF3, R1b представляет собой H, R5 представляет собой H

Q	Q	Q	Q
2-пиридинил	3-пиридинил	4-пиридинил	2-пиримидинил
4-пиримидинил	5-пиримидинил	2-пиразинил	3-пиразинил
3-пиридазинил	4-пиридазинил	3-(1,2,4-триазинил)	5-(1,2,4-триазинил)
6-(1,2,4-триазинил)	2-(1,3,5-триазинил)	2-фуранил	3-фуранил
2-тиенил	3-тиенил	2-пирролил	3-пирролил
1-Me-2-пирролил	1-Me-3-пирролил	3-пиразолил	4-пиразолил
5-пиразолил	1-Me-3-пиразолил	1-Me-4-пиразолил	1-Me-5-пиразолил
2-имидазолил	4-имидазолил	1-Me-2-имидазолил	1-Me-4-имидазолил
1-Me-5-имидазолил	1,2,3-триазолил	1-Me-4-(1,2,3-триазолил)	1-Me-5-(1,2,3-триазолил)
1,2,4-триазолил	1-Me-3-(1,2,4-триазолил)	1-Me-5-(1,2,4-триазолил)	2-Me-3-(1,2,4-триазолил)
2-Me-5-(1,2,4-триазолил)	4-Me-3-(1,2,4-триазолил)	тетразолил	1-Me-5-(тетразолил)
2-Me-5-(тетразолил)	2-оксазолил	4-оксазолил	5-оксазолил
2-тиазолил	4-тиазолил	5-тиазолил	3-изоксазолил
4-изоксазолил	5-изоксазолил	3-изотиазолил	4-изотиазолил
5-изотиазолил	4-(1,2,3-оксадиазолил)	5-(1,2,3-оксадиазолил)	3-(1,2,4-оксадиазолил)
5-(1,2,4-	1,3,4-оксадиазолил	4-(1,2,3-	5-(1,2,3-

оксадиазолил)		тиадиазолил)	тиадиазолил)
3-(1,2,4-тиадиазолил)	5-(1,2,4-тиадиазолил)	1,3,4-тиадиазолил	

R1a представляет собой CF3, R1b представляет собой Cl, R5 представляет собой H

Q	Q	Q	Q
2-пиридинил	3-пиридинил	4-пиридинил	2-пиримидинил
4-пиримидинил	5-пиримидинил	2-пиразинил	3-пиразинил
3-пиридазинил	4-пиридазинил	3-(1,2,4-триазинил)	5-(1,2,4-триазинил)
6-(1,2,4-триазинил)	2-(1,3,5-триазинил)	2-фуранил	3-фуранил
2-тиенил	3-тиенил	2-пирролил	3-пирролил
1-Me-2-пирролил	1-Me-3-пирролил	3-пиразолил	4-пиразолил
5-пиразолил	1-Me-3-пиразолил	1-Me-4-пиразолил	1-Me-5-пиразолил
2-имидазолил	4-имидазолил	1-Me-2-имидазолил	1-Me-4-имидазолил
1-Me-5-имидазолил	1,2,3-триазолил	1-Me-4-(1,2,3-триазолил)	1-Me-5-(1,2,3-триазолил)
1,2,4-триазолил	1-Me-3-(1,2,4-триазолил)	1-Me-5-(1,2,4-триазолил)	2-Me-3-(1,2,4-триазолил)
2-Me-5-(1,2,4-триазолил)	4-Me-3-(1,2,4-триазолил)	тетразолил	1-Me-5-(тетразолил)
2-Me-5-(тетразолил)	2-оксазолил	4-оксазолил	5-оксазолил
2-тиазолил	4-тиазолил	5-тиазолил	3-изоксазолил
4-изоксазолил	5-изоксазолил	3-изотиазолил	4-изотиазолил
5-изотиазолил	4-(1,2,3-оксадиазолил)	5-(1,2,3-оксадиазолил)	3-(1,2,4-оксадиазолил)
5-(1,2,4-оксадиазолил)	1,3,4-оксадиазолил	4-(1,2,3-тиадиазолил)	5-(1,2,3-тиадиазолил)
3-(1,2,4-тиадиазолил)	5-(1,2,4-тиадиазолил)	1,3,4-тиадиазолил	

R1a представляет собой Cl, R1b представляет собой Cl, R5 представляет собой Me

Q	Q	Q	Q
2-пиридинил	3-пиридинил	4-пиридинил	2-пиримидинил
4-пиримидинил	5-пиримидинил	2-пиразинил	3-пиразинил
3-пиридазинил	4-пиридазинил	3-(1,2,4-триазинил)	5-(1,2,4-триазинил)
6-(1,2,4-триазинил)	2-(1,3,5-триазинил)	2-фуранил	3-фуранил

2-тиенил	3-тиенил	2-пирролил	3-пирролил
1-Me-2-пирролил	1-Me-3-пирролил	3-пиразолил	4-пиразолил
5-пиразолил	1-Me-3-пиразолил	1-Me-4-пиразолил	1-Me-5-пиразолил
2-имидазолил	4-имидазолил	1-Me-2-имидазолил	1-Me-4-имидазолил
1-Me-5-имидазолил	1,2,3-триазолил	1-Me-4-(1,2,3-триазолил)	1-Me-5-(1,2,3-триазолил)
1,2,4-триазолил	1-Me-3-(1,2,4-триазолил)	1-Me-5-(1,2,4-триазолил)	2-Me-3-(1,2,4-триазолил)
2-Me-5-(1,2,4-триазолил)	4-Me-3-(1,2,4-триазолил)	тетразолил	1-Me-5-(тетразолил)
2-Me-5-(тетразолил)	2-оксазолил	4-оксазолил	5-оксазолил
2-тиазолил	4-тиазолил	5-тиазолил	3-изоксазолил
4-изоксазолил	5-изоксазолил	3-изотиазолил	4-изотиазолил
5-изотиазолил	4-(1,2,3-оксадиазолил)	5-(1,2,3-оксадиазолил)	3-(1,2,4-оксадиазолил)
5-(1,2,4-оксадиазолил)	1,3,4-оксадиазолил	4-(1,2,3-тиадиазолил)	5-(1,2,3-тиадиазолил)
3-(1,2,4-тиадиазолил)	5-(1,2,4-тиадиазолил)	1,3,4-тиадиазолил	

R1a представляет собой CF3, R1b представляет собой H, R5 представляет собой Me

Q	Q	Q	Q
2-пиридинил	3-пиридинил	4-пиридинил	2-пиримидинил
4-пиримидинил	5-пиримидинил	2-пиразинил	3-пиразинил
3-пиридазинил	4-пиридазинил	3-(1,2,4-триазинил)	5-(1,2,4-триазинил)
6-(1,2,4-триазинил)	2-(1,3,5-триазинил)	2-фуранил	3-фуранил
2-тиенил	3-тиенил	2-пирролил	3-пирролил
1-Me-2-пирролил	1-Me-3-пирролил	3-пиразолил	4-пиразолил
5-пиразолил	1-Me-3-пиразолил	1-Me-4-пиразолил	1-Me-5-пиразолил
2-имидазолил	4-имидазолил	1-Me-2-имидазолил	1-Me-4-имидазолил
1-Me-5-имидазолил	1,2,3-триазолил	1-Me-4-(1,2,3-триазолил)	1-Me-5-(1,2,3-триазолил)
1,2,4-триазолил	1-Me-3-(1,2,4-триазолил)	1-Me-5-(1,2,4-триазолил)	2-Me-3-(1,2,4-триазолил)
2-Me-5-(1,2,4-	4-Me-3-(1,2,4-	тетразолил	1-Me-5-(тетразолил)

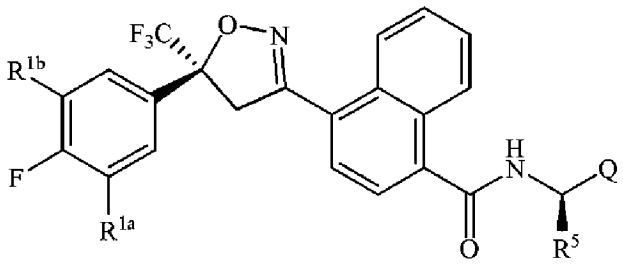
триазолил)	триазолил)		
2-Me-5-(тетразолил)	2-оксазолил	4-оксазолил	5-оксазолил
2-тиазолил	4-тиазолил	5-тиазолил	3-изоксазолил
4-изоксазолил	5-изоксазолил	3-изотиазолил	4-изотиазолил
5-изотиазолил	4-(1,2,3-оксадиазолил)	5-(1,2,3-оксадиазолил)	3-(1,2,4-оксадиазолил)
5-(1,2,4-оксадиазолил)	1,3,4-оксадиазолил	4-(1,2,3-тиадиазолил)	5-(1,2,3-тиадиазолил)
3-(1,2,4-тиадиазолил)	5-(1,2,4-тиадиазолил)	1,3,4-тиадиазолил	

R1a представляет собой CF3, R1b представляет собой Cl, R5 представляет собой Me

Q	Q	Q	Q
2-пиридинил	3-пиридинил	4-пиридинил	2-пиримидинил
4-пиримидинил	5-пиримидинил	2-пиразинил	3-пиразинил
3-пиридазинил	4-пиридазинил	3-(1,2,4-триазинил)	5-(1,2,4-триазинил)
6-(1,2,4-триазинил)	2-(1,3,5-триазинил)	2-фуранил	3-фуранил
2-тиенил	3-тиенил	2-пирролил	3-пирролил
1-Me-2-пирролил	1-Me-3-пирролил	3-пиразолил	4-пиразолил
5-пиразолил	1-Me-3-пиразолил	1-Me-4-пиразолил	1-Me-5-пиразолил
2-имидазолил	4-имидазолил	1-Me-2-имидазолил	1-Me-4-имидазолил
1-Me-5-имидазолил	1,2,3-триазолил	1-Me-4-(1,2,3-триазолил)	1-Me-5-(1,2,3-триазолил)
1,2,4-триазолил	1-Me-3-(1,2,4-триазолил)	1-Me-5-(1,2,4-триазолил)	2-Me-3-(1,2,4-триазолил)
2-Me-5-(1,2,4-триазолил)	4-Me-3-(1,2,4-триазолил)	тетразолил	1-Me-5-(тетразолил)
2-Me-5-(тетразолил)	2-оксазолил	4-оксазолил	5-оксазолил
2-тиазолил	4-тиазолил	5-тиазолил	3-изоксазолил
4-изоксазолил	5-изоксазолил	3-изотиазолил	4-изотиазолил
5-изотиазолил	4-(1,2,3-оксадиазолил)	5-(1,2,3-оксадиазолил)	3-(1,2,4-оксадиазолил)
5-(1,2,4-оксадиазолил)	1,3,4-оксадиазолил	4-(1,2,3-тиадиазолил)	5-(1,2,3-тиадиазолил)

3-(1,2,4-тиадиазолил)	5-(1,2,4-тиадиазолил)	1,3,4-тиадиазолил	

ТАБЛИЦА 2-4



R1a представляет собой Cl, R1b представляет собой Cl, R5 представляет собой Me

Q	Q	Q	Q
2-пиридинил	3-пиридинил	4-пиридинил	2-пиримидинил
4-пиримидинил	5-пиримидинил	2-пиразинил	3-пиразинил
3-пиридазинил	4-пиридазинил	3-(1,2,4-триазинил)	5-(1,2,4-триазинил)
6-(1,2,4-триазинил)	2-(1,3,5-триазинил)	2-фуранил	3-фуранил
2-тиенил	3-тиенил	2-пирролил	3-пирролил
1-Me-2-пирролил	1-Me-3-пирролил	3-пиразолил	4-пиразолил
5-пиразолил	1-Me-3-пиразолил	1-Me-4-пиразолил	1-Me-5-пиразолил
2-имидазолил	4-имидазолил	1-Me-2-имидазолил	1-Me-4-имидазолил
1-Me-5-имидазолил	1,2,3-триазолил	1-Me-4-(1,2,3-триазолил)	1-Me-5-(1,2,3-триазолил)
1,2,4-триазолил	1-Me-3-(1,2,4-триазолил)	1-Me-5-(1,2,4-триазолил)	2-Me-3-(1,2,4-триазолил)
2-Me-5-(1,2,4-триазолил)	4-Me-3-(1,2,4-триазолил)	тетразолил	1-Me-5-(тетразолил)
2-Me-5-(тетразолил)	2-оксазолил	4-оксазолил	5-оксазолил
2-тиазолил	4-тиазолил	5-тиазолил	3-изоксазолил
4-изоксазолил	5-изоксазолил	3-изотиазолил	4-изотиазолил
5-изотиазолил	4-(1,2,3-оксадиазолил)	5-(1,2,3-оксадиазолил)	3-(1,2,4-оксадиазолил)
5-(1,2,4-оксадиазолил)	1,3,4-оксадиазолил	4-(1,2,3-тиадиазолил)	5-(1,2,3-тиадиазолил)
3-(1,2,4-тиадиазолил)	5-(1,2,4-тиадиазолил)	1,3,4-тиадиазолил	

R1a представляет собой CF3, R1b представляет собой H, R5 представляет собой Me

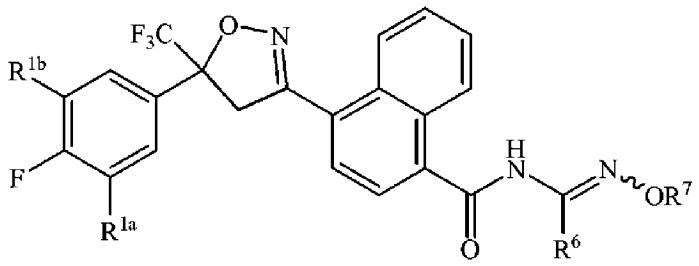
Q	Q	Q	Q
2-пиридинил	3-пиридинил	4-пиридинил	2-пиримидинил
4-пиримидинил	5-пиримидинил	2-пиразинил	3-пиразинил
3-пиридазинил	4-пиридазинил	3-(1,2,4-триазинил)	5-(1,2,4-триазинил)
6-(1,2,4-триазинил)	2-(1,3,5-триазинил)	2-фуранил	3-фуранил
2-тиенил	3-тиенил	2-пирролил	3-пирролил
1-Me-2-пирролил	1-Me-3-пирролил	3-пиразолил	4-пиразолил
5-пиразолил	1-Me-3-пиразолил	1-Me-4-пиразолил	1-Me-5-пиразолил
2-имидазолил	4-имидазолил	1-Me-2-имидазолил	1-Me-4-имидазолил
1-Me-5-имидазолил	1,2,3-триазолил	1-Me-4-(1,2,3-триазолил)	1-Me-5-(1,2,3-триазолил)
1,2,4-триазолил	1-Me-3-(1,2,4-триазолил)	1-Me-5-(1,2,4-триазолил)	2-Me-3-(1,2,4-триазолил)
2-Me-5-(1,2,4-триазолил)	4-Me-3-(1,2,4-триазолил)	тетразолил	1-Me-5-(тетразолил)
2-Me-5-(тетразолил)	2-оксазолил	4-оксазолил	5-оксазолил
2-тиазолил	4-тиазолил	5-тиазолил	3-изоксазолил
4-изоксазолил	5-изоксазолил	3-изотиазолил	4-изотиазолил
5-изотиазолил	4-(1,2,3-оксадиазолил)	5-(1,2,3-оксадиазолил)	3-(1,2,4-оксадиазолил)
5-(1,2,4-оксадиазолил)	1,3,4-оксадиазолил	4-(1,2,3-тиадиазолил)	5-(1,2,3-тиадиазолил)
3-(1,2,4-тиадиазолил)	5-(1,2,4-тиадиазолил)	1,3,4-тиадиазолил	

R1a представляет собой CF3, R1b представляет собой Cl, R5 представляет собой Me

Q	Q	Q	Q
2-пиридинил	3-пиридинил	4-пиридинил	2-пиримидинил
4-пиримидинил	5-пиримидинил	2-пиразинил	3-пиразинил
3-пиридазинил	4-пиридазинил	3-(1,2,4-триазинил)	5-(1,2,4-триазинил)
6-(1,2,4-триазинил)	2-(1,3,5-триазинил)	2-фуранил	3-фуранил
2-тиенил	3-тиенил	2-пирролил	3-пирролил
1-Me-2-пирролил	1-Me-3-пирролил	3-пиразолил	4-пиразолил
5-пиразолил	1-Me-3-пиразолил	1-Me-4-пиразолил	1-Me-5-пиразолил

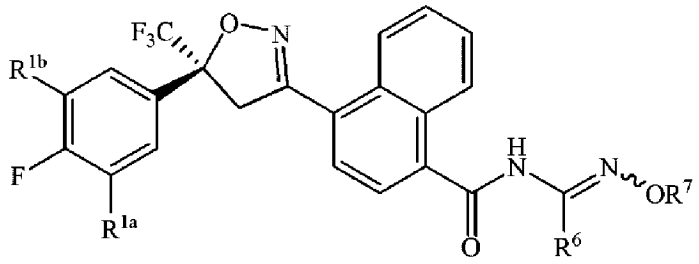
2-имидазолил	4-имидазолил	1-Me-2-имидазолил	1-Me-4-имидазолил
1-Me-5-имидазолил	1,2,3-триазолил	1-Me-4-(1,2,3-триазолил)	1-Me-5-(1,2,3-триазолил)
1,2,4-триазолил	1-Me-3-(1,2,4-триазолил)	1-Me-5-(1,2,4-триазолил)	2-Me-3-(1,2,4-триазолил)
2-Me-5-(1,2,4-триазолил)	4-Me-3-(1,2,4-триазолил)	тетразолил	1-Me-5-(тетразолил)
2-Me-5-(тетразолил)	2-оксазолил	4-оксазолил	5-оксазолил
2-тиазолил	4-тиазолил	5-тиазолил	3-изоксазолил
4-изоксазолил	5-изоксазолил	3-изотиазолил	4-изотиазолил
5-изотиазолил	4-(1,2,3-оксадиазолил)	5-(1,2,3-оксадиазолил)	3-(1,2,4-оксадиазолил)
5-(1,2,4-оксадиазолил)	1,3,4-оксадиазолил	4-(1,2,3-тиадиазолил)	5-(1,2,3-тиадиазолил)
3-(1,2,4-тиадиазолил)	5-(1,2,4-тиадиазолил)	1,3,4-тиадиазолил	

ТАБЛИЦА 3-1



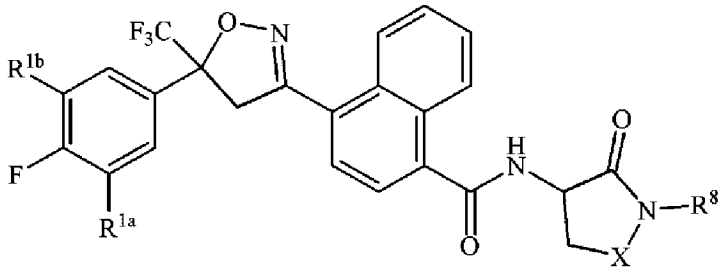
R1a	R1b	R6	R7		R1a	R1b	R6	R7
Cl	Cl	H	Me		CF3	H	H	Me
Cl	Cl	H	Et		CF3	H	H	Et
Cl	Cl	Me	Me		CF3	H	Me	Me
Cl	Cl	Me	Et		CF3	H	Me	Et
CF3	Cl	H	Me		CF3	Cl	Me	Me
CF3	Cl	H	Et		CF3	Cl	Me	Et

ТАБЛИЦА 3-2



R1a	R1b	R6	R7		R1a	R1b	R6	R7
Cl	Cl	H	Me		CF3	H	H	Me
Cl	Cl	H	Et		CF3	H	H	Et
Cl	Cl	Me	Me		CF3	H	Me	Me
Cl	Cl	Me	Et		CF3	H	Me	Et
CF3	Cl	H	Me		CF3	Cl	Me	Me
CF3	Cl	H	Et		CF3	Cl	Me	Et

ТАБЛИЦА 4-1



X представляет собой -O-

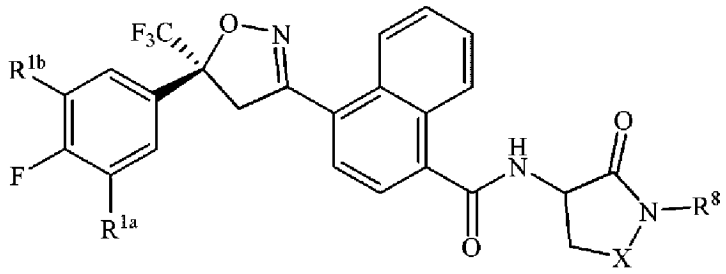
R1a	R1b	R8		R1a	R1b	R8
Cl	Cl	Me		CF3	H	Me
Cl	Cl	Et		CF3	H	Et
Cl	Cl	CH2CF3		CF3	H	CH2CF3
CF3	Cl	Me				
CF3	Cl	Et				
CF3	Cl	CH2CF3				

X представляет собой -C(O)-

R1a	R1b	R8		R1a	R1b	R8
Cl	Cl	Me		CF3	H	Me
Cl	Cl	Et		CF3	H	Et
Cl	Cl	CH2CF3		CF3	H	CH2CF3
CF3	Cl	Me				
CF3	Cl	Et				

CF3	Cl	CH2CF3				

ТАБЛИЦА 4-2



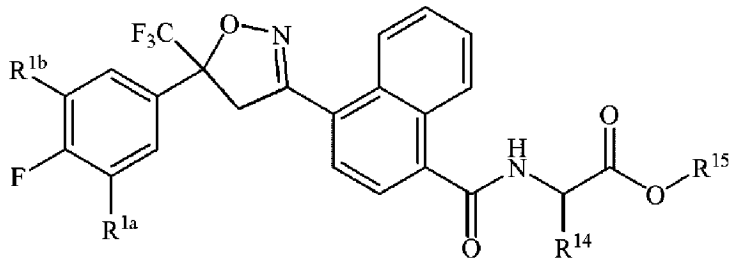
X представляет собой -O-

R1a	R1b	R8		R1a	R1b	R8
Cl	Cl	Me		CF3	H	Me
Cl	Cl	Et		CF3	H	Et
Cl	Cl	CH2CF3		CF3	H	CH2CF3
CF3	Cl	Me				
CF3	Cl	Et				
CF3	Cl	CH2CF3				

X представляет собой -C(O)-

R1a	R1b	R8		R1a	R1b	R8
Cl	Cl	Me		CF3	H	Me
Cl	Cl	Et		CF3	H	Et
Cl	Cl	CH2CF3		CF3	H	CH2CF3
CF3	Cl	Me				
CF3	Cl	Et				
CF3	Cl	CH2CF3				

ТАБЛИЦА 5-1

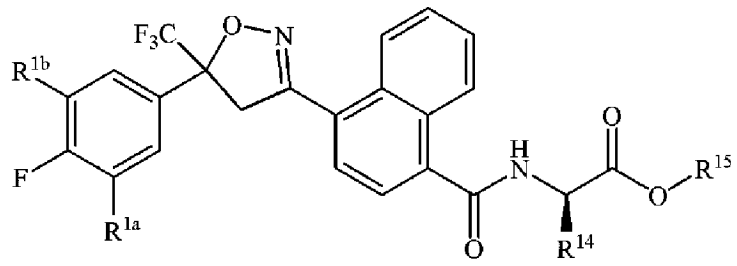


R1a	R1b	R14	R15		R1a	R1b	R14	R15
Cl	Cl	Me	H		CF3	H	Me	H
Cl	Cl	Et	H		CF3	H	Et	H
Cl	Cl	i-Pr	H		CF3	H	i-Pr	H

Cl	Cl	i-Bu	H		CF3	H	i-Bu	H
Cl	Cl	CH2OH	H		CF3	H	CH2OH	H
Cl	Cl	CH2OMe	H		CF3	H	CH2OMe	H
Cl	Cl	Me	Me		CF3	H	Me	Me
Cl	Cl	Et	Me		CF3	H	Et	Me
Cl	Cl	i-Pr	Me		CF3	H	i-Pr	Me
Cl	Cl	i-Bu	Me		CF3	H	i-Bu	Me
Cl	Cl	CH2OH	Me		CF3	H	CH2OH	Me
Cl	Cl	CH2OMe	Me		CF3	H	CH2OMe	Me
Cl	Cl	Me	Et		CF3	H	Me	Et
Cl	Cl	Et	Et		CF3	H	Et	Et
Cl	Cl	i-Pr	Et		CF3	H	i-Pr	Et
Cl	Cl	i-Bu	Et		CF3	H	i-Bu	Et
Cl	Cl	CH2OH	Et		CF3	H	CH2OH	Et
Cl	Cl	CH2OMe	Et		CF3	H	CH2OMe	Et
Cl	Cl	Me	i-Pr		CF3	H	Me	i-Pr
Cl	Cl	Et	i-Pr		CF3	H	Et	i-Pr
Cl	Cl	i-Pr	i-Pr		CF3	H	i-Pr	i-Pr
Cl	Cl	i-Bu	i-Pr		CF3	H	i-Bu	i-Pr
Cl	Cl	CH2OH	i-Pr		CF3	H	CH2OH	i-Pr
Cl	Cl	CH2OMe	i-Pr		CF3	H	CH2OMe	i-Pr
Cl	Cl	Me	CH2CF3		CF3	H	Me	CH2CF3
Cl	Cl	Et	CH2CF3		CF3	H	Et	CH2CF3
Cl	Cl	i-Pr	CH2CF3		CF3	H	i-Pr	CH2CF3
Cl	Cl	i-Bu	CH2CF3		CF3	H	i-Bu	CH2CF3
Cl	Cl	CH2OH	CH2CF3		CF3	H	CH2OH	CH2CF3
Cl	Cl	CH2OMe	CH2CF3		CF3	H	CH2OMe	CH2CF3
CF3	Cl	Me	H		CF3	Cl	Me	i-Pr
CF3	Cl	Et	H		CF3	Cl	Et	i-Pr

CF3	Cl	i-Pr	H		CF3	Cl	i-Pr	i-Pr
CF3	Cl	i-Bu	H		CF3	Cl	i-Bu	i-Pr
CF3	Cl	CH2OH	H		CF3	Cl	CH2OH	i-Pr
CF3	Cl	CH2OMe	H		CF3	Cl	CH2OMe	i-Pr
CF3	Cl	Me	Me		CF3	Cl	Me	CH2CF3
CF3	Cl	Et	Me		CF3	Cl	Et	CH2CF3
CF3	Cl	i-Pr	Me		CF3	Cl	i-Pr	CH2CF3
CF3	Cl	i-Bu	Me		CF3	Cl	i-Bu	CH2CF3
CF3	Cl	CH2OH	Me		CF3	Cl	CH2OH	CH2CF3
CF3	Cl	CH2OMe	Me		CF3	Cl	CH2OMe	CH2CF3
CF3	Cl	Me	Et					
CF3	Cl	Et	Et					
CF3	Cl	i-Pr	Et					
CF3	Cl	i-Bu	Et					
CF3	Cl	CH2OH	Et					
CF3	Cl	CH2OMe	Et					

ТАБЛИЦА 5-2

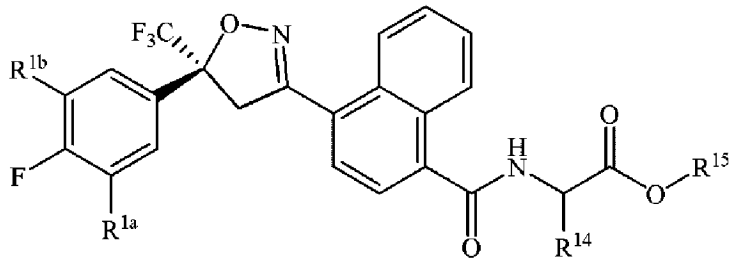


R1a	R1b	R14	R15		R1a	R1b	R14	R15
Cl	Cl	Me	H		CF3	H	Me	H
Cl	Cl	Et	H		CF3	H	Et	H
Cl	Cl	i-Pr	H		CF3	H	i-Pr	H
Cl	Cl	i-Bu	H		CF3	H	i-Bu	H
Cl	Cl	CH2OH	H		CF3	H	CH2OH	H
Cl	Cl	CH2OMe	H		CF3	H	CH2OMe	H

Cl	Cl	Me	Me		CF3	H	Me	Me
Cl	Cl	Et	Me		CF3	H	Et	Me
Cl	Cl	i-Pr	Me		CF3	H	i-Pr	Me
Cl	Cl	i-Bu	Me		CF3	H	i-Bu	Me
Cl	Cl	CH2OH	Me		CF3	H	CH2OH	Me
Cl	Cl	CH2OMe	Me		CF3	H	CH2OMe	Me
Cl	Cl	Me	Et		CF3	H	Me	Et
Cl	Cl	Et	Et		CF3	H	Et	Et
Cl	Cl	i-Pr	Et		CF3	H	i-Pr	Et
Cl	Cl	i-Bu	Et		CF3	H	i-Bu	Et
Cl	Cl	CH2OH	Et		CF3	H	CH2OH	Et
Cl	Cl	CH2OMe	Et		CF3	H	CH2OMe	Et
Cl	Cl	Me	i-Pr		CF3	H	Me	i-Pr
Cl	Cl	Et	i-Pr		CF3	H	Et	i-Pr
Cl	Cl	i-Pr	i-Pr		CF3	H	i-Pr	i-Pr
Cl	Cl	i-Bu	i-Pr		CF3	H	i-Bu	i-Pr
Cl	Cl	CH2OH	i-Pr		CF3	H	CH2OH	i-Pr
Cl	Cl	CH2OMe	i-Pr		CF3	H	CH2OMe	i-Pr
Cl	Cl	Me	CH2CF3		CF3	H	Me	CH2CF3
Cl	Cl	Et	CH2CF3		CF3	H	Et	CH2CF3
Cl	Cl	i-Pr	CH2CF3		CF3	H	i-Pr	CH2CF3
Cl	Cl	i-Bu	CH2CF3		CF3	H	i-Bu	CH2CF3
Cl	Cl	CH2OH	CH2CF3		CF3	H	CH2OH	CH2CF3
Cl	Cl	CH2OMe	CH2CF3		CF3	H	CH2OMe	CH2CF3
CF3	Cl	Me	H		CF3	Cl	Me	i-Pr
CF3	Cl	Et	H		CF3	Cl	Et	i-Pr
CF3	Cl	i-Pr	H		CF3	Cl	i-Pr	i-Pr
CF3	Cl	i-Bu	H		CF3	Cl	i-Bu	i-Pr
CF3	Cl	CH2OH	H		CF3	Cl	CH2OH	i-Pr
CF3	Cl	CH2OM	H		CF3	Cl	CH2OM	i-Pr

		e					e	
CF3	Cl	Me	Me		CF3	Cl	Me	CH2CF3
CF3	Cl	Et	Me		CF3	Cl	Et	CH2CF3
CF3	Cl	i-Pr	Me		CF3	Cl	i-Pr	CH2CF3
CF3	Cl	i-Bu	Me		CF3	Cl	i-Bu	CH2CF3
CF3	Cl	CH2OH	Me		CF3	Cl	CH2OH	CH2CF3
CF3	Cl	CH2OMe	Me		CF3	Cl	CH2OMe	CH2CF3
CF3	Cl	Me	Et					
CF3	Cl	Et	Et					
CF3	Cl	i-Pr	Et					
CF3	Cl	i-Bu	Et					
CF3	Cl	CH2OH	Et					
CF3	Cl	CH2OMe	Et					

ТАБЛИЦА 5-3

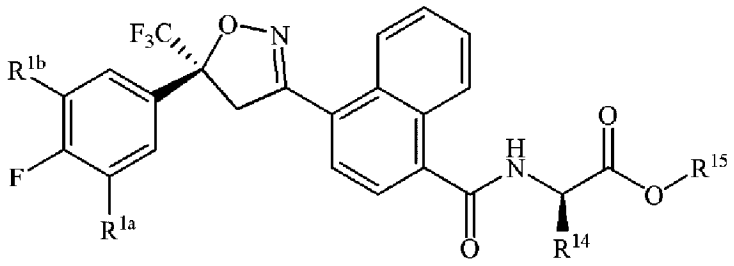


R1a	R1b	R14	R15		R1a	R1b	R14	R15
Cl	Cl	Me	H		CF3	H	Me	H
Cl	Cl	Et	H		CF3	H	Et	H
Cl	Cl	i-Pr	H		CF3	H	i-Pr	H
Cl	Cl	i-Bu	H		CF3	H	i-Bu	H
Cl	Cl	CH2OH	H		CF3	H	CH2OH	H
Cl	Cl	CH2OMe	H		CF3	H	CH2OMe	H
Cl	Cl	Me	Me		CF3	H	Me	Me
Cl	Cl	Et	Me		CF3	H	Et	Me
Cl	Cl	i-Pr	Me		CF3	H	i-Pr	Me
Cl	Cl	i-Bu	Me		CF3	H	i-Bu	Me
Cl	Cl	CH2OH	Me		CF3	H	CH2OH	Me

Cl	Cl	CH2OMe	Me		CF3	H	CH2OMe	Me
Cl	Cl	Me	Et		CF3	H	Me	Et
Cl	Cl	Et	Et		CF3	H	Et	Et
Cl	Cl	i-Pr	Et		CF3	H	i-Pr	Et
Cl	Cl	i-Bu	Et		CF3	H	i-Bu	Et
Cl	Cl	CH2OH	Et		CF3	H	CH2OH	Et
Cl	Cl	CH2OMe	Et		CF3	H	CH2OMe	Et
Cl	Cl	Me	i-Pr		CF3	H	Me	i-Pr
Cl	Cl	Et	i-Pr		CF3	H	Et	i-Pr
Cl	Cl	i-Pr	i-Pr		CF3	H	i-Pr	i-Pr
Cl	Cl	i-Bu	i-Pr		CF3	H	i-Bu	i-Pr
Cl	Cl	CH2OH	i-Pr		CF3	H	CH2OH	i-Pr
Cl	Cl	CH2OMe	i-Pr		CF3	H	CH2OMe	i-Pr
Cl	Cl	Me	CH2CF3		CF3	H	Me	CH2CF3
Cl	Cl	Et	CH2CF3		CF3	H	Et	CH2CF3
Cl	Cl	i-Pr	CH2CF3		CF3	H	i-Pr	CH2CF3
Cl	Cl	i-Bu	CH2CF3		CF3	H	i-Bu	CH2CF3
Cl	Cl	CH2OH	CH2CF3		CF3	H	CH2OH	CH2CF3
Cl	Cl	CH2OMe	CH2CF3		CF3	H	CH2OMe	CH2CF3
CF3	Cl	Me	H		CF3	Cl	Me	i-Pr
CF3	Cl	Et	H		CF3	Cl	Et	i-Pr
CF3	Cl	i-Pr	H		CF3	Cl	i-Pr	i-Pr
CF3	Cl	i-Bu	H		CF3	Cl	i-Bu	i-Pr
CF3	Cl	CH2OH	H		CF3	Cl	CH2OH	i-Pr
CF3	Cl	CH2OMe	H		CF3	Cl	CH2OMe	i-Pr
CF3	Cl	Me	Me		CF3	Cl	Me	CH2CF3
CF3	Cl	Et	Me		CF3	Cl	Et	CH2CF3
CF3	Cl	i-Pr	Me		CF3	Cl	i-Pr	CH2CF3
CF3	Cl	i-Bu	Me		CF3	Cl	i-Bu	CH2CF3

CF3	Cl	CH2OH	Me		CF3	Cl	CH2OH	CH2CF3
CF3	Cl	CH2OMe	Me		CF3	Cl	CH2OMe	CH2CF3
CF3	Cl	Me	Et					
CF3	Cl	Et	Et					
CF3	Cl	i-Pr	Et					
CF3	Cl	i-Bu	Et					
CF3	Cl	CH2OH	Et					
CF3	Cl	CH2OMe	Et					

ТАБЛИЦА 5-4

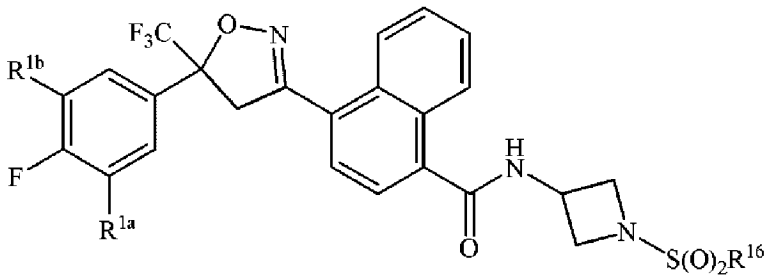


R1a	R1b	R14	R15		R1a	R1b	R14	R15
Cl	Cl	Me	H		CF3	H	Me	H
Cl	Cl	Et	H		CF3	H	Et	H
Cl	Cl	i-Pr	H		CF3	H	i-Pr	H
Cl	Cl	i-Bu	H		CF3	H	i-Bu	H
Cl	Cl	CH2OH	H		CF3	H	CH2OH	H
Cl	Cl	CH2OMe	H		CF3	H	CH2OMe	H
Cl	Cl	Me	Me		CF3	H	Me	Me
Cl	Cl	Et	Me		CF3	H	Et	Me
Cl	Cl	i-Pr	Me		CF3	H	i-Pr	Me
Cl	Cl	i-Bu	Me		CF3	H	i-Bu	Me
Cl	Cl	CH2OH	Me		CF3	H	CH2OH	Me
Cl	Cl	CH2OMe	Me		CF3	H	CH2OMe	Me
Cl	Cl	Me	Et		CF3	H	Me	Et
Cl	Cl	Et	Et		CF3	H	Et	Et
Cl	Cl	i-Pr	Et		CF3	H	i-Pr	Et

Cl	Cl	i-Bu	Et		CF3	H	i-Bu	Et
Cl	Cl	CH2OH	Et		CF3	H	CH2OH	Et
Cl	Cl	CH2OMe	Et		CF3	H	CH2OMe	Et
Cl	Cl	Me	i-Pr		CF3	H	Me	i-Pr
Cl	Cl	Et	i-Pr		CF3	H	Et	i-Pr
Cl	Cl	i-Pr	i-Pr		CF3	H	i-Pr	i-Pr
Cl	Cl	i-Bu	i-Pr		CF3	H	i-Bu	i-Pr
Cl	Cl	CH2OH	i-Pr		CF3	H	CH2OH	i-Pr
Cl	Cl	CH2OMe	i-Pr		CF3	H	CH2OMe	i-Pr
Cl	Cl	Me	CH2CF3		CF3	H	Me	CH2CF3
Cl	Cl	Et	CH2CF3		CF3	H	Et	CH2CF3
Cl	Cl	i-Pr	CH2CF3		CF3	H	i-Pr	CH2CF3
Cl	Cl	i-Bu	CH2CF3		CF3	H	i-Bu	CH2CF3
Cl	Cl	CH2OH	CH2CF3		CF3	H	CH2OH	CH2CF3
Cl	Cl	CH2OMe	CH2CF3		CF3	H	CH2OMe	CH2CF3
CF3	Cl	Me	H		CF3	Cl	Me	i-Pr
CF3	Cl	Et	H		CF3	Cl	Et	i-Pr
CF3	Cl	i-Pr	H		CF3	Cl	i-Pr	i-Pr
CF3	Cl	i-Bu	H		CF3	Cl	i-Bu	i-Pr
CF3	Cl	CH2OH	H		CF3	Cl	CH2OH	i-Pr
CF3	Cl	CH2OMe	H		CF3	Cl	CH2OMe	i-Pr
CF3	Cl	Me	Me		CF3	Cl	Me	CH2CF3
CF3	Cl	Et	Me		CF3	Cl	Et	CH2CF3
CF3	Cl	i-Pr	Me		CF3	Cl	i-Pr	CH2CF3
CF3	Cl	i-Bu	Me		CF3	Cl	i-Bu	CH2CF3
CF3	Cl	CH2OH	Me		CF3	Cl	CH2OH	CH2CF3
CF3	Cl	CH2OMe	Me		CF3	Cl	CH2OMe	CH2CF3
CF3	Cl	Me	Et					
CF3	Cl	Et	Et					

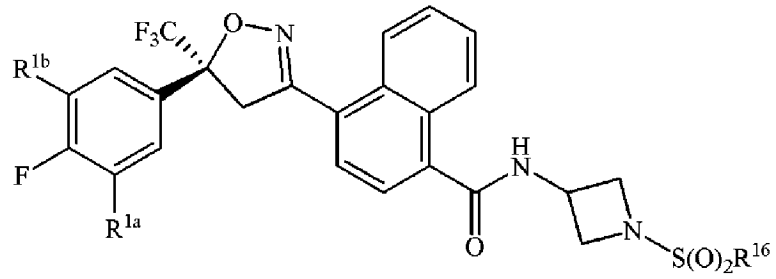
CF3	Cl	i-Pr	Et					
CF3	Cl	i-Bu	Et					
CF3	Cl	CH2OH	Et					
CF3	Cl	CH2OMe	Et					

ТАБЛИЦА 6-1



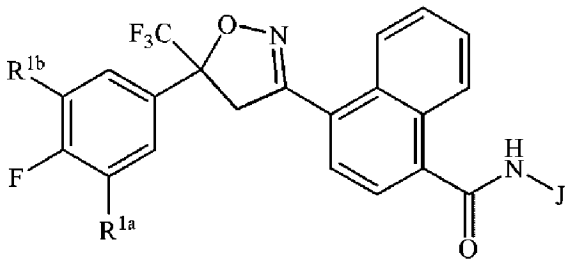
R1a	R1b	R16		R1a	R1b	R16
Cl	Cl	Me		CF3	H	Me
Cl	Cl	F		CF3	H	F
Cl	Cl	NH2		CF3	H	NH2
CF3	Cl	Me				
CF3	Cl	F				
CF3	Cl	NH2				

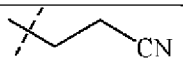
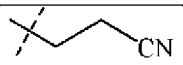
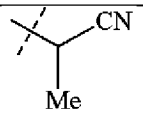
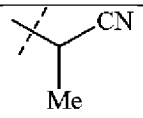
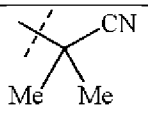
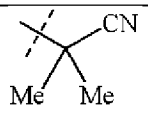
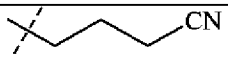
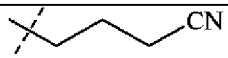
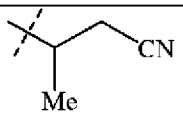
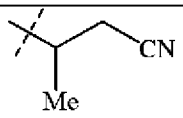
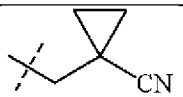
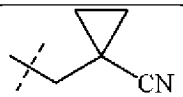
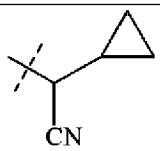
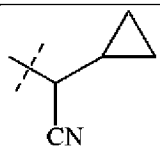
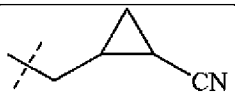
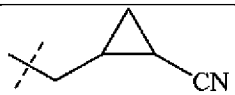
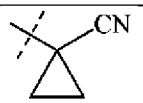
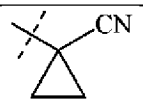
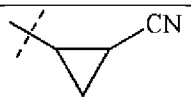
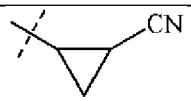
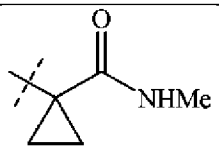
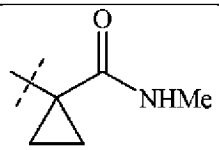
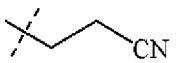
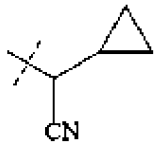
ТАБЛИЦА 6-2



R1a	R1b	R16		R1a	R1b	R16
Cl	Cl	Me		CF3	H	Me
Cl	Cl	F		CF3	H	F
Cl	Cl	NH2		CF3	H	NH2
CF3	Cl	Me				
CF3	Cl	F				
CF3	Cl	NH2				

ТАБЛИЦА 7-1



R1a	R1b	J		R1a	R1b	J
Cl	Cl			CF3	H	
Cl	Cl			CF3	H	
Cl	Cl			CF3	H	
Cl	Cl			CF3	H	
Cl	Cl			CF3	H	
Cl	Cl			CF3	H	
Cl	Cl			CF3	H	
Cl	Cl			CF3	H	
Cl	Cl			CF3	H	
Cl	Cl	циклопропил		CF3	H	циклопропил
Cl	Cl			CF3	H	
Cl	Cl			CF3	H	
Cl	Cl			CF3	H	
CF3	Cl			CF3	Cl	

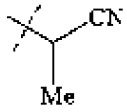
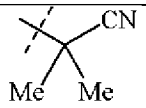
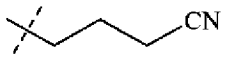
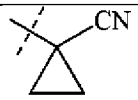
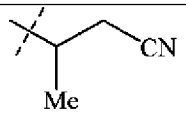
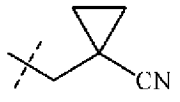
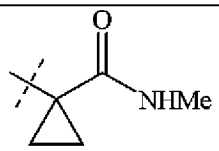
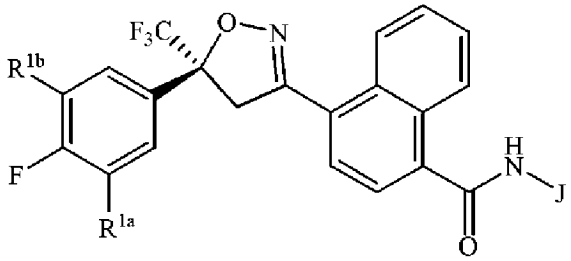
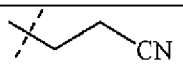
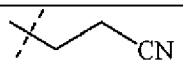
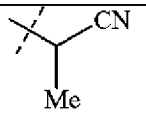
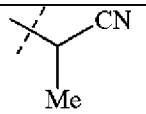
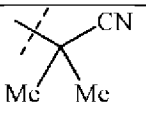
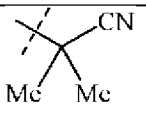
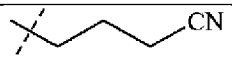
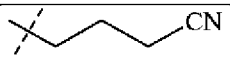
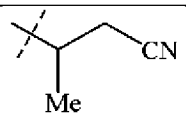
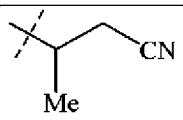
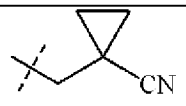
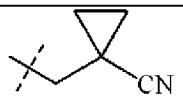
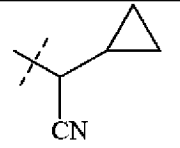
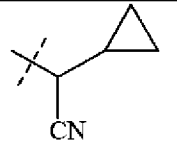
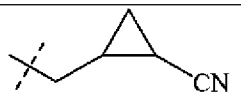
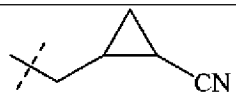
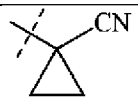
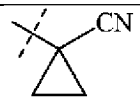
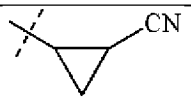
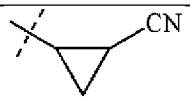
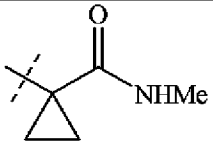
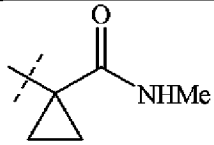
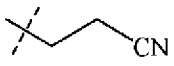
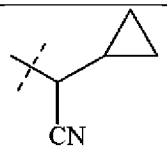
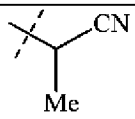
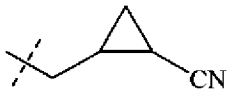
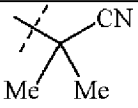
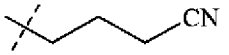
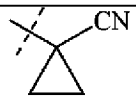
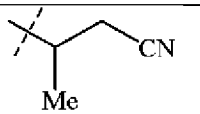
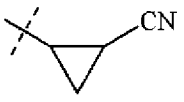
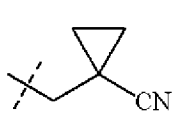
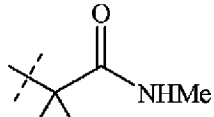
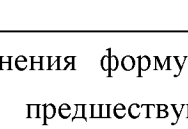
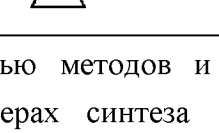
CF3	Cl		CF3	Cl	
CF3	Cl		CF3	Cl	циклопропил
CF3	Cl		CF3	Cl	
CF3	Cl		CF3	Cl	
CF3	Cl		CF3	Cl	

ТАБЛИЦА 7-2



R1a	R1b	J	R1a	R1b	J
Cl	Cl		CF3	H	
Cl	Cl		CF3	H	
Cl	Cl		CF3	H	
Cl	Cl		CF3	H	
Cl	Cl		CF3	H	
Cl	Cl		CF3	H	
Cl	Cl		CF3	H	

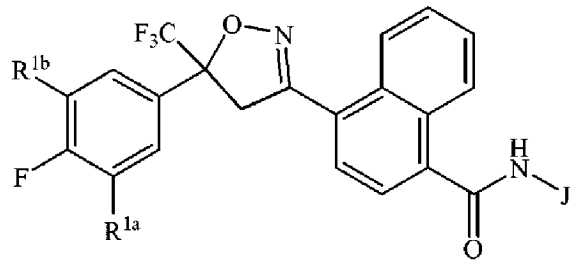
Cl	Cl		CF3	H	
Cl	Cl	циклопропил	CF3	H	циклопропил
Cl	Cl		CF3	H	
Cl	Cl		CF3	H	
Cl	Cl		CF3	H	
CF3	Cl		CF3	Cl	
CF3	Cl		CF3	Cl	
CF3	Cl		CF3	Cl	циклопропил
CF3	Cl		CF3	Cl	
CF3	Cl		CF3	Cl	
CF3	Cl		CF3	Cl	
CF3	Cl		CF3	Cl	

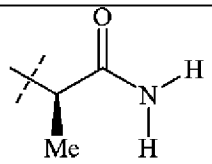
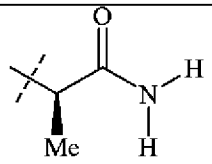
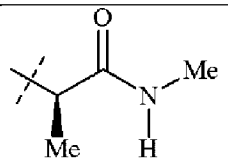
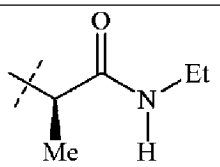
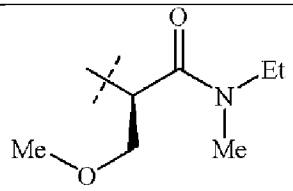
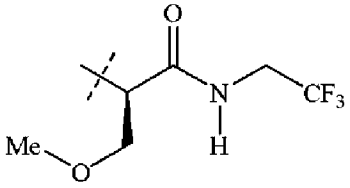
Конкретные соединения формулы **1**, полученные с помощью методов и их вариантов, описанных в предшествующих схемах 1-11 и примерах синтеза 1-5, представлены в таблицах показателей ниже. Могут использоваться следующие условные сокращенные обозначения: "соед." обозначает соединение, "т" обозначает третичный, "с" обозначает цикло, Me обозначает метил, Et обозначает этил, и Ph обозначает фенил. Сокращение "Пр." обозначает "пример", за которым следует число, указывающее на номер примера синтеза, в котором получают соединение.

Данные по температуре плавления (MP) представлены в виде температурного диапазона (например, 122-126). Масс-спектральные данные (MS) представлены в форме одного численного значения (например, 542). Для масс-спектральных данных (AP+ (M+1)), приведенное численное значение представляет собой молекулярную массу

исходного молекулярного иона (M), образованную путем добавления H+ (с молекулярной массой 1) к молекуле с получением пика M+1, обнаруживаемого методом масс-спектрометрии с использованием химической ионизации при атмосферном давлении (AP+). Альтернативные пики молекулярного иона (например, M+2 или M+4), которые возникают в случае соединений, содержащих более одного галогена, не приводятся.

ТАБЛИЦА ПОКАЗАТЕЛЕЙ A



Соединение №	R1a	R1b	J	Данные MP/MS
1	Cl	Cl		542
2	CF3	Cl		575
3	Cl	Cl		556
4	Cl	Cl		570
5	Cl	Cl		78-82
6	Cl	Cl		122-126

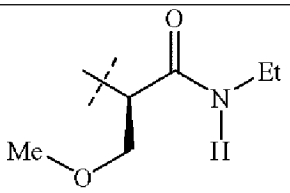
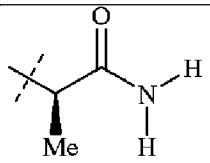
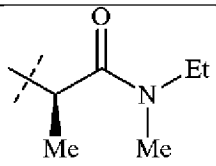
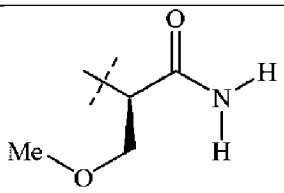
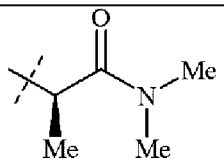
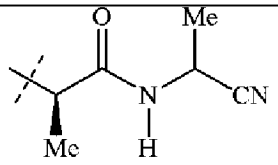
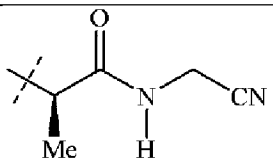
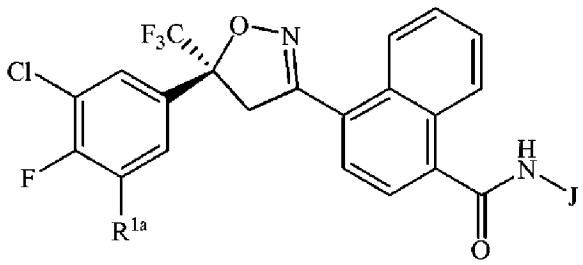
7	Cl	Cl		147-151
43	CF3	H		106-110
44	Cl	Cl		584
45	Cl	Cl		572
46	Cl	Cl		570
47	Cl	Cl		595
48	Cl	Cl		581

ТАБЛИЦА ПОКАЗАТЕЛЕЙ А-1



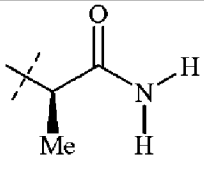
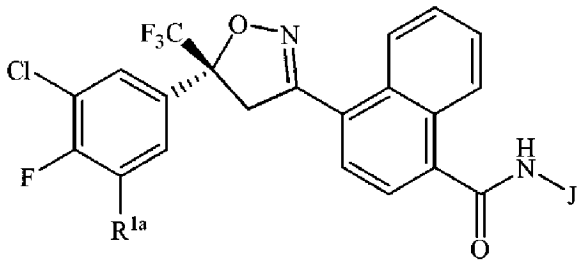
Соединение №	R1a	J	Данные MS
8	Cl		542

ТАБЛИЦА ПОКАЗАТЕЛЕЙ А-2



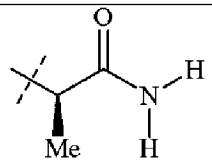
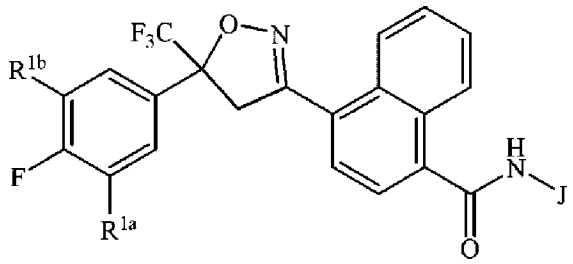
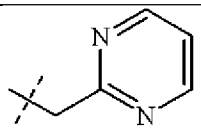
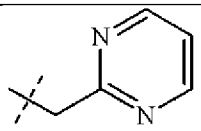
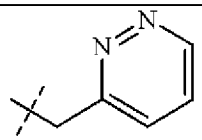
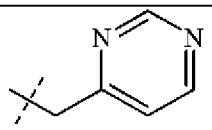
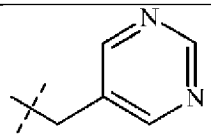
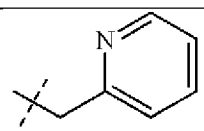
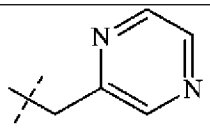
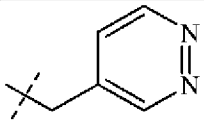
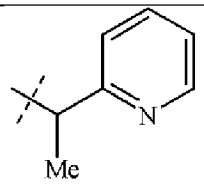
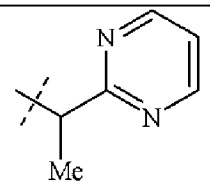
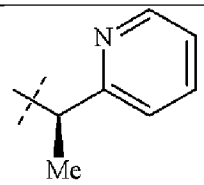
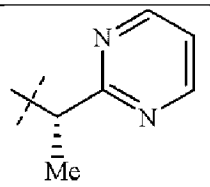
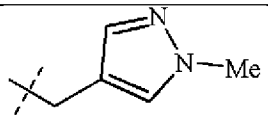
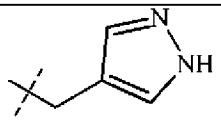
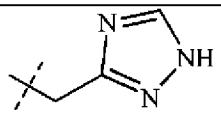
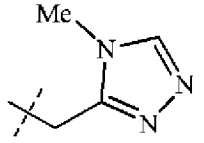
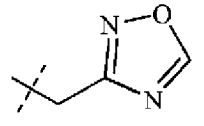
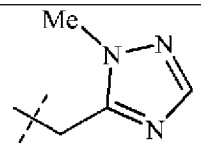
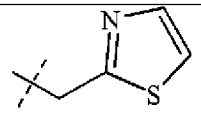
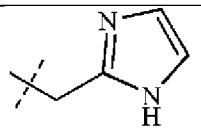
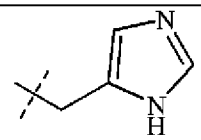
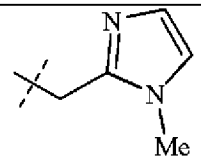
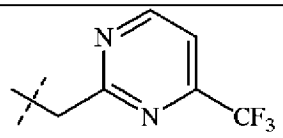
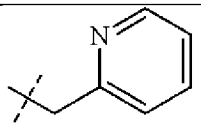
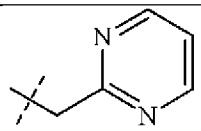
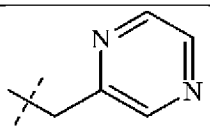
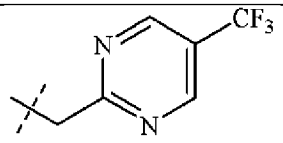
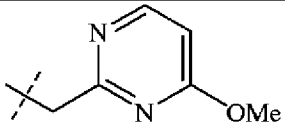
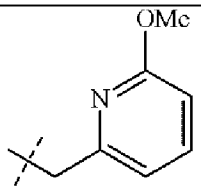
Соединение №	R1a	J	Данные MS
9	Cl		542

ТАБЛИЦА ПОКАЗАТЕЛЕЙ В



Соединение №	R1a	R1b	J	Данные MP/MS
10	Cl	Cl		563
11	CF3	Cl		597
12	Cl	Cl		563
13	Cl	Cl		563
14	Cl	Cl		563
15	Cl	Cl		562

16	Cl	Cl		563
17	Cl	Cl		563
18	Cl	Cl		576
19	Cl	Cl		577
20	Cl	Cl		576
21	Cl	Cl		577
22	Cl	Cl		565
23	Cl	Cl		551
24	Cl	Cl		552
25	Cl	Cl		566
26	Cl	Cl		553

27	Cl	Cl		566
28	Cl	Cl		568
29	Cl	Cl		551
30	Cl	Cl		551
31	Cl	Cl		565
32	Cl	Cl		631
49	CF3	H		151-155
50	CF3	H		153-157
51	CF3	H		563
52	Cl	Cl		631
53	Cl	Cl		593
54	Cl	Cl		207-208

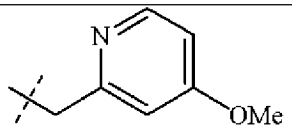
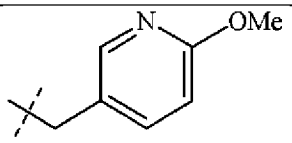
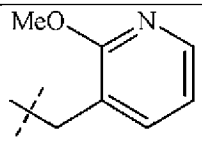
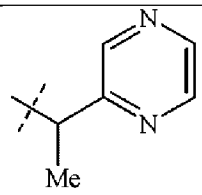
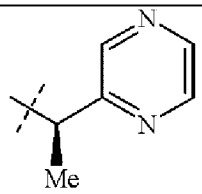
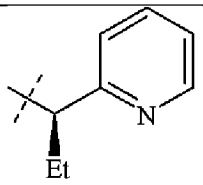
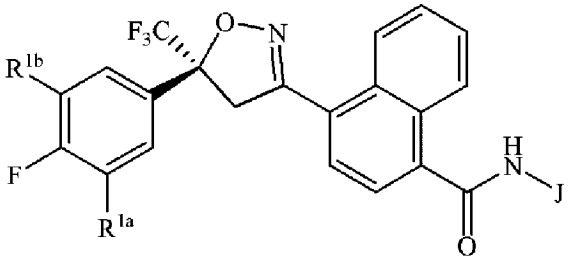
55	Cl	Cl		69-71
56	Cl	Cl		183-184
57	Cl	Cl		202-203
58	Cl	Cl		577
59	Cl	Cl		577
60	Cl	Cl		590

ТАБЛИЦА ПОКАЗАТЕЛЕЙ B-1



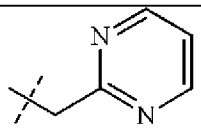
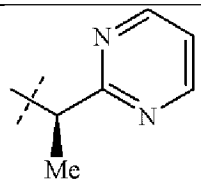
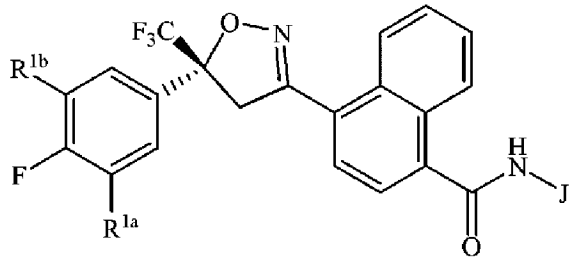
Соединение №	R1a	R1b	J	Данные MP/MS
61	Cl	Cl		120-124
63	Cl	Cl		577

ТАБЛИЦА ПОКАЗАТЕЛЕЙ B-2



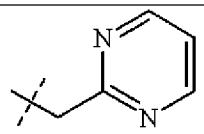
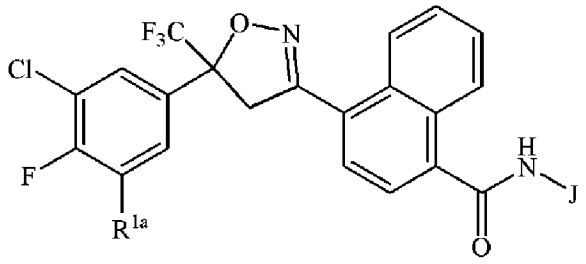
Соединение №	R1a	R1b	J	Данные MS
62	Cl	Cl		563

ТАБЛИЦА ПОКАЗАТЕЛЕЙ C



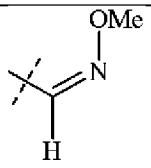
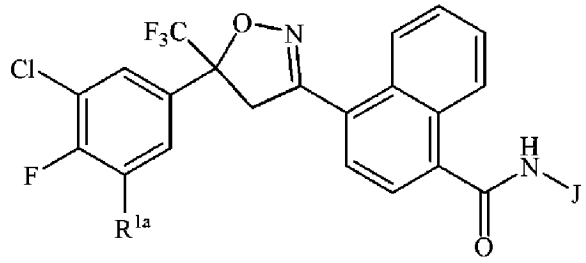
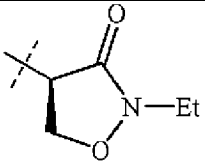
Соединение №	R1a	J	Данные MS
33	Cl		528

ТАБЛИЦА ПОКАЗАТЕЛЕЙ D



Соединение №	R1a	J	Данные MS
34	Cl		584

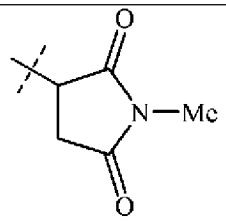
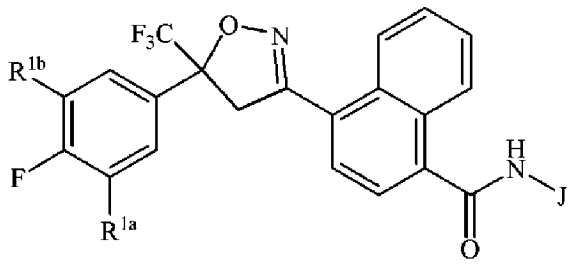
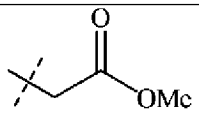
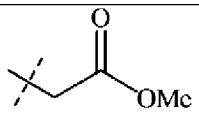
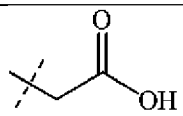
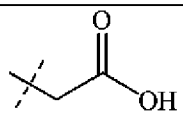
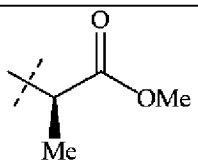
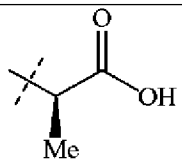
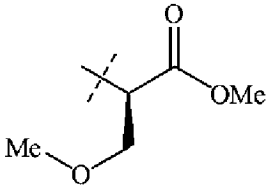
64	Cl		582

ТАБЛИЦА ПОКАЗАТЕЛЕЙ E



Соединение №	R1a	R1b	J	Данные MP/MS
35	Cl	Cl		543
36	CF3	Cl		577
37	CF3	Cl		563
38	Cl	Cl		529
39	Cl	Cl		557
40	Cl	Cl		543
41	Cl	Cl		587

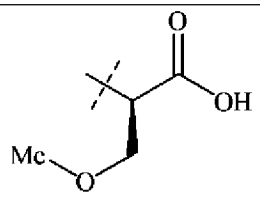
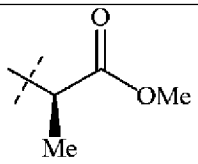
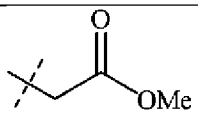
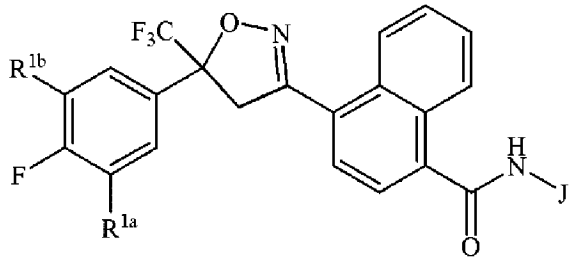
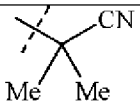
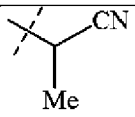
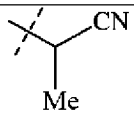
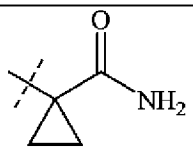
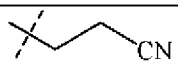
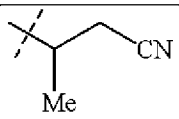
42	Cl	Cl		573
65	CF3	H		161-165
66	CF3	H		79-83

ТАБЛИЦА ПОКАЗАТЕЛЕЙ F



Соединение №	R1a	R1b	J	Данные MP/MS
67	CF3	H	циклопропил	153-157
68	CF3	H		200-204
69	CF3	H		524
70	Cl	Cl	циклопропил	511
71	Cl	Cl		524
72	Cl	Cl		256-260
73	Cl	Cl		525,1
74	Cl	Cl		538,2

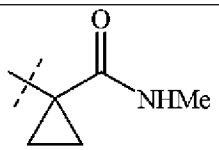
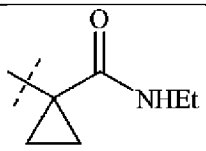
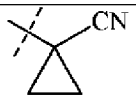
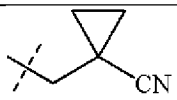
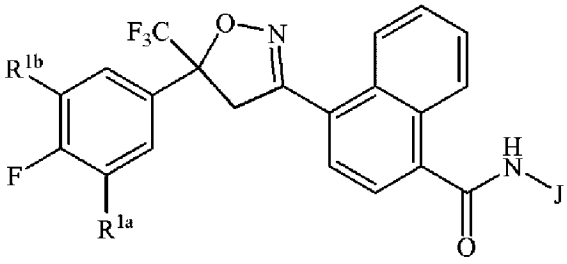
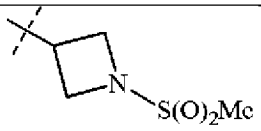
75	Cl	Cl		94-98
76	Cl	Cl		135-139
77	Cl	Cl		536
78	Cl	Cl		550

ТАБЛИЦА ПОКАЗАТЕЛЕЙ G



Соединение №	R1a	R1b	J	Данные MS
79	Cl	Cl		604

Соединения по этому изобретению предполагается применять, как правило, в качестве активного ингредиента в композиции для борьбы с беспозвоночным вредителем, то в форме препарата, включающего, по меньшей мере, один дополнительный компонент, выбранный из группы, состоящей из поверхностно-активных веществ, твердых разбавителей и жидких разбавителей, которые служат в качестве носителя. Ингредиенты препарата или композиции выбирают таким образом, чтобы они соответствовали физическим свойствам активного ингредиента, способу применения и факторам влияния окружающей среды, таким как тип почвы, влажность и температура.

Применяемые препараты включают как жидкие, так и твердые композиции. Жидкие композиции включают растворы (в том числе эмульгируемые концентраты), суспензии, эмульсии (в том числе микроэмульсии, эмульсии типа масло в воде, жидкотекучие концентраты и/или суспоэмульсии) и другие подобные формы, которые, необязательно, могут быть сгущены в гели. Обычные типы водных жидких композиций представляют собой растворимый концентрат, концентрат суспензии, суспензию капсул, концентрированную эмульсию, микроэмульсию, эмульсию типа масло в воде, жидкотекучий концентрат и суспоэмульсию. Обычные типы неводных жидких

композиций представляют собой эмульгируемый концентрат, микроэмульгируемый концентрат, диспергируемый концентрат и масляную дисперсию.

Обычные типы твердых композиций представляют собой дусты, порошки, гранулы, пеллеты, дробинки, пастилки, таблетки, наполненные пленки (в том числе образующиеся пленочные покрытия при дражировании семян) и другие типы, которые могут быть диспергируемыми в воде ("смачивающимися") или водорастворимыми. Пленки и покрытия, образованные из пленкообразующих растворов или жидкотекучих суспензий, особенно подходят для обработки семян. Активный ингредиент может быть (микро) инкапсулирован и затем превращен в суспензируемый или твердый препарат; в качестве варианта, взятый в целом препарат активного ингредиента может быть инкапсулирован (или "иметь слой покрытия"). Инкапсулирование может позволять контролировать или замедлять высвобождение активного ингредиента. Эмульгируемая гранула объединяет преимущества как препарата в форме эмульгируемого концентрата, так и препарата в форме сухих гранул. Высококонцентрированные композиции используют в основном в качестве промежуточных композиций для последующего приготовления препарата.

Распыляемые препараты обычно разбавляют в подходящей среде перед распылением. Такие жидкие и твердые препараты приготавливают так, чтобы их было легко разбавлять в среде для распыления, обычно воде, но в редких случаях, другой подходящей среде, такой как ароматический или парафиновый углеводород или растительное масло. Распыляемые объемы могут составлять от приблизительно одного до нескольких тысяч литров на гектар, но, более часто, от приблизительно десяти до нескольких сотен литров на гектар. Распыляемые препараты могут быть приготовлены в форме баковой смеси с водой или другой подходящей средой для некорневой обработки путем нанесения с самолета или нанесения на почву, или для нанесения на питательную среду для роста растения. Жидкие и сухие препараты могут быть введены в дозированном количестве непосредственно в системы капельного орошения и в борозду при посадке растений. Жидкие и сухие препараты могут быть нанесены на семена сельскохозяйственных культур и другой требуемой растительности путем обработки семян перед посадкой с целью защиты развития корневой системы и других находящихся в земле частей растений и/или листвы в результате системного усвоения.

Препараты обычно содержат эффективные количества активного ингредиента, разбавитель и поверхностно-активное вещество в диапазоне следующих количеств, которые в сумме составляют 100 процентов по массе.

	Массовый процент		
	Активный ингредиент	Разбавитель	Поверхностно-активное вещество

Вододиспергируемый и водорастворимые гранулы, таблетки и порошки	0,001-90	0-99,999	0-15
Масляные дисперсии, суспензии, эмульсии, растворы (в том числе эмульгируемые концентраты)	1-50	40-99	0-50
Дусты	1-25	70-99	0-5
Гранулы и пеллеты	0,001-99	5-99,999	0-15
Высококонцентрированные композиции	90-99	0-10	0-2

Твердые разбавители включают, например, глины, такие как бентонит, монтмориллонит, аттапульгит и каолин, гипс, целлюлозу, диоксид титана, оксид цинка, крахмал, декстрин, сахара (например, лактозу, сахароза), диоксид кремния, тальк, слюду, диатомит, мочевину, карбонат кальция, карбонат и бикарбонат натрия, и сульфат натрия. Типичные твердые разбавители описаны в справочнике Watkins et al., Handbook of Insecticide Dust Diluents и Carriers, 2nd Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jersey.

Жидкие разбавители включают, например, воду, N, N-диметилалканамиды (например, N, N-диметилформамид), лимонен, диметилсульфоксид, N-алкилпирролидоны (например, N-метилпирролидинон), алкилфосфаты (например, триэтилфосфат), этиленгликоль, триэтиленгликоль, пропиленгликоль, дипропиленгликоль, полипропиленгликоль, пропиленкарбонат, бутиленкарбонат, парафины (например, светлые минеральные масла, нормальные парафины, изопарафины), алкилбензолы, алкилнафталины, глицерин, глицерол триацетат, сорбит, ароматические углеводороды, деароматизированные алифатические углеводороды, алкилбензолы, алкилнафталины, кетоны, такие как циклогексанон, 2-гептанон, изофорон и 4-гидрокси-4-метил-2-пентанон, ацетаты, такие как изоамилацетат, гексилацетат, гептилацетат, октилацетат, нонилацетат, тридецилацетат и изоборнилацетат, другие эфиры, такие как алкилированные лактатные эфиры, эфир двухосновной кислоты с алкил- и арилбензоатами, γ- бутиролактон, и спирты, которые могут быть линейными, разветвленными, насыщенными или ненасыщенными, такие как метанол, этанол, н-пропанол, изопропиловый спирт, н-бутанол, изобутиловый спирт, н-гексанол, 2-этилгексанол, н-октанол, деканол, изодециловый спирт, изооктадеканол, цетиловый спирт, лауриловый спирт, тридециловый спирт, олеиловый спирт, циклогексанол, тетрагидрофурфуриловый спирт, диацетоновый спирт, крезол и бензиловый спирт. Жидкие разбавители также включают эфиры глицерина насыщенных и ненасыщенных жирных кислот (обычно, C6-C22), такие как масло из семян растений и масло из плодов растений (например, оливковое масло, касторовое масло, льняное масло, кунжутное масло, кукурузное (маисовое) масло,

арахисовое масло, подсолнечное масло, масло из виноградных косточек, сафлоровое масло, хлопковое масло, соевое масло, рапсовое масло, кокосовое масло и косточковое пальмовое масло), жиры животного происхождения (например, говяжье сало, свиное сало, свиной жир, тресковый печеночный жир, рыбий жир), и их смеси. Жидкие разбавители также включают алкилированные жирные кислоты (например, метилированные, этилированные, бутилированные), где жирные кислоты могут быть получены гидролизом эфиров глицерина из растительных и животных источников, и могут быть очищены дистилляцией. Типичные жидкие разбавители описаны в руководстве Marsden, Solvents Guide, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950.

Твердые и жидкие композиции по настоящему изобретению часто включают одно или более поверхностно-активных веществ. При добавлении к жидкости, поверхностно-активные вещества (называемые также "сурфактантами") обычно модифицируют, чаще всего, снижают поверхностное натяжение жидкости. В зависимости от природы гидрофильных и липофильных групп в молекуле поверхностно-активного вещества, поверхностно-активные вещества могут применяться в качестве смачивающих средств, диспергирующих средств, эмульгаторов или пеногасителей.

Поверхностно-активные вещества могут быть подразделены на неионные, анионные или катионные. Неионные поверхностно-активные вещества, применяемые для приготовления настоящих композиций, включают, но этим не ограничивая, алкоксилаты спиртов, такие как алкоксилаты спиртов на основе природных и синтетических спиртов (которые могут быть разветвленными или линейными), которые получают из спиртов и оксида этилена, оксида пропилена, оксида бутилена или их смесей; этоксилаты аминов, алканоламиды и этоксилированные алканоламиды; алкоксилированные триглицериды, такие как этоксилириванные соевое, касторовое и рапсовое масла; алкоксилаты алкилфенолов, такие как этоксилаты октилфенола, этоксилаты нонилфенола, этоксилаты динонилфенола и этоксилаты додецилфенола (полученные из фенолов и оксида этилена, оксида пропилена, оксида бутилена или их смесей); блок-полимеры, полученные из оксида этилена или оксида пропилена, и обратные блок-полимеры, в которых концевые блоки получают из оксида пропилена; этоксилированные жидкие кислоты; этоксилированные жирные эфиры и масла; этоксилированные метиловые эфиры; этоксилированный тристирилфенол (в том числе полученный из оксида этилена, оксида пропилена, оксида бутена или их смесей); эфиры жирных кислот, эфиры глицерина, производные на основе ланолина, полиэтоксилированные эфиры, такие как полиэтоксилированные эфиры жирных кислот и сорбитана, полиэтоксилированные эфиры жирных кислот и сорбита и полиэтоксилированные эфиры жирных кислот и глицерина; другие производные сорбитана, такие как такие как эфиры сорбитана; полимерные поверхностно-активные вещества, такие как статистические сополимеры, блок-сополимеры, алкидные полиэтиленгликолевые смолы, привитые или привитые гребнеподобные сополимеры и звездообразные полимеры; полиэтиленгликоли; эфиры полиэтиленгликоля и жирных кислот; поверхностно-активные вещества на основе

кремнийорганических соединений; и производные сахаров, такие как эфиры сахарозы, алкилполигликозиды и алкилполисахариды.

Применяемые анионные поверхностно-активные вещества включают, но этим не ограничивая, алкиларилсульфоновые кислоты и их соли; карбоксилированный спирт или этоксилаты алкилфенолов; производные дифенилсульфоната; лигнин и производные лигнина, такие как лигносульфонаты; малеиновую или янтарную кислоту или их ангидриды; олефинсульфонаты; фосфатные эфиры, такие как фосфатные эфиры алкоксилатов спиртов, фосфатные эфиры алкоксилатов алкилфенолов и фосфатные эфиры этоксилатов стирилфенола; поверхностно-активные вещества на основе белков; производные саркозина; сульфат эфира стирилфенола; сульфаты и сульфонаты масел и жирных кислот; сульфаты и сульфонаты этоксилированных алкилфенолов; сульфаты спиртов; сульфаты этоксилированных спиртов; сульфонаты аминов и амидов, такие как N, N-алкилтаураты; сульфонаты бензола, кумола, толуола, ксилола и додецил- и тридецилбензолов; сульфонаты конденсированных нафталинов; сульфонаты нафталина и алкилнафталина; сульфонаты фракционированных продуктов нефти; сульфосукциноматы; и сульфосукцинаты и их производные, такие как диалкилсульфосукцинатные соли.

Применяемые катионные поверхностно-активные вещества включают, но этим не ограничивая, амиды и этоксилированные амиды; амины, такие как N-алкилпропандиамины, трипропилентриамины и дипропилентетрамины, и этоксилированные амины, этоксилированные диамины и пропоксилированные амины (полученные из аминов и оксида этилена, оксида пропилена, оксида бутилена или их смесей); соли аминов, такие как аминацетаты, и соли диаминов; четвертичные аммониевые соли, такие как четвертичные соли, этоксилированные четвертичные соли и дичетвертичные соли; и оксиды аминов, такие как оксиды алкилдиметиламинов и оксиды бис-(2-гидроксиэтил)-алкиламинов.

Кроме того, в настоящих композициях могут применяться смеси неионных и анионных поверхностно-активных веществ или смеси неионных и катионных поверхностно-активных веществ. Неионные, анионные и катионные поверхностно-активные вещества и их рекомендованное применение описаны в ряде публикаций, в том числе в McCutcheon's Emulsifiers and Detergents, annual American and International Editions published by McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; Sisely and Wood, Encyclopedia of Surface Active Agents, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964; и A. S. Davidson and B. Milwidsky, Synthetic Detergents, Seventh Edition, John Wiley and Sons, New York, 1987.

Композиции по этому изобретению могут также содержать вспомогательные вещества и добавки, которые известны специалистам в данной области в качестве веществ, используемых при приготовлении препаратов (некоторые из которых могут выполнять также функцию твердых разбавителей, жидких разбавителей или поверхностно-активных веществ). Такие вспомогательные вещества и добавки могут регулировать pH (буферы), пенообразование в процессе приготовления препарата

(противовспениватели, такие как полиорганосилоксаны), осаждение активных ингредиентов (суспендирующее средство), вязкость (тиксотропные загустители), рост микроорганизмов в таре (противомикробные вещества), замерзание продукта (антифризы), цвет (дисперсии красителя/пигмента), вымывание (пленкообразователи или загустители), испарение (замедлители испарения) и другие свойства препаратов. Пленкообразователи включают, например, поливинилацетаты, сополимеры поливинилацетата, сополимер поливинилпирролидон-винилацетат, поливиниловые спирты, сополимеры поливинилового спирта и воски. Примеры вспомогательных веществ и добавок, применяемых при приготовлении препаратов, включают вспомогательные вещества и добавки, описанные в публикациях McCutcheon's Volume 2: Functional Materials, annual International and North American editions published by McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co. и PCT Publication WO 03/024222.

Соединение формулы **1** и любые другие активные ингредиенты обычно вводят в настоящие композиции путем растворения активного ингредиента в растворителе или путем измельчения в жидком или сухом разбавители. Растворы, в том числе эмульгируемые концентраты, могут быть приготовлены путем простого смешения ингредиентов. Если растворитель жидкой композиции, предназначенной для применения в форме эмульгируемого концентрата, является не смешивающимся с водой, то в этом случае обычно добавляют эмульгатор для эмульгирования содержащего активное вещество растворителя при разбавлении водой. Суспензии активного ингредиента с диаметром частиц вплоть до 2000 мкм могут быть подвергнуты мокрому помолу с использованием сред для размола для получения частиц со средним диаметром меньше 3 мкм. Водные суспензии могут быть приготовлены в форме готовых концентратов суспензий (смотрите, например, U.S. 3060084) или могут быть подвергнуты дополнительной обработке методом распылительной сушки с получением диспергируемых в воде гранул. Сухие препараты обычно требуют использование процессов сухого помола, которые позволяют достигать среднего диаметра частиц в диапазоне от 2 до 10 мкм. Дусты и порошки могут быть приготовлены путем смешения и обычно измельчения (например, с использованием молотковой мельницы или струйной мельница). Гранулы и брикеты могут быть приготовлены путем распыления активного материала на предварительно сформованные гранулированные носители или методом спекания. Смотрите публикации Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, December 4, 1967, pp 147-48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, pages 8-57 and following, and WO 91/13546. Брикеты могут быть приготовлены, как описано в U.S. 4172714. Вододиспергируемые и водорастворимые гранулы могут быть приготовлены, как описано в U.S. 4144050, U.S. 3920442 и DE 3246493. Таблетки могут быть приготовлены, как описано в U.S. 5180587, U.S. 5232701 и U.S. 5208030. Пленки могут быть приготовлены, как описано в GB 2095558 и U.S. 3299566.

Более подробную информацию по поводу приготовления препаратов можно найти в публикации T. S. Woods, "The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture" in Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge, T. Brooks and T. R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, pp. 120-133. Смотрите также публикации U.S. 3235361, Col. 6, line 16 through Col. 7, line 19 and Examples 10-41; U.S. 3309192, Col. 5, line 43 through Col. 7, line 62 and Examples 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138-140, 162-164, 166, 167 and 169-182; U.S. 2891855, Col. 3, line 66 through Col. 5, line 17 and Examples 1-4; Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pp 81-96; Hance et al., Weed Control Handbook, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989; и Developments in formulation technology, PJB Publications, Richmond, UK, 2000.

В приведенных далее примерах, все препараты приготавливают традиционными методами. Номера соединений обозначают соединения в таблицах показателей A-G. Предполагается, что специалист в данной области, используя представленное выше описание, может без проведения дополнительного исследования использовать настоящее изобретение в его самом полном объеме. В силу этого, представленные далее примеры следует истолковывать только как иллюстрации, и никоим образом их не следует считать в качестве ограничений для изобретения. Проценты являются процентами по массе, за исключением тех случаев, когда указано иное.

Пример A

Высококонцентрированный концентрат	
Соединение 1	98,5%
Силикагель	0,5%
Синтетический аморфный мелкодисперсный кремнезем	1,0%

Пример B

Смачивающийся порошок	
Соединение 3	65,0%
Эфир додецилфенола и полиэтиленгликоля	2,0%
Лигнинсульфонат натрия	4,0%
Алюмосиликат натрия	6,0%
Монтмориллонит (кальцинированный)	23,0%

Пример C

Гранула	
Соединение 8	10,0%

Гранулы аттапульгита (нелетучего вещества, 0,71/0,30 мм; сита U.S.S. No. 25-50)	90,0%

Пример D

Экструдируемый брикет	
Соединение 10	25,0%
Безводный сульфат натрия	10,0%
Неочищенный лигнинсульфонат кальция	5,0%
Алкилнафталинсульфонат натрия	1,0%
Кальциевый/магниевый бентонит	59,0%

Пример E

Эмульгируемый концентрат	
Соединение 11	10,0%
Гексаолеат полиоксиэтиленсорбитана	20,0%
Метиловый эфир C6-C10 жирной кислоты	70,0%

Пример F

Микроэмульсия	
Соединение 19	5,0%
Сополимер поливинилпирролидон-винилацетат	30,0%
Алкилполигликозид	30,0%
Глицерил моноолеат	15,0%
Вода	20,0%

Пример G

Обработка семян	
Соединение 20	20,00%
Сополимер поливинилпирролидон-винилацетат	5,00%
Кислый монтан воск	5,00%
Лигнинсульфонат кальция	1,00%
Блок-сополимеры полиоксиэтилен/полиоксипропилен	1,00%
Стеариловый спирт (POE 20)	2,00%
Полиорганосилан	0,20%
Окрашивающий красный краситель	0,05%
Вода	65,75%

Пример H

Удобрение в форме палочки	
Соединение 33	2,5%

Сополимер пирролидон-стирол	4,8%
Тристирилфенил 16-этоксилат	2,3%
Тальк	0,8%
Кукурузный крахмал	5,0%
Удобрение в форме с замедленным высвобождением	36,0%
Каолин	38,0%
Вода	10,6%

Пример I

Концентрат суспензии	
Соединение 34	35%
Блок-сополимер бутилполиоксиэтилен/полипропилен	4,0%
Сополимер стеариновая кислота/полиэтиленгликоль	1,0%
Стиролакриловый полимер	1,0%
Ксантановая камедь	0,1%
Пропиленгликоль	5,0%
Пеногаситель на основе кремнийорганики	0,1%
1,2-Бензизотиазолин-3-он	0,1%
Вода	53,7%

Пример J

Эмульсия в воде	
Соединение 39	10,0%
Блок-сополимер бутилполиоксиэтилен/полипропилен	4,0%
Сополимер стеариновая кислота/полиэтиленгликоль	1,0%
Стиролакриловый полимер	1,0%
Ксантановая камедь	0,1%
Пропиленгликоль	5,0%
Пеногаситель на основе кремнийорганики	0,1%
1,2-Бензизотиазолин-3-он	0,1%
Углеводород на основе ароматической фракции нефти	20,0
Вода	58,7%

Пример K

Масляная дисперсия	
Соединение 50	25%
Гексаолеат полиоксиэтиленсорбитана	15%

Органически модифицированная бентонитовая глина	2,5%
Метиловый эфир жирной кислоты	57,5%

Пример L

Суспоэмульсия	
Соединение 61	10,0%
Имидаклоприд	5,0%
Блок-сополимер бутилполиоксиэтилен/полипропилен	4,0%
Сополимер стеариновая кислота/полиэтиленгликоль	1,0%
Стиролакриловый полимер	1,0%
Ксантановая камедь	0,1%
Пропиленгликоль	5,0%
Пеногаситель на основе кремнийорганики	0,1%
1,2-Бензизотиазолин-3-он	0,1%
Углеводород на основе ароматической фракции нефти	20,0%
Вода	53,7%

Пример M

Концентрат суспензии	
Соединение 67	35%
Блок-сополимер бутилполиоксиэтилен/полипропилен	4,0%
Сополимер стеариновая кислота/полиэтиленгликоль	1,0%
Стиролакриловый полимер	1,0%
Ксантановая камедь	0,1%
Пропиленгликоль	5,0%
Пеногаситель на основе кремнийорганики	0,1%
1,2-Бензизотиазолин-3-он	0,1%
Вода	53,7%

Пример N

Эмульсия в воде	
Соединение 69	10,0%
Блок-сополимер бутилполиоксиэтилен/полипропилен	4,0%
Сополимер стеариновая кислота/полиэтиленгликоль	1,0%
Стиролакриловый полимер	1,0%
Ксантановая камедь	0,1%
Пропиленгликоль	5,0%

Пеногаситель на основе кремнийорганики	0,1%
1,2-Бензизотиазолин-3-он	0,1%
Углеводород на основе ароматической фракции нефти	20,0
Вода	58,7%

Пример O

Масляная дисперсия	
Соединение 70	25%
Гексаолеат полиоксиэтиленсорбитана	15%
Органически модифицированная бентонитовая глина	2,5%
Метиловый эфир жирной кислоты	57,5%

Пример P

Суспоэмульсия	
Соединение 71	10,0%
Имидаклоприд	5,0%
Блок-сополимер бутилполиоксиэтилен/полипропилен	4,0%
Сополимер стеариновая кислота/полиэтиленгликоль	1,0%
Стиролакриловый полимер	1,0%
Ксантановая камедь	0,1%
Пропиленгликоль	5,0%
Пеногаситель на основе кремнийорганики	0,1%
1,2-Бензизотиазолин-3-он	0,1%
Углеводород на основе ароматической фракции нефти	20,0%
Вода	53,7%

Соединения по этому изобретению проявляют активность в отношении широкого спектра беспозвоночных вредителей. Эти сельскохозяйственные вредители включают беспозвоночных вредителей, обитающих в различных средах, таких как, например, листва растений, корневая система, почва, собранный урожай или другие пищевые продукты, или строительные конструкции. Эти сельскохозяйственные вредители включают, например, беспозвоночных вредителей, питающихся листвой (в том числе листьями, стеблями, цветками и плодами), семенами, древесиной или текстильными волокнами, и вследствие этого вызывающих повреждение или наносящих вред, например, растущим или хранимым сельскохозяйственным культурам, лесам, тепличным культурам, декоративным растениям, выращиваемым в питомниках растениям, хранимым пищевым продуктам или продуктам из волокон, или жилым помещениям или другим сооружениям или их содержимому. Для специалистов в данной области является очевидным, что не все

соединения в равной степени эффективны при применении их на всех стадиях развития всех сельскохозяйственных вредителей.

Таким образом, эти представленные соединения и композиции могут применяться в агротехнических целях для защиты полевых культур от растениеядных беспозвоночных вредителей, а также в неагротехнических целях для защиты других садовых культур и растений от растениеядных беспозвоночных вредителей. Это применение включает защиту зерновых культур и других растений (то есть как агротехнических, так и неагротехнических), которые содержат генетический материал, введенный методами генной инженерии (то есть трансгенных) или модифицированный путем мутагенеза для придания им желательных характеристик. Примеры таких характеристик включают переносимость воздействия гербицидов, устойчивость к растениеядным вредителям (например, насекомым, клещам, тлям, паукам, нематодам, улиткам, фитопатогенным грибам, бактериям и вирусам), усиленный рост растений, повышенная переносимость неблагоприятных условий произрастания, таких как высокие или низкие температуры, низкая или высокая влажность почвы и высокая засоленность, усиленное цветение или плодоношение, более высокая урожайность, более быстрое созревание, более высокое качество и/или питательная ценность собранного продукта, или улучшенные свойства хранения или переработки собранных продуктов. Трансгенные растения могут быть модифицированы для придания им сразу многих желательных характеристик. Примеры растений, которым были обеспечены желательные характеристики методами генной инженерии или путем мутагенеза, включают сорта кукурузы, хлопка, сои и картофеля, экспрессирующие инсектицидный токсин Bacillus thuringiensis, такие как YIELD GARD®, KNOCKOUT®, STARLINK®, BOLLGARD®, NuCOTN® и NEWLEAF®, INVICTA RR2 PROTM, и гербицидостойкие сорта кукурузы, хлопка, сои и рапса, такие как ROUNDUP READY®, LIBERTY LINK®, IMI®, STS® и CLEARFIELD®, а также зерновые культуры, экспрессирующие N-ацетилтрансферазу (GAT) для обеспечения устойчивости к гербициду на основе глифосата, или зерновые культуры, содержащие ген HRA, обеспечивающий устойчивость к гербицидам, ингибирующим ацетолактатсинтазу (ALS). Представленные соединения и композиции могут характеризоваться усиленным действием, обладая характеристиками, приданные им методами генной инженерии или модифицированными путем мутагенеза, благодарю чему усиливается фенотипическая экспрессия или эффективность характеристик или повышается эффективность представленных соединений и композиций при их использовании для борьбы с беспозвоночным вредителем. В частности, представленные соединения и композиции могут характеризоваться усиленным действием в результате фенотипической экспрессии белков или других природных продуктов, токсичных для беспозвоночных вредителей, с обеспечением более высокой, чем просто аддитивной, эффективности борьбы с этими сельскохозяйственными вредителями.

Композиции по этому изобретению могут также необязательно включать питательные вещества для растений, например, композицию удобрения, содержащую, по

меньшей мере, одно питательное вещество для растений, выбранное из азота, фосфора, калия, серы, кальция, магния, железа, меди, бора, марганца, цинка и молибдена. Следует особо отметить композиции, включающие, по меньшей мере, одну композицию удобрения, содержащую, по меньшей мере, одно питательное вещество для растений, выбранное из азота, фосфора, калия, серы, кальция и магния. Композиции по настоящему изобретению, которые дополнительно содержат, по меньшей мере, одно питательное вещество для растений, могут находиться в форме жидкостей или твердых веществ. Следует отметить твердые препараты в форме гранул, небольших палочек или таблеток. Твердые препараты, включающие композицию удобрения, могут быть приготовлены путем смешения соединения или композиции по настоящему изобретению с композицией удобрения в сочетании с другими ингредиентами, входящими в состав препарата, и затем путем изготовления препарата с помощью таких методов, как гранулирование или экструзия. В качестве варианта, твердые препараты могут быть приготовлены путем разбрызгивания раствора или суспензии соединения или композиции по настоящему изобретению в летучем растворителе на предварительно подготовленную композицию удобрения в форме размеростабильных смесей, например, гранул, небольших палочек или таблеток, и затем испарения растворителя.

Неагротехническое применение относится к борьбе с беспозвоночным вредителем на территориях, не являющихся полями выращивания сельскохозяйственных культур. Неагротехническое применение представленных соединений и композиций включает борьбу с беспозвоночным вредителем зерна в зернохранилищах, продовольствия и других пищевых продуктов, и текстильных изделий, таких как одежда и ковры. Неагротехническое применение представленных соединений и композиций включает также борьбу с беспозвоночным вредителем декоративных растений, лесов, в складах, вдоль обочин и железнодорожных полос отчуждения, и газонов, таких как лужайки, поля для гольфа и пастбищные угодья. Неагротехническое применение представленных соединений и композиций включает также борьбу с беспозвоночным вредителем в жилых помещениях и других сооружениях, которые могут занимать люди и/или домашние животные, сельскохозяйственные животные, содержащиеся на ферме животные, содержащиеся в зоопарках животные или другие животные. Неагротехническое применение представленных соединений и композиций включает также борьбу с вредными насекомыми, такими как термиты, которые могут повреждать древесину или другие конструкционные материалы, используемые внутри зданий.

Примеры агротехнических или неагротехнических беспозвоночных вредителей включают яйца, личинки и взрослых особей отряда Lepidoptera (чешуекрылых), таких как гусеницы, совки, пяденицы, и подсемейства Heliothines (гелиотиновых) семейства Noctuidae (совки) (например, точильщика стеблевого розового (Sesamia inferens Walker), огневки кукурузной стеблевой (Sesamia nonagrioides Lefebvre), южной совки (Spodoptera eridania Cramer), травяной совки (Spodoptera frugiperda J. E. Smith), малой совки (Spodoptera exigua Hübner), хлопковой совки (Spodoptera littoralis Boisduval), совки

полосатой желто-бурой (Spodoptera ornithogalli Guenée), совки-ипсилон (Agrotis ipsilon Hufnagel), гусеницы бархатных бобов (Anticarsia gemmatalis Hübner), зеленой плодожорки (Lithophane antennata Walker), капустной совки (Barathra brassicae Linnaeus), соевой пяденицы (Pseudoplusia includens Walker), совки ни (Trichoplusia ni Hübner), табачной совки (Heliothis virescens Fabricius)); точильщиков, чехликовых молей, гусениц, строящих паутинное гнездо, еловых шишковых листоверток, гусениц бабочки-капустницы и вредителей, скелетирующих листья, из семейства Pyralidae (например, мотылька кукурузного (Ostrinia nubilalis Hübner), пупочного апельсинового червя (Amyelois transitella Walker), огневки кукурузной (Crambus caliginosellus Clemens), гусениц луговых мотыльков (Pyralidae: Crambinae), таких как луговой мотылек (Herpetogramma licarsisalis Walker), точильщика стеблей сахарного тростника (Chilo infuscatellus Snellen), томатного малого точильщика (Neoleucinodes elegantalis Guenée), зеленой листовертки (Cnaphalocerus medinalis), виноградной листовертки (Desmia funeralis Hübner), дынной гусеницы (Diaphania nitidalis Stoll), личинки капустного центра (Helluala hydralis Guenée), желтого стеблевого точильщика (Scirpophaga incertulas Walker), сверлильщика ранних побегов (Scirpophaga infuscatellus Snellen), белого стеблевого точильщика (Scirpophaga innotata Walker), сверлильщика верхних побегов (Scirpophaga nivella Fabricius), темноголовой рисовой огневки (Chilo polychrysus Meyrick), полосатой рисовой огневки (Chilo suppressalis Walker), ложногусеницы соцветия капусты (Crocidolomia binotalis English)); листоверток, листоверток-почкоедов, гусениц семенных и плодожорок из семейства Tortricidae (например, плодожорки яблоневой (Cydia pomonella Linnaeus), листовертки виноградной (Endopiza viteana Clemens), листовертки восточной персиковой (Grapholita molesta Busck), цитрусовой ложной моли дикого яблока (Cryptophlebia leucotreta Meyrick), цитрусовой совки (Ecdytolopha aurantiana Lima), краснополосной листовертки (Argyrotaenia velutinana Walker), волнистой листовертки (Choristoneura rosaceana Harris), светло-коричневой яблочной моли (Epiphyas postvittana Walker), европейской виноградной моли (Eupoecilia ambiguella Hübner), вертуньи почковой (Pandemis pyrusana Kearfott), всеядной листовертки (Platynota stultana Walsingham), листовертки кривоусой смородинной (Pandemis cerasana Hübner), листовертки кривоусой ивовой (Pandemis heparana Denis & Schiffermüller)) и многих других экономически важных представителей отряда Lepidoptera (например, моли капустной (Plutella xylostella Linnaeus), розового хлопкового червя (Pectinophora gossypiella Saunders), шелкопряда непарного (Lymanthria dispar Linnaeus), плодожорки персиковой (Carposina niponensis Walsingham), плодожорки урюковой (Anarsia lineatella Zeller), моли картофельной клубневой (Phthorimaea operculella Zeller), моли-пестрянки плодовой нижнесторонней (Lithocolletis blancardella Fabricius), азиатской яблочной моли-пестрянки (Lithocolletis ringoniella Matsumura), рисовой листовертки (Lerodea eufala Edwards), моли кружковой боярышниковой (Leucoptera scitella Zeller)); яйца, личинки и взрослых особей представителей отряда Blattodea, в том числе тараканов из семейств Blattellidae и Blattidae (например, таракана черного (Blatta orientalis Linnaeus), таракана азиатского (Blatella

asahinai Mizukubo), таракана рыжего (Blatella germanica Linnaeus), таракана полосатого (Supella longipalpa Fabricius), таракана американского (Periplaneta americana Linnaeus), таракана коричневого (Periplaneta brunnea Burmeister), таракана мадейрского (Leucophaea maderae Fabricius), бурого таракана (Periplaneta fuliginosa Service), австралийского таракана (Periplaneta australasiae Fabr.), таракана серого (Nauphoeta cinerea Olivier) и гладкого таракана (Symploce pallens Stephens)); яйца, личинки, питающиеся листвой, питающиеся плодами, питающиеся корнями, питающиеся семенами и питающиеся пузырчатой тканью, а также взрослых особей представителей отряда Coleoptera, в том числе долгоносиков из семейств Anthribidae, Bruchidae и Curculionidae (например, долгоносика хлопкового (Anthonomus grandis Boheman), долгоносика рисового водяного (Lissorhoptrus oryzophilus Kuschel), долгоносика амбарного (Sitophilus granarius Linnaeus), долгоносика рисового (Sitophilus oryzae Linnaeus), долгоносика мятлика однолетнего (Listronotus maculicollis Dietz), долгоносика мятлика (Sphenophorus parvulus Gyllenhal), рыскающего долгоносика (Sphenophorus venatus vestitus), денверского долгоносика (Sphenophorus cicatristriatus Fahraeus)); земляных блошек, картофельных блошек, корнеедов, листоедов, колорадских жуков и листовых минеров из семейства Chrysomelidae (например, колорадского жука (Leptinotarsa decemlineata Say), западного кукурузного жука (Diabrotica virgifera LeConte)); хрущей и других жуков из семейства Scarabaeidae (например, хрущика японского (Popillia japonica Newman), хрущика восточного (Anomala orientalis Waterhouse, Exomala orientalis (Waterhouse) Baraud), северного хрущика (Cyclocephala borealis Arrow), южного хрущика (Cyclocephala immaculata Olivier или C. lurida Bland), жука-навозника и майского хруща (Aphodius spp.), черного хруща (Ataenius spretulus Haldeman), хруща блестящего зеленого (Cotinis nitida Linnaeus), хрущика азиатского садового (Maladera castanea Arrow), майского/июньского хрущей (Phyllophaga spp.) и хруща обыкновенного (Rhizotrogus majalis Razoumowsky)); кожеедов из семейства Dermestidae; проволочников из семейства Elateridae; жуков-короедов из семейства Scolytidae и мучных хрущаков из семейства Tenebrionidae.

Кроме того, агротехнические и неагротехнические вредители включают яйца, взрослых особей и личинок представителей отряда Dermaptera, в том числе уховерток из семейства Forficulidae (например, уховертку обыкновенную (Forficula auricularia Linnaeus), уховертку черную (Chelisoches morio Fabricius)); яйца, неполовозрелых особей, взрослых особей и нимф представителей отрядов Hemiptera и Homoptera, таких как клопы-слепняки из семейства Miridae, цикады из семейства Cicadidae, цикадки (например, Empoasca spp.) из семейства Cicadellidae, постельные клопы (например, Cimex lectularius Linnaeus) из семейства Cimicidae, фонарницы из семейств Fulgoroidae и Delphacidae, горбатки из семейства Membracidae, листоблошки из семейства Psyllidae, белокрылки семейства Aleyrodidae, тли из семейства Aphididae, филлоксеры из семейства Phylloxeridae, червецы из семейства Pseudococcidae, щитовки из семейств Coccidae, Diaspididae и Margarodidae, клопы-кружевницы из семейства Tingidae, клопы-щитники из семейства Pentatomidae, клопы-черепашки (например, пшеничный клоп-черепашка (Blissus leucopterus hirtus

Montandon) и южный клоп-черепашка (Blissus insularis Barber)) и другие наземники из семейства Lygaeidae, пенницы из семейства Cercopidae, тыквенные клопы из семейства Coreidae и красноклопы, в том числе хлопковые красноклопы, из семейства Pyrrhocoridae.

Агротехнические и неагротехнические вредители также включают яйца, личинок, куколки и взрослых особей представителей отряда Acari (клещи), таких как паутинный клещик и красный клещ из семейства Tetranychidae (например, красный плодовый клещ (Panonychus ulmi Koch), клещик паутинный двупятнистый (Tetranychus urticae Koch), клещик МакДаниэла (Tetranychus mcdanieli McGregor)), плоские клещи из семейства Tenuipalpidae (например, клещик плоский цитрусовый (Brevipalpus lewisi McGregor)), ржавчинные и почковые клещи из семейства Eriophyidae и другие питающиеся листвой клещи и клещи, опасные для здоровья человека и животных, например, пылевые клещи из семейства Epidermoptidae, железницы из семейства Demodicidae, зерновые клещи из семейства Glycyphagidae, клещи из семейства Ixodidae (например, олений клещ (Ixodes scapularis Say), австралийский парализующий клещ (Ixodes holocyclus Neumann), иксодовый клещ изменчивый (Dermacentor variabilis Say), клещ американский (Amblyomma americanum Linnaeus)) и клещи из семейства Argasidae, общеизвестные как мягкие клещи (например, аргасовый клещ (Ornithodoros turicata), обыкновенный персидский клещ (Argas radiatus)); конские клещи и чесоточные зудни из семейств Psoroptidae, Pyemotidae и Sarcoptidae; яйца, взрослых и неполовозрелых особей представителей отряда Orthoptera, в том числе виды саранчи, цикад и сверчков (например, виды кобылок (например, Melanoplus sanguinipes Fabricius, M. differentialis Thomas), виды американской саранчи (например, Schistocerca americana Drury), саранчу пустынную (Schistocerca gregaria Forskal), мигрирующую саранчу (Locusta migratoria Linnaeus), кустовую саранчу (Zonocerus spp.), сверчка домового (Acheta domesticus Linnaeus), виды медведок (например, бурую медведку (Scapteriscus vicinus Scudder) и южную медведку (Scapteriscus borellii Giglio-Tos)); яйца, взрослых особей и неполовозрелых особей представителей отряда Diptera, в том числе минирующих мух (например, Liriomyza spp., таких как томатный листовой минер (Liriomyza sativae Blanchard)), мелких двукрылых насекомых, плодовых мушек (Tephritidae), мушек шведских (например, Oscinella frit Linnaeus), живущих в почве личинок насекомых, комнатных мух (например, Musca domestica Linnaeus), журчалок домашних (например, Fannia canicularis Linnaeus, F. femoralis Stein), жигалок осенних (например, Stomoксis calcitrans Linnaeus), мух обыкновенных полевых, жигалок коровьих малых, падальных мух (например, Chrysomya spp., Phormia spp.) и других мускоидных летающих вредителей, слепней (например, Tabanus spp.), оводов (например, Gastrophilus spp., Oestrus spp.), личинок бычьего полосатого овода (например, Hypoderma spp.), оленьих мух (например, Chrysops spp.), рунца овечьего (например, Melophagus ovinus Linnaeus) и других Brachycera, комаров (например, Aedes spp., Anopheles spp., Culex spp.), мошек (например, Prosimulium spp., Simulium spp.), мокрецов, москитов, сциарид и других Nematocera; яйца, взрослых особей и неполовозрелых особей представителей отряда Thysanoptera, в том числе трипса

табачного (Thrips tabaci Lindeman) и других питающихся листвой трипсов; насекомых-вредителей из отряда Hymenoptera, в том числе муравьев из семейства Formicidae, в том числе флоридского муравья-древоточца (Camponotus floridanus Buckley), красного муравья-древоточца (Camponotus ferrugineus Fabricius), муравья-древоточца пенсильванского (Camponotus pennsylvanicus De Geer), белоногого муравья (Technomyrmex albipes fr. Smith), большеголовых муравьев (Pheidole sp.), муравья-призрака (Tapinoma melanocephalum Fabricius); фараонового муравья (Monomorium pharaonis Linnaeus), муравья огненного малого (Wasmannia auropunctata Roger), муравья Рихтера (Solenopsis geminate Fabricius), красного муравья Рихтера (Solenopsis invicta Buren), муравья аргентинского (Iridomyrmex humilis Mayr), паратрехину (Paratrechina longicornis Latreille), муравья дернового (Тетрамorium caespitum Linnaeus), кукурузного муравья (Lasius alienus Förster) и пахучего домового муравья (Tapinoma sessile Say). Другие представители отряда Hymenoptera включают пчел (в том числе пчел-плотников), шершней, настоящих ос, роющих ос и пилильщиков (Neodiprion spp.; Cephus spp.); насекомые-вредители из отряда Isoptera включают термитов из семейств Termitidae (например, Macrotermes sp., Odontotermes obesus Rambur), Kalotermitidae (например, Cryptotermes sp.) и Rhinotermitidae (например, Reticulitermes sp., Coptotermes sp., Heterotermes tenuis Hagen), восточного подземного термита (Reticulitermes flavipes Kollar), западного подземного термита (Reticulitermes hesperus Banks), тайваньского подземного термита (Coptotermes formosanus Shiraki), вест-индийского сухо-деревянного термита (Incisitermes immigrans Snyder), сухо-деревянного термита (Cryptotermes brevis Walker), сухо-деревянного пьяного термита (Incisitermes snyderi Light), южного подземного термита (Reticulitermes virginicus Banks), западного сухо-деревянного термита (Incisitermes minor Hagen), древесных термитов, таких как Nasutitermes sp., и других экономически важных термитов; насекомые-вредители из отряда Thysanura включают таких насекомых, как чешуйница (Lepisma saccharina Linnaeus) и термобия домашняя (Thermobia domestica Packard); насекомые-вредители из отряда Mallophaga включают головную вошь (Pediculus humanus capitis De Geer), нательную вошь (Pediculus humanus Linnaeus), куриную вошь (Menacanthus stramineus Nitszch), власоеда собачьего (Trichodectes canis De Geer), пухоеда куриного пестробрюхого (Goniocotes gallinae De Geer), вошь овечью (Bovicola ovis Schrank), вошь бычью (Haematopinus eurysternus Nitzsch), вошь рогатого скота длинноносую (Linognathus vituli Linnaeus) и других сосущих и грызущих паразитарных вшей, которые нападают на людей и животных; насекомые-вредители из отряда Siphonoptera включают крысиную блоху (Xenopsylla cheopis Rothschild), кошачью блоху (Ctenocephalides felis Bouche), собачью блоху (Ctenocephalides canis Curtis), куриную блоху (Ceratophyllus gallinae Schrank), блоху домашней птицы (Echidnophaga gallinacea Westwood), блоху человеческую (Pulex irritans Linnaeus) и других блох, поражающих млекопитающих и птиц. Другие охватываемые членистоногие вредители включают пауков из отряда Araenae, таких как коричневый паук-затворник (Loxcosceles reclusa Gertsch & Mulaik) и паук черная вдова (Latrodectus mactans Fabricius), а также многоножек

из отряда Scutigeromorpha, таких как мухоловка обыкновенная (Scutigera coleoptrata Linnaeus).

Примеры беспозвоночных вредителей зерна, хранящегося в зернохранилище, крупного зернового мотылька (Prostephanus truncatus), мелкого зернового точильщика (Rhyzopertha dominica), рисового долгоносика (Stiophilus oryzae), кукурузного долгоносика (Stiophilus zeamais), зерновку китайскую (Callosobruchus maculatus), хрущака каштанового (Tribolium castaneum), долгоносика амбарного (Stiophilus granarius), моль индийскую мучную (Plodia interpunctella), хрущака мучного (Ephestia kuhniella) и мукоеда малого или рыжего (Cryptolestis ferrugineus).

Соединения по этому изобретению обладают активностью в отношении вредителей из отряда Lepidoptera (например, Alabama argillacea Hübner (хлопковой совки), Archips argyrospila Walker (листовертки плодовых деревьев), A. rosana Linnaeus (листовертки резанной) и других видов Archips, Chilo suppressalis Walker (сверлильщика рисового стеблевого), Cnaphalocrosis medinalis Guenée (листовертки рисовой), Crambus caliginosellus Clemens (огневки кукурузной корневой), Crambus teterrellus Zincken (бабочки травяной), Cydia pomonella Linnaeus (плодожорки яблонной), Earias insulana Boisduval (шиповатого червя), Earias vittella Fabricius (совки пятнистой), Helicoverpa armigera Hübner (коробочного червя), Helicoverpa zea Boddie (совки хлопковой), Heliothis virescens Fabricius (табачной листовертки), Herpetogramma licarsisalis Walker (лугового мотылька), Lobesia botrana Denis & Schiffermüller (листовертки виноградной), Pectinophora gossypiella Saunders (розового коробочного червя), Phyllocnistis citrella Stainton (минирующей цитрусовой моли), Pieris brassicae Linnaeus (капустной белянки), Pieris rapae Linnaeus (белянки репной), Plutella xylostella Linnaeus (моли капустной), Spodoptera exigua Hübner (совки малой), Spodoptera litura Fabricius (азиатской хлопковой совки, гроздевой листовертки), Spodoptera frugiperda J.E. Smith (совки травяной), Trichoplusia ni Hübner (совки ни) и Tuta absoluta Meyrick (томатной моли)).

Соединения по этому изобретению обладают активностью в отношении вредителей из отряда Homoptera, включающих Acyrthosiphon pisum Harris (тлю гороховую), Aphis craccivora Koch (тлю люцерновую), Aphis fabae Scopoli (тлю бобовую), Aphis gossypii Glover (тлю хлопковую, тлю бахчевую), Aphis pomi De Geer (тлю яблонную), Aphis spiraecola Patch (тлю таволговую), Aulacorthum solani Kaltenbach (тлю картофельную), Chaetosiphon fragaefolii Cockerell (тлю земляничную), Diuraphis noxia Kurdjumov/Mordvilko (русскую пшеничную тлю), Dysaphis plantaginea Paaserini (тлю яблоневую розовую), Eriosoma lanigerum Hausmann (тлю яблонную кровяную), Hyalopterus pruni Geoffroy (тлю мучнистую сливовую), Lipaphis erysimi Kaltenbach (тлю горчичную листовую), Metopolophium dirrhodum Walker (тлю злаковую), Macrosiphum euphorbiae Thomas (тлю картофельную листовую), Myzus persicae Sulzer (персиковую тлю, зеленую персиковую тлю), Nasonovia ribisnigri Mosley (салатную тлю), Pemphigus spp. (корневые тли и галловые тли), Rhopalosiphum maidis Fitch (тлю кукурузную листовую), Rhopalosiphum padi Linnaeus (тлю черемуховую), Schizaphis graminum Rondani (тлю

злаковую), Sitobion avenae Fabricius (тлю большую злаковую), Therioaphis maculata Buckton (тлю клеверную), Toxoptera aurantii Boyer de Fonscolombe (тлю цитрусовую) и Toxcoptera citricida Kirkaldy (тлю цитрусовую коричневую); Adelges spp. (хермесов); Phylloxera devastatrix Pergande (филлоксеру гикори); Bemisia tabaci Gennadius (белокрылку табачную, белокрылку бататовую), Bemisia argentifolii Bellows and Perring (белокрылку магнолиевую), Dialeurodes citri Ashmead (белокрылку цитрусовую) и Trialeurodes vaporariorum Westwood (белокрылку тепличную); Empoasca fabae Harris (цикадку картофельную), Laodelphax striatellus Fallen (малую коричневую цикадку), Macrolestes quadrilineatus Forbes (астровую цикадку), Nephotettix cinticeps Uhler (зеленую цикадку), Nephotettix nigropictus Stål (рисовую цикадку), Nilaparvata lugens Stål (коричневую цикадку), Peregrinus maidis Ashmead (кукурузную цикадку), Sogatella furcifera Horvath (цикадку белоспинную), Sogatodes orizicola Muir (дельфацида рисового), Typhlocyba pomaria McAtee (белую яблонную цикадку), Erythroneoura spp. (виноградных цикадок); Magicidada septendecim Linnaeus (периодическую цикаду); Icerya purchasi Maskell (червеца австралийского желобчатого), Quadraspidiotus perniciosus Comstock (щитовку калифорнийскую); Planococcus citri Risso (червеца цитрусового); Pseudococcus spp. (комплекса других мучнистых червецов); Cacopsylla pyricola Foerster (медяницу грушевую), Trioza diospyri Ashmead (листоблошку хурмовую).

Соединения по настоящему изобретению обладают активностью в отношении представителей отряда Hemiptera, включающих Acrosternum hilare Say (клопа-щитника), Anasa tristis De Geer (клопа-ромбовика печального), Blissus leucopterus Say (клопа-черепашки), Cimex lectularius Linnaeus (клопа постельного), Corythuca gossypii Fabricius (клопа хлопкового), Cyrtopeltis modesta Distant (томатного клопа), Dysdercus suturellus Herrich-Schäffer (красноклопа хлопкового), Euchistus servus Say (коричневой цикадки), Euchistus variolarius Palisot de Beauvois (щитника однопятнистого), Graptosthetus spp. (комплекса наземников), Leptoglossus corculus Say (клопа-краевика семян сосны), Lygus lineolaris Palisot de Beauvois (клопа полевого), Nezara viridula Linnaeus (зеленого овощного клопа), Oebalus pugnax Fabricius (клопа-щитника рисового), Oncopeltus fasciatus Dallas (клопа-солдатика), Pseudatomoscelis seriatus Reuter (травяного клопа хлопкового). Другие отряды насекомых, борьбу с которыми осуществляют с помощью твердых форм соединения 1, включают Thysanoptera (например, Frankliniella occidentalis Pergande (трипса цветочного западного), Scirthothrips citri Moulton (трипса цитрусового), Sericothrips variabilis Beach (трипса соевого) и Thrips tabaci Lindeman (трипса лукового); а также отряд Coleoptera (например, Leptinotarsa decemlineata Say (колорадского жука картофельного), Epilachna varivestis Mulsant (зерновку бобовую мексиканскую) и проволочников из родов Agriotes, Athous или Limonius).

Следует отметить применение соединений по этому изобретению для борьбы с молью капустной (Plutella xylostella). Следует отметить применение соединений по этому изобретению для борьбы с совкой травяной (Spodoptera frugiperda). Следует отметить применение соединений по этому изобретению для борьбы с западным цветочным

трипсом (Frankliniella occidentalis). Следует отметить применение соединений по этому изобретению для борьбы с цикадкой картофельной (Empoasca fabae). Следует отметить применение соединений по этому изобретению для борьбы с кукурузным дельфацидом (Peregrinus maidis). Следует отметить применение соединений по этому изобретению для борьбы с бахчевой тлей (Aphis gossypii). Следует отметить применение соединений по этому изобретению для борьбы с тлей персиковой зеленой (Myzus persicae). Следует отметить применение соединений по этому изобретению для борьбы с табачной белокрылкой (Bemisia tabaci).

Соединения по настоящему изобретению могут также применяться для увеличения силы роста сельскохозяйственной культуры. Этот способ включает контактирование сельскохозяйственной культуры (например, листвы, цветков, плодов или корней) или семян, из которых выращивают сельскохозяйственную культуру, с соединением формулы **1** в количестве, достаточном для достижения требуемого эффекта увеличения силы роста (то есть в биологически эффективном количестве). Обычно соединение формулы **1** применяют в форме приготовленной композиции. Несмотря на то, что соединение формулы **1** часто наносят непосредственно на сельскохозяйственную культуру или ее семена, тем не менее, оно может быть нанесено на местоположение сельскохозяйственной культуры, то есть на место среды обитания сельскохозяйственной культуры, в частности, на часть среды обитания, которая находится в непосредственной близости, что позволяет соединению формулы **1** мигрировать к сельскохозяйственной культуре. Местоположение, подходящее для этого способа нанесения, чаще всего включает среду для выращивания (то есть среду, обеспечивающую растение питательными веществами), обычно, почву, в которой выращивают растение. Соответственно, обработка сельскохозяйственной культуры с целью увеличения силы роста сельскохозяйственной культуры включает контактирование сельскохозяйственной культуры, семян, из которых выращивают сельскохозяйственную культуру, или местоположения сельскохозяйственной культуры с биологически эффективным количеством соединения формулы **1**.

Увеличения силы роста сельскохозяйственной культуры может приводить к одному или более из следующих обнаруживаемых эффектов: (a) оптимальная приживаемость сельскохозяйственной культуры, характеризующаяся отличным прорастанием семян, появлением всходов и устойчивостью сельскохозяйственной культуры к полеганию; (b) усиленный рост сельскохозяйственной культуры, характеризующийся быстрым и полноценным ростом листвы (например, измеряемым индексом листовой поверхности), высотой растения, числом отростков (например, для риса), массой корневой системы и общей массы сухого вещества вегетативной массы сельскохозяйственной культуры; (c) улучшение урожайности, характеризующееся временем для цветения, продолжительностью цветения, числом цветков, суммарным накоплением биомассы (то есть урожайностью) и/или степенью пригодности произведенных плодов или зерна для продажи (то есть качеством произведенной продукции); (d) повышенная способность сельскохозяйственной культуры противостоять

или предотвращать инфекционные заболевания растений и заражения членистоногими, нематодными или мягкотелами вредителями; и (e) повышенная способность сельскохозяйственной культуры противостоять неблагоприятным воздействиям окружающей среды, таким как воздействия экстремальных температур, неблагоприятной влажности или фитотоксичных химических веществ.

Соединения по настоящему изобретению могут увеличивать силу роста подвергнутых обработке растений по сравнению с необработанными растениями в результате уничтожения или же предотвращения питания растительноядных беспозвоночных вредителей в среде обитания растений. При отсутствии такой борьбы с растительноядными беспозвоночными вредителями, вредители снижают силу роста растения в результате потребления ими растительной ткани или сока растения, или распространения патогенов растений, таких как вирусы. Даже в отсутствии растительноядных беспозвоночных вредителей, соединения по изобретению могут увеличивать силу роста растений в результате модификации метаболизма растений. Обычно, сила роста сельскохозяйственной культуры будет наиболее значительно повышаться в результате обработки растения соединением по изобретению, если растение выращивают в неидеальный окружающей среде, то есть в среде, включающей один или более аспектов, неблагоприятных для достижения растениями полного генетического потенциала, который мог бы быть достигнут в идеальной окружающей среде.

Следует отметить способ увеличения силы роста сельскохозяйственной культуры, где сельскохозяйственную культуру выращивают в среде, включающей растительноядные беспозвоночные вредители. Кроме того, следует отметить способ увеличения силы роста сельскохозяйственной культуры, где сельскохозяйственную культуру выращивают в среде, не содержащей растительноядных беспозвоночных вредителей. Кроме того, следует отметить способ увеличения силы роста сельскохозяйственной культуры, где сельскохозяйственную культуру выращивают в среде, содержащей количество влаги, меньше чем идеальное количество для поддержания роста сельскохозяйственной культуры. Следует отметить способ увеличения силы роста сельскохозяйственной культуры, где сельскохозяйственная культура является рисом. Кроме того, следует отметить способ увеличения силы роста сельскохозяйственной культуры, где сельскохозяйственная культура является кукурузой. Кроме того, следует отметить способ увеличения силы роста сельскохозяйственной культуры, где сельскохозяйственная культура является соей.

Соединения по этому изобретению могут быть также смешены с одним или более другими биологически активными соединениями или средствами, включающими инсектициды, фунгициды, нематоциды, бактерициды, акарициды, гербициды, антидоты гербицидов, регуляторы роста, такие как ингибиторы линьки насекомых и стимуляторы образования корней, хемостерилизаторы, химические сигнальные вещества, репелленты, аттрактанты, феромоны, стимуляторы поедания, другие биологически активные соединения или энтомопатогенные бактерии, вирусы или грибки, для образования

многокомпонентного пестицида, имеющего еще более широкий спектр агротехнического и неагротехнического применения. Таким образом, настоящее изобретение также относится к композиции, включающей биологически эффективное количество соединения формулы **1**, по меньшей мере, один дополнительный компонент, выбранный из группы, состоящей из поверхностно-активных веществ, твердых разбавителей и жидких разбавителей и, по меньшей мере, одного дополнительного биологически активного соединения или средства. Применительно к смесям по настоящему изобретению, другие биологически активные соединения или средства могут быть приготовлены вместе с настоящими соединениями, включающими соединения формулы **1**, с образованием заранее приготовленной смеси, или другие биологически активные соединения или средства могут быть приготовлены отдельно от настоящих соединений, включающих соединения формулы **1**, и эти два препарата объединяют вместе перед применением (например, в распылительном приборе) или, в качестве варианта, применяют последовательно.

Примерами таких биологически активных соединений или средств, вместе с которыми могут быть приготовлены соединения по этому изобретению, являются инсектициды, такие как абамектин, ацефат, ацехиноцил, ацетамиприд, акринатрин, афидопиропен ([(3S,4R,4aR,6S,6aS,12R,12aS,12bS)-3-[(циклопропилкарбонил)-окси]-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-декагидро-6,12-дигидрокси-4,6a,12b-триметил-11-оксо-9-(3-пиридинил)-2H,11H-нафто[2,1-b]-пирано[3,4-e]пиран-4-ил]метилциклопропанкарбоксилат), амидофлумет, амитраз, авермектин, азадирахтин, азинфос-метил, бенфуракарб, бенсултап, бифентрин, бифеназат, бистрифлурон, борат, бупрофезин, кадусафос, карбарил, карбофуран, картап, карзол, хлорантранилипрол, хлорфенапир, хлорфлуазурон, хлорпирифос, хлорпирифос-метил, хромафенозид, клофентезин, клотианидин, циантранилипрол (3-бром-1-(3-хлор-2-пиридинил)-N-[4-циано-2-метил-6-[(метиламино)карбонил]фенил]-1H-пиразол-5-карбоксамид), цикланилипрол (3-бром-N-[2-бром-4-хлор-6-[[(1-циклопропилэтил)-амино]карбонил]фенил]-1-(3-хлор-2-пиридинил)-1H-пиразол-5-карбоксамид), циклопротрин, циклоксаприд ((5S,8R)-1-[(6-хлор-3-пиридинил)метил]-2,3,5,6,7,8-гексагидро-9-нитро-5,8-эпокси-1H-имидазо[1,2-a]азепин), цифлуметофен, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, гамма-цигалотрин, лямда-цигалотрин, циперметрин, альфа-циперметрин, дзета-циперметрин, циромазин, дельтаметрин, дипфентиурон, диазинон, диелдрин, дифлубензурон, димефлутрин, димегипо, диметоат, динотефуран, диофенолан, эмамектин, эндосульфан, эсфенвалерат, этипрол, этофенпрокс, этоксазол, фенбутатина оксид, фенитротион, фенотиокарб, феноксикарб, фенпропатрин, фенвалерат, фипронил, флометохин (2-этил-3,7-диметил-6-[4-(трифторметокси)феноксi]-4-хинолинила метил-карбонат), флоникамид, флубендиамид, флуцитринат, флуфенерим, флуфеноксурон, флуфеноксистробин (метил (αE)-2-[[2-хлор-4-(трифторметил)феноксi]метил]-α-(метоксиметилен)бензолацетат), флуфенсульфон (5-хлор-2-[(3,4,4-трифтор-3-бутен-1-ил)сульфонил]-тиазол), флугексафон, флуопирам, флупипрол (1-[2,6-дихлор-4-

(трифторметил)фенил]-5-[(2-метил-2-пропен-1-ил)амино]-4-[(три-фторметил)сульфинил]-1H-пиразол-3-карбонитрил), флупирадифурон (4-[[(6-хлор-3-пиридинил)метил](2,2-дифторэтил)амино]-2(5H)-фуранон), флувалинат, тау-флувалинат, фонофос, форметанат, фостиазат, галофенозид, гептафлутрин ([2,3,5,6-тетрафтор-4-(метоксиметил)фенил]метил 2,2-диметил-3-[(1Z)-3,3,3-трифтор-1-пропен-1-ил]циклопропанкарбоксилат), гексафлумурон, гекситиазокс, гидраметилнон, имидаклоприд, индоксакарб, инсектицидные мыла, изофенфос, луфенурон, малатион, меперфлутрин ([2,3,5,6-тетрафтор-4-(метоксиметил)фенил]метил (1R,3S)-3-(2,2-дихлорэтенил)-2,2-диметилциклопропанкарбоксилат), метафлумизон, метальдегид, метамидофос, метидатион, метиодикарб, метомил, метопрен, метоксихлор, метофлутрин, метоксифенозид, метофлутрин, монокротофос, монофтортрин ([2,3,5,6-тетрафтор-4-(метоксиметил)-фенил]метил 3-(2-циано-1-пропен-1-ил)-2,2-диметилциклопропан-карбоксилат), никотин, нитенпирам, нитиазин, новалурон, новифлумурон, оксамил, паратион, паратион-метил, перметрин, форат, фозалон, фосмет, фосфамидон, пиримикарб, профенофос, профлутрин, пропаргит, протрифенбут, пифлубумид (1,3,5-триметил-N-(2-метил-1-оксопропил)-N-[3-(2-метилпропил)-4-[2,2,2-трифтор-1-метокси-1-(трифторметил)этил]фенил]-1H-пиразол-4-карбоксамид), пиметрозин, пирафлупрол, пиретрин, пиридабен, пиридалил, пирифлухиназон, пириминостробин (метил (αE)-2-[[[2-[(2,4-дихлорфенил)амино]-6-(трифторметил)-4-пиримидинил]окси]метил]-α-(метоксиметилен)-бензолацетат), пирипрол, пирипроксифен, ротенон, рианодин, силафлуофен, спинеторам, спиносад, спиродиклофен, спиромезифен, спиротетрамат, сульпрофос, сульфоксафлор (N-[метилоксидо[1-[6-(трифторметил)-3-пиридинил]этил]-λ^4-сульфанилиден]цианамид), тебуфенозид, тебуфенпирад, тефлубензурон, тефлутрин, тербуфос, тетрахлорвинфос, тетраметрин, тетраметилфлутрин ([2,3,5,6-тетра-фтор-4-(метокси-метил)фенил]метил 2,2,3,3-тетраметилциклопропан-карбоксилат), тетранилипрол, тиаклоприд, тиаметоксам, тиодикарб, тиосультап-натрий, тиоксазафен (3-фенил-5-(2-тиенил)-1,2,4-окса-диазол), толфенпирад, тралометрин, триазамат, трихлорфон, трифлумезопирим (2,4-диоксо-1-(5-пиримидинилметил)-3-[3-(трифтор-метил)фенил]-2H-пиридо[1,2-a]пиримидиния внутренняя соль), трифлумурон, дельта-эндотоксины бактерий Bacillus thuringiensis, энтомопатогенные бактерии, энтомопатогенные вирусы и энтомопатогенные грибы.

Следует отметить такие инсектициды, как абамектин, ацетамиприд, акринатрин, афидопиропен, амитраз, авермектин, азадирахтин, бенфуракарб, бенсултап, бифентрин, бупрофезин, кадусафос, карбарил, картап, хлорантранилипрол, хлорфенапир, хлорпирифос, клотианидин, циантранилипрол, цикланилипрол, циклопротрин, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, гамма-цигалотрин, лямда-цигалотрин, циперметрин, альфа-циперметрин, дзета-циперметрин, циромазин, дельтаметрин, диелдрин, динотефуран, диофенолан, эмамектин, эндосульфан, эсфенвалерат, этипрол, этофенпрокс, этоксазол, фенитротион, фенотиокарб, феноксикарб, фенвалерат, фипронил, флометохин, флоникамид, флубендиамид, флуфеноксурон, флуфеноксистробин,

флуфенсульфон, флупипрол, флупирадифурон, флувалинат, форметанат, фостиазат, гептафлутрин, гексафлумурон, гидраметилнон, имидаклоприд, индоксакарб, луфенурон, меперфлутрин, метафлумизон, метиодикарб, метомил, метопрен, метоксифенозид, метофлутрин, монофтортрин, нитенпирам, нитиазин, новалурон, оксамил, пифлубумид, пиметрозин, пиретрин, пиридабен, пиридалил, пириминостробин, пирипроксифен, рианодин, спинеторам, спиносад, спиродиклофен, спиромезифен, спиротетрамат, сульфоксафлор, тебуфенозид, тетраметрин, тетраметилфлутрин, тиаклоприд, тиаметоксам, тиодикарб, тиосультап-натрий, тралометрин, триазамат, трифлумезопирим, трифлумурон, дельта-эндотоксины бактерий Bacillus thuringiensis, все штаммы бактерий Bacillus thuringiensis и все штаммы вирусов ядерного полиэдроза.

Один вариант осуществления биологических средств для смешения с соединениями по этому изобретению включает энтомопатогенные бактерии, такие как Bacillus thuringiensis, и инкапсулированные дельта-эндотоксины бактерий Bacillus thuringiensis, такие как биоинсектициды MVP® и MVPII®, приготовленные с помощью процесса CellCap® (CellCap®, MVP® и MVPII® являются товарными знаками фирмы Mycogen Corporation, Indianapolis, Indiana, USA); энтомопатогенные грибы, такие как мускардинные грибы; и энтомопатогенные (как природные, так и генетически модифицированные) вирусы, включающие бакуловирус, вирус ядерного полиэдроза (NPV), такой как вирус ядерного полиэдроза хлопковой совки Helicoverpa zea (HzNPV), вирус ядерного полиэдроза совки Anagrapha falcifera (AfNPV); и вирус гранулеза (GV), такой как вирус гранулеза яблонной плодожорки Cydia pomonella (CpGV).

Особо следует отметить такую комбинацию, в которой активные ингредиенты для борьбы с беспозвоночным вредителем принадлежат к другому классу химических соединений или другое место приложения действия, чем соединение формулы **1**. В конкретных случаях, комбинация, по меньшей мере, с одним другим активным ингредиентом для борьбы с беспозвоночным вредителем, обладающим аналогичным спектром действия, но отличающимся местом приложения действия, будет особенно эффективной для борьбы с резистентными к действию средств защиты растений беспозвоночными вредителями. В силу этого, композиция по настоящему изобретению может дополнительно включать биологически эффективное количество, по меньшей мере, одного дополнительного активного ингредиента для борьбы с беспозвоночным вредителем, обладающего аналогичным спектром действия, но принадлежащего к другому химическому классу или имеющему другое место приложения действия. Эти дополнительные биологически активные соединения или средства включают, но этим не ограничивая, ингибиторы ацетилхолинэстеразы (AChE), такие как карбаматы метомил, оксамил, тиодикарб, триазамат, и органофосфаты хлорпирифос; антагонисты гамма-аминомасляной кислоты (GABA)-зависимого хлоридного канала, такие как циклодиены диелдрин и эндосульфан, и фенилпиразолы этипрол и фипронил; модуляторы натриевого канала, такие как пиретроиды бифентрин, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, лямда-цигалотрин, циперметрин, дельтаметрин, димефлутрин, эсфенвалерат,

метофлутрин и профлутрин; агонисты никотинового ацетилхолинового рецептора (nAChR), такие как неоникотиноиды ацетамиприд, клотианидин, динотефуран, имидаклоприд, нитенпирам, нитиазин, тиаклоприд и тиаметоксам, и сульфоксафлор; аллостерические активаторы никотинового ацетилхолинового рецептора (nAChR), такие как спиносины спинеторам и спиносад; активаторы хлоридного канала, такие как авермектины абамектин и эмамектин; мимики увенильного гормона, такие как диофенолан, метопрен, феноксикарб и пирипроксифен; селективные блокаторы питания равнокрылых насекомых, такие как пиметрозин и флоникамид; ингибиторы роста клещей, такие как этоксазол; ингибиторы митохондриальной АТФ-синтазы, такие как пропаргит; разобщающие средства для окислительного фосфорилирования путем нарушения протонного градиента, такие как хлорфенапир; блокаторы каналов никотинового ацетилхолинового рецептора (nAChR), такие как аналоги нереистоксина картап; ингибиторы биосинтеза хитина, такие как бензоилмочевины флуфеноксурон, гексафлумурон, луфенурон, новалурон, новифлумурон и трифлумурон, и бупрофезин; средства, нарушающие линьку двукрылых насекомых, такие как циромазин; агонисты экдизонового рецептора, такие как диацилгидразины метоксифенозид и тебуфенозид; агонисты октопаминового рецептора, такие как амитраз; ингибиторы митохондриального комплекса III переноса электронов, такие как гидраметилнон; ингибиторы митохондриального комплекса I переноса электронов, такие как пиридабен; блокаторы потенциалозависимого натриевого канала, такие как индоксакарб; ингибиторы ацетил-CoA-карбоксилазы, такие как тетроновые и тетрамовые кислоты спиродиклофен, спиромезифен и спиротетрамат; ингибиторы митохондриального комплекса II переноса электронов, такие как β-кетонитрилы циенопирафен и цифлуметофен; модуляторы рецептор рианодина, такие как антраниловые диамиды хлорантранилипрол, циантранилипрол и циантранилипрол, диамиды, такие как флубендиамид, и лиганды рецептора рианодина, такие как рианодин; соединения, для которых сайт-мишень, ответственный за биологическую активность, неизвестен или не описан, такие как азадирахтин, бифеназат, пиридалил, пирифлухиназон и трифлумезопирим; микробные разрушители мембран средней кишки насекомых, такие как бактерии Bacillus thuringensis, и эндотоксины, которые они продуцируют, и бактерии Bacillus sphaericus; и биологические средства, включающие вирусы ядерного полиэдроза (NPV) и другие природные или генетически модифицированные вирусы.

Дополнительными примерами биологически активных соединений или средств, вместе с которыми могут быть приготовлены соединения по этому изобретению, являются фунгициды, такие как ацибензолар-S-метил, альдиморф, аметоктрадин, амисульбром, анилазин, азаконазол, азоксистробин, беналаксил (в том числе беналаксил-M), беноданил, беномил, бентиаваликарб (в том числе бентиаваликарб-изопропил), бензовиндифлупир, бетоксазин, бинапакрил, бифенил, битертанол, биксафен, бластицидин-S, боскалид, бромуконазол, бупиримат, бутиобат, карбоксин, карпропамид, каптафол, каптан, карбендазим, хлорнеб, хлорталонил, хлозолинат, гидроксид меди, оксихлорид меди,

сульфат меди, коумоксистробин, циазофамид, цифлуфенамид, цимоксанил, ципрокогназол, ципродинил, дихлофлуанид, диклоцимет, дикломезин, диклоран, диетофенкарб, дифеноконазол, дифлуметорим, диметиримол, диметоморф, димоксистробин, диниконазол (в том числе диниконазол -M), динокап, дитианон, дитиоланы, додеморф, додин, эконазол, этаконазол, эдифенфос, эноксастробин (также известный как энестробурин), эроксиконазол, этабоксам, этиримол, этридиазол, фамоксадон, фенамидон, фенаминстробин, фенаримол, фенбуконазол, фенфурам, фенгексамид, феноксанил, фенпиклонил, фенпропидин, фенпропиморф, фенпиразамин, фентин ацетат, фентин гидроксид, фербам, феримзон, флометохин, флуазинам, флудиоксонил, флуфеноксистробин, флуморф, флуопиколид, флуопирам, флуоксастробин, флухинконазол, флузилазол, флусульфамид, флутианил, флутоланил, флутриафол, флуксапироксад, фолпет, фталид (также известный как фталид), фуберидазол, фуралаксил, фураметпир, гексаконазол, гимексазол, гуазатин, имазалил, имибенконазол, иминоктадин альбесилат, иминоктадин триацетат, йодикарб, ипконазол, изофетамид, ипробенфос, ипродион, ипроваликарб, изопротиолан, изопиразам, изотианил, касугамицин, крезоксим-метил, манкозеб, мандипропамид, мандестробин, манеб, мапанипирин, мепронил, мептилдинокап, металаксил (в том числе металаксил-M/мефеноксам), метконазол, метасулфокарб, метирам, метоминостробин, метрафенон, миклобутанил, нафтитин, нео-азоцин (метанарсонаты трехвалентного железа), нуаримол, октилинон, офурак, оризастробин, оксадиксил, оксатиапипролин, оксолиновая кислота, окспоконазол, оксикарбоксин, окситетрациклин, пенконазол, пенцицурон, пенфлуфен, пентиопирад, перфуразоат, фосфористая кислота (в том числе ее соли, например, фозетил-алюминий), пикоксистробин, пипералин, полиоксин, пробеназол, прохлораз, процимидон, пропамокарб, пропиконазол, пропинеб, прохиназид, протиокарб, протиоконазол, пираклостробин, пираметастробин, пираоксистробин, пиразофос, пирибенкарб, пирибутакарб, пирифенокс, пириофенон, перизоксазол, пириметанил, пирифенокс, пирролнитрин, пирохилон, хинконазол, хинметионат, хиноксифен, хинтозен, силтиофам, седаксан, симеконазол, спироксамин, стрептомицин, сера, тебуконазол, тебуфлохин, теклофталам, теклофталам, текназен, тербинафин, тетраконазол, тиабендазол, трифлузамид, тиофанат, теклофталам-метил, тирам, тиадинил, толклофос-метил, толпрокарб, толифлуанид, триадимефон, триадименол, триаримол, триазоксид, трехосновной сульфат меди, триклопирикарб, тридеморф, трифлоксистробин, трифлумизол, триморфамид трициклазол, трифлоксистробин, трифорин, тритиконазол, униконазол, валидамицин, валифеналат (также известный как валифенал), винклозолин, зинеб, зирам, зоксамид и 1-[4-[4-[5-(2,6-дифтор-фенил)-4,5-дигидро-3-изоксазолил]-2-тиазолил]-1-пиперидинил]-2-[5-метил-3-(трифторметил)-1H-пиразол-1-ил]этанон;

нематоциды, такие как флуопирам, спиротетрамат, тиодикарб, фостиазат, абамектин, ипродион, флуенсульфон, диметилдисульфид, тиоксазафен, 1,3-дихлорпропен (1,3-D), метам (натрий и калий), дазомет, хлорпикрин, фенамифос, этопрофос, кадусафос, тербуфос, имициафос, оксамил, карбофуран, тиоксазафен, Bacillus firmus и Pasteuria

nishizawae; бактерициды, такие как стрептомицин; акарициды, такие как амитраз, хинометионат, хлорбензилат, цигексатин, дикофол, диенохлор, этоксазол, феназахин, фенбутатина оксид, фенпропатрин, фенпироксимат, гекситиазокс, пропаргит, пиридабен и тебуфенпирад.

В конкретных случаях, комбинации соединения по этому изобретению с другими биологически активными (в частности, в отношении борьбы с беспозвоночным вредителем) соединениями или средствами (то есть с активными ингредиентами) позволяют в результате достигать усиления действия. Всегда желательным является снижение количества активных ингредиентов, высвобождающихся в окружающую среду, но при обеспечении эффективной борьбы с сельскохозяйственными вредителями. Когда более эффективную борьбу с беспозвоночным вредителем проводят при нормах нанесения, дающих удовлетворительные агротехнические результаты по уровням борьбы с беспозвоночным вредителем, такие комбинации могут быть предпочтительными с точки зрения снижения себестоимости производства сельскохозяйственной культуры и снижения нагрузки на окружающую среду.

Соединения по этому изобретению и их композиции могут быть нанесены на растения, которые генетически трансформированы для экспрессии белков, токсичных для беспозвоночных вредителей (таких как дельта-эндотоксины бактерий Bacillus thuringiensis). Такое нанесение может обеспечивать более широкий спектр защиты растений и может быть желательным с точки зрения борьбы с резистентностью к действию средств защиты растений безпозвоночных вредителей. Экзогенно наносимые соединения по этому изобретению в комбинации с белками, экспрессирующими токсин, может давать усиленный эффект при борьбе с беспозвоночным вредителем.

Подробная информация по поводу этих средств защиты сельскохозяйственных растений (то есть инсектицидов, фунгицидов, нематоцидов, акарицидов, гербицидов и биологических средств) представлена в руководствах The Pesticide Manual, 13th Edition, C. D. S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2003 и The BioPesticide Manual, 2nd Edition, L. G. Copping, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2001.

Борьбу с беспозвоночными вредителями проводят с агротехническими и неагротехническими целями путем нанесения одного или более соединений по этому изобретению, обычно, в форме композиции, в биологически эффективном количестве, на среду обитания сельскохозяйственных вредителей, включающую агротехническое и/или неагротехническое местоположение заражения, на площадь, подвергаемую защите, или непосредственно на сельскохозяйственных вредителей, против которых проводится борьба.

Таким образом, настоящее изобретение включает способ борьбы с беспозвоночным вредителем с агротехническими и/или неагротехническими целями, включающий контактирование беспозвоночного вредителя или его среды обитания с биологически эффективным количеством одного или более из соединений по изобретению, или с

композицией, включающей, по меньшей мере, одно такое соединение, или с композицией, включающей, по меньшей мере, одно такое соединение и биологически эффективное количество, по меньшей мере, одного дополнительного биологически активного соединения или средства. Примеры подходящих композиций, включающих соединение по изобретению и биологически эффективное количество, по меньшей мере, одного дополнительного биологически активного соединения или средства включают гранулированные композиции, где дополнительное активное соединение присутствует в той же самой грануле, что и соединение по изобретению, или в гранулах, которые отделены от гранул соединения по изобретению.

Для достижения контакта с соединением или композицией по изобретению для защиты полевой культуры от беспозвоночных вредителей, соединение или композицию обычно наносят на семена сельскохозяйственной культуры перед их посадкой, на листву (например, листья, стебли, цветки, плоды) сельскохозяйственных культур, или на почву или другую среду для выращивания до или после посадки культуры.

Одним вариантом осуществления метода контакта является распыление. В качестве варианта, гранулированная композиция, включающая соединение по изобретению, может быть нанесена на листву или почву. Соединения по этому изобретению могут быть также эффективно доставлены за счет поглощения растением в результате контактирования растения с композицией, включающей соединение по этому изобретению, нанесенного путем пропитки почвы жидким препаратом, внесения гранулированного препарата в почву, путем обработки коробок с посадочным материалом в питомниках или окунания посадочного материала. Следует отметить композицию по настоящему изобретению в форме жидкого препарата для пропитки почвы. Кроме того, следует отметить способ борьбы с беспозвоночным вредителем, включающий контактирование беспозвоночного вредителя или его среды обитания с биологически эффективным количеством соединения по настоящему изобретению или с композицией, включающей биологически эффективное количество соединения по настоящему изобретению. Кроме того, следует отметить такой способ, где средой обитания является почва, и композицию наносят на почву в форме жидкого препарата для пропитки почвы. Кроме того, следует отметить, что соединения по этому изобретению являются также эффективными при их местном нанесении на местоположение заражения. Другие методы контакта включают нанесение соединения или композиции по изобретению путем прямого опрыскивания и опрыскивания раствором с последействием, авиационного разбрызгивания, с помощью гелей, путем дражирования семян, путем микроинкапсулирования, системного всасывания, путем использования приманок, использования бирок, болюсов, генератора искусственного тумана, фумигантов, аэрозолей, дустов и многих других вариантов. Один вариант осуществления метода контакта представляет собой размеростабильные гранулы удобрения, палочку или таблетку, включающие соединение или композицию по изобретению. Соединения по этому изобретению могут быть также использованы для пропитки материалов, из которых

изготавливают устройства для борьбы с беспозвоночными вредителями (например, противомоскитная сетка).

Соединения по изобретению применяют при обработки растений в целом, частей растений и семян. Сорта растений и семян, и культурные сорта растений могут быть получены традиционными методами размножения и скрещивания, или методами генной инженерии. Генетически модифицированные растения и семена (трансгенные растения и семена) представляют собой растения и семена, в которых гетерологический ген (трансген) был стабильно интегрирован в геном растения или семян. Трансген, который определяют по его конкретному местонахождению в геноме растения, называют объектом трансформации или трансгенным объектом.

Культурные сорта генетически модифицированных растений и семян, которые могут быть подвергнуты обработке в соответствии с изобретением, включают сорта, которые являются устойчивыми к воздействию одного или более биотических стрессов (сельскохозяйственные вредители, такие как нематоды, насекомые, клещи, грибы, и так далее) или абиотических стрессов (засуха, холодная температура, засоленность почвы, и так далее), или которые обладают другими требуемыми характеристиками. Растения и семена могут быть генетически модифицированы для приобретения ими полезных характеристик, например, стойкости к воздействию гербицидов, стойкости к воздействию вредных насекомых, модифицированных характеристик содержания масел или засухоустойчивости.

Обработка генетически модифицированных растений и семян с помощью соединений по изобретению может приводить в результате к супераддитивным или усиленным эффектам. Например, снижение норм нанесения, расширение спектра активности, повышение устойчивости к воздействию биотических/абиотических стрессов или улучшение сохранности при хранении могут характеризоваться более высокими показателями, чем можно было бы ожидать в результате только простых аддитивных эффектов нанесения соединений по изобретению на генетически модифицированные растения и семена.

Соединения по этому изобретению могут также применяться при обработке семян для защиты семян от беспозвоночных вредителей. Применительно к настоящему изобретению и формуле изобретения, обработка семян подразумевает контактирование семян с биологически эффективным количеством соединения по этому изобретению, которое обычно приготавливают в форме композиции по изобретению. Эта обработка семян защищает семена от живущих в почве вредных беспозвоночных насекомых, и обычно обработка семян может также защищать корневую систему и другие части растений, находящиеся в контакте с почвой, в которой происходит развитие всходов из прорастающих семян. Обработка семян может также обеспечивать защиту листвы в результате передвижения соединения по этому изобретению или второго активного ингредиента внутри развивающегося растения. Обработка семян может применяться ко всем типам семян, включая семена, из которых будут прорастать растения, генетически

трансформированные для проявления ими специализированных требуемых свойств. Типичные примеры включают примеры экспрессии белков, токсичных для беспозвоночных вредителей, таких как токсин бактерий Bacillus thuringiensis, или примеры экспрессии фермента, обеспечивающего устойчивость к гербицидам, такого как глифосат ацетилтрансфераза, которая обеспечивает устойчивость к воздействию гербицида глифосат. Обработка семян с помощью соединений по этому изобретению может также увеличивать силу роста растений из семян.

Одним методом обработки семян является обрызгивание или обсыпка семян с помощью соединения по изобретению (то есть, в форме приготовленной композиции) перед посевом семян. Композиции, приготавливаемые для обработки семян, обычно включают пленкообразующее вещество или клейкое вещество. Поэтому, обычно композиция для нанесения покрытия на семена по настоящему изобретению включает биологически эффективное количество соединения формулы **1** и пленкообразующее вещество или клейкое вещество. Покрытие на семена может быть нанесено путем опрыскивания жидкотекучим концентратом суспензии непосредственно в слое семян, переворачиваемых в барабанной сушилке, и затем сушки семян. В качестве варианта, на семена могут быть нанесены путем опрыскивания другие типы препаратов, такие как смачиваемые порошки, растворы, суспоэмульсии, эмульгируемые концентраты и эмульсии в воде. Этот процесс применяют, в частности, для нанесения на семена пленочных покрытий. Для специалиста в данной области хорошо известны различные процессы и оборудование для нанесения покрытий. Подходящие процессы включают процессы, описанные в публикации P. Kosters et al., Seed treatment: Progress and Prospects, 1994 BCPC Mongraph No. 57, и в цитируемой в этой публикации литературе.

Соединения формулы **1** и их композиции, как в отдельности, так и в комбинации с другими инсектицидами, нематоцидами и фунгицидами, применяются, в частности, при обработке семян сельскохозяйственных культур, включающих, но этим не ограничивая, маис или кукурузу, сою, хлопок, злаки (например, пшеницу, овес, ячмень, рожь и рис), картофель, овощи и масличный рапс.

Другие инсектициды, вместе с которыми могут быть приготовлены соединения формулы **1** с получением смесей, применяемых при обработке семян, включают абамектин, ацетамиприд, акринатрин, амитраз, авермектин, азадирахтин, бенсултап, бифентрин, бупрофезин, кадусафос, карбарил, карбофуран, картап, хлорантранилипрол, хлорфенапир, хлорпирифос, клотианидин, циантранилипрол, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, гамма-цигалотрин, лямда-цигалотрин, циперметрин, альфа-циперметрин, дзета-циперметрин, циромазин, дельтаметрин, диелдрин, динотефуран, диофенолан, эмамектин, эндосульфан, эсфенвалерат, этипрол, этофенпрокс, этоксазол, фенотиокарб, феноксикарб, фенвалерат, фипронил, флоникамид, флубендиамид, флуфеноксурон, флувалинат, форметанат, фостиазат, гексафлумурон, гидраметилнон, имидаклоприд, индоксакарб, луфенурон, метафлумизон, метиокарб, метомил, метопрен, метоксифенозид, нитенпирам, нитиазин, новалурон, оксамил, пиметрозин, пиретрин, пиридабен,

пиридалил, пирипроксифен, рианодин, спинеторам, спиносад, спиродиклофен, спиромезифен, спиротетрамат, сульфоксафлор, тебуфенозид, тетраметрин, тиаклоприд, тиаметоксам, тиодикарб, тиосультап-натрий, тралометрин, триазамат, трифлумурон, дельта-эндотоксины бактерий Bacillus thuringiensis, все штаммы бактерий Bacillus thuringiensis и все штаммы вирусов ядерного полиэдроза.

Фунгициды, вместе с которыми могут быть приготовлены соединения формулы **1** с получением смесей, применяемых при обработке семян, включают амисульбром, азоксистробин, боскалид, карбендазим, карбоксин, цимоксанил, ципроконазол, дифеноконазол, диметоморф, флуазинам, флудиоксонил, флухинконазол, флуопиколид, флуоксастробин, флутриафол, флуксапироксад, ипконазол, ипродион, металаксил, мефеноксам, метконазол, миклобутанил, паклобутразол, пенфлуфен, пикоксистробин, протиоконазол, пираклостробин, седаксан, силтиофам, тебуконазол, тиабендазол, тиофанат-метил, тирам, трифлоксистробин и тритиконазол.

Композиции, включающие соединения формулы **1,** применяемые для обработки семян, могут дополнительно включать бактерии и грибки, которые обладают способностью обеспечивать защиту от вредного воздействия фитопатогенных грибов или бактерий и/или рожденных в почве животных, таких как нематоды. Бактерии, обладающие нематицидальными способностями, могут включать, но этим не ограничивая, Bacillus firmus, Bacillus cereus, Bacillius subtiliis и Pasteuria penetrans. Подходящим штаммом Bacillus firmus является штамм CNCM I-1582 (GB-126), который продается под торговой маркой BioNemTM. Подходящим штаммом Bacillus cereus является штамм NCMM I-1592. Оба штамма Bacillus раскрыты в патенте US 6406690. Другими подходящими бактериями, обладающими нематицидальной активностью, являются B. amyloliquefaciens IN937a и B. subtilis штамм GB03. Бактерии, обладающие фунгицидальными свойствами, могут включать, но этим не ограничивая, B. pumilus штамм GB34. Виды грибков, проявляющие нематицидальные свойства, могут включать, но этим не ограничивая, Myrothecium verrucaria, Paecilomyces lilacinus и Purpureocillium lilacinum.

Обработка семян может также включать обработку одним или более нематицидальными средствами природного происхождения, такими как элиситорный белок, называемый гарпином, который выделяют из конкретных бактериальных патогенов растений, таких как Erwinia amylovora. Примером является технология обработки семян Harpin-N-Tek, предоставляемая под торговой маркой N-HibitTM Gold CST.

Обработка семян может также включать обработку одним или более видами клубеньковых бактерий, обитающих в корнях бобовых растений, таких как микросимбиотические фиксирующие азот бактерии Bradyrhizobium japonicum. Эти бактериальные препараты могут необязательно включать один или более липо-хитоолигосахаридов (LCO), которые являются факторами образования клубеньков (Nod), продуцируемыми бактериями rhizobia в процессе инициирования образования клубеньков на корнях бобовых растений. Например, технология обработки семян под брендом

Optimize® включают технологию LCO Promoter TechnologyTM в комбинации с инокуляций бактериями.

Обработка семян может также включать обработку одним или более изофлавонами, которые могут повышать уровень образования на корнях колоний микоризных грибов. Микоризные грибы улучшают рост растений за счет усиления всасывания корнями питательных веществ, таких как вода, сульфаты, нитраты, фосфаты и металлы. Примеры изофлавонов включают, но этим не ограничивая, генистеин, биоханин A, формононетин, даидзеин, глицитеин, гесперетин, нарингенин и пратенсеин. Формононетин используют в качестве активного ингредиента в продуктах для инокуляции микоризных грибов, таких как PHC Colonize® AG.

Обработка семян может также включать обработку одним или более активаторами растений, которые индуцируют приобретаемую растениями системную устойчивость после контакта с патогеном. Примером активатора растений, который индуцирует такие защитные механизмы, является ацибензолар-S-метил.

Обработанные семена обычно включают соединение по настоящему изобретению в количестве от приблизительно 0,1 г до 1 кг на 100 кг семян (то есть от приблизительно 0,0001 до 1% по массе семян до обработки). Жидкотекучая суспензия, приготовленная для обработки семян, обычно включает от приблизительно 0,5 до приблизительно 70% активного ингредиента, от приблизительно 0,5 до приблизительно 30% образующего пленку клейкого вещества, от приблизительно 0,5 до приблизительно 20% диспергирующего средства, от 0 до приблизительно 5% загустителя, от 0 до приблизительно 5% пигмента и/или красителя, от 0 до приблизительно 2% пеногасителя, от 0 до приблизительно 1% консерванта, и от 0 до приблизительно 75% летучего жидкого растворителя.

Соединения по этому изобретению могут быть введены в композицию для приманки, которую поедает беспозвоночный вредитель, или которую используют в устройстве, таком как ловушка, устройство типа мышеловки, и другие подобные устройства. Такая композиция для приманки может быть в форме гранул, которые включают (a) активные ингредиенты, то есть биологически эффективное количество соединения формулы **1**; (b) одно или более пищевых веществ; необязательно, (c) аттрактант, и, необязательно, (d) одно или более увлажняющих веществ. Следует отметить гранулы или композиции для приманки, которые включают приблизительно 0,001-5% активных ингредиентов, приблизительно 40-99% пищевых материалов и/или аттрактанта; и, необязательно, приблизительно 0,05-10% увлажняющих веществ, которые являются эффективными при борьбе с живущими в почве беспозвоночными вредителями при очень низких нормах нанесения, в частности, при дозах активного ингредиента, которые являются летальными в результате заглатывания внутрь, а не в результате непосредственного контакта. Некоторые пищевые материалы могут выполнять функцию как источника пищи, так и аттрактанта. Пищевые материалы включают углеводы, белки и жиры. Примерами пищевых материалов являются мелкоизмельченная растительность,

сахар, крахмалы, животный жир, растительное масло, дрожжевые экстракты и сухие молочные остатки. Примерами аттрактантов являются одоранты и ароматизаторы, такие как плодовые или растительные экстракты, ароматизирующее вещество или другие животные или растительные компоненты, феромоны или другие средства, используемые для привлечения требуемого беспозвоночного вредителя. Примерами увлажняющих веществ, то есть сохраняющих влагу веществ, являются гликоли и другие полиолы, глицерин и сорбит. Следует отметить композицию для приманки (и способ применения такой композиции для приманки), применяемую для борьбы, по меньшей мере, с одним беспозвоночным вредителем, выбранным из группы, состоящей из муравьев, термитов и тараканов. Устройство для борьбы с беспозвоночным вредителем может включать настоящую композицию для приманки и корпус, приспособленный для загрузки в него указанной композиции для приманки, где корпус имеет, по меньшей мере, одно отверстие, размер которого позволяет проходить беспозвоночному вредителю через отверстие, в результате чего беспозвоночный вредитель может получать доступ к указанной композиции для приманки из его места нахождения снаружи корпуса, и где корпус дополнительно приспособлен для размещения в месте или рядом с местом потенциальной или известной активности беспозвоночного вредителя.

Один вариант осуществления настоящего изобретения относится к способу борьбы с беспозвоночными вредителями, включающему разбавление пестицидной композиции по настоящему изобретению (соединения формулы **1,** приготовленного вместе с поверхностно-активными веществами, твердыми разбавителями и жидкими разбавителями, или приготовленной смеси соединения формулы **1** и, по меньшей мере, с одним другим пестицидом) водой, и, необязательно, добавление вспомогательного вещества с образованием разбавленной композиции, и контактирование беспозвоночного вредителя или его среды обитания с эффективным количеством указанной разбавленной композиции.

Несмотря на то, что композиция для разбрызгивания, образованная путем разбавления водой достаточной концентрации настоящей пестицидной композиции, может обеспечивать достаточную эффективность при борьбе с беспозвоночными вредители, тем не менее, отдельно приготовленные вспомогательные продукты могут быть также добавлены к разбрызгиваемым баковым смесям. Эти дополнительные вспомогательные вещества обычно называют "дополнительными веществами для разбрызгиваемых композиций" или "дополнительными веществами для баковых смесей", и они включают любое вещество, смешиваемое в баке опрыскивателя с целью улучшения действия пестицида или изменения физических свойств разбрызгиваемой смеси. Вспомогательные вещества могут представлять собой поверхностно-активные вещества, эмульгаторы, растительные масла на нефтяной основе, масла из семян сельскохозяйственных культур, подкислители, буферы, загустители или пеногасители. Вспомогательные вещества используют для повышения эффективности (например, биологической доступности, адгезии, проникновения, однородности покрытия и

продолжительности защиты) или минимизации или предотвращения проблем нанесения путем разбрызгивания, связанных с несовместимостью, вспениванием, уносом, испарением, улетучиванием и разложением. Для получения оптимальных рабочих характеристик, дополнительные вещества выбирают с учетом свойств активного ингредиента, препарата и объекта-мишени (например, сельскохозяйственных культур, насекомых-вредителей).

Среди вспомогательных веществ для разбрызгиваемых композиций, масла, включающие масла для добавления в гербицидные препараты, концентраты масел для добавления в гербицидные препараты, концентраты масел из семян растений и концентраты метилированных масел из семян растений чаще всего используют для повышения эффективности применения пестицидов, возможно, в силу того, что они способствуют более ровному и однородному осаждению разбрызгиваемых препаратов. В ситуациях, когда фитотоксичность, потенциально вызываемая маслами или другими не смешивающимися с водой жидкостями, необходимо принимать во внимание, разбрызгиваемые композиции, приготовленные из композиции по настоящему изобретению, как правило не будут содержать вспомогательные вещества на основе масел. Однако, в ситуациях, когда фитотоксичность, вызываемая вспомогательными веществами на основе масел, содержащимися в разбрызгиваемых композициях, не является коммерчески значимой, разбрызгиваемые композиции, приготовленные из композиции по настоящему изобретению, могут также содержать вспомогательные вещества на основе масел, которые могут потенциально повышать эффективность борьбы с беспозвоночными вредителями, а также увеличивать продолжительность времени, необходимого после применения препарата перед дождем, для того чтобы препарат продолжал быть эффективным.

Продукты, которые идентифицируют как "масло для добавления в гербицидные препараты", обычно содержат от 95 до 98% парафинового масла или нефтяного масла на основе нафты и от 1 до 2% одного или более поверхностно-активных веществ, выполняющих функции эмульгаторов. Продукты, которые идентифицируют как "концентраты масла для добавления в гербицидные препараты", обычно содержат от 80 до 85% эмульгируемого масла на основе нефти и от 15 до 20% неионных поверхностно-активных веществ. Продукты, которые правильно идентифицировать как "концентраты масел из семян растений" обычно содержат от 80 до 85% растительного масла (то есть масла из семян или плодов, чаще всего из семян хлопка, льна, сои или подсолнечника) и от 15 до 20% неионных поверхностно-активных веществ. Эксплуатационные характеристики вспомогательного вещества могут быть улучшены путем замены растительное масло на метиловые эфиры жирных кислот, которые обычно получают из растительных масел. Примеры концентратов метилированных масел из семян растений включают продукты MSO® Concentrate (UAP-Loveland Products, Inc.) и Premium MSO Methylated Spray Oil (Helena Chemical Company).

Количество вспомогательных веществ, добавляемых в разбрызгиваемые смеси обычно не превышает приблизительно 2,5% по объему, и, чаще всего, это количество составляет от приблизительно 0,1 до приблизительно 1% по объему. Удельный расход вспомогательных веществ, добавляемых в разбрызгиваемые смеси, обычно составляет приблизительно от 1 до 5 литров на гектар. Типичные примеры вспомогательных веществ для разбрызгиваемых смесей включают Adigor® (Syngenta) 47% метилированное рапсовое масло в жидких углеводородах, Silwet® (Helena Chemical Company) модифицированный полиалкиленоксидом гептаметилтрисилоксан и Assist® (BASF) 17% смеси поверхностно-активных веществ в 83% минерального масла на основе парафина.

Соединения по этому изобретению могут применяться без других вспомогательных веществ, но чаще всего используют препарат, включающий один или более активных ингредиентов с подходящими носителями, разбавителями и поверхностно-активными веществами, и, зачастую, в комбинации с кормом, в зависимости от предполагаемого конечного применения. Один метод нанесения включает разбрызгивание водной дисперсии или раствора соединение по настоящему изобретению в рафинированном масле. Комбинации с маслами для разбрызгиваемых препаратов, концентратами масел для разбрызгиваемых препаратов, адгезивными средствами, вспомогательными веществами, другими растворителями и пиперонилбутоксидом часто усиливает активность соединения. В случае неагротехнического применения, такие разбрызгиваемые препараты могут быть нанесены из емкостей для разбрызгивания, таких как банка, фляга или другая емкость, или с помощью насоса или путем высвобождения из емкости, находящейся под повышенным давлении, например, из находящегося под повышенным давлении аэрозольного баллона. Такие композиции для разбрызгивания могут принимать различные формы, например, форму аэрозолей, туманов, пен, паров или дыма. В силу этого, такие композиции для разбрызгивания, в зависимости от конкретного случая, могут дополнительно включать пропелленты, пенообразующие средства, и так далее. Следует отметить композицию для разбрызгивания, включающую биологически эффективное количество соединения или композиции по настоящему изобретению и носитель. Один вариант осуществления такой композиции для разбрызгивания включает биологически эффективное количество соединения или композиции по настоящему изобретению и пропеллент. Типичные пропелленты включают, но этим не ограничивая, метан, этан, пропан, бутан, изобутан, бутен, пентан, изопентан, неопентан, пентен, гидрофторуглероды, хлорфторуглероды, диметиловый эфир, и смеси перечисленных выше веществ. Следует отметить композицию для разбрызгивания (и метод использования такой композиции для разбрызгивания, высвобождаемой из емкости для разбрызгивания), применяемую для борьбы, по меньшей мере, с одним беспозвоночным вредителем, выбранным из группы, состоящей из москитов, мошек, жигалок осенних, слепней, лошадиных слепней, ос, складчатокрылых ос, шершней, иксодовых клещей, пауков, муравьев, комаров и других подобных насекомых, в том числе индивидуально или в комбинациях.

Представленные далее испытания демонстрируют эффективность борьбы с конкретными сельскохозяйственными вредителями с помощью соединений по этому изобретению. "Эффективность борьбы" означает ингибирование развития беспозвоночного вредителя (а том числе смертность), что приводит к значительному снижению поглощаемой им пищи. Однако, борьба с сельскохозяйственными вредителями, обеспечиваемая соединениями, не ограничивается только этими видами вредителей. Смотрите таблицы показателей A-G для описаний соединений.

ПРИМЕРЫ ИСПЫТАНИЯ БИОЛОГИЧЕСКОЙ АКТИВНОСТИ СОЕДИНЕНИЙ ПО ИЗОБРЕТЕНИЮ

Препарат и метод разбрызгивания для испытаний A-H

Испытуемые соединения приготавливали с использованием раствора, содержащего 10% ацетона, 90% воды и 300 ppm неионного поверхностно-активного вещества Activator 90® (Loveland Products, Loveland, Colorado, USA). Приготовленные соединения наносили в объеме 1 мл жидкости через форсунку, расположенную на 1,27 см выше верхней части каждого объекта испытания. Испытуемые соединения разбрызгивали при указанных номах расхода, и каждое испытание воспроизводили три раза.

Испытание A

Для оценки борьбы с молью капустной (Plutella xylostella (L.)), объект испытания состоял из небольшой открытой емкости, внутри которой находилось растение горчицы в фазе развития 12-14 дней. Это растение предварительно заражали с помощью ~50 новорожденных личинок, которые переносили в объект испытания на зернах грубого помола початка кукурузы с использованием инокулятора. Личинки двигались по испытуемому растению после их перенесения в объект испытания.

Испытуемые соединения приготавливали и разбрызгивали при концентрациях 250, 50, 10 и 2 ppm. После разбрызгивания приготовленного испытуемого соединения, каждый объект испытания подсушивали в течение 1 часа и затем сверху закрывали черной крышкой с пробитыми отверстиями. Объекты испытания выдерживали в течение 6 дней в вегетационной камере при 25°C и 70% относительной влажности. Затем визуально оценивали повреждение в результате поедания растения на основе съеденной листвы, и оценивали смертность личинок.

Из соединений формулы **1,** испытываемых при 250 ppm, следующие соединения обеспечивали уровни эффективности борьбы от очень хорошего до отличного (40% или менее повреждения в результате поедания растения и/или 100% смертность): 1, 2, 10, 34, 35, 39 и 40.

Из соединений формулы **1,** испытываемых при 50 ppm, следующие соединения обеспечивали уровни эффективности борьбы от очень хорошего до отличного (40% или менее повреждения в результате поедания растения и/или 100% смертность): 1, 2, 10, 34, 35, 39 и 40.

Из соединений формулы **1,** испытываемых при 10 ppm, следующие соединения обеспечивали уровни эффективности борьбы от очень хорошего до отличного (40% или

менее повреждения в результате поедания растения и/или 100% смертность): 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 28, 29, 30, 31, 32, 33, 34, 35, 39, 40, 41, 42, 43, 44, 45, 46, 47, 48, 49, 50, 52, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 59, 60, 61, 62, 63, 65, 70, 71, 72, 73, 74, 75, 76, 77, 78 и 79.

Из соединений формулы **1,** испытываемых при 2 ppm, следующие соединения обеспечивали уровни эффективности борьбы от очень хорошего до отличного (40% или менее повреждения в результате поедания растения и/или 100% смертность): 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 22, 23, 24, 26, 27, 28, 29, 30, 31, 33, 34, 35, 39, 40, 41, 43, 44, 45, 46, 47, 48, 49, 50, 52, 53, 55, 56, 58, 59, 60, 61, 63, 65, 70, 71, 72, 73, 74, 75, 76, 77, 78 и 79.

Испытание B

Для оценки борьбы с совкой травяной (Spodoptera frugiperda (J.E. Smith)), объект испытания состоял из небольшой открытой емкости, внутри которой находилось растение кукурузы в фазе развития 4-5 дней. Это растение предварительно заражали с помощью 10-15 личинок в возрасте 1 день на кусочке корма для насекомого.

Испытуемые соединения приготавливали и разбрызгивали при 250, 50, 10 и 2 ppm. После разбрызгивания приготовленного испытуемого соединения, объекты испытания выдерживали в вегетационной камере в течение 6 дней при 25°C и 70% относительной влажности. Затем визуально оценивали повреждение в результате поедания растения на основе съеденной листвы, и оценивали смертность личинок.

Из соединений формулы 1, испытываемых при 250 ppm, следующие соединения обеспечивали уровни эффективности борьбы от очень хорошего до отличного (40% или менее повреждения в результате поедания растения и/или 100% смертность: 1, 2, 10, 34, 35, 39 и 40.

Из соединений формулы 1, испытываемых при 50 ppm, следующие соединения обеспечивали уровни эффективности борьбы от очень хорошего до отличного (40% или менее повреждения в результате поедания растения и/или 100% смертность: 1, 2, 10, 34, 35, 39 и 40.

Из соединений формулы 1, испытываемых при 10 ppm, следующие соединения обеспечивали уровни эффективности борьбы от очень хорошего до отличного (40% или менее повреждения в результате поедания растения и/или 100% смертность: 1, 2, 3, 4, 6, 7, 8, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 22, 23, 24, 27, 28, 29, 30, 31, 33, 34, 39, 41, 43, 44, 45, 46, 47, 48, 49, 50, 52, 55, 58, 59, 60, 61, 63, 65, 70, 71, 72, 73, 74, 75, 76, 77, 78 и 79.

Из соединений формулы 1, испытываемых при 2 ppm, следующие соединения обеспечивали уровни эффективности борьбы от очень хорошего до отличного (40% или менее повреждения в результате поедания растения и/или 100% смертность: 1, 2, 3, 4, 8, 10, 11, 13, 15, 16, 18, 19, 20, 33, 34, 39, 43, 46, 49, 50, 59, 60, 61, 63, 65, 70, 71, 74, 76, 78 и 79.

Испытание C

Для оценки борьбы с кукурузной цикадкой (Peregrinus maidis (Ashmead)) путем контактирования и/или системно, объект испытания состоял из небольшой открытой емкости, внутри которой находилось растение кукурузы на стадии развития 3-4 дней. Поверх почвы добавляли чистый кварцевый песок, затем наносили испытуемое соединение.

Испытуемые соединения приготавливали и разбрызгивали при 50 ppm. После разбрызгивания приготовленного испытуемого соединения, объекты испытания сушили в течение 1 часа, затем их предварительно заражали с помощью ~15-20 личинок (в возрасте 18-21 день). Каждый объект испытания сверху закрывали черной крышкой с пробитыми отверстиями, и объекты испытания выдерживали в течение 6 дней в вегетационной камере при 22-24°C и 50-70% относительной влажности. Каждый объект испытания затем визуально оценивали на смертность насекомых.

Из соединений формулы 1, испытываемых при 50 ppm, следующие соединения в результате приводили, по меньшей мере, к 80% смертности насекомых: 11, 44, 46, 60, 61 и 63.

Испытание D

Для оценки борьбы с цикадкой картофельной (Empoasca fabae (Harris)) путем контактирования и/или системно, объект испытания состоял из небольшой открытой емкости, внутри которой находилось бобовое растение Soleil в фазе развития 5-6 дней (появление первых листьев). Поверх почвы добавляли чистый кварцевый песок, и один из первых листьев удаляли, затем наносили испытуемое соединение.

Испытуемые соединения приготавливали и разбрызгивали при 250, 50, 10 и 2 ppm. После разбрызгивания приготовленного испытуемого соединения, объекты испытания сушили в течение 1 часа, затем их предварительно заражали с помощью 5 картофельных цикадок (взрослых особой в возрасте 18- 21 день). Объект испытания сверху закрывали черной крышкой с пробитыми отверстиями, и объекты испытания выдерживали в течение 6 дней в вегетационной камере при 20°C и 70% относительной влажности. Каждый объект испытания затем визуально оценивали на смертность насекомых.

Из соединений формулы 1, испытываемых при 250 ppm, следующие соединения в результате приводили, по меньшей мере, к 80% смертности насекомых: 1, 2, 10, 34, 35, 39 и 40.

Из соединений формулы 1, испытываемых при 50 ppm, следующие соединения в результате приводили, по меньшей мере, к 80% смертности насекомых: 1, 2, 3, 4, 5, 8, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 27, 31, 33, 34, 39, 40, 41, 42, 43, 44, 45, 46, 47, 48, 49, 50, 52, 53, 55, 58, 59, 60, 61, 63, 65, 70, 71, 72, 75, 76, 78 и 79.

Из соединений формулы 1, испытываемых при 10 ppm, следующие соединения в результате приводили, по меньшей мере, к 80% смертности насекомых: 3, 4, 8, 10, 11, 13, 14, 15, 16, 18, 19, 20, 27, 33, 41, 43, 44, 47, 48, 49, 50, 52, 58, 59, 60, 61, 63, 65, 70, 71, 72, 75, 76, 78, 79.

Из соединений формулы 1, испытываемых при 2 ppm, следующие соединения в результате приводили, по меньшей мере, к 80% смертности насекомых: 15, 16, 18, 20, 33, 61 и 63.

Испытание E

Для оценки борьбы с тлей персиковой зеленой (Myzus persicae (Sulzer)) путем контактирования и/или системно, объект испытания состоял из небольшой открытой емкости, внутри которой находилось растение редьки на стадии развития 12-15 дней. Растение предварительно заражали путем помещения на лист испытуемого растения 30-40 тлей на кусочке листа, вырезанного из растения культуры (метод рассеченного листа). Тли двигались по испытуемому растению по мере засыхания кусочка листа. После предварительного заражения, на почву объекта испытания наносили слой песка.

Испытуемые соединения приготавливали и разбрызгивали при 250, 50 и 10 ppm. После разбрызгивания приготовленного испытуемого соединения, каждый объект испытания подсушивали в течение 1 часа, и затем сверху закрывали черной крышкой с пробитыми отверстиями. Объекты испытания выдерживали в течение 6 дней в вегетационной камере при 19-21°C и 50-70% относительной влажности. Каждый объект испытания затем визуально оценивали на смертность насекомых.

Из соединений формулы 1, испытываемых при 250 ppm, следующие соединения в результате приводили, по меньшей мере, к 80% смертности насекомых: 2, 10, 34 и 35.

Из соединений формулы 1, испытываемых при 50 ppm, следующие соединения в результате приводили, по меньшей мере, к 80% смертности насекомых: 3, 4, 8, 11, 18, 19, 20, 33, 34, 35, 41, 44, 50, 58, 60, 61, 63 и 70.

Из соединений формулы 1, испытываемых при 10 ppm, следующие соединения в результате приводили, по меньшей мере, к 80% смертности насекомых: 61 и 63.

Испытание F

Для оценки борьбы с бахчевой или хлопковой тлей (Aphis gossypii (Glover)) путем контактирования и/или системно, объект испытания состоял из небольшой открытой емкости, внутри которой находилось растение окра на стадии развития 5 дней. Это растение предварительно заражали с помощью 30-40 насекомых на кусочке листа методом рассеченного листа, и на почву объекта испытания наносили слой песка.

Испытуемые соединения приготавливали и разбрызгивали при 250, 50 и 10 ppm. После разбрызгивания, объекты испытания выдерживали в вегетационной камере в течение 6 дней при 19°C и 70% относительной влажности. Каждый объект испытания затем визуально оценивали на смертность насекомых.

Из соединений формулы 1, испытываемых при 250 ppm, следующие соединения в результате приводили, по меньшей мере, к 80% смертности насекомых: 1, 2, 10, 34, 35 и 39.

Из соединений формулы 1, испытываемых при 50 ppm, следующие соединения в результате приводили, по меньшей мере, к 80% смертности насекомых: 3, 4, 8, 10, 11, 16, 18, 19, 20, 22, 33, 34, 35, 41, 44, 46, 47, 49, 50, 55, 58, 59, 60, 61, 63 и 70.

Из соединений формулы 1, испытываемых при 10 ppm, следующие соединения в результате приводили, по меньшей мере, к 80% смертности насекомых: 19, 20, 33, 41, 44, 59, 60, 61, 63 и 70.

Испытание G

Для оценки борьбы с хлопковой белокрылкой (Bemisia tabaci (Gennadius)) путем контактирования и/или системно, объект испытания состоял из небольшой открытой емкости, внутри которой находилось растение хлопчатника на стадии развития 12-14 дней. Перед нанесением путем разбрызгивания, удаляли из растения обе семядоли, оставляя для исследования один настоящий лист. Взрослым особям белокрылок давали возможность отложить яйца на растении, и затем их удаляли из объекта испытания. Растения хлопчатника, зараженные, по меньшей мере, 15 яйцами, подвергали испытанию на обработку разбрызгиванием.

Испытуемые соединения приготавливали и разбрызгивали при 250, 50 и 10 ppm. После разбрызгивания, объекты испытания сушили в течение 1 часа. Баллоны затем удаляли, и объекты помещали в вегетационную камеру и выдерживали в течение 13 дней при 28°C и 50-70% относительной влажности. Каждый объект испытания затем визуально оценивали на смертность насекомых.

Из соединений формулы 1, испытываемых при 250 ppm, следующие соединения в результате приводили, по меньшей мере, к 70% смертности насекомых: 2, 34 и 40.

Из соединений формулы 1, испытываемых при 50 ppm, следующие соединения в результате приводили, по меньшей мере, к 70% смертности насекомых: 3, 8, 11, 15, 17, 18, 19, 20, 33, 34, 41, 42, 44, 46, 49, 55, 58, 60, 61, 63 и 70.

Из соединений формулы 1, испытываемых при 10 ppm, следующие соединения в результате приводили, по меньшей мере, к 70% смертности насекомых: 8, 11, 18, 19, 20, 33, 34, 42, 49, 61 и 63.

Из соединений формулы 1, испытываемых при 2 ppm, следующие соединения в результате приводили, по меньшей мере, к 70% смертности насекомых: 18, 20, 33 и 63.

Испытание H

Для оценки борьбы с западным цветочным трипсом (Franklinellla occidentalis (Pergande)) путем контактирования и/или системно, объект испытания состоял из небольшой открытой емкости, внутри которой находилось бобовое растение Soleil на стадии развития 5-7 дней.

Испытуемые соединения приготавливали и разбрызгивали при 250, 50, 10 и 2 ppm. После разбрызгивания, объекты испытания сушили в течение 1 часа, и затем в каждый объект добавляли ~60 трипсов (взрослых особей и личинок). Сверху закрывали черной крышкой с пробитыми отверстиями, и объекты испытания выдерживали в течение 6 дней при 25°C и 45-55% относительной влажности. Каждый объект испытания затем визуально оценивали на поврежденность растений и на смертность насекомых.

Из соединений формулы 1, испытываемых при 250 ppm, следующие соединения обеспечивали уровни эффективности борьбы от очень хорошего до отличного (30% или менее повреждения растения и/или 100% смертность): 1, 2, 10, 34, 35, 39 и 40.

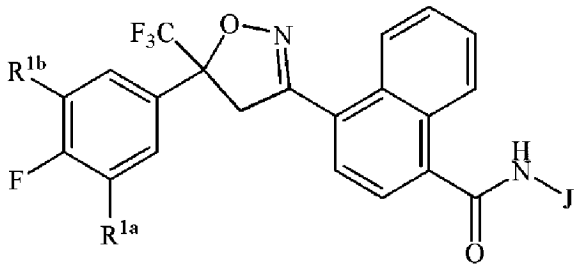
Из соединений формулы 1, испытываемых при 50 ppm, следующие соединения обеспечивали уровни эффективности борьбы от очень хорошего до отличного (30% или менее повреждения растения и/или 100% смертность: 1, 10, 34, 35, 39 и 40.

Из соединений формулы 1, испытываемых при 10 ppm, следующие соединения обеспечивали уровни эффективности борьбы от очень хорошего до отличного (30% или менее повреждения растения и/или 100% смертность: 1, 3, 4, 5, 7, 8, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 25, 26, 27, 28, 29, 31, 33, 34, 39, 41, 43, 44, 45, 46, 47, 48, 49, 50, 58, 59, 60, 61, 63, 65, 70, 71, 72, 73, 74, 75, 76, 78 и 79.

Из соединений формулы 1, испытываемых при 2 ppm, следующие соединения обеспечивали уровни эффективности борьбы от очень хорошего до отличного (30% или менее повреждения растения и/или 100% смертность: 3, 4, 8, 10, 11, 13, 14, 16, 19, 20, 22, 26, 27, 33, 34, 39, 43, 44, 46, 47, 50, 59, 60, 61, 63, 70, 71, 72, 73, 74, 75, 76, 78 и 79.

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Соединение формулы **1**,

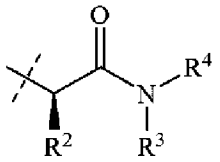


1

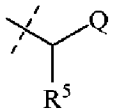
где

J представляет собой C2-C4 алкил, замещенный с помощью одной цианогруппы; -CH2(циклопропил), замещенный с помощью одной цианогруппы; или циклопропил, незамещенный или замещенный с помощью одной цианогруппы или одной группы $C(O)NHR^{17}$; или

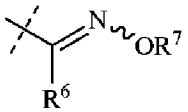
J представляет собой



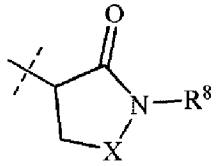
J-1



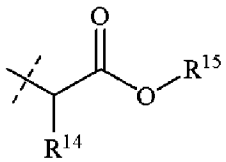
J-2



J-3

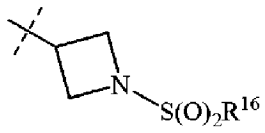


J-4



J-5

или



J-6

R^{1a} представляет собой Cl или CF_3;

R^{1b} представляет собой H или Cl;

R^2 представляет собой C1-C4 алкил, незамещенный или замещенный с помощью заместителей, выбранных из циано, нитро, OR^9, $S(O)nR^{10}$, $CO2R^{11}$ и $C(O)NR^{12}R^{13}$;

R^3 представляет собой H или C1-C4 алкил, незамещенный или замещенный с помощью заместителей, выбранных из циано, нитро, OR^9, $S(O)nR^{10}$, CO_2R^{11} и $C(O)NR^{12}R^{13}$;

R^4 представляет собой H, C1-C4 алкил или C1-C4 галогеналкил;

R^5 представляет собой H или C1-C4 алкил;

R^6 представляет собой H или C1-C4 алкил;

R^7 представляет собой H, C1-C4 алкил или C1-C4 галогеналкил;

X представляет собой -O- или -C(O)-;

R^8 представляет собой H, C1-C4 алкил, C1-C4 галогеналкил или C3-C6 циклоалкил;

каждый R^9, R^{10}, R^{11}, R^{12} и R^{13} представляет собой независимо H или C1-C4 алкил;

R^{14} представляет собой H или C1-C4 алкил, незамещенный или замещенный с помощью заместителей, выбранных из циано, нитро, OR^9, $S(O)nR^{10}$, CO_2R^{11} и $C(O)NR^{12}R^{13}$;

R^{15} представляет собой H, C1-C4 алкил или C1-C4 галогеналкил;

R^{16} представляет собой фтор, C1-C4 алкил, C1-C4 галогеналкил, C1-C6 алкокси, C1-C6 галогеналкокси, амино или C1-C6 алкиламино;

R^{17} представляет собой H, C1-C4 алкил, C1-C4 галогеналкил или C3-C6 циклоалкил;

Q представляет собой пиридинил, пиримидинил, пиразинил, пиридазинил, 1,2,4-триазинил, 1,3,5-триазинил, фуранил, тиенил, пирролил, пиразолил, имидазолил, 1,2,3-триазолил, 1,2,4-триазолил, тетразолил, оксазолил, тиазолил, изоксазолил, изотиазолил, 1,2,3-оксадиазолил, 1,2,4-оксадиазолил, 1,3,4-оксадиазолил, 1,2,3-тиадиазолил, 1,2,4-тиадиазолил или 1,3,4-тиадиазолил, каждый из которых не замещен или замещен с помощью заместителей, независимо выбранных из циано, нитро, галогена, C1-C4 алкила, C1-C4 галогеналкила, C1-C4 алкокси, C1-C4 галогеналкокси, C1-C4 алкилтио, C1-C4 галогеналкилтио, C1-C4 алкилсульфинила, C1-C4 галогеналкилсульфинила, C1-C4 алкилсульфонила, C1-C4 галогеналкилсульфонила, C2-C5 алкоксикарбонила, C2-C5 алкиламинокарбонила и C3-C5 диалкиламинокарбонила; и

каждый n представляет собой независимо 0, 1 или 2.

2. Соединение по п. 1, где

J представляет собой C2-C4 алкил, замещенный с помощью одной цианогруппы; -CH_2(циклопропил), замещенный с помощью одной цианогруппы; или циклопропил, незамещенный или замещенный с помощью одной цианогруппы или одной группы $C(O)NHR^{17}$; или J-1, J-2 или J-5.

3. Соединение по п. 2, где

R^{1a} представляет собой Cl, и R^{1b} представляет собой Cl; или

R^{1a} представляет собой CF_3, и R^{1b} представляет собой H.

4. Соединение по п. 3, где

J представляет собой C2-C4 алкил, замещенный с помощью одной цианогруппы, или циклопропил.

5. Соединение по п. 3, где J представляет собой J-1.

6. Соединение по п. 5, где

R^2 представляет собой метил;

R^3 представляет собой H или метил; и

R^4 представляет собой H или метил.

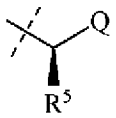
7. Соединение по п. 3, где J представляет собой J-2.

8. Соединение по п. 7, где

R^5 представляет собой H или метил; и

Q представляет собой пиридинил или пиримидинил.

9. Соединение по п. 8, где J-2 представляет собой



J-2a .

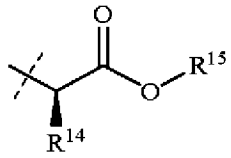
10. Соединение по п. 3, где J представляет собой J-5.

11. Соединение по п. 10, где

R^{14} представляет собой H или метил; и

R^{15} представляет собой C1-C4 алкил.

12. Соединение по п. 11, где J-5 представляет собой



J-5a .

13. Композиция, содержащая соединение по п. 1 и, по меньшей мере, один дополнительный компонент, выбранный из группы, состоящей из поверхностно-активных веществ, твердых разбавителей и жидких разбавителей, где указанная композиция необязательно дополнительно включает, по меньшей мере, одно дополнительное биологически активное соединение или средство.

14. Композиция по п. 13, где, по меньшей мере, одно дополнительное биологически активное соединение или средство выбирают из группы, состоящей из следующих веществ: абамектин, ацефат, ацехиноцил, ацетамиприд, акринатрин, афидопиропен, амидофлумет, амитраз, авермектин, азадирахтин, азинфос-метил, бенфуракарб, бенсултап, бифентрин, бифеназат, бистрифлурон, борат, бупрофезин, карбарил, карбофуран, картап, карзол, хлорантранилипрол, хлорфенапир, хлорфлуазурон, хлорпирифос, хлорпирифос-метил, хромафенозид, клофентезин, клотианидин, циантранилипрол, цикланилипрол, циклопротрин, циклоксаприд, цифлуметофен, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, гамма-цигалотрин, лямда-цигалотрин, циперметрин, альфа-циперметрин, дзета-циперметрин, циромазин, дельтаметрин, дипфентиурон, диазинон, диелдрин, дифлубензурон, димефлутрин, димегипо, диметоат, динотефуран, диофенолан, эмамектин, эндосульфан, эсфенвалерат, этипрол, этофенпрокс, этоксазол, фенбутатина оксид, фенитротион, фенотиокарб, феноксикарб, фенпропатрин, фенвалерат, фипронил, флометохин, флоникамид, флубендиамид, флуцитринат, флуфенерим, флуфеноксурон, флуфеноксистробин, флуфенсульфон, флуопирам, флупипрол, флупирадифурон, флувалинат, тау-флувалинат, фонофос, форметанат, фостиазат, галофенозид, гептафлутрин, гексафлумурон, гекситиазокс, гидраметилнон, имидаклоприд, индоксакарб, инсектицидные мыла, изофенфос, луфенурон, малатион, меперфлутрин, метафлумизон,

метальдегид, метамидофос, метидатион, метиодикарб, метомил, метопрен, метоксихлор, метофлутрин, монокротофос, монофлутрин, метоксифенозид, нитенпирам, нитиазин, новалурон, новифлумурон, оксамил, паратион, паратион-метил, перметрин, форат, фозалон, фосмет, фосфамидон, пиримикарб, профенофос, профлутрин, пропаргит, протрифенбут, пифлубумид, пиметрозин, пирафлупрол, пиретрин, пиридабен, пиридалил, пирифлухиназон, пириминостробин, пирипрол, пирипроксифен, ротенон, рианодин, силафлуофен, спинеторам, спиносад, спиродиклофен, спиромезифен, спиротетрамат, сульпрофос, сульфоксафлор, тебуфенозид, тебуфенпирад, тефлубензурон, тефлутрин, тербуфос, тетрахлорвинфос, тетраметрин, тетраметилфлутрин, тиаклоприд, тиаметоксам, тиодикарб, тиосультап-натрий, толфенпирад, тралометрин, триазамат, трихлорфон, трифлумурон, все штаммы Bacillus thuringiensis, энтомопатогенные бактерии, все штаммы вирусов ядерного полиэдроза, энтомопатогенные вирусы и энтомопатогенные грибы.

15. Композиция по п. 14 где, по меньшей мере, одно дополнительное биологически активное соединение или средство выбирают из группы, состоящей из следующих веществ: абамектин, ацетамиприд, акринатрин, афидопиропен, амитраз, авермектин, азадирахтин, бенфуракарб, бенсултап, бифентрин, 3-бром-1-(3-хлор-2-пиридинил)-N-[4-циано-2-метил-6-[(метиламино)карбонил]фенил]-1H-пиразол-5-карбоксамид, бупрофезин, карбарил, картап, хлорантранилипрол, хлорфенапир, хлорпирифос, клотианидин, циантранилипрол, цикланилипрол, циклопротрин, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, лямда-цигалотрин, гамма-цигалотрин, циперметрин, альфа-циперметрин, дзета-циперметрин, циромазин, дельтаметрин, диелдрин, динотефуран, диофенолан, эмамектин, эндосульфан, эсфенвалерат, этипрол, этофенпрокс, этоксазол, фенитротион, фенотиокарб, феноксикарб, фенвалерат, фипронил, флометохин, флоникамид, флубендиамид, флуфеноксурон, флуфеноксистробин, флуфенсульфон, флупипрол, флупирадифурон, флувалинат, форметанат, фостиазат, гептафлутрин, гексафлумурон, гидраметилнон, имидаклоприд, индоксакарб, луфенурон, меперфлутрин, метафлумизон, метиодикарб, метомил, метопрен, метоксифенозид, метофлутрин, монофлутрин, нитенпирам, нитиазин, новалурон, оксамил, пифлубумид, пиметрозин, пиретрин, пиридабен, пиридалил, пириминостробин, пирипроксифен, рианодин, спинеторам, спиносад, спиродиклофен, спиромезифен, спиротетрамат, сульфоксафлор, тебуфенозид, тетраметрин, тиаклоприд, тиаметоксам, тиодикарб, тиосультап-натрий, тралометрин, тетраметилфлутрин, триазамат, трифлумурон, все штаммы Bacillus thuringiensis и все штаммы вирусов ядерного полиэдроза.

16. Способ борьбы с беспозвоночным вредителем, включающий контактирование беспозвоночного вредителя или среды его обитания с биологически эффективным количеством соединения по п. 1.

17. Протравленные семена, включающие соединение по п. 1 в количестве от приблизительно 0,0001 до 1% по массе семян до обработки.

По доверенности