

(19)



Евразийское  
патентное  
ведомство

(21) 202191472 (13) A1

## (12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ

(43) Дата публикации заявки  
2021.09.10(51) Int. Cl. C07D 213/26 (2006.01)  
A01N 53/00 (2006.01)  
C07C 237/42 (2006.01)  
C07D 333/12 (2006.01)(22) Дата подачи заявки  
2019.11.15

## (54) МЕТА-ДИАМИДНЫЕ СОЕДИНЕНИЯ ДЛЯ БОРЬБЫ С БЕСПОЗВОНОЧНЫМИ ВРЕДИТЕЛЯМИ

(31) 62/771,414

(72) Изобретатель:

(32) 2018.11.26

Пахутски, мл., Томас Фрэнсис, Слэк  
Рэйчел, Деанджелис Эндрю Джон (US)

(33) US

(86) PCT/US2019/061764

(74) Представитель:

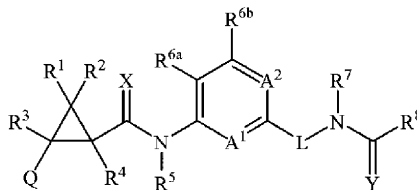
(87) WO 2020/112390 2020.06.04

Медведев В.Н. (RU)

(71) Заявитель:

ФМК КОРПОРЕЙШН (US)

(57) Описаны соединения формулы 1, их N-оксиды и соли



1

где Q, X, Y, A<sup>1</sup>, A<sup>2</sup>, L, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6a</sup>, R<sup>6b</sup>, R<sup>7</sup> и R<sup>8</sup> представляют собой, как определено в настоящем изобретении. Также описаны композиции, содержащие соединения формулы 1 и способы борьбы с беспозвоночными вредителями, включающие контакт беспозвоночного вредителя или его окружающей среды с биологически эффективным количеством соединения или композиции настоящего изобретения.

A1

202191472

202191472

A1

# ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ

2420-568658EA/018

## МЕТА-ДИАМИДНЫЕ СОЕДИНЕНИЯ ДЛЯ БОРЬБЫ С БЕСПОЗВОНОЧНЫМИ ВРЕДИТЕЛЯМИ

### ПЕРЕКРЕСТНАЯ ССЫЛКА НА РОДСТВЕННЫЕ ЗАЯВКИ

Настоящая заявка испрашивает приоритет предварительной заявки на патент США 62/771414, поданной 26 ноября 2018.

### ОБЛАСТЬ ТЕХНИКИ НАСТОЯЩЕГО ИЗОБРЕТЕНИЯ

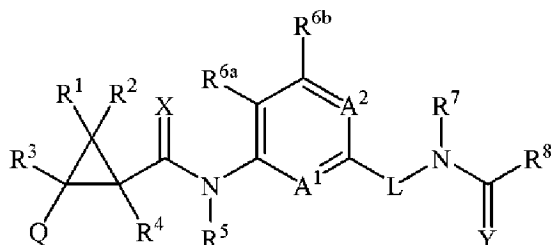
Настоящее изобретение относится к определенным диамидным соединениям, их N-оксидам, солям и композициям, пригодным для агрономического и неагрономического применения, и способам их применения для борьбы с беспозвоночными вредителями, такими как членистоногие, как в агрономической, так и в неагрономической среде.

### УРОВЕНЬ ТЕХНИКИ

Борьба с беспозвоночными вредителями чрезвычайно важна для достижения высокой продуктивности сельскохозяйственных культур. Повреждение беспозвоночными вредителями растущим и хранящимся агрономическим культурам может привести к значительному снижению продуктивности и, таким образом, к увеличению затрат для потребителя. Также важна борьба с беспозвоночными вредителями в лесном хозяйстве, тепличных культурах, декоративных культурах, саженцах, при хранении пищевых и волокнистых продуктов, животноводстве, домашнем хозяйстве, газоне, продукции из древесины, а также для здоровья населения и животных. Для этих целей коммерчески доступны многие продукты, но сохраняется потребность в новых соединениях, которые являются более эффективными, менее дорогостоящими, менее токсичными, более безопасными для окружающей среды или имеющими другие участки действия.

### СУЩНОСТЬ НАСТОЯЩЕГО ИЗОБРЕТЕНИЯ

Настоящее изобретение относится к соединениям формулы **1**, их N-оксидам и солям, и содержащим их композициям и их применению для борьбы с беспозвоночными вредителями:



**1**

где

R<sup>1</sup> представляет собой H, F, Cl, Br, I, CH<sub>3</sub> или CF<sub>3</sub>

R<sup>2</sup> представляет собой F, Cl, Br, I, CH<sub>3</sub> или CF<sub>3</sub>;

каждый R<sup>3</sup> и R<sup>4</sup> независимо представляет собой H или C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> алкил;

Q представляет собой фенил, тиофенил, фуранил, пиридинил или нафталенил, причем каждый является незамещенным или замещенным 1-3 R10;

X представляет собой O или S;

Y представляет собой O или S;

R5 представляет собой H, C(O)OR<sup>11</sup>, C(O)NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>, C(O)R<sup>14</sup> или S(O)<sub>n</sub>R<sup>15</sup>; или C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкил, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкенил или C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкинил, причем каждый является незамещенным или замещенным, по меньшей мере, одним R<sup>x</sup>;

A1 представляет собой CR9a или N;

A2 представляет собой CR9b или N;

R6a представляет собой H, галоген, циано, нитро, C(O)OR<sup>11</sup>, C(O)NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>, C(O)R<sup>14</sup>, NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>, OR<sup>16</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>15</sup> или SO<sub>2</sub>NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>; или C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкил, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкенил, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкинил, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub> циклоалкил или C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> циклоалкилалкил, причем каждый является незамещенным или замещенным, по меньшей мере, одним R<sub>x</sub>;

R6b представляет собой H, галоген, циано, нитро, C(O)OR<sup>11</sup>, C(O)NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>, C(O)R<sup>14</sup>, NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>, OR<sup>16</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>15</sup> или SO<sub>2</sub>NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>; или C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкил, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкенил, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкинил, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub> циклоалкил или C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> циклоалкилалкил, причем каждый является незамещенным или замещенным, по меньшей мере, одним R<sub>x</sub>;

L представляет собой C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> алкиленил, незамещенный или замещенный 1 или 2 C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> алкилами;

R7 представляет собой H, C(O)OR<sup>11</sup>, C(O)NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>, C(O)R<sup>14</sup> или S(O)<sub>n</sub>R<sup>15</sup>; или C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкил, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкенил или C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкинил, причем каждый является незамещенным или замещенным, по меньшей мере, одним R<sup>x</sup>;

R8 представляет собой H, NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>, OR<sup>16</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>15</sup> или SO<sub>2</sub>NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>; или C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкил, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкенил, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкинил, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub> циклоалкил или C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> циклоалкилалкил, причем каждый является незамещенным или замещенным, по меньшей мере, одним R<sub>x</sub>; или фенил, 5- или 6-членное гетероциклическое ароматическое кольцо или 3-7-членное гетероциклическое неароматическое кольцо, причем каждое кольцо содержит кольцевые атомы, выбранные из атомов углерода и 2 гетероатомов, независимо выбранных из одного атома кислорода, одного атома серы, и вплоть до 2, где вплоть до 2 кольцевых члена, являющихся атомами углерода, независимо выбраны из C(=O) и C(=S), и кольцевой член, являющийся атомом серы, выбран из S, S(O) или S(O)<sub>2</sub>, причем кольцо является незамещенным или замещенным, по меньшей мере, одним заместителем, независимо выбранных из группы, состоящей из галогена, циано, нитро, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкила, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилтио, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилтио, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилсульфинила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилсульфинила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилсульфонила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилсульфонила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилкарбонила или C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкоксикарбонила;

каждый R<sup>x</sup> независимо представляет собой галоген, циано, нитро, гидроксиль, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> галогеналкил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> галогеналкокси, C(O)OR<sup>11</sup>, C(O)NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>, NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>, C(O)R<sup>14</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>15</sup> или SO<sub>2</sub>NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>;

R9a представляет собой H, галоген, циано, нитро, C(O)OR<sub>11</sub>, C(O)NR<sub>12</sub>R<sub>13</sub>, C(O)R<sub>14</sub>, NR<sub>12</sub>R<sub>13</sub>, OR<sub>16</sub>, S(O)<sub>n</sub>R<sub>15</sub> или SO<sub>2</sub>NR<sub>12</sub>R<sub>13</sub>; или C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкил, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкенил, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкинил, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub> циклоалкил или C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> циклоалкилалкил, причем каждый является незамещенным или замещенным, по меньшей мере, одним R<sub>x</sub>;

R9b представляет собой H, галоген, циано, нитро, C(O)OR<sub>11</sub>, C(O)NR<sub>12</sub>R<sub>13</sub>, C(O)R<sub>14</sub>, NR<sub>12</sub>R<sub>13</sub>, OR<sub>16</sub>, S(O)<sub>n</sub>R<sub>15</sub> или SO<sub>2</sub>NR<sub>12</sub>R<sub>13</sub>; или C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкил, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкенил, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкинил, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub> циклоалкил или C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> циклоалкилалкил, причем каждый является незамещенным или замещенным, по меньшей мере, одним R<sub>x</sub>;

каждый R<sub>10</sub> независимо представляет собой галоген, циано, нитро, C(O)OR<sub>11</sub>, C(O)NR<sub>12</sub>R<sub>13</sub>, C(O)R<sub>14</sub>, NR<sub>12</sub>R<sub>13</sub>, OR<sub>16</sub>, S(O)<sub>n</sub>R<sub>15</sub> или SO<sub>2</sub>NR<sub>12</sub>R<sub>13</sub>; или C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкил, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкенил, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкинил, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub> циклоалкил или C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> циклоалкилалкил, причем каждый является незамещенным или замещенным, по меньшей мере, одним R<sub>x</sub>; и где два R<sub>10</sub> соединены с соседними атомами углерода, указанные два R<sub>10</sub> можно взять вместе с атомами углерода, с которыми они соединены, образуя 3-7-членное кольцо, содержащее кольцевые члены, выбранные и атомов углерода и вплоть до 2 гетероатомов, независимо выбранных из двух атомов кислорода, одного атома серы, и вплоть до 2 атомов азота, где вплоть до 2 кольцевых члена, являющихся атомами углерода, независимо выбраны из C(=O) и C(=S), и кольцевой член, являющийся атомом серы, выбран из S, S(O) или S(O)<sub>2</sub>, причем кольцо является незамещенным или замещенным, по меньшей мере, одним заместителем, независимо выбранным из группы, состоящей из галогена, циано, нитро, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкила, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкокси и C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкокси;

каждый R<sup>11</sup> независимо представляет собой C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкил или C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> галогенциклоалкил; или фенил, незамещенный или замещенный, по меньшей мере, одним заместителем, независимо выбранным из группы, состоящей из галогена, циано, нитро, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкила, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилтио, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилтио, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилсульфинила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилсульфинила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилсульфонила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилсульфонила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилкарбонила или C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкоксикарбонила;

каждый R<sup>12</sup> независимо представляет собой H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкил, C(O)R<sup>17</sup> или S(O)<sub>2</sub>R<sup>17</sup>; или фенил или 5- или 6-членное гетероциклическое ароматическое кольцо, причем каждый является незамещенным или замещенным, по меньшей мере, одним заместителем, независимо выбранным из группы, состоящей из галогена, циано, нитро, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкила, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилтио, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилтио, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилсульфинила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилсульфинила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилсульфонила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилсульфонила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилкарбонила или C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкоксикарбонила;

каждый R<sup>13</sup> независимо представляет собой H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкил или C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкил; или

R<sup>12</sup> и R<sup>13</sup> берут вместе с атомом азота, с которым они соединены, образуя 3-7-

членное кольцо, содержащее кольцевые члены, выбранные и атомов углерода и вплоть до 2 гетероатомов, независимо выбранных из одного атома кислорода, одного атома серы и вплоть до 2 атомов азота, где вплоть до 2 кольцевых члена, являющихся атомами углерода, независимо выбраны из C(=O) и C(=S), и кольцевой член, являющийся атомом серы, выбран из S, S(O) или S(O)<sub>2</sub>, причем кольцо является незамещенным или замещенным, по меньшей мере, одним заместителем, независимо выбранным из группы, состоящей из галогена, циано, нитро, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкила, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилтио, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилтио, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилсульфинила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилсульфинила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилсульфонила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилсульфонила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилкарбонила или C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкоксикарбонила;

каждый R<sup>14</sup> независимо представляет собой C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкил или C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> галогенциклоалкил; или фенил, незамещенный или замещенный, по меньшей мере, одним заместителем, независимо выбранным из группы, состоящей из галогена, циано, нитро, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкила, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилтио, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилтио, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилсульфинила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилсульфинила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилсульфонила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилсульфонила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилкарбонила или C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкоксикарбонила;

каждый R<sup>15</sup> независимо представляет собой C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкил или C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> галогенциклоалкил; или фенил, незамещенный или замещенный, по меньшей мере, одним заместителем, независимо выбранным из группы, состоящей из галогена, циано, нитро, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкила, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилтио, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилтио, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилсульфинила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилсульфинила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилсульфонила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилсульфонила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилкарбонила или C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкоксикарбонила;

каждый R<sup>16</sup> независимо представляет собой C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкил или C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> галогенциклоалкил; или фенил, незамещенный или замещенный, по меньшей мере, одним заместителем, независимо выбранным из группы, состоящей из галогена, циано, нитро, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкила, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилтио, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилтио, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилсульфинила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилсульфинила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилсульфонила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилсульфонила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилкарбонила или C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкоксикарбонила;

каждый R<sup>17</sup> независимо представляет собой C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкил или C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> галогенциклоалкил; и

каждый n независимо представляет собой 0, 1 или 2.

Настоящее изобретение также относится к композиции, содержащей соединение формулы **1**, его N-оксид или соль, и, по меньшей мере, один дополнительный компонент, выбранный из группы, состоящей из поверхностно-активных соединений, твердых разбавителей и жидких разбавителей. В одном варианте осуществления, настоящее изобретение также относится к композиции для борьбы с беспозвоночными вредителями,

содержащей соединение формулы **1**, его N-оксид или соль, и, по меньшей мере, один дополнительный компонент, выбранный из группы, состоящей из поверхностно-активных соединений, твердых разбавителей и жидких разбавителей, причем указанная композиция необязательно дополнительно содержит, по меньшей мере, одно биологически активное соединение или агент.

Настоящее изобретение также относится к способу борьбы с беспозвоночными вредителями, включающему контакт беспозвоночного вредителя или его окружающей среды с биологически эффективным количеством соединения формулы **1**, его N-оксидом или соль (например, в виде композиции, описанной в настоящем изобретении). Настоящее изобретение также относится к такому способу, в котором беспозвоночный вредитель или его окружающей среды контактирует с композицией, содержащей биологически эффективное количество соединения формулы **1**, его N-оксида или соли, и, по меньшей мере, один дополнительный компонент, выбранный из группы, состоящей из поверхностно-активных соединений, твердых разбавителей и жидких разбавителей, причем указанная композиция необязательно дополнительно содержит биологически эффективное количество, по меньшей мере, одного дополнительного биологически активного соединения или агента.

Настоящее изобретение также относится к способу борьбы с беспозвоночными вредителями, включающему контакт беспозвоночного вредителя или его окружающей среды с биологически эффективным количеством любой из приведенных выше композиций, где окружающая среда представляет собой растение.

Настоящее изобретение также относится к способу борьбы с беспозвоночными вредителями, включающему контакт беспозвоночного вредителя или его окружающей среды с биологически эффективным количеством любой из приведенных выше композиций, где окружающая среда представляет собой животное.

Настоящее изобретение также относится к способу борьбы с беспозвоночными вредителями, включающему контакт беспозвоночного вредителя или его окружающей среды с биологически эффективным количеством любой из приведенных выше композиций, где окружающая среда представляет собой семена.

Настоящее изобретение также относится к способу защиты семян от беспозвоночного вредителя, включающему контакт семян с биологически эффективным количеством соединения формулы **1**, его N-оксида или соли (например, в виде композиции, описанной в настоящем изобретении). Настоящее изобретение также относится к обработанным семенам (т.е., семенам, контактировавшим с соединением формулы **1**).

Настоящее изобретение также относится к способу увеличения жизнеспособности культурного растения, включающему контакт культурного растения, семян, из которого выращено культурное растение, или локуса (например, питательной среды) культурного растения с биологически эффективным количеством соединения формулы **1** (например, в виде композиции, описанной в настоящем изобретении)

### Подробное описание

Как применяют в настоящем изобретении, предполагается, что термины “содержит,” “содержащий,” “включающий,” “включая,” “имеет,” “имеющий,” “характеризующийся” или любой другой их вариант, включают неисключительное включение с учетом явно указанных ограничений. Например, композиция, смесь, процесс или способ, который содержит список элементов, не обязательно ограничивается только данными элементами, но может включать другие элементы, не перечисленные явно или присущие данной композиции, смеси, процессу или способу.

Переходная фраза «состоящий из» исключает любой неуказанный элемент, стадию или ингредиент. Если она находится в пункте формулы изобретения, она может завершать пункт включением материалов, отличных от перечисленных, за исключением примесей, обычно связанных с ними. Когда фраза «состоящий из» появляется в придаточном предложении основной части пункта, а не сразу после преамбулы, она ограничивает только элемент, изложенный в данном придаточном предложении; другие элементы не исключаются из утверждения в целом.

Переходную фразу «состоящий по существу из» применяют для определения композиции или способа, который включает материалы, стадии, признаки, компоненты или элементы, в дополнение к тем, которые описаны буквально, при условии, что данные дополнительные материалы, стадии, признаки, компоненты или элементы существенно не влияют на основные и новые характеристики заявленного изобретения. Термин «состоящий по существу из» занимает золотую середину между «содержащим» и «состоящим из».

Если заявители определили изобретение или его часть открытым термином, таким как «содержащий», следует понимать, что (если не указано иное) описание следует интерпретировать так, чтобы оно также описывало данное изобретение, применяя термины «состоящее по существу из» или “состоящий из”.

Кроме того, если прямо не указано иное, «или» относится к включающему или и не относится к исключающему или. Например, условие А или В удовлетворяется одним из следующих условий: А истинно (или присутствует) и В ложно (или отсутствует), А ложно (или отсутствует) и В истинно (или присутствует), и оба А и В истинны (или присутствуют).

Кроме того, неопределенные артикли «а» и «an», предшествующие элементу или компоненту настоящего изобретения, предназначены для того, чтобы не ограничивать количество экземпляров (т.е., появлений) элемента или компонента. Следовательно, «а» или «an» следует читать как включающие один или, по меньшей мере, один, и форма слова единственного числа элемента или компонента также включает множественное число, если явно не предполагается, что число является единичным.

Также ясно, что любой числовой диапазон, приведенный в настоящем изобретении, включает все значения от нижнего значения до верхнего значения. Например, если диапазон весового отношения заявлен как 1:50, предполагается, что значения, такие как

2:40, 10:30 или 1:3 и т.д., явно перечислены в данном описании. Это только примеры того, что именно предполагается, и все возможные комбинации числовых значений между и включая перечисленные наименьшее значение и наибольшее значение должны рассматриваться как явно указанные в настоящем изобретении.

Как ссылаются в настоящем изобретении, термин “беспозвоночный вредитель” включает членистоногих, брюхоногих, нематод и гельминтов, имеющие хозяйственное значение как вредители. Термин «членистоногие» включает насекомых, клещей, пауков, скорпионов, многоножек, двупарноногих, мокриц и симфилов. Термин «брюхоногие» включает улиток, слизней и других Stylommatophora. Термин «нематода» включает представителей филума нематод, таких как нематоды-фитофаги и нематоды-гельминты, паразитирующие на животных. Термин «гельминт» включает всех паразитических червей, таких как круглые черви (филум Nematoda), сердечные черви (филум Nematoda, класс Secernentea), сосальщики (филум Platyhelminthes, класс Tematoda), акантоцефаланы (филум Acanthocephala) и ленточные червячки (филум Platyhelminthes, класс Cestoda).

В контексте настоящего изобретения “борьба с беспозвоночным вредителем” обозначает ингибирование развития беспозвоночного вредителя (включая смертность, снижение кормления и/или нарушение спаривания), и родственные выражения определяют аналогично.

Термин «агрономический» относится к выращиванию полевых культур, таких как пищевые продукты и волокна, и включает выращивание маиса или кукурузы, сои и других бобовых, риса, зерновых (например, пшеницы, овса, ячменя, ржи и риса), листовых овощей (например, салата, капусты и других выращиваемых культур), плодовых овощей (например, томатов, перца, баклажанов, крестоцветных и тыквенных), картофеля, сладкого картофеля, винограда, хлопка, древесных плодов (например, семечковых, косточковых и цитрусовых), мелких фруктов (например, ягод и вишни) и других специальных культур (например, рапса, подсолнечника и оливок).

Термин «неагрономический» относится к отличным от полевых культурам, таким как садовые культуры (например, тепличные растения, саженцы или декоративные растения, не выращиваемые в поле), жилые, сельскохозяйственные, коммерческие и промышленные сооружения, травяной покров (например, дерновая ферма, пастбище, корт для гольфа, лужайка, спортивная площадка и т.д.), изделия из древесины, хранимая продукция, агролесоводство и контроль растительности, общественное здравоохранение (т.е., здоровье человека) и здоровье животных (например, одомашненных животных, таких как домашние животные, домашний скот и домашняя птица, неприрученных животных, таких как дикие животные).

Термин «жизнеспособность культуры» относится к скорости роста или накоплению биомассы культурного растения. «Повышение жизнеспособности» относится к увеличению роста или накоплению биомассы в культурном растении по сравнению с необработанным контрольным культурным растением. Термин «урожайность» относится к рентабельности растительного материала, как по количеству, так и по качеству,



полученной после уборки урожая. «Повышение урожайности» относится к увеличению урожайности по сравнению с необработанным контрольным растением.

Термин “биологически эффективное количество” относится к количеству биологически активного соединения (например, соединения формулы 1), достаточному для получения требуемого биологического эффекта при нанесении (т.е., при контакте с) на беспозвоночного вредителя, с которым борются, или в его окружающую среду, или на растение, семена, из которого выращено растение, или locus растения (например, питательную среду) для защиты растения от повреждения беспозвоночным вредителем или для другого требуемого эффекта (например, увеличения жизнеспособности растения).

В приведенном выше описании, термин “алкил”, применяемый или отдельно или в составных словах, таких как “алкилтио” или “галогеналкил”, включает нормальный или разветвленный алкил, такой как метил, этил, *n*-пропил, изопропил различные изомеры бутила, пентила или гексила. “Алкенил” включает нормальные или разветвленные алкены, такие как этенил, 1-пропенил, 2-пропенил и различные изомеры бутенила, пентенила и гексенила. “Алкенил” также включает полиены, такие как 1,2-пропадиенил и 2,4-гексадиенил. “Алкинил” включает нормальные или разветвленные алкины, такие как этинил, 1-пропинил, 2-пропинил и различные изомеры бутинила, пентинила и гексинила. “Алкинил” может также включать фрагменты, состоящие из нескольких тройных связей, такие как 2,5-гексадиинил. “Алкилен” обозначает нормальный или разветвленный алкандиол. Примеры “алкилена” включают  $\text{CH}_2$ ,  $\text{CH}_2\text{CH}_2$ ,  $\text{CH}(\text{CH}_3)$ ,  $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ ,  $\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)$  различные изомеры бутилена.

“Алкокси” включает, например, метокси, этокси, *n*-пропилокси, изопропилокси и различные изомеры бутокси, пентокси и гексокси.

“Циклоалкил” включает, например, циклопропил, циклобутил, циклопентил и циклогексил. Термин “алкилциклоалкил” обозначает алкильное замещение по циклоалкильному фрагменту и включает, например, этилциклопропил, изопропилциклобутил, 3-метилциклопентил и 4-метилциклогексил. Термин “циклоалкилалкил” обозначает циклоалкильное замещение по алкильному фрагменту. Примеры “циклоалкилалкила” включают циклопропилметил, циклопентилэтил, и другие циклоалкильные фрагменты, соединенные с нормальными или разветвленными алкильными группами.

Термин “галоген”, или отдельно или в составных словах, таких как “галогеналкил”, или при применении в описаниях, таких как “алкил, замещенный галогеном” включает фтор, хлор, бром или йод. Кроме того, при применении в составных словах, таких как “галогеналкил”, или при применении в описаниях, таких как “алкил, замещенный галогеном”, указанный алкил может быть частично или полностью замещен атомами галогена, которые могут быть одинаковыми или отличными. Примеры “галогеналкила” или “алкила, замещенного галогеном” включают  $\text{F}_3\text{C}$ -,  $\text{ClCH}_2$ -,  $\text{CF}_3\text{CH}_2$ - и  $\text{CF}_3\text{CCl}_2$ -.

Химические сокращения  $\text{S}(\text{O})$  и  $\text{S}(=\text{O})$ , как применяют в настоящем изобретении, представляют собой сульфинильный фрагмент. Химические сокращения  $\text{SO}_2$ ,  $\text{S}(\text{O})_2$  и

$S(=O)_2$ , как применяют в настоящем изобретении, представляют собой сульфонильный фрагмент. Химические сокращения  $C(O)$  и  $C(=O)$ , как применяют в настоящем изобретении, представляют собой карбонильный фрагмент. Химические сокращения  $CO_2$ ,  $C(O)O$  и  $C(=O)O$ , как применяют в настоящем изобретении, представляют собой оксикарбонильный фрагмент. “СНО” обозначает формил.

Если не указано иначе, “кольцо” или “кольцевая система” в качестве компонента формулы **1** является карбоциклическим или гетероциклическим. Термин “кольцевая система” обозначает два или более сопряженных колец. Термин “кольцевой член” относится к атому или другому фрагменту (например,  $C(=O)$ ,  $C(=S)$ ,  $S(O)$  или  $S(O)_2$ ), образующему остов кольца или кольцевой системы.

Термины “гетероциклическое кольцо”, “гетероцикл” или “гетероциклическая кольцевая система” обозначают кольцо или кольцевую систему, в которой, по меньшей мере, один атом, образующий кольцевой остов, не является углеродом, например, азот, кислород или сера. Обычно гетероциклическое кольцо содержит не более чем 4 азота, не более чем 2 кислорода и не более чем 2 серы. Если не указано иначе, карбоциклическое кольцо или гетероциклическое кольцо может представлять собой насыщенное или ненасыщенное кольцо.

Если не указано иначе, гетероциклические кольца и кольцевые системы можно присоединять через любой доступный углерод или азот путем замены водорода при указанном углероде или азоте.

“Ароматический” указывает на то, что каждый из кольцевых атомов по существу находится в той же плоскости и имеет  $n$ -орбиталь, перпендикулярную плоскости кольца, и в которой  $(4n+2)$   $\pi$  электронов, где  $n$  представляет собой положительное целое, соединены с кольцом в соответствии с правилом Хюккеля. Термин “ароматическая кольцевая система” обозначает карбоциклическую или гетероциклическую кольцевую систему, в которой, по меньшей мере, одно кольцо кольцевой системы является ароматическим. Когда полностью ненасыщенное карбоциклическое кольцо удовлетворяет правилу Хюккеля, это кольцо также называют «ароматическим кольцом» или «ароматическим карбоциклическим кольцом».

Термин “ароматическая карбоциклическая кольцевая система” обозначает карбоциклическую кольцевую систему, в которой, по меньшей мере, одно кольцо кольцевой системы является ароматическим. Когда полностью ненасыщенное гетероциклическое кольцо удовлетворяет правилу Хюккеля, то указанное кольцо также называют “гетероароматическим кольцом” или “ароматическим гетероциклическим кольцом”. Термин “ароматическая гетероциклическая кольцевая система” обозначает гетероциклическую кольцевую систему, в которой, по меньшей мере, одно кольцо кольцевой системы является ароматическим.

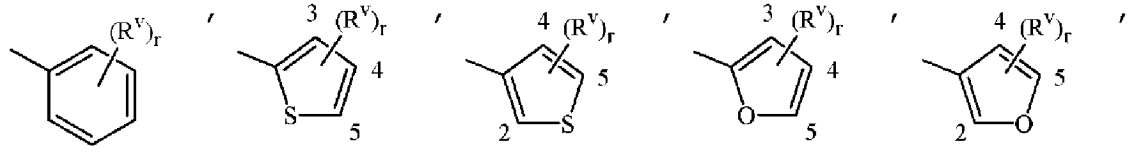
Термин “необязательно замещенный” в сочетании с гетероциклическими кольцами относится к группам, которые являются незамещенными или содержат, по меньшей мере, один заместитель, отличный от водорода, который не подавляет биологическую

активность, которой обладает незамещенный аналог. Как применяют в настоящем изобретении, применяют следующие определения, если не указано иначе. Термин «необязательно замещенный» применяют взаимозаменяемо с фразой «замещенный или незамещенный» или термином «(не)замещенный». Если не указано иначе, необязательно замещенная группа может содержать заместитель в каждом замещаемом положении группы, и каждое замещение не зависит от другой.

Когда R8 представляет собой 5- или 6-членное азотсодержащее гетероциклическое кольцо, оно может быть присоединено к остатку формулы **1** через любой иеющийся кольцевой атом углерода или азота, если не описано иначе. Как указано выше, R8 может представлять собой (среди других) фенил, необязательно замещенный одним или более заместителями, выбранными из группы заместителей, как определено в сущности настоящего изобретения. Пример фенила, необязательно замещенного одним-пятью заместителями, представляет собой кольцо, показанное как U-1 в приложении 1, где Rv представляет собой, как определено сущности настоящего изобретения для R8, и г представляет собой целое 0-5.

Как указано выше, R8 может представлять собой (среди других) 5- или 6-членное гетероциклическое кольцо, которое может быть замещенным или незамещенным, необязательно замещенным одним или более заместителями, выбранными из группы заместителей, как определено в сущности настоящего изобретения. Примеры 5- или 6-членного ненасыщенного ароматического гетероциклического кольца, необязательно замещенного одним или более заместителями, включают кольца U-2-U-61, показанные в приложении 1, где Rv представляет собой любой заместитель, как определено в сущности настоящего изобретения для R8, и г представляет собой целое 0-4, ограниченное количеством доступных положений при каждой группе U. Поскольку U-29, U-30, U-36, U-37, U-38, U-39, U-40, U-41, U-42 и U-43 имеют только одно доступное положение, для данных групп U г ограничено целыми числами 0 или 1, и г, равный 0, обозначает, что группа U незамещена, и водород присутствует в положении, обозначенном (Rv)г.

## Приложение 1



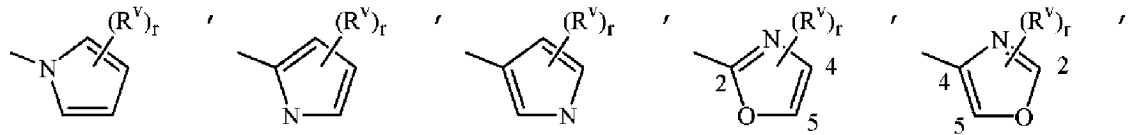
U-1

U-2

U-3

U-4

U-5



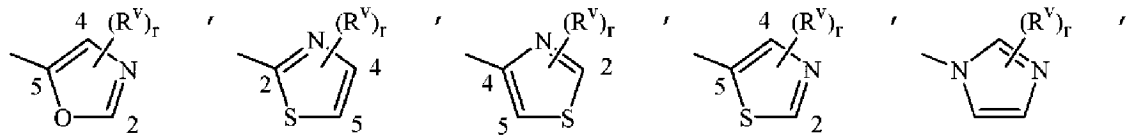
U-6

U-7

U-8

U-9

U-10



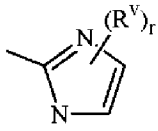
U-11

U-12

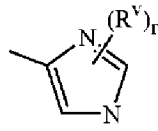
U-13

U-14

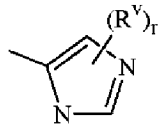
U-15



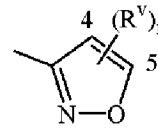
U-16



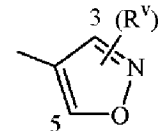
U-17



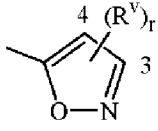
U-18



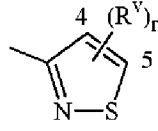
U-19



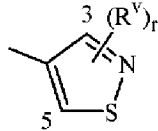
U-20



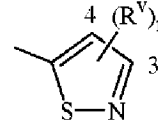
U-21



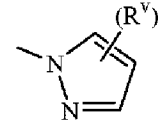
U-22



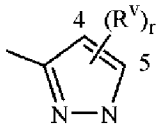
U-23



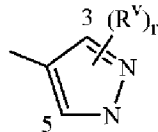
U-24



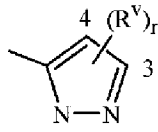
U-25



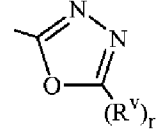
U-26



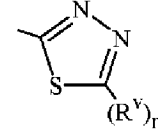
U-27



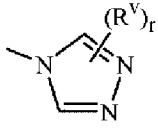
U-28



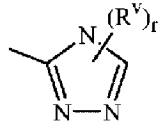
U-29



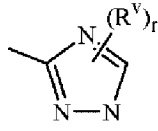
U-30



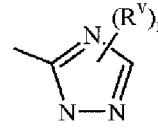
U-31



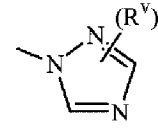
U-32



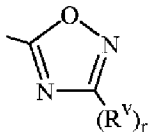
U-33



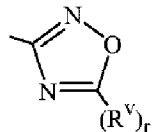
U-34



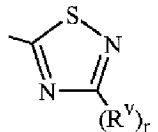
U-35



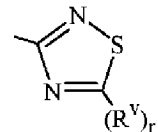
U-36



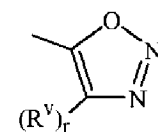
U-37



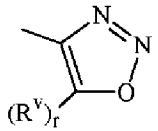
U-38



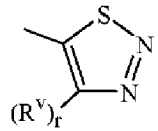
U-39



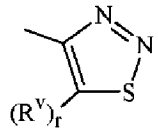
U-40



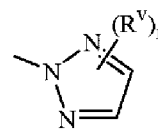
U-41



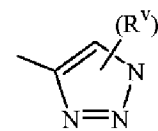
U-42



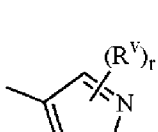
U-43



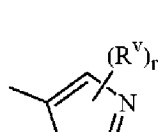
U-44



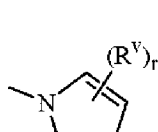
U-45



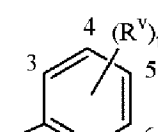
U-46



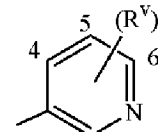
U-47



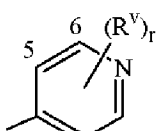
U-48



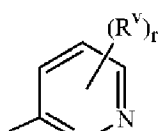
U-49



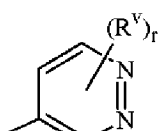
U-50



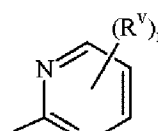
U-51



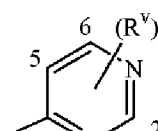
U-52



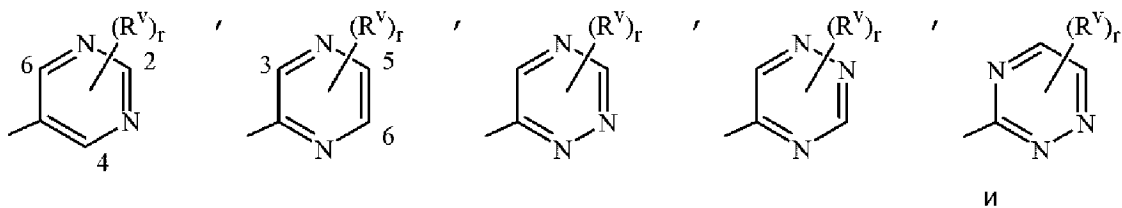
U-53



U-54



U-55



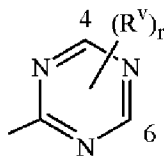
U-56

U-57

U-58

U-59

U-60



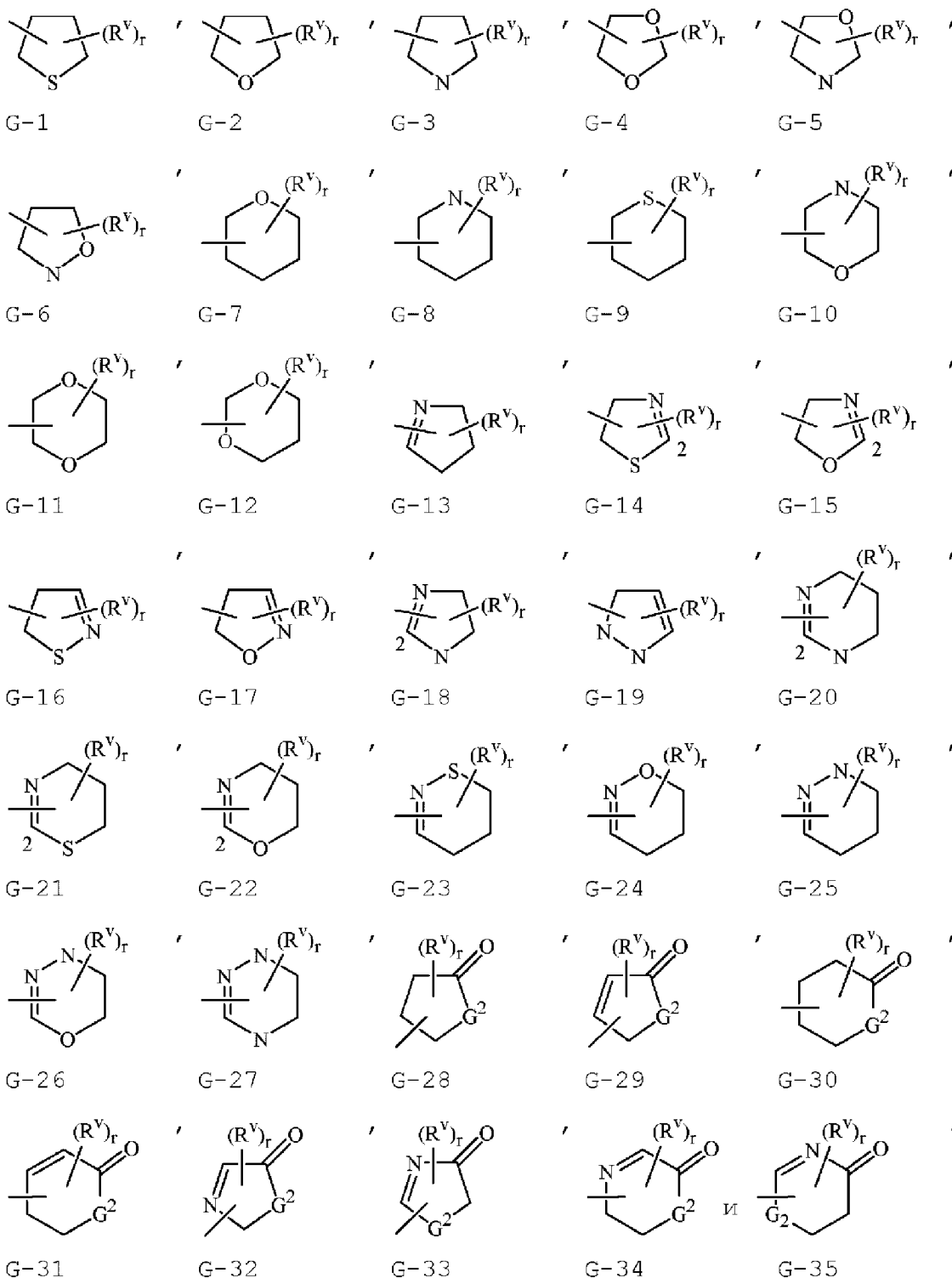
U-61

Следует отметить, что когда R8 представляет собой 3-7-членное гетероциклическое неароматическое кольцо, необязательно замещенное одним или более заместителями, выбранными из группы заместителей, как определено в сущности настоящего изобретения для R8, один или два углеродных кольцевых члена гетероцикла могут необязательно быть в окисленной форме карбонильного фрагмента.

Примеры 5- или 6-членного неароматического гетероциклического кольца включают кольца G-1-G-35, как показано в приложении 2. Следует отметить, что когда место присоединения по G группе показано как плавающее, G группа может быть присоединена к остатку формулы **1** через любой имеющийся углерод или азот G группа замещением атома водорода. Необязательные заместители, соответствующие R<sub>v</sub>, можно присоединять к любому доступному углероду или азоту путем замещения атома водорода. Для данных G колец г обычно представляет собой целое 0-4, ограниченное количеством доступных позиций в каждой G группе.

Следует отметить, что когда R8 содержит кольцо, выбранное из G-28-G-35, G2 выбран из O, S или N. Следует отметить, что когда G2 представляет собой N, атом азота может завершить свою валентность замещением или на H или на заместители, соответствующие R<sub>v</sub>, как определено в сущности настоящего изобретения для R8.

## Приложение 2



В данной области известен широкий спектр синтетических способов, позволяющих получить ароматические и неароматические гетероциклические кольца и кольцевые системы; для подробных обзоров смотри набор из восьми томов *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, A. R. Katritzky and C. W. Rees editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1984 и набор из двенадцати томов *Comprehensive Heterocyclic Chemistry II*, A. R. Katritzky, C. W. Rees and E. F. V. Scriven editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1996.

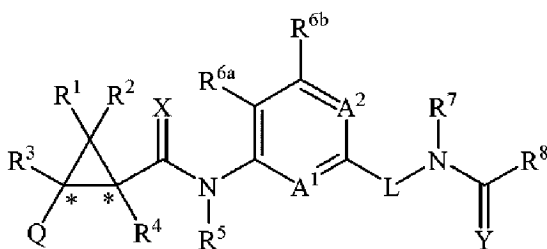
Соединения настоящего изобретения могут существовать в виде одного или более стереоизомеров. Стереоизомеры представляют собой изомеры идентичного строения, но

различаются расположением атомов в пространстве и включают энантиомеры, диастереомеры, цис-транс изомеры (также известные как геометрические изомеры) и атропоизомеры. Атропоизомеры возникают в результате ограниченного вращения вокруг одинарных связей, где вращательный барьер достаточно высок, чтобы обеспечить выделение изомерных молекул. Специалист в данной области техники поймет, что один стереоизомер может быть более активным и/или может иметь положительные эффекты при обогащении по сравнению с другим стереоизомером (стереоизомерами) или при отделении от другого стереоизомера (стереоизомеров). Кроме того, специалист знает, как разделить, обогатить и/или селективно получить указанные стереоизомеры. Для всестороннего обсуждения всех аспектов стереоизомерии, смотри Ernest L. Eliel and Samuel H. Wilen, *Stereochemistry of Organic Compounds*, John Wiley & Sons, 1994.

Приведенные в настоящем изобретении молекулярные изображения соответствуют стандартным правилам изображения стереохимии. Для обозначения стереоконфигурации связи, поднимающиеся над плоскостью рисунка и по направлению к зрителю, обозначают сплошными клиньями, при этом широкий конец клина присоединен к атому, поднимающемуся над плоскостью рисунка к зрителю. Связи, идущие ниже плоскости рисунка и от наблюдателя, обозначены пунктирными клиньями, при этом узкий конец клина присоединен к атому дальше от наблюдателя.

Соединения настоящего изобретения могут существовать в виде стереоизомеров из-за возможных хиральных атомов углерода, присутствующих в формуле **1**. Таким образом, настоящее изобретение включает индивидуальные стереоизомеры соединений формулы **1**, а также смеси стереоизомеров соединений формулы **1**.

Вариант осуществления настоящего изобретения включает индивидуальные стереоизомеры соединений формулы **1-trans**, а также смеси стереоизомеров соединений формулы **1-trans**. Формула **1-trans** представляет собой формулу **1**, в которой Q группа и -C(X)N(R<sup>5</sup>)- группа, присоединенные к циклопропановому кольцу по атомам углерода, отмеченным звездочкой (\*), находятся в транс положении друг к другу.



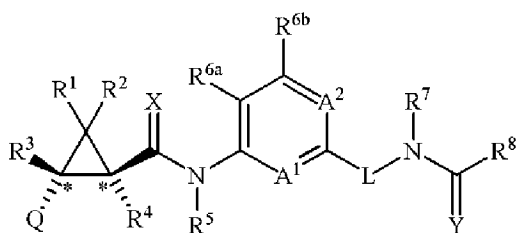
**1-trans**

Где Q и -C(X)N(R<sup>5</sup>)- представляют собой транс

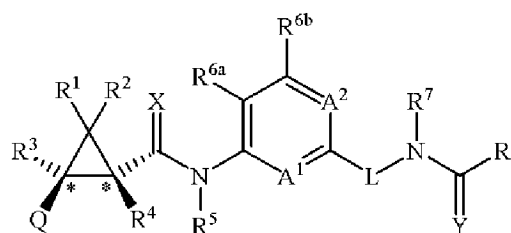
Таким образом, формула **1-trans** представляет собой два энантиомерных транс стереоизомера, показанные ниже как формула **1-R, R** и формула **1-S, S**. Формула **1-R, R** имеет (R) конфигурацию при обоих хиральных атомах углерода циклопропанового кольца, отмеченных звездочками в структурах выше, и формула **1-S, S** имеет (S) конфигурацию при обоих атомах углерода циклопропанового кольца, отмеченных



звездочками в структурах выше.



**1-R,R**



**1-S,S**

Считают, что более биологически активным энантиомером является формула **1-R, R**.

Настоящее изобретение включает рацемические смеси равных количеств энантиомеров формул **1-R, R** и **1-S, S**. Кроме того, настоящее изобретение включает смеси, которые обогащены энантиомером формулы **1-R, R** по сравнению с рацемической смесью формул **1-R, R** и **1-S, S**. Настоящее изобретение также включает по существу чистый энантиомер формулы **1-R, R**.

Вариант осуществления настоящего изобретения включает смеси стереоизомеров соединений формулы **1-R, R** и формулы **1-S, S**, где отношение **1-R, R** к **1-S, S** составляет, по меньшей мере, 75:25 (50% энантиомерный избыток).

Вариант осуществления настоящего изобретения включает смеси стереоизомеров соединений формулы **1-R, R** и формулы **1-S, S**, где отношение **1-R, R** к **1-S, S** составляет, по меньшей мере, 90:10 (80% энантиомерный избыток).

Вариант осуществления настоящего изобретения включает смеси стереоизомеров соединений формулы **1-R, R** и формулы **1-S, S**, где отношение **1-R, R** к **1-S, S** составляет, по меньшей мере, 95:5 (90% энантиомерный избыток **1-R, R**).

Вариант осуществления настоящего изобретения включает смеси стереоизомеров соединений формулы **1-R, R** и Формула **1-S, S**, где отношение **1-R, R** к **1-S, S** составляет, по меньшей мере, 98:2 (96% энантиомерный избыток **1-R, R**).

Вариант осуществления настоящего изобретения включает смеси стереоизомеров соединений формулы **1-R, R** и формулы **1-S, S**, где отношение **1-R, R** к **1-S, S** составляет, по меньшей мере, 99:1 (98% энантиомерный избыток **1-R, R**).

Вариант осуществления настоящего изобретения включает смеси стереоизомеров соединений формулы **1-R, R** и формулу **1-S, S**, где отношение **1-R, R** к **1-S, S** составляет по существу 100:0.

Вариант осуществления настоящего изобретения включает соединения формулы **1-R, R**.

Специалисту в данной области техники ясно, что не все азотсодержащие гетероциклы могут образовывать N-оксиды, поскольку азоту требуется доступная неподеленная пара для окисления до оксида; Специалисту в данной области ясно, какие азотсодержащие гетероциклы могут образовывать N-оксиды. Специалисту в данной

области также ясно, что третичные амины могут образовывать N-оксиды. Синтетические способы получения N-оксидов гетероциклов и третичных аминов очень хорошо известны специалистам в данной области техники, включая окисление гетероциклов и третичных аминов пероксикислотами, такими как перуксусная и 3-хлорпербензойная кислота (MCPBA), пероксидом водорода, алкилгидропероксидами, такими как трет-бутилгидропероксид, перборатом натрия и диоксиранами, такими как диметилдиоксиран. Данные способы получения N-оксидов подробно описаны и рассмотрены в литературе, смотри, например: T. L. Gilchrist в *Comprehensive Organic Synthesis*, т. 7, стр. 748-750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler and B. Stanovnik в *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, т. 3, стр. 18-20, A. J. Boulton and A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M. R. Grimmett and B. R. T. Keene в *Advances in Heterocyclic Chemistry*, т. 43, стр. 149-161, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler and B. Stanovnik в *Advances in Heterocyclic Chemistry*, т. 9, стр. 285-291, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press; и G. W. H. Cheeseman and E. S. G. Werstiuk в *Advances in Heterocyclic Chemistry*, т. 22, стр. 390-392, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press.

Специалисту в данной области техники ясно, что поскольку в окружающей среде и в физиологических условиях соли химических соединений находятся в равновесии с их соответствующими несолевыми формами, соли обладают биологической пригодностью несолевых форм. Таким образом, широкий спектр солей соединения формулы 1 является пригодным для борьбы с беспозвоночными вредителями. Соли соединения формулы 1 включают соли присоединения кислоты с неорганическими или органическими кислотами, такими как бромистоводородная, хлористоводородная, азотная, фосфорная, серная, уксусная, масляная, фумаровая, молочная, малеиновая, малоновая, щавелевая, пропионовая, салициловая, винная, 4-толуолсульфоновая или валериановая кислота. Когда соединение формулы 1 содержит кислотный фрагмент, такой как карбоновая кислота или фенол, соли также включают соли, образованные с органическими или неорганическими основаниями, такими как пиридин, триэтиламин или аммиак, или амидами, гидридами, гидроксидами или карбонатами натрия, калия, лития, кальций, магний или барий. Соответственно, настоящее изобретение включает соединения, выбранные из формулы 1, их N-оксидов и подходящих солей.

Соединения, выбранные из формулы 1, ее стереоизомеров, таутомеров, N-оксидов и солей, обычно существуют в более чем одной форме, и формула 1, таким образом, включает все кристаллические и некристаллические формы соединений, которые формула 1 представляет собой. Некристаллические формы включают варианты осуществления, которые представляют собой твердые вещества, такие как воски и камеди, а также варианты осуществления, которые являются жидкостями, такими как растворы и расплавы. Кристаллические формы включают варианты осуществления, которые представляют собой по существу монокристаллический тип, и варианты осуществления, которые представляют собой смесь полиморфов (т.е. различные кристаллические типы). Термин «полиморф» относится к определенной кристаллической форме химического

соединения, которое может кристаллизоваться в различных кристаллических формах, причем данные формы имеют различное расположение и/или конформации молекул в кристаллической решетке. Хотя полиморфные соединения могут иметь одну и ту же химическую композицию, они также могут различаться в составе из-за присутствия или отсутствия сокристаллизованной воды или других молекул, которые могут быть слабо или сильно связаны в решетке. Полиморф может различаться по таким химическим, физическим и биологическим свойствам, как форма кристалла, плотность, твердость, цвет, химическая стабильность, температура плавления, гигроскопичность, суспендируемость, скорость растворения и биологическая доступность. Специалисту в данной области техники ясно, что полиморф соединения, представленного формулой 1, может проявлять полезные эффекты (например, пригодность для полученных подходящих составов, улучшенные биологические характеристики) по сравнению с другим полиморфом или смесью полиморфов того же соединения, представленного формулой 1. Получение и выделение определенного полиморфа соединения, представленного формулой 1, может быть достигнуто способами, известными специалистам в данной области техники, включая, например, кристаллизацию, применяя выбранные растворители и температуры. Соединения настоящего изобретения могут существовать в виде одного или нескольких кристаллических полиморфов. Настоящее изобретение включает как индивидуальные полиморфы, так и смеси полиморфов, включая смеси, обогащенные одним полиморфом по сравнению с другими. Для всестороннего обсуждения полиморфизма смотри R. Hilfiker, Ed., *Polymorphism in the Pharmaceutical Industry*, Wiley-VCH, Weinheim, 2006.

Варианты осуществления настоящего изобретения, как описано в сущности настоящего изобретения, включают варианты осуществления, описанные ниже. В следующих вариантах осуществления, ссылка на “соединение формулы 1” включает определения заместителей, указанных в сущности настоящего изобретения, если дополнительно не определено в вариантах осуществления.

Вариант осуществления 1. Соединение формулы 1, где R1 представляет собой H, F, Cl, Br, CH<sub>3</sub> или CF<sub>3</sub>.

Вариант осуществления 1a. Соединение формулы 1, где R1 представляет собой F, Cl, Br или CH<sub>3</sub>.

Вариант осуществления 1b. Соединение формулы 1, где R1 представляет собой F, Cl или Br.

Вариант осуществления 1c. Соединение формулы 1, где R1 представляет собой F или Cl.

Вариант осуществления 1d. Соединение формулы 1, где R1 представляет собой Cl.

Вариант осуществления 2. Соединение формулы 1, где R2 представляет собой F, Cl, Br, CH<sub>3</sub> или CF<sub>3</sub>.

Вариант осуществления 2a. Соединение формулы 1, где R2 представляет собой F, Cl, Br или CH<sub>3</sub>.

Вариант осуществления 2b. Соединение формулы 1, где R2 представляет собой F,

Cl или Br.

Вариант осуществления 2с. Соединение формулы **1**, где R2 представляет собой F или Cl.

Вариант осуществления 2d. Соединение формулы **1**, где R2 представляет собой Cl.

Вариант осуществления 3. Соединение формулы **1**, где R1 представляет собой F, и R2 представляет собой F, или R1 представляет собой Cl, и R2 представляет собой Cl.

Вариант осуществления 3a. Соединение формулы **1**, где R1 представляет собой F, и R2 представляет собой F.

Вариант осуществления 3b. Соединение формулы **1**, где R1 представляет собой Cl, и R2 представляет собой Cl.

Вариант осуществления 3с. Соединение формулы **1**, где R1 представляет собой Br, и R2 представляет собой Br.

Вариант осуществления 3d. Соединение формулы **1**, где R1 представляет собой CH<sub>3</sub>, и R2 представляет собой CH<sub>3</sub>.

Вариант осуществления 3d. Соединение формулы **1**, где R1 представляет собой CF<sub>3</sub> и R2 представляет собой CF<sub>3</sub>.

Вариант осуществления 4. Соединение формулы **1**, где R3 представляет собой H.

Вариант осуществления 5. Соединение формулы **1**, где R4 представляет собой H.

Вариант осуществления 6. Соединение формулы **1**, где R3 представляет собой H, и R4 представляет собой H.

Вариант осуществления 7. Соединение формулы **1**, где Q представляет собой фенил или пиридинил, причем каждый является незамещенным или замещенным 1-3 R<sub>10</sub>.

Вариант осуществления 7a. Соединение формулы **1**, где Q представляет собой фенил, незамещенный или замещенный 1-3 R<sub>10</sub>.

Вариант осуществления 7b. Соединение формулы **1**, где Q представляет собой пиридинил, незамещенный или замещенный 1-3 R<sub>10</sub>.

Вариант осуществления 7с. Соединение формулы **1**, где Q представляет собой фенил, замещенный 1-3 R<sub>10</sub>.

Вариант осуществления 7d. Соединение формулы **1**, где Q представляет собой фенил, замещенный 1-3 R<sub>10</sub>, и каждый R<sub>10</sub> независимо представляет собой галоген, C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> галогеналкилокси или C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> галогеналкил.

Вариант осуществления 7e. Соединение формулы **1**, где Q представляет собой фенил, замещенный 1-3 R<sub>10</sub>, и каждый R<sub>10</sub> независимо представляет собой F, Cl или CF<sub>3</sub>.

Вариант осуществления 7f. Соединение формулы **1**, где Q представляет собой фенил, замещенный 1-3 R<sub>10</sub>, где первый R<sub>10</sub> находится в 3 положении фенильного кольца, и второй R<sub>10</sub>, если присутствует, находится в 4 или 5 положении фенильного кольца; и каждый R<sub>10</sub> независимо представляет собой F, Cl или CF<sub>3</sub>.

Вариант осуществления 7g. Соединение формулы **1**, где Q представляет собой фенил, замещенный 1-3 R<sub>10</sub>, где первый R<sub>10</sub> находится в 3 положении фенильного кольца, и второй R<sub>10</sub>, если присутствует, находится в 4 или 5 положении фенильного

кольца; и каждый R10 независимо представляет собой F или Cl.

Вариант осуществления 7h. Соединение формулы **1**, где Q представляет собой фенил, замещенный 1-3 R10, где первый R10 находится во 2 положении фенильного кольца, и второй R10, если присутствует, находится в 3, 4 или 5 положении фенильного кольца; и каждый R10 независимо представляет собой F, Cl или CF<sub>3</sub>.

Вариант осуществления 7. Соединение формулы **1**, где Q представляет собой тиофенил или пиридинил, причем каждый является незамещенным или замещенным 1-3 R10.

Вариант осуществления 8. Соединение формулы **1**, где X представляет собой O.

Вариант осуществления 8a. Соединение формулы **1**, где Y представляет собой O.

Вариант осуществления 8b. Соединение формулы **1**, где X представляет собой O, и Y представляет собой O.

Вариант осуществления 9. Соединение формулы **1**, где R5 представляет собой H или метил.

Вариант осуществления 9a. Соединение формулы **1**, где R5 представляет собой H.

Вариант осуществления 10. Соединение формулы **1**, где R7 представляет собой H или метил.

Вариант осуществления 10a. Соединение формулы **1**, где R7 представляет собой H.

Вариант осуществления 11. Соединение формулы **1**, где A1 представляет собой CR9a.

Вариант осуществления 11a. Соединение формулы **1**, где A2 представляет собой CR9b.

Вариант осуществления 11b. Соединение формулы **1**, где A1 представляет собой CR9a, и A2 представляет собой CR9b.

Вариант осуществления 11c. Соединение формулы **1**, где A1 представляет собой N.

Вариант осуществления 11d. Соединение формулы **1**, где A2 представляет собой N.

Вариант осуществления 11e. Соединение формулы **1**, где A1 представляет собой N, и A2 представляет собой N.

Вариант осуществления 12. Соединение формулы **1**, где A1 представляет собой CR9a, и R9a представляет собой H или галоген.

Вариант осуществления 12a. Соединение формулы **1**, где A1 представляет собой CR9a, и R9a представляет собой H, F или Cl.

Вариант осуществления 12b. Соединение формулы **1**, где A1 представляет собой CR9a, и R9a представляет собой H или F.

Вариант осуществления 12c. Соединение формулы **1**, где A1 представляет собой CR9a, и R9a представляет собой H.

Вариант осуществления 12d. Соединение формулы **1**, где A2 представляет собой CR9b, и R9b представляет собой циано, галоген или C1-C3 алкил.

Вариант осуществления 12e. Соединение формулы **1**, где A2 представляет собой CR9b, и R9b представляет собой циано, F, Cl, Br или метил.

Вариант осуществления 12f. Соединение формулы **1**, где A2 представляет собой CR9b, и R9b представляет собой F или Cl.

Вариант осуществления 12g. Соединение формулы **1**, где A1 представляет собой CR9a, и R9a представляет собой F или Cl, и A2 представляет собой CR9b, и R9b представляет собой F или Cl.

Вариант осуществления 12e. Соединение формулы **1**, где A1 представляет собой CR9a, и R9a представляет собой H, и A2 представляет собой CR9b, и R9b представляет собой F или Cl.

Вариант осуществления 13. Соединение формулы **1**, где R6a представляет собой H.

Вариант осуществления 13a. Соединение формулы **1**, где R6b представляет собой H.

Вариант осуществления 13b. Соединение формулы **1**, где R6a представляет собой H и R6b представляет собой H.

Вариант осуществления 14. Соединение формулы **1**, где L представляет собой -CH<sub>2</sub>-.

Вариант осуществления 14a. Соединение формулы **1**, где L представляет собой -CH(CH<sub>3</sub>)-.

Вариант осуществления 14b. Соединение формулы **1**, где L представляет собой -C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>-.

Вариант осуществления 14c. Соединение формулы **1**, где L представляет собой -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-.

Вариант осуществления 15. Соединение формулы **1**, где R8 представляет собой H, NR<sub>12</sub>R<sub>13</sub> или R<sub>16</sub>; или C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкил или C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub> циклоалкил, причем каждый является незамещенным или замещенным, по меньшей мере, одним R<sub>x</sub>.

Вариант осуществления 15a. Соединение формулы **1**, где R8 представляет собой H, NR<sub>12</sub>R<sub>13</sub> или R<sub>16</sub>; или C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкил или C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub> циклоалкил, причем каждый является незамещенным или замещенным, по меньшей мере, одним R<sub>x</sub>; где каждый R<sub>12</sub> и R<sub>13</sub> независимо представляет собой H, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкил или C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкил; R<sub>16</sub> представляет собой C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкил; и каждый R<sub>x</sub> независимо представляет собой галоген, циано, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкил или C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкокси.

Вариант осуществления 15b. Соединение формулы **1**, где R8 представляет собой -CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, или циклопропил.

Вариант осуществления 16. Соединение формулы **1-транс**.

Вариант осуществления 17. Соединение формулы **1-R, R**.

Варианты осуществления настоящего изобретения, включая варианты осуществления 1-17 выше, а также любые другие варианты осуществления, описанные в настоящем изобретении, можно комбинировать любым способом, и описания переменных в вариантах осуществления относятся не только к соединениям формулы **1**, но также к исходным соединениям и промежуточным соединениям, применяемым для получения соединений формулы **1**. Кроме того, варианты осуществления настоящего изобретения,

включая варианты осуществления 1-17 выше, а также любые другие варианты осуществления, описанные в настоящем изобретении, и любая их комбинация относятся к композициям и способам настоящего изобретения.

Комбинации вариантов осуществления 1-17 показаны далее:

Вариант осуществления А. Соединение формулы **1**, где

R3 и R4 представляют собой H;

X и Y представляют собой O;

R5 представляет собой H; и

R7 представляет собой H.

Вариант осуществления В. Соединение варианта осуществления А, где

R1 представляет собой F, Cl или Br;

R2 представляет собой F, Cl или Br;

Q представляет собой фенил, незамещенный или замещенный 1-3 R10;

A1 представляет собой CR9a;

A2 представляет собой CR9b;

R6a представляет собой H;

R6b представляет собой H;

R9a представляет собой H или галоген; и

R9b представляет собой галоген, циано или C1-C6 алкил.

Вариант осуществления С. Соединение варианта осуществления В, где

R1 представляет собой F или Cl;

R2 представляет собой F или Cl;

L представляет собой -CH2-;

R9a представляет собой H или F; и

R9b представляет собой F или Cl.

Вариант осуществления D. Соединение формулы **1-транс**, где

R3 и R4 представляют собой H;

X и Y представляют собой O;

R5 представляет собой H; и

R7 представляет собой H.

Вариант осуществления E. Соединение варианта осуществления D, где

R1 представляет собой F, Cl или Br;

R2 представляет собой F, Cl или Br;

Q представляет собой фенил, незамещенный или замещенный 1-3 R10;

A1 представляет собой CR9a;

A2 представляет собой CR9b;

R6a представляет собой H;

R6b представляет собой H;

R9a представляет собой H или галоген; и

R9b представляет собой галоген, циано или C1-C6 алкил.

Вариант осуществления F. Соединение варианта осуществления E, где

R1 представляет собой F или Cl;

R2 представляет собой F или Cl;

L представляет собой -CH<sub>2</sub>-;

R9a представляет собой H или F; и

R9b представляет собой F или Cl.

Вариант осуществления G. Соединение формулы **1-R, R**, где

R3 и R4 представляют собой H;

X и Y представляют собой O;

R5 представляет собой H; и

R7 представляет собой H.

Вариант осуществления H. Соединение варианта осуществления г, где

R1 представляет собой F, Cl или Br;

R2 представляет собой F, Cl или Br;

Q представляет собой фенил, незамещенный или замещенный 1-3 R10;

A1 представляет собой CR9a;

A2 представляет собой CR9b;

R6a представляет собой H;

R6b представляет собой H;

R9a представляет собой H или галоген; и

R9b представляет собой галоген, циано или C1-C6 алкил.

Вариант осуществления I. Соединение варианта осуществления H, где

R1 представляет собой F или Cl;

R2 представляет собой F или Cl;

L представляет собой -CH<sub>2</sub>-;

R9a представляет собой H или F; и

R9b представляет собой F или Cl.

Конкретные варианты осуществления включают соединения формулы **1**, выбранные из группы, состоящей из соединений 33, 38, 39, 40, 42 и 43. Конкретные варианты осуществления также включают соединения формулы I, выбранные из 2,2-дихлор-3-(3,4-дихлорфенил)-N-[4-фтор-3-[(3,3,3-трифтор-1-оксопропил)амино]метил]фенил]циклопропанкарбоксамида (Соединение 79), 2,2-дихлор-N-[4-хлор-3-[(2,2,2-трифторацетил)амино]метил]фенил]-3-(3,4-дихлорфенил)циклопропанкарбоксамида (Соединение 175), 2,2-дихлор-3-[4-фтор-3-(трифторметил)фенил]-N-[4-фтор-3-[(3,3,3-трифтор-1-оксопропил)амино]метил]фенил]циклопропанкарбоксамида (Соединение 78), 2,2-дихлор-N-[3-[(циклопропилкарбонил)амино]метил]-4-фторфенил]-3-[4-фтор-3-(трифторметил)фенил]циклопропанкарбоксамида (Соединение 77), 2,2-дихлор-3-(3-хлор-4-фторфенил)-N-[2,4-дифтор-3-[(3,3,3-трифтор-1-оксопропил)амино]метил]фенил]циклопропанкарбоксамида (Соединение 170), 2,2-

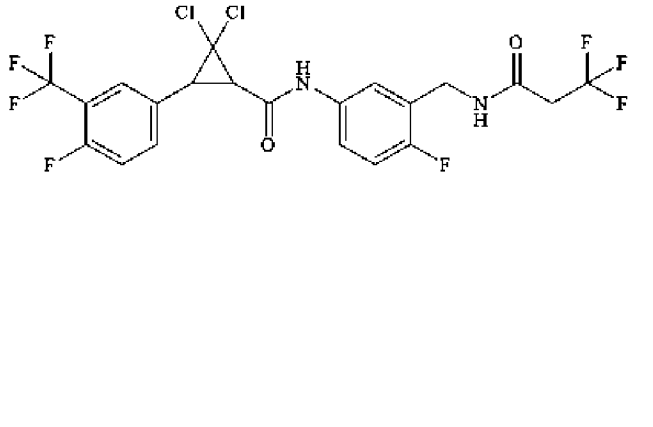
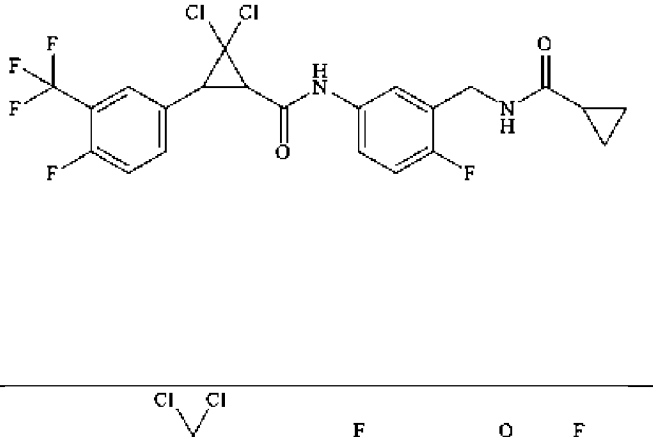
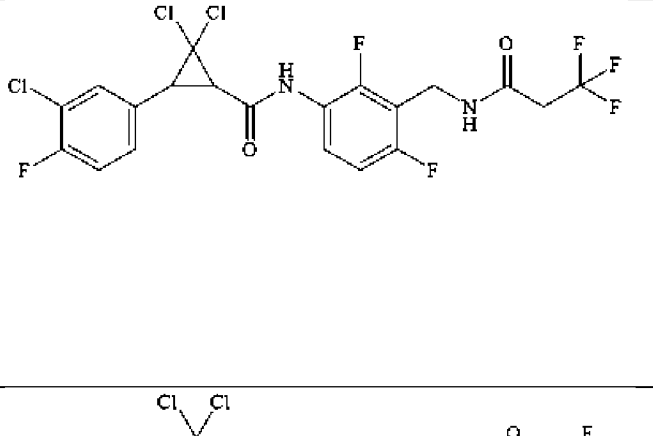
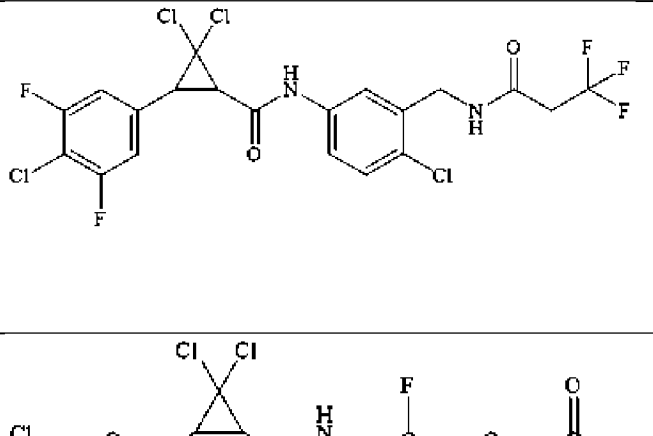
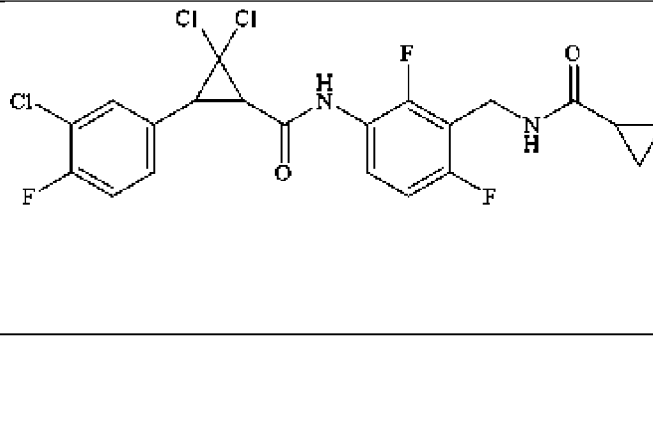


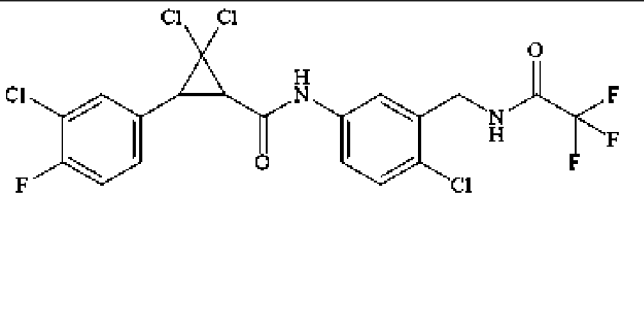
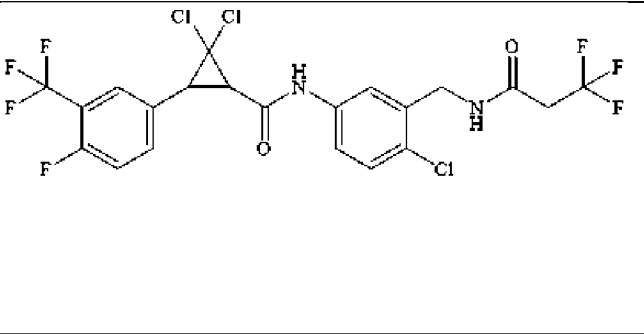
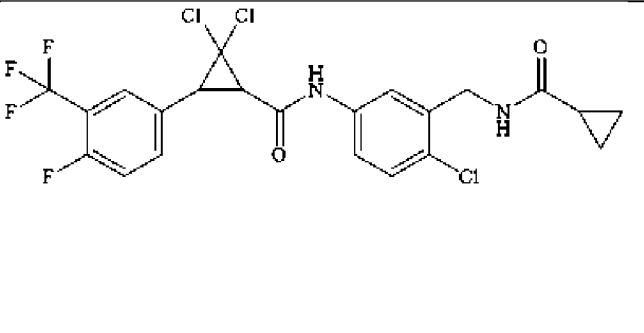
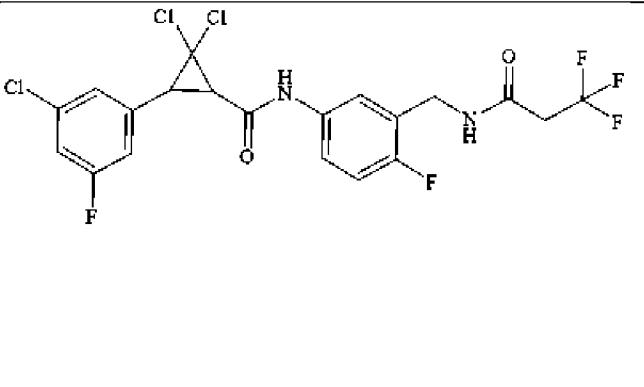
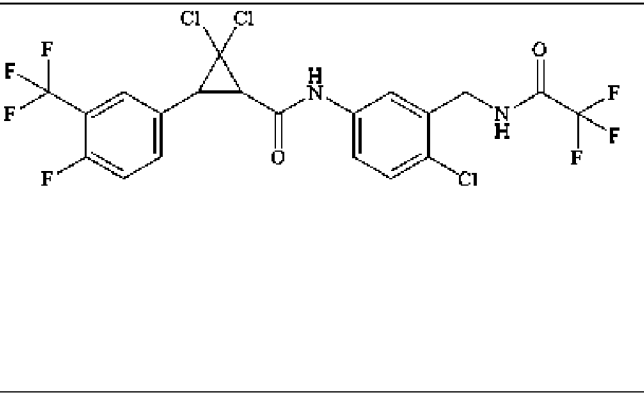
дихлор-3-(4-хлор-3,5-дифторфенил)-N-[4-фтор-3-[[3,3,3-трифтор-1-оксопропил)амино]метил]фенил]циклопропанкарбоксамида (Соединение 169), 2,2-дихлор-3-(3-хлор-4-фторфенил)-N-[3-[[циклопропилкарбонил)амино]метил]-2,4-дифторфенил]циклопропанкарбоксамида (Соединение 164), 2,2-дихлор-3-(3-хлор-4-фторфенил)-N-[4-хлор-3-[[2,2,2-трифторацетил)амино]метил]фенил]циклопропанкарбоксамида (Соединение 19), 2,2-дихлор-N-[4-хлор-3-[[3,3,3-трифтор-1-оксопропил)амино]метил]фенил]-3-[4-фтор-3-(трифторметил)фенил]циклопропанкарбоксамида (Соединение 116), 2,2-дихлор-N-[4-хлор-3-[[циклопропилкарбонил)амино]метил]фенил]-3-[4-фтор-3-(трифторметил)фенил]циклопропанкарбоксамида (Соединение 39), 2,2-дихлор-3-(3-хлор-5-фторфенил)-N-[4-фтор-3-[[3,3,3-трифтор-1-оксопропил)амино]метил]фенил]циклопропанкарбоксамида (Соединение 129), 2,2-дихлор-N-[4-хлор-3-[[2,2,2-трифторацетил)амино]метил]фенил]-3-[4-фтор-3-(трифторметил)фенил]циклопропанкарбоксамида (Соединение 174), 2,2-дихлор-N-[4-хлор-3-[[3,3,3-трифтор-1-оксопропил)амино]метил]фенил]-3-(3,4,5-трифторфенил)циклопропанкарбоксамида (Соединение 118), 2,2-дихлор-3-(3-хлор-4-фторфенил)-N-[4-фтор-3-[[3,3,3-трифтор-1-оксопропил)амино]метил]фенил]циклопропанкарбоксамида (Соединение 219) и 3-[3,5-бис(трифторметил)фенил]-2,2-дихлор-N-[4-фтор-3-[[3,3,3-трифтор-1-оксопропил)амино]метил]фенил]циклопропанкарбоксамида (Соединение 220). Номера соединений относятся к индексным таблицам.

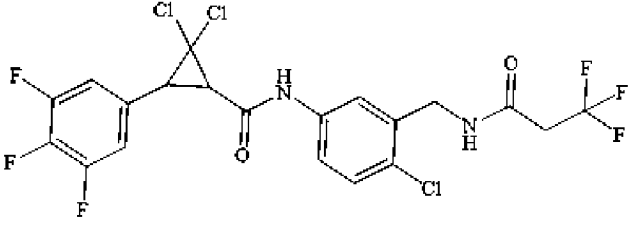
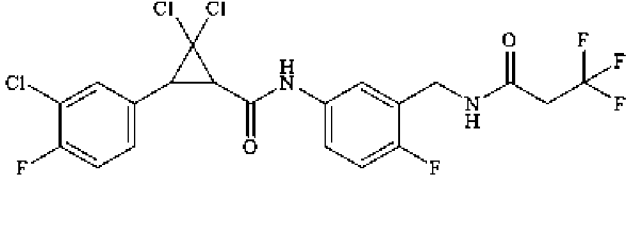
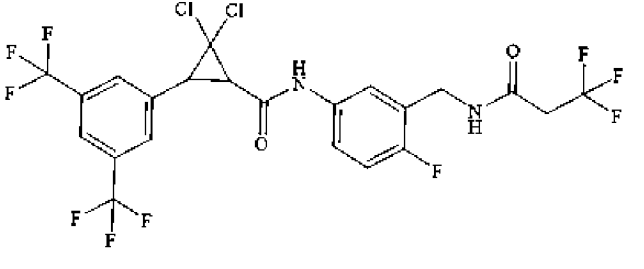
В одном варианте осуществления, соединения формулы I представляют собой соединения, где соединение выбрано из соединений в индексной таблице 1.

Таблица 1.

Соединение No.	Структура соединения	Химическое название и Номер соединения
79		2,2-дихлор-3-(3,4-дихлорфенил)-N-[4-фтор-3-[[3,3,3-трифтор-1-оксопропил)амино]метил]фенил]циклопропанкарбоксамид
175		2,2-дихлор-N-[4-хлор-3-[[2,2,2-трифторацетил)амино]метил]фенил]-3-(3,4-дихлорфенил)циклопропанкарбоксамид

78		<p>2,2-дихлор-3-[4-фтор-3-(трифторметил)фенил]-N-[4-фтор-3-[[3,3,3-трифтор-1-оксопропил)амино]метил]фенил]циклопропанкарбоксамид</p>
77		<p>2,2-дихлор-N-[3-[[циклопропилкарбонил)амино]метил]-4-фторфенил]-3-[4-фтор-3-(трифторметил)фенил]циклопропанкарбоксамид (Соединение 77)</p>
170		<p>2,2-дихлор-3-(3-хлор-4-фторфенил)-N-[2,4-дифтор-3-[[3,3,3-трифтор-1-оксопропил)амино]метил]фенил]циклопропанкарбоксамид</p>
169		<p>2,2-дихлор-3-(4-хлор-3,5-дифторфенил)-N-[4-фтор-3-[[3,3,3-трифтор-1-оксопропил)амино]метил]фенил]циклопропанкарбоксамид</p>
164		<p>2,2-дихлор-3-(3-хлор-4-фторфенил)-N-[3-[[циклопропилкарбонил)амино]метил]-2,4-дифторфенил]циклопропанкарбоксамид</p>

19		2,2-дихлор-3-(3-хлор-4-фторфенил)-N-[4-хлор-3-[[2,2,2-трифторацетил)амино]метил]фенил]циклопропанкарбоксамид
116		2,2-дихлор-N-[4-хлор-3-[[3,3,3-трифтор-1-оксопропил)амино]метил]фенил]-3-[4-фтор-3-(трифторметил)фенил]циклопропанкарбоксамид
39		2,2-дихлор-N-[4-хлор-3-[[циклопропилкарбонил)амино]метил]фенил]-3-[4-фтор-3-(трифторметил)фенил]циклопропанкарбоксамид
129		2,2-дихлор-3-(3-хлор-5-фторфенил)-N-[4-фтор-3-[[3,3,3-трифтор-1-оксопропил)амино]метил]фенил]циклопропанкарбоксамид
174		2,2-дихлор-N-[4-хлор-3-[[2,2,2-трифторацетил)амино]метил]фенил]-3-[4-фтор-3-(трифторметил)фенил]циклопропанкарбоксамид

118		2,2-дихлор-N-[4-хлор-3-[[3,3,3-трифтор-1-оксопропил)амино]метил]фенил]-3-(3,4,5-трифторфенил)циклопропанкарбоксамид
219		2,2-дихлор-3-(3-хлор-4-фторфенил)-N-[4-фтор-3-[[3,3,3-трифтор-1-оксопропил)амино]метил]фенил]циклопропанкарбоксамид
220		3-[3,5-Бис(трифторметил)фенил]-2,2-дихлор-N-[4-фтор-3-[[3,3,3-трифтор-1-оксопропил)амино]метил]фенил]циклопропанкарбоксамид

или энантиомеры или диастереомеры, или комбинации приведенных выше соединений.

Следует отметить, что соединения настоящего изобретения характеризуются благоприятными метаболическими и/или остаточными почвенными паттернами и проявляют активность по борьбе со спектром агрономических и неагрономических беспозвоночных вредителей.

Стоит отдельно отметить, по причинам спектра борьбы с беспозвоночными вредителями и экономической важности, защита агрономических культур от повреждения или ущерба, вызванного беспозвоночными вредителями, путем борьбы с беспозвоночными вредителями являются вариантами осуществления настоящего изобретения. Соединения по настоящему изобретению, благодаря их благоприятным транслокационным свойствам или системности в растениях также защищают листву или другие части растения, которые не контактируют напрямую с соединением формулы 1 или композицией, содержащей соединение.

Также следует отметить, что варианты осуществления настоящего изобретения представляют собой композиции, содержащие соединение любого из предыдущих вариантов осуществления, а также любые другие варианты осуществления, описанный в настоящем изобретении, и любые их комбинации, и, по меньшей мере, один

дополнительный компонент, выбранный из группы, состоящей из поверхностно-активного соединения, твердого разбавителя и жидкого разбавителя, причем указанная композиция необязательно дополнительно содержит, по меньшей мере, одно дополнительное биологически активное соединение или агент.

Также заслуживают внимания варианты осуществления настоящего изобретения, представляющие собой композиции для борьбы с беспозвоночными вредителями, содержащие соединение любого из предшествующих вариантов осуществления, а также любых других вариантов осуществления, описанных в настоящем изобретении, и любой их комбинации, и, по меньшей мере, один дополнительный компонент, выбранный из группы, состоящей из поверхностно-активного соединения, твердого разбавителя и жидкого разбавителя, причем указанные композиции необязательно дополнительно содержат, по меньшей мере, одно дополнительное биологически активное соединение или агент. Варианты осуществления настоящего изобретения дополнительно включают способы борьбы с беспозвоночными вредителями, включающие контакт беспозвоночного вредителя или его окружающей среды с биологически эффективным количеством соединения любого из предшествующих вариантов осуществления (например, в виде композиции, описанной в настоящем изобретении).

Варианты осуществления настоящего изобретения также включают композиции, содержащие соединение любого из предшествующих вариантов осуществления, в виде жидкого состава для пропитки почвы. Варианты осуществления настоящего изобретения дополнительно включают способы борьбы с беспозвоночными вредителями, включающие контакт почвы с жидкой композицией в виде состава для пропитки почвы, содержащего биологически эффективное количество соединения любого из предшествующих вариантов осуществления.

Варианты осуществления настоящего изобретения также включает распыляемую композицию для борьбы с беспозвоночными вредителями, содержащую биологически эффективное количество соединения любого из предшествующих вариантов осуществления и пропеллент. Варианты осуществления настоящего изобретения дополнительно включают композицию для приманки для борьбы с беспозвоночными вредителями, содержащую биологически эффективное количество соединения любого из предшествующих вариантов осуществления, один или более пищевых материалов, необязательно аттрактант, и необязательно увлажнитель. Варианты осуществления настоящего изобретения также включают устройство для борьбы с беспозвоночными вредителями, содержащее указанную композицию для приманки и корпус, приспособленный для размещения указанной композиции для приманки, причем корпус имеет, по меньшей мере, одно отверстие с размером, позволяющим беспозвоночному вредителю проникать через отверстие, так что беспозвоночный вредитель может получить доступ к указанной композиции для приманки из места за пределами корпуса, и где корпус дополнительно приспособлен для размещения в или вблизи места потенциальной или известной активности беспозвоночного вредителя.

В одном варианте осуществления, композиции, описанные в настоящем изобретении, представляют собой твердые композиции, такие как пудра, порошки, гранулы, пеллеты, дробинки, пастилки, таблетки или пленки с наполнителем. В некоторых вариантах осуществления композиции, описанные в настоящем изобретении, представляют собой твердые композиции и являются вододиспергируемыми или водорастворимыми.

В одном варианте осуществления, жидкий или сухой состав содержит композиции, как описано в настоящем изобретении, для применения в системе капельного орошения, бороздах во время посева, ручном опрыскивателе, ранцевом опрыскивателе, штанговом опрыскивателе, наземном опрыскивателе, воздушном распылении, беспилотном летательном аппарате или при обработке семян.

В одном варианте осуществления, композиции, как описано в настоящем изобретении для применения в системе капельного орошения, бороздах во время посева, ручном опрыскивателе, ранцевом опрыскивателе, штанговом опрыскивателе, наземном опрыскивателе, воздушном распылении, беспилотном летательном аппарате или при обработке семян, где указанный состав распыляют при сверхнизком объеме.

Варианты осуществления настоящего изобретения также включают способы защиты семян от беспозвоночных вредителей, включающие контакт семян с биологически эффективным количеством соединения любого из предшествующих вариантов осуществления.

Варианты осуществления настоящего изобретения также включают способы защиты животного от беспозвоночных паразитических вредителей, включающие введение животному паразитарно эффективного количества соединения любого из предшествующих вариантов осуществления.

Варианты осуществления настоящего изобретения также включают способы борьбы с беспозвоночными вредителями, включающие контакт беспозвоночного вредителя или его окружающей среды с биологически эффективным количеством соединения формулы **1**, его N-оксидом или солью (например, в виде композиции, описанной в настоящем изобретении), при условии, что данные способы не являются способами лечения тела человека или животного с помощью терапии.

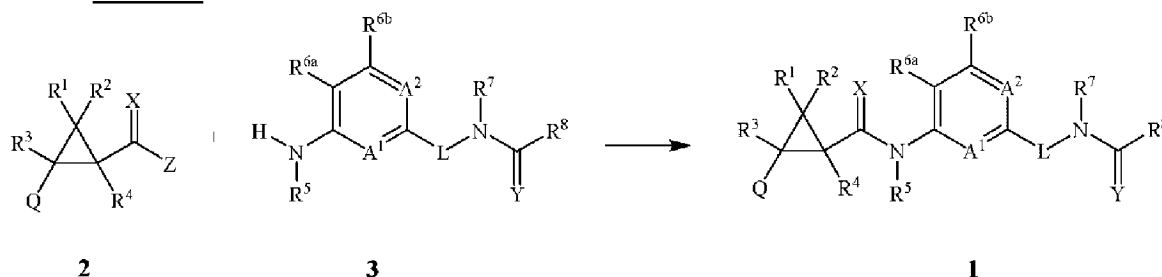
Настоящее изобретение также относится к способам, где беспозвоночный вредитель или его окружающая среда контактирует с композицией, содержащей биологически эффективное количество соединения формулы **1**, его N-оксида или соли, и, по меньшей мере, один дополнительный компонент, выбранный из группы, состоящей из поверхностно-активных соединений, твердых разбавителей и жидких разбавителей, причем указанная композиция необязательно дополнительно содержит биологически эффективное количество, по меньшей мере, одного дополнительного биологически активного соединения или агента, при условии, что данные способы не являются способами лечения тела человека или животного с помощью терапии.

Соединения формулы **1** можно получить одним или более из следующих способов

и вариантов, как описано на схемах 1-21. Определения заместителей в соединениях формул **1-26** ниже представляют собой, как определено выше в сущности настоящего изобретения, если не указано иначе. Можно применять следующие сокращения: DMF представляет собой N, N-диметилформамид, и DBU представляет собой 1,8-диазабицикло[5,4,0]ундец-7-ен. Комнатная температура или температура окружающей среды представляет собой, как определено как приблизительно 20-25 °С.

Соединения формулы **1** можно получить конденсацией кислот или хлорангидридов кислот формулы **2** с аминами формулы **3**, как показано на схеме 1. Данный способ включает применение конденсирующего реагента, такого как HATU, EDC или TATU, или in-situ генерирование хлорангидрида кислоты с помощью оксалилхлорида и DMF перед добавлением амина формулы **3** в присутствии органического основания, такого как триэтиламин или основание Хунига. Стандартные реакционные условия включают органические растворители, такие как хлористый метилен, DMSO или DMF, и стандартные реакционные температуры составляют 0-80 °С (смотри, например, Jiang, Xiaolong et al. *Bioorganic & Medicinal Chemistry*, **2015**, 23(3), страницы 564-578).

Схема 1



Z представляет собой OH или Cl

Соединения формулы **2a** (соединения формулы **2**, где X представляет собой O) можно получить способом, показанным на схеме 2. В данном способе, подходящим образом замещенный альдегид формулы **4** окисляют реагентом, таким как перманганат калия или DDQ, в растворителях, таких как ацетон, при температурах в диапазоне от 0-50 °С (смотри, например, Kryshnal, G.V. et al. *Izestiya Akademi Nauk SSR, Seriya Khimicheskaya*, **1979**, 10, страницы 2381-2383).

Схема 2



Соединения формулы **4** можно получить деблокированием ацеталей формулы **5** в присутствии кислоты. Стандартные реакционные условия включают обработку хлористоводородной кислотой, каталитическим количеством пара-толуолсульфокислоты,

или трифторуксусной кислоты, в растворителях, таких как хлористый метилен, при температурах 0-50 °С (смотри, например, Shim, Su Yong, et al. *Organic Letters*, **2016**, 18(2), страницы 160-163). Данный способ показан на схеме 3.

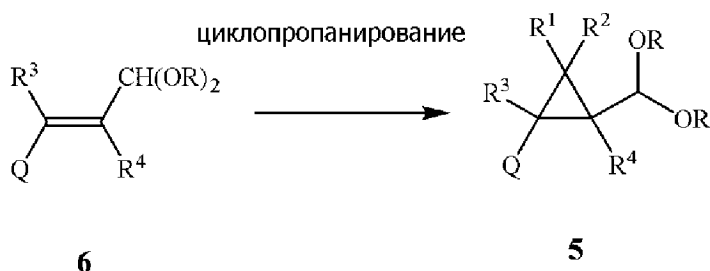
Схема 3



R представляет собой C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил

Соединения формулы **5** можно получить рядом способов из алкеновых соединений формулы **6**, в зависимости от замещения R1 и R2. Как показано на схеме 4, когда R1 и R2 представляют собой фтор, реакция соединения формулы **6** с дибромдифторметаном в присутствии сильного основания, такого как гидроксид натрия, и катализатора межфазного переноса, такого как гидросульфат тетрабутиламмония, дает соединение формулы **5**, где R1 и R2 представляют собой фтор (смотри, например, Bakerzak, Pavel, et al. *Journal of the Chemical Society, Chemical Communications*, **1991**, 12, страницы 826-827). Когда R1 и R2 представляют собой хлор или бром, хлороформ или бромформ в присутствии сильного основания, такого как трет-бутоксид калия или гидроксид калия, с или без катализатора межфазного переноса, в растворителе, таком как этанол, вода или циклогексан при температуре 0-80°С дает требуемые галогенированное циклопропановое соединение формулы **5**, где R1 и R2 представляют собой хлор или бром (для хлора смотри, например, Kargowska, H. et al. *Polish Journal of Chemistry*, **2007**, 81(1), страницы 45-49; для брома смотри, например Jackson, James E. et al. *Tetrahedron*, **1985**, 41(8), страницы 1453-1464).

Схема 4

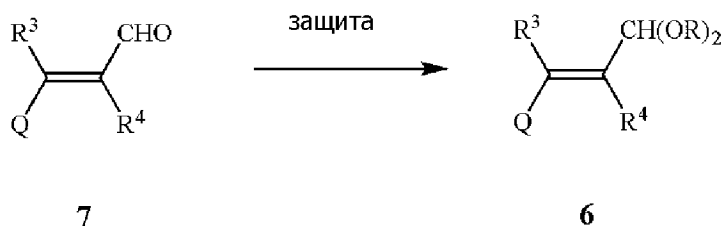


R представляет собой C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил

Ацетальные соединения формулы **6** можно получить защитой альдегидов формулы **7** тралкилортоформиатами в присутствии каталитического количества N-бромсукцинимиды или пиридин-1-ий-4-метилбензолсульфоната, в растворителях, таких как этанол, при температурах 0-50°С, как описано на схеме 5 (смотри, например, Sheshenev, Andrey et al. *Tetrahedron*, **2009**, 65(48), страницы 10036-10046).

Схема 5

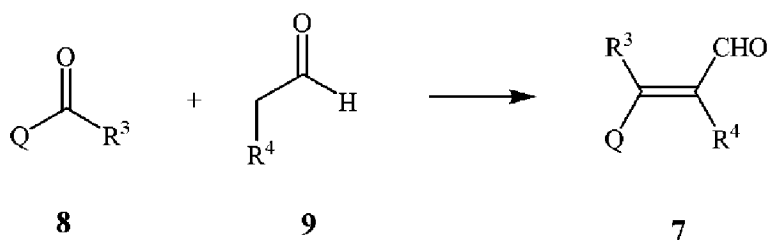




R представляет собой C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил

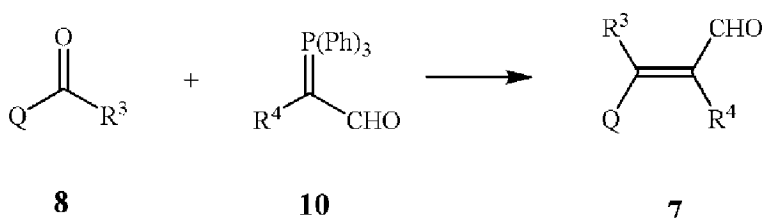
Соединения формулы **7** можно получить альдольной конденсацией соединений формулы **8** и **9**, как описано на схеме 6. В данном способе, соединение формулы **8** обрабатывают сильным основанием, таким как гидроксид калия, и полученный в результате енолят реагирует с альдегидом формулы **9**, образуя промежуточное альдольное соединение, которое затем подвергают дегидратации при повышенных температурах 50-150°C и/или обработкой кислотой, такой как хлороводород, получая соединение формулы **7** (смотри, например Hayashi, Yujiro et al. *Organic Letters*, **2016**, 18(1), страницы 4-7). Соединения формул **8** и **9** являются коммерчески доступными, или их можно получить хорошо разработанными способами, известными в данной области техники.

Схема 6



Соединения формулы **7** можно также получить реакцией соединений формулы **8** с реагентом Виттига формулы **10**, таким как трифенилфосфарилиденацетальдегид, в растворителях, таких как толуол, при температурах в диапазоне от 0 до 110 °C (смотри McGarraugh, Patrick G. et al. *Journal of Organic Chemistry*, **2011**, 76(15), страницы 6309-6319). Данный способ показан на схеме 7. Соединения формулы **8** являются или коммерчески доступными или их можно получить хорошо разработанными способами, известными в литературе.

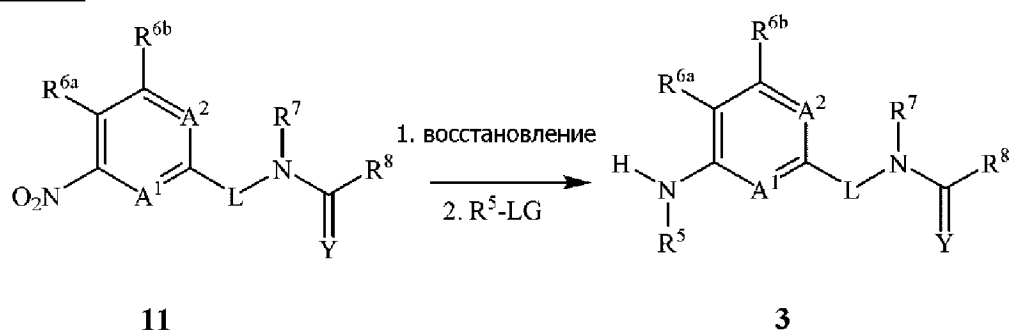
Схема 7



Соединения формулы **3** можно получить способом, показанным на схеме 8. В данном способе, нитро-содержащее соединение формулы **11** восстанавливают в присутствии катализатора, такого как оксид платины или палладий на угле, в атмосфере газообразного водорода, в растворителе, таком как этанол, этилацетат или

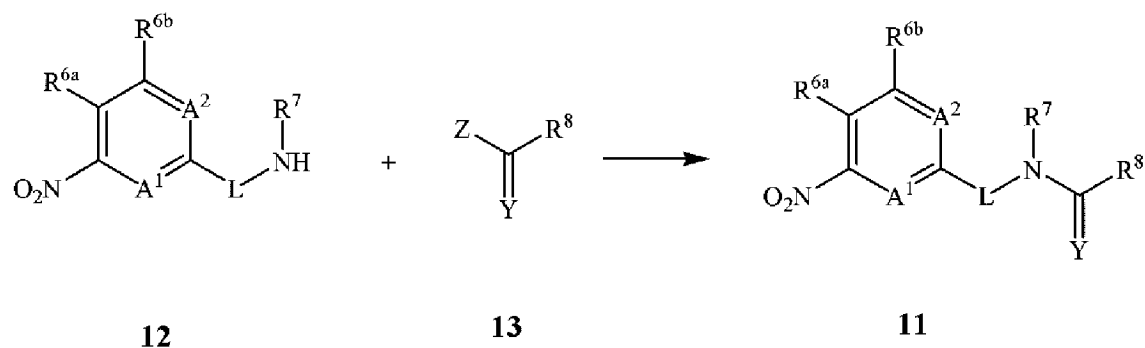
тетрагидрофуран (смотри, например, Lee, Nicholas et al. *Organic Letters*, 2017, 19(24), страницы 6518-6521). Соединения формулы **3** можно также получить восстановлением нитрогруппы при различных других условиях, таки как железом в уксусной кислоте или водной хлористоводородной кислоте, при температурах 25-80 °С (смотри, например, Spalding, David et al. *Journal of Organic Chemistry*, **1954**, 19, страницы 357-364). Соединения формулы **3**, где R5 является отличным от H, можно получить реакцией соединений формулы **3**, где R5 представляет собой H, с алкилирующими или ацилирующими агентами R5-LG (где LG представляет собой подходящую уходящую группу) способами, известными в данной области техники.

Схема 8



Соединения формулы **11** можно получить способом, показанным на схеме 9. В данном способе, соединение формулы **12** реагирует с органической кислотой или хлорангидридом кислоты формулы **13** в присутствии органического основания, такого как триэтиламин или DBU, при температурах в диапазоне от 0 до 80°C в растворителе, таком как хлористый метилен или DMSO. Что касается органических кислот, можно применять конденсирующий реагент, такой как HATU или EDC (смотри, например, Lee, Y. et al *Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters*, **2000**, 10(24), страницы 2771-2774 или Nordquist, Anneli et al. *ACS Medicinal Chemistry Letters*, **2014**, 5(5), страницы 527-532). Соединения формулы **13** являются коммерчески доступными, или их можно получить хорошо разработанными способами, известными в данной области техники.

Схема 9

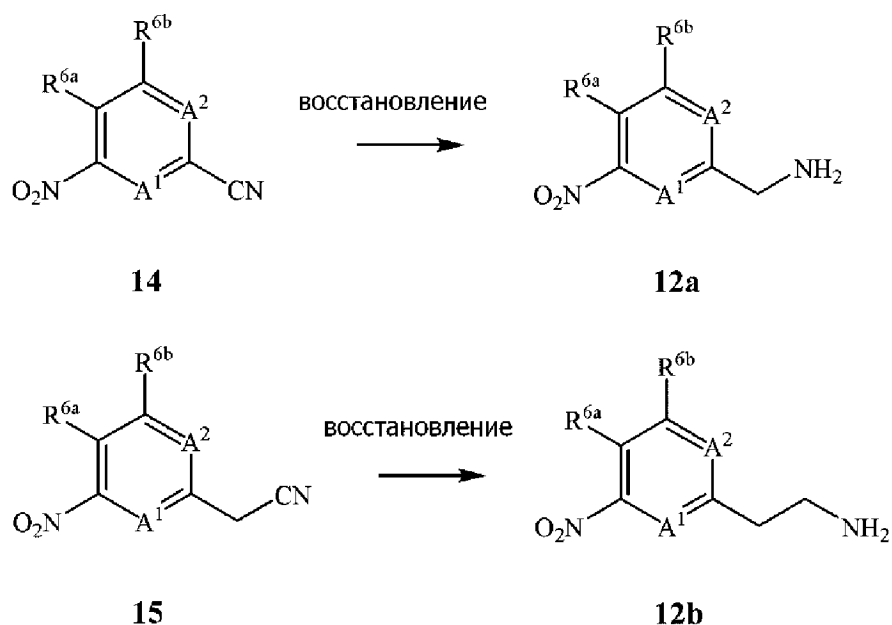


Z представляет собой OH или Cl

Соединения формулы **12** можно получить восстановлением подходящих нитрилов, как описано на схеме 10. В данном способе, нитрил формулы **14** или **15** восстанавливают боргидридом натрия, комплексами бора или литийалюмогидридом, в растворителе, таком

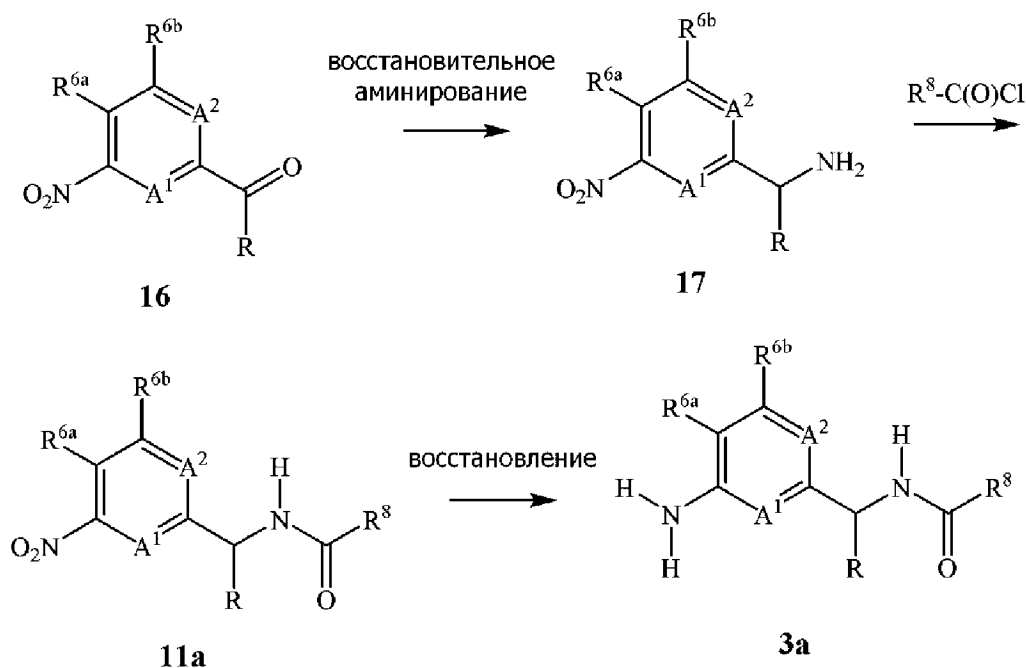
как тетрагидрофуран, эфир или диоксан, при температурах 0-80 °С (смотри, например, Ann, Jihae et al. *Bioorganic & Medicinal Chemistry*, **2015**, 23(21), страницы 6844-6854 или Verma, Praveen Kumar et al. *Synthetic Communications*, **2013**, 43(21), страницы 2867-2875). Соединения формул **14** и **15** являются или коммерчески доступными, или их можно получить хорошо разработанными способами, известными в данной области техники.

Схема 10



Соединения формулы **3a** (соединения формулы **3**, где L представляет собой C1 алкиленильную группу, замещенную C1-C3 алкилом) можно получить способом, показанным на схеме 11. В данном способе, соединения формулы **16** подвергают восстановительному аминированию, получая амин формулы **17**, который можно необязательно обрабатывать подходящим хлорангидридом кислоты, получая соединение формулы **11a** (где R8 является отличным от H). Восстановление соединения формулы **11a** дает соединение формулы **3a**. Соединения формулы **16** являются или коммерчески доступными, или их можно получить хорошо разработанными способами, известными в данной области техники.

Схема 11

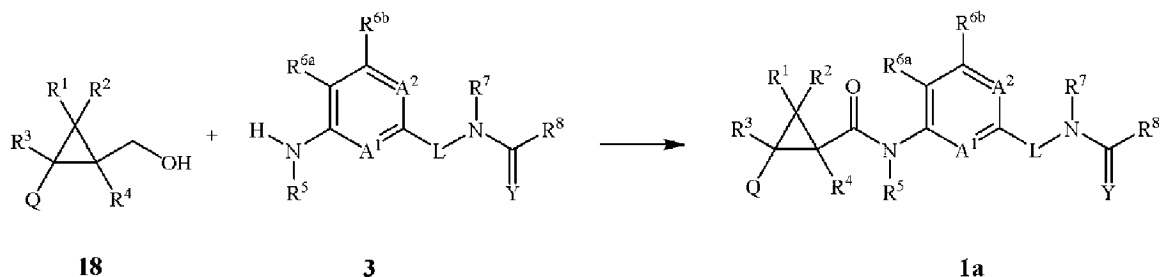


R представляет собой C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> алкил

Соединения формулы **1a** (Формула **1**, где X представляет собой O) можно также получить окислительным амидированием, катализируемым родием, спиртов формулы **18** с аминами формулы **3** способом, показанным на схеме 12. Данный способ включает конденсацию соединений формул **18** и **3** в присутствии катализатора, такого как [Rh(COD)<sub>2</sub>]BF<sub>4</sub>, лигандов, таких как Xantphos или DPPB, генератора для гидрирования с переносом водорода, такого как трифторацетофенон, и основания, такого как ацетат цезия или карбонат цезия. Стандартные реакционные условия включают органические растворители, такие как THF или диоксан, и температуры реакции 0-100 °C (смотри, например, Nguyen, Trang T. и Hull, Kami L. ACS Catalysis, **2016**, 6, страницы 8214-8218).

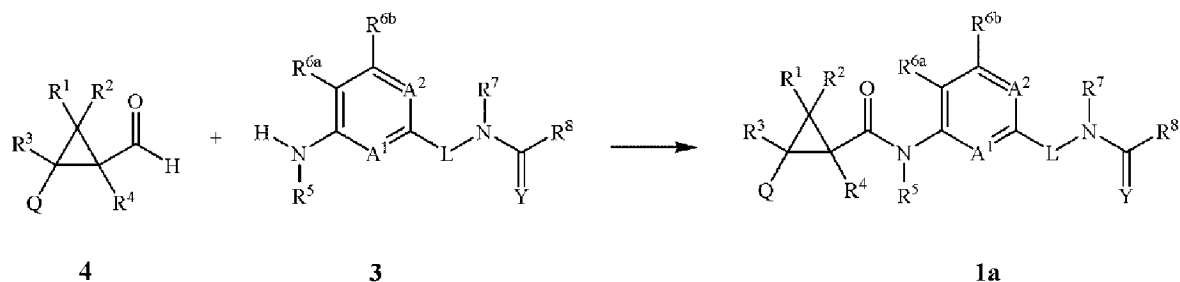
Аналогичный способ конденсации применяет тиокарбоксамидные комплексы рутения (II) в аэробных условиях. Данный способ включает конденсацию соединений формул **18** и **3** в присутствии катализатора, такого как [RuHClCO(AsPh<sub>3</sub>)<sub>3</sub>], с тиокарбоксамидными лигандами в кипящем этаноле (смотри, например, Sindhuja, E., et. al.. Organometalics, **2014**, 33, страницы 4269-4278).

Схема 12



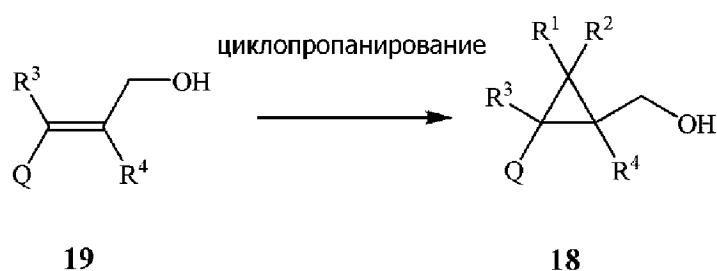
Соединения формулы **1a** можно также получить амидированием, катализируемым родием, альдегидов формулы **4** с аминами формулы **3**, как описано на схеме 13. Данный способ является аналогичным способу, описанному на схеме 12.

## Схема 13



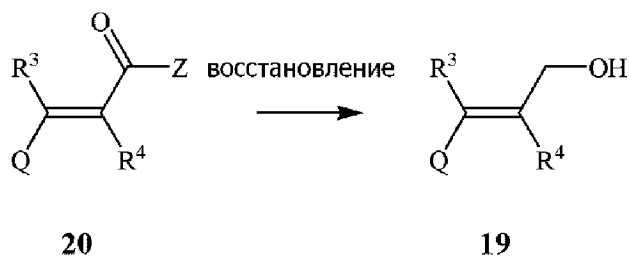
Циклопропановые спиртовые соединения формулы **18** можно получить рядом способов из акленовых соединений формулы **19**, в зависимости от замещения  $R^1$  и  $R^2$ . Данные способы являются аналогичными способам, описанным на схеме 4 выше.

## Схема 14



Спирты формулы **19** можно получить восстановлением эфиров коричной кислоты и альдегидов формулы **20**, как описано на схеме 15.

## Схема 15



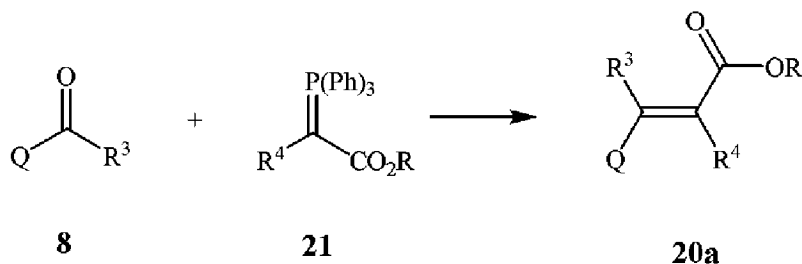
$Z$  представляет собой  $H$  или алкокси

Стандартные восстанавливающие агенты в данном способе включают алюминиевые восстанавливающие агенты, такие как триизобутилалюмогидрид, литийалюмогидрид, и боргидри натрия. Стандартные реакционные условия включают растворители, такие как хлористый метилен, диоксан или тетрагидрофуран, и реакционные температуры в диапазоне  $-90$ - $100$  °C. Для примеров данных типов восстановления, смотри Spoehrle, Stephanie S. M. et al. *Journal of the American Chemical Society*, **2017**, 139(34), страницы 11895-11902, и Wei, Hanwen et al. *European Journal of Medicinal Chemistry*, **2018**, 145, страницы 235-251. Соединения формулы **20**, где  $Z$  представляет собой водород, можно получить способами, описанными на схемах 6 и 7.

Соединения формулы **20a** (Формула **20**, где  $Z$  представляет собой алкокси) можно получить способом, показанным на схеме 16. В данном способе, альдегид формулы **8**

обрабатывают реагентом Виттига формулы **21**, получая соединение формулы **20a**. Стандартные реакционные условия включают растворители, такие как толуол, и реакционные температуры в диапазоне 0-110 °С (смотри, например, Obi, Grace и Van Heerden, Fanie R. *Synthetic Communications*, **2018**, 48(12), страницы 1482-1486). Соединения формулы **8** являются или коммерчески доступными или их можно получить хорошо разработанными способами, известными в литературе.

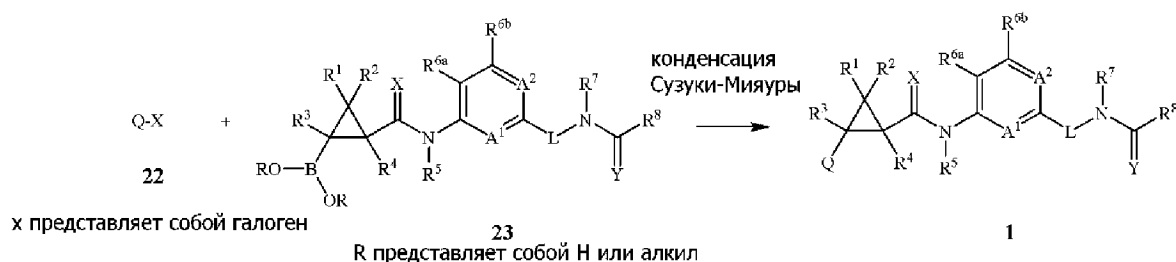
Схема 16



R представляет собой алкил

Соединения формулы **1** можно также получить конденсацией Сузуки-Мияуры бороновых эфиров или кислот формулы **23** с ароматическими галогенидными соединениями формулы **22**, как описано на схеме 17.

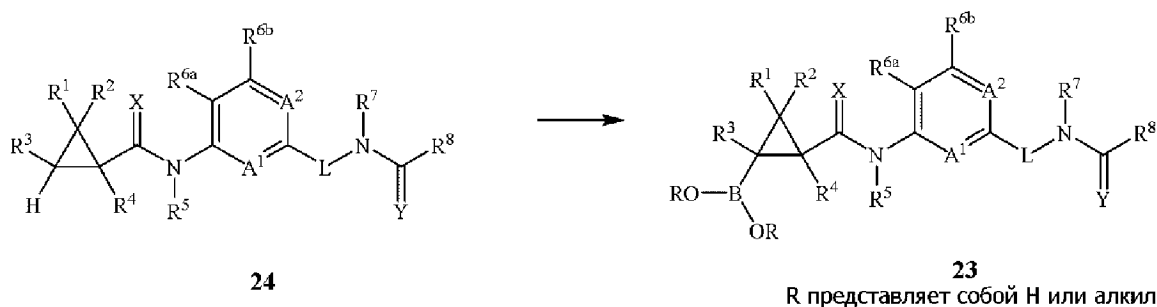
Схема 17



Данный способ включает применение катализатора, такого как Pd(dba)<sub>2</sub>, с лигандами, такими как трифенилфосфин, в присутствии основания, такого как трет-бутоксид калия. Стандартные реакционные условия включают органические растворители, такие как THF или диоксан, и стандартные реакционные температуры составляют 0-100 °С (смотри, например, Liskey, Carl W. и Harwig, John F. *Journal of the American Chemical Society*, **2013**, 135(9), страницы 3375-3378). Соединения формулы **22** являются коммерчески доступными или их можно получить хорошо разработанными способами, известными в данной области техники.

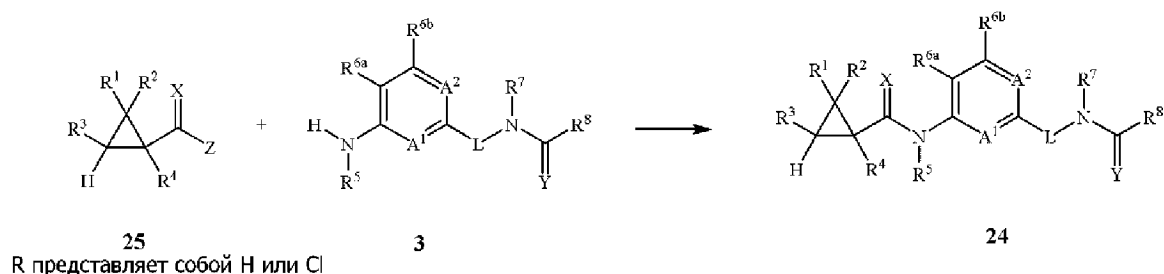
Соединения формулы **23** можно получить, как описано на схеме 18. Данный способ включает C(sp<sup>3</sup>)-H борилирование соединений формулы **24** бис(пинаколато)дибором и оптимальным бидентатным оксазолиновым лигандом, каталитическим количеством Pd(CH<sub>3</sub>CN)<sub>4</sub>(OTf)<sub>2</sub> в присутствии кислорода, гидрофосфата калия в качестве основания, и варьирующихся соотношений ацетонитрила, дихлорэтана и воды в качестве растворителей. Стандартные реакционные температуры находятся в диапазоне от комнатной температуры до 100 °С (смотри, например, He, Jian et. al. *Journal of the American Chemical Society*, **2017**, 139, страницы 3344-3347).

## Схема 18



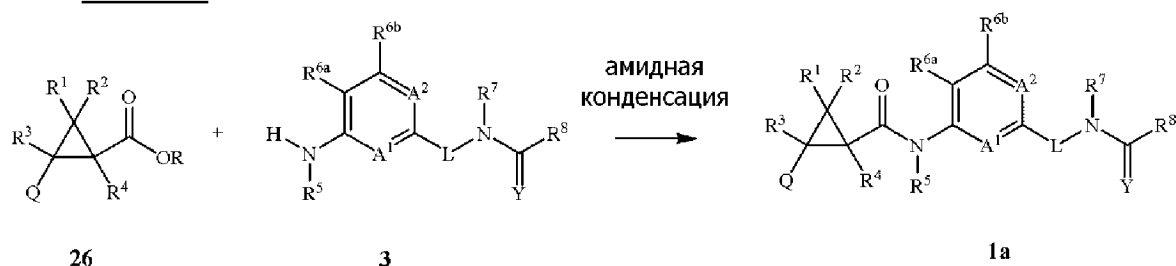
Соединения формулы **24** можно получить рядом способов. В данном способе, показанном на схеме 19, кислоту или хлорангидрид кислоты формулы **25** обрабатывают амином формулы **3**. Данный способ является аналогичным способу, описанному на схеме 1. Соединения формулы **25** являются коммерчески доступными или их можно получить хорошо разработанными способами, известными в данной области техники.

## Схема 19



Соединения формулы **1a** можно также получить способом, показанным на схеме 20. В данном способе, эфир формулы **26** реагирует с амином формулы **3** в присутствии триалкилалюминиевого комплекса, давая соединение формулы **1a**. Стандартные реакционные условия включают растворители, такие как толуол или гексан, и стандартные реакционные температуры находятся в диапазоне 0-150 °C (смотри, например, Takahashi, Masashi et al. *Tetrahedron*, **2010**, 66(1), страницы 288-296). Альтернативно, эфиры формулы **26** можно подвергать амидированию, опосредованному трет-бутоксидом, с аминами формулы **3** в тетрагидрофуране при температурах 0-50 °C, получая амиды формулы **1a** (смотри, например, Kim, Bo Ram et al. *Synthesis*, **2012**, 44(1), страницы 42-50).

## Схема 20

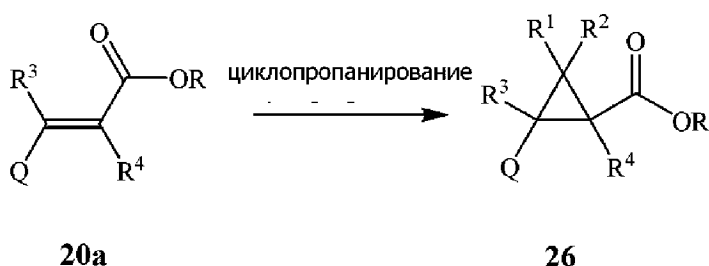


**R** представляет собой метил или этил

Соединения формулы **26** можно получить, как описано на схеме 21 рядом способов. Эфиры формулы **20a**, при реакции с тригалогенированным ацетатом натрия в

присутствии серебряного катализатора, подвергают дигалогенциклопропанированию с высоким выходом при температурах от комнатной температуры до 125°C в растворителях, таких как дихлорэтан (смотри, например Andrianova, Anastasia A. et al. *Journal of Fluorine Chemistry*, **2018**, 209, страницы 49-55). Соединения формулы **26** можно также получить обработкой соединениями формулы **20a** и хлороформом или бромформом в присутствии сильных оснований, таких как гидроксид натрия, и катализатора межфазного переноса, такого как гидросульфат тетрабутиламмония (смотри, например, Voitsov, V. M. et al. *Russian Journal of Organic Chemistry*, **2004**, 40(12), страницы 1760-1763). Соединения формулы **20a** являются коммерчески доступными или их можно получить хорошо разработанными способами известными в данной области техники.

Схема 21



R представляет собой метил или этил

Соединения формулы **1**, где X или Y представляют собой S, можно также получить из соответствующих соединений формулы **1**, где X или Y представляют собой O общими способами, известными в данной области техники, включающими обработку тионирующими агентами, такими как P4S10, или реагентом Лавессона (2,4-бис(4-метоксифенил)-1,3-дитиа-2,4-дифосфетан 2,4-дисульфид).

Схемы 1-21 показывают способы получения соединений формулы **1**, содержащих ряд заместителей. Соединения формулы **1**, содержащие заместители, отличные от заместителей, показанных конкретно на схемах 1-21, можно получить общими способами, известными в данной области синтетической органической химии, включая способы, аналогичные способам, описанным на схемах 1-21.

Ясно, что некоторые реагенты и условия реакции, описанные выше для получения формулы **1**, могут быть несовместимы с определенными функциональными группами, присутствующими в промежуточных соединениях. В данных случаях включение последовательностей защиты/снятия защиты или взаимных превращений функциональных групп в синтезе будет способствовать получению требуемых продуктов. Применение и выбор защитных групп будут очевидными для специалиста в области химического синтеза (смотри, например, Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. *Protective Groups in Organic Synthesis*, 2nd ed.; Wiley: New York, 1991). Специалисту в данной области техники ясно, что, в некоторых случаях, после введения реагентов, показанных на отдельных схемах, могут потребоваться дополнительные стандартные стадии синтеза, не описанные подробно, для завершения синтеза соединений формулы **1**. Специалисту в данной области

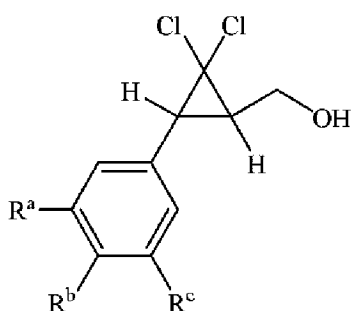


также ясно, что может быть необходимо выполнить комбинацию стадий, проиллюстрированных в приведенных выше схемах, в порядке, отличном от того, который подразумевается конкретной последовательностью, представленной для получения соединений формулы 1.

Специалисту в данной области техники также ясно, что соединения формулы 1 и промежуточные соединения, описанные в настоящем изобретении, можно подвергать различным электрофильным, нуклеофильным, радикальным, металлоорганическим реакциям, реакциям окисления и восстановления для добавления заместителей или модификации имеющихся заместителей.

Примеры промежуточных соединений, пригодных в получении соединений настоящего изобретения, показаны в таблицах I-1-I-2a.

Таблица I-1



<u>Соединение №</u>	<u>R<sub>a</sub></u>	<u>R<sub>b</sub></u>	<u>R<sub>c</sub></u>
I-1	Cl	H	Cl
I-2	Cl	F	Cl
I-3	F	F	F
I-4	F	F	H
I-5	Cl	Cl	H
I-6	F	Cl	H
I-7	Cl	F	H
I-8	CF <sub>3</sub>	F	H
I-9	F	CF <sub>3</sub>	H
I-10	CF <sub>3</sub>	Cl	H
I-11	Cl	CF <sub>3</sub>	H
I-12	H	F	H
I-13	H	Cl	H
I-14	H	CF <sub>3</sub>	H
I-15	Cl	Cl	Cl
I-16	Cl	H	CF <sub>3</sub>

I-17	Br	F	H
------	----	---	---

Таблица I-1a

Таблица I-1a является идентичной таблице I-1, за исключением того, что в таблице I-1a структура непосредственно под заголовком «Таблица I-1a» представляет собой структуру

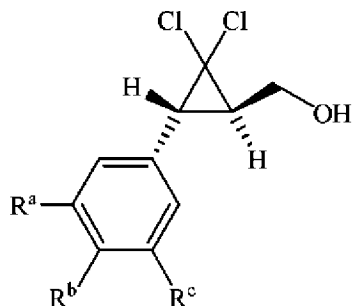
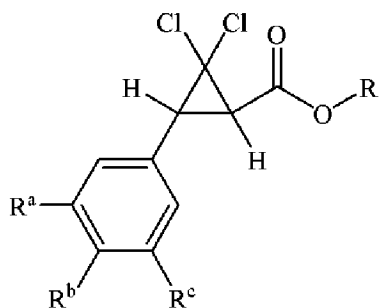


Таблица I-2



R представляет собой Me

<u>Соединение №</u>	<u>R<sub>a</sub></u>	<u>R<sub>b</sub></u>	<u>R<sub>c</sub></u>
I-1	Cl	H	Cl
I-2	Cl	F	Cl
I-3	F	F	F
I-4	F	F	H
I-5	Cl	Cl	H
I-6	F	Cl	H
I-7	Cl	F	H
I-8	CF <sub>3</sub>	F	H
I-9	F	CF <sub>3</sub>	H
I-10	CF <sub>3</sub>	Cl	H
I-11	Cl	CF <sub>3</sub>	H
I-12	H	F	H
I-13	H	Cl	H
I-14	H	CF <sub>3</sub>	H

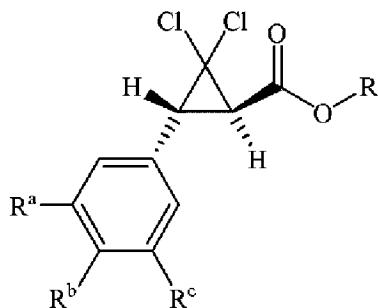
I-15	Cl	Cl	Cl
I-16	Cl	H	CF <sub>3</sub>
I-17	Br	F	H

R представляет собой Et

<u>Соединение №</u>	<u>R<sub>a</sub></u>	<u>R<sub>b</sub></u>	<u>R<sub>c</sub></u>
I-1	Cl	H	Cl
I-2	Cl	F	Cl
I-3	F	F	F
I-4	F	F	H
I-5	Cl	Cl	H
I-6	F	Cl	H
I-7	Cl	F	H
I-8	CF <sub>3</sub>	F	H
I-9	F	CF <sub>3</sub>	H
I-10	CF <sub>3</sub>	Cl	H
I-11	Cl	CF <sub>3</sub>	H
I-12	H	F	H
I-13	H	Cl	H
I-14	H	CF <sub>3</sub>	H
I-15	Cl	Cl	Cl
I-16	Cl	H	CF <sub>3</sub>
I-17	Br	F	H

Таблица I-2а

Таблица I-2а является идентичной таблице I-2, за исключением того, что в таблице I-2а структура непосредственно под заголовком «Таблица I-2а» представляет собой структуру



Без дальнейшего уточнения считают, что специалист в данной области техники, применяющий предыдущее описание, может применять настоящее изобретение в его

самом полном объеме. Следующие ниже примеры получения, следовательно, должны быть истолкованы как просто иллюстративные и никоим образом не ограничивающие настоящее изобретение. Стадии в следующих примерах получения иллюстрируют способы для каждой стадии в общем синтетическом преобразовании, и исходный материал для каждой стадии можно необязательно получать с помощью конкретного подготовительного цикла, способ которого описан в других примерах или стадиях.

Окружающая или комнатная температура определяется как приблизительно 20-25 °С. Проценты даны по массе, за исключением смесей хроматографических растворителей или если указано иное. Части и проценты для смесей растворителей для хроматографии указаны по объему, если не указано иначе. <sup>1</sup>Н ЯМР спектры приведены в м.д. в слабом поле от тетраметилсилана; «s» обозначает синглет, «d» обозначает дублет, «t» обозначает триплет, «q» обозначает квартет, «m» обозначает мультиплет, «dd» обозначает дублет дублетов, «dt» обозначает дублет триплетов, «br s» обозначает уширенный синглет.

#### ПРИМЕР ПОЛУЧЕНИЯ 1

Получение 2,2-дихлор-N-[4-хлор-3-[(циклопропанкарбониламино)метил]фенил]-3-(3,5-дихлорфенил)циклопропан-1-карбоксамид (соединение 62)

##### Стадия А: получение (Е)-3-(3,5-Дихлорфенил)акриальдегида

Ацетальдегид (75,41 г, 1,714 моль) добавляли к перемешиваемому раствору 3,5-дихлорбензальдегида (60,00 г, 342,9 ммоль) в 300 мл толуола при 0°С при перемешивании в атмосфере азота. Раствор 10 мольных процентов гидроксида калия (1,923 г, 34,29 ммоль) в 4 мл метанола добавляли по каплям. Реакционную смесь перемешивали в течение 4 часов, медленно нагревая вплоть до комнатной температуры. Этилацетат (300 мл) и концентрированную водную хлористоводородную кислоту (28,58 мл) добавляли при 10°С к реакции, которую затем нагревали при 80 °С, отгоняя бесцветную жидкость. Реакцию затем охлаждали до комнатной температуры и разбавляли 500 мл воды и экстрагировали 250 мл этилацетата, органический слой сушили сульфатом магния, фильтровали, и летучие компоненты удаляли при пониженном давлении, получая 49,86 г заявленного в заголовке соединения, которое применяли в следующей стадии без дополнительной очистки. <sup>1</sup>Н ЯМР (CDCl<sub>3</sub>): δ 9,71 (дд, 1H), 7,43 (кв, 3H), 7,35 (д, 1H), 6,68 (дд, 1H).

##### Стадия В: Получение (Е)-1,3-Дихлор-5-(3,3-диэтоксипроп-1-ен-1-ил)бензола

Триэтилортоформиат (36,72 г, 248,1 ммоль) добавляли к (Е)-3-(3,5-дихлорфенил)акриальдегиду (49,86 г, 248,1 ммоль) в этаноле (250 мл). Каталитическое количество толуолсульфоната пиридиния (500 мг) добавляли к реакционной смеси и перемешивали в течение 24 часов при комнатной температуре. Этанол удаляли при пониженном давлении. Остаток полученной в результате реакционной смеси добавляли к водному раствору бикарбоната натрия (250 мл) и экстрагировали 3×250 мл гексана, сушили над безводным сульфатом магния, фильтровали, и летучие компоненты удаляли при пониженном давлении, получая требуемый продукт (42,71 г). <sup>1</sup>Н ЯМР (CDCl<sub>3</sub>): δ 7,25 (м, 3H) 6,62 (д, 1H), 6,21 (дд, 1H), 5,20 (д, 1H) 3,45-3,76 (т, 4H), 1,25 (кв, 6H).

Стадия С: Получение 1,3-Дихлор-5-[2,2-дихлор-3-(диэтоксиметил)циклопропил]бензола

(Е)-1,3-дихлор-5-(3,3-диэтоксиргор-1-ен-1-ил)бензол (42,71 г, 155,3 ммоль) растворяли в хлороформе (400 мл) и добавляли гексафторфосфат тетрабутиламмония (1,000 г) и при энергичном перемешивании реакционную смесь нагревали до 45 °С. Водный гидроксид натрия (50% по весу, 90 мл) добавляли по каплям в течение 30 минут. Реакцию продолжали нагревать в течение ночи. Реакцию затем охлаждали до комнатной температуры и разбавляли 400 мл гексана, и органический слой фильтровали через целит, сушили над безводным сульфатом магния, фильтровали, и летучие компоненты удаляли при пониженном давлении, получая 46,35 г черного масла, который применяли без дополнительной очистки. <sup>1</sup>H ЯМР (CDCl<sub>3</sub>): δ 7,30 (с, 1H), 7,16 (дд, 2H), 4,58 (д, 1H) 3,55-3,82 (м, 4H) 2,77 (д, 1H), 2,26 (дд, 1H), 1,20-1,30 (м, 6H).

Стадия D: Получение 2,2-Дихлор-3-(3,5-дихлорфенил)циклопропанкарбоксальдегида

1,3-Дихлор-5-[2,2-дихлор-3-(диэтоксиметил)циклопропил]бензол (46,35 г, 129,5 ммоль) растворяли в ацетонитриле (400 мл) и добавляли 42 мл концентрированной водной хлористоводородной кислоты, и реакцию перемешивали при комнатной температуре в течение 16 ч. Добавляли воду (200 мл), и летучие компоненты удаляли при пониженном давлении, с последующей экстракцией 2×400 мл гексана. Органические слои объединяли и сушили над сульфатом магния, фильтровали, и летучие компоненты удаляли при пониженном давлении. Неочищенную смесь очищали MPLC (силикагель, элюируя 0-25% этилацетата в гексане), получая заявленное в заголовке соединение в виде желтого масла (12,87 г). <sup>1</sup>H ЯМР (CDCl<sub>3</sub>): δ 9,54 (д, 1H), 7,37 (м, 1H), 7,17 (м, 2H), 3,50 (д, 1H), 2,92 (дд, 1H).

Стадия E: Получение 2,2-Дихлор-3-(3,5-дихлорфенил)циклопропанкарбоновой кислоты

Перманганат натрия (40% водный раствор, 18 г) добавляли по каплям к 2,2-дихлор-3-(3,5-дихлорфенил)циклопропанкарбоксальдегиду (12,87 г, 42,90 ммоль) в ацетоне (250 мл) при 15 °С. Реакционную смесь перемешивали в течение 2 ч, нагревая до комнатной температуры со временем, затем добавляли 5 мл изопропилов спирта, и реакцию перемешивали в течение 30 минут. Летучие компоненты затем удаляли при пониженном давлении, получая неочищенное масло и добавляли 100 мл 1 N хлористоводородной кислоты и 500 мл этилацетата. Жидкую смесь добавляли к фильтровальной присадке из 100 г целлита и фильтровали. Органический слой отделяли, сушили над сульфатом магния, фильтровали, и летучие компоненты удаляли при пониженном давлении, получая требуемый неочищенный кислотный продукт, который промывали гексаном, получая белый порошок (9,84 г). <sup>1</sup>H ЯМР (CDCl<sub>3</sub>): δ 7,36 (м, 1H), 7,17 (дд, 2H), 3,43 (д, 1H), 2,87 (д, 1H).

Стадия F: Получение N-[(2-хлор-5-нитрофенил)метил]-циклопропанкарбоксиамида 2-хлор-5-нитробензонитрил (4,97 г, 27,23 ммоль) растворяли в 100 мл

тетрагидрофурана, перемешивая в атмосфере азота. Боран-диметилсульфидный комплекс (2,0 М в THF, 55 мл, 110,0 ммоль) добавляли по каплям при комнатной температуре в течение 15 минут. Реакционную смесь нагревали до 80°C в течение 18 ч. Очень аккуратно, 25 мл 2N хлористоводородной кислоты добавляли по каплям к реакционной смеси после удаления нагревания, но реакцию не охлаждали до комнатной температуры. Реакционную смесь кипятили с обратным холодильником в течение 1 ч, затем охлаждали до комнатной температуры. Летучие компоненты удаляли при пониженном давлении и нагревали, получая хлористоводородную соль 2-хлор-5-нитробензиламина, который применяли без дополнительной очистки. 2-хлор-5-нитробензиламин (427,0 мг, 2,289 ммоль) растворяли в 10 мл хлористого метилена и 1 мл триэтиламина, охлаждали до 0°C и после 15 минут перемешивания все твердые вещества растворялись. К данной реакционной смеси циклопропилкарбонилхлорид (263,1 мг, 2,518 ммоль) добавляли по каплям, поддерживая температуру ниже 5°C. Реакционную смесь медленно нагревали до комнатной температуры в течение 18 ч. Реакционную смесь добавляли к воде (50 мл) и экстрагировали хлористым метиленом, сушили над сульфатом магния, фильтровали, и летучие компоненты удаляли при пониженном давлении, получая неочищенное масло, которое хроматографировали с системой элюентов гексан-этилацетат, получая 539 мг требуемого продукта. <sup>1</sup>H ЯМР (CDCl<sub>3</sub>): δ 8,25 (с, 1H), 8,10 (д, 1H), 7,58 (д, 1H), 6,25 (уш с, 1H), 4,60 (д, 2H), 1,44 (м, 1H), 1,00 (м, 2H), 0,80 (м, 2H).

Стадия G: Получение N-[(2-хлор-5-аминофенил)метил]-циклопропанкарбоксамид

N-[(2-хлор-5-нитрофенил)метил]циклопропанкарбоксамид (539 мг, 2,118 ммоль) растворяли в 50 мл этилацетата и 10 мл этанола и помещали в атмосфере азота в сосуде рагг. Оксид платины (100 мг) добавляли одной порцией, и реакционную смесь продували три раза азотом и затем продували три раза водородом, получая давление приблизительно 50 пси газообразного водорода. Реакционную смесь встряхивали в течение 3 ч. Газообразный водород удаляли, и реакционную смесь фильтровали через целит. Фильтрат помещали на роторный испаритель, и летучие компоненты удаляли, получая 429 мг заявленного в заголовке соединения в виде светло-оранжевого твердого остатка. <sup>1</sup>H ЯМР (CDCl<sub>3</sub>): δ 7,12 (д, 1H), 6,72 (с, 1H), 6,55 (д, 1H), 6,02 (уш с, 1H), 4,44 (д, 2H), 3,51 (уш с, 2H), 1,37 (м, 1H), 0,99 (м, 2H), 0,74 (м, 2H)

Стадия Н: Получение 2,2-дихлор-N-[4-хлор-3-(циклопропанкарбониламино)метил]фенил]-3-(3,5-дихлорфенил)циклопропан-1-карбоксамид

2,2-дихлор-3-(3,5-дихлорфенил)циклопропанкарбоновую кислоту (600 мг, 2,000 ммоль) растворяли в 10 мл хлористого метилена и добавляли оксалилхлорид (279,4 мг, 2,200 ммоль) и охлаждали до 0°C. Десять капель диметилформамида затем добавляли, и реакционную смесь перемешивали в течение 15 минут, в течение которых возникло пузырение. Реакционную смесь нагревали до комнатной температуры в течение 1 ч, после чего добавляли N-[(2-хлор-5-аминофенил)метил]циклопропанкарбоксамид (300 мг, 1,336 ммоль), с последующим добавлением 1 мл триэтиламина. Реакционную смесь

перемешивали при комнатной температуре в течение 18 ч. Реакционную смесь добавляли к водному раствору бикарбоната натрия и экстрагировали три раза 25 мл хлористого метилена, затем сушили над сульфатом магния, фильтровали, и летучие компоненты удаляли при пониженном давлении, получая неочищенный твердый остаток, который хроматографировали на MPLC с элюентом гексан-50% этилацетата. Данная очистка давала 129,9 мг заявленного в заголовке соединения.  $^1\text{H}$  ЯМР ( $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta$  9,78 (уш с, 1H), 7,64 (д, 1H), 7,59 (с, 1H), 7,46 (д, 1H), 7,32 (с, 1H), 7,18 (с, 2H), 6,43 (уш с, 1H), 4,50 (д, 2H), 3,49 (д, 1H), 3,03 (д, 1H), 1,29 (м, 1H), 0,99 (м, 2H), 0,76 (м, 2H).

#### ПРИМЕР ПОЛУЧЕНИЯ 2

Получение 2,2-дихлор-3-(3,5-дихлорфенил)-N-[4-фтор-3-[(пропаноиламино)метил]фенил]циклопропан-1-карбоксамид (соединение 55)

##### Стадия А: Получение N-[(2-фтор-5-нитрофенил)метил]-пропанамида

2-Фтор-5-нитробензонитрил (5,000 г, 30,12 ммоль) растворяли в 100 мл тетрагидрофурана, перемешивая в атмосфере азота. Боран-диметилсульфидный комплекс (2,0 М в THF, 55 мл, 110,0 ммоль) добавляли по каплям при комнатной температуре в течение 15 минут. Реакционную смесь нагревали при 80°C в течение 18 ч. Очень аккуратно, 25 мл 2N хлористоводородной кислоты добавляли по каплям к реакционной смеси, после этого нагревания убирали, но реакцию не охлаждали до комнатной температуры. Реакционную смесь затем кипятили с обратным холодильником в течение 1 ч, затем охлаждали до комнатной температуры. Летучие компоненты удаляли при пониженном давлении и нагревали, получая хлористоводородную соль 2-фтор-5-нитробензиламина, которую применяли без дополнительной очистки. 2-фтор-5-нитробензиламин (1,000 г, 5,882 ммоль) растворяли в 10 мл хлористого метилена и 1 мл триэтиламина, охлаждали до 0°C и через 15 минут перемешивания все твердые вещества растворились. К данной реакционной смеси добавляли пропионилхлорид (821 мг, 6,471 ммоль) по каплям, поддерживая температуру ниже 5°C. Реакционную смесь медленно нагревали до комнатной температуры в течение 18 ч. Реакционную смесь добавляли к воде (50 мл) и экстрагировали хлористым метиленом, сушили над сульфатом магния, фильтровали, и летучие компоненты удаляли при пониженном давлении, получая неочищенное масло, которое хроматографировали с системой элюентов гексан-этилацетат, получая 799 мг требуемого продукта.  $^1\text{H}$  ЯМР ( $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta$  8,26 (с, 1H), 8,14 (д, 1H), 7,19 (т, 1H), 6,60 (уш с, 1H), 4,56 (д, 2H), 2,33 (кв, 2H), 1,19 (т, 3H).

##### Стадия В: Получение N-[(2-фтор-5-аминофенил)метил]-пропанамида

N-[(2-фтор-5-нитрофенил)метил]пропанамида (779 мг, 3,466 ммоль) растворяли в 50 мл этилацетата и 10 мл этанола и помещали в атмосферу азота в сосуде рагг. Оксид платины (100 мг) добавляли одной порцией, и реакционную смесь продували три раза азотом и затем продували три раза водородом, получая давление приблизительно 50 пси газообразного водорода. Реакционную смесь встряхивали в течение 3 ч. Газообразный водород удаляли, и реакционную смесь фильтровали через целит. Фильтрат помещали на роторный испаритель, и летучие компоненты удаляли, получая 458 мг заявленного в

заголовке соединения в виде светло-желтого твердого остатка.  $^1\text{H}$  ЯМР ( $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta$  6,83 (т, 1H), 6,64 (дд, 1H), 6,52 (ддд, 1H), 5,81 (уш с, 1H) 4,39 (д, 2H), 3,56 (уш с, 2H), 2,23 (кв, 2H), 1,16 (т, 3H).

Стадия С: Получение 2,2-дихлор-3-(3,5-дихлорфенил)-N-[4-фтор-3-[(пропаноиламино)метил]фенил]циклопропан-1-карбоксамид

2,2-дихлор-3-(3,5-дихлорфенил)циклопропанкарбоновую кислоту (500 мг, 1,666 ммоль) растворяли в 10 мл хлористого метилена и добавляли оксалилхлорид (228 мг, 1,800 ммоль) и охлаждали до  $0^\circ\text{C}$ . Затем добавляли десять капель диметилформамида, и реакционную смесь перемешивали в течение 15 минут, в течение которых возникло пузырение. Реакционную смесь нагревали до комнатной температуры в течение 1 ч, после чего добавляли N-[(2-фтор-5-аминофенил)метил]пропанамид (294,0 мг, 1,500 ммоль), с последующим добавлением 1 мл триэтиламина. Реакционную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 18 ч. Реакционную смесь добавляли к водному раствору бикарбоната натрия и экстрагировали три раза 25 мл хлористого метилена, затем сушили над сульфатом магния, фильтровали, и летучие компоненты удаляли при пониженном давлении, получая неочищенный твердый остаток, который хроматографировали на MPLC с элюентом гексан-50% этилацетат. Данная очистка давала 157,9 мг заявленного в заголовке соединения.  $^1\text{H}$  ЯМР ( $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta$  9,49 (уш с, 1H), 7,68 (д, 1H), 7,33 (с, 1H), 7,27 (м, 1H), 7,16 (с, 2H), 6,97 (т, 1H), 6,24 (уш с, 1H), 4,44 (д, 2H), 3,51 (д, 1H), 3,03 (д, 1H), 2,31 (кв, 2H), 1,19 (т, 3H).

### ПРИМЕР ПОЛУЧЕНИЯ 3

Получение 2,2-дихлор-N-[4-хлор-3-[(циклопропанкарбониламино)метил]фенил]-3-[3,4,5-трифторфенил]фенилциклопропан-1-карбоксамид (соединение 39)

Стадия А: Получение (Е)-3-(4-Фтор-3-трифторметилфенил)акриальдегида

Ацетальдегид (50 г, 1,136 моль) добавляли к перемешиваемому раствору 4-фтор-3-(трифторметил)бензальдегида (24,00 г, 125,0 ммоль) в 50 мл метанола при  $0^\circ\text{C}$ , перемешивая в атмосфере азота. Раствор гидроксида калия (1,0 г, 17,86 ммоль) в 10 мл метанола добавляли по каплям. Реакционную смесь перемешивали в течение 40 минут, медленно нагревая до комнатной температуры. Уксусный ангидрид (75 мл) добавляли при  $10^\circ\text{C}$  к реакции, которую затем нагревали при  $80^\circ\text{C}$  в течение 1 ч. Реакцию затем охлаждали до комнатной температуры и добавляли 20 мл концентрированной хлористоводородной кислоты. Реакцию затем кипятили с обратным холодильником в течение 30 минут. Реакционную смесь разбавляли 500 мл воды и экстрагировали 250 мл этилацетата, органический слой сушили сульфатом магния, фильтровали, и летучие компоненты удаляли при пониженном давлении, получая 22,78 г заявленного в заголовке соединения, которое применяли в следующей стадии без дополнительной очистки.  $^1\text{H}$  ЯМР ( $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta$  9,73 (д, 1H), 7,74-7,81 (м, 2H), 7,45 (д, 1H), 7,29 (д, 1H), 6,69 (дд, 1H).

Стадия В: Получение (Е)-2-Фтор-1-трифторметил-5-(3,3-диэтоксипроп-1-ен-1-ил)бензола

Триэтилортоформиат (19,32 г, 130,6 ммоль) добавляли к (Е)-3-(4-Фтор-3-



трифторметилфенил)акриальдегиду (22,78 г, 104,5 ммоль) в этаноле (200 мл). Каталитическое количество N-бромсукцинимиды (500 мг) добавляли к реакционной смеси и перемешивали в течение 24 часов при комнатной температуре. Этанол удаляли при пониженном давлении. Полученный в результате остаток реакционной смеси добавляли к водному раствору 5% гидроксида натрия (100 мл) и экстрагировали 3×300 мл диэтилового эфира, сушили над безводным сульфатом магния, фильтровали, и летучие компоненты удаляли при пониженном давлении, получая требуемый продукт (29,33 г). <sup>1</sup>H ЯМР (CDCl<sub>3</sub>): δ 7,61 (д, 1H), 7,56 (дт, 1H), 7,16 (т, 1H), 6,68 (д, 1H), 6,19 (дд, 1H), 5,08 (д, 1H), 3,56-3,72 (м, 4H), 1,22-1,26 (м, 6H).

Стадия С: Получение 2-Фтор-1-трифторметил-5-[2,2-дихлор-3-(диэтоксиметил)циклопропил]бензола

(E)-2-Фтор-1-трифторметил-5-(3,3-диэтоксиргор-1-ен-1-ил)бензол (29,33 г, 100,4 ммоль) растворяли в хлороформе (400 мл) и добавляли гексафторфосфат тетрабутиламмония (1,000 г) и с энергичным перемешиванием реакционную смесь нагревали до 40°C. Добавляли по каплям водный гидроксид натрия (50% по весу, 60 мл) в течение 30 минут. Реакцию продолжали нагревать в течение ночи. Реакцию затем охлаждали до комнатной температуры и разбавляли 400 мл гексана, и органический слой фильтровали через целит, сушили над безводным сульфатом магния, фильтровали, и летучие компоненты удаляли при пониженном давлении, получая 18,36 г темного масла, которое применяли без дополнительной очистки. <sup>1</sup>H ЯМР (CDCl<sub>3</sub>): δ 7,49 (д, 1H), 7,44 (дт, 1H) 7,19 (т, 1H) 4,59 (д, 1H), 3,58-3,77 (м, 4H), 2,83 (д, 1H), 2,27 (дд, 1H), 1,32 (т, 3H), 1,21 (т, 3H).

Стадия D: Получение 2,2-Дихлор-3-(4-фтор-3-трифторметилфенил)циклопропанкарбоксальдегида

(18,36 г, 48,96 ммоль) растворяли в ацетонитриле (400 мл) и добавляли 42 мл концентрированной водной хлористоводородной кислоты, и реакцию перемешивали при комнатной температуре в течение 16 ч. Добавляли воду (200 мл), и летучие компоненты удаляли при пониженном давлении, с последующей экстракцией 2×400 мл гексана. Органические слои объединяли и сушили над сульфатом магния, фильтровали, и летучие компоненты удаляли при пониженном давлении. Неочищенную смесь очищали MPLC (силикагель, элюируя 0-25% этилацетата в гексане), получая заявленное в заголовке соединение в виде желтого масла (9,681 г). <sup>1</sup>H ЯМР (CDCl<sub>3</sub>): δ 9,55 (д, 1H), 7,51 (д, 1H), 7,47 (дт, 1H), 7,25 (т, 1H), 3,56 (д, 1H), 2,94 (дд, 1H)

Стадия E: Получение 2,2-Дихлор-3-(4-фтор-3-трифторметилфенил)циклопропанкарбоновой кислоты

Перманганат натрия (40% водный раствор, 13,50 г) добавляли по каплям к 2,2-дихлор-3-(4-фтор-3-трифторметилфенил)циклопропанкарбоксальдегиду (9,681 г, 30,54 ммоль) в ацетоне (200 мл) при 15°C. Реакционную смесь перемешивали в течение 2 ч, нагревая до комнатной температуры с течением времени, затем добавляли 5 мл изопропилового спирта, и реакцию перемешивали в течение 30 минут. Летучие

компоненты затем удаляли при пониженном давлении, получая неочищенное масло и добавляли 100 мл 1 N хлористоводородной кислоты и 500 мл этилацетата. Жидкую смесь добавляли к 100 г наполнителя из целлита для фильтра и фильтровали. Органический слой отделяли, сушили над сульфатом магния, фильтровали, и летучие компоненты удаляли при пониженном давлении, получая неочищенный кислотный продукт, который промывали гексаном, получая белый порошок (4,36 г).  $^1\text{H}$  ЯМР (CDCl<sub>3</sub>):  $\delta$  7,51-7,54 (м, 2H), 7,26 (т, 1H), 5,01 (уш с, 1H), 3,52 (д, 1H), 2,91 (д, 1H).

Стадия	F:	Получение	2,2-дихлор-N-[4-хлор-3-(циклопропанкарбониламино)метил]фенил]-3-[4-фтор-3-(трифторметил)фенил]циклопропан-1-карбоксоамида
--------	----	-----------	---

2,2-дихлор-3-(4-фтор-3-трифторметилфенил)циклопропанкарбоновую кислоту (200 мг, 0,631 ммоль) растворяли в 7,5 мл безводного диметилформаида при комнатной температуре в атмосфере азота с интенсивным перемешиванием. Добавляли гексафторфосфат 3-оксида 1-[бис(диметиламино)метилен]-1H-1,2,3-триазоло[4,5-b]пиридиния (HATU) (300 мг, 0,789 ммоль), и полученный в результате прозрачный раствор перемешивали в течение 10 минут. N-[(2-хлор-5-аминофенил)метил]-циклопропанкарбоксоамид (141,7 мг, 0,631 ммоль) добавляли в реакционную смесь. Через 20 минут добавляли по каплям 1 мл диизопропилэтиламина, и реакционную смесь перемешивали в течение 16 ч. Реакционную смесь добавляли к насыщенному раствору бикарбоната натрия и экстрагировали три раза 50 мл диэтилового эфира. Объединенные органические экстракты промывали один раз водой, сушили над сульфатом магния, фильтровали, и летучие компоненты удаляли при пониженном давлении, получая неочищенный твердый остаток, который хроматографировали, применяя MPLC с элюентом гексан-50% этилацетат. Это давало заявленное в заголовке соединение (187,4 мг).  $^1\text{H}$  ЯМР (CDCl<sub>3</sub>):  $\delta$  9,18 (с, 1H), 7,46-7,54 (м, 3H), 7,38 (с, 1H), 7,20-7,25 (м, 2H), 6,46 (уш с, 1H), 4,48 (д, 2H), 3,51 (д, 1H), 2,97 (д, 1H), 1,48 (м, 1H), 0,99 (м, 2H), 0,80 (м, 2H).

Способами, описанными в настоящем изобретении вместе со способами, известными в данной области техники, можно получить следующие соединения таблиц А-1-F-12. Каждая таблица представляет три группы соединений: первая группа соединений представляет собой поднабор формулы **1**, вторая группа соединений представляет собой поднабор формулы **1-транс**, и третья группа соединений представляет собой поднабор формулы **1-R, R**. Например, первая позиция в таблице А-1 представляет собой следующие три соединения: соединение формулы **1** как определено в первой позиции таблицы А-1, соединение формулы **1-транс**, как определено в первой позиции таблицы А-1, и соединение формулы **1-R, R** как определено в первой позиции таблицы А-1. Структуры данных трех соединений показаны ниже.

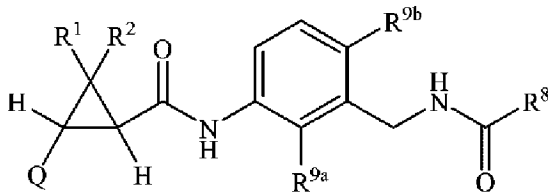


где 3,4-дихлорфенил и C(O)NH-  
группы, соединенные с  
циклопропановым кольцом по  
атомам углерода, отмеченным  
звездочкой, представляют собой  
*транс* друг к другу



Следующие сокращения можно применять в таблицах, которые следуют далее: CN обозначает циано, Ph обозначает фенил.

ТАБЛИЦА А-1



$R_1$  представляет собой Cl;  $R_2$  представляет собой Cl;  $R_{9a}$  представляет собой H;

$R_{9b}$  представляет собой F

<u>Q</u>	<u>R8</u>	<u>Q</u>	<u>R8</u>
3,4-ди(Cl)фенил	H	3,4-ди(F)фенил	H
3,4-ди(Cl)фенил	метил	3,4-ди(F)фенил	метил
3,4-ди(Cl)фенил	этил	3,4-ди(F)фенил	этил
3,4-ди(Cl)фенил	циклопропил	3,4-ди(F)фенил	циклопропил
3,4-ди(Cl)фенил	2-фторциклопропил	3,4-ди(F)фенил	2-фторциклопропил
3,4-ди(Cl)фенил	2-цианоциклопропил	3,4-ди(F)фенил	2-цианоциклопропил
3,4-ди(Cl)фенил	2-(CF <sub>3</sub> )циклопропил	3,4-ди(F)фенил	2-(CF <sub>3</sub> )циклопропил
3,4-ди(Cl)фенил	циклобутил	3,4-ди(F)фенил	циклобутил
3,4-ди(Cl)фенил	циклопентил	3,4-ди(F)фенил	циклопентил
3,4-ди(Cl)фенил	-CF <sub>3</sub>	3,4-ди(F)фенил	-CF <sub>3</sub>
3,4-ди(Cl)фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3,4-ди(F)фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3,4-ди(Cl)фенил	-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3,4-ди(F)фенил	-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>

3,4-ди(Cl)фенил	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	3,4-ди(F)фенил	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
3,4-ди(Cl)фенил	-OCH <sub>3</sub>	3,4-ди(F)фенил	-OCH <sub>3</sub>
3,4-ди(Cl)фенил	-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3,4-ди(F)фенил	-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3,4-ди(Cl)фенил	-NHCH <sub>3</sub>	3,4-ди(F)фенил	-NHCH <sub>3</sub>
3,4-ди(Cl)фенил	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	3,4-ди(F)фенил	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
3,4-ди(Cl)фенил	-NH(CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )	3,4-ди(F)фенил	-NH(CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )
3-Cl-4-F-фенил	H	3-F-4-Cl-фенил	H
3-Cl-4-F-фенил	метил	3-F-4-Cl-фенил	метил
3-Cl-4-F-фенил	этил	3-F-4-Cl-фенил	этил
3-Cl-4-F-фенил	циклопропил	3-F-4-Cl-фенил	циклопропил
3-Cl-4-F-фенил	2-фторциклопропил	3-F-4-Cl-фенил	2-фторциклопропил
3-Cl-4-F-фенил	2-цианоциклопропил	3-F-4-Cl-фенил	2-цианоциклопропил
3-Cl-4-F-фенил	2-(CF <sub>3</sub> )циклопропил	3-F-4-Cl-фенил	2-(CF <sub>3</sub> )циклопропил
3-Cl-4-F-фенил	циклобутил	3-F-4-Cl-фенил	циклобутил
3-Cl-4-F-фенил	циклопентил	3-F-4-Cl-фенил	циклопентил
3-Cl-4-F-фенил	-CF <sub>3</sub>	3-F-4-Cl-фенил	-CF <sub>3</sub>
3-Cl-4-F-фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3-F-4-Cl-фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3-Cl-4-F-фенил	-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3-F-4-Cl-фенил	-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3-Cl-4-F-фенил	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	3-F-4-Cl-фенил	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
3-Cl-4-F-фенил	-OCH <sub>3</sub>	3-F-4-Cl-фенил	-OCH <sub>3</sub>
3-Cl-4-F-фенил	-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3-F-4-Cl-фенил	-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3-Cl-4-F-фенил	-NHCH <sub>3</sub>	3-F-4-Cl-фенил	-NHCH <sub>3</sub>
3-Cl-4-F-фенил	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	3-F-4-Cl-фенил	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
3-Cl-4-F-фенил	-NH(CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )	3-F-4-Cl-фенил	-NH(CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	H	3,4,5-три(F)фенил	H
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	метил	3,4,5-три(F)фенил	метил
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	этил	3,4,5-три(F)фенил	этил
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	циклопропил	3,4,5-три(F)фенил	циклопропил
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	2-фторциклопропил	3,4,5-три(F)фенил	2-фторциклопропил

3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	2-цианоциклопропил	3,4,5-три(F)фенил	2-цианоциклопропил
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	2-(CF <sub>3</sub> )циклопропил	3,4,5-три(F)фенил	2-(CF <sub>3</sub> )циклопропил
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	циклобутил	3,4,5-три(F)фенил	циклобутил
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	циклопентил	3,4,5-три(F)фенил	циклопентил
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	-CF <sub>3</sub>	3,4,5-три(F)фенил	-CF <sub>3</sub>
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3,4,5-три(F)фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3,4,5-три(F)фенил	-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	3,4,5-три(F)фенил	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	-OCH <sub>3</sub>	3,4,5-три(F)фенил	-OCH <sub>3</sub>
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3,4,5-три(F)фенил	-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	-NHCH <sub>3</sub>	3,4,5-три(F)фенил	-NHCH <sub>3</sub>
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	3,4,5-три(F)фенил	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	-NH(CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )	3,4,5-три(F)фенил	-NH(CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )
3-(CF <sub>3</sub> )-4-F-фенил	H	3,5-ди(F)-4-Cl-фенил	H
3-(CF <sub>3</sub> )-4-F-фенил	метил	3,5-ди(F)-4-Cl-фенил	метил
3-(CF <sub>3</sub> )-4-F-фенил	этил	3,5-ди(F)-4-Cl-фенил	этил
3-(CF <sub>3</sub> )-4-F-фенил	циклопропил	3,5-ди(F)-4-Cl-фенил	циклопропил

3-(CF <sub>3</sub> )-4-F-фенил	2-фторциклопропил	3,5-ди(F)-4-Cl-фенил	2-фторциклопропил
3-(CF <sub>3</sub> )-4-F-фенил	2-цианоциклопропил	3,5-ди(F)-4-Cl-фенил	2-цианоциклопропил
3-(CF <sub>3</sub> )-4-F-фенил	2-(CF <sub>3</sub> )циклопропил	3,5-ди(F)-4-Cl-фенил	2-(CF <sub>3</sub> )циклопропил
3-(CF <sub>3</sub> )-4-F-фенил	циклобутил	3,5-ди(F)-4-Cl-фенил	циклобутил
3-(CF <sub>3</sub> )-4-F-фенил	циклопентил	3,5-ди(F)-4-Cl-фенил	циклопентил
3-(CF <sub>3</sub> )-4-F-фенил	-CF <sub>3</sub>	3,5-ди(F)-4-Cl-фенил	-CF <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-4-F-фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3,5-ди(F)-4-Cl-фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-4-F-фенил	-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3,5-ди(F)-4-Cl-фенил	-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-4-F-фенил	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	3,5-ди(F)-4-Cl-фенил	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-4-F-фенил	-OCH <sub>3</sub>	3,5-ди(F)-4-Cl-фенил	-OCH <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-4-F-фенил	-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3,5-ди(F)-4-Cl-фенил	-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-4-F-фенил	-NHCH <sub>3</sub>	3,5-ди(F)-4-Cl-фенил	-NHCH <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-4-F-фенил	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	3,5-ди(F)-4-Cl-фенил	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-4-F-фенил	-NH(CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )	3,5-ди(F)-4-Cl-фенил	-NH(CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )
3-Cl-5-F-фенил	H	3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	H
3-Cl-5-F-фенил	метил	3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	метил
3-Cl-5-F-фенил	этил	3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	этил
3-Cl-5-F-фенил	циклопропил	3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	циклопропил
3-Cl-5-F-фенил	2-фторциклопропил	3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	2-фторциклопропил
3-Cl-5-F-фенил	2-цианоциклопропил	3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	2-цианоциклопропил

3-Cl-5-F-фенил	2-(CF <sub>3</sub> )циклопропил	3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	2-(CF <sub>3</sub> )циклопропил
3-Cl-5-F-фенил	циклобутил	3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	циклобутил
3-Cl-5-F-фенил	циклопентил	3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	циклопентил
3-Cl-5-F-фенил	-CF <sub>3</sub>	3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	-CF <sub>3</sub>
3-Cl-5-F-фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3-Cl-5-F-фенил	-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3-Cl-5-F-фенил	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
3-Cl-5-F-фенил	-OCH <sub>3</sub>	3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	-OCH <sub>3</sub>
3-Cl-5-F-фенил	-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3-Cl-5-F-фенил	-NHCH <sub>3</sub>	3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	-NHCH <sub>3</sub>
3-Cl-5-F-фенил	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
3-Cl-5-F-фенил	-NH(CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )	3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	-NH(CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )
3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	H	3-(OCF <sub>3</sub> )-фенил	H
3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	метил	3-(OCF <sub>3</sub> )-фенил	метил
3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	этил	3-(OCF <sub>3</sub> )-фенил	этил
3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	циклопропил	3-(OCF <sub>3</sub> )-фенил	циклопропил
3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	2-фторциклопропил	3-(OCF <sub>3</sub> )-фенил	2-фторциклопропил
3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	2-цианоциклопропил	3-(OCF <sub>3</sub> )-фенил	2-цианоциклопропил
3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	2-(CF <sub>3</sub> )циклопропил	3-(OCF <sub>3</sub> )-фенил	2-(CF <sub>3</sub> )циклопропил
3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	циклобутил	3-(OCF <sub>3</sub> )-фенил	циклобутил
3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	циклопентил	3-(OCF <sub>3</sub> )-фенил	циклопентил
3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	-CF <sub>3</sub>	3-(OCF <sub>3</sub> )-фенил	-CF <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3-(OCF <sub>3</sub> )-фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3-(OCF <sub>3</sub> )-фенил	-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	3-(OCF <sub>3</sub> )-фенил	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	-OCH <sub>3</sub>	3-(OCF <sub>3</sub> )-фенил	-OCH <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3-(OCF <sub>3</sub> )-фенил	-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	-NHCH <sub>3</sub>	3-(OCF <sub>3</sub> )-фенил	-NHCH <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	3-(OCF <sub>3</sub> )-фенил	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	-NH(CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )	3-(OCF <sub>3</sub> )-фенил	-NH(CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )

ТАБЛИЦА А-2

Таблица А-2 является идентичной таблице А-1, за исключением того, что R9b представляет собой Cl.

ТАБЛИЦА А-3

Таблица А-3 является идентичной таблице А-1, за исключением того, что R9b

представляет собой CN.

ТАБЛИЦА А-4

Таблица А-4 является идентичной таблице А-1, за исключением того, что R9b представляет собой Bг.

ТАБЛИЦА А-5

Таблица А-5 является идентичной таблице А-1, за исключением того, что R9b представляет собой Me.

ТАБЛИЦА А-6

Таблица А-6 является идентичной таблице А-1, за исключением того, что R9a представляет собой F.

ТАБЛИЦА А-7

Таблица А-7 является идентичной таблице А-1, за исключением того, что R9a представляет собой F, и R9b представляет собой Cl.

ТАБЛИЦА А-8

Таблица А-8 является идентичной таблице А-1, за исключением того, что R9a представляет собой F, и R9b представляет собой CN.

ТАБЛИЦА А-9

Таблица А-9 является идентичной таблице А-1, за исключением того, что R9a представляет собой F, и R9b представляет собой Bг.

ТАБЛИЦА А-10

Таблица А-10 является идентичной таблице А-1, за исключением того, что R9a представляет собой F, и R9b представляет собой Me.

ТАБЛИЦА А-11

Таблица А-11 является идентичной таблице А-1, за исключением того, что R9a представляет собой Cl.

ТАБЛИЦА А-12

Таблица А-12 является идентичной таблице А-1, за исключением того, что R9a представляет собой Cl, и R9b представляет собой Cl.

ТАБЛИЦА А-13

Таблица А-13 является идентичной таблице А-1, за исключением того, что R9a представляет собой Cl, и R9b представляет собой CN.

ТАБЛИЦА А-14

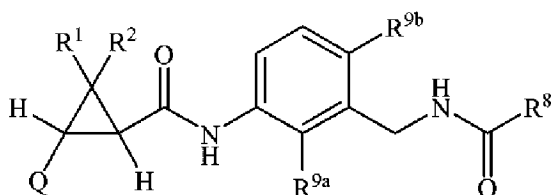
Таблица А-14 является идентичной таблице А-1, за исключением того, что R9a представляет собой Cl, и R9b представляет собой Bг.

ТАБЛИЦА А-15

Таблица А-15 является идентичной таблице А-1, за исключением того, что R9a представляет собой Cl, и R9b представляет собой Me.

ТАБЛИЦА В-1





R1 представляет собой F; R2 представляет собой F; R9a представляет собой H; R9b

представляет собой F

<u>Q</u>	<u>R8</u>	<u>Q</u>	<u>R8</u>
3,4-ди(Cl)фенил	H	3,4-ди(F)фенил	H
3,4-ди(Cl)фенил	метил	3,4-ди(F)фенил	метил
3,4-ди(Cl)фенил	этил	3,4-ди(F)фенил	этил
3,4-ди(Cl)фенил	циклопропил	3,4-ди(F)фенил	циклопропил
3,4-ди(Cl)фенил	2-фторциклопропил	3,4-ди(F)фенил	2-фторциклопропил
3,4-ди(Cl)фенил	2-цианоциклопропил	3,4-ди(F)фенил	2-цианоциклопропил
3,4-ди(Cl)фенил	2-(CF3)циклопропил	3,4-ди(F)фенил	2-(CF3)циклопропил
3,4-ди(Cl)фенил	циклобутил	3,4-ди(F)фенил	циклобутил
3,4-ди(Cl)фенил	циклопентил	3,4-ди(F)фенил	циклопентил
3,4-ди(Cl)фенил	-CF3	3,4-ди(F)фенил	-CF3
3,4-ди(Cl)фенил	-CH2CF3	3,4-ди(F)фенил	-CH2CF3
3,4-ди(Cl)фенил	-CF2CF3	3,4-ди(F)фенил	-CF2CF3
3,4-ди(Cl)фенил	-CH2OCH3	3,4-ди(F)фенил	-CH2OCH3
3,4-ди(Cl)фенил	-OCH3	3,4-ди(F)фенил	-OCH3
3,4-ди(Cl)фенил	-OCH2CF3	3,4-ди(F)фенил	-OCH2CF3
3,4-ди(Cl)фенил	-NHCH3	3,4-ди(F)фенил	-NHCH3
3,4-ди(Cl)фенил	-N(CH3)3	3,4-ди(F)фенил	-N(CH3)3
3,4-ди(Cl)фенил	-NH(CH2CF3)	3,4-ди(F)фенил	-NH(CH2CF3)
3-Cl-4-F-фенил	H	3-F-4-Cl-фенил	H
3-Cl-4-F-фенил	метил	3-F-4-Cl-фенил	метил
3-Cl-4-F-фенил	этил	3-F-4-Cl-фенил	этил
3-Cl-4-F-фенил	циклопропил	3-F-4-Cl-фенил	циклопропил
3-Cl-4-F-фенил	2-фторциклопропил	3-F-4-Cl-фенил	2-фторциклопропил
3-Cl-4-F-фенил	2-цианоциклопропил	3-F-4-Cl-фенил	2-цианоциклопропил
3-Cl-4-F-фенил	2-(CF3)циклопропил	3-F-4-Cl-фенил	2-(CF3)циклопропил
3-Cl-4-F-фенил	циклобутил	3-F-4-Cl-фенил	циклобутил
3-Cl-4-F-фенил	циклопентил	3-F-4-Cl-фенил	циклопентил

3-Cl-4-F-фенил	-CF <sub>3</sub>	3-F-4-Cl-фенил	-CF <sub>3</sub>
3-Cl-4-F-фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3-F-4-Cl-фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3-Cl-4-F-фенил	-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3-F-4-Cl-фенил	-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3-Cl-4-F-фенил	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	3-F-4-Cl-фенил	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
3-Cl-4-F-фенил	-OCH <sub>3</sub>	3-F-4-Cl-фенил	-OCH <sub>3</sub>
3-Cl-4-F-фенил	-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3-F-4-Cl-фенил	-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3-Cl-4-F-фенил	-NHCH <sub>3</sub>	3-F-4-Cl-фенил	-NHCH <sub>3</sub>
3-Cl-4-F-фенил	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	3-F-4-Cl-фенил	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
3-Cl-4-F-фенил	-NH(CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )	3-F-4-Cl-фенил	-NH(CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	H	3,4,5-три(F)фенил	H
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	метил	3,4,5-три(F)фенил	метил
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	этил	3,4,5-три(F)фенил	этил
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	циклопропил	3,4,5-три(F)фенил	циклопропил
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	2-фторциклопропил	3,4,5-три(F)фенил	2-фторциклопропил
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	2-цианоциклопропил	3,4,5-три(F)фенил	2-цианоциклопропил
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	2-(CF <sub>3</sub> )циклопропил	3,4,5-три(F)фенил	2-(CF <sub>3</sub> )циклопропил
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	циклобутил	3,4,5-три(F)фенил	циклобутил
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	циклопентил	3,4,5-три(F)фенил	циклопентил
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	-CF <sub>3</sub>	3,4,5-три(F)фенил	-CF <sub>3</sub>
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3,4,5-три(F)фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3,4,5-три(F)фенил	-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	3,4,5-три(F)фенил	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>

фенил			
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	-OCH <sub>3</sub>	3,4,5-три(F)фенил	-OCH <sub>3</sub>
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3,4,5-три(F)фенил	-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	-NHCH <sub>3</sub>	3,4,5-три(F)фенил	-NHCH <sub>3</sub>
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	3,4,5-три(F)фенил	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	-NH(CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )	3,4,5-три(F)фенил	-NH(CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )
3-(CF <sub>3</sub> )-4-F-фенил	H	3,5-ди(F)-4-Cl-фенил	H
3-(CF <sub>3</sub> )-4-F-фенил	метил	3,5-ди(F)-4-Cl-фенил	метил
3-(CF <sub>3</sub> )-4-F-фенил	этил	3,5-ди(F)-4-Cl-фенил	этил
3-(CF <sub>3</sub> )-4-F-фенил	циклопропил	3,5-ди(F)-4-Cl-фенил	циклопропил
3-(CF <sub>3</sub> )-4-F-фенил	2-фторциклопропил	3,5-ди(F)-4-Cl-фенил	2-фторциклопропил
3-(CF <sub>3</sub> )-4-F-фенил	2-цианоциклопропил	3,5-ди(F)-4-Cl-фенил	2-цианоциклопропил
3-(CF <sub>3</sub> )-4-F-фенил	2-(CF <sub>3</sub> )циклопропил	3,5-ди(F)-4-Cl-фенил	2-(CF <sub>3</sub> )циклопропил
3-(CF <sub>3</sub> )-4-F-фенил	циклобутил	3,5-ди(F)-4-Cl-фенил	циклобутил
3-(CF <sub>3</sub> )-4-F-фенил	циклопентил	3,5-ди(F)-4-Cl-фенил	циклопентил
3-(CF <sub>3</sub> )-4-F-фенил	-CF <sub>3</sub>	3,5-ди(F)-4-Cl-фенил	-CF <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-4-F-фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3,5-ди(F)-4-Cl-фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-4-F-фенил	-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3,5-ди(F)-4-Cl-фенил	-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>

фенил			
3-(CF <sub>3</sub> )-4-F-фенил	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	3,5-ди(F)-4-Cl-фенил	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-4-F-фенил	-OCH <sub>3</sub>	3,5-ди(F)-4-Cl-фенил	-OCH <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-4-F-фенил	-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3,5-ди(F)-4-Cl-фенил	-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-4-F-фенил	-NHCH <sub>3</sub>	3,5-ди(F)-4-Cl-фенил	-NHCH <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-4-F-фенил	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	3,5-ди(F)-4-Cl-фенил	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-4-F-фенил	-NH(CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )	3,5-ди(F)-4-Cl-фенил	-NH(CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )
3-Cl-5-F-фенил	H	3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	H
3-Cl-5-F-фенил	метил	3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	метил
3-Cl-5-F-фенил	этил	3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	этил
3-Cl-5-F-фенил	циклопропил	3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	циклопропил
3-Cl-5-F-фенил	2-фторциклопропил	3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	2-фторциклопропил
3-Cl-5-F-фенил	2-цианоциклопропил	3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	2-цианоциклопропил
3-Cl-5-F-фенил	2-(CF <sub>3</sub> )циклопропил	3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	2-(CF <sub>3</sub> )циклопропил
3-Cl-5-F-фенил	циклобутил	3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	циклобутил
3-Cl-5-F-фенил	циклопентил	3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	циклопентил
3-Cl-5-F-фенил	-CF <sub>3</sub>	3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	-CF <sub>3</sub>
3-Cl-5-F-фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3-Cl-5-F-фенил	-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3-Cl-5-F-фенил	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
3-Cl-5-F-фенил	-OCH <sub>3</sub>	3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	-OCH <sub>3</sub>
3-Cl-5-F-фенил	-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3-Cl-5-F-фенил	-NHCH <sub>3</sub>	3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	-NHCH <sub>3</sub>
3-Cl-5-F-фенил	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
3-Cl-5-F-фенил	-NH(CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )	3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	-NH(CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )
3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	H	3-(OCF <sub>3</sub> )-фенил	H
3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	метил	3-(OCF <sub>3</sub> )-фенил	метил
3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	этил	3-(OCF <sub>3</sub> )-фенил	этил

3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	циклопропил	3-(OCF <sub>3</sub> )-фенил	циклопропил
3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	2-фторциклопропил	3-(OCF <sub>3</sub> )-фенил	2-фторциклопропил
3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	2-цианоциклопропил	3-(OCF <sub>3</sub> )-фенил	2-цианоциклопропил
3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	2-(CF <sub>3</sub> )циклопропил	3-(OCF <sub>3</sub> )-фенил	2-(CF <sub>3</sub> )циклопропил
3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	циклобутил	3-(OCF <sub>3</sub> )-фенил	циклобутил
3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	циклопентил	3-(OCF <sub>3</sub> )-фенил	циклопентил
3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	-CF <sub>3</sub>	3-(OCF <sub>3</sub> )-фенил	-CF <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3-(OCF <sub>3</sub> )-фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3-(OCF <sub>3</sub> )-фенил	-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	3-(OCF <sub>3</sub> )-фенил	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	-OCH <sub>3</sub>	3-(OCF <sub>3</sub> )-фенил	-OCH <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3-(OCF <sub>3</sub> )-фенил	-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	-NHCH <sub>3</sub>	3-(OCF <sub>3</sub> )-фенил	-NHCH <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	3-(OCF <sub>3</sub> )-фенил	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	-NH(CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )	3-(OCF <sub>3</sub> )-фенил	-NH(CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )

ТАБЛИЦА В-2

Таблица В-2 является идентичной таблице В-1, за исключением того, что R<sup>9b</sup> представляет собой Cl.

ТАБЛИЦА В-3

Таблица В-3 является идентичной таблице В-1, за исключением того, что R<sup>9b</sup> представляет собой CN.

ТАБЛИЦА В-4

Таблица В-4 является идентичной таблице В-1, за исключением того, что R<sup>9b</sup> представляет собой Br.

ТАБЛИЦА В-5

Таблица В-5 является идентичной таблице В-1, за исключением того, что R<sup>9b</sup> представляет собой Me.

ТАБЛИЦА В-6

Таблица В-6 является идентичной таблице В-1, за исключением того, что R<sup>9a</sup> представляет собой F.

ТАБЛИЦА В-7

Таблица В-7 является идентичной таблице В-1, за исключением того, что R<sup>9a</sup> представляет собой F, и R<sup>9b</sup> представляет собой Cl.

ТАБЛИЦА В-8

Таблица В-8 является идентичной таблице В-1, за исключением того, что R<sup>9a</sup> представляет собой F, и R<sup>9b</sup> представляет собой CN.

ТАБЛИЦА В-9

Таблица В-9 является идентичной таблице В-1, за исключением того, что R<sup>9a</sup> представляет собой F, и R<sup>9b</sup> представляет собой Br.

ТАБЛИЦА В-10

Таблица В-10 является идентичной таблице В-1, за исключением того, что R<sup>9a</sup> представляет собой F, и R<sup>9b</sup> представляет собой Me.

ТАБЛИЦА В-11

Таблица В-11 является идентичной таблице В-1, за исключением того, что R<sup>9a</sup> представляет собой Cl.

ТАБЛИЦА В-12

Таблица В-12 является идентичной таблице В-1, за исключением того, что R<sup>9a</sup> представляет собой Cl, и R<sup>9b</sup> представляет собой Cl.

ТАБЛИЦА В-13

Таблица В-13 является идентичной таблице В-1, за исключением того, что R<sup>9a</sup> представляет собой Cl, и R<sup>9b</sup> представляет собой CN.

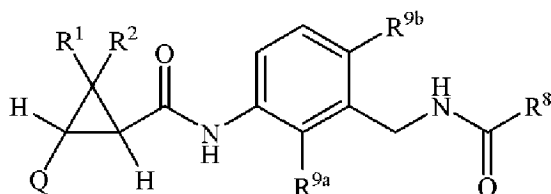
ТАБЛИЦА В-14

Таблица В-14 является идентичной таблице В-1, за исключением того, что R<sup>9a</sup> представляет собой Cl, и R<sup>9b</sup> представляет собой Br.

ТАБЛИЦА В-15

Таблица В-15 является идентичной таблице В-1, за исключением того, что R<sup>9a</sup> представляет собой Cl, и R<sup>9b</sup> представляет собой Me.

ТАБЛИЦА С-1



R1 представляет собой Cl; R2 представляет собой Cl; R<sup>9a</sup> представляет собой H;

R<sup>9b</sup> представляет собой F

<u>Q</u>	<u>R8</u>	<u>Q</u>	<u>R8</u>
3-F-фенил	метил	3-F-фенил	этил
3-Cl-фенил	метил	3-Cl-фенил	этил
3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	метил	3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	этил
4-F-фенил	метил	4-F-фенил	этил
4-Cl-фенил	метил	4-Cl-фенил	этил
4-(CF <sub>3</sub> )-фенил	метил	4-(CF <sub>3</sub> )-фенил	этил
3,5-ди(Cl)фенил	метил	3,5-ди(Cl)фенил	этил
3,5-ди(F)фенил	метил	3,5-ди(F)фенил	этил
3-Cl-5-F-фенил	метил	3-Cl-5-F-фенил	этил

3-(CF <sub>3</sub> )-4-Cl-фенил	метил	3-(CF <sub>3</sub> )-4-Cl-фенил	этил
3-(CF <sub>3</sub> )-5-Cl-фенил	метил	3-(CF <sub>3</sub> )-5-Cl-фенил	этил
3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	метил	3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	этил
3,4,5-три(Cl)фенил	метил	3,4,5-три(Cl)фенил	этил
2-пиридинил	метил	2-пиридинил	этил
3-пиридинил	метил	3-пиридинил	этил
4-пиридинил	метил	4-пиридинил	этил
2-нафталенил	метил	2-нафталенил	этил
3-F-фенил	циклопропил	3-F-фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3-Cl-фенил	циклопропил	3-Cl-фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	циклопропил	3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
4-F-фенил	циклопропил	4-F-фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
4-Cl-фенил	циклопропил	4-Cl-фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
4-(CF <sub>3</sub> )-фенил	циклопропил	4-(CF <sub>3</sub> )-фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3,5-ди(Cl)фенил	циклопропил	3,5-ди(Cl)фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3,5-ди(F)фенил	циклопропил	3,5-ди(F)фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3-Cl-5-F-фенил	циклопропил	3-Cl-5-F-фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-4-Cl-фенил	циклопропил	3-(CF <sub>3</sub> )-4-Cl-фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-5-Cl-фенил	циклопропил	3-(CF <sub>3</sub> )-5-Cl-фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	циклопропил	3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3,4,5-три(Cl)фенил	циклопропил	3,4,5-три(Cl)фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
2-пиридинил	циклопропил	2-пиридинил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3-пиридинил	циклопропил	3-пиридинил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
4-пиридинил	циклопропил	4-пиридинил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
2-нафталенил	циклопропил	2-нафталенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3-F-фенил	-CF <sub>3</sub>	3-(CF <sub>3</sub> )-4-Cl-фенил	-CF <sub>3</sub>
3-Cl-фенил	-CF <sub>3</sub>	3-(CF <sub>3</sub> )-5-Cl-фенил	-CF <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	-CF <sub>3</sub>	3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	-CF <sub>3</sub>
4-F-фенил	-CF <sub>3</sub>	3,4,5-три(Cl)фенил	-CF <sub>3</sub>
4-Cl-фенил	-CF <sub>3</sub>	2-пиридинил	-CF <sub>3</sub>
4-(CF <sub>3</sub> )-фенил	-CF <sub>3</sub>	3-пиридинил	-CF <sub>3</sub>
3,5-ди(Cl)фенил	-CF <sub>3</sub>	4-пиридинил	-CF <sub>3</sub>
3,5-ди(F)фенил	-CF <sub>3</sub>	2-нафталенил	-CF <sub>3</sub>
3-Cl-5-F-фенил	-CF <sub>3</sub>		

## ТАБЛИЦА С-2

Таблица С-2 является идентичной таблице С-1, за исключением того, что R9b представляет собой Cl.

## ТАБЛИЦА С-3

Таблица С-3 является идентичной таблице С-1, за исключением того, что R9b представляет собой CN.

## ТАБЛИЦА С-4

Таблица С-4 является идентичной таблице С-1, за исключением того, что R9b представляет собой Vg.

## ТАБЛИЦА С-5

Таблица С-5 является идентичной таблице С-1, за исключением того, что R9b представляет собой Me.

## ТАБЛИЦА С-6

Таблица С-6 является идентичной таблице С-1, за исключением того, что R9a представляет собой F.

## ТАБЛИЦА С-7

Таблица С-7 является идентичной таблице С-1, за исключением того, что R9a представляет собой F, и R9b представляет собой Cl.

## ТАБЛИЦА С-7а

Таблица С-7а является идентичной таблице С-1, за исключением того, что R9a представляет собой F, и R9b представляет собой F.

## ТАБЛИЦА С-8

Таблица С-8 является идентичной таблице С-1, за исключением того, что R9a представляет собой F, и R9b представляет собой CN.

## ТАБЛИЦА С-9

Таблица С-9 является идентичной таблице С-1, за исключением того, что R9a представляет собой F, и R9b представляет собой Vg.

## ТАБЛИЦА С-10

Таблица С-10 является идентичной таблице С-1, за исключением того, что R9a представляет собой F, и R9b представляет собой Me.

## ТАБЛИЦА С-11

Таблица С-11 является идентичной таблице С-1, за исключением того, что R9a представляет собой Cl.

## ТАБЛИЦА С-12

Таблица С-12 является идентичной таблице С-1, за исключением того, что R9a представляет собой Cl, и R9b представляет собой Cl.

## ТАБЛИЦА С-13

Таблица С-13 является идентичной таблице С-1, за исключением того, что R9a представляет собой Cl, и R9b представляет собой CN.

## ТАБЛИЦА С-14

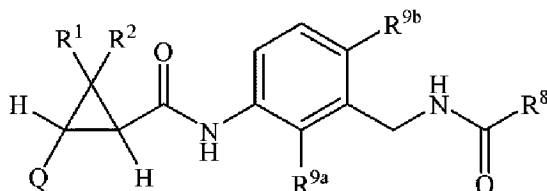


Таблица С-14 является идентичной таблице С-1, за исключением того, что R<sup>9a</sup> представляет собой Cl, и R<sup>9b</sup> представляет собой Br.

ТАБЛИЦА С-15

Таблица С-15 является идентичной таблице С-1, за исключением того, что R<sup>9a</sup> представляет собой Cl, и R<sup>9b</sup> представляет собой Me.

ТАБЛИЦА D-1



R<sup>1</sup> представляет собой F; R<sup>2</sup> представляет собой F; R<sup>9a</sup> представляет собой H; R<sup>9b</sup>

представляет собой F

<u>Q</u>	<u>R8</u>	<u>Q</u>	<u>R8</u>
3-F-фенил	метил	3-F-фенил	этил
3-Cl-фенил	метил	3-Cl-фенил	этил
3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	метил	3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	этил
4-F-фенил	метил	4-F-фенил	этил
4-Cl-фенил	метил	4-Cl-фенил	этил
4-(CF <sub>3</sub> )-фенил	метил	4-(CF <sub>3</sub> )-фенил	этил
3,5-ди(Cl)фенил	метил	3,5-ди(Cl)фенил	этил
3,5-ди(F)фенил	метил	3,5-ди(F)фенил	этил
3-Cl-5-F-фенил	метил	3-Cl-5-F-фенил	этил
3-(CF <sub>3</sub> )-4-Cl-фенил	метил	3-(CF <sub>3</sub> )-4-Cl-фенил	этил
3-(CF <sub>3</sub> )-5-Cl-фенил	метил	3-(CF <sub>3</sub> )-5-Cl-фенил	этил
3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	метил	3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	этил
3,4,5-три(Cl)фенил	метил	3,4,5-три(Cl)фенил	этил
2-пиридинил	метил	2-пиридинил	этил
3-пиридинил	метил	3-пиридинил	этил
4-пиридинил	метил	4-пиридинил	этил
2-нафталенил	метил	2-нафталенил	этил
3-F-фенил	циклопропил	3-F-фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3-Cl-фенил	циклопропил	3-Cl-фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	циклопропил	3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
4-F-фенил	циклопропил	4-F-фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
4-Cl-фенил	циклопропил	4-Cl-фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>

4-(CF <sub>3</sub> )-фенил	циклопропил	4-(CF <sub>3</sub> )-фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3,5-ди(Cl)фенил	циклопропил	3,5-ди(Cl)фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3,5-ди(F)фенил	циклопропил	3,5-ди(F)фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3-Cl-5-F-фенил	циклопропил	3-Cl-5-F-фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-4-Cl-фенил	циклопропил	3-(CF <sub>3</sub> )-4-Cl-фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-5-Cl-фенил	циклопропил	3-(CF <sub>3</sub> )-5-Cl-фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	циклопропил	3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3,4,5-три(Cl)фенил	циклопропил	3,4,5-три(Cl)фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
2-пиридинил	циклопропил	2-пиридинил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3-пиридинил	циклопропил	3-пиридинил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
4-пиридинил	циклопропил	4-пиридинил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
2-нафталенил	циклопропил	2-нафталенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3-F-фенил	-CF <sub>3</sub>	3-(CF <sub>3</sub> )-4-Cl-фенил	-CF <sub>3</sub>
3-Cl-фенил	-CF <sub>3</sub>	3-(CF <sub>3</sub> )-5-Cl-фенил	-CF <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-фенил	-CF <sub>3</sub>	3-(CF <sub>3</sub> )-5-F-фенил	-CF <sub>3</sub>
4-F-фенил	-CF <sub>3</sub>	3,4,5-три(Cl)фенил	-CF <sub>3</sub>
4-Cl-фенил	-CF <sub>3</sub>	2-пиридинил	-CF <sub>3</sub>
4-(CF <sub>3</sub> )-фенил	-CF <sub>3</sub>	3-пиридинил	-CF <sub>3</sub>
3,5-ди(Cl)фенил	-CF <sub>3</sub>	4-пиридинил	-CF <sub>3</sub>
3,5-ди(F)фенил	-CF <sub>3</sub>	2-нафталенил	-CF <sub>3</sub>
3-Cl-5-F-фенил	-CF <sub>3</sub>		

ТАБЛИЦА D-2

Таблица D-2 является идентичной таблице D-1, за исключением того, что R9b представляет собой Cl.

ТАБЛИЦА D-3

Таблица D-3 является идентичной таблице D-1, за исключением того, что R9b представляет собой CN.

ТАБЛИЦА D-4

Таблица D-4 является идентичной таблице D-1, за исключением того, что R9b представляет собой Br.

ТАБЛИЦА D-5

Таблица D-5 является идентичной таблице D-1, за исключением того, что R9b представляет собой Me.

ТАБЛИЦА D-6

Таблица D-6 является идентичной таблице D-1, за исключением того, что R9a представляет собой F.

## ТАБЛИЦА D-7

Таблица D-7 является идентичной таблице D-1, за исключением того, что R9a представляет собой F, и R9b представляет собой Cl.

## ТАБЛИЦА D-7a

Таблица D-7 является идентичной таблице D-1, за исключением того, что R9a представляет собой F, и R9b представляет собой F.

## ТАБЛИЦА D-8

Таблица D-8 является идентичной таблице D-1, за исключением того, что R9a представляет собой F, и R9b представляет собой CN.

## ТАБЛИЦА D-9

Таблица D-9 является идентичной таблице D-1, за исключением того, что R9a представляет собой F, и R9b представляет собой Br.

## ТАБЛИЦА D-10

Таблица D-10 является идентичной таблице D-1, за исключением того, что R9a представляет собой F, и R9b представляет собой Me.

## ТАБЛИЦА D-11

Таблица D-11 является идентичной таблице D-1, за исключением того, что R9a представляет собой Cl.

## ТАБЛИЦА D-12

Таблица D-12 является идентичной таблице D-1, за исключением того, что R9a представляет собой Cl, и R9b представляет собой Cl.

## ТАБЛИЦА D-13

Таблица D-13 является идентичной таблице D-1, за исключением того, что R9a представляет собой Cl, и R9b представляет собой CN.

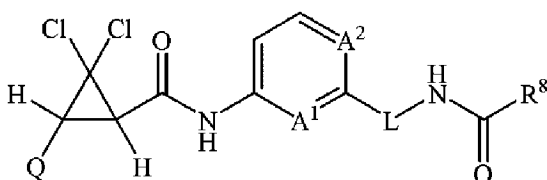
## ТАБЛИЦА D-14

Таблица D-14 является идентичной таблице D-1, за исключением того, что R9a представляет собой Cl, и R9b представляет собой Br.

## ТАБЛИЦА D-15

Таблица D-15 является идентичной таблице D-1, за исключением того, что R9a представляет собой Cl, и R9b представляет собой Me.

## ТАБЛИЦА E-1



A1 представляет собой CH; A2 представляет собой CH; L представляет собой -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-;

<u>Q</u>	<u>R8</u>	<u>Q</u>	<u>R8</u>
3,4-ди(Cl)фенил	метил	3,4-ди(F)фенил	метил

3,4-ди(Cl)фенил	этил	3,4-ди(F)фенил	этил
3,4-ди(Cl)фенил	циклопропил	3,4-ди(F)фенил	циклопропил
3,4-ди(Cl)фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3,4-ди(F)фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3,4-ди(Cl)фенил	-CF <sub>3</sub>	3,4-ди(F)фенил	-CF <sub>3</sub>
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	метил	3,4,5-три(F)фенил	метил
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	этил	3,4,5-три(F)фенил	этил
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	циклопропил	3,4,5-три(F)фенил	циклопропил
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	3,4,5-три(F)фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	-CF <sub>3</sub>	3,4,5-три(F)фенил	-CF <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-4-F-фенил	метил	3-(CF <sub>3</sub> )-4-F-фенил	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-4-F-фенил	этил	3-(CF <sub>3</sub> )-4-F-фенил	-CF <sub>3</sub>
3-(CF <sub>3</sub> )-4-F-фенил	циклопропил		

ТАБЛИЦА E-2

Таблица E-2 является идентичной таблице E-1, за исключением того, что L представляет собой -CH(CH<sub>3</sub>)-.

ТАБЛИЦА E-3

Таблица E-3 является идентичной таблице E-1, за исключением того, что L представляет собой -C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>-.

ТАБЛИЦА E-4

Таблица E-4 является идентичной таблице E-1, за исключением того, что A1 представляет собой N.

ТАБЛИЦА E-5

Таблица E-5 является идентичной таблице E-1, за исключением того, что A1 представляет собой N, и L представляет собой -CH(CH<sub>3</sub>)-.

ТАБЛИЦА E-6

Таблица E-6 является идентичной таблице E-1, за исключением того, что A1 представляет собой N, и L представляет собой -C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>-.

ТАБЛИЦА E-7

Таблица E-7 является идентичной таблице E-1, за исключением того, что A2 представляет собой N.

ТАБЛИЦА E-8

Таблица E-8 является идентичной таблице E-1, за исключением того, что A2 представляет собой N, и L представляет собой -CH(CH<sub>3</sub>)-.

ТАБЛИЦА E-9

Таблица E-9 является идентичной таблице E-1, за исключением того, что A2 представляет собой N, и L представляет собой -C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>-.

ТАБЛИЦА E-10

Таблица E-10 является идентичной таблице E-1, за исключением того, что A1

представляет собой N, и A2 представляет собой N.

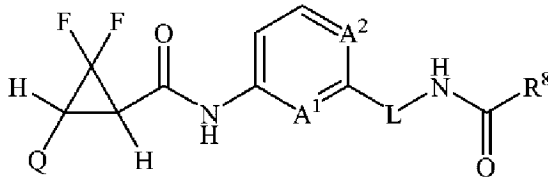
ТАБЛИЦА E-11

Таблица E-11 является идентичной таблице E-1, за исключением того, что A1 представляет собой N, A2 представляет собой N, и L представляет собой -CH(CH3)-.

ТАБЛИЦА E-12

Таблица E-12 является идентичной таблице E-1, за исключением того, что A1 представляет собой N, A2 представляет собой N, и L представляет собой -C(CH3)2-.

ТАБЛИЦА F-1



A1 представляет собой CH; A2 представляет собой CH; L представляет собой -CH2CH2-;

<u>Q</u>	<u>R8</u>	<u>Q</u>	<u>R8</u>
3,4-ди(Cl)фенил	метил	3,4-ди(F)фенил	метил
3,4-ди(Cl)фенил	этил	3,4-ди(F)фенил	этил
3,4-ди(Cl)фенил	циклопропил	3,4-ди(F)фенил	циклопропил
3,4-ди(Cl)фенил	-CH2CF3	3,4-ди(F)фенил	-CH2CF3
3,4-ди(Cl)фенил	-CF3	3,4-ди(F)фенил	-CF3
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	метил	3,4,5-три(F)фенил	метил
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	этил	3,4,5-три(F)фенил	этил
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	циклопропил	3,4,5-три(F)фенил	циклопропил
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	-CH2CF3	3,4,5-три(F)фенил	-CH2CF3
3,5-ди(Cl)-4-F-фенил	-CF3	3,4,5-три(F)фенил	-CF3
3-(CF3)-4-F-фенил	метил	3-(CF3)-4-F-фенил	-CH2CF3
3-(CF3)-4-F-фенил	этил	3-(CF3)-4-F-фенил	-CF3
3-(CF3)-4-F-фенил	циклопропил		

ТАБЛИЦА F-2

Таблица F-2 является идентичной таблице F-1, за исключением того, что L представляет собой -CH(CH3)-.

ТАБЛИЦА F-3

Таблица F-3 является идентичной таблице F-1, за исключением того, что L представляет собой -C(CH3)2-.

ТАБЛИЦА F-4

Таблица F-4 является идентичной таблице F-1, за исключением того, что A1 представляет собой N.

## ТАБЛИЦА F-5

Таблица F-5 является идентичной таблице F-1, за исключением того, что A1 представляет собой N, и L представляет собой -CH(CH<sub>3</sub>)-.

## ТАБЛИЦА F-6

Таблица F-6 является идентичной таблице F-1, за исключением того, что A1 представляет собой N, и L представляет собой -C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>-.

## ТАБЛИЦА F-7

Таблица F-7 является идентичной таблице F-1, за исключением того, что A2 представляет собой N.

## ТАБЛИЦА F-8

Таблица F-8 является идентичной таблице F-1, за исключением того, что A2 представляет собой N, и L представляет собой -CH(CH<sub>3</sub>)-.

## ТАБЛИЦА F-9

Таблица F-9 является идентичной таблице F-1, за исключением того, что A2 представляет собой N, и L представляет собой -C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>-.

## ТАБЛИЦА F-10

Таблица F-10 является идентичной таблице F-1, за исключением того, что A1 представляет собой N, и A2 представляет собой N.

## ТАБЛИЦА F-11

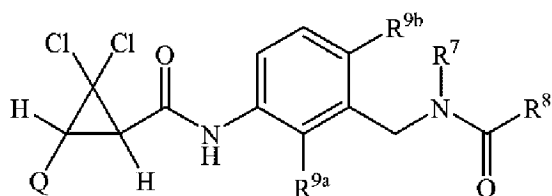
Таблица F-11 является идентичной таблице F-1, за исключением того, что A1 представляет собой N, A2 представляет собой N, и L представляет собой -CH(CH<sub>3</sub>)-.

## ТАБЛИЦА F-12

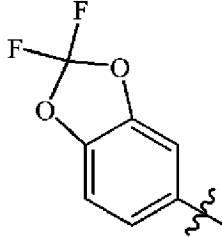
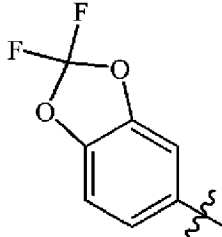
Таблица F-12 является идентичной таблице F-1, за исключением того, что A1 представляет собой N, A2 представляет собой N, и L представляет собой -C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>-.

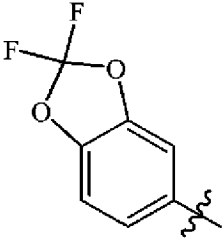
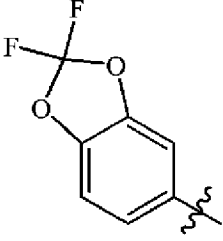
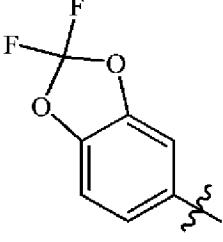
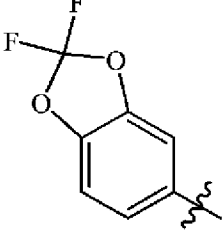
Конкретные соединения формулы **1**, полученные способами и вариантами, как описано в предшествующих схемах 1-19 и примерах получения 1-3, показаны в индексных таблицах ниже. Можно применять следующие сокращения: *Strpd* обозначает соединение, *t* представляет собой третичный, *c* представляет собой цикло, *Me* представляет собой метил, *Et* представляет собой этил, и *Ph* представляет собой фенил. Сокращение “Ex.” обозначает “пример” и затем следует номер, указывающий, в каком примере получения получают соединение. Что касается масс спектральных данных (AP+ (M+1)), приведенная числовая величина представляет собой молекулярный вес исходного молекулярного иона (M), образованного добавлением H<sup>+</sup> (молекулярный вес 1) к молекуле, получая M+1 пик, наблюдаемый масс-спектрометрией, применяя химическую ионизацию в атмосферном давлении (AP+). Альтернативные пики молекулярных ионов (например, M+2 или M+4), которые возникают для соединений, содержащих несколько галогенов, не приводят.

## ИНДЕКСНАЯ ТАБЛИЦА A



R7 представляет собой H

<u>Соединение №</u>	<u>Q</u>	<u>R9a</u>	<u>R9b</u>	<u>R8</u>	<u>MS данные</u>
1	3,5-дихлорфенил	F	F	1-(трифторметил)циклопропил	577
2	3,5-дихлорфенил	F	F	-CF <sub>3</sub>	537
3	3,4-дихлорфенил	H	F	-CH <sub>3</sub>	460,9*
4	4-фтор-3-(трифторметил)фенил	H	F	-CH <sub>3</sub>	479,2*
5		H	F	-CH <sub>3</sub>	475,2
6	4-фторфенил	H	F	-CH <sub>3</sub>	413
7	4-фторфенил	H	F	циклопропил	439
8	4-фторфенил	H	Cl	-CH <sub>3</sub>	429
9	4-фторфенил	H	Cl	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	443
10	4-фторфенил	H	F	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	427
11	фенил	H	F	циклопропил	421
12	фенил	H	Cl	-CH <sub>3</sub>	411
13	фенил	H	Cl	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	425
14		H	F	циклопропил	501

15		H	Cl	циклопропил	517,1
16		H	F	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	490,1
17		H	Cl	-CH <sub>3</sub>	491
18		H	Cl	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	505
19	3-хлор-4-фторфенил	H	Cl	-CF <sub>3</sub>	516,9
20	3,5-дихлорфенил	F	H	-CH <sub>3</sub>	465,1
21	3,5-дихлорфенил	F	H	-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	493,1
22	3,5-дихлорфенил	F	H	циклопропил	491,1
23	3,5-дихлорфенил	F	F	-CH <sub>3</sub>	483
24	3,5-дихлорфенил	F	F	-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	511
25	3-хлор-4-фторфенил	H	F	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	461
26	3-хлор-4-фторфенил	H	Cl	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	477
27	3-хлор-4-фторфенил	H	Cl	-CH <sub>3</sub>	462,9
28	3,5-дихлорфенил	F	F	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	497
29	3,5-дихлорфенил	F	F	1-цианоциклопропил	534
33	3,5-дихлорфенил	F	F	циклопропил	509
34	3-хлор-4-фторфенил	H	Cl	циклопропил	489
35	3,4-дихлорфенил	H	Cl	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	492,9
36	4-фтор-3-	H	F	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	495



	(трифторметил)фенил				
37	4-фтор-3-(трифторметил)фенил	H	F	-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	508,1
38	4-фтор-3-(трифторметил)фенил	H	Cl	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	511
39	4-фтор-3-(трифторметил)фенил	H	Cl	циклопропил	522,1
40	3,4-дихлорфенил	H	Cl	циклопропил	504,9
41	3,4-дихлорфенил	H	Cl	-OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	508,9
42	3,4-дихлорфенил	H	F	циклопропил	477
43	3,4-дихлорфенил	H	F	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	477
44	3,4-дихлорфенил	H	F	-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	491
45	3,5-дихлорфенил	H	Cl	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -	549,9
49	3,5-дихлорфенил	H	Cl	-OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	508,9
50	3,5-дихлорфенил	H	Cl	-CF <sub>3</sub>	532,9
51	3,5-дихлорфенил	H	Cl	1-цианоциклопропил	529,9
52	3,5-дихлорфенил	H	Cl	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	492,9
53	3,5-дихлорфенил	H	Cl	-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	507
54	3,5-дихлорфенил	H	F	-CH <sub>3</sub>	462,9
55	3,5-дихлорфенил	H	F	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	477
56	3,5-дихлорфенил	H	F	-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	491
57	3,5-дихлорфенил	H	Cl	-CH <sub>3</sub>	478,9
58	3,5-дихлор-4-фторфенил	H	Cl	циклопропил	522,9
59	3,5-дихлор-4-фторфенил	H	Cl	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	510,9
60	3,5-дихлор-4-фторфенил	H	Cl	-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	522,9*
61	3,5-дихлор-4-	H	Cl	-CH <sub>3</sub>	496,9

	фторфенил				
62	3,5-дихлорфенил	H	Cl	циклопропил	504,9
63	3,5-дихлорфенил	H	Cl	2,4-дифторфенил	574,9*
64	3,5-дихлорфенил	H	Cl	4-фторфенил	557,9*
65	3,4-дихлорфенил	H	Cl	циклобутил	519,2
66	3,5-дихлорфенил	H	Cl	циклобутил	519,2
67	3,5-дифторфенил	H	Cl	циклобутил	487,2
68	4-фторфенил	H	Cl	циклобутил	469,2
69	3,5-дифторфенил	H	Cl	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	477,2
70	4-фторфенил	H	Cl	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	459,2
71	3,4-дихлорфенил	H	Cl	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	511,1*
72	3,5-дифторфенил	H	Cl	-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	509,1
73	3,4-дихлорфенил	H	Cl	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	521,2
74	3,5-дифторфенил	H	Cl	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	521,2
75	3,4-дихлорфенил	H	Cl	-CH <sub>3</sub>	476,9*
76	4-фтор-3-(трифторметил)фенил	H	Cl	-CH <sub>3</sub>	497,2
77	4-фтор-3-(трифторметил)фенил	H	F	циклопропил	507,2
78	4-фтор-3-(трифторметил)фенил	H	F	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	549,1
79	3,4-дихлорфенил	H	F	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	531,1
80	3,4-дихлорфенил	H	F	-CF <sub>3</sub>	517
81	3,5-дифторфенил	H	Cl	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	461,2
82	3,5-дифторфенил	H	Cl	-CH <sub>3</sub>	447,1*
83	3,5-дифторфенил	H	F	циклопропил	457,2
84	3,5-дихлорфенил	H	F	1-фторциклопропил	508,1
85	3,4-дихлорфенил	H	F	1-фторциклопропил	508,1
90	3,4-дихлорфенил	H	Cl	-COOCH <sub>3</sub>	522,9
91	3,4-дифторфенил	H	F	циклопропил	457,1

92	3,4-дифторфенил	H	Cl	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	461,1
93	3,4-дифторфенил	H	Cl	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	489,1
94	3,4-дифторфенил	H	F	1-фторциклопропил	475,1
95	3,4-дифторфенил	H	Cl	CH <sub>3</sub>	447
96	3,4-дифторфенил	H	Cl	циклопропил	473
97	3-хлор-5-фторфенил	H	Cl	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	477
98	3-хлор-5-фторфенил	H	Cl	циклопропил	489
99	3-хлор-5-фторфенил	H	F	циклопропил	473
100	3,4-дифторфенил	H	Cl	циклобутил	487
101	4-фтор-3-трифторметилфенил	F	F	циклопропил	525
102	4-фтор-3-трифторметилфенил	F	F	1-трифторметилциклопропил	593
103	4-фтор-3-трифторметилфенил	F	F	CH <sub>2</sub> CN	524
104	3,4,5-трифторфенил	H	F	циклопропил	491,1
105	3,4,5-трифторфенил	H	Cl	CH <sub>3</sub>	465
106	3,4,5-трифторфенил	H	F	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	517,2
107	3,4,5-трифторфенил	H	Cl	циклобутил	505,2
108	3,4,5-трифторфенил	H	Cl	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	479,2
109	3,5-дихлорфенил	H	Cl	CH <sub>2</sub> COOCH <sub>3</sub>	539,1
110	3,4-дихлорфенил	H	Cl	CH <sub>2</sub> COOCH <sub>3</sub>	540
111	3,4,5-трифторфенил	H	Cl	CH <sub>2</sub> COOCH <sub>3</sub>	525,1
112	4-фтор-3-трифторметилфенил	H	Cl	CH <sub>2</sub> COOCH <sub>3</sub>	557,1
115	3,4-дихлорфенил	H	Cl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	547
116	4-фтор-3-трифторметилфенил	H	Cl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	565
117	3-хлор-5-фторфенил	H	Cl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	531,1
118	3,4,5-трифторфенил	H	Cl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	532,9
119	3-хлор-4-фторфенил	H	Cl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	531
120	3,5-дихлорфенил	H	Br	циклопропил	103-107

121	3,5-дихлорфенил	H	Br	CH <sub>3</sub>	205-209
124	3,5-дихлорфенил	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	222-226
126	3,4-дихлорфенил	H	Cl	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	521
127	3-хлор-5-фторфенил	H	Cl	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	505
128	3-хлор-4-фторфенил	H	Cl	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	505
129	3-хлор-5-фторфенил	H	F	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	515
130	4-хлор-3-фторфенил	H	F	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	515,1
131	4-хлор-3-фторфенил	H	Cl	CH <sub>3</sub>	462,9
132	4-хлор-3-фторфенил	H	Cl	циклопропил	489
133	3-хлор-4-фторфенил	H	Br	CH <sub>3</sub>	183-187
134	3,5-дихлорфенил	H	CH <sub>3</sub>	циклопропил	226-230
138	3-хлор-4-фторфенил	H	Br	циклопропил	116-120
139	3-хлор-4-фторфенил	H	Me	CH <sub>3</sub>	104-108
140	4-фтор-3-трифторметилфенил	F	F	CF <sub>3</sub>	553
141	4-фтор-3-трифторметилфенил	F	F	CHCN(CH <sub>3</sub> )	538
142	3-хлор-4-фторфенил	H	Me	циклопропил	98-112
143	3-фтор-4-трифторметилфенил	H	Cl	циклопропил	523
151	3-хлор-4-фторфенил	H	F	2-трифторметилциклопропил	541,1
152	3-хлор-4-фторфенил	H	F	CF <sub>3</sub>	501,1
155	4-фтор-3-трифторметилфенил	H	F	CH <sub>2</sub> NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	94-98
156	4-фтор-3-трифторметилфенил	H	F	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	76-80
157	4-фтор-3-трифторметилфенил	H	F	CH(NH <sub>2</sub> )CH <sub>3</sub>	78-82
158	4-фтор-3-трифторметилфенил	H	F	CH <sub>2</sub> NHCOOC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	226-230
159	4-фтор-3-	H	F	CH(CH <sub>3</sub> )NHCOOC(CH <sub>3</sub> )	136-140

	трифторметилфенил			3	
160	4-фтор-3-трифторметилфенил	H	F	CH(CH <sub>3</sub> )NH <sub>2</sub> HCl	194-198
161	4-фтор-3-трифторметилфенил	H	F	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub> HCl	201-205
162	4-фтор-3-трифторметилфенил	H	F	CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	181-185
163	4-фтор-3-трифторметилфенил	H	F	3-метилсульфонилазатиди н	221-225
164	3-хлор-4-фторфенил	F	F	циклопропил	491
165	3-хлор-4-фторфенил	F	F	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	479
166	3-хлор-4-фторфенил	F	F	CH <sub>3</sub>	465
167	3-хлор-4-фторфенил	F	F	CF <sub>3</sub>	519
168	4-хлор-3,5-дифторфенил	H	Cl	CF <sub>3</sub>	534,9
169	4-хлор-3,5-дифторфенил	H	F	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	533,1
170	3-хлор-4-фторфенил	F	F	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	533
171	4-фтор-3-трифторметилфенил	H	F	2,2-дифторциклопропил	543
172	3-хлор-4-фторфенил	H	F	2,2-дифторциклопропил	509
173	3-фтор-5-трифторметилфенил	H	Cl	CF <sub>3</sub>	551,1
174	4-фтор-3-трифторметилфенил	H	Cl	CF <sub>3</sub>	551,3
175	3,4-дихлорфенил	H	Cl	CF <sub>3</sub>	535
176	3-хлор-5-фторфенил	H	Cl	CF <sub>3</sub>	517
177	3,4,5-трифторфенил	H	Cl	CF <sub>3</sub>	519,1
178	3-трифторметоксифенил	H	Cl	CF <sub>3</sub>	549
179	3-трифторметоксифенил	H	Cl	циклопропил	521,1

	л				
180	3-трифторметоксифенил	H	Cl	CHCF <sub>3</sub>	563,1
181	4-фтор-3-трифторметилфенил	H	Cl	CH <sub>2</sub> (2-пиримидин)	575,3
182	3,4,5-трифторфенил	H	Cl	CH <sub>2</sub> (2-пиримидин)	543,2
183	3,4-дихлорфенил	H	Cl	CH <sub>2</sub> (2-пиримидин)	557,2
184	4-хлор-3,5-дифторфенил	H	Cl	CH <sub>2</sub> (2-пиримидин)	558,2
185	3-хлор-4-фторфенил	H	Cl	CH <sub>2</sub> (2-пиримидин)	541
186	3-хлор-4-фторфенил	H	F	CF <sub>2</sub> Cl	96-100
187	3-хлор-4-фторфенил	H	F	CF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	101-105
188	3-хлор-4-фторфенил	H	F	CH(Cl)CH <sub>3</sub>	104-107
189	3-хлор-4-фторфенил	H	F	CH <sub>2</sub> Cl	151-155
190	3-хлор-4-фторфенил	H	F	CCl <sub>2</sub> H	166-170
191	4-трифторметилфенил	H	Cl	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	111-115
192	4-трифторметилфенил	H	Cl	циклопропил	126-130
193	4-трифторметилфенил	H	Cl	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	116-120
194	4-трифторметилфенил	H	Cl	CH <sub>3</sub>	175-179
195	3,4,5-трифторфенил	H	F	CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	527
196	4-хлор-3,5-дифторфенил	H	F	CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	542,9
197	3-хлор-4-фторфенил	H	F	CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	524,9
198	3,5-бис(трифторметил)фенил	H	Cl	циклопропил	573
199	4-трифторметилфенил	H	Cl	4-фторфенил	162-166
200	4-	H	Cl	CH <sub>2</sub> (циклопропил)	109-113

	трифторметилфенил				
201	4-трифторметилфенил	H	Cl	CF <sub>3</sub>	172-176
202	3-трифторметилфенил	H	Cl	CH <sub>3</sub>	106-110
203	3-трифторметилфенил	H	Cl	4-фторфенил	158-162
206	4-фтор-3-трифторфенил	F	F	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	567
207	3-трифторметилфенил	H	Cl	CF <sub>3</sub>	174-177
208	3-трифторметилфенил	H	Cl	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	167-170
209	3-трифторметилфенил	H	Cl	циклопропил	199-203
210	3-трифторметилфенил	H	Cl	CH <sub>2</sub> (циклопропил)	164-167
211	3-трифторметилфенил	H	Cl	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	156-159
212	3,5-бистрифторметилфенил	H	Cl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	615,2
213	2,4-дихлорфенил	H	Cl	циклопропил	504,9
214	2,4-дихлорфенил	H	Cl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	546,9
215	2,4-дихлорфенил	H	Cl	CF <sub>3</sub>	533,9
219	3-хлор-4-фторфенил	H	F	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	515
220	3,5-бистрифторметилфенил	H	F	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	599,1
222	3-трифторметилфенил	H	Cl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	206-209
223	4-трифторметилфенил	H	Cl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	184-187
224	4-	H	F	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	545,2*

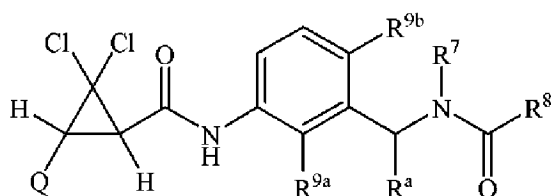
	трифторметоксифенил				
225	4-трифторметоксифенил	H	Cl	циклопропил	521,2
226	3-фтор-4-трифторметоксифенил	H	Cl	циклопропил	539,1
227	3-фтор-4-трифторметоксифенил	H	F	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	565,2
228	2-фтор-5-трифторметилфенил	H	F	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	549,2
229	2-фтор-5-трифторметилфенил	H	F	циклопропил	507,2
230	2-фтор-5-трифторметилфенил	H	Cl	CF <sub>3</sub>	551
232	3,4-дихлорфенил	H	F	-OCH <sub>3</sub>	480,1
233	3,5-дихлорфенил	H	F	-OCH <sub>3</sub>	480,1
234	4-фторфенил	H	F	-OCH <sub>3</sub>	429,2
243	3-хлор-5-трифторметилфенил	H	Cl	циклопропил	539
244	3-хлор-5-трифторметилфенил	H	F	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	565
245	3-хлор-5-трифторметилфенил	H	F	циклопропил	523,1
246	3-хлор-5-трифторметилфенил	H	Cl	CF <sub>3</sub>	566,9
249	3-хлор-5-трифторметилфенил	H	Cl	циклопропил	539
250	3-хлор-5-трифторметилфенил	H	F	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	565
251	3-хлор-5-трифторметилфенил	H	F	циклопропил	523,1



252	3-хлор-5-трифторметилфенил	H	Cl	CF <sub>3</sub>	566,9
258	3,5-дихлор-4-фторфенил	H	F	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	549,1
259	3,5-дихлор-4-фторфенил	H	Cl	CF <sub>3</sub>	551
260	3-метил-4-фторфенил	H	F	циклопропил	453

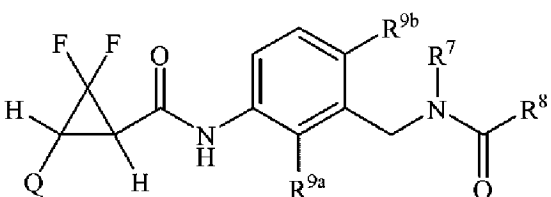
\* обозначает MS исходный-1

### ИНДЕКСНАЯ ТАБЛИЦА В



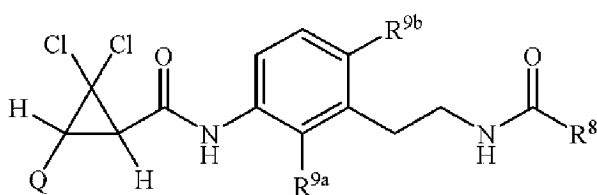
<u>Соединение №</u>	<u>Q</u>	<u>R<sup>9a</sup></u>	<u>R<sup>9b</sup></u>	<u>R<sup>a</sup></u>	<u>R<sup>8</sup></u>	<u>R<sup>7</sup></u>	<u>MS данные</u>
86	3,5-дихлорфенил	H	Cl	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	507,1
87	3,5-дихлорфенил	H	Cl	-CH <sub>3</sub>	циклопропил	H	519,1
204	3,5-дихлорфенил	H	Cl	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	495
205	3,5-дихлорфенил	H	Cl	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	509
216	3,5-дихлорфенил	H	Cl	H	циклопропил	CH <sub>3</sub>	521
217	3,5-дихлорфенил	H	Cl	H	4-фторфенил	CH <sub>3</sub>	575
218	3,5-дихлорфенил	H	Cl	H	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	549

### ИНДЕКСНАЯ ТАБЛИЦА С



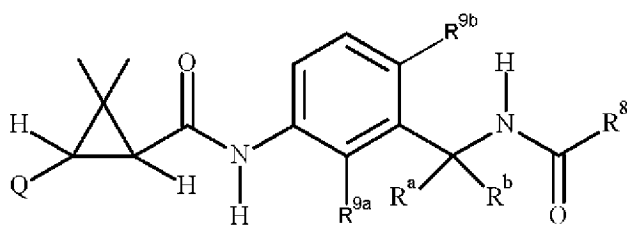
<u>Соединение №</u>	<u>Q</u>	<u>R<sup>9a</sup></u>	<u>R<sup>9b</sup></u>	<u>R<sup>7</sup></u>	<u>R<sup>8</sup></u>	<u>MP data</u>
30	3,5-дихлорфенил	H	Cl	Me	1-цианоциклопропил	196-200
31	3,5-дихлорфенил	H	Cl	Me	-CH <sub>3</sub>	235-239
32	3,5-дихлорфенил	H	Cl	Me	циклопропил	151-155
46	3,5-дихлорфенил	H	Cl	H	1-цианоциклопропил	168-172
47	3,5-дихлорфенил	H	Cl	H	-CH <sub>3</sub>	206-210
48	3,5-дихлорфенил	H	Cl	H	циклопропил	282-286
235	2-тиофен	H	Cl	H	циклопропил	193-197
236	3-тиофен	H	Cl	H	циклопропил	101-105
237	5-хлор-2-тиофен	H	Cl	H	циклопропил	93-97
238	4-хлор-2-тиофен	H	Cl	H	циклопропил	102-106

ИНДЕКСНАЯ ТАБЛИЦА D



<u>Соединение №</u>	<u>Q</u>	<u>R<sup>9a</sup></u>	<u>R<sup>9b</sup></u>	<u>R<sup>8</sup></u>	<u>MS данные</u>
88	3,5-дихлорфенил	H	F	циклопропил	503
89	3,4-дихлорфенил	H	F	циклопропил	503,2

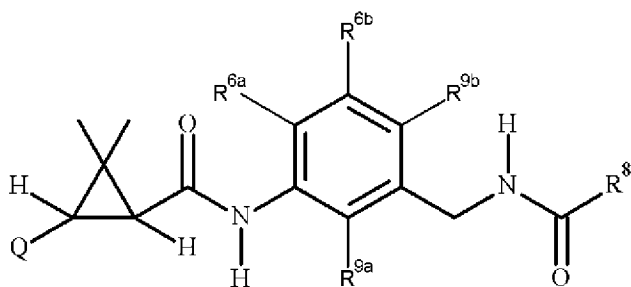
ИНДЕКСНАЯ ТАБЛИЦА E



R7 представляет собой H

<u>Соединение №</u>	<u>Q</u>	<u>R<sub>9a</sub></u>	<u>R<sub>9b</sub></u>	<u>R<sub>a</sub></u>	<u>R<sub>b</sub></u>	<u>R<sub>8</sub></u>	<u>MS данные</u>
113	3,5-дихлорфенил	H	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	521,1
114	3,5-дихлорфенил	H	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	циклопропил	533

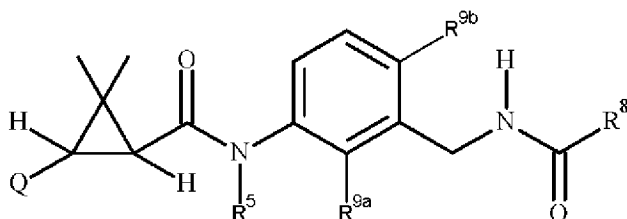
ИНДЕКСНАЯ ТАБЛИЦА F



R7 представляет собой H

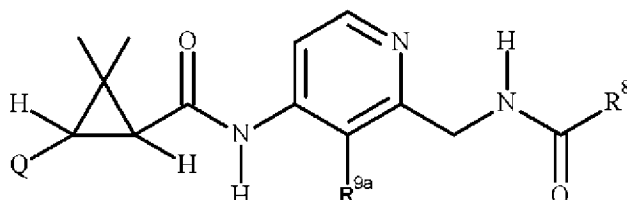
<u>Соединение №</u>	<u>Q</u>	<u>R<sub>9a</sub></u>	<u>R<sub>9b</sub></u>	<u>R<sub>6a</sub></u>	<u>R<sub>6b</sub></u>	<u>R<sub>8</sub></u>	<u>MP data</u>
122	3,5-дихлорфенил	H	H	H	Cl	CH <sub>3</sub>	180-184
123	3,5-дихлорфенил	H	H	H	Cl	циклопропил	207-211
125	3,5-дихлорфенил	H	H	H	Cl	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	231-235
135	3,5-дихлорфенил	H	H	Cl	H	CH <sub>3</sub>	101-105
136	3,5-дихлорфенил	H	H	Cl	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	187-191
137	3,5-дихлорфенил	H	H	Cl	H	циклопропил	108-112

## ИНДЕКСНАЯ ТАБЛИЦА G



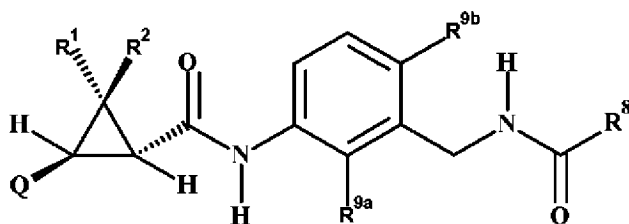
<u>Соединение №</u>	<u>Q</u>	<u>R9a</u>	<u>R9b</u>	<u>R8</u>	<u>R5</u>	<u>MP data</u>
147	3,5-дихлорфенил	H	Cl	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	194-198
148	3,5-дихлорфенил	H	Cl	циклопропил	CH <sub>3</sub>	77-81
149	3-хлор-4-фторфенил	H	Cl	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	183-187
150	3-хлор-4-фторфенил	H	Cl	циклопропил	CH <sub>3</sub>	95-99
153	3,5-дихлорфенил	H	F	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	86-90
154	3-хлор-4-фторфенил	H	F	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	99-103
231	3-трифторметилфенил	H	F	циклопропил	CH <sub>3</sub>	61-64
248	4-фтор-3-трифторметилфенил	H	F	циклопропил	CH <sub>3</sub>	122-125
257	4-фтор-3-трифторметилфенил	H	F	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	67-70

## ИНДЕКСНАЯ ТАБЛИЦА H



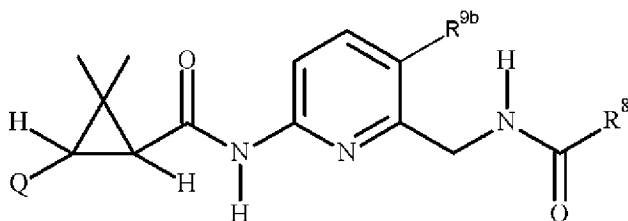
<u>Соединение №</u>	<u>Q</u>	<u>R9a</u>	<u>R8</u>	<u>MS данные</u>
144	3,5-дихлорфенил	H	4-фторфенил	526
145	3,5-дихлорфенил	H	циклопропил	472
145	3,5-дихлорфенил	H	CH <sub>3</sub>	445,9

ИНДЕКСНАЯ ТАБЛИЦА I



<u>Соединение №</u>	<u>Q</u>	<u>R<sup>9a</sup></u>	<u>R<sup>8</sup></u>	<u>R<sup>1</sup></u>	<u>R<sup>2</sup></u>	<u>MS данные</u>
239	3,4-дихлорфенил	H	F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	491,2
240	3,4-дихлорфенил	H	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	494,9
241	3,5-дихлорфенил	H	Cl	CF <sub>3</sub>	H	533,3
242	3,5-дихлорфенил	H	Cl	H	CF <sub>3</sub>	533,3

ИНДЕКСНАЯ ТАБЛИЦА J



<u>Соединение №</u>	<u>Q</u>	<u>R<sup>9b</sup></u>	<u>R<sup>8</sup></u>	<u>MP data</u>
247	3-хлор-4-фторфенил	Br	CH <sub>3</sub>	170-173
254	3-хлор-4-фторфенил	Br	циклопропил	152-155
255	3-хлор-4-фторфенил	Br	4-фторфенил	131-134
256	3-хлор-4-фторфенил	Br	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	184-187

Соединение настоящего изобретения будут обычно применять в качестве активного ингредиента для борьбы с беспозвоночными вредителями в композиции, т.е., составе, по меньшей мере, с одним дополнительным компонентом, выбранным из группы, состоящей из поверхностно-активных соединений, твердых разбавителей и жидких разбавителей, который служит в качестве носителя. Ингредиенты составов или композиций выбирают так, чтобы они были совместимыми с физическими свойствами активного ингредиента, способом применения и окружающими факторами, такими как тип почвы, влажность и температура.

Подходящие составы включают и жидкие и твердые композиции. Жидкие композиции включают растворы (включая эмульгируемые концентраты), суспензии, эмульсии (включая микроэмульсии, эмульсии масло в воде, текучие концентраты и/или

суспоземульсии) и подобные, которые необязательно могут быть загущены в гели. Основные типы водных жидких композиций включают растворимый концентрат, концентрат суспензии, суспензию для капсул, концентрированную эмульсию, микроэмульсию, эмульсию масло в воде, текучий концентрат и суспоземульсию. Основными типами неводных жидких композиций являются эмульгируемый концентрат, микроэмульгируемый концентрат, диспергируемый концентрат и масляная дисперсия.

Общие типы твердых композиций представляют собой пудры, порошки, гранулы, пеллеты, дробинки, пастилки, таблетки, пленки с наполнителем (включая покрытия для семян) и подобные, которые могут быть диспергируемыми в воде («смачиваемыми») или растворимыми в воде. Пленки и покрытия, образованные из пленкообразующих растворов или текучих суспензий, являются особенно пригодными для обработки семян. Активный ингредиент может быть (микро)инкапсулирован и дополнительно формован в виде суспензии или твердого состава; альтернативно весь состав активного ингредиента можно инкапсулировать (или «покрывать»). Инкапсуляция может контролировать или задерживать высвобождение активного ингредиента. Эмульгируемые гранулы сочетают в себе преимущества как состава эмульгируемого концентрата, так и сухого гранулированного состава. Композиции высокой концентрации в основном применяют в качестве промежуточных продуктов для последующего состава.

Распыляемые составы обычно распределяют в подходящей среде перед распылением. Такие жидкие и твердые составы составлены таким образом, чтобы их можно было легко разбавлять в распыляемой среде, обычно в воде, но иногда в другой подходящей среде, например, в ароматическом или парафиновом углеводороде или растительном масле. Объемы распыления могут составлять от приблизительно одного до нескольких тысяч литров на гектар, но обычно находятся в диапазоне от приблизительно десяти до нескольких сотен литров на гектар. Распыляемые составы могут быть смешаны в емкости с водой или другой подходящей средой для внекорневой обработки с воздуха или земли, или для внесения в питательную среду растения. Жидкие и сухие составы можно дозировать непосредственно в системы капельного орошения или дозировать в борозду во время посева. Жидкие и твердые составы можно наносить на семена сельскохозяйственных культур и другой требуемой растительности при обработке семян перед посадкой для защиты развивающихся корней и других подземных частей растений и/или листьев за счет системного поглощения.

Составы будут обычно содержать эффективные количества активного ингредиента, разбавителя и поверхностно-активного соединения в следующих приблизительных диапазонах, которые добавляют вплоть до 100 процентов по весу.

Весовые проценты

<u>Активный</u>	<u>Разбавитель</u>	<u>Поверхностно-</u>
<u>Ингредиент</u>		<u>активное</u>
		<u>соединение</u>

Диспергируемые в воде и водорастворимые гранулы, таблетки и порошки	0,001-90	0-99,999	0-15
Масляные дисперсии, суспензии, эмульсии, растворы (включая эмульгируемые концентраты)	1-50	40-99	0-50
Пудры	1-25	70-99	0-5
Гранулы и пеллеты	0,001-99	5-99,999	0-15
Композиции с высокой концентрацией	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, сахарозу), кремнезем, тальк, слюду, диатомовую землю, мочевины, кальций кальция, карбонат и бикарбонат натрия, и сульфат натрия. Типичные разбавители описаны в Watkins et al., *Handbook of Insecticide Dust Diluents and 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-метилпирролидон), алкилфосфаты (например, триэтилфосфат), этиленгликоль, триэтиленгликоль, пропиленгликоль, дипропиленгликоль, полипропиленгликоль, пропиленкарбонат, бутиленкарбонат, парафины (например, белые минеральные масла, нормальные парафины, изопарафины), алкилбензолы, алкилнафталины, глицерин, глицеринтриацетат, сорбит, ароматические углеводороды, деароматизированные алифатические соединения, 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 сложные эфиры, такие как алкилированные эфиры лактата, сложные двухосновные эфирные алкил и арилбензоаты,  $\gamma$ -бутиролактон, и спирты, которые могут быть линейными, разветвленными, насыщенными или ненасыщенными, такими как метанол, этанол, n-пропанол, изопропиловый спирт, n-бутанол, изобутиловый спирт, n-гексанол, 2-этилгексанол, n-октанол, деканол, изодециловый спирт, изооктадеканол, цетиловый спирт, лауриловый спирт, тридециловый спирт, олеиловый спирт, циклогексанол, тетрагидрофуруриловый спирт, диацетоновый спирт, крезол и бензиловый спирт. Жидкие разбавители также включают глицериновые эфиры насыщенных и ненасыщенных жирных кислот (обычно C6-C22), такие как масла из семян растений и фруктов (например, оливковое, касторовое, льняное, кунжутное, кукурузное (маисовое), арахисовое, подсолнечное, виноградное, сафлоровое, хлопковое, соевое, рапсовое, кокосовое и пальмоядровое масло), жиры животного происхождения

(например, говяжий жир, свиной жир, сало, жир из печени трески, рыбий жир) и их смеси. Жидкие разбавители также включают алкилированные жирные кислоты (например, метилированные, этилированные, бутилированные), где жирные кислоты можно получить гидролизом сложных эфиров глицерина из растительных и животных источников и можно очистить перегонкой. Типичные жидкие разбавители описаны в Marsden, *Solvents Guide*, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950.

Твердые и жидкие композиции настоящего изобретения часть содержат одно или более поверхностно-активных соединений. При добавлении в жидкость поверхностно-активные соединения (также известные как «поверхностно-активные агенты») обычно модифицируют, чаще всего снижают поверхностное натяжение жидкости. В зависимости от природы гидрофильных и липофильных групп в молекуле поверхностно-активного соединения, поверхностно-активные соединения могут быть полезны в качестве смачивающих агентов, диспергаторов, эмульгаторов или пеногасителей.

Поверхностно-активные соединения можно классифицировать как неионные, анионные или катионные. Неионные поверхностно-активные соединения, пригодные в настоящих композициях, включают, но не ограничиваются: алкоксилаты спиртов, такие как алкоксилаты спиртов на основе природных и синтетических спиртов (которые могут быть разветвленными или линейными) и полученные из спиртов и этиленоксида, пропиленоксида, бутиленоксида или их смесей; амин этоксилаты, алканоламиды и этоксилированные алканоламиды; алкоксилированные триглицериды, такие как этоксилированное соевое, касторовое и рапсовое масло; алкоксилаты алкилфенолов, такие как этоксилаты октилфенола, этоксилаты нонилфенола, этоксилаты динонилфенола и этоксилаты додецилфенола (полученные из фенолов и этиленоксида, пропиленоксида, бутиленоксида или их смесей); блочные полимеры, полученные из этиленоксида или пропиленоксида и обращенные блочные полимеры, где концевые звенья получают из пропиленоксида; этоксилированные жирные кислоты; этоксилированные жирные эфиры и масла; этоксилированные метиловые эфиры; этоксилированный тристирилфенол (включая тот, что получен из этиленоксида, пропиленоксида, бутиленоксида или их смесей); сложные эфиры жирных кислот, сложные эфиры глицерина, производные на основе ланолина, сложные эфиры полиэтоксилата, такие как полиэтоксилированные сложные эфиры сорбитана и жирных кислот, полиэтоксилированные сложные эфиры сорбита и жирных кислот и полиэтоксилированные сложные эфиры глицерина и жирных кислот; другие производные сорбитана, такие как сложные эфиры сорбитана; полимерные поверхностно-активные соединения, такие как статистические сополимеры, блок-сополимеры, алкидные полимеры (полиэтиленгликоль), привитые или гребенчатые полимеры и звездообразные полимеры; полиэтиленгликоли (ПЭГ); сложные эфиры жирных кислот и полиэтиленгликоля; поверхностно-активные соединения на основе силикона; и сахарные производные, такие как сложные эфиры сахарозы, алкилполигликозиды и алкилполисахариды.

Подходящие анионные поверхностно-активные соединения включают, но не



ограничиваются: алкиларилсульфокислоты и их соли; карбоксилированные спиртовые или алкилфенольные этоксилаты; производные дифенилсульфоната; лигнин и производные лигнина, такие как лигносульфонаты; малеиновая или янтарная кислоты или их ангидриды; олефиновые сульфонаты; фосфатные эфиры, такие как фосфатные эфиры алкоксилатов спиртов, фосфатные эфиры алкоксилатов алкилфенола и фосфатные эфиры этоксилатов стирилфенола; белковые поверхностно-активные соединения; производные саркозина; сульфат стирилфенольного эфира; 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, додецил и тридецилбензолов; сульфонаты конденсированных нафталинов; сульфонаты нафталина и алкилнафталина; сульфонаты фракционированной нефти; сульфосукцинаматы; и сульфосукцинаты и их производные, такие как соли диалкилсульфосукцината.

Подходящие катионные поверхностно-активные соединения включают, но не ограничиваются: амиды и этоксилированные амиды; амины, такие как N-алкилпропандиамины, трипропилентриамины и дипропилентетрамин, и этоксилированные амины, этоксилированные диамины и пропоксилированные амины (полученные из аминов и этиленоксида, пропиленоксида, бутиленоксида или их смесей); соли аминов, такие как аминацетаты и диаминовые соли; соли четвертичного аммония, такие как четвертичные соли, этоксилированные четвертичные соли и дичетвертичные соли; и аминоксиды, такие как алкилдиметиламиноксиды и бис-(2-гидроксиэтил) алкиламиноксиды.

Кроме того, пригодные в настоящих композициях являются смеси неионных и анионных поверхностно-активных соединений или смеси неионных и катионных поверхностно-активных соединений. Неионные, анионные и катионные поверхностно-активные соединения и их рекомендованное применение описаны в ряды опубликованных ссылок, включая *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 настоящего изобретения могут также содержать вспомогательные вещества для составов и добавки, известные специалисту в данной области техники как добавки для составов (некоторые из них можно рассматривать также как функционирующие как твердые разбавители, жидкие разбавители или поверхностно-активные соединения). Данные вспомогательные вещества для составов и добавки могут контролировать: pH (буферы), пенообразование во время обработки (пеногасители, такие как полиорганосилоксаны), осаждение активных ингредиентов (суспендирующие агенты), вязкость (тиксотропные загустители), рост микробов в контейнере (противомикробные препараты), замораживание продукта (антифризы), цвет (красители/дисперсии

пигментов), смывание (пленкообразователи или связующие), испарение (замедлители испарения) и другие атрибуты состава. Пленкообразователи включают, например, поливинилацетаты, сополимеры поливинилацетата, сополимер поливинилпирролидон-винилацетат, поливиниловые спирты, сополимеры поливинилового спирта и воски. Примеры вспомогательных веществ для составов и добавок включают те, которые перечислены в *McCutcheon's m. 2: Functional Materials*, annual International and North American editions published by McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; и РСТ публикации WO 03/024222.

Соединение формулы **1** и любые другие активные ингредиенты обычно вводят в настоящие композиции растворением активного ингредиента в растворителе или измельчением в жидкости или сухом разбавителе. Растворы, включая эмульгируемые концентраты, можно получить простым смешением ингредиентов. Если растворитель жидкой композиции, предназначенной для применения в качестве эмульгируемого концентрата, не смешивается с водой, обычно добавляют эмульгатор для эмульгирования растворителя, содержащего активный ингредиент, при разбавлении водой. Суспензии активного ингредиента с диаметром частиц вплоть до 2000 мкм могут быть измельчены во влажном состоянии, применяя мельницу, для получения частиц со средним диаметром менее 3 мкм. Водные суспензии можно превратить в готовые концентраты суспензий (смотри, например, US 3,060,084) или подвергнуть дальнейшей обработке путем распылительной сушки с образованием диспергируемых в воде гранул. Сухие составы обычно требуют процессов сухого помола, при которых средний диаметр частиц составляет от 2 до 10 мкм. Пудры и порошки можно получить смешиванием и обычно измельчением (например, с помощью молотковой или жидкостной мельницы). Гранулы и пеллеты можно получить путем распыления активного материала на предварительно сформированные гранулированные носители или способами агломерации. Смотри Browning, "Agglomeration", *Chemical Engineering*, December 4, 1967, стр. 147-48, *Perry's Chemical Engineer's Handbook*, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, страницы 8-57 и следующие, и WO 91/13546. Пеллеты можно получить, как описано в U.S. 4172714. Диспергируемые в воде и водорастворимые гранулы можно получить, как описано в U.S. 4144050, U.S. 3920442 и DE 3246493. Таблетки можно получить, как описано в U.S. 5180587, U.S. 5232701 и U.S. 5208030. Пленки можно получить, как описано в GB 2095558 и U.S. 3299566.

Для получения дополнительной информации относительно способов формулирования, смотри 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. Смотри также U.S. 3235361, колонка 6, линия 16-колонка 7, линия 19 и примеры 10-41; U.S. 3309192, колонка 5, линия 43-колонка 7, линия 62 и примеры 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138-140, 162-164, 166, 167 и 169-182; U.S. 2,891,855, колонка 3, линия 66-колонка 5, линия 17 и

примеры 1-4; Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, стр. 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 следующих примерах, все составы получают обычными способами. Номера соединений относятся к соединениям в индексных таблицах. Считается, что без дальнейшего уточнения специалист в данной области техники, применяя предыдущее описание, может применять настоящее изобретение в его самом полном объеме. Следующие ниже примеры, следовательно, должны толковаться как просто иллюстративные и никоим образом не ограничивающие настоящее изобретение. Проценты даны по весу, если не указано иное.

#### Пример А

##### Концентрат с высокой концентрацией

соединение 33	98,5%
силикатный аэрогель	0,5%
синтетический аморфный мелкодисперсный диоксид кремния	1,0%

#### Пример В

##### Смачиваемый порошок

соединение 38	65,0%
додецилфенолполиэтиленгликольный эфир	2,0%
лигнинсульфонат натрия	4,0%
Силикоалюминат натрия	6,0%
монтмориллонит (кальцинированный)	23,0%

#### Пример С

##### гранула

соединение 39	10,0%
аттапульгитные гранулы (низколетучие вещества, 0,71/0,30 мм; U.S.S. No. 25-50 сита)	90,0%

#### Пример D

##### Экструдированный пеллет

соединение 40	25,0%
безводный сульфат натрия	10,0%
неочищенный лигнинсульфонат кальция	5,0%
алкилнафталинсульфонат натрия	1,0%
Бентонит кальция/магния	59,0%

#### Пример E

Эмульгируемый концентрат

соединение 42	10,0%
полиоксиэтиленсорбитгексаолеат	20,0%
Метиловый эфир С6-С10 жирной кислоты	70,0%

## Пример F

микроэмульсия

соединение 43	5,0%
поливинилпирролидон-винилацетатный сополимер	30,0%
алкилполиглизозид	30,0%
глицерилмоноолеат	15,0%
вода	20,0%

## Пример G

Обработка семян

соединение 33	20,0%
поливинилпирролидон-винилацетатный сополимер	5,00%
Воск монтан	5,00%
лигнинсульфонат кальция	1,00%
полиоксиэтилен/полиоксипропиленовый блочный сополимер	1,00%
Стеариловый спирт (РОЕ 20)	2,00%
полиорганосилан	0,20%
краситель красный	0,05%
вода	65,7%

## Пример H

Стержень с удобрениями

соединение 38	2,5%
пирролидон-стирольный сополимер	4,8%
тристирилфенил 16-этоксилат	2,3%
тальк	0,8%
Кукурузный крахмал	5,0%
Медленно высвобождающееся удобрение	36,0%
каолин	38,0%
вода	10,6%

## Пример I

Концентрат суспензии

соединение 39	35%
---------------	-----

бутил полиоксиэтилен/полипропиленовый блочный сополимер	4,0%
Стеариновая кислота/полиэтиленгликольный сополимер	1,0%
Стиролакриловый полимер	1,0%
Ксантановая камедь	0,1%
пропиленгликоль	5,0%
пеногаситель на основе силикона	0,1%
1,2-бензизотиазолин-3-он	0,1%
вода	53,7%

#### Пример J

##### Эмульсия в воде

соединение 40	10,0%
бутил полиоксиэтилен/полипропиленовый блочный сополимер	4,0%
Стеариновая кислота/полиэтиленгликольный сополимер	1,0%
Стиролакриловый полимер	1,0%
Ксантановая камедь	0,1%
пропиленгликоль	5,0%
пеногаситель на основе силикона	0,1%
1,2-бензизотиазолин-3-он	0,1%
углеводород на основе ароматической нефти	20,0
вода	58,7%

#### Пример K

##### Масляная суспензия

соединение 42	25%
полиоксиэтиленсорбитгексаолеат	15%
органически модифицированная бентонитовая глина	2,5%
Метилловый эфир жирной кислоты	57,5%

#### Пример L

##### суспоэмульсия

соединение 43	10,0%
имидаклоприд	5,0%
бутил полиоксиэтилен/полипропиленовый блочный сополимер	4,0%
Стеариновая кислота/полиэтиленгликольный сополимер	1,0%
Стиролакриловый полимер	1,0%
Ксантановая камедь	0,1%
пропиленгликоль	5,0%

пеногаситель на основе силикона	0,1%
1,2-бензизотиазолин-3-он	0,1%
углеводород на основе ароматической нефти	20,0%
вода	53,7%

Соединения настоящего изобретения проявляют активность против широкого спектра беспозвоночных вредителей. Данные вредители включают беспозвоночных, населяющих различные среды, такие как, например, листва растений, корни, почва, собранные урожаи или другие продукты питания, строительные конструкции или покровы животных. Данные вредители включают, например, беспозвоночных, питающихся листвой (включая листья, стебли, цветы и плоды), семенами, древесиной, текстильными волокнами или кровью или тканями животных, и тем самым вызывая травмы или ущерб, например, выращиванию или хранению сельскохозяйственных культур, лесов, тепличных культур, декоративных растений, саженцев, хранящихся продуктов питания или изделий из волокна, или домам или другим строениям, или их содержимому, или наносящие вред здоровью животных или населения. Специалистам в данной области техники ясно, что не все соединения одинаково эффективны против всех стадий роста всех вредителей.

Данные настоящие соединения и композиции, таким образом, являются пригодными агрономически для защиты полевых культур от растительноядных беспозвоночных вредителей, и также неагрономически для защиты других плодовоовощных культур и растений от растительноядных беспозвоночных вредителей. Данная полезность включает защиту сельскохозяйственных культур и других растений (т.е., как агрономических, так и неагрономических), которые содержат генетический материал, введенный с помощью генной инженерии (т.е. трансгенный), или модифицированные мутагенезом, чтобы обеспечить полезные свойства. Примеры данных признаков включают толерантность к гербицидам, устойчивость к растительноядным вредителям (например, насекомым, клещам, тле, паукам, нематодам, улиткам, патогенным для растений грибам, бактериям и вирусам), улучшенный рост растений, повышенную толерантность к неблагоприятным условиям выращивания, таким как высокие или низкие температуры, низкая или высокая влажность почвы, и высокая засоленность, усиленное цветение или плодоношение, более высокие урожаи, более быстрое созревание, более высокое качество и/или питательная ценность собранного продукта, или улучшенные характеристики хранения или обработки собранных продуктов. Трансгенные растения можно модифицировать для проявления нескольких признаков. Примеры растений, содержащих признаки, полученные с помощью генной инженерии или мутагенеза, включают сорта кукурузы, хлопка, сои и картофеля, экспрессирующие инсектицидный токсин *Bacillus thuringiensis*, такие как YIELD GARD<sup>®</sup>, KNOCKOUT<sup>®</sup>, STARLINK<sup>®</sup>, BOLLGARD<sup>®</sup>, NuCOTN<sup>®</sup> и NEWLEAF<sup>®</sup>, INVICTA RR2 PRO<sup>™</sup> и устойчивые к гербицидам сорта кукурузы, хлопка, сои и рапса, такие как ROUNDUP READY<sup>®</sup>, LIBERTY LINK<sup>®</sup>, IMI<sup>®</sup>, STS<sup>®</sup> и CLEARFIELD<sup>®</sup>, а также культуры, экспрессирующие N-

ацетилтрансферазу (GAT) для обеспечения устойчивости к глифосатному гербициду, или культуры, содержащие ген HRA, обеспечивающий устойчивость к гербицидам, ингибирующим ацетолактатсинтазу (ALS). Настоящие соединения и композиции могут проявлять усиленные эффекты с признаками, введенными генной инженерией или модифицированными мутагенезом, таким образом, увеличивая фенотипическую экспрессию или эффективность признаков или увеличивая эффективность борьбы с беспозвоночными вредителями настоящих соединений и композиций. В частности, настоящие соединения и композиции могут проявлять улучшенные эффекты с фенотипической экспрессией белков или других природных продуктов, токсичных для беспозвоночных вредителей, для обеспечения более чем аддитивной борьбы с данными вредителями.

Композиции настоящего изобретения могут также необязательно содержать питательные вещества для растений, например, композицию удобрений, 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 выделить композиции, содержащие, по меньшей мере, одну композицию удобрений, содержащую, по меньшей мере, одно питательное вещество для растений, выбранное из азота, фосфора, калия, серы, кальция и магния. Композиции настоящего изобретения, которые дополнительно содержат, по меньшей мере, одно питательное вещество для растений, могут быть в виде жидкостей или твердых композиций. Следует выделить твердый состав в виде гранул, небольших стержней или таблеток. Твердые составы, содержащие композицию удобрений, можно получить смешением соединения или композиции настоящего изобретения с композицией удобрений вместе с формулированием ингредиентов и затем получением состава способами, такими как гранулирование или экструзия. Альтернативно, твердые составы можно получить распылением раствора или суспензии соединения или композиции настоящего изобретения в летучем растворителе на заранее полученную композицию удобрений в виде стабильных по размерам смесей, например, гранул, небольших стержней или таблеток, и затем упариванием растворителя.

Под неагрономическим применением понимают борьбу с беспозвоночным вредителем на территориях, отличных от посевов сельскохозяйственных культур. Неагрономические применения настоящих соединений и композиций включают борьбу с беспозвоночными вредителями в хранящемся зерне, бобах и других пищевых продуктах, а также в текстильных изделиях, таких как одежда и ковры. Неагрономические применения настоящих соединений и композиций также включают борьбу с беспозвоночными вредителями в декоративных растениях, лесах, во дворах, вдоль обочин дорог и на полосах отвода железных дорог и на травяном покрове, таком как газоны, поля для гольфа и пастбища. Неагрономические применения настоящих соединений и композиций также включают борьбу с беспозвоночными вредителями в домах и других зданиях, которые могут быть заняты людьми и/или домашними животными, сельскохозяйственными

животными, животными, содержащимися на ранчо или в зоопарках, или другими животными. Неагрономические применения настоящих соединений и композиций также включают борьбу с вредителями, такими как термиты, которые могут повредить древесину или другие конструкционные материалы, применяемые в зданиях.

Неагрономические применения настоящих соединений и композиций также включают защиту здоровья человека и животных путем борьбы с беспозвоночными вредителями, которые являются паразитами или передают инфекционные заболевания. Борьба с паразитами животных включает борьбу с внешними паразитами, паразитирующими на поверхности тела животного-хозяина (например, плечах, подмышках, животе, внутренней части бедер), и внутренними паразитами, паразитирующими на внутренней части тела животного-хозяина (например, желудке, кишечнике, легких, венах, под кожей, лимфатической ткани). К внешним паразитам или вредителям, передающим заболевания, относятся, например, клещи-красотелки, клещи, вши, комары, мухи, микроскопические клещи и блохи. К внутренним паразитам относятся сердечные черви, анкилостомы и гельминты. Соединения и композиции настоящего изобретения являются пригодными для системной и/или несистемной борьбы с инфестью или заражением животных паразитами. Соединения и композиции настоящего изобретения особенно подходят для борьбы с внешними паразитами или вредителями-переносчиками болезней. Соединения и композиции настоящего изобретения пригодны для борьбы с паразитами, поражающими сельскохозяйственных рабочих животных, таких как крупный рогатый скот, овцы, козы, лошади, свиньи, ослы, верблюды, буйволы, кролики, куры, индейка, утки, гуси и пчелы; домашних животных и одомашненных животных, таких как собаки, кошки, домашние птицы и аквариумные рыбки; а также так называемых экспериментальных животных, таких как хомяки, морские свинки, крысы и мыши. Путем борьбы с данными паразитами снижаются смертность и снижение характеристик (в отношении мяса, молока, шерсти, кожи, яиц, меда и т.д.), так что применение композиции, содержащей соединение по настоящему изобретению, позволяет более экономично и просто содержать животных.

Примеры агрономических или неагрономических беспозвоночных вредителей включают яйца, личинки и взрослые особи отряда Lepidoptera, такие как совки луговые, совки озимые, петлители и гелиотины в семействе Noctuidae (например, розовый стебельчатый мотыль (*Sesamia inferens* Walker), мотыль кукурузного стебля (*Sesamia nonagrioides* Lefebvre), южная совка (*Spodoptera eridania* Cramer), совок трояная (*Spodoptera frugiperda* JE Smith), совка малая (*Spodoptera exigua* Hübner), азиатская хлопковая совка (*Spodoptera littoralis* Boisduval), совка желтополосая (*Spodoptera ornithogalli* Guenée), совка черная (*Agrotis ipsilon* Hufnagel), совка бархатных бобов (*Anticarsia gemmatilis* Hübner), зеленый плодовый червь (*Lithophane antennata* Walker), совка капустная (*Barathra brassicae* Linnaeus), соевая совка (*Pseudoplusia includens* Walker), капустная совка (*Trichoplusia ni* Hübner), табачный червь (*Heliothis virescens* Fabricius)); мотыльки, гусеницы, гусеницы, строящие паутинное гнездо, глобоидальные



черви, капустные черви и вредители, скелетирующие листья из семейства Pyralidae (например, европейский кукурузный мотылек (*Ostrinia nubilalis* Hübner), черви пуповидного апельсина (*Amyelois transitella* Walker), гусеница, строящая паутинное гнездо, питающаяся корнями кукурузы (*Crambus caliginosellus* Clemens), гусеницы, строящие паутинное гнездо, питающиеся дерном (Pyralidae: Crambinae), такие как веб-червь (*Herpetogramma licarsisalis* Walker), желто-верховой мотыль (*Chilo infuscatellus* Snellen), томатная огневка (*Neoleucinodes elegantalis* Guenée), рисовый листорез (*Snaphalocrocis medinalis*), виноградный червяк (*Desmia funeralis* Hübner), соленый червь (*Diaphania nitidalis* Stoll), огневка капустная (*Helluala hydralis* Guenée), желтостебельный мотиылек (*Scirpophaga incertulas* Walker), огневки-травянки вида *Scirpophaga infuscatellus* (*Scirpophaga infuscatellus* Snellen), белого стебледа (*Scirpophaga innotata* Walker), бабочки вида *Scirpophaga nivella* (*Scirpophaga nivella* Fabricius), темноголового рисового буравчика (*Chilo polychrysus* Meyrick), полосатого рисового буравчика (*Chilo suppressalis* Walker), моли вида *Crocidolomia binotalis* (*Crocidolomia binotalis* English)); листокруток, листоверток, семенных червей и фруктовых червей семейства Tortricidae (например, плодоярка яблонная (*Cydia pomonella* Linnaeus), листовертка виноградная (*Endopiza viteana* Clemens), плодоярка восточная персиковая (*Grapholita molesta* Busck), ложная цитрусовая плодоярка (*Cryptophlebia leucotreta* Meyrick), цитрусовый сверлильщик (*Ecdyolopha aurantiana* Lima), краснополосая листокрутка (*Argyrotaenia velutinana* Walker), скошеннополосая листокрутка (*Choristoneura rosaceana* Harris), светло-рыжая моль яблочная (*Epiphyas postvittana* Walker), моль ягод европейского винограда (*Eupoecilia ambiguella* Hübner), вертунья почковая (*Pandemis pyrusana* Kearfott), всеядная листокрутка (*Platynota stultana* Walsingham), поперечно-полосатая террикса плодового дерева (*Pandemis cerasana* Hübner), яблочная коричневая террикса (*Pandemis heparana* Denis & Schiffermüller)); и многих других экономически важных lepidoptera (например, моль капустная (*Plutella xylostella* Linnaeus), розовый коробочный червь (*Pectinophora gossypiella* Saunders), шелкопряд непарный (*Lymantria dispar* Linnaeus), персиковый сверлильщик (*Carposina niponensis* Walsingham), плодоярка урюковая (*Anarsia lineatella* Zeller), личинка выемчатокрылой моли (*Phthorimaea operculella* Zeller), плодовая нижнеминирующая моль-пестрянка (*Lithocolletis blancardella* Fabricius), азиатская яблочная моль-пестрянка (*Lithocolletis ringoniella* Matsumura), леродея Эуфала (*Lerodea eufala* Edwards), яблочный листовой минер (*Leucoptera scitella* Zeller)); яйца, нимфы и взрослые особи отряда Blattodea, включая тараканов из семейства Blattellidae и Blattidae (например, таракан черный (*Blatta orientalis* Linnaeus), азиатский таракан (*Blattella asahinai* Mizukubo), прусский таракан (*Blattella germanica* Linnaeus), коричневополосый таракан (*Supella longipalpa* Fabricius), американский таракан (*Periplaneta americana* Linnaeus), коричневый таракан (*Periplaneta brunnea* Burmeister), таракан с острова Мадейра (*Leucophaea maderae* Fabricius)), дымчато-коричневый таракан (*Periplaneta fuliginosa* Service), австралийский таракан (*Periplaneta australasiae* Fabr.), таракан серый (*Nauphoeta cinerea* Olivier) и голый таракан (*Symploce pallens* Stephens)); яйца, личинки и взрослые

особи, питающиеся листвой, плодами, корнями, семенами и путырчатой тканью, отряда Coleoptera, включая долгоносиков из семейства Anthribidae, Bruchidae и Curculionidae (например, долгоносик хлопковый (*Anthonomus grandis* Boheman), долгоносик рисовый водяной (*Lissorhoptrus oryzophilus* Kuschel), долгоносик амбарный (*Sitophilus granarius* Linnaeus), долгоносик рисовый (*Sitophilus oryzae* Linnaeus)), долгоносик мятлика однолетнего (*Listronotus maculicollis* Dietz), мятлик-клоп (*Sphenophorus parvulus* Gyllenhal), охотничий клоп (*Sphenophorus venatus vestitus*), жук скалистых гор (*Sphenophorus cicatristriatus* Fahraeus)); земляные блошки, огуречный жук, личинки, повреждающие корни, листоеды, колорадский жук и листовые минеры семейства Chrysomelidae (например, колорадский жук (*Leptinotarsa decemlineata* Say), западный кукурузный жук (*Diabrotica virgifera virgifera* LeConte)); жестоккрылые и другие жуки из семейства Scarabaeidae (например, японский жук (*Popillia japonica* Newman), хрущик восточный (*Anomala orientalis* Waterhouse, *Exomala orientalis* (Waterhouse) Baraud), северный масковый ткач (*Cyclocephala borealis* Arrow), южный масковый ткач (*Cyclocephala immaculata* Olivier или *C. lurida* Bland), жук-навозник и личинка хруща (*Aphodius* spp.), черный дерновый атениус (*Ataenius spretulus* Haldeman), хрущ блестящий зеленый (*Cotinis nitida* Linnaeus), хрущик азиатский садовый (*Maladera castanea* Arrow), майский/июньский хрущ (*Phyllophaga* spp.) и хрущ европейский (*Rhizotrogus majalis* Razoumowsky)); ковровые жуки из семейства Dermestidae; проволочники из семейства Elateridae; короеды из семейства Scolytidae и мучные хрущаки из семейства Tenebrionidae.

Кроме того, агрономические и неагрономические вредители включают: яйца, взрослые особи и личинки отряда Dermaptera, включая ухвертки из семейства Forficulidae (например, ухвертка обыкновенная (*Forficula auricularia* Linnaeus), черная ухвертка (*Chelisoche morio* Fabricius)); яйца, неполовозрелые особи, взрослые особи и нимфы отряда Hemiptera, такие как, слепняки из семейства Miridae, цикады из семейства Cicadidae, кобылочки (например, *Empoasca* spp.) из семейства Cicadellidae, постельные клопы (например, *Cimex lectularius* Linnaeus) из семейства Cimicidae, цикадки из семейства Fulgoridae и Delphacidae, горбатки из семейства Membracidae, псиллиды из семейства Liviidae, Psyllidae и Triozidae, белокрылки из семейства Aleyrodidae, афиды из семейства Aphididae, филлоксеры из семейства Phylloxeridae, войлочники из семейства Pseudococcidae, щитовки из семейства Coccidae, Diaspididae и Margarodidae, кружевницы из семейства Tingidae, булавники из семейства Pentatomidae, клопы-наземники (например, волосатый клоп-наземник (*Blissus leucopterus hirtus* Montandon) и южный клоп-наземник (*Blissus insularis* Barber)) и другие наземники из семейства Lygaeidae, пенницы из семейства Coreidae, клопы-ромбовики печальные из семейства Coreidae, и красноклопы и хлопковые красноклопы из семейства Pyrrhocoridae.

Агрономические и неагрономические вредители также включают: яйца, личинки, нимфы и взрослые особи отряда Acari (клещи), такие как паутинные клещики и красные клещи в семействе Tetranychidae (например, европейский красный клещ (*Panonychus ulmi* Koch), клещик паутинный двупятнистый (*Tetranychus urticae* Koch), клещ Макдэниела

(*Tetranychus mcDanieli* McGregor)); плоские клещи в семействе Tenuipalpidae (например, цитрусовый плоский клещ (*Brevipalpus lewisi* McGregor)); галловые клещи и клещи смородиновые в семействе Eriophyidae и другие питающиеся листвой клещи и клещи, важные для здоровья людей и животных, т.е., клещи домашней пыли в семействе Epidermoptidae, клещи-железницы угревые в семействе Demodicidae, зерновые клещи в семействе Glycyphagidae; клещи в семействе Ixodidae, обычно известные как клещи с твердым покровом (например, черноногий клещ (*Ixodes scapularis* Say), австралийский парализующий клещ (*Ixodes holocyclus* Neumann), американский собачий клещ (*Dermacentor variabilis* Say), клещ-одиночка (*Amblyomma americanum* Linnaeus)) и клещи в семействе Argasidae, обычно известные как клещи с мягким покровом (например, клещ орнитодорус (*Ornithodoros turicata*), обычный клещ персидский (*Argas radiatus*)); конские клещи и чесоточные клещи в семействе Psoroptidae, Psymmatidae и Sarcoptidae; яйца, взрослые и неполовозрелые особи отряда Orthoptera, включая кузнечиков, саранчу и сверчков (например, перелетные кузнечики (например, *Melanoplus sanguinipes* Fabricius, *M. differentialis* Thomas), американские кузнечики (например, *Schistocerca americana* Drury), саранча пустынная (*Schistocerca gregaria* Forskal), саранча перелетная (*Locusta migratoria* Linnaeus), кустовая саранча (*Zonocerus* spp.), сверчок домашней (*Acheta domesticus* Linnaeus), медведки (например, рыжевато-коричневая медведка (*Scapteriscus vicinus* Scudder) и южная медведка (*Scapteriscus borellii* Giglio-Tos)); яйца, взрослые и неполовозрелые особи отряда Diptera, включая минирующих мушек (например, *Liriomyza* spp., такие как серпентиновый овоцной минер (*Liriomyza sativae* Blanchard)), звонцы, плодовые мушки (Tephritidae), злаковые мушки (например, *Oscinella frit* Linnaeus), личинки земляной мухи, комнатные мухи (например, *Musca domestica* Linnaeus), малые комнатные мухи (например, *Fannia canicularis* Linnaeus, *F. femoralis* Stein), настоящие мухи (например, *Stomoxys calcitrans* Linnaeus), мухи полевые, жигалки коровьи малые, мясные мухи (например, *Chrysomya* spp., *Phormia* spp.), и другие мухообразные вредители, слепни (например, *Tabanus* spp.), носоглоточные оводы (например, *Gastrophilus* spp., *Oestrus* spp.), овод бычий (например, *Hypoderma* spp.), оленьи мухи (например, *Chrysops* spp.), кровососки овечьи (например, *Melophagus ovinus* Linnaeus) и другие Brachycera, комары (например, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp.), тля черная (например, *Prosimum* spp., *Simulium* spp.), мокрецы, песчаные мухи, сцимарида и другие Nematocera; яйца, взрослые и неполовозрелые особи отряда Thysanoptera, включая трипсы луковые (*Thrips tabaci* Lindeman), трипсы обыкновенные (*Frankliniella* spp.), и другие питающиеся листьями трипсы; насекомые-вредители отряда Hymenoptera, включая муравьев семейства Formicidae, включая муравья-плотника флоридского (*Camponotus floridanus* Buckley), красного муравья-плотника (*Camponotus ferrugineus* Fabricius), черного муравья-плотника (*Camponotus pennsylvanicus* De Geer), бледноногого муравья (*Technomyrmex albipes* fr. Smith), большеголовых муравьев (*Pheidole* sp.), муравья-призрака (*Tarionoma melanocepalum* Fabricius); муравья-Фараон (*Monomorium pharaonis* Linnaeus), огненного муравья малого (*Wasmannia auropunctata* Roger), огненного муравья

(*Solenopsis geminata* Fabricius), муравья огненного импортного красного (*Solenopsis invicta* Buren), аргентинского муравья (*Iridomyrmex humilis* Mayr), сумасшедшего муравья (*Paratrechina longicornis* Latreille), муравья дернового (*Tetramorium caespitum* Linnaeus), муравья садового бледного (*Lasius alienus* Förster) и пахнущего муравья-вора домового (*Tarpinoma sessile* Say). Другие Hymenoptera, включая пчел (включая пчел-плотников), шершней, настоящих ос, ос и пилильщиков (*Neodiprion* spp.; *Cephus* spp.); вредители-насекомые отряда Isoptera, включая термитов в семействах termitidae (например, *Macrotermes* sp., *Odontotermes obesus* Rambur), Kalotermitidae (например, *Cryptotermes* sp.), и Rhinotermitidae (например, *Reticulitermes* sp., *Coptotermes* sp., *Heterotermes tenuis* Hagen), термита желтого (*Reticulitermes flavipes* Kollar), восточного подземного термита (*Reticulitermes hesperus* Banks), тайванского подземного термита (*Coptotermes formosanus* Shiraki), вест-индийского термита сухого дерева (*Incisitermes immigrans* Snyder), паудерпост термита (*Cryptotermes brevis* Walker), термита сухого дерева (*Incisitermes snyderi* Light), эго-восточного подземного термита (*Reticulitermes virginicus* Banks), западного термита сухого дерева (*Incisitermes minor* Hagen), древесных термитов, таких как *Nasutitermes* sp. и други термитов эконолической важности; насекомых-вредителей отряда Thysanura, таких как чешуйница обыкновенная (*Lepisma saccharina* Linnaeus) и чешуйница домашняя (*Thermobia domestica* Packard); насекомых-вредителей отряда Mallophaga и включающего вошь головную (*Pediculus humanus capitis* De Geer), телесную вошь (*Pediculus humanus* Linnaeus), пероеда на теле цыплят (*Menacanthus stramineus* Nitzsch), собачего власоеда (*Trichodectes canis* De Geer), пухоеда куриного пестробрюхого (*Goniocotes gallinae* De Geer), вошь овец (*Bovicola ovis* Schrank), вошь крупного рогатого скота коротконосую кровососущую (*Haematorpinus eurysternus* Nitzsch), вошь крупного рогатого скота долгоносую кровососущую (*Linognathus vituli* Linnaeus) и другие сосущие и жующие паразитические вши, нападающие на человека и животных; насекомых-вредителей отряда Siphonoptera, включая блоху крысиная южная (*Xenopsylla cheopis* Rothschild), блоху кошачью (*Ctenocephalides felis* Bouche), блоху собачью (*Ctenocephalides canis* Curtis), куриную блоху (*Ceratophyllus gallinae* Schrank), блоху присасывающуюся (*Echidnophaga gallinacea* Westwood), человеческую блоху (*Pulex irritans* Linnaeus) и других блох, поражающих млекопитающих и птиц. Дополнительные включенные членистоногие вредители включают: пауков в отряде Araneae, таких как коричневый паук-отшельник (*Loxosceles reclusa* Gertsch & Mulaik) и паук "черная вдова" (*Latrodectus mactans* Fabricius), и сколопендры в отряде Scutigeraomorpha, такие как домашняя сколопендра (*Scutigera coleoptrata* Linnaeus).

Примеры беспозвоночных вредителей хранимого зерна включают «крупнозернистого» бурильного молотка (*Prostephanus truncatus*), точильщика зернового (*Rhyzopertha dominica*), долгоносика рисового (*Stiophilus oryzae*), кукурузного долгоносика (*Stiophilus zeamais*), зерновку китайскую (*Callosobruchus maculatus*), хруща каштанового (*Tribolium castaneum*), долгоносика амбарного (*Stiophilus granarius*), моль индийскую

мучную (*Plodia interpunctella*), мельничной огневки (*Ephestia kuhniella*) и мукоеда малого или мукоеда рыжего (*Cryptolestis ferrugineus*).

Соединения настоящего изобретения показывают особенно высокую активность против вредителей в отряде *Lepidoptera* (например, *Alabama argillacea* Hübner (совка хлопковая американская), *Archips argyrospila* Walker (листовертка плодовых деревьев), *A. rosana* Linnaeus (европейская листовертка) и другие виды *Archips*, *Chilo suppressalis* Walker (сверлильщик рисовый стеблевой), *Sparganothis medinalis* Guenée (рисовую листовертка), *Crambus caliginosellus* Clemens (гусеница, строящая паутинное гнездо, поедающая корни кукурузы), *Crambus teterrellus* Zincken (огневка мятликая), *Cydia pomonella* Linnaeus (плодожорка яблонная), *Earias insulana* Boisduval (совка хлопковая египетская), *Earias vittella* Fabricius (совка пятнистая), *Helicoverpa armigera* Hübner (американская совка), *Helicoverpa zea* Boddie (гусеница совки хлопковой американской), *Heliothis virescens* Fabricius (табачная листовертка), *Herpetogramma licarsisalis* Walker (луговой мотылек тропической травы), *Lobesia botrana* Denis & Schiffermüller (листовертка виноградная), *Pectinophora gossypiella* Saunders (розовый коробочный червь), *Phyllocnistis citrella* Stainton (цитрусовый листовой минер), *Pieris brassicae* Linnaeus (капустница), *Pieris rapae* Linnaeus (репница), *Plutella xylostella* Linnaeus (капустная моль), *Spodoptera exigua* Hübner (совка малая), *Spodoptera litura* Fabricius (азиатская хлопковая совка, гусеница азиатской хлопковой совки), *Spodoptera frugiperda* J. E. Smith (совка трояная), *Trichoplusia ni* Hübner (совка капустная) и *Tuta absoluta* Meyrick (томатный листовой минер)).

Соединения настоящего изобретения также обладают значительной активностью на членов из отряда *Hemiptera*, включая: *Acyrtosiphon pisum* Harris (тля гороховая), *Aphis craccivora* Koch (тля люцерновая), *Aphis fabae* Scopoli (тля бобовая), *Aphis gossypii* Glover (тля хлопковая, тля бахчевая), *Aphis pomi* De Geer (яблочная тля), *Aphis spiraeicola* Patch (тля зеленая цитрусовая), *Aulacorthum solani* Kaltenbach (тля картофельная обыкновенная), *Chaetosiphon fragaefolii* Cockerell (клубничная тля), *Diuraphis noxia* Kurdjumov/Mordvilko (русская пшеничная тля), *Dysaphis plantaginea* Passerini (тля яблонево-розовая), *Eriosoma lanigerum* Hausmann (тля яблонная кровавая), *Hyalopterus pruni* Geoffroy (тля сливовая опыленная), *Lipaphis pseudobrassicae* Davis (тля ложнокапустная), *Metopolophium dirhodum* Walker (тля розанно-злаковая), *Macrosiphum euphorbiae* Thomas (тля картофельная обыкновенная), *Myzus persicae* Sulzer (тля оранжерейная, зеленая персиковая тля), *Nasonovia ribisnigri* Mosley (тля салатная зеленая), *Pemphigus* spp. (корневая тля и галловая тля), *Rhopalosiphum maidis* Fitch (тля кукурузная листовая), *Rhopalosiphum padi* Linnaeus (тля черемуховая обыкновенная), *Schizaphis graminum* Rondani (злаковая тля), *Sitobion avenae* Fabricius (тля листовая), *Therioaphis maculata* Buckton (бородавчатая тля), *Toxoptera aurantii* Boyer de Fonscolombe (черная цитрусовая тля), и *Toxoptera citricidus* Kirkaldy (коричневая цитрусовая тля); *Adelges* spp. (хермес); *Phylloxera devastatrix* Pergande (филлоксера пекана); *Bemisia tabaci* Gennadius (белокрылка табачная, белокрылка сладкого картофеля), *Bemisia argentifolii* Bellows & Perring

(белокрылка серебристая), *Dialeurodes citri* Ashmead (цитрусовая белокрылка) и *Trialeurodes vaporariorum* Westwood (белокрылка тепличная); *Empoasca fabae* Harris (цикадка картофельная), *Laodelphax striatellus* Fallen (маленькая бурая рисовая цикадка), *Macrostelus quadrilineatus* Forbes (астровая цикадка), *Nephotettix cincticeps* Uhler (зеленая рисовая цикадка), *Nephotettix nigropictus* Stål (рисовая цикадка), *Nilaparvata lugens* Stål (бурая рисовая цикадка), *Peregrinus maidis* Ashmead (кукурузная цикадка), *Sogatella furcifera* Horvath (белобокая цикадка), *Tagosodes orizicolus* Muir (рисовый дельфацид), *Typhlocyba pomaria* McAtee (цикадка яблонная), *Erythroneura* spp. (виноградная цикадка); *Magidada septendecim* Linnaeus (периодическая цикада); *Icerya purchasi* Maskell (червец австралийский желобчатый), *Quadraspidiotus perniciosus* Comstock (щитовка калифорнийская); *Planococcus citri* Risso (мучнистый червец виноградный); *Pseudococcus* spp. (другие группы мучнистого червца); *Cacopsylla rugicola* Foerster (листоблошка грушевая), *Trioza diospyri* Ashmead (листоблошка хурмовая).

Соединения настоящего изобретения также обладают активностью на членов из отряда Hemiptera, включая: *Acrosternum hilare* Say (щитник), *Anasa tristis* De Geer (клоп ромбовик печальный), *Blissus leucopterus* Say (клоп-черепашка), *Cimex lectularius* Linnaeus (клоп постельный) *Corythuca gossypii* Fabricius (клоп хлопковый), *Cyrtopeltis modesta* Distant (клоп томатный), *Dysdercus suturellus* Herrich-Schäffer (хлопковый красноклоп), *Euchistus servus* Say (коричневый щитник), *Euchistus variolarius* Palisot de Beauvois (однотонный щитник), *Graptosthetus* spp. (комплекс наземников), *Halymorpha halys* Stål (щитник мраморный), *Leptoglossus corculus* Say (ромбовик семян сосны), *Lygus lineolaris* Palisot de Beauvois (клоп полевой), *Nezara viridula* Linnaeus (эжный щитник), *Oebalus pugnax* Fabricius (рисовый щитник), *Oncopeltus fasciatus* Dallas (большой жук молочая), *Pseudatomoscelis seriatus* Reuter (слепняк хлопковый). Другие насекомые-вредители, с которыми борются соединениями настоящего изобретения, включают Thysanoptera (например, *Frankliniella occidentalis* Pergande (западные цветочные трипсы), *Scirtothrips citri* Moulton (цитрусовые трипсы), *Sericothrips variabilis* Beach (трипсы соевых бобов) и *Thrips tabaci* Lindeman (луковые трипсы); и отряда Coleoptera (например, *Leptinotarsa decemlineata* Say (колорадский жук), *Epilachna varivestis* Mulsant (мексиканский бобовый жук) и проволочники родов *Agriotes*, *Athous* или *Limonius*).

Следует отметить применение соединений настоящего изобретения для борьбы с белокрылкой сладкого картофеля (*Bemisia argentifolii*). Следует отметить применение соединений настоящего изобретения для борьбы с западным цветочным трипсом (*Frankliniella occidentalis*). Следует отметить применение соединений настоящего изобретения для борьбы с цикадкой картофельной (*Empoasca fabae*). Следует отметить применение соединений настоящего изобретения для борьбы с кукурузной цикадкой (*Peregrinus maidis*). Следует отметить применение соединений настоящего изобретения для борьбы с хлопковой бахчевой тлей (*Aphis gossypii*). Следует отметить применение соединений настоящего изобретения для борьбы с зеленой персиковой тлей (*Myzus persicae*). Следует отметить применение соединений настоящего изобретения для борьбы

с капустной молью (*Plutella xylostella*). Следует отметить применение соединений настоящего изобретения для борьбы с совкой трояной (*Spodoptera frugiperda*).

Соединения настоящего изобретения также являются пригодными для увеличения жизненность культурных растений. Данный способ включает контакт культурного растения (например, листьев, цветов, плодов или корней) или семян, из которых вырастает культурное растение, с соединением формулы **1** в количестве, достаточном для достижения требуемого эффекта на жизненность растения (т.е., биологически эффективным количестве). Обычно соединение формулы **1** применяют в сформулированной композиции. Хотя соединение формулы **1** часто наносят непосредственно на культурное растение или его семена, его также можно наносить в месте расположения культурного растения, то есть в окружающей среде культурного растения, в частности в части окружающей среды, находящейся достаточно близко, чтобы обеспечить перемещение соединения формулы **1** на культурные растения. Локус, относящийся к данному способу, обычно включает среду для выращивания (т.е. среду, обеспечивающую питательные вещества для растения), обычно почву, в которой выращивают растение. Обработка культурного растения для увеличения жизненности культурного растения, таким образом, включает контактирование культурного растения, семян, из которых выращивают культурное растение, или места произрастания культурного растения с биологически эффективным соединением формулы **1**.

Повышенная жизненность культуры может привести к одному или нескольким из следующих наблюдаемых эффектов: (a) оптимальное укоренение посевов, о чем свидетельствует превосходная прорастание семян, всхожесть культуры и древостой; (b) усиленный рост сельскохозяйственных культур, что демонстрируется быстрым и устойчивым ростом листьев (например, измеряется индексом площади листа), высотой растения, количеством побегов (например, для риса), корневой массой и общим сухим весом вегетативной массы урожая; (c) повышение урожайности сельскохозяйственных культур, что демонстрируется временем до цветения, продолжительностью цветения, количеством цветков, общим накоплением биомассы (т.е. количеством урожая) и/или товарным качеством плодов или зерна (т.е. качеством урожая); (d) повышенная способность культуры противостоять или предотвращать инфекции растений и заражения членистоногими, нематодами или моллюсками; и (e) повышенная способность культуры противостоять стрессам окружающей среды, таким как воздействие экстремальных температур, недостаточная влажность или фитотоксичные химические вещества.

Соединения настоящего изобретения могут повышать жизненность обработанных растений по сравнению с необработанными растениями, убивая или иначе предотвращая питание растительноядными беспозвоночными вредителями в окружающей среде растений. В отсутствие данной борьбы с растительноядными беспозвоночными вредителями, вредители снижают жизненность растений за счет потребления растительных тканей или сока или передачи патогенов растений, таких как вирусы. Даже в отсутствие растительноядных беспозвоночных вредителей соединения настоящего

изобретения могут повышать жизненность растений, изменяя метаболизм растений. Как правило, жизненность культурного растения будет наиболее значительно повышена обработкой растения соединением настоящего изобретения, если растение выращивается в неидеальной среде, т.е. в среде, содержащей один или несколько аспектов, неблагоприятных для достижения растением полного генетического потенциала, который он проявлял бы в идеальной среде.

Соединения настоящего изобретения можно также смешивать с одним или более другими биологически активными соединениями или агентами, включая инсектициды, фунгициды, нематоциды, бактерициды, акарициды, гербициды, антидоты гербицидов, регуляторы роста, такие как ингибиторы линьки насекомых и стимуляторы корнеобразования, хемотриланты, полухимикаты, репелленты, аттрактанты, феромоны, стимуляторы питания, другие биологически активные соединения или энтомопатогенные бактерии, вирусные или грибковые для образования многокомпонентного пестицида, дающего еще более широкий спектр агрономической и неагрономической полезности. Таким образом, настоящее изобретение также относится к композициям, содержащим биологически эффективное количество соединения формулы **1**, по меньшей мере, один дополнительный компонент, выбранный из группы, состоящей из поверхностно-активных соединений, твердых разбавителей и жидких разбавителей, и, по меньшей мере, один дополнительное биологически активное соединение или агент. Что касается смесей настоящего изобретения, другие биологически активные соединения или агенты можно формулировать вместе с настоящими соединениями, включая соединения формулы **1**, получая предварительную смесь, или другие биологически активные соединения или агенты можно формулировать отдельно от настоящих соединений, включая соединения формулы **1**, и два состава смешивают вместе перед применением (например, в распылительном приборе) или, альтернативно, применяют последовательно.

Примеры данных биологически активных соединений или агентов, с которыми соединения настоящего изобретения можно формулировать, представляют собой инсектициды такие как абамектин, ацефат, ацехиноцил, ацетамиприд, акринатрин, ацинонапир, 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-c]пиран-4-ил]метилциклопропанкарбоксилат), амидофлумет, амитраз, авермектин, азадирахтин, азинфосметил, бенфуракарб, бенсультап, бензпиримоксан, бифентрин, каппа-бифентрин, бифеназат, бистрифлурон, борат, брофланилид, бупрофезин, кадусафос, карбарил, карбофуран, картап, карзол, хлорантранилипрол, хлорфенапир, хлорфлуазурон, хлорпраллетрин, хлорпирифос, хлорпирифос-е, хлорпирифос-метил, хромафенозид, клофентезин, хлорпраллетрин, клотианидин, циантранилипрол (3-бром-1-(3-хлор-2-пиридинил)-N-[4-циано-2-метил-6-[(метиламино)карбонил]фенил]-1H-пиразол-5-карбоксамид), циклнилипрол (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), циенопирафен, цифлуметофен, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалодиамида, цигалотрин, гамма-цигалотрин, лямбда-цигалотрин, циперметрин, альфа-циперметрин, зета-циперметрин, циромазин, дельтаметрин, диафентиурон, диазинон, диклоромезотиаз, диэльдрин, дифлубензурон, димефлутрин, димегипо, диметоат, димпропиридаз, динотефуран, диофенолан, эмаектин, эмаектинбензоат, эндосульфат, эсфенвалерат, этипрол, этофенпрокс, эпсилон-метофлутрин, этоксазол, оксид фенбутатина, фенитротио, фенотиокарб, феноксикарб, фенпропатрин, фенвалерат, фипронил, флометоквин (2-этил-3,7-диметил-6-[4-(трифторметокси)фенокси]-4-хинолинилметилкарбонат), флоникамид, флуазаиндолизин, флубендиамид, флуцитринат, флуфенерим, флуфеноксурон, флуфеноксистробин (метил (αE)-2-[[2-хлор-4-(трифторметил)фенокси]метил]-α-(метоксиметилен)бензолацетат), флуенсульфон (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-[(трифторметил)сульфинил]-1H-пиразол-3-карбонитрил), флупирадифурон (4-[[6-хлор-3-пиридинил)метил](2,2-дифторэтил)амино]-2(5H)-фуранон), флупиримин, флувалинат, тау-флувалинет, флуксаметамида, фонофос, форметанат, фостиазат, гамма-цигалотрин, 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, изоциклоцерам, каппа-тефлутрин, лямбда-цигалотрин, луфенурон, малатион, мепефлутрин ([2,3,5,6-тетрафтор-4-(метоксиметил)фенил]метил (1R,3S)-3-(2,2-дихлорэтенил)-2,2-диметилциклопропанкарбоксилат), метафлумизон, метальдегид, метамидофос, метидатион, метиокарб, метомил, метопрен, метоксихлор, метофлутрин, метоксифенозид, эпсилон-метофлутрин, эпсилон-момфлуоротрин, монокротофос, монофлуоротрин ([2,3,5,6-тетрафтор-4-(метоксиметил)фенил]метил 3-(2-циано-1-пропен-1-ил)-2,2-диметилциклопропанкарбоксилат), никотин, нитенпирам, нитиазин, новалурон, новифлумурон, оксамил, оксазосульфил, паратион, паратион-метил, перметрин, форат, фосфалон, 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, силафлуфен, спинеторам, спиносид, спироциклофен, спиромезифен, спиропидион, спиротетрамат, сульфофос, сульфоксафлор (N-[метилоксидо[1-[6-(трифторметил)-3-пиридинил]этил]-λ<sup>4</sup>-сульфанилиден]цианамид), тебуфенозид, тебуфенпирад, тефлубензурон, тефлутрин, каппа-тефлутрин, тербуфос, тетрахлорантранилипрол, тетрахлорвинфос, тетраметрин, тетраметилфлутрин ([2,3,5,6-

тетрафтор-4-(метоксиметил)фенил]метил 2,2,3,3-тетраметилциклопропанкарбоксилат), тетранилипрол, тиаклоприд, тиаметоксам, тиодикарб, тиосультап-натрия, тиоксазафен (3-фенил-5-(2-тиенил)-1,2,4-оксадиазол), толфенпирад, тралометрин, триазамат, трихлорфон, трифлумезопирим (2,4-диоксо-1-(5-пиримидинилметил)-3-[3-(трифторметил)фенил]-2Н-пиридо[1,2-а]пиримидиновая внутренняя соль), трифлумурон, циклопиразофлор, дзета-циперметрин, дельта-эндотоксины *Bacillus thuringiensis*, энтомопатогенные бактерии, энтомопатогенные вирусы или энтомопатогенные грибы.

Следует отметить инсектициды, такие как абамектин, ацетамиприд, акринатрин, ацинонапир, афидопиропен, амитраз, авермектин, азадирахтин, бенфуракарб, бенсультап, бифентрин, бупрофезин, брофланилид, кадусафос, карбарил, картап, хлорантранилипирол, хлоропраллетрин, хлорфенапир, хлорпирифос, клотианидин, циантранилипрол, цикланилипрол, циклопротрин, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, гамма-цигалотрин, лямбда-цигалотрин, циперметрин, альфа-циперметрин, зета-циперметрин, циромазин, дельтаметрин, дильдрин, динотефуран, диофенолан, эмаектин, эндосульфат, эпсилон-метофлутрин, эсфенвалерат, этипрол, этофенпрокс, этоксазол, фнитротрион, фенотиокарб, феноксикарб, фенвалерат, фипронил, флометокин, флуксаметамид, флоникамид, флубендиамид, флуенсульфон, флуфеноксурон, флуфеноксистробин, флуфенсульфон, флупипрол, флупиримин, флупирадифурон, флувалинат, форметанат, фостиазат, гамма-цигалотрин, гептафлутрин, гексафлумурон, гидраметилнон, имидаклоприд, индоксакарб, изоциклосерам, каппа-тефлутрин, лямбда-цигалотрин, луфенурон, меперфлутрин, метафлумизон, метиодикарб, метомил, метопрен, метоксифенозид, метофлутрин, монофлуоротрин, нитенпирам, нитиазин, новалурон, оксамил, пифлубумид, пиметрозин, пиретрин, пиридабен, пиридалил, пириминостробин, пирипроксифен, рианодин, спинеторам, спиносат, спиродиклофен, спиромезифен, спиротетрамат, сульфоксафлор, тебуфенозид, тетраметрин, тетраметилфлутрин, тиаклоприд, тиаметоксам, тиодикарб, тиосультап-натрия, тралометрин, триазамат, трифлумезопирим, трифлумурон, циклопиразофлор, дзета-циперметрин, дельта-эндотоксины *Bacillus thuringiensis*, все штаммы *Bacillus thuringiensis* и все штаммы вирусов нуклеополиэдрога.

Один вариант осуществления биологических агентов для смешения с соединениями настоящего изобретения включает энтомопатогенные бактерии, такие как *Bacillus thuringiensis*, и инкапсулированные дельта-эндотоксины *Bacillus thuringiensis*, такие как MVP® и MVPII® биоинсектициды, полученные способом CellCap® (CellCap®, MVP® и MVPII® представляют собой торговые марки Mucogen Corporation, Indianapolis, Indiana, USA); энтомопатогенные грибы, такие как гриб зеленый мускардин; и энтомопатогенные (как природные, так и генетически модифицированные) вирусы, включая бакуловирус, нуклеополигедровирус (NPV), такой как нуклеополигедровирус *Helicoverpa zea* (HzNPV), нуклеополиэдровирус *Anagrapha falcifera* (AfNPV); и вирус гранулеза (GV), такой как вирус *Cydia pomonella granulosus* (CpGV).

Один вариант осуществления биологических агентов для смешения с

соединениями настоящего изобретения включает один или комбинацию из (i) бактерий рода *Actinomycetes*, *Agrobacterium*, *Arthrobacter*, *Alcaligenes*, *Aureobacterium*, *Azobacter*, *Bacillus*, *Beijerinckia*, *Bradyrhizobium*, *Brevibacillus*, *Burkholderia*, *Chromobacterium*, *Clostridium*, *Clavibacter*, *Comamonas*, *Corynebacterium*, *Curtobacterium*, *Enterobacter*, *Flavobacterium*, *Gluconobacter*, *Hydrogenophaga*, *Klebsiella*, *Methylobacterium*, *Paenibacillus*, *Pasteuria*, *Photobacterium*, *Phyllobacterium*, *Pseudomonas*, *Rhizobium*, *Serratia*, *Sphingobacterium*, *Stenotrophomonas*, *Streptomyces*, *Variovorax* или *Xenorhabdus*, например, *Bacillus amyloliquefaciens*, *Bacillus cereus*, *Bacillus firmus*, *Bacillus licheniformis*, *Bacillus pumilus*, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus subtilis*, *Bacillus thuringiensis*, *Bradyrhizobium japonicum*, *Chromobacterium subtsugae*, *Pasteuria nishizawae*, *Pasteuria penetrans*, *Pasteuria usage*, *Pseudomonas fluorescens*, и *Streptomyces lydicus*; (ii) грибы, такие как зеленый мускардин; (iii) вирус, включая бакуловирус, нуклеополигедровирус, такой как нуклеополигедровирус *Helicoverpa zea*, нуклеополиэдровирус *Anagrapha falcifera* (AfNPV); и вирус гранулеза, такой как вирус *Cydia pomonella granulosis* (CpGV).

Следует отметить такую комбинацию, в которой другой активный ингредиент для борьбы с беспозвоночным вредителем относится к отличному химическому классу или имеет отличное место действия от соединений формулы I или формулы II. В определенных случаях, комбинация, по меньшей мере, с одним другим активным ингредиентом для борьбы с беспозвоночными вредителями, обладающим аналогичным спектром действия, но другим местом действия, будет особенно полезна для борьбы с устойчивостью. Таким образом, композиция настоящего изобретения может дополнительно содержать, по меньшей мере, один дополнительный активный ингредиент для борьбы с беспозвоночными вредителями, имеющий аналогичный спектр контроля, но принадлежащий к другому химическому классу или имеющий другое место действия. Данные дополнительные биологически активные соединения или агенты включают, но не ограничиваются, ингибиторы ацетилхолинэстеразы (AChE), такие как карбаматы метомил, оксамил, тиодикарб, триазамат и органофосфаты хлорпирифос; антагонисты ГАМК-зависимых хлоридных каналов, такие как циклодиены дизельдрин и эндосульфат, и фенилпиразолы этипрол и фипронил; модуляторы натриевых каналов, такие как пиретроиды бифентрин, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, лямбда-цигалотрин, циперметрин, дельтаметрин, димефлутрин, эсфенвалерат, метофлутрин и профлутрин; агонисты никотиновых ацетилхолиновых рецепторов (nAChR), такие как неоникотиноиды ацетамиприд, клотианидин, динотефуран, имидаклоприд, нитенпирам, нитиазин, тиаклоприд, тиаметоксам и сульфоксафлор; аллостерические активаторы никотинового ацетилхолинового рецептора (nAChR), такие как спинозины спинеторам и спиносад; активаторы хлоридных каналов, такие как авермектины абамектин и эмабектин; имитаторы ювенильного гормона, такие как диофенолан, метопрен, феноксикарб и пирипроксифен; селективные блокаторы питания гомоптеранов, такие как пиметрозин и флоникамид; ингибиторы роста клещей, такие как этоксазол; ингибиторы митохондриальной АТФ-синтазы, такие как пропаргит; соединители окислительного

фосфорилирования через нарушение 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; нарушители линьки двукрылых, такие как циромазин; агонисты рецептора экдизона, такие как диацилгидразины метоксифенозид и тебуфенозид; агонисты рецептора октопамина, такие как амитраз; ингибиторы транспорта электронов митохондриального комплекса III, такие как гидраметилнон; ингибиторы транспорта электронов митохондриального комплекса I, такие как пиридабен; блокаторы потенциалозависимых натриевых каналов, такие как индоксакарб; ингибиторы ацетил-КоА-карбоксилазы, такие как тетровая и тетрамовая кислоты спироциклофен, спиромезифен и спиротетрамат; ингибиторы транспорта электронов митохондриального комплекса II, такие как  $\beta$ -кетонитрилы циенопирафен и цифлуметофен; модуляторы рианидиновых рецепторов, такие как антраниловые диамиды хлорантранилипрол, циантранилипрол и циантранилипрол, диамиды, такие как флубендиамид, диамиды, такие как бромантранилипрол, дихлорантранилипрол, лиганды рианоидиновых рецепторов, такие как рианодин; соединения, где целевой сайт, ответственный за биологическую активность, является неизвестным или не охарактеризован, например азадирахтин, бифеназат, пиридалил, пирифлухиназон и трифлумезопирим; микробные разрушители мембран средней кишки насекомых, такие как *Bacillus thuringensis* и продуцируемые ими дельта-эндотоксины и *Bacillus sphaericus*; и биологические агенты, включая нуклеополиэдровирусы (NPV) и другие природные или генетически модифицированные инсектицидные вирусы.

Дополнительные примеры биологически активных соединения или агентов, с которыми соединения настоящего изобретения можно формулировать, представляют собой: фунгициды, такие как ацибензолар-S-метил, альдиморф, аметоктрадин, аминопирифен, амисульбром, анилазин, азаконазол, азоксистробин, беналаксил (включая беналаксил-M), беноданил, беномил, бентиаваликарб (включая бентиаваликарб-изопропил), бензовиндифлупир, бетоксазин, бинапакрил, бифенил, битертанол, биксафен, бластицидин-S, боскалид, бромуконазол, бупиримат, бутиобат, карбоксин, карпропамид, каптафол, каптан, карбендазим, хлоронеб, хлоротанолин, хлозолинат, гидроксид меди, оксихлорид меди, сульфат меди, кумоксистробин, циазофамид, цифлуфенамид, цимоксанил, ципроконазол, ципродинил, дихлобентиазокс, дихлофлуанид, диклоцимет, дикломезин, диклоран, диэтофенкарб, дифеноконазол, дифлуметорим, диметиримол, диметоморф, димоксистробин, диниконазол (включая диниконазол M), динокап, дипиметитрон, дитианон, дитиоланы, додеморф, додин, эконазол, этаконазол, эдифенфос, эноксастробин (также известный как энестробурин), эпоксиконазол, этабоксам, этиримол, этридазол, фамоксадон, фенамидон, фенаминстробин, фенаримол, фенбуконазол, фенфурам, фенгексамид, феноксанил, фенпиклонил, фенпикоксамид, фенпропидин, фенпропиморф, фенпиразамин, фентинацетат, фентингидроксид, фербам, феримзон,

флометоквин, флорилпикоксамид, флуопимомид, флуазинам, флудиоксонил, флуфеноксистробин, флуиндапир, флуморф, флуопиколид, флуопирам, флуоксапипролин, флуоксастробин, флуквинконазол, флусилазол, флусульфамид, флутианил, флутоланил, флутриафол, флуксапироксад, фолпет, фталид (также известный как фталид), фуберидазол, фуралаксил, фураметпир, гексаконазол, гимексазол, гуазатин, имазалил, имибенконазол, иминоктадин альбесилат, иминоктадин триацетат, инпирфлюксам, йодикарб, ипконазол, ипфентрифлуконазол, ипфлуфеноквин, изофетамид, ипробенфос, ипродион, ипроваликарб, изофлуципрам, изопротиолан, изопиразам, изотианил, касугамицин, крезоксим-метил, ланкотрион, манкозоб, мандипропамид, мандестробин, манеб, мапанипирин, мефентрифлуконазол, мепронил, мептилдинокап, металаксил (включая металаксил-М/мефеноксам), метконазол, метасульфокарб, метирам, метоминостробин, метилтетрапрол, метрафенон, миклобутанил, нафтитин, неоазозин (ментанарсонат железа), нуаримол, октилинон, офурац, оризастробин, оксациксил, оксатиапипролин, оксолиновая кислота, окспоконазол, оксикарбоксин, окситетрациклин, пенконазол, пенцикурон, пенфлуфен, пентиопирад, перфуразоат, фосфористая кислота (включая ее соли, например, фосетил-алюминий), пикоксистробин, пипералин, полиоксин, пробеназол, прохлораз, процимидон, пропамокарб, пропиконазол, пропиенеб, проквиназид, протиокарб, протиоконазол, пидифлуметофен (Adepidyn®), пираклостробин, пираметостробин, пирапропойн, пираоксистробин, пиразифлумид, пиразофос, пирибенкарб, пирибулакарб, пиридахлометил, пирифенокс, пириофенон, перизоксазол, приметанил, пирифенокс, пиррольнитрин, пироквилон, хинконазол, квинметионат, квинофумелин, квиноксифен, квинтозен, силтиофам, седаксан, симеконазол, спироксамин, стрептомицин, сера, тебуконазол, тебуфлорин, теклофталам, теклофталам, текназен, тербинафин, тетраконазол, тиабендазол, тифлузамид, тиофанат, тиофанат-метил, тирам, тиадинил, толклофос-метил, толпрокарб, толифлуанид, триадимефон, триадименол, триаримол, триазоксид, сульфат трехосновной меди, триклопирикарб, тридеморф, трифлуксистробин, трифлумизол, тримоксипирамид, трициклазол, трифлуксистробин, трифорин, тритиконазол, униканазол, валидамицин, валифеналат (также известный как валифенал), винклозолин, цинеб, цирам, зоксамид и 1-[4-[4-[5-(2,6-дифторфенил)-4,5-дигидро-3-изоксазоллил]-2-тиазолил]-1-пиримидинил]-2-[5-метил-3-(трифторметил)-1H-пирозол-1-ил]этанон; нематоциды, такие как флуопирам, спиротетрамат, тиодикарб, фостиазат, абамектин, ипродион, флуенсульфон, диметилдисульфид, тиоксазафен, 1,3-дихлорпропен (1,3-D), метам (натрия и калия), дазомет, хлоропикрин, фенамифос, этофосфос, кадузафос, 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, оксид фенбутатина, фенпропатрин, фенпироксимат, гекситиазокс, пропаргит, пиридабен и тебуфенпирад.

В определенных случаях, комбинации соединения настоящего изобретения с другими биологически активными (в частности для борьбы с беспозвоночными

вредителями) соединениями или агентами (т.е., активными ингредиентами) может привести к более чем аддитивному (т.е. синергетическому) эффекту. Всегда желательно уменьшение количества активных ингредиентов, выделяемых в окружающую среду, при обеспечении эффективной борьбы с вредителями. Когда синергизм активных ингредиентов для борьбы с беспозвоночными вредителями возникает при дозах внесения, обеспечивающих агрономически удовлетворительные уровни борьбы с беспозвоночными вредителями, данные комбинации могут быть полезными для снижения затрат на растениеводство и уменьшения нагрузки на окружающую среду.

Соединения настоящего изобретения и их композиции можно применять на растениях, генетически трансформированных для экспрессии белков, токсичных для беспозвоночных вредителей (таких как дельта-эндотоксины *Bacillus thuringiensis*). Данное применение может обеспечить более широкий спектр защиты растений и быть полезным для борьбы с устойчивостью. Эффект экзогенно применяемых соединений для борьбы с беспозвоночными вредителями может быть синергическим с экспрессируемыми токсинными белками.

Общие ссылки для данных агрокультурных средств защиты (т.е., инсектицидов, фунгицидов, нематоцидов, акарицидов, гербицидов и биологических агентов) включают *The Pesticide Manual*, 13th Edition, C. D. S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2003 и *The BioPesticide Manual*, 2<sup>nd</sup> Edition, L. G. Copping, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2001.

Беспозвоночные вредители контролируются в агрономических и неагрономических применениях применением одного или нескольких соединений по настоящему изобретению, обычно в форме композиции, в биологически эффективном количестве, в окружающей среде вредителей, включая агрономические и/или неагрономические очаги заражения, в защищаемой зоне или непосредственно на вредителях, подлежащих контролю.

Таким образом, настоящее изобретение включает способ борьбы с беспозвоночными вредителями в агрономических и/или неагрономических применениях, включающий контакт беспозвоночных вредителей или его окружающей среды с биологически эффективным количеством одного или более из соединений настоящего изобретения, или композиции, содержащей, по меньшей мере, одно данное соединение или композицию, содержащую, по меньшей мере, одно данное соединение и биологически эффективное количество, по меньшей мере, одного дополнительного биологически активного соединения или агента. Примеры подходящих композиций, содержащих соединение настоящего изобретения и биологически эффективное количество, по меньшей мере, одного дополнительного биологически активного соединения или агента включают гранулярные композиции, где дополнительный активный компонент присутствует на той же грануле, как соединение настоящего изобретения или на гранулах, отличных от гранул соединения настоящего изобретения.

Для достижения контакта с соединением или композицией настоящего изобретения

для защиты полевой культуры от беспозвоночных вредителей, соединение или композицию обычно наносят на семена культуры перед посадкой, на листву (например, листья, стебли, цветы, плоды) культурных растений, или в почву или другую питательную среду до или после посадки культуры.

Один вариант осуществления способа контакта представляет собой распыление. Альтернативно, гранулярную композицию, содержащую соединение настоящего изобретения, можно наносить на листву растения или в почву. Соединения настоящего изобретения также можно эффективно доставлять посредством поглощения растением путем контактирования растения с композицией, содержащей соединение настоящего изобретения, нанесенной в виде пропитки почвы жидким составом, гранулированного состава в почву, обработкой в рассаднике или погружением трансплантатов. Следует отметить композицию настоящего изобретения в виде жидкого состава для пропитки почвы. Также следует отметить способ борьбы с беспозвоночными вредителями, включающий контакт беспозвоночных вредителей или их окружающей среды с биологически эффективным количеством соединения настоящего изобретения или с композицией, содержащей биологически эффективное количество соединения настоящего изобретения. Также следует отметить данный способ, где окружающая среда представляет собой почву, и композицию вносят в почву в виде состава для смачивания почвы. Также следует отметить, что соединения настоящего изобретения являются также эффективными при локальном применении в очаге заражения. Другие способы контакта включают нанесение соединения или композиции настоящего изобретения путем прямого и остаточного распыления, воздушного распыления, гелей, покрытий семян, микрокапсулирования, системного поглощения, приманок, ушных бирок, болюсов, увлажнителей, фумигантов, аэрозолей, пудры и многих других. Один вариант осуществления способа контакта представляет собой пространственно стабильную гранулу, стержень или таблетку удобрения, содержащую соединение или композицию настоящего изобретения. Соединениями настоящего изобретения также могут быть пропитаны материалы для изготовления устройств для борьбы с беспозвоночными (например, сетки от насекомых).

Соединения настоящего изобретения являются пригодными в лечении всех растений, частей растений и семян. Варианты и сорта растений и семян можно получить обычными способами размножения и селекции или способами генной инженерии. Генетически модифицированные растения или семена (трансгенные растения или семена) представляют собой растения или семена, в которых гетерологичный ген (трансген) стабильно интегрирован в геном растения или семени. Трансген, определяемый его конкретным положением в геноме растения, называют трансформацией или трансгенным событием.

Генетически модифицированные сорта растений и семян, которые можно обрабатывать в соответствии с настоящим изобретением, включают те, которые устойчивы к одному или нескольким биотическим стрессам (вредителям, таким как

нематоды, насекомые, клещи, грибы и т.д.) или абиотическим стрессам (засуха, низкая температура, соленость почвы и т.д.), или содержат другие желательные характеристики. Растения и семена можно генетически модифицировать по проявляемым признакам, например, устойчивости к гербицидам, устойчивости к насекомым, профилям модифицированных масел или устойчивости к засухе.

Обработка генетически модифицированных растений и семян соединениями настоящего изобретения может привести к усилению эффектов. Например, снижение норм внесения, расширение спектра активности, повышенная устойчивость к биотическим/абиотическим стрессам или повышенная стабильность при хранении могут быть большими, чем ожидалось от просто аддитивных эффектов применения соединений настоящего изобретения на генетически модифицированных растениях и семенах.

Соединения настоящего изобретения являются также пригодными в обработке семян для защиты семян от беспозвоночных вредителей. В контексте настоящего изобретения и формулы изобретения, обработка семян обозначает контакт семян с биологически эффективным количеством соединения настоящего изобретения, которое обычно формулируют в виде композиции настоящего изобретения. Данная обработка семян защищает семена от беспозвоночных почвенных вредителей и, как правило, может также защитить корни и другие части растения, контактирующие с почвой, проростков, развивающихся из проросших семян. Обработка семян может также обеспечивать защиту листвы путем перемещения соединения настоящего изобретения или второго активного ингредиента в развивающееся растение. Обработка семян может применяться ко всем типам семян, в том числе к тем, из которых будут прорасти растения, генетически трансформированные для экспрессии специализированных признаков. Репрезентативные примеры включают растения, экспрессирующие токсичные для беспозвоночных вредителей белки, такие как токсин *Bacillus thuringiensis*, или растения, экспрессирующие устойчивость к гербицидам, такие как глифосатацетилтрансфераза, которая обеспечивает устойчивость к глифосату. Обработка семян соединениями настоящего изобретения также может повысить жизнеспособность растений, вырастающих из обработанных семян.

Один из способов обработки семян заключается в опрыскивании или посыпании семян соединением настоящего изобретения (т.е. в виде сформулированной композиции) перед посевом семян. Композиции, разработанные для обработки семян, обычно содержат пленкообразователь или адгезивный агент. Следовательно, обычно композиция для покрытия семян настоящего изобретения содержит биологически эффективное количество соединения формулы **1**, его N-оксида или его соли и пленкообразователь или адгезивный агент. На семена можно нанести покрытие путем распыления концентрата текучей суспензии непосредственно на переворачивающийся слой семян с последующей сушкой семян.

Альтернативно, на семена можно распылять другие типы составов, такие как увлажненные порошки, растворы, суспензии, эмульгируемые концентраты и эмульсии в воде. Данный способ является особенно пригодным для нанесения пленочного



покрытия на семена. Специалисту в данной области доступны различные машины и способы нанесения покрытий. Подходящие способы включают способы, которые перечислены в P. Kusters et al., *Обработка семян: Progress and Prospects*, 1994 ВСРС Monograph No. 57, и ссылках в ней.

Соединения формулы 1 и их композиции, как по отдельности, так и в комбинации с другими инсектицидами и фунгицидами, являются особенно пригодными для обработки семян сельскохозяйственных культур, включая, но не ограничиваясь, маис или кукурузу, соевые бобы, хлопок, злаки (например, пшеницу, овес, ячмень, рожь и рис), картофель, овощи и масличный рапс.

Другие инсектициды, с которыми можно формулировать соединения формулы 1 для обеспечения смесей, пригодных в обработке семян, включают абамектин, ацетамиприд, акринатрин, амитраз, авермектин, азадирахтин, бенсультап, бифентрин, бупрофезин, карбарил, карбофуран, картап, хлорантранилипрол, хлорфенапир, хлорпирифос, клотианидин, циантранилипрол, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, гамма-цигалотрин, лямбда-цигалотрин, циперметрин, альфа-циперметрин, зета-циперметрин, циромазин, дельтаметрин, дильдрин, динотефуран, диофенолан, эмаектин, эндосульфат, эсфенвалерат, этипрол, этофенпрокс, этоксазол, фенотиокарб, феноксикарб, фенвалерат, фипронил, флониамид, флубендиамид, флуфеноксурон, флувалинат, форметанат, фостиазат, гексафлумурон, гидраметилнон, имидаклоприд, индоксакарб, люфенурон, метафлумизон, метиокарб, метомил, метопрен, метоксифенозид, нитенпирам, нитиазин, новалурон, оксамил, пиметрозин, пиретрин, пиридабен, пиридалил, пирипроксифен, рианодин, спинеторам, спиносид, спиродиклофен, спиромезифен, спиротетрамат, сульфоксафлор, тебуфенозид, тетраметрин, тиаклоприд, тиаметоксам, тиодикарб, тиосультап-натрия, тралометрин, триазамат, трифлумурон, дельта-эндотоксины *Bacillus thuringiensis*, все штаммы *Bacillus thuringiensis* и все штаммы вирусов ядерного полиэдрома.

Фунгициды, с которыми можно формулировать соединения формулы 1 для обеспечения смесей, пригодных в 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, пиракlostробин, седаксан, силтиофам, тебуконазол, тиабендазол, тиофанат-метил, тирам, трифлуксистробин и тритиконазол.

Композиции, содержащие соединения формулы 1, пригодные для обработки семян, дополнительно включают бактерии и грибы, которые обладают способностью обеспечивать защиту от вредного воздействия патогенных грибов растений или бактерий и/или животных, переносимых почвой, таких как нематоды. Бактерии, проявляющие нематодцидные свойства, могут включать, но не ограничиваются, *Bacillus firmus*, *Bacillus cereus*, *Bacillus subtilis* и *Pasteuria Penetrans*. Пригодный штамм *Bacillus firmus*

представляет собой штамм CNCM I-1582 (GB-126), который является коммерчески доступными как BioNem<sup>TM</sup>. Пригодный штамм *Bacillus cereus* представляет собой штамм NCMM I-1592. Оба штамма *Bacillus* описаны в US 6406690. Другими подходящие бактерии, проявляющие нематическую активность, являются *B. amyloliquefaciens* IN937a и штамм GB03 *B. subtilis*. Бактерии, проявляющие фунгицидные свойства, могут включать, но не ограничиваются, штамм GB34 *B. pumilus*. Виды грибов, проявляющие нематическую активность, могут включать, но не ограничиваются, *Myrothecium verrucaria*, *Raecilomyces lilacinus* и *Purpureocillium lilacinum*.

Обработка семян может также включать один или несколько нематических агентов природного происхождения, таких как белок-элиситор, называемый гарпином, который выделен из определенных бактериальных патогенов растений, таких как *Erwinia amylovora*. Пример представляет собой технологию обработки семян Harpin-N-Tek, доступную как N-Hibit<sup>TM</sup> Gold CST.

Обработка семян может также включать один или несколько видов клубеньковых бактерий корней бобовых, такие как микросимбиотические азотфиксирующие бактерии *Bradyrhizobium japonicum*. Данные инокулянты могут необязательно содержать один или несколько липохитоолигосахаридов (LCO), которые являются факторами клубеньков (Nod), продуцируемыми клубеньковыми бактериями во время инициации образования клубеньков на корнях бобовых. Например, технология обработки семян под торговой маркой Optimize<sup>®</sup> включает технологию LCO Promoter Technology<sup>TM</sup> в сочетании с инокулянтом.

Обработка семян может также включать один или несколько изофлавонов, которые могут увеличивать уровень колонизации корней микоризными грибами. Микоризные грибы улучшают рост растений, увеличивая поглощение корнями питательных веществ, таких как вода, сульфаты, нитраты, фосфаты и металлы. Примеры изофлавонов включают, но не ограничиваются, генистеин, биоханин А, формонетин, даидзеин, глицитеин, гесперетин, нарингенин и пратенсеин. Формонетин доступен в качестве активного ингредиента в микоризных инокулянтах, таких как PNC Colonize<sup>®</sup> AG.

Обработка семян может также включать один или несколько активаторов растений, которые вызывают системную приобретенную устойчивость у растений после контакта с патогеном. Примером активатора растений, который индуцирует данные защитные механизмы, является ацибензолар-S-метил.

Обработанные семена обычно содержат соединение настоящего изобретения в количестве от приблизительно 0,1 г- 1 кг на 100 кг семян (т.е., от приблизительно 0,0001 до 1% по весу семян до обработки). Текучая суспензия, сформулированная для обработки семян, обычно содержит от приблизительно 0,5 до приблизительно 70% активного ингредиента, от приблизительно 0,5 до приблизительно 30% пленкообразующего адгезива, от приблизительно 0,5 до приблизительно 20% диспергирующего агента, 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 разбавителя.

Соединения настоящего изобретения можно вводить в композицию для приманки, которая потребляется беспозвоночным вредителем или применять в устройстве, таком как ловушка, приманочная станция и подобных. Данная композиция для приманки может представлять собой гранулы, которые содержат (а) активный ингредиент, а именно биологически эффективное количество соединения формулы 1, его N-оксида или соли; (b) один или несколько пищевых материалов; необязательно (с) аттрактант, и необязательно (d) один или несколько увлажнителей. Следует отметить гранулы или композиции для приманки, которые содержат приблизительно 0,001-5% активных ингредиентов, приблизительно 40-99% пищевого материала и/или аттрактанта; и необязательно приблизительно 0,05-10% увлажнителей, которые эффективны для борьбы с почвенными беспозвоночными вредителями при очень низких дозах внесения, особенно при дозах активного ингредиента, которые являются смертельными при проглатывании, а не при прямом контакте. Некоторые пищевые материалы могут функционировать как источник пищи и как аттрактант. Пищевые материалы включают углеводы, белки и липиды. Примерами пищевых материалов являются овощи, мука, сахар, крахмалы, животный жир, растительное масло, дрожжевые экстракты и сухое молоко. Примерами аттрактантов являются отдушки и ароматизаторы, такие как экстракты фруктов или растений, ароматизирующие вещества или другие компоненты животного или растительного происхождения, феромоны или другие агенты, которые, как известно, привлекают целевого беспозвоночного вредителя. Примерами увлажнителей, т.е., влагоудерживающих агентов, являются гликоли и другие полиолы, глицерин и сорбит. Следует отметить композицию для приманки (и способ применения данной 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 беспозвоночными вредителями может содержать настоящую композицию для приманки и корпус, адаптированный для приема композиции для приманки, где корпус имеет, по меньшей мере, одно отверстие размером, позволяющим беспозвоночному вредителю проходить через отверстие, так что беспозвоночный вредитель может получить доступ к композиции для приманки из местоположения за пределами корпуса, и, где корпус дополнительно приспособлен для размещения в или вблизи места потенциальной или известной активности беспозвоночного вредителя.

Соединения настоящего изобретения можно применять без других адьювантов, но чаще всего применяют состав, содержащий один или несколько активных ингредиентов с подходящими носителями, разбавителями, поверхностно-активными соединениями и, возможно, в сочетании с пищей в зависимости от предполагаемого конечного применения. Один из способов применения включает распыление водной дисперсии или раствора очищенного масла соединения настоящего изобретения. Комбинации с маслами для распыления, концентрированными маслами для распыления, адгезивами, адьювантами, другими растворителями и пиперонилбутоксидом часто повышают

эффективность соединения. Для неагрономических применений данные спреи можно наносить из контейнеров для распыления, таких как банка, бутылка или другой контейнер, либо с помощью насоса, либо путем высвобождения его из контейнера под давлением, например, из баллончика с аэрозолем под давлением. Данные композиции в виде спрея могут принимать различные формы, например, спреи, туманы, пены, пары или туман. Таким образом, данные композиции для распыления могут дополнительно содержать пропелленты, пенообразующие агенты и т.д., в зависимости от обстоятельств. Следует отметить композицию для распыления, содержащую биологически эффективное количество соединения или его композицию настоящего изобретения и носитель. Один вариант осуществления данной композиции для распыления содержит биологически эффективное количество соединения или композицию настоящего изобретения и пропеллент. Репрезентативные пропелленты включают, но не ограничиваются, метан, этан, пропан, бутан, изобутан, бутен, пентан, изопентан, неопентан, пентен, гидрофторуглероды, хлорфторуглероды, диметиловый эфир и смеси вышеперечисленных. Следует отметить композицию для распыления (и способ применения данной композиции для распыления, распыляемой из контейнера для распыления), применяемую, по меньшей мере, для борьбы с одним беспозвоночным вредителем, выбранным из группы, состоящей из комаров, мошек, настоящих мух, оленьих мух, слепней, ос, настоящих ос, шершней, клещей, пауков, муравьев, мошек и подобных, включая отдельно или в комбинациях.

Один вариант осуществления настоящего изобретения относится к способу борьбы с беспозвоночными вредителями, включающему разбавление пестицидной композиции настоящего изобретения (соединения формулы 1, сформулированного с поверхностно-активными соединениями, твердыми разбавителями и жидкими разбавителями, или сформулированная смесь соединения формулы 1 и, по меньшей мере, еще одного пестицида) водой, и необязательно добавление адьюванта, получая разбавленную композицию, контакт беспозвоночного вредителя или его окружающей среды с эффективным количеством указанной разбавленной композицией.

Хотя композиция для распыления, образованная разбавлением водой достаточной концентрации настоящей пестицидной композиции может обеспечить достаточную эффективность для борьбы с беспозвоночными вредителями, отдельно сформулированные адьювантные продукты также можно добавлять к смесям для распылительного прибора. Данные дополнительные адьюванты обычно известны как «адьюванты для распыления» или «адьюванты для баковых смесей» и включают любое вещество, смешанное в распылительном приборе для улучшения характеристик пестицида или изменения физических свойств смеси для распыления. Адьюванты могут быть поверхностно-активными соединениями, эмульгирующими агентами, растительными маслами на нефтяной основе, растительными маслами семян растений, подкислителями, буферами, загустителями или пеноподавляющими агентами. Адьюванты применяют для повышения эффективности (например, биологической доступности, адгезии, проникновения, однородности покрытия и долговечности защиты) или для минимизации или устранения

проблем с нанесением распылением, связанных с несовместимостью, пенообразованием, сносом, испарением, улетучиванием и разложением. Для достижения оптимальных характеристик адъюванты выбирают с учетом свойств активного ингредиента, состава и мишени (например, сельскохозяйственных культур, насекомых-вредителей).

Среди адъювантов для распыления масла, включая растительные масла, концентраты растительных масел, концентраты растительных масел и концентраты метилированных растительных масел, наиболее часто применяют для повышения эффективности пестицидов, возможно, посредством стимулирования более равномерных и однородных отложений при распылении. В ситуациях, когда фитотоксичность, потенциально вызываемая маслами или другими несмешивающимися с водой жидкостями, является проблемой, композиция для распыления, полученная из композиции настоящего изобретения, обычно не будет содержать адъювантов на масляной основе для распыления. Однако в ситуациях, когда фитотоксичность, вызываемая адъювантами на масляной основе для распыления, коммерчески не значима, композиция для распыления, полученная из композиции настоящего изобретения, также может содержать адъюванты на масляной основе для распыления, которые потенциально могут дополнительно улучшить борьбу с беспозвоночными вредителями, а также стойкость к дождю.

Продукты, обозначенные как «растительные масла», обычно содержат от 95 до 98% парафина нефтяного масла на основе нефтепродуктов и от 1 до 2% одного или более поверхностно-активных соединений, действующих как эмульгаторы. Продукты, обозначенные как «концентраты растительных масел», обычно состоят из 80-85% эмульгируемого масла на нефтяной основе и 15-20% неионных поверхностно-активных соединений. Продукты, правильно определяемые как «концентраты растительных масел», обычно состоят из 80-85% растительного масла (т.е. масла семян или фруктов, чаще всего хлопкового, льняного, соевого или подсолнечного) и от 15 до 20% неионных поверхностно-активных соединений. Характеристики адъюванта можно улучшить, заменив растительное масло метиловыми эфирами жирных кислот, которые обычно получают из растительных масел. Примеры концентратов метиловых масел семян включают концентрат MSO<sup>®</sup> (UAP-Loveland Products, Inc.) и Premium MSO метилированное масло для распыления (Helena Chemical Company).

Количество адъювантов, добавляемых к смесям для распыления, обычно не превышает приблизительно 2,5% по объему, и чаще всего это количество составляет приблизительно от 0,1 до приблизительно 1% по объему. Нормы расхода адъювантов, добавляемых к смесям для распыления, обычно составляют приблизительно от 1 до 5 л на гектар. Типичные примеры аэрозольных адъювантов включают: Adigor<sup>®</sup> (Syngenta) 47% метилированное рапсовое масло в жидком углеводороде, Silwet<sup>®</sup> (Helena Chemical Company), модифицированный полиалкиленоксидом гептаметилтрисилоксан и Assist<sup>®</sup> (BASF), 17% смесь поверхностно-активных соединений в 83% минеральном парафиновом масле.

Следующие тесты демонстрируют эффективность борьбы соединениями настоящего изобретения с конкретными вредителями. «Эффективность борьбы» представляет собой ингибирование развития беспозвоночного вредителя (включая смертность), что приводит к значительному снижению питания. Однако защита от вредителей, обеспечиваемая соединениями, не ограничивается данными видами. Смори индексные таблицы A-D для описания соединений.

## БИОЛОГИЧЕСКИЕ ПРИМЕРЫ НАСТОЯЩЕГО ИЗОБРЕТЕНИЯ

### Состав и способ распыления для тестов A-H

Тестируемые соединения формулировали, применяя раствор, содержащий 10% ацетона, 90% воды и 300 ppm Activator 90® неионного поверхностно-активного соединения (Loveland Products, Loveland, Colorado, USA). Сформулированные соединения наносили в 1 мл жидкости через распыляющий наконечник, расположенный на 1,27 см (0,5 дюйма) над каждой испытательной установкой. Тестируемые соединения распыляли при указанных скоростях, и каждый тест повторяли три раза.

#### Тест А

Для оценки борьбы с капустной молью (*Plutella xylostella* (L.)) испытательная установка состояла из небольшого открытого контейнера с 12-14-дневным растением горчицы внутри. Она была предварительно заражена ~50 новорожденными личинками, которые были помещены в испытательную установку через крупку из кукурузных початков, применяя инокулятор. Личинки перемещались на тестируемое растение после того, как были помещены в испытательную установку.

Тестируемые соединения формулировали и распыляли при 250 и/или 50 ppm. После распыления сформулированного тестового соединения, каждую испытательную установку сушили в течение 1 часа и затем сверху надевали черную сетчатую крышку. Испытательные установки выдерживали в течение 6 дней в камере для выращивания при 25°C и 70% относительной влажности. Затем визуально оценивали повреждение растений, вызванное поеданием листы, и личинок оценивали на смертность.

Из соединений формулы **1**, тестируемых при 250 ppm, следующие обеспечивали от очень хорошего до отличного уровня эффективности борьбы (40% или меньше повреждение в результате поедания и/или 100% смертность): 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 28, 29, 31, 33, 34, 35, 36, 37, 38, 39, 40, 41, 42, 43, 44, 45, 46, 47, 48, 49, 50, 52, 53, 54, 55, 56, 57, 59, 60, 62, 63, 64, 92, 120, 121, 122, 123, 124, 125, 133, 134, 137, 138, 139, 142, 144, 145, 146, 147, 148, 149, 150, 153, 154, 155, 156, 157, 160, 161, 162, 187, 188, 189, 190, 191, 192, 193, 194, 199, 200, 201, 236, 237, и 238.

Из соединений формулы **1**, тестируемых при 50 ppm, следующие обеспечивали от очень хорошего до отличного уровня эффективности борьбы (40% или меньше повреждение в результате поедания и/или 100% смертность): 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 28, 29, 33, 34, 35, 36, 37, 38, 39, 40, 41, 42, 43, 44, 45, 47, 48, 49, 50, 52, 53, 54, 55, 56, 57, 59, 60, 62, 64, 65, 66, 67, 68, 69, 70, 71,

72, 73, 74, 75, 76, 77, 78, 79, 80, 81, 82, 83, 84, 85, 86, 87, 88, 91, 92, 93, 94, 95, 96, 97, 98, 99, 100, 101, 102, 103, 104, 105, 106, 107, 108, 109, 110, 111, 112, 115, 116, 117, 118, 119, 120, 121, 125, 126, 127, 128, 129, 130, 132, 133, 137, 138, 139, 140, 141, 142, 143, 144, 145, 146, 147, 148, 149, 150, 151, 152, 153, 154, 155, 160, 162, 164, 165, 166, 167, 171, 172, 173, 174, 175, 176, 177, 178, 180, 181, 182, 183, 184, 186, 187, 188, 189, 190, 191, 192, 193, 194, 195, 196, 197, 198, 200, 201, 202, 203, 206, 207, 208, 209, 210, 211, 212, 213, 214, 215, 232, 233, 234, 237, и 238.

#### Тест В

Для оценки борьбы с совкой трояной (*Spodoptera frugiperda* (J.E. Smith)) испытательная установка состояла из небольшого открытого контейнера с 4-5-дневным растением кукурузы (маиса) внутри. Она была предварительно заражена 10-15 однодневными личинками на куске пищи для насекомых.

Тестируемые соединения формулировали и распыляли при 250 и/или 50 ppm. После распыления сформулированного тестового соединения, испытательные установки выдерживали в камере для выращивания в течение 6 дней при 25°C и 70% относительной влажности. Затем визуально оценивали повреждение растений, вызванное поеданием листвы, и личинок оценивали на смертность.

Из соединений формулы **1**, тестируемых при 250 ppm, следующие обеспечивали от очень хорошего до отличного уровня эффективности борьбы (40% или меньше повреждение в результате поедания и/или 100% смертность): 1, 3, 4, 7, 8, 9, 10, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 28, 29, 33, 34, 35, 36, 37, 38, 39, 40, 41, 42, 43, 44, 47, 49, 50, 52, 53, 54, 55, 56, 57, 59, 60, 62, 64, 92, 120, 121, 122, 123, 124, 125, 133, 138, 139, 142, 144, 145, 147, 148, 149, 150, 153, 154, 155, 156, 157, 160, 161, 162, 187, 188, 189, 190, 191, 192, 193, 194, 199, 200 и 201.

Из соединений формулы **1**, тестируемых при 50 ppm, следующие обеспечивали от очень хорошего до отличного уровня эффективности борьбы (40% или меньше повреждение в результате поедания и/или 100% смертность): 3, 4, 9, 15, 16, 19, 20, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 28, 29, 33, 34, 35, 36, 37, 38, 39, 40, 41, 42, 43, 44, 47, 48, 49, 50, 52, 53, 54, 55, 56, 57, 59, 62, 64, 65, 66, 71, 72, 75, 76, 77, 78, 79, 80, 83, 84, 85, 86, 87, 91, 92, 95, 96, 97, 98, 99, 100, 101, 102, 103, 104, 106, 109, 115, 116, 117, 118, 119, 120, 121, 122, 123, 125, 126, 127, 128, 129, 130, 132, 133, 138, 140, 143, 145, 147, 148, 149, 150, 151, 152, 153, 154, 162, 164, 165, 166, 167, 168, 169, 170, 171, 172, 173, 174, 175, 176, 177, 178, 179, 180, 181, 185, 186, 187, 188, 190, 191, 192, 193, 194, 196, 197, 198, 200, 201, 202, 203, 206, 207, 208, 209, 210, 211, 212, 213, 214, 215, 233, 239 и 240.

#### Тест С

Для оценки борьбы с кукурузной цикадкой (*Peregrinus maidis* (Ashmead)) посредством контактного и/или системного способов, испытательная установка состояла из небольшого открытого контейнера с 3-4-дневным растением кукурузы (маиса) внутри. Белый песок добавляли к поверхности почвы перед нанесением испытуемого соединения.

Тестируемые соединения формулировали и распыляли при 250 и/или 50 ppm.

После распыления сформулированного тестового соединения, испытательные установки сушили в течение 1 ч перед тем, как они были заражены ~15-20 нимфами (в возрасте от 18 до 21 дня). На каждую испытательную установку помещали черную сетчатую крышку, и испытательные установки выдерживали в течение 6 дней в камере для выращивания при 22-24°C и 50-70% относительной влажности. Каждую испытательную установку затем визуально оценивали на смертность насекомых.

Из соединений формулы **1**, тестируемых при 250 ppm, следующие приводили в результате к, по меньшей мере, 80% смертности: 59, 153, 154, 187.

#### Тест D

Для оценки борьбы с цикадкой картофельная (*Empoasca fabae* (Harris)) посредством контактного и/или системного способов, испытательная установка состояла из небольшого открытого контейнера с 5-6-дневным растением солнечных бобов (появились первичные листья) внутри. Белый песок добавляли к верхнему слою почвы, и один из первичных листьев удаляли перед применением тестируемого соединения.

Тестируемые соединения формулировали и распыляли при 250 и/или 50 ppm. После распыления сформулированного тестового соединения, испытательные установки сушили в течение 1 часа перед тем, как их постинфицировали 5 картофельными цикадками (взрослые особи в возрасте от 18 до 21 дня). На испытательную установку помещали черную сетчатую крышку, и испытательные установки выдерживали в течение 6 дней в камере для выращивания при 20°C и 70% относительной влажности. Каждую испытательную установку затем визуально оценивали на смертность насекомых.

Из соединений формулы **1**, тестируемых при 250 ppm, следующие приводили в результате к, по меньшей мере, 80% смертности: 3, 4, 6, 7, 8, 10, 11, 14, 15, 19, 23, 25, 26, 27, 28, 29, 33, 34, 35, 36, 37, 38, 39, 40, 42, 43, 44, 47, 48, 49, 50, 53, 54, 55, 56, 57, 59, 60, 62, 120, 121, 133, 138, 139, 142, 147, 149, 153, 154, 157, 160, 161, 162, 188, and, 190.

Из соединений формулы **1**, тестируемых при 50 ppm, следующие приводили в результате к, по меньшей мере, 80% смертности: 3, 4, 6, 7, 8, 19, 23, 25, 27, 34, 35, 36, 37, 38, 39, 40, 42, 43, 47, 48, 50, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 59, 60, 61, 62, 75, 76, 77, 78, 79, 80, 83, 86, 87, 91, 96, 101, 103, 104, 106, 115, 116, 117, 118, 119, 120, 129, 130, 132, 133, 138, 140, 147, 149, 151, 152, 153, 154, 162, 164, 165, 166, 167, 168, 169, 170, 171, 172, 173, 174, 175, 176, 177, 178, 186, 188, и 233.

#### Тест E

Для оценки борьбы с зеленой персиковой тлей (*Myzus persicae* (Sulzer)) посредством контактного и/или системного способов, испытательная установка состояла из небольшого открытого контейнера с 12-15-дневным растением редьки внутри. Его предварительно заражали, помещая на лист испытываемого растения 30-40 афидов на кусок листа, вырезанный из культурного растения (способ срезанных листьев). Афиды перемещались на тестируемое растение по мере высыхания части листа. После предварительного заражения почву испытательной установки засыпали слоем песка.

Тестируемые соединения формулировали и распыляли при 250 и/или 50 ppm.



После распыления сформулированного тестового соединения, каждую испытательную установку сушили в течение 1 часа и затем сверху надевали черную сетчатую крышку. Испытательные установки выдерживали в течение 6 дней в камере для выращивания при 19-21°C и 50-70% относительной влажности. Каждую испытательную установку затем визуально оценивали на смертность насекомых.

Из соединений формулы **1**, тестируемых при 250 ppm, следующие приводили в результате к, по меньшей мере, 80% смертности: 3, 4, 6, 7, 8, 9, 10, 14, 15, 16, 19, 25, 26, 27, 34, 35, 36, 37, 38, 39, 40, 42, 43, 44, 47, 50, 53, 54, 55, 56, 57, 59, 60, 62, 92, 120, 133, 138, 139, 142, 147, 148, 153, 154, 155, 162, 187, 188, 191, 192, и 200.

Из соединений формулы **1**, тестируемых при 50 ppm, следующие приводили в результате к, по меньшей мере, 80% смертности: 3, 4, 6, 7, 8, 10, 14, 16, 19, 25, 26, 27, 34, 35, 36, 37, 38, 39, 40, 42, 43, 44, 50, 54, 55, 56, 57, 58, 59, 61, 62, 71, 75, 77, 78, 80, 83, 91, 92, 96, 99, 100, 103, 104, 106, 109, 110, 111, 112, 120, 129, 130, 131, 132, 138, 139, 142, 147, 148, 152, 153, 154, 155, 162, 165, 166, 169, 170, 171, 172, 173, 174, 175, 177, 186, 187, 188, 195, 196, 197, 198, 202, 206, 207, 208, 212, 214, 232, 233, и 234.

#### Тест F

Для оценки борьбы с хлопковой бахчевой тлей (*Aphis gossypii* (Glover)) посредством контактного и/или системного способов, испытательная установка состояла из небольшого открытого контейнера с 5-дневным растением бамии внутри. Ее предварительно заражали 30-40 насекомыми на листе по способу срезанного листа, а почву испытательной установки засыпали слоем песка.

Тестируемые соединения формулировали и распыляли при 250 и/или 50 ppm. После распыления, испытательные установки содержали в камере для выращивания в течение 6 дней при 19°C и 70% относительной влажности. Каждую испытательную установку затем визуально оценивали на смертность насекомых.

Из соединений формулы **1**, тестируемых при 250 ppm, следующие приводили в результате к, по меньшей мере, 80% смертности: 3, 4, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 14, 15, 16, 19, 25, 26, 27, 28, 34, 35, 36, 37, 38, 39, 40, 41, 42, 43, 44, 47, 48, 49, 50, 52, 53, 54, 55, 56, 57, 59, 60, 62, 120, 133, 138, 139, 142, 147, 148, 149, 153, 154, 155, 162, 187, 188, 189, 190, 192, 194, 200, и 201.

Из соединений формулы **1**, тестируемых при 50 ppm, следующие приводили в результате к, по меньшей мере, 80% смертности: 3, 4, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 14, 19, 25, 26, 27, 34, 35, 36, 37, 38, 39, 40, 42, 43, 44, 47, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 59, 60, 61, 62, 71, 75, 76, 77, 78, 79, 83, 91, 92, 96, 99, 100, 101, 104, 106, 108, 111, 112, 129, 130, 131, 132, 133, 138, 139, 147, 148, 151, 152, 153, 154, 162, 165, 166, 169, 170, 171, 172, 174, 175, 177, 178, 181, 186, 187, 188, 194, 195, 196, 197, 198, 202, 207, 211, 214, 232, 233, и 234.

#### Тест G

Для оценки борьбы с белокрылкой батата (*Bemisia tabaci* (Gennadius)) посредством контактного и/или системного способов, испытательная установка состояла из небольшого открытого контейнера с 12-14-дневным хлопчатником или 7-9-дневным

растением сои внутри. Перед опрыскиванием обе семядоли удаляли из растения, оставляя один настоящий лист для анализа. Взрослые белокрылки откладывали яйца на растение, и затем их удаляли из испытательной установки. Растения хлопка или сои, зараженные, по меньшей мере, 15 яйцами, подвергали испытанию на опрыскивание.

Тестируемые соединения формулировали и распыляли при 250 и/или 50 ppm. После распыления, испытательные установки сушили в течение 1 часа. Затем цилиндры удаляли, и установки помещали в камеру для выращивания и выдерживали в течение 13 дней при 28°C и 50-70% относительной влажности. каждую испытательную установку затем визуально оценивали на смертность насекомых.

Из соединений формулы **1**, тестируемых при 250 ppm, следующие приводили в результате к, по меньшей мере, 70% смертности: 3, 4, 14, 19, 25, 26, 27, 34, 35, 36, 38, 39, 40, 42, 43, 44, 50, 62, 75, 77, 79, 91, 96, 104, 106, 118, 120, 129, 139, 147, 148, 151, 152, 153, 173, и 174.

Из соединений формулы **1**, тестируемых при 50 ppm, следующие приводили в результате к, по меньшей мере, 70% смертности: 3, 10, 19, 25, 26, 27, 36, 38, 39, 42, 43, 50, 77, 78, 91, 104, 106, 129, 147, 148, 152, и 153.

#### Тест Н

Для оценки борьбы с западными цветочными трипсами (*Frankliniella occidentalis* (Pergande)) посредством контактного и/или системного способов, испытательная установка состояла из небольшого открытого контейнера с 5-7-дневным растением солнечных бобов внутри.

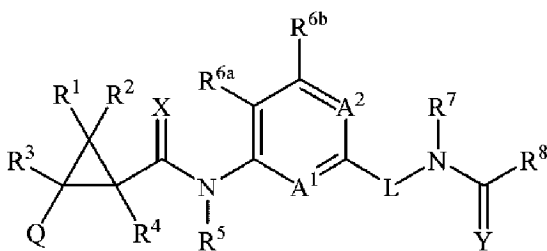
Тестируемые соединения формулировали и распыляли при 250 и/или 50 ppm. После распыления, испытательные установки сушили в течение 1 часа, и затем приблизительно 60 трипсов (взрослых особей и нимф) помещали в каждую установку. Сверху помещали черную сетчатую крышку, и испытательные установки выдерживали в течение 6 дней при 25°C и 45-55% относительной влажности. Каждую испытательную установку затем визуально оценивали на повреждение растения и смертность насекомых.

Из соединений формулы **1**, тестируемых при 250 ppm, следующие обеспечивали от очень хорошего до отличного уровня эффективности борьбы (30% или меньше повреждение растения и/или 100% смертность): 3, 4, 6, 8, 9, 10, 12, 25, 26, 27, 34, 35, 36, 38, 43, 49, 62, 76, 77, 78, 91, 96, 102, 104, 106, 109, 111, 116, 118, 119, 129, 133, 138, 146, 148, 151, 153, 155, 161, 162, 166, 169, 171, 172, 173, 174, 175, 177, 178, 179, 181, 182, 183, 184, 185, 187, 219, 237 и 238.

Из соединений формулы **1**, тестируемых при 50 ppm, следующие обеспечивали от очень хорошего до отличного уровня эффективности борьбы (30% или меньше повреждение растения и/или 100% смертность): 3, 4, 6, 8, 26, 27, 34, 35, 36, 43, 49, 62, 75, 104, 106, 116, 118, 129, 138, 148, 153, 162, 169, 171, 172, 177, 181 и 185.

### ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Соединение, выбранное из формулы **1**, его N-оксиды и соли,



**1**

где

R1 представляет собой H, F, Cl, Br, I, CH<sub>3</sub> или CF<sub>3</sub>;

R2 представляет собой F, Cl, Br, I, CH<sub>3</sub> или CF<sub>3</sub>;

каждый R3 и R4 независимо представляет собой H или C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> алкил;

Q представляет собой фенил, тиофенил, фуранил, пиридинил или нафталинил, причем каждый является незамещенным или замещенным 1-3 R<sub>10</sub>;

X представляет собой O или S;

Y представляет собой O или S;

R5 представляет собой H, C(O)OR<sup>11</sup>, C(O)NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>, C(O)R<sup>14</sup> или S(O)<sub>n</sub>R<sup>15</sup>; или C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкил, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкенил или C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкинил, причем каждый является незамещенным или замещенным, по меньшей мере, одним R<sup>x</sup>;

A1 представляет собой CR<sup>9a</sup> или N;

A2 представляет собой CR<sup>9b</sup> или N;

R6a представляет собой H, галоген, циано, нитро, C(O)OR<sup>11</sup>, C(O)NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>, C(O)R<sup>14</sup>, NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>, OR<sup>16</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>15</sup> или SO<sub>2</sub>NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>; или C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкил, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкенил, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкинил, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub> циклоалкил или C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> циклоалкилалкил, причем каждый является незамещенным или замещенным, по меньшей мере, одним R<sup>x</sup>;

R6b представляет собой H, галоген, циано, нитро, C(O)OR<sup>11</sup>, C(O)NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>, C(O)R<sup>14</sup>, NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>, OR<sup>16</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>15</sup> или SO<sub>2</sub>NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>; или C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкил, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкенил, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкинил, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub> циклоалкил или C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> циклоалкилалкил, причем каждый является незамещенным или замещенным, по меньшей мере, одним R<sup>x</sup>;

L представляет собой C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> алкиленил, незамещенный или замещенный 1 или 2 C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> алкилами;

R7 представляет собой H, C(O)OR<sup>11</sup>, C(O)NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>, C(O)R<sup>14</sup> или S(O)<sub>n</sub>R<sup>15</sup>; или C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкил, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкенил или C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкинил, причем каждый является незамещенным или замещенным, по меньшей мере, одним R<sup>x</sup>;

R8 представляет собой H, NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>, OR<sup>16</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>15</sup> или SO<sub>2</sub>NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>; или C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкил, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкенил, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкинил, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub> циклоалкил или C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> циклоалкилалкил, причем каждый является незамещенным или замещенным, по меньшей мере, одним R<sup>x</sup>; или фенил, 5- или 6-членное гетероциклическое ароматическое кольцо или 3-7-членное

гетероциклическое неароматическое кольцо, причем каждое кольцо содержит кольцевые атомы, выбранные из атомов углерода и вплоть до 2 гетероатомов, независимо выбранных из одного атома кислорода, одного атома серы, и вплоть до 2 атомов азота, где вплоть до 2 кольцевых члена, являющихся атомами углерода, независимо выбраны из C(=O) и C(=S), и кольцевой член, являющийся атомом серы, выбран из S, S(O) или S(O)<sub>2</sub>, причем кольцо является незамещенным или замещенным, по меньшей мере, одним заместителем, независимо выбранным из группы, состоящей из галогена, циано, нитро, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкила, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилтио, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилтио, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилсульфинила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилсульфинила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилсульфонила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилсульфонила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилкарбонила или C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкоксикарбонила;

каждый R<sup>x</sup> независимо представляет собой галоген, циано, нитро, гидроксид, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> галогеналкил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкил, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> галогеналкокси, C(O)OR<sup>11</sup>, C(O)NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>, NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>, C(O)R<sup>14</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>15</sup> или SO<sub>2</sub>NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>;

R<sup>9a</sup> представляет собой H, галоген, циано, нитро, C(O)OR<sup>11</sup>, C(O)NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>, C(O)R<sup>14</sup>, NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>, OR<sup>16</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>15</sup> или SO<sub>2</sub>NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>; или C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкил, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкенил, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкинил, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub> циклоалкил или C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> циклоалкилалкил, причем каждый является незамещенным или замещенным, по меньшей мере, одним R<sup>x</sup>;

R<sup>9b</sup> представляет собой H, галоген, циано, нитро, C(O)OR<sup>11</sup>, C(O)NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>, C(O)R<sup>14</sup>, NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>, OR<sup>16</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>15</sup> или SO<sub>2</sub>NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>; или C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкил, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкенил, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкинил, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub> циклоалкил или C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> циклоалкилалкил, причем каждый является незамещенным или замещенным, по меньшей мере, одним R<sup>x</sup>;

каждый R<sup>10</sup> независимо представляет собой галоген, циано, нитро, C(O)OR<sup>11</sup>, C(O)NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>, C(O)R<sup>14</sup>, NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>, OR<sup>16</sup>, S(O)<sub>n</sub>R<sup>15</sup> или SO<sub>2</sub>NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>; или C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкил, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкенил, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> алкинил, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub> циклоалкил или C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub> циклоалкилалкил, причем каждый является незамещенным или замещенным, по меньшей мере, одним R<sup>x</sup>; и где два R<sup>10</sup> соединены с соседними атомами углерода, причем указанные два R<sup>10</sup> можно взять вместе с атомами углерода, с которыми они соединены, получая 3-7-членное кольцо, содержащее кольцевые члены, выбранные из атомов углерода и вплоть до 2 гетероатомов, независимо выбранных из двух атомов кислорода, одного атома серы, и вплоть до 2 атомов азота, где вплоть до 2 кольцевых члена, являющихся атомами углерода, независимо выбраны из C(=O) и C(=S), и кольцевой член, являющийся атомом серы, выбран из S, S(O) или S(O)<sub>2</sub>, причем кольцо является незамещенным или замещенным, по меньшей мере, одним заместителем, независимо выбранным из группы, состоящей из галогена, циано, нитро, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкила, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкокси и C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкокси;

каждый R<sup>11</sup> независимо представляет собой C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкил или C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> галогенциклоалкил; или фенил, незамещенный или замещенный, по меньшей мере, одним заместителем, независимо выбранным из группы, состоящей из галогена, циано, нитро, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкила, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>

алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилтио, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилтио, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилсульфинила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилсульфинила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилсульфонила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилсульфонила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилкарбонила или C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкоксикарбонила;

каждый R<sup>12</sup> независимо представляет собой H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкил, C(O)R<sup>17</sup> или S(O)2R<sup>17</sup>; или фенил или 5- или 6-членное гетероциклическое ароматическое кольцо, причем каждый является незамещенным или замещенным, по меньшей мере, одним заместителем, независимо выбранным из группы, состоящей из галогена, циано, нитро, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкила, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилтио, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилтио, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилсульфинила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилсульфинила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилсульфонила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилсульфонила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилкарбонила или C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкоксикарбонила;

каждый R<sup>13</sup> независимо представляет собой H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкил или C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкил; или

R<sup>12</sup> и R<sup>13</sup> берут вместе с атомом азота, с которой они соединены, образуя 3-7-членное кольцо, содержащее кольцевые члены, выбранные и атомов углерода и вплоть до 2 гетероатомов, независимо выбранных из одного атома кислорода, одного атома серы, и вплоть до 2 атомов азота, где вплоть до 2 кольцевых члена, являющихся атомами углерода, независимо выбраны из C(=O) и C(=S), и кольцевой член, являющийся атомом серы, выбран из S, S(O) или S(O)<sub>2</sub>, причем кольцо является незамещенным или замещенным, по меньшей мере, одним заместителем, независимо выбранных из группы, состоящей из галогена, циано, нитро, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкила, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилтио, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилтио, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилсульфинила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилсульфинила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилсульфонила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилсульфонила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилкарбонила или C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкоксикарбонила;

каждый R<sup>14</sup> независимо представляет собой C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкил или C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> галогенциклоалкил; или фенил, незамещенный или замещенный, по меньшей мере, одним заместителем, независимо выбранным из группы, состоящей из галогена, циано, нитро, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкила, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилтио, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилтио, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилсульфинила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилсульфинила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилсульфонила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилсульфонила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилкарбонила или C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкоксикарбонила;

каждый R<sup>15</sup> независимо представляет собой C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкил или C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> галогенциклоалкил; или фенил, незамещенный или замещенный, по меньшей мере, одним заместителем, независимо выбранным из группы, состоящей из галогена, циано, нитро, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкила, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилтио, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилтио, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилсульфинила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилсульфинила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилсульфонила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилсульфонила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилкарбонила или C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкоксикарбонила;

каждый R<sup>16</sup> независимо представляет собой C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>

циклоалкил или C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> галогенциклоалкил; или фенил, незамещенный или замещенный, по меньшей мере, одним заместителем, независимо выбранным из группы, состоящей из галогена, циано, нитро, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкила, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилтио, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилтио, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилсульфинила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилсульфинила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилсульфонила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкилсульфонила, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкилкарбонила или C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкоксикарбонила;

каждый R<sup>17</sup> независимо представляет собой C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> галогеналкил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> циклоалкил или C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> галогенциклоалкил; и

каждый n независимо представляет собой 0, 1 или 2.

2. Соединение по п. 1, где:

R3 и R4 представляют собой H;

X и Y представляют собой O;

R5 представляет собой H; и

R7 представляет собой H.

3. Соединение по п. 1 или 2, где:

R1 представляет собой F, Cl или Br;

R2 представляет собой F, Cl или Br;

Q представляет собой фенил, незамещенный или замещенный 1-3 R<sup>10</sup>;

A1 представляет собой CR<sup>9a</sup>;

A2 представляет собой CR<sup>9b</sup>;

R6a представляет собой H;

R6b представляет собой H;

R9a представляет собой H или галоген; и

R9b представляет собой галоген, циано или C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкил.

4. Соединение по любому из пунктов 1-3, где:

R1 представляет собой F или Cl;

R2 представляет собой F или Cl;

L представляет собой -CH<sub>2</sub>-;

R9a представляет собой H или F; и

R9b представляет собой F или Cl.

5. Соединение по любому из пунктов 1-4, где:

R1 представляет собой Cl;

R2 представляет собой Cl; и

R9a представляет собой H;

6. Соединение по любому из пунктов 1-5, где:

Q представляет собой фенил, замещенный 1-3 R<sup>10</sup>; и

R<sup>10</sup> представляет собой галоген или C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкил, замещенный, по меньшей мере, одним R<sub>x</sub>; и R<sub>x</sub> представляет собой Cl или F.

7. Соединение по любому из пунктов 1-6, где:

R8 представляет собой -CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CF<sub>3</sub> или циклопропил.

8. Соединение по любому из пунктов 1-7, где:

R1 представляет собой Cl;

R2 представляет собой Cl;

R3 и R4 представляют собой H;

X и Y представляют собой O;

R5 представляет собой H;

R7 представляет собой H;

R8 представляет собой -CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CF<sub>3</sub>, или циклопропил

Q представляет собой фенил, замещенный 1-3 R10; и

R10 представляет собой галоген или C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> алкил, замещенный h, по меньшей мере, одним R<sub>x</sub>; и R<sub>x</sub> представляет собой Cl или F;

9. Соединение по п. 1, где указанное соединение выбирают из

2,2-дихлор-3-(3,4-дихлорфенил)-N-[4-фтор-3-[[3,3,3-трифтор-1-оксопропил)амино]метил]фенил]циклопропанкарбоксамид (Соединение 79), 2,2-дихлор-N-[4-хлор-3-[[2,2,2-трифторацетил)амино]метил]фенил]-3-(3,4-дихлорфенил)циклопропанкарбоксамид (Соединение 175), 2,2-дихлор-3-[4-фтор-3-(трифторметил)фенил]-N-[4-фтор-3-[[3,3,3-трифтор-1-оксопропил)амино]метил]фенил]циклопропанкарбоксамид (Соединение 78), 2,2-дихлор-N-[3-[[циклопропилкарбонил)амино]метил]-4-фторфенил]-3-[4-фтор-3-(трифторметил)фенил]циклопропанкарбоксамид (Соединение 77), 2,2-дихлор-3-(3-хлор-4-фторфенил)-N-[2,4-дифтор-3-[[3,3,3-трифтор-1-оксопропил)амино]метил]фенил]циклопропанкарбоксамид (Соединение 170), 2,2-дихлор-3-(4-хлор-3,5-дифторфенил)-N-[4-фтор-3-[[3,3,3-трифтор-1-оксопропил)амино]метил]фенил]циклопропанкарбоксамид (Соединение 169), 2,2-дихлор-3-(3-хлор-4-фторфенил)-N-[3-[[циклопропилкарбонил)амино]метил]-2,4-дифторфенил]циклопропанкарбоксамид (Соединение 164), 2,2-дихлор-3-(3-хлор-4-фторфенил)-N-[4-хлор-3-[[2,2,2-трифторацетил)амино]метил]фенил]циклопропанкарбоксамид (Соединение 19), 2,2-дихлор-N-[4-хлор-3-[[3,3,3-трифтор-1-оксопропил)амино]метил]фенил]-3-[4-фтор-3-(трифторметил)фенил]циклопропанкарбоксамид (Соединение 116), 2,2-дихлор-N-[4-хлор-3-[[циклопропилкарбонил)амино]метил]фенил]-3-[4-фтор-3-(трифторметил)фенил]циклопропанкарбоксамид (Соединение 39), 2,2-дихлор-3-(3-хлор-5-фторфенил)-N-[4-фтор-3-[[3,3,3-трифтор-1-оксопропил)амино]метил]фенил]циклопропанкарбоксамид (Соединение 129), 2,2-дихлор-N-[4-хлор-3-[[2,2,2-трифторацетил)амино]метил]фенил]-3-[4-фтор-3-(трифторметил)фенил]циклопропанкарбоксамид (Соединение 174), 2,2-дихлор-N-[4-хлор-3-[[3,3,3-трифтор-1-оксопропил)амино]метил]фенил]-3-(3,4,5-трифторфенил)циклопропанкарбоксамид (Соединение 118), 2,2-дихлор-3-(3-хлор-4-фторфенил)-N-[4-фтор-3-[[3,3,3-трифтор-1-оксопропил)амино]метил]фенил]циклопропанкарбоксамид (Соединение 219), и 3-[3,5-

Бис(трифторметил)фенил]-2,2-дихлор-N-[4-фтор-3-[(3,3,3-трифтор-1-оксопропил)амино]метил]фенил]циклопропанкарбоксамид (Соединение 220).

10. Композиция, содержащая соединение по любому из пунктов 1-6 и, по меньшей мере, один дополнительный компонент, выбранный из группы, состоящей из поверхностно-активных соединений, твердых разбавителей и жидких разбавителей, причем указанная композиция необязательно дополнительно содержит, по меньшей мере, одно дополнительное биологически активное соединение или агент.

11. Композиция по п. 6, где, по меньшей мере, одно дополнительное биологически активное соединение или агент выбирают из абамектина, ацефата, ацехиноцила, ацетамиприда, акринатрина, ацинонапира, афидопиропена [(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]метилциклопропанкарбоксилата), амидофлумета, амитраза, авермектина, азадирахтина, азинфос-метила, бенфуракарба, бенсультапа, бензпиримоксана, бифентрина, каппа-бифентрина, бифеназата, бистрифлуруна, бората, брофланилида, бупрофезина, кадусафоса, карбарила, карбофурана, картапа, карзола, хлорантранилипрола, хлорфенапира, хлорфлуазуруна, хлорпраллетрина, хлорпирифоса, хлорпирифоса-е, хлорпирифос-метила, хромафенозида, клофентезина, хлорпраллетрина, клотианидина, циантранилипрола (3-бром-1-(3-хлор-2-пиридинил)-N-[4-циано-2-метил-6-[(метиламино)карбонил]фенил]-1H-пиразол-5-карбоксамид), циклнилипрола (3-бром-N-[2-бром-4-хлор-6-[(1-циклопропилэтил)амино]карбонил]фенил]-1-(3-хлор-2-пиридинил)-1H-пиразол-5-карбоксамид), циклопротрина, 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]азепина), циенопирафена, цифлуметофена, цифлутрина, бета-цифлутрина, цигалодиамида, цигалотрина, гамма-цигалотрина, лямбда-цигалотрина, циперметрина, альфа-циперметрина, зета-циперметрина, цирوماзина, дельтаметрина, диафентиурона, диазинона, диклоромезотиаза, диэльдрина, дифлубензуруна, димефлутрина, димегипо, диметоата, димпропиридаза, динотефурана, диофенолана, эмамектина, эмамектинбензоата, эндосульфана, эсфенвалерата, этипрола, этофенпрокса, эпсилон-метофлутрина, этоксазола, оксида фенбутатина, фенитротиио, фенотиокарба, феноксикарба, фенпропатрина, фенвалерата, фипронила, флометоквина (2-этил-3,7-диметил-6-[4-(трифторметокси)фенокси]-4-хинолинилметилкарбоната), флонирамида, флузаиндолизина, флубендиамида, флуцитрината, флуфенерима, флуфеноксурона, флуфеноксистербина (метил (αE)-2-[[2-хлор-4-(трифторметил)фенокси]метил]-α-(метоксиметилен)бензолацетата), флуенсульфона (5-хлор-2-[(3,4,4-трифтор-3-бутен-1-ил)сульфонил]тиазола), флугексафона, флуопирама, флупипрола (1-[2,6-дихлор-4-(трифторметил)фенил]-5-[(2-метил-2-пропен-1-ил)амино]-4-[(трифторметил)сульфинил]-1H-пиразол-3-карбонитрила), флупирадифуруна (4-[[6-хлор-3-пиридинил)метил](2,2-дифторэтил)амино]-2(5H)-фуранона), флупиримина, флувалината, тау-флувалинета,



флуксаметамида, фонофоса, форметаната, фостиазата, гамма-цигалотрина, галофенозида, гептафлутрина ([2,3,5,6-тетрафтор-4-(метоксиметил)фенил]метил 2,2-диметил-3-[(1Z)-3,3,3-трифтор-1-пропен-1-ил]циклопропанкарбоксилата), гексафлумуруна, гекситиазокса, гидраметилнона, имидаклоприда, индосакарба, инсектицидных мыл, изофенфоса, изоциклоцерама, каппа-тефлутрина, лямбда-цигалотрина, луфенуруна, малатиона, мепефлутрина ([2,3,5,6-тетрафтор-4-(метоксиметил)фенил]метил (1R,3S)-3-(2,2-дихлорэтенил)-2,2-диметилциклопропанкарбоксилата), метафлумизона, метальдегида, метамидофоса, метидатиона, метиокарба, метомила, метопрена, метоксихлора, метофлутрина, метоксифенозида, эпсилон-метофлутрина, эпсилон-момфлуоротрина, монокротофоса, монофлуоротрина ([2,3,5,6-тетрафтор-4-(метоксиметил)фенил]метил 3-(2-циано-1-пропен-1-ил)-2,2-диметилциклопропанкарбоксилата), никотина, нитенпирама, нитиазина, новалуруна, новифлумуруна, оксамила, оксасосульфила, паратиона, паратион-метила, перметрина, фората, фосфалона, фосмета, фосфамидона, пиримикарба, профенофоса, профлутрина, пропаргита, протрифенбута, пифлубумида (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), пиметрозина, пирафлупрола, пиретрина, пиридабена, пиридалила, пирифлухиназона, пириминостробина (метил ( $\alpha$ E)-2-[[[2-[(2,4-дихлорфенил)амино]-6-(трифторметил)-4-пиримидинил]окси]метил]- $\alpha$ -(метоксиметилен)бензолацетата), пирипрола, пирипроксифена, ротенона, рианоидина, силафлуфена, спинеторама, спиносада, спиродиклофена, спиромезифена, спиропидиона, спиротетрамата, сульфифоса, сульфоксафлора (N-[метилоксидо[1-[6-(трифторметил)-3-пиридинил]этил]- $\lambda^4$ -сульфанилиден]цианамид), тебуфенозида, тебуфенпирада, тефлубензуруна, тефлутрина, каппа-тефлутрина, тербуфоса, тетрахлорантранилипрола, тетрахлорвинфоса, тетраметрина, тетраметилфлутрина ([2,3,5,6-тетрафтор-4-(метоксиметил)фенил]метил 2,2,3,3-тетраметилциклопропанкарбоксилата), тетранилипрола, тиаклоприда, тиаметоксама, тиодикарба, тиосультапа натрия, тиоксазафена (3-фенил-5-(2-тиенил)-1,2,4-оксадиазола), толфенпирада, тралометрина, триазамата, трихлорфона, трифлумезопирима (2,4-диоксо-1-(5-пиримидинилметил)-3-[3-(трифторметил)фенил]-2H-пиридо[1,2-a]пиримидиневой внутренней соли), трифлумуруна, циклопиразофлора, дзета-циперметрина, дельта-эндотоксинов *Bacillus thuringiensis*, энтомопатогенных бактерий, энтомопатогенных вирусов или энтомопатогенных грибов.

12. Композиция по п. 7, где, по меньшей мере, одно дополнительное биологически активное соединение или агент выбирают из группы, состоящей из абамектина, ацетамиприда, акринатрина, ацинонапира, афидопиропена, амитраза, авермектина, азадирахтина, бенфуракарба, бенсультапа, бифентрина, бупрофезина, брофланилида, кадусафоса, карбарила, картапа, хлорантранилипирола, хлоропраллетрина, хлорфенапира, хлорпирифоса, клотианидина, циантранилипрола, цикланилипрола, циклопротрина, цифлутрина, бета-цифлутрина, цигалотрина, гамма-цигалотрина, лямбда-цигалотрина, циперметрина, альфа-циперметрина, зета-циперметрина, цирوماзина, дельтаметрина,

дильдрин, динотефуран, диофенолан, эмабектин, эндосульфана, эпсилон-метофлутрина, эсфенвалерата, этипрола, этофенпрокса, этоксазола, фнитротриона, фенотиокарба, феноксикарба, фенвалерата, фипронила, флометокина, флуксаметамида, флоникамида, флубендиамида, флуенсульфона, флуфеноксурона, флуфеноксистробина, флуфенсульфона, флупипрола, флупиримина, флупирадифурина, флувалината, форметаната, фостиазата, гамма-цигалотрина, гептафлутрина, гексафлумурина, гидраметилнона, имидаклоприда, индосакарба, изоциклосерама, каппа-тефлутрина, лямбда-цигалотрина, луфенурина, меперфлутрина, метафлумизона, метиодикарба, метомила, метопрена, метоксифенозида, метофлутрина, монофлуоротрина, нитенпирама, нитиазина, новалурона, оксамила, пифлубумида, пиметрозина, пиретрина, пиридабена, пиридалила, пириминостробина, пирипроксифена, рианодина, спинеторама, спиносада, спиродиклофена, спиромезифена, спиротетрамата, сульфоксафлора, тебуфенозида, тетраметрина, тетраметилфлутрина, тиаклоприда, тиаметоксама, тиодикарба, тиосультама натрия, тралометрина, триазамата, трифлумезопирима, трифлумурина, циклопиразофлора, дзета-циперметрина, дельта-эндотоксинов *Bacillus thuringiensis*, всех штаммов *Bacillus thuringiensis* и всех штаммов вирусов нуклеополиэдроза.

13. Композиция по любому из пунктов 10-12, дополнительно содержащая жидкое удобрение.

14. Композиция по п. 13, где жидкое удобрение является удобрением на водной основе.

15. Композиция по любому из пунктов 10-14 для применения в системе капельного орошения, бороздах во время посева, ручном опрыскивателе, ранцевом опрыскивателе, штанговом опрыскивателе, наземном опрыскивателе, воздушном распылении, беспилотном летательном аппарате или при обработке семян.

16. Композиция по п. 15, где указанную композицию распыляют в сверхнизком объеме.

17. Композиция для защиты животного от беспозвоночного паразитического вредителя, содержащая паразитически эффективное количество соединения по п. 1 и, по меньшей мере, один носитель.

18. Способ борьбы с беспозвоночными вредителями, включающий контактирование беспозвоночного вредителя или окружающей его среды с биологически эффективным количеством соединения по п. 1.

19. Способ по п. 18, где окружающая среда представляет собой почву или листву растений.

20. Обработанные семена, содержащие соединение по п. 1 в количестве от приблизительно 0,0001 до 1% по весу семян до обработки.