

(19)



Евразийское
патентное
ведомство

(21) 202292225 (13) A1

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ

(43) Дата публикации заявки
2022.11.29(22) Дата подачи заявки
2021.01.29

(51) Int. Cl. C07D 401/04 (2006.01)
C07D 401/14 (2006.01)
C07D 405/04 (2006.01)
C07D 405/14 (2006.01)
C07D 409/04 (2006.01)
C07D 413/04 (2006.01)
A01N 43/40 (2006.01)
A01N 43/50 (2006.01)
A01N 43/54 (2006.01)
A01N 43/56 (2006.01)
A01N 43/647 (2006.01)
A01N 43/76 (2006.01)
A01N 43/78 (2006.01)
A01N 43/80 (2006.01)
A01N 43/82 (2006.01)

(54) СОЕДИНЕНИЯ НА ОСНОВЕ ПИРИДИНА ДЛЯ ОБЕСПЕЧЕНИЯ КОНТРОЛЯ БЕСПОЗВОНОЧНЫХ ВРЕДИТЕЛЕЙ

(31) 62/967,838

(32) 2020.01.30

(33) US

(86) PCT/US2021/015643

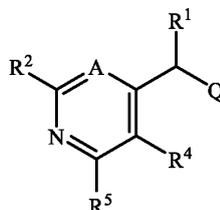
(87) WO 2021/155106 2021.08.05

(71) Заявитель:
ЭфЭмСи КОРПОРЕЙШН (US)

(72) Изобретатель:
Ахмад Омар Халед, Бридделл
Твайла А., Чан Доминик Минг-Так,
Чен Ючжон, Хамм Джейсон Чарльз,
Кар Мумита, Пахуцки Томас Фрэнсис
Джр, Стивенсон Томас Мартин, Сюй
Мин, Слэк Рэйчел (US)

(74) Представитель:
Салинник Е.А., Ляджин А.В. (KZ)

(57) Раскрыты соединения формулы 1, в том числе все их геометрические изомеры и стереоизомеры, N-оксиды и соли,



где R¹, A, R², R⁴, R⁵ и Q определены в настоящем изобретении. Также раскрыты композиции, содержащие соединения формулы 1, и способы обеспечения контроля беспозвоночного вредителя, предусматривающие приведение в контакт беспозвоночного вредителя или его окружающей среды с биологически эффективным количеством соединения или композиции по настоящему изобретению.

A1

202292225

202292225

A1

СОЕДИНЕНИЯ НА ОСНОВЕ ПИРИДИНА ДЛЯ ОБЕСПЕЧЕНИЯ КОНТРОЛЯ БЕСПОЗВОНОЧНЫХ ВРЕДИТЕЛЕЙ

5 ПЕРЕКРЕСТНАЯ ССЫЛКА НА РОДСТВЕННЫЕ ЗАЯВКИ

Данная заявка испрашивает приоритет предварительной заявки на патент США № 62/967838, поданной 30 января 2020 г.

ОБЛАСТЬ ТЕХНИКИ

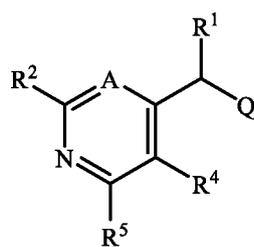
10 Настоящее изобретение относится к определенным соединениям на основе пиридина, к их *N*-оксидам, солям и композициям на их основе, подходящим для агрономических, неагрономических путей применения, и к способам их применения для обеспечения контроля беспозвоночных вредителей, таких как членистоногие, как в агрономических, так и в неагрономических средах.

15 УРОВЕНЬ ТЕХНИКИ

Контроль беспозвоночных вредителей является чрезвычайно важным для достижения высокой эффективности сельскохозяйственной культуры. Повреждение растущих и хранящихся агрономических сельскохозяйственных культур беспозвоночными вредителями может вызвать значительное снижение продуктивности и таким образом привести к увеличению затрат для потребителя. Также важен контроль беспозвоночных вредителей в лесном хозяйстве, тепличных сельскохозяйственных культурах, декоративных сельскохозяйственных культурах, саженцах, хранящихся пищевых продуктах и волокнистых продуктах, животноводстве, домашнем хозяйстве, газоне, продуктах из древесины и здоровье населения и животных. Многие продукты являются коммерчески доступными для таких целей, но продолжает существовать необходимость в новых соединениях, которые являются более эффективными, менее дорогими, менее токсичными, более безопасными в отношении окружающей среды, или которые характеризуются другими местами приложения действия.

30 СУЩНОСТЬ ИЗОБРЕТЕНИЯ

Настоящее изобретение направлено на соединения формулы 1 (в том числе все их геометрические изомеры и стереоизомеры), *N*-оксиды и соли, и композиции, их содержащие, и их применение для обеспечения контроля беспозвоночных вредителей,



1

где

R^1 представляет собой F, OR^6 или $S(O)_nR^6$;

5 A представляет собой N или CR^3 ;

R^2 представляет собой H, галоген, CN, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_3 - C_4 циклоалкил, C_3 - C_4 галогенциклоалкил, C_1 - C_4 алкокси или C_1 - C_4 галогеналкокси;

10 R^3 представляет собой H, галоген, CN, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_3 - C_4 циклоалкил, C_3 - C_4 галогенциклоалкил, C_1 - C_4 алкокси или C_1 - C_4 галогеналкокси;

15 R^4 представляет собой 5-6-членное гетероциклическое кольцо, при этом каждое кольцо содержит члены кольца, выбранные из атомов углерода и от 1 до 4 гетероатомов, независимо выбранных из не более чем 2 атомов O, не более чем 2 атомов S и не более чем 4 атомов N, при этом не более чем 2 члена кольца независимо выбраны из $C(=O)$, $C(=S)$, $S(=O)$ и $S(=O)_2$, при этом каждое кольцо необязательно замещено не более чем 5 заместителями, независимо выбранными из R^v , и g представляет собой количество заместителей;

20 каждый R^v независимо представляет собой H, циано, галоген, C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 галогеналкокси, C_1 - C_6 галогеналкил, C_2 - C_6 алкенил, C_2 - C_6 галогеналкенил, C_2 - C_6 алкинил, C_2 - C_6 галогеналкинил, C_3 - C_6 циклоалкил, C_3 - C_6 галогенциклоалкил, C_2 - C_6 цианоалкил, C_1 - C_6 гидроксиалкил, C_4 - C_{10} алкилциклоалкил, C_4 - C_{10} циклоалкилалкил, C_3 - C_6 циклоалкенил, C_3 - C_6 галогенциклоалкенил, C_2 - C_6 алкоксиалкил, C_4 - C_{10} циклоалкоксиалкил, C_3 - C_{10} алкоксиалкоксиалкил, C_2 - C_6 алкилтиоалкил, C_2 - C_6 алкилсульфинилалкил, C_3 - C_6 циклоалкокси, C_3 - C_6 галогенциклоалкокси, C_4 - C_{10} циклоалкилалкокси, C_2 - C_6 алкенилокси, C_2 - C_6 галогеналкенилокси, C_2 - C_6 алкоксиалкокси, C_2 - C_6 алкилкарбонилокси, C_1 - C_6 алкилтио, C_1 - C_6 галогеналкилтио, C_3 -

- С₆циклоалкилтио, С₁-С₆алкилсульфинил, С₁-С₆галогеналкилсульфинил, С₁-С₆алкилсульфонил, С₁-С₆галогеналкилсульфонил, С₃-С₆циклоалкилсульфонил, С₁-С₆алкиламино, С₂-С₆диалкиламино, С₁-С₆галогеналкиламино, С₂-С₆галогендиалкиламино или С₃-С₆циклоалкиламино;
- 5 г равняется 1, 2, 3, 4 или 5;
- R⁵ представляет собой H, галоген, CN, С₁-С₄алкил, С₁-С₄галогеналкил, С₃-С₄циклоалкил, С₃-С₄галогенциклоалкил, С₁-С₄алкокси или С₁-С₄галогеналкокси;
- 10 R⁶ представляет собой С₁-С₄алкил, С₁-С₄галогеналкил, С₃-С₄циклоалкил или С₃-С₄галогенциклоалкил;
- Q представляет собой шестичленное ароматическое кольцо, содержащее члены кольца, выбранные из атомов углерода и не более чем 2 атомов азота, при этом каждое кольцо необязательно замещено по членам кольца, представляющим собой атомы углерода, не более чем 5 заместителями, независимо выбранными из одного или нескольких R^w; и s представляет собой количество заместителей;
- 15 R^w независимо представляет собой H, циано, галоген, С₁-С₆алкил, С₁-С₆галогеналкил, С₁-С₆алкокси, С₁-С₆галогеналкокси, С₂-С₆алкенил, С₂-С₆галогеналкенил, С₂-С₆алкинил, С₂-С₆галогеналкинил, С₃-С₆циклоалкил, С₃-С₆галогенциклоалкил, С₂-С₆цианоалкил, С₁-С₆гидроксиалкил, С₄-С₁₀алкилциклоалкил, С₄-С₁₀циклоалкилалкил, С₃-С₆циклоалкенил, С₃-С₆галогенциклоалкенил, С₂-С₆алкоксиалкил, С₄-С₁₀циклоалкоксиалкил, С₃-С₁₀алкоксиалкоксиалкил, С₂-С₆алкилтиоалкил, С₂-С₆алкилсульфинилалкил, С₁-С₆алкокси, С₁-С₆галогеналкокси, С₃-С₆циклоалкокси, С₃-С₆галогенциклоалкокси, С₄-С₁₀циклоалкилалкокси, С₂-С₆алкенилокси, С₂-С₆галогеналкенилокси, С₂-С₆алкоксиалкокси, С₂-С₆алкилкарбонилокси, С₁-С₆алкилтио, С₁-С₆галогеналкилтио, С₃-С₆циклоалкилтио, С₁-С₆алкилсульфинил, С₁-С₆галогеналкилсульфинил, С₃-С₆циклоалкилсульфинил, С₁-С₆алкилсульфонил, С₁-С₆галогеналкилсульфонил, С₃-С₆циклоалкилсульфонил, С₁-С₆алкиламино, С₂-С₆диалкиламино, С₁-С₆галогеналкиламино, С₂-С₆галогендиалкиламино или С₃-С₆циклоалкиламино; или два R^w при смежных атомах углерода вместе могут образовывать кольцо циклического эфира -OCF₂O-, -OCH₂O-, -OCF₂S-, -OCH₂CH₂-, OCF₂CF₂O-;
- 30
- 35

s равняется 1, 2, 3, 4 или 5;

n равняется 0, 1 или 2;

при условии, что

- 1) если R^1 представляет собой F, R^2 представляет собой H, A представляет собой CR^3 , где R^3 представляет собой F, R^4 представляет собой пиразол-1-ил, и R^5 представляет собой H, Q является отличным от 4-OCF₃-фенила; и
- 2) R^4 является отличным от пиридинила.

В настоящем изобретении также предусматривается композиция, содержащая соединение формулы **1**, его *N*-оксид или соль и по меньшей мере один дополнительный компонент, выбранный из группы, состоящей из поверхностно-активных веществ, твердых разбавителей и жидких разбавителей. В одном варианте осуществления в настоящем изобретении также предусматривается композиция для обеспечения контроля беспозвоночного вредителя, содержащая соединение формулы **1**, его *N*-оксид или соль и по меньшей мере один дополнительный компонент, выбранный из группы, состоящей из поверхностно-активных веществ, твердых разбавителей и жидких разбавителей, при этом указанная композиция необязательно дополнительно содержит по меньшей мере одно дополнительное биологически активное соединение или средство.

В настоящем изобретении также предусматривается способ обеспечения контроля беспозвоночного вредителя, предусматривающий приведение в контакт беспозвоночного вредителя или его окружающей среды с биологически эффективным количеством соединения формулы **1**, его *N*-оксида или его соли (например, в виде композиции, описанной в данном документе). Настоящее изобретение также относится к такому способу, где беспозвоночного вредителя или его окружающую среду приводят в контакт 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 веществ, твердых разбавителей и жидких разбавителей, при этом указанная композиция необязательно дополнительно содержит биологически эффективное количество по меньшей мере одного дополнительного биологически активного соединения или средства.

В настоящем изобретении также предусматривается способ обеспечения контроля беспозвоночного вредителя, предусматривающий приведение в контакт беспозвоночного вредителя или его окружающей среды с биологически эффективным

количеством любой из вышеуказанных композиций, где окружающая среда представляет собой растение.

В настоящем изобретении также предусматривается способ обеспечения контроля беспозвоночного вредителя, предусматривающий приведение в контакт беспозвоночного вредителя или его окружающей среды с биологически эффективным количеством любой из вышеуказанных композиций, где окружающая среда представляет собой животное.

В настоящем изобретении также предусматривается способ обеспечения контроля беспозвоночного вредителя, предусматривающий приведение в контакт беспозвоночного вредителя или его окружающей среды с биологически эффективным количеством любой из вышеуказанных композиций, где окружающая среда представляет собой семя.

В настоящем изобретении также предусматривается способ обеспечения защиты семени от беспозвоночного вредителя, предусматривающий приведение в контакт семени с биологически эффективным количеством соединения формулы **1**, его *N*-оксида или соли (например, в виде композиции, описанной в данном документе). Настоящее изобретение также относится к обработанному семени (т. е. семени, приведенному в контакт с соединением формулы **1**).

В настоящем изобретении также предусматривается способ повышения интенсивности роста сельскохозяйственной культуры, предусматривающий приведение в контакт сельскохозяйственного растения, семени, из которого выращивают сельскохозяйственное растение, или места произрастания (например, среды для роста) сельскохозяйственного растения с биологически эффективным количеством соединения формулы **1** (например, в виде композиции, описанной в данном документе).

В настоящем изобретении дополнительно предусматривается способ обеспечения защиты животного от беспозвоночного паразитического вредителя, предусматривающий введение животному паразитоцидно эффективного количества соединения формулы **1**, его *N*-оксида или соли (например, в виде композиции, описанной в данном документе). В настоящем изобретении также предусматривается применение соединения формулы **1**, его *N*-оксида или соли (например, в виде композиции, описанной в данном документе) в обеспечении защиты животного от беспозвоночного вредителя.

ПОДРОБНОЕ ОПИСАНИЕ

Используемые в данном документе термины "предусматривает", "предусматривающий", "включает", "включающий", "имеет", "имеющий", "содержит", "содержащий", "характеризуется" или любые другие их вариации предназначены для охвата неисклЮчительного включения с учетом любого явно указанного ограничения. Например, композиция, смесь, процесс или способ, которые предусматривают перечень элементов, не обязательно ограничены только этими элементами, а могут предусматривать другие элементы, явно не перечисленные или не свойственные для такой композиции, смеси, процесса или способа.

Переходная фраза "состоящий из" исключает любые неуказанные элемент, стадию или ингредиент. Если упомянутая фраза присутствует в пункте формулы изобретения, она будет ограничивать включение в пункт формулы изобретения материалов, отличных от тех, которые указаны, за исключением примесей, обычно связанных с ними. Если фраза "состоящий из" появляется в формулировке отличительной части формулы изобретения, а не непосредственно после вводной части, она ограничивает только элемент, представленный в этой формулировке; другие элементы в целом не исключаются из пункта формулы изобретения.

Переходное выражение "состоящий по сути из" используется для определения композиции или способа, которые включают материалы, стадии, признаки, компоненты или элементы в дополнение к буквально указанным, при условии, что эти дополнительные материалы, стадии, признаки, компоненты или элементы не влияют существенно на основной(основные) и новый(новые) признак(признаки) настоящего изобретения. Термин "по сути состоящий из" занимает промежуточное положение между "содержащий" и "состоящий из".

Если заявители определили вариант осуществления или его часть с помощью неограничивающего термина, такого как "содержащий", следует уверенно понимать, что (если не указано иное) описание следует интерпретировать как также описывающее такой вариант осуществления с применением терминов "по сути состоящий из" или "состоящий из".

Кроме того, если явно не указано иное, "или" относится к включающему или, а не к исключающему или. Например, условие А или В удовлетворяется любым из следующего: А является верным (или присутствует), а В является ложным (или не присутствует), А является ложным (или не присутствует), а В является верным (или присутствует), и оба из А и В являются верными (или присутствуют).

Также предусматривается, что формы единственного числа, предшествующие элементу или компоненту настоящего изобретения, являются неограничивающими в отношении количества единиц (т.е. случаев) элемента или компонента. Следовательно, форму единственного числа следует читать как такую, которая
5 включает один или по меньшей мере один, и форма единственного числа элемента или компонента также включает форму множественного числа, если количество очевидно не предусматривает форму единственного числа.

Как упоминается в данном раскрытии, термин "беспозвоночный вредитель" включает членистоногих, брюхоногих моллюсков, нематод и гельминтов, имеющих
10 экономическое значение как вредители. Термин "членистоногое" включает насекомых, клещей, пауков, скорпионов, сколопендр, многоножек, мокриц и симфилов. Термин "брюхоногий моллюск" включает улиток, слизней и других представителей отряда Stylommatophora. Термин "нематода" включает представителей типа Nematoda, таких как нематоды-фитофаги и нематоды-гельминты,
15 паразитирующие на животных. Термин "гельминты" включает всех паразитических червей, таких как круглые черви (тип Nematoda), сердечные гельминты (тип Nematoda, класс Secernentea), сосальщики (тип Platyhelminthes, класс Tematoda), скребни (тип Acanthocephala) и ленточные черви (тип Platyhelminthes, класс Cestoda).

В контексте настоящего изобретения "контроль беспозвоночных вредителей"
20 означает подавление развития беспозвоночных вредителей (включая смертность, сокращение питания и/или нарушение спаривания), и родственные выражения определены аналогично.

Термин "агрономический" относится к выращиванию полевых культур, например, для получения продуктов питания и волокон, и включает выращивание
25 маиса или кукурузы, сои и других бобовых, риса, зерновых (например, пшеницы, овса, ячменя, ржи и риса), листовых овощей (например, салата, капусты и других капустных культур), плодовых овощей (например, томатов, перца, баклажанов, крестоцветных и тыквенных), картофеля, батата, винограда, хлопчатника, древесных плодовых культур (например, семечковых, косточковых и цитрусовых), мелких плодовых культур
30 (например, ягод и вишни) и других специальных сельскохозяйственных культур (например, канолы, подсолнечника и оливковых деревьев).

Термин "неагрономический" относится к культурам, отличным от полевых, таким как садовые культуры (например, тепличные растения, выращиваемые в питомниках растения или декоративные растения, не выращиваемые в поле),
35 домашним, сельскохозяйственным растениям, растениям для выращивания в

коммерческих и промышленных структурах, газону (например, дерновой ферме, пастбищу, полю для гольфа, лужайке, спортивной площадке и т. п.), продуктам из древесины, хранящемуся продукту, агролесоводству и контролю растительности, применению для общественного здоровья (т. е. для здоровья человека) и здоровья животных (например, одомашненных животных, таких как домашние животные, домашний скот и птица, неодомашненных животных, таких как дикие животные).

Термин "интенсивность роста сельскохозяйственной культуры" относится к скорости роста или накопления биомассы сельскохозяйственного растения. "Повышение интенсивности роста" относится к повышению скорости роста или накопления биомассы сельскохозяйственного растения по сравнению с необработанным контрольным сельскохозяйственным растением. Термин "урожайность сельскохозяйственной культуры" относится к выходу материала сельскохозяйственной культуры с точки зрения как количества, так и качества, полученного после сбора урожая сельскохозяйственного растения. "Повышение урожайности сельскохозяйственной культуры" относится к повышению урожайности сельскохозяйственной культуры по сравнению с необработанным контрольным сельскохозяйственным растением.

Термин "биологически эффективное количество" означает количество биологически активного соединения (например, соединения формулы 1), достаточное для получения требуемого биологического эффекта при применении в отношении беспозвоночных вредителей (т. е. при контакте с таковыми), подлежащих контролю, или их окружающей среды, или в отношении растения, семени, из которого выращивается растение, или места произрастания растения (например, среды роста) для защиты растения от повреждения беспозвоночным вредителем или для другого требуемого эффекта (например, повышения интенсивности роста растения).

Пути неагрономического применения включают обеспечение защиты животного от беспозвоночного паразитического вредителя путем введения паразитоцидно эффективного (т. е. биологически эффективного) количества соединения по настоящему изобретению, как правило, в форме композиции, составленной для ветеринарного применения, животному, подлежащему защите. Указанные в настоящем изобретении и формуле изобретения термины "паразитоцидный" и "паразитоцидно" означают наблюдаемые эффекты в отношении беспозвоночного паразитического вредителя с обеспечением защиты животного от вредителя. Паразитоцидные эффекты, как правило, относятся к уменьшению случаев возникновения или активности целевого беспозвоночного паразитического вредителя.

Такие эффекты в отношении вредителя включают некроз, гибель, замедленный рост, уменьшенную подвижность или сниженную способность оставаться на животном-хозяине или внутри него, пониженную способность к питанию и ингибирование размножения. Такие эффекты в отношении беспозвоночных паразитических вредителей обеспечивают контроль (в том числе предупреждение, понижение или устранение) паразитического поражения или заражения животного.

В указанных выше перечислениях термин "алкил", используемый либо отдельно, либо в составных словах, таких как "алкилтио" или "галогеналкил", включает алкил с прямой или разветвленной цепью, такой как метил, этил, *n*-пропил, изопропил или различные изомеры бутила, пентила или гексила. "Алкенил" включает алкены с прямой или разветвленной цепью, 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 алкины с прямой или разветвленной цепью, такие как этинил, 1-пропинил, 2-пропинил и различные изомеры бутинила, пентинила и гексинила. "Алкинил" может также включать фрагменты, содержащие несколько тройных связей, такие как 2,5-гексадиинил. "Алкилен" означает алкандиил с прямой или разветвленной цепью. Примеры "алкилена" включают CH_2 , CH_2CH_2 , $\text{CH}(\text{CH}_3)$, $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$, $\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)$ и различные изомеры бутилена. "Алкенилен" означает алкендиил с прямой или разветвленной цепью, содержащий одну олефиновую связь. Примеры "алкенилена" включают $\text{CH}=\text{CH}$, $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}$, $\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)$ и различные изомеры бутенилена. "Алкинилен" означает алкиндиил с прямой или разветвленной цепью, содержащий одну тройную связь. Примеры "алкинилена" включают $\text{C}\equiv\text{C}$, $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{C}$, $\text{C}\equiv\text{CCH}_2$ и различные изомеры бутинилена.

"Алкокси" включает, например, метокси, этокси, *n*-пропилокси, изопропилокси и различные изомеры бутокси, пентокси и гексилокси. "Алкоксиалкил" означает замещение алкоксигруппой при алкиле. Примеры "алкоксиалкила" включают CH_3OCH_2 , $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ и $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$. "Алкоксиалкокси" означает замещение алкоксигруппой при алкокси. "Алкенилокси" включает фрагменты алкенилокси с прямой или разветвленной цепью. Примеры "алкенилокси" включают $\text{H}_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{O}$, $(\text{CH}_3)_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{O}$, $(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{O}$, $(\text{CH}_3)\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{O}$ и $\text{CH}_2=\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{O}$. "Алкинилокси" включает фрагменты алкинилокси с прямой или разветвленной цепью. Примеры "алкинилокси" включают $\text{HC}\equiv\text{CCH}_2\text{O}$, $\text{CH}_3\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{O}$ и $\text{CH}_3\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{O}$. "Алкилтио" включает фрагменты

алкилтио с разветвленной или прямой цепью, такие как метилтио, этилтио и различные изомеры пропилтио, бутилтио, пентилтио и гексилтио. "Алкилсульфинил" включает оба энантиомера алкилсульфинильной группы. Примеры "алкилсульфинила" включают $\text{CH}_3\text{S(O)-}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S(O)-}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S(O)-}$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHS(O)-}$ и различные изомеры бутилсульфинила, пентилсульфинила и гексилсульфинила. Примеры "алкилсульфонила" включают $\text{CH}_3\text{S(O)}_2-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S(O)}_2-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S(O)}_2-$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHS(O)}_2-$ и различные изомеры бутилсульфонила, пентилсульфонила и гексилсульфонила. "Алкилтиоалкил" означает замещение алкилтиогруппой при алкиле. Примеры "алкилтиоалкила" включают CH_3SCH_2 , $\text{CH}_3\text{SCH}_2\text{CH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_2$ и $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_2$. "Алкилтиоалкокси" означает замещение алкилтиогруппой при алкокси. "Алкилдитио" означает фрагменты алкилдитио с разветвленной или прямой цепью. Примеры "алкилдитио" включают $\text{CH}_3\text{SS-}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SS-}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SS-}$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHSS-}$ и различные изомеры бутилдитио и пентилдитио. "Цианоалкил" означает алкильную группу, замещенную одной цианогруппой. Примеры "цианоалкила" включают NCCH_2 , NCCH_2CH_2 и $\text{CH}_3\text{CH}(\text{CN})\text{CH}_2$. "Алкиламино", "диалкиламино", "алкенилтио", "алкенилсульфинил", "алкенилсульфонил", "алкинилтио", "алкинилсульфинил", "алкинилсульфонил" и т. п. определены аналогично примерам выше.

"Циклоалкил" включает, например, циклопропил, циклобутил, циклопентил и циклогексил. Термин "алкилциклоалкил" означает замещение алкилом при циклоалкильном фрагменте и включает, например, этилциклопропил, изопропилциклобутил, 3-метилциклопентил и 4-метилциклогексил. Термин "циклоалкилалкил" означает замещение циклоалкилом при алкильном фрагменте. Примеры "циклоалкилалкила" включают циклопропилметил, циклопентилэтил и другие циклоалкильные фрагменты, связанные с алкильными группами с прямой или разветвленной цепью. Термин "циклоалкокси" означает циклоалкил, присоединенный посредством атома кислорода, такой как циклопентилокси и циклогексилокси. "Циклоалкилалкокси" означает циклоалкилалкил, присоединенный посредством атома кислорода, присоединенного к алкильной цепи. Примеры "циклоалкилалкокси" включают циклопропилметокси, циклопентилэтокси и другие циклоалкильные фрагменты, связанные с алкоксигруппами с прямой или разветвленной цепью. "Цианоциклоалкил" означает циклоалкильную группу, замещенную одной цианогруппой. Примеры "цианоциклоалкила" включают 4-цианоциклогексил и 3-цианоциклопентил. "Циклоалкенил" включает группы, такие как циклопентенил и

циклогексенил, а также группы с более чем одной двойной связью, такие как 1,3- и 1,4-циклогексадиенил.

Термин "галоген" либо отдельно, либо в составных словах, таких как "галогеналкил", или если используется в описаниях, таких как "алкил, замещенный галогеном", включает фтор, хлор, бром или йод. Кроме того, если он используется в составных словах, таких как "галогеналкил", или если используется в описаниях, таких как "алкил, замещенный галогеном", указанный алкил может быть частично или полностью замещен атомами галогена, которые могут быть одинаковыми или различными. Примеры "галогеналкила" или "алкила, замещенного галогеном" включают F_3C- , $ClCH_2-$, CF_3CH_2- и CF_3CCl_2- . Термины "галогенциклоалкил", "галогеналкоксии", "галогеналкилтио", "галогеналкенил", "галогеналкинил" и т. п. определены аналогично термину "галогеналкил". Примеры "галогеналкоксии" включают CF_3O- , CCl_3CH_2O- , $HCF_2CH_2CH_2O-$ и CF_3CH_2O- . Примеры "галогеналкилтио" включают CCl_3S- , CF_3S- , CCl_3CH_2S- и $ClCH_2CH_2CH_2S-$. Примеры "галогеналкилсульфинила" включают $CF_3S(O)-$, $CCl_3S(O)-$, $CF_3CH_2S(O)-$ и $CF_3CF_2S(O)-$. Примеры "галогеналкилсульфонила" включают $CF_3S(O)_2-$, $CCl_3S(O)_2-$, $CF_3CH_2S(O)_2-$ и $CF_3CF_2S(O)_2-$. Примеры "галогеналкенила" включают $(Cl)_2C=CHCH_2-$ и $CF_3CH_2CH=CHCH_2-$. Примеры "галогеналкинила" включают $HC\equiv CCHCl-$, $CF_3C\equiv C-$, $CCl_3C\equiv C-$ и $FCH_2C\equiv CCH_2-$. Примеры "галогеналкоксиалкоксии" включают CF_3OCH_2O- , $ClCH_2CH_2OCH_2CH_2O-$, $Cl_3CCH_2OCH_2O-$, а также разветвленные производные алкила.

"Алкилкарбонил" означает алкильные фрагменты с прямой или разветвленной цепью, связанные с фрагментом $C(=O)$. Примеры "алкилкарбонила" включают $CH_3C(=O)-$, $CH_3CH_2CH_2C(=O)-$ и $(CH_3)_2CHC(=O)-$. Примеры "алкоксикарбонила" включают $CH_3OC(=O)-$, $CH_3CH_2OC(=O)-$, $CH_3CH_2CH_2OC(=O)-$, $(CH_3)_2CHOC(=O)-$ и различные изомеры бутокси- или пентоксикарбонила.

Химические сокращения $S(O)$ и $S(=O)$, используемые в данном документе, представляют собой сульфинильный фрагмент. Химические сокращения SO_2 , $S(O)_2$ и $S(=O)_2$, используемые в данном документе, представляют собой сульфонильный фрагмент. Химические сокращения $C(O)$ и $C(=O)$, используемые в данном документе, представляют собой карбонильный фрагмент. Химические сокращения CO_2 , $C(O)O$ и $C(=O)O$, используемые в данном документе, представляют собой оксикарбонильный фрагмент. "СНО" означает формил.

Если R^4 представляет собой 5-6-членное гетероциклическое кольцо, замещенное не более чем 5 заместителями, независимо выбранными из R^v , то заместители R^v могут

быть присоединены к остальной части соединения формулы 1 посредством любого доступного члена кольца гетероциклического кольца.

Если Q представляет собой шестичленное ароматическое кольцо, замещенное не более чем 5 заместителями, независимо выбранными из R^w, то заместители R^w могут
5 быть присоединены к остальной части соединения формулы 1 посредством любого доступного члена кольца шестичленного ароматического кольца.

Общее число атомов углерода в группе-заместителе указано посредством
10 префикса "C_i-C_j", где i и j представляют собой числа от 1 до 10. Например, C₁-C₄алкилсульфонил означает от метилсульфонила до бутилсульфонила; C₂алкоксиалкил означает CH₃OCH₂-; C₃алкоксиалкил означает, например, CH₃CH(OCH₃)-, CH₃OCH₂CH₂- или CH₃CH₂OCH₂-; и C₄алкоксиалкил означает различные изомеры алкильной группы, замещенной алкоксигруппой, в общем
15 содержащей четыре атома углерода, при этом примеры включают CH₃CH₂CH₂OCH₂- и CH₃CH₂OCH₂CH₂-.

Если соединение замещено заместителем, несущим нижний индекс, который указывает на число указанных заместителей, которое может превышать 1, то указанные заместители (если их количество превышает 1) независимо выбраны из
20 группы определенных заместителей, например, [(R^v)_r], где r равняется 1, 2, 3, 4 или 5; и [(R^w)_s], где s равняется 1, 2, 3, 4 или 5. Если группа содержит заместитель, который может представлять собой водород, например, R^v или R^w, то, если данный заместитель принимает значение водорода, следует понимать, что это является эквивалентным тому, что указанная группа является незамещенной. Если указано, что одно или
25 несколько положений в группе являются "не замещенными" или "незамещенными", то присоединены атомы водорода с заполнением любой свободной валентности.

Если не указано иное, "кольцо" в качестве компонента формулы 1 (например, заместитель R⁴) является карбоциклическим или гетероциклическим. Термин "член
30 кольца" означает атом или другой фрагмент (например, C(=O), C(=S), S(O) или S(O)₂), образующий остов кольца.

Термин "карбоциклическое кольцо" или "карбоцикл" означает кольцо, в котором атомы, образующие главную цепь кольца, выбраны только из атомов углерода. Термин "гетероциклическое кольцо" или "гетероцикл" означает кольцо, в котором по
35 меньшей мере один атом, образующий главную цепь кольца, является отличным от углерода, например, представляет собой атом азота, кислорода или серы. Как правило,

гетероциклическое кольцо содержит не более чем 4 атома азота, не более чем 2 атома кислорода и не более чем 2 атома серы. Если не указано иное, карбоциклическое кольцо или гетероциклическое кольцо может представлять собой насыщенное или ненасыщенное кольцо. "Насыщенный" означает кольцо, содержащее остов, состоящий из атомов, присоединенных друг к другу посредством одинарных связей; если не 5
указано иное, оставшиеся валентности атомов заняты атомами водорода. Если не указано иное, "ненасыщенное кольцо" может быть частично ненасыщенным или полностью ненасыщенным. Выражение "полностью ненасыщенное кольцо" означает кольцо из атомов, в котором связи между атомами в кольце представляют собой 10
одинарные или двойные связи в соответствии с теорией валентных связей, и, кроме того, связи между атомами в кольце включают наибольшее возможное количество двойных связей, при этом двойные связи не являются кумулятивными (т. е. без C=C=C или C=C=N). Термин "частично ненасыщенное кольцо" означает кольцо, содержащее по меньшей мере один член кольца, связанный со смежным членом кольца 15
посредством двойной связи, и которое концептуально потенциально может содержать число некумулятивных двойных связей между смежными членами кольца (т. е. в полностью ненасыщенной форме аналога) большее, чем число присутствующих двойных связей (т. е. в частично ненасыщенной форме).

Если не указано иное, гетероциклические кольца могут быть присоединены 20
посредством любого доступного атома углерода или азота путем замены атома водорода при указанном атоме углерода или азота.

"Ароматический" указывает на то, что каждый из атомов в кольце располагается по сути в одной и той же плоскости и имеет *p*-орбиталь, перпендикулярную плоскости 25
кольца, и в котором $(4n + 2)$ π -электронов, где *n* представляет собой положительное целое число, связаны с кольцом, чтобы соответствовать правилу Хюккеля. Если полностью ненасыщенное карбоциклическое кольцо соответствует правилу Хюккеля, то указанное кольцо также называют "ароматическим кольцом" или "ароматическим карбоциклическим кольцом". Если полностью ненасыщенное гетероциклическое 30
кольцо соответствует правилу Хюккеля, то указанное кольцо также называют "гетероароматическим кольцом" или "ароматическим гетероциклическим кольцом".

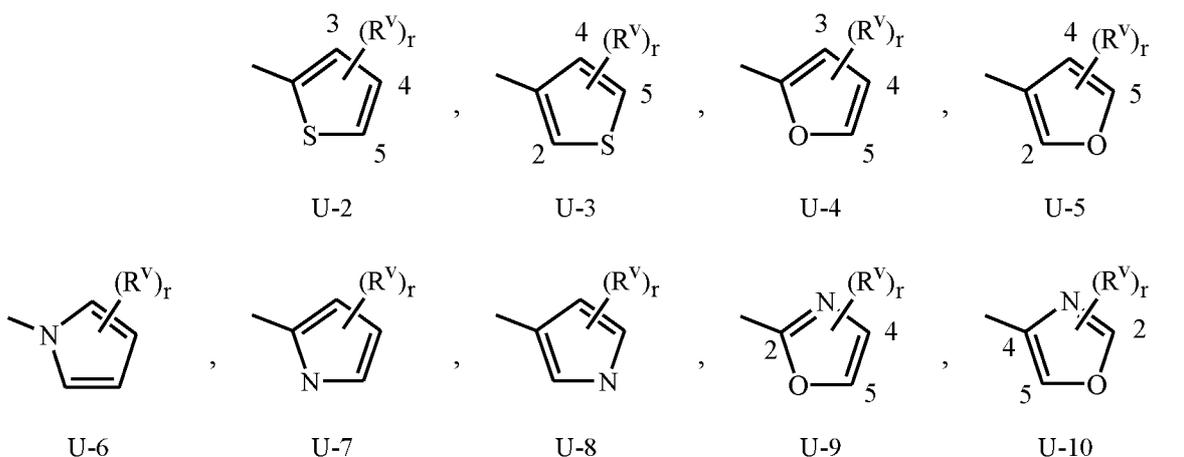
Термин "необязательно замещенный" в отношении гетероциклических колец означает группу, которая является незамещенной или содержит по меньшей мере один 35
заместитель, отличный от водорода, который не устраняет биологическую активность, проявляемую незамещенным аналогом. Будут применяться следующие используемые в данном документе определения, если не указано иное. Термин "необязательно

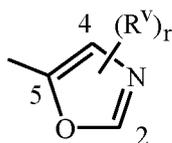
замещенный" используется взаимозаменяемо с выражением "замещенный или незамещенный" или с термином "(не)замещенный". Если не указано иное, необязательно замещенная группа может содержать заместитель при каждом замещаемом положении группы, и при этом каждое замещение является независимым от другого.

Если R^4 представляет собой 5- или 6-членное азотсодержащее гетероциклическое кольцо, то он может быть присоединен к остальной части формулы **1** посредством любого доступного атома углерода или азота в кольце, если не описано иное.

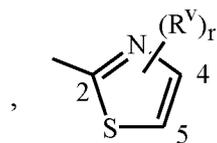
Как указано выше, R^4 может представлять собой 5- или 6-членное гетероциклическое кольцо, которое может быть насыщенным или ненасыщенным, необязательно замещенное одним или несколькими заместителями, выбранными из группы заместителей, определенной в разделе "Сущность изобретения". Примеры 5- или 6-членного ненасыщенного ароматического гетероциклического кольца, необязательно замещенного одним или несколькими заместителями, включают кольца U-2 – U-61, проиллюстрированные в приложении 1, где R^v представляет собой любой заместитель, определенный в разделе "Сущность изобретения", и r представляет собой целое число от 1 до 4, ограниченное числом доступных положений при каждой группе U. Так как в U-29, U-30, U-36, U-37, U-38, U-39, U-40, U-41, U-42 и U-43 имеется только одно доступное положение, для таких групп U r ограничено целым числом 1, и если R^v представляет собой H, и r равняется 1, это означает, что группа U является незамещенной, и в положении, обозначенном $(R^v)_r$, находится водород.

Приложение 1

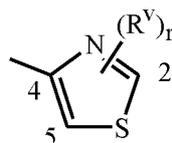




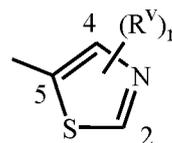
U-11



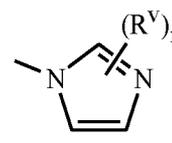
U-12



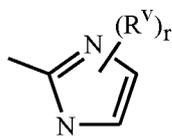
U-13



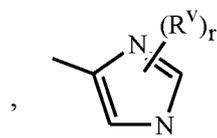
U-14



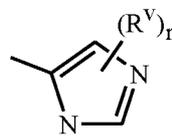
U-15



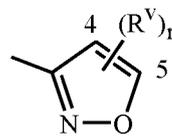
U-16



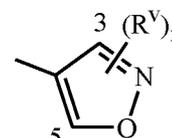
U-17



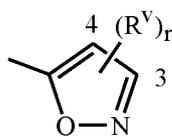
U-18



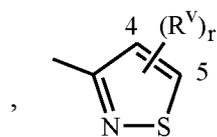
U-19



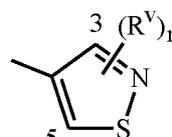
U-20



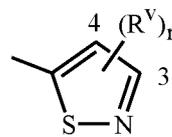
U-21



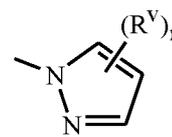
U-22



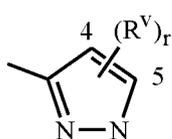
U-23



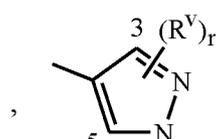
U-24



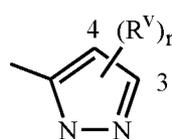
U-25



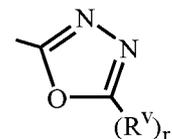
U-26



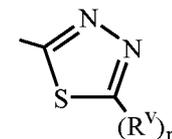
U-27



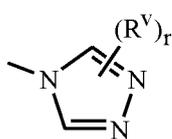
U-28



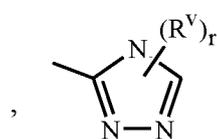
U-29



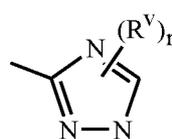
U-30



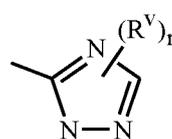
U-31



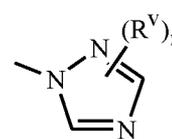
U-32



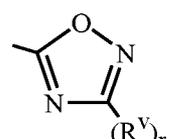
U-33



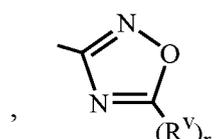
U-34



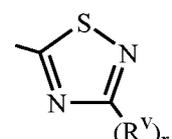
U-35



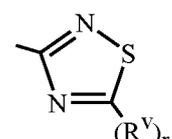
U-36



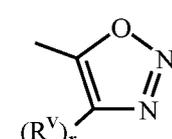
U-37



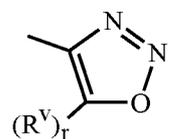
U-38



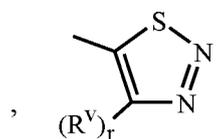
U-39



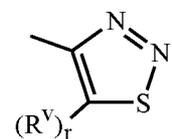
U-40



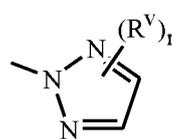
U-41



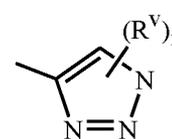
U-42



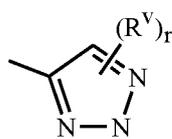
U-43



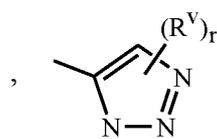
U-44



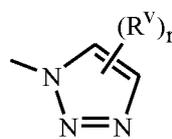
U-45



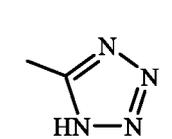
U-46



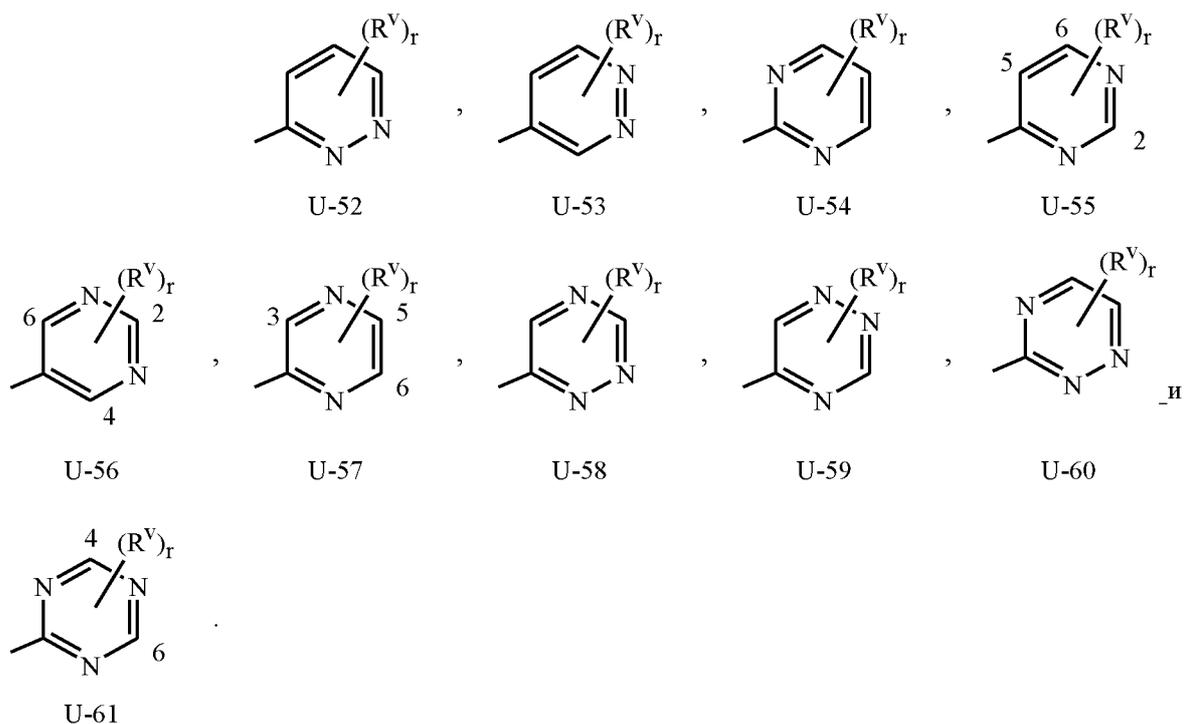
U-47



U-48



U-49

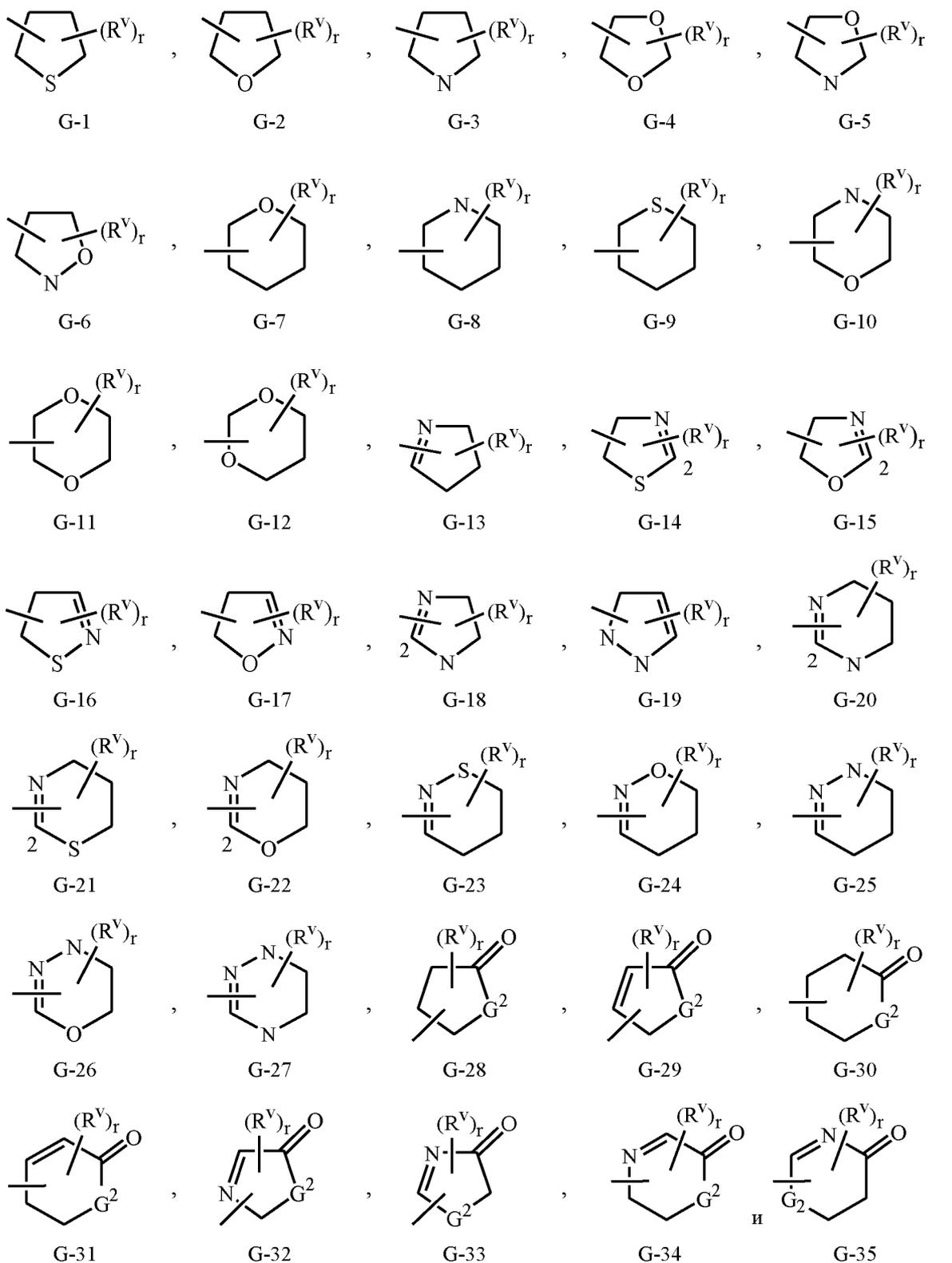


Следует отметить, что если R^4 представляет собой 5- или 6-членное насыщенное или ненасыщенное неароматическое гетероциклическое кольцо, необязательно замещенное одним или несколькими заместителями, выбранными из группы заместителей, определенной в разделе "Сущность изобретения", то один или два члена кольца, представляющие собой углерод, гетероцикла необязательно могут находиться в окисленной форме в виде карбонильного фрагмента.

Примеры 5- или 6-членного насыщенного или неароматического ненасыщенного гетероциклического кольца, включают кольца G-1 – G-35, проиллюстрированные в приложении 2. Следует отметить, что если точка присоединения при группе G проиллюстрирована как плавающая, то группа G может быть присоединена к остальной части формулы 1 посредством любого доступного атома углерода или азота группы G путем замены атома водорода. Необязательные заместители, соответствующие R^v , могут быть присоединены к любому доступному атому углерода или азота путем замены атома водорода. Для таких G колец s, как правило, представляет собой целое число от 1 до 5, ограниченное числом доступных положений при каждой группе G.

Следует отметить, что если R^4 предусматривает кольцо, выбранное из G-28 – G-35, то G^2 выбран из O, S или N. Следует отметить, что если G^2 представляет собой N, то в атоме азота валентность может заполняться путем замещения заместителями, соответствующими R^w , определенному в разделе "Сущность изобретения".

Приложение 2



Хотя группы R^V показаны в структурах U-2 – U-61, следует отметить, что их присутствие не является необходимым, поскольку они являются необязательными

заместителями. Следует отметить, что если R^v представляет собой H, присоединенный к атому, это означает то же самое, как если бы указанный атом являлся незамещенным. Атомы азота, при которых необходимо замещение для заполнения их валентности, замещены с помощью H или R^v . Следует отметить, что если точка

5 присоединения между $(R^v)_r$ и кольцом U проиллюстрирована как плавающая, то $(R^v)_r$ может быть присоединен к любому доступному атому углерода или атому азота кольца U. Следует отметить, что если точка присоединения при кольце U проиллюстрирована как плавающая, то группа U может быть присоединена к

10 остальной части формулы 1 посредством любого доступного атома углерода или азота группы U путем замены атома водорода. Следует отметить, что некоторые кольца U могут быть замещены только менее чем 4 группами R^v (например, U-2 – U-5, U-7 – U-49 и U-52 – U-61).

Из уровня техники известно широкое разнообразие способов синтеза для обеспечения получения ароматических и неароматических гетероциклических колец и

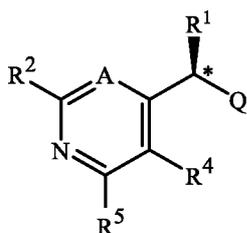
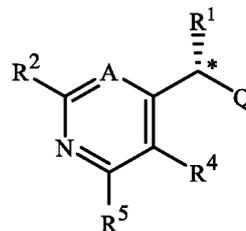
15 кольцевых систем; для содержательного обзора см. сборник из восьми томов *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, A. R. Katritzky and C. W. Rees editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1984 и сборник из двенадцати томов *Comprehensive Heterocyclic Chemistry II*, A. R. Katritzky, C. W. Rees and E. F. V. Scriven editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1996.

20 Соединения по настоящему изобретению могут существовать в виде одного или нескольких стереоизомеров. Стереоизомеры представляют собой изомеры идентичного состава, но отличающиеся конфигурацией их атомов в пространстве, и включают энантимеры, диастереомеры, цис-транс-изомеры (также известные как геометрические изомеры) и атропоизомеры. Атропоизомеры образуются вследствие

25 ограниченного вращения вокруг одинарных связей, где вращательный барьер является достаточно высоким, чтобы обеспечивать выделение изомерных молекул. Специалист в данной области поймет, что один стереоизомер может быть более активным и/или может проявлять благоприятные эффекты, если он является обогащенным относительно другого(других) стереоизомера(стереоизомеров) или отделенным от

30 другого(других) стереоизомера(стереоизомеров). Кроме того, специалисту в данной области известно, как отделять, обогащать и/или селективно получать указанные стереоизомеры. Для исчерпывающего обсуждения всех аспектов стереоизомерии см. Ernest L. Eliel and Samuel H. Wilen, *Stereochemistry of Organic Compounds*, John Wiley & Sons, 1994.

Соединения по настоящему изобретению могут быть представлены в виде смеси стереоизомеров или в виде отдельных стереоизомеров. Например, два возможных энантиомера формулы **1** изображены в виде формулы **1a** и формулы **1a'**, вовлекающих хиральный центр, представляющий собой атом углерода, идентифицированный звездочкой (*). Аналогично, возможными являются другие хиральные центры, например, при R⁴.

**1a****1a'**

Изображения молекул, изображенные в данном документе, соответствуют стандартным условным обозначениям для изображения стереохимии. Для указания стереоконфигурации связи, поднимающиеся от плоскости изображения по направлению к смотрящему, обозначены с помощью сплошных клинообразных линий, где широкий конец клинообразной линии присоединен к атому, поднимающемуся от плоскости изображения по направлению к смотрящему. Связи, направленные под плоскость изображения и по направлению от смотрящего, обозначены пунктирными клинообразными линиями, где широкий конец клинообразной линии присоединен к атому, отдаленному от смотрящего.

Соединения по настоящему изобретению могут существовать в виде стереоизомеров, поскольку в формуле **1** присутствуют возможные хиральные атомы углерода. Таким образом, в настоящем изобретении предусматриваются отдельные стереоизомеры соединений формулы **1**, а также смеси стереоизомеров соединений формулы **1**.

Соединения формулы **1** могут содержать дополнительные хиральные центры. Например, заместители и другие молекулярные составляющие, такие как R⁴, сами по себе могут содержать хиральные центры. В настоящем изобретении предусматриваются рацемические смеси, а также обогащенные и по сути чистые стереоконфигурации при таких дополнительных хиральных центрах.

Соединения по настоящему изобретению могут существовать в виде одного или нескольких конформационных изомеров вследствие ограниченного вращения вокруг любых связей в формуле **1**. В настоящем изобретении предусматриваются смеси конформационных изомеров. Кроме того, настоящее изобретение включает соединения, которые обогащены одним конформером относительно других.

Считается, что более биологически активный энантиомер представляет собой формулу **1a** (R-энантиомер формулы **1**).

В настоящем изобретении предусмотрены рацемические смеси равных количеств энантиомеров формул **1a** (R-энантиомер формулы **1**) и **1a'** (S-энантиомер формулы **1**). Кроме того, настоящее изобретение включает смеси, которые обогащены энантиомером формулы **1a** по сравнению с рацемической смесью формул **1a** и **1a'**. Также в настоящем изобретении предусмотрен по сути чистый энантиомер формулы **1a**.

В одном варианте осуществления настоящего изобретения предусмотрены смеси стереоизомеров соединений формулы **1a** и формулы **1a'**, где соотношение **1a** и **1a'** составляет по меньшей мере 75:25 (энантиомерный избыток 50%).

В одном варианте осуществления настоящего изобретения предусмотрены смеси стереоизомеров соединений формулы **1a** и формулы **1a'**, где соотношение **1a** и **1a'** составляет по меньшей мере 90:10 (энантиомерный избыток **1a** 80%).

В одном варианте осуществления настоящего изобретения предусмотрены смеси стереоизомеров соединений формулы **1a** и формулы **1a'**, где соотношение **1a** и **1a'** составляет по меньшей мере 95:5 (энантиомерный избыток **1a** 90%).

В одном варианте осуществления настоящего изобретения предусмотрены смеси стереоизомеров соединений формулы **1a** и формулы **1a'**, где соотношение **1a** и **1a'** составляет по меньшей мере 98:2 (энантиомерный избыток **1a** 96%).

В одном варианте осуществления настоящего изобретения предусмотрены смеси стереоизомеров соединений формулы **1a** и формулы **1a'**, где соотношение **1a** и **1a'** составляет по меньшей мере 99:1 (энантиомерный избыток **1a** 98%).

В одном варианте осуществления настоящего изобретения предусмотрены смеси стереоизомеров соединений формулы **1a** и формулы **1a'**, где соотношение **1a** и **1a'** составляет по сути 100:0.

В одном варианте осуществления настоящего изобретения предусмотрены соединения формулы **1a**.

Специалист в данной области техники поймет, что не все азотсодержащие гетероциклы способны образовывать *N*-оксиды, поскольку для атома азота требуется доступная неподеленная пара для окисления с получением оксида; специалист в данной области техники отличит те азотсодержащие гетероциклы, которые могут образовывать *N*-оксиды. Специалист в данной области техники также отличит те третичные амины, которые могут образовывать *N*-оксиды. Способы синтеза для получения *N*-оксидов гетероциклов и третичных аминов являются общеизвестными специалистам в данной области техники, в том числе окисление гетероциклов и третичных аминов с помощью пероксикислот, таких как перуксусная и 3-хлорпербензойная кислота (МСПВА), пероксида водорода, алкилгидропероксидов, таких как *трет*-бутилгидропероксид, пербората натрия и диоксиранов, таких как диметилдиоксиран. Такие способы получения *N*-оксидов были содержательно описаны и рассмотрены в литературе, см., например, Т. L. Gilchrist в *Comprehensive Organic Synthesis*, том 7, сс. 748–750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler и B. Stanovnik в *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, том 3, сс. 18–20, A. J. Boulton and A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M. R. Grimmett и B. R. T. Keene в *Advances in Heterocyclic Chemistry*, том 43, сс. 149–161, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler и B. Stanovnik в *Advances in Heterocyclic Chemistry*, том 9, сс. 285–291, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press и G. W. H. Cheeseman и E. S. G. Werstiuk в *Advances in Heterocyclic Chemistry*, том 22, сс. 390–392, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press.

Специалист в данной области техники понимает, что, поскольку в окружающей среде и в физиологических условиях соли химических соединений находятся в равновесии с их соответствующими несолевыми формами, соли разделяют биологическую полезность несолевых форм. Таким образом, широкое разнообразие солей соединений формулы **1** является пригодным для контроля беспозвоночных вредителей. Соли соединений формулы **1** включают соли присоединения кислот, образованные с применением неорганических или органических кислот, таких как бромистоводородная, хлористоводородная, азотная, фосфорная, серная, уксусная, масляная, фумаровая, молочная, малеиновая, малоновая, щавелевая, пропионовая, салициловая, винная, 4-толуолсульфоновая или валериановая кислоты. Если соединение формулы **1** содержит кислотный фрагмент, такой как карбоновая кислота или фенол, то соли также включают соли, образованные с применением органических или неорганических оснований, таких как пиридин, триэтиламин или аммиак, или амидов, гидридов, гидроксидов или карбонатов натрия, калия, лития, кальция, магния

или бария. Соответственно, в настоящем изобретении предусматриваются соединения, выбранные из формулы 1, их *N*-оксидов и подходящих солей.

Соединения, выбранные из формулы 1, их стереоизомеры, таутомеры, *N*-оксиды и соли, как правило, существуют в более чем одной форме, и формула 1, таким образом, включает все кристаллические и некристаллические формы соединений, которые описывает формула 1. Некристаллические формы включают варианты осуществления, которые предусматривают твердые вещества, такие как виды воска и смолы, а также варианты осуществления, которые предусматривают жидкости, такие как растворы и расплавы. Кристаллические формы включают варианты осуществления, которые предусматривают по сути монокристаллический тип, и варианты осуществления, которые предусматривают смесь полиморфов (т. е. разных кристаллических типов). Термин "полиморф" означает конкретную кристаллическую форму химического соединения, которая может кристаллизоваться в разные кристаллические формы, при этом такие формы имеют разные группировки и/или конформации молекул в кристаллической решетке. Хотя полиморфы могут иметь одинаковый химический состав, они также могут отличаться по составу вследствие присутствия или отсутствия сокристаллизованной воды или других молекул, которые могут быть слабо или сильно связаны в решетке. Полиморфы могут отличаться в отношении химических, физических и биологических свойств, таких как кристаллическая форма, плотность, твердость, цвет, химическая стабильность, точка плавления, гигроскопичность, суспензируемость, скорость растворения и биологическая доступность. Специалисту в данной области техники будет понятно, что полиморф соединения, представленного формулой 1, может проявлять благоприятные эффекты (например, пригодность для получения пригодных составов, улучшенная биологическая эффективность) по сравнению с другим полиморфом или смесью полиморфов одного и того же соединения, представленного формулой 1. Получение и выделение конкретного полиморфа соединения, представленного с помощью формулы 1, можно достичь с помощью способов, известных специалистам в данной области техники, в том числе, например, кристаллизации с применением выбранных растворителей и значений температуры. Соединения по настоящему изобретению могут существовать в виде одного или нескольких кристаллических полиморфов. В настоящем изобретении предусмотрены как отдельные полиморфы, так и смеси полиморфов, в том числе смеси, обогащенные одним полиморфом относительно других. Для исчерпывающего обсуждения полиморфизма см. R. Hilfiker, Ed., *Polymorphism in the Pharmaceutical Industry*, Wiley-VCH, Weinheim, 2006.

Варианты осуществления настоящего изобретения, описанные в разделе "Сущность изобретения", включают описанные ниже. В следующих вариантах осуществления формула 1 включает ее стереоизомеры, *N*-оксиды и соли, и ссылка на "соединение формулы 1" включает определения заместителей, указанных в разделе "Сущность изобретения", если дополнительно не определено в вариантах осуществления.

Вариант осуществления 1. Соединение формулы 1, где R^1 представляет собой F, OR^6 или SR^6 .

Вариант осуществления 1a. Соединение формулы 1 или в соответствии с вариантом осуществления 1, где R^1 представляет собой F.

Вариант осуществления 1b. Соединение формулы 1 или в соответствии с вариантом осуществления 1, где R^1 представляет собой OR^6 .

Вариант осуществления 1c. Соединение формулы 1 или в соответствии с вариантом осуществления 1, где R^1 представляет собой SR^6 .

Вариант осуществления 2. Соединение формулы 1 или в соответствии с любым из предыдущих вариантов осуществления, где A представляет собой N или CR^3 .

Вариант осуществления 2a. Соединение формулы 1 или в соответствии с любым из предыдущих вариантов осуществления, где A представляет собой N.

Вариант осуществления 2b. Соединение формулы 1 или в соответствии с любым из предыдущих вариантов осуществления, где A представляет собой CR^3 .

Вариант осуществления 3. Соединение формулы 1 или в соответствии с любым из предыдущих вариантов осуществления, где R^2 представляет собой H, галоген, CN, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_3 - C_4 циклоалкил, C_3 - C_4 галогенциклоалкил, C_1 - C_4 алкокси или C_1 - C_4 галогеналкокси.

Вариант осуществления 3a. Соединение формулы 1 или в соответствии с любым из предыдущих вариантов осуществления, где R^2 представляет собой H, галоген или C_1 - C_4 алкил.

Вариант осуществления 3b. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 3, где R^2 представляет собой H.

Вариант осуществления 3c. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 3, где R^2 представляет собой галоген.

Вариант осуществления 3d. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 3, где R^2 представляет собой C_1 - C_4 алкил.

Вариант осуществления 4. Соединение формулы 1 или в соответствии с любым из предыдущих вариантов осуществления, где R^3 представляет собой H, галоген, CN, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_3 - C_4 циклоалкил, C_3 - C_4 галогенциклоалкил, C_1 - C_4 алкокси или C_1 - C_4 галогеналкокси.

Вариант осуществления 4a. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 4, где R^3 представляет собой H, галоген, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_1 - C_4 алкокси или C_1 - C_4 галогеналкокси.

10 Вариант осуществления 4b. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 4a, где R^3 представляет собой H или галоген.

Вариант осуществления 4c. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 4b, где R^3 представляет собой H.

15 Вариант осуществления 4d. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 4a, где R^3 представляет собой галоген.

Вариант осуществления 4f. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 4d, где R^3 представляет собой F.

Вариант осуществления 4g. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 4d, где R^3 представляет собой Cl.

20 Вариант осуществления 4h. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 4d, где R^3 представляет собой Br.

Вариант осуществления 4i. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 4a, где R^3 представляет собой C_1 - C_4 алкил.

25 Вариант осуществления 4j. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 4i, где R^3 представляет собой Me.

Вариант осуществления 4k. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 4a, где R^3 представляет собой C_1 - C_4 галогеналкил.

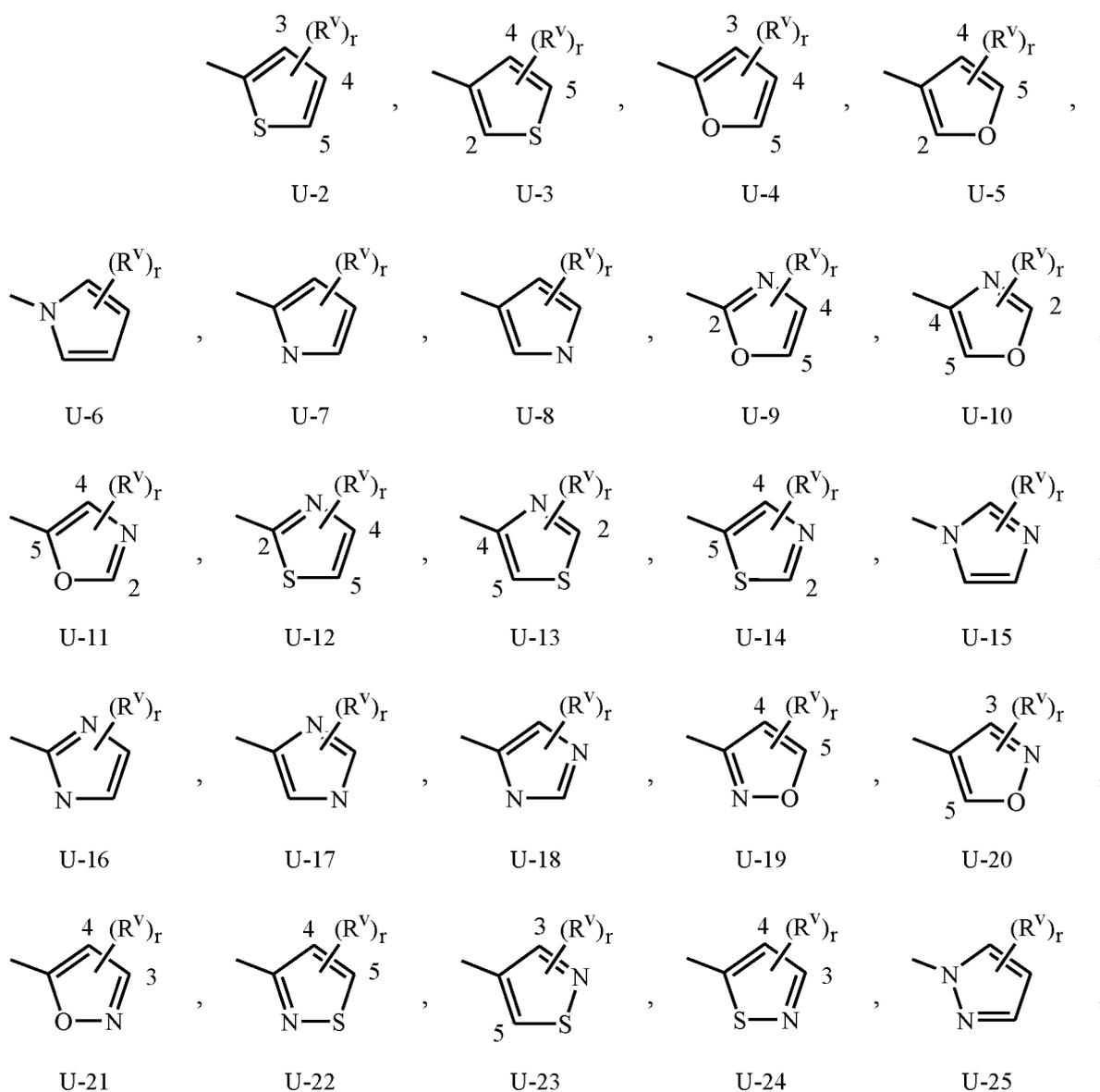
Вариант осуществления 4l. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 4k, где R^3 представляет собой CF_3 .

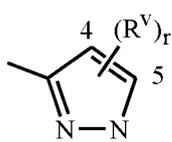
30 Вариант осуществления 5. Соединение формулы 1 или в соответствии с любым из предыдущих вариантов осуществления, где R^4 представляет собой 5-6-членное

гетероциклическое кольцо, при этом каждое кольцо содержит члены кольца, выбранные из атомов углерода и от 1 до 4 гетероатомов, независимо выбранных из не более чем 2 атомов O, не более чем 2 атомов S и не более чем 4 атомов N, при этом не более чем 2 члена кольца независимо выбраны из C(=O), C(=S), S(=O) и S(=O)₂, при этом каждое кольцо или кольцевая система необязательно замещены не более чем 5 заместителями, независимо выбранными из R^v, и r представляет собой количество заместителей.

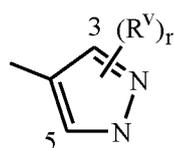
Вариант осуществления 5а. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 5, где R⁴ выбран из U-2 – U-49 или U52 – U61, показанных в приложении 1.

Приложение 1

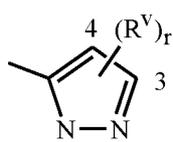




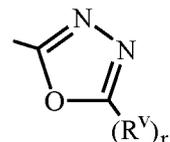
U-26



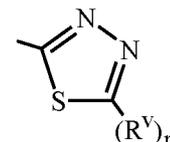
U-27



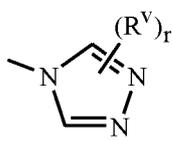
U-28



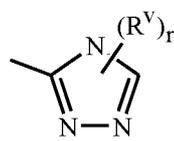
U-29



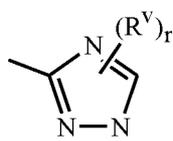
U-30



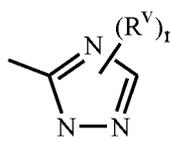
U-31



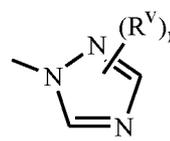
U-32



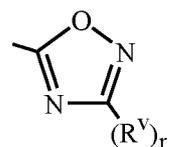
U-33



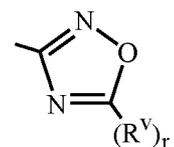
U-34



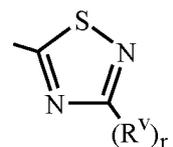
U-35



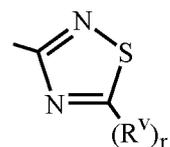
U-36



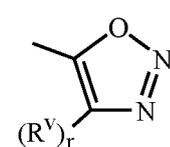
U-37



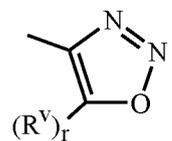
U-38



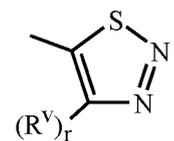
U-39



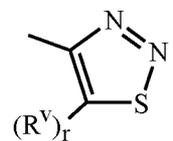
U-40



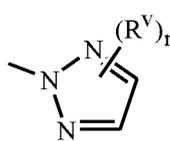
U-41



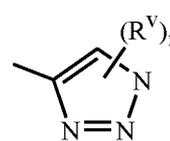
U-42



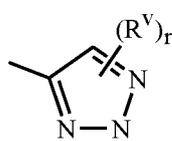
U-43



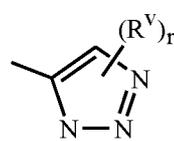
U-44



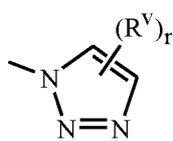
U-45



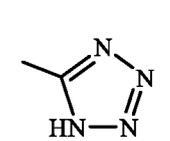
U-46



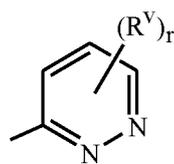
U-47



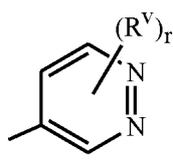
U-48



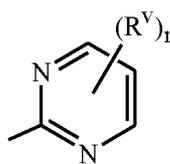
U-49



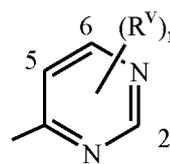
U-52



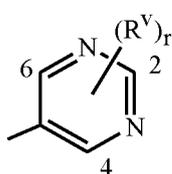
U-53



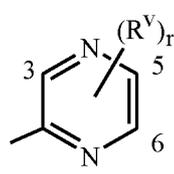
U-54



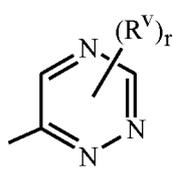
U-55



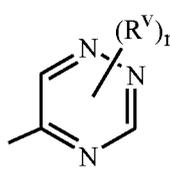
U-56



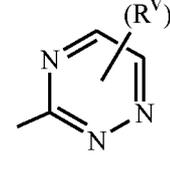
U-57



U-58

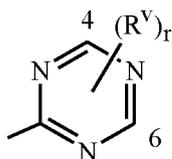


U-59



U-60

_H



U-61

Вариант осуществления 5b. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 5a, где R^4 выбран из U-2 – U-49.

Вариант осуществления 5c. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 5b, где R^4 выбран из U-2, U-3, U-4, U-5, U-7, U-9, U-11, U-12, U-13, U-16, U-21, U-25, U-26, U-27, U-28, U-29, U-31, U-32, U-35, U-36, U-37, U-44, U-48 и U-49.

Вариант осуществления 5d. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 5c, где R^4 выбран из U-9, U-11, U-32, U-36 и U-44.

Вариант осуществления 5e. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 5d, где R^4 выбран из U-9 и U-44.

Вариант осуществления 5f. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 5e, где R^4 представляет собой U-9.

Вариант осуществления 5g. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 5d, где R^4 представляет собой U-11.

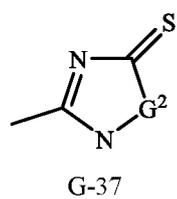
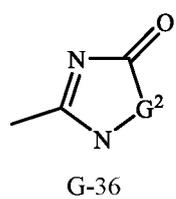
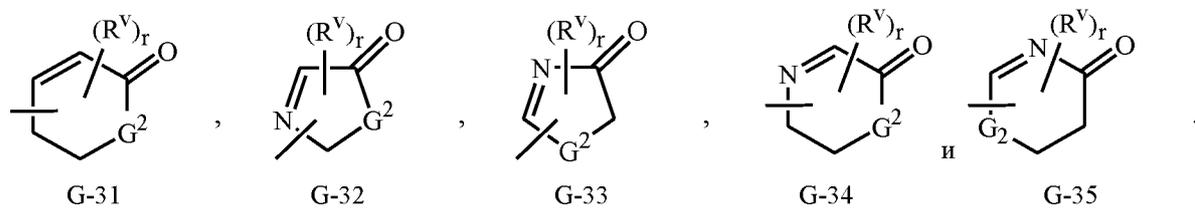
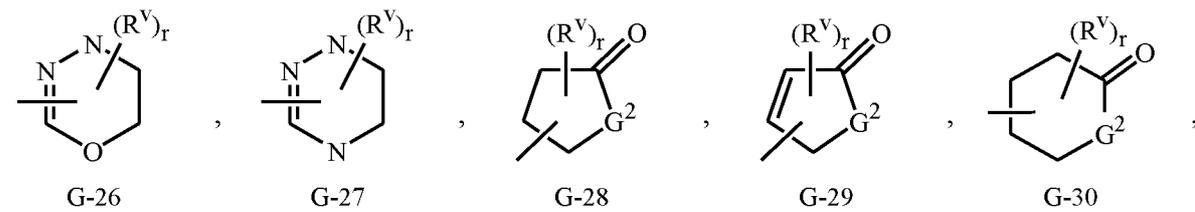
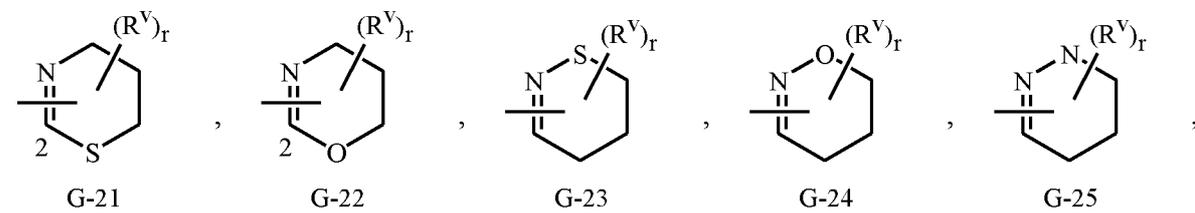
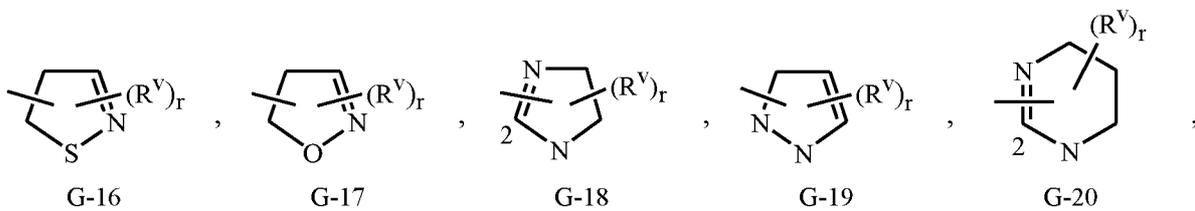
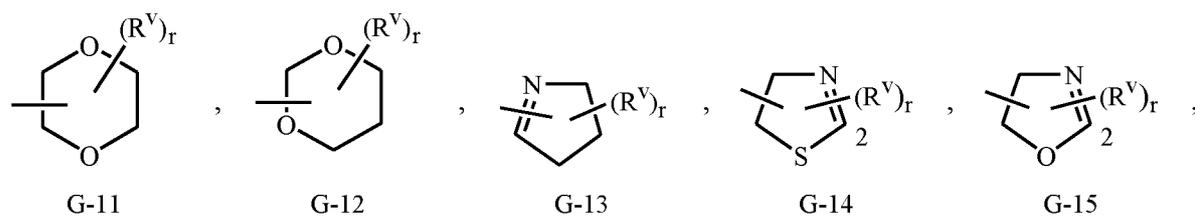
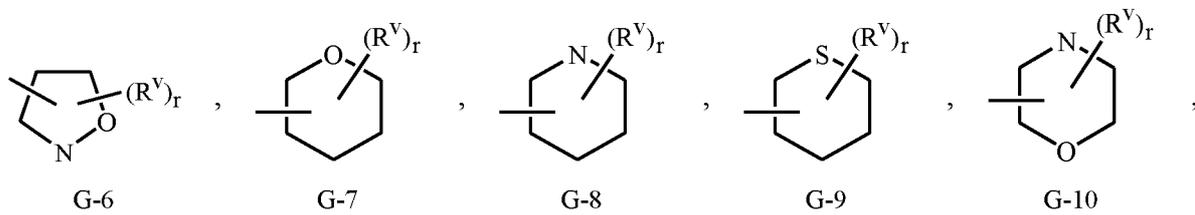
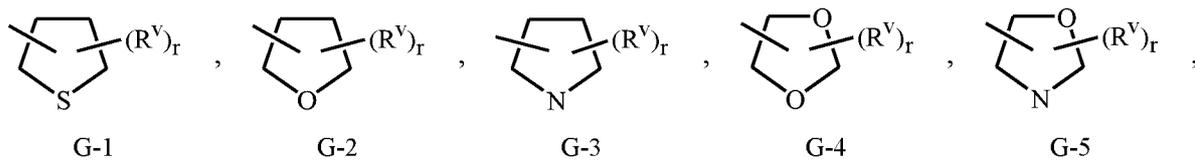
Вариант осуществления 5h. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 5d, где R^4 представляет собой U-32.

Вариант осуществления 5i. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 5d, где R^4 представляет собой U-36.

Вариант осуществления 5j. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 5d, где R^4 представляет собой U-44.

Вариант осуществления 5k. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 5, где R^4 выбран из G-1 – G-37, показанных в приложении 2.

Приложение 2



Вариант осуществления 5l. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 5k, где G^2 представляет собой O, S или N.

5 Вариант осуществления 5m. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 5l, где G^2 представляет собой O.

Вариант осуществления 5n. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 5l, где G^2 представляет собой S.

Вариант осуществления 5o. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 5l, где G^2 представляет собой N.

10 Вариант осуществления 6. Соединение формулы 1 или в соответствии с любым из предыдущих вариантов осуществления, где R^v независимо представляет собой H, галоген, C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 галогеналкил, C_1 - C_6 алкокси или C_1 - C_6 галогеналкокси.

Вариант осуществления 6a. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 6, где R^v представляет собой H.

15 Вариант осуществления 6b. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 6, где R^v представляет собой галоген.

Вариант осуществления 6c. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 6, где R^v представляет собой C_1 - C_6 алкил.

20 Вариант осуществления 6d. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 6c, где R^v представляет собой Me.

Вариант осуществления 7. Соединение формулы 1 или в соответствии с любым из вариантов осуществления 5 – 6d, где r равняется 1, 2, 3, 4 или 5.

Вариант осуществления 7a. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 7, где r равняется 1 или 2.

25 Вариант осуществления 7b. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 7, где r равняется 1.

Вариант осуществления 7c. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 7, где r равняется 2.

30 Вариант осуществления 7d. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 7, где r равняется 3.

Вариант осуществления 7e. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 7, где r равняется 4.

Вариант осуществления 7f. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 7, где r равняется 5.

5 Вариант осуществления 8. Соединение формулы **1** или в соответствии с любым из предыдущих вариантов осуществления, где R^5 представляет собой H, галоген, CN, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_3 - C_4 циклоалкил, C_3 - C_4 галогенциклоалкил, C_1 - C_4 алкокси или C_1 - C_4 галогеналкокси.

10 Вариант осуществления 8a. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 8, где R^5 представляет собой H, галоген, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_1 - C_4 алкокси или C_1 - C_4 галогеналкокси.

Вариант осуществления 8b. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 8a, где R^5 представляет собой H или галоген.

15 Вариант осуществления 8c. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 8b, где R^5 представляет собой H.

Вариант осуществления 8d. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 8b, где R^5 представляет собой галоген.

Вариант осуществления 8e. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 8d, где R^5 представляет собой F.

20 Вариант осуществления 8e. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 8d, где R^5 представляет собой Cl.

Вариант осуществления 8e. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 8d, где R^5 представляет собой Br.

25 Вариант осуществления 8e. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 8a, где R^5 представляет собой C_1 - C_4 алкил.

Вариант осуществления 9. Соединение формулы **1** или в соответствии с любым из предыдущих вариантов осуществления, где R^6 представляет собой C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_3 - C_4 циклоалкил или C_3 - C_4 галогенциклоалкил.

30 Вариант осуществления 9a. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 9, где R^6 представляет собой C_1 - C_4 алкил или C_1 - C_4 галогеналкил.

Вариант осуществления 9b. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 9, где R^6 представляет собой C_1 - C_4 алкил.

Вариант осуществления 9c. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 9b, где R^6 представляет собой Me.

5 Вариант осуществления 9d. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 9, где R^6 представляет собой C_1 - C_4 галогеналкил.

Вариант осуществления 9e. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 9b, где R^6 представляет собой CF_3 .

10 Вариант осуществления 10. Соединение формулы 1 или в соответствии с любым из предыдущих вариантов осуществления, где Q представляет собой шестичленное ароматическое кольцо с 0-2 атомами N в кольце, при этом каждое кольцо необязательно замещено при членах кольца, представляющих собой атомы углерода, не более чем 5 заместителями, независимо выбранными из R^w .

15 Вариант осуществления 10a. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 10, где Q представляет собой фенильное, пиридинильное, пиримидинильное или пиазинильное кольцо, при этом каждое кольцо необязательно замещено при членах кольца, представляющих собой атомы углерода, не более чем 5 заместителями, независимо выбранными из R^w .

20 Вариант осуществления 10b. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 10a, где Q представляет собой фенильное кольцо, необязательно замещенное при членах кольца, представляющих собой атомы углерода, не более чем 5 заместителями, независимо выбранными из R^w .

25 Вариант осуществления 10c. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 10a, где Q представляет собой пиридинильное кольцо, необязательно замещенное при членах кольца, представляющих собой атомы углерода, не более чем 5 заместителями, независимо выбранными из R^w .

30 Вариант осуществления 10d. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 10a, где Q представляет собой пиримидинильное кольцо, необязательно замещенное при членах кольца, представляющих собой атомы углерода, не более чем 5 заместителями, независимо выбранными из R^w .

Вариант осуществления 10e. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 10a, где Q представляет собой пиазинильное кольцо, необязательно

замещенное при членах кольца, представляющих собой атомы углерода, не более чем 5 заместителями, независимо выбранными из R^w.

5 Вариант осуществления 11. Соединение формулы 1 или в соответствии с любым из вариантов осуществления 9-9e, где R^w независимо представляет собой H, циано, галоген, C₁-C₆алкил, C₁-C₆алкокси, C₁-C₆галогеналкокси, C₁-C₆галогеналкил, C₂-C₆алкенил, C₂-C₆галогеналкенил, C₂-C₆алкинил, C₂-C₆галогеналкинил, C₂-C₆алкоксиалкокси, C₁-C₆алкилтио, C₁-C₆галогеналкилтио, C₃-C₆циклоалкилтио, C₁-C₆алкилсульфинил, C₁-C₆галогеналкилсульфинил, C₁-C₆алкилсульфонил, C₁-C₆галогеналкилсульфонил или C₃-C₆циклоалкилсульфонил.

10 Вариант осуществления 11a. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 11, где R^w представляет собой циано, галоген, C₁-C₆алкил, C₁-C₆алкокси, C₁-C₆галогеналкокси, C₁-C₆галогеналкил, C₂-C₆алкенил, C₂-C₆галогеналкенил, C₂-C₆алкинил, C₂-C₆галогеналкинил, C₁-C₆алкилтио, C₁-C₆галогеналкилтио, C₁-C₆алкилсульфинил, C₁-C₆галогеналкилсульфинил, C₁-C₆алкилсульфонил или C₁-C₆галогеналкилсульфонил.

15

Вариант осуществления 11b. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 11a, где R^w представляет собой C₁-C₆галогеналкокси, C₁-C₆галогеналкил, C₂-C₆алкенил, C₂-C₆галогеналкенил, C₂-C₆алкинил, C₂-C₆галогеналкинил, C₁-C₆алкилтио, C₁-C₆галогеналкилтио, C₁-C₆алкилсульфинил, C₁-C₆галогеналкилсульфинил, C₁-C₆алкилсульфонил, C₁-C₆галогеналкилсульфонил.

20

Вариант осуществления 11c. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 11b, где R^w представляет собой C₁-C₆галогеналкокси, C₁-C₆галогеналкил, C₂-C₆галогеналкенил, C₂-C₆галогеналкинил, C₁-C₆галогеналкилтио, C₁-C₆галогеналкилсульфинил, C₁-C₆галогеналкилсульфонил.

25 Вариант осуществления 11d. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 11c, где R^w представляет собой OCF₃, SCF₃, CF₃, SOCF₃ или SO₂CF₃.

Вариант осуществления 11e. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 11d, где R^w представляет собой OCF₃.

30 Вариант осуществления 11f. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 11d, где R^w представляет собой SCF₃.

Вариант осуществления 11g. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 11d, где R^w представляет собой CF₃.

Вариант осуществления 11h. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 11d, где R^w представляет собой SO_2CF_3 или SO_2CF_3 .

Вариант осуществления 12. Соединение формулы **1** или в соответствии с любым из предыдущих вариантов осуществления, где s равняется 1, 2, 3, 4 или 5.

5 Вариант осуществления 12a. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 12, где r равняется 1 или 2.

Вариант осуществления 12b. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 12, где r равняется 1.

10 Вариант осуществления 12c. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 12, где r равняется 2.

Вариант осуществления 12d. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 12, где r равняется 3.

Вариант осуществления 12e. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 12, где r равняется 4.

15 Вариант осуществления 12f. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 12, где r равняется 5.

Вариант осуществления 13. Соединение формулы **1** или в соответствии с любым из предыдущих вариантов осуществления, где n равняется 0, 1 или 2.

20 Вариант осуществления 13a. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 13, где n равняется 0.

Вариант осуществления 13b. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 13, где n равняется 1.

Вариант осуществления 13c. Соединение в соответствии с вариантом осуществления 13, где n равняется 2.

25 Вариант осуществления A1. Соединение в соответствии с любым из вариантов осуществления 1-13c, где соединение формулы **1** представляет собой соединение формулы **1a**.

30 Вариант осуществления A2. Соединение в соответствии с любым из вариантов осуществления 1-13c, где соединение формулы **1** представляет собой соединение формулы **1a'**.

Вариант осуществления А3. Композиция, содержащая соединение формулы **1a** и соединение формулы **1a'**.

5 Вариант осуществления А3а. Композиция в соответствии с вариантом осуществления А3, где отношение соединения формулы **1a** к соединению формулы **1a'** составляет более чем 60:40.

Вариант осуществления А3b. Композиция в соответствии с вариантом осуществления А3а, где отношение соединения формулы **1a** к соединению формулы **1a'** составляет более чем 80:20.

10 Вариант осуществления А3с. Композиция в соответствии с вариантом осуществления А3а, где отношение соединения формулы **1a** к соединению формулы **1a'** составляет более чем 90:10.

Вариант осуществления А3d. Композиция в соответствии с вариантом осуществления А3а, где отношение соединения формулы **1a** к соединению формулы **1a'** составляет более чем 99:1.

15 Вариант осуществления А4. Композиция, содержащая соединение формулы **1a'** и соединение формулы **1a**.

Вариант осуществления А4а. Композиция в соответствии с вариантом осуществления А4, где отношение соединения формулы **1a'** к соединению формулы **1a** составляет более чем 60:40.

20 Вариант осуществления А4b. Композиция в соответствии с вариантом осуществления А4, где отношение соединения формулы **1a'** к соединению формулы **1a** составляет более чем 80:20.

25 Вариант осуществления А4с. Композиция в соответствии с вариантом осуществления А4, где отношение соединения формулы **1a'** к соединению формулы **1a** составляет более чем 90:10.

Вариант осуществления А4d. Композиция в соответствии с вариантом осуществления А4, где отношение соединения формулы **1a'** к соединению формулы **1a** составляет более чем 99:1.

30 Вариант осуществления X. Способ обеспечения контроля беспозвоночного вредителя, предусматривающий приведение в контакт беспозвоночного вредителя или его окружающей среды с биологически эффективным количеством соединения формулы **1**.

Вариант осуществления X1. Способ в соответствии с вариантом осуществления X, где беспозвоночный вредитель является членом отряда Hemiptera.

Вариант осуществления X2. Способ в соответствии с вариантом осуществления X1, где член отряда Hemiptera является членом подотряда Homoptera.

5 Вариант осуществления X2a. Способ в соответствии с вариантом осуществления X2, где подотряд Homoptera предусматривает цикадок из семейств Cicadellidae и Delphacidae.

Вариант осуществления X2b. Способ в соответствии с вариантом осуществления X2, где подотряд Homoptera предусматривает тлей из семейства Aphididae.

10 Вариант осуществления X2c. Способ в соответствии с вариантом осуществления X2, где подотряд Homoptera предусматривает белокрылок из семейства Aleyrodidae.

Вариант осуществления X3. Способ в соответствии с вариантом осуществления X2, где подотряд Homoptera предусматривает СРН, СМА, GPA и WF.

Вариант осуществления X4. Способ в соответствии с вариантом осуществления X2, где подотряд Homoptera предусматривает *Aphis fabae* Scopoli (тлю бобовую), *Aphis gossypii* Glover (тлю хлопковую или тлю бахчевую), *Bemisia tabaci* Gennadius (белокрылку табачную, белокрылку бататовую), *Bemisia argentifolii* Bellows & Perring (белокрылку магнолиевую), *Dialeurodes citri* Ashmead (белокрылку цитрусовую) и *Trialeurodes vaporariorum* Westwood (белокрылку тепличную); *Empoasca fabae* Harris (цикадку картофельную), *Laodelphax striatellus* Fallen (цикадку малую коричневую), *Macrostelus quadrilineatus* Forbes (цикадку астровую), *Nephotettix cincticeps* Uhler (цикадку рисовую зеленую), *Nephotettix nigropictus* Stål (цикадку рисовую), *Nilaparvata lugens* Stål (цикадку коричневую), *Peregrinus maidis* Ashmead (цикадку кукурузную), *Sogatella furcifera* Horvath (цикадку белоспинную), *Tagosodes orizicolus* Muir (дельфацида рисового), *Typhlocyba pomaria* McAtee (цикадку белую яблоневую) или *Erythroneura* spp. (виноградных цикадок).

15
20
25

Вариант осуществления X5. Способ в соответствии с вариантом осуществления X1, где Hemiptera является членом подотряда Heteroptera.

Вариант осуществления X5a. Способ в соответствии с вариантом осуществления X5, где подотряд Heteroptera предусматривает *Acrosternum hilare* Say (клопа-щитника), *Anasa tristis* De Geer (клопа-ромбовика печального), *Blissus leucopterus leucopterus* Say (клопа-черепашку), *Cimex lectularius* Linnaeus (клопа постельного) *Corythucha gossypii*

30

Fabricius (клопа хлопкового), *Cyrtopeltis modesta* Distant (клопа томатного), *Dichelops melacanthus* Dallas (клопа зеленобрюхого), *Dysdercus suturellus* Herrich-Schäffer (красноклопа хлопкового), *Euschistus heros* Fabricius (щитника коричневого неотропического), *Euschistus servus* Say (щитника коричневого), *Euschistus variolarius* Palisot de Beauvois (щитника однопятнистого), *Graptostethus* spp. (комплекс наземников), *Halyomorpha halys* Stål (клопа коричневого мраморного), *Leptoglossus corculus* Say (клопа-краевика семян сосны), *Lygus lineolaris* Palisot de Beauvois (клопа полевого), *Nezara viridula* Linnaeus (щитника южного зеленого), *Oebalus pugnax* Fabricius (щитника рисового), *Oncopeltus fasciatus* Dallas (клопа-солдатика),
 5 *Pseudatomoscelis seriatus* Reuter (слепняка хлопкового).
 10

Вариант осуществления X6. Способ в соответствии с вариантом осуществления X5, где подотряд Heteroptera предусматривает щитников из семейства Pentatomidae.

Вариант осуществления X7. Способ в соответствии с вариантом осуществления X6, где подотряд Heteroptera предусматривает *Acrosternum hilare* Say (клопа-щитника),
 15 *Dichelops melacanthus* Dallas (клопа зеленобрюхого), *Euschistus heros* Fabricius (щитника коричневого неотропического), *Euschistus servus* Say (щитника коричневого), *Euschistus variolarius* Palisot de Beauvois (щитника однопятнистого), *Halyomorpha halys* Stål (клопа коричневого мраморного), *Nezara viridula* Linnaeus (щитника южного зеленого), *Oebalus pugnax* Fabricius (щитника рисового).

Вариант осуществления X8. Способ в соответствии с вариантом осуществления X5, где подотряд Heteroptera предусматривает *Anasa tristis* De Geer (клопа-ромбовика печального), *Blissus leucopterus* Say (клопа-черепашку), *Cimex lectularius* Linnaeus (клопа постельного), *Corythuca gossypii* Fabricius (клопа хлопкового), *Cyrtopeltis modesta* Distant (клопа томатного), *Dysdercus suturellus* Herrich-Schaffer (красноклопа хлопкового), *Graptostethus* spp. (комплекс наземников), *Leptoglossus corculus* Say (клопа-краевика семян сосны), *Lygus lineolaris* Palisot de Beauvois (клопа полевого), *Oncopeltus fasciatus* Dallas (клопа-солдатика) или *Pseudatomoscelis seriatus* Reuter (слепняка хлопкового).
 20
 25

Варианты осуществления настоящего изобретения, в том числе представленные выше варианты осуществления 1 – X8, а также любые другие варианты осуществления, описанные в данном документе, можно объединять любым образом, и описания переменных в вариантах осуществления относятся не только к соединениям формулы 1, но также к исходным соединениям и промежуточным соединениям,
 30

пригодным для получения соединений формулы 1. Кроме того, варианты осуществления настоящего изобретения, в том числе представленные выше варианты осуществления 1 – X8, а также любые другие варианты осуществления, описанные в данном документе, и любая их комбинация относятся к композициям и способам по настоящему изобретению.

Комбинации вариантов осуществления 1 – X8 проиллюстрированы с помощью следующего.

Вариант осуществления А. Соединение формулы 1, где

R^1 представляет собой F;

10 A представляет собой CR^3 ;

R^2 представляет собой H, галоген, CN, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_3 - C_4 циклоалкил, C_3 - C_4 галогенциклоалкил, C_1 - C_4 алкокси или C_1 - C_4 галогеналкокси;

15 R^3 представляет собой H, галоген, CN, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_3 - C_4 циклоалкил, C_3 - C_4 галогенциклоалкил, C_1 - C_4 алкокси или C_1 - C_4 галогеналкокси;

20 R^4 представляет собой 5-6-членное гетероциклическое кольцо, при этом каждое кольцо содержит члены кольца, выбранные из атомов углерода и от 1 до 4 гетероатомов, независимо выбранных из не более чем 2 атомов O, не более чем 2 атомов S и не более чем 4 атомов N, при этом не более чем 2 члена кольца независимо выбраны из $C(=O)$, $C(=S)$, $S(=O)$ и $S(=O)_2$, при этом каждое кольцо или кольцевая система необязательно замещены не более чем 5 заместителями, независимо выбранными из R^v , и g представляет собой количество заместителей;

25 каждый R^v независимо представляет собой H, галоген, C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 галогеналкил, C_1 - C_6 алкокси или C_1 - C_6 галогеналкокси;

g равняется 1, 2, 3, 4 или 5;

30 R^5 представляет собой H, галоген, CN, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_3 - C_4 циклоалкил, C_3 - C_4 галогенциклоалкил, C_1 - C_4 алкокси или C_1 - C_4 галогеналкокси;

Q представляет собой шестичленное ароматическое кольцо с 0-2 N в кольце, при этом каждое кольцо необязательно замещено при членах кольца, представляющих собой атомы углерода, не более чем 5 заместителями, независимо выбранными из R^w ;

R^w независимо представляет собой циано, галоген, C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 галогеналкокси, C_1 - C_6 галогеналкил, C_2 - C_6 алкенил, C_2 - C_6 галогеналкенил, C_2 - C_6 алкинил, C_2 - C_6 галогеналкинил, C_1 - C_6 алкилтио, C_1 - C_6 галогеналкилтио, C_1 - C_6 алкилсульфинил, C_1 - C_6 галогеналкилсульфинил, C_1 - C_6 алкилсульфонил или C_1 - C_6 галогеналкилсульфонил;

5

s равняется 1, 2, 3, 4 или 5;

n равняется 0, 1 или 2.

Вариант осуществления В. Соединение в соответствии с вариантом

10

осуществления А, где

R^2 представляет собой Н, галоген или C_1 - C_4 алкил;

R^3 представляет собой Н, галоген, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_1 - C_4 алкокси или C_1 - C_4 галогеналкокси;

R^4 выбран из U-2 – U-49 или U52 – U61, показанных в приложении 1;

15

г равняется 1 или 2;

R^5 представляет собой Н, галоген, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_1 - C_4 алкокси или C_1 - C_4 галогеналкокси;

R^w представляет собой C_1 - C_6 галогеналкокси, C_1 - C_6 галогеналкил, C_2 - C_6 галогеналкенил, C_2 - C_6 галогеналкинил, C_1 - C_6 галогеналкилтио, C_1 - C_6 галогеналкилсульфинил, C_1 - C_6 галогеналкилсульфонил;

20

s равняется 1 или 2.

Вариант осуществления С. Соединение в соответствии с вариантом

осуществления В, где

25

R^2 представляет собой Н;

R^3 представляет собой Н или галоген;

R^4 выбран из U-2 – U-49;

R^v представляет собой Н;

R^5 представляет собой Н или галоген;

30

Q представляет собой фенильное, пиридиное, пиримидиное или пиазининое кольцо, при этом каждое кольцо необязательно замещено при членах кольца, представляющих собой атомы углерода, не более чем 5 заместителями, независимо выбранными из R^w ;

R^w представляет собой OCF_3 , SCF_3 , CF_3 , $SOCF_3$ или SO_2CF_3 .

35

Вариант осуществления D. Соединение в соответствии с вариантом

осуществления B, где

R^2 представляет собой H;

R^3 представляет собой H или галоген;

5 R^4 выбран из U-2 – U-49;

R^v представляет собой C_1 - C_6 алкил;

R^5 представляет собой H;

10 Q представляет собой фенильное, пиридиное, пиримидиное или пиразинное кольцо, при этом каждое кольцо обязательно замещено при членах кольца, представляющих собой атомы углерода, не более чем 5 заместителями, независимо выбранными из R^w ;

Вариант осуществления E. Соединение в соответствии с вариантом осуществления C, где

15 R^3 представляет собой галоген;

R^4 выбран из U-2, U-3, U-4, U-5, U-7, U-9, U-11, U-12, U-13, U-16, U-21, U-25, U-26, U-27, U-28, U-29, U-31, U-32, U-35, U-36, U-37, U-44, U-48 и U-49;

R^5 представляет собой H;

20 Q представляет собой фенильное, пиридиное, пиримидиное или пиразинное кольцо, при этом каждое кольцо обязательно замещено при членах кольца, представляющих собой атомы углерода, не более чем 5 заместителями, независимо выбранными из R^w .

Вариант осуществления F. Соединение в соответствии с вариантом осуществления E, где

25 R^3 представляет собой F;

R^4 выбран из U-9, U-11, U-32, U-36 и U-44;

30 Q представляет собой фенильное кольцо, обязательно замещенное при членах кольца, представляющих собой атомы углерода, не более чем 5 заместителями, независимо выбранными из R^w .

Вариант осуществления G. Соединение в соответствии с вариантом

осуществления F, где

R^4 выбран из U-9 и U-44.

Вариант осуществления Н. Соединение в соответствии с вариантом осуществления G, где

R^4 выбран из группы, состоящей из U-9.

5 Вариант осуществления I. Соединение в соответствии с вариантом осуществления G, где

R^4 выбран из группы, состоящей из U-44.

Вариант осуществления J. Соединение в соответствии с вариантом осуществления B, где

10

R^2 представляет собой C_1 - C_4 алкил;

R^3 представляет собой H или галоген;

R^4 выбран из U-2 – U-49;

R^v представляет собой H;

15

г равняется 2;

R^5 представляет собой H;

Q представляет собой фенильное, пиридицильное, пиримидинильное или пиразинильное кольцо, при этом каждое кольцо необязательно замещено при членах кольца, представляющих собой атомы углерода, не более чем 5

20

заместителями, независимо выбранными из R^w ;

R^w представляет собой OCF_3 , SCF_3 , CF_3 , $SOCF_3$ или SO_2CF_3 .

Вариант осуществления AA. Соединение формулы 1, где

R^1 представляет собой OR^6 ;

25

A представляет собой CR^3 ;

R^2 представляет собой H, галоген, CN, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_3 - C_4 циклоалкил, C_3 - C_4 галогенциклоалкил, C_1 - C_4 алкокси или C_1 - C_4 галогеналкокси;

30

R^3 представляет собой H, галоген, CN, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_3 - C_4 циклоалкил, C_3 - C_4 галогенциклоалкил, C_1 - C_4 алкокси или C_1 - C_4 галогеналкокси;

R^4 представляет собой 5-6-членное гетероциклическое кольцо, при этом каждое кольцо содержит члены кольца, выбранные из атомов углерода и от 1 до 4 гетероатомов, независимо выбранных из не более чем 2 атомов O, не более

- чем 2 атомов S и не более чем 4 атомов N, при этом не более чем 2 члена кольца независимо выбраны из C(=O), C(=S), S(=O) и S(=O)₂, при этом каждое кольцо или кольцевая система необязательно замещены не более чем 5 заместителями, независимо выбранными из R^v, и г представляет собой количество заместителей;
- каждый R^v независимо представляет собой H, галоген, C₁-C₆алкил, C₁-C₆галогеналкил, C₁-C₆алкокси или C₁-C₆галогеналкокси;
- г равняется 1, 2, 3, 4 или 5;
- R⁵ представляет собой H, галоген, CN, C₁-C₄алкил, C₁-C₄галогеналкил, C₃-C₄циклоалкил, C₃-C₄галогенциклоалкил, C₁-C₄алкокси или C₁-C₄галогеналкокси;
- R⁶ представляет собой C₁-C₄алкил;
- Q представляет собой шестичленное ароматическое кольцо с 0-2 N в кольце, при этом каждое кольцо необязательно замещено при членах кольца, представляющих собой атомы углерода, не более чем 5 заместителями, независимо выбранными из R^w;
- R^w независимо представляет собой циано, галоген, C₁-C₆алкил, C₁-C₆алкокси, C₁-C₆галогеналкокси, C₁-C₆галогеналкил, C₂-C₆алкенил, C₂-C₆галогеналкенил, C₂-C₆алкинил, C₂-C₆галогеналкинил, C₁-C₆алкилтио, C₁-C₆галогеналкилтио, C₁-C₆алкилсульфинил, C₁-C₆галогеналкилсульфинил, C₁-C₆алкилсульфонил или C₁-C₆галогеналкилсульфонил;
- s равняется 1, 2, 3, 4 или 5;
- n равняется 0, 1 или 2.
- 25 Вариант осуществления ВВ. Соединение в соответствии с вариантом осуществления АА, где
- R² представляет собой H, галоген или C₁-C₄алкил;
- R³ представляет собой H, галоген, C₁-C₄алкил, C₁-C₄галогеналкил, C₁-C₄алкокси или C₁-C₄галогеналкокси;
- 30 R⁴ выбран из U-2 – U-49 или U52 – U61, показанных в приложении 1;
- г равняется 1 или 2;
- R⁵ представляет собой H, галоген, C₁-C₄алкил, C₁-C₄галогеналкил, C₁-C₄алкокси или C₁-C₄галогеналкокси;
- R⁶ представляет собой Me;

R^w представляет собой C_1 - C_6 галогеналкокси, C_1 - C_6 галогеналкил, C_2 - C_6 галогеналкенил, C_2 - C_6 галогеналкинил, C_1 - C_6 галогеналкилтио, C_1 - C_6 галогеналкилсульфинил, C_1 - C_6 галогеналкилсульфонил;
s равняется 1 или 2.

5

Вариант осуществления СС. Соединение в соответствии с вариантом осуществления ВВ, где

R^2 представляет собой H;

R^3 представляет собой H или галоген;

10

R^4 выбран из U-2 – U-49;

R^v представляет собой H;

r равняется 2;

R^5 представляет собой H или галоген;

15

Q представляет собой фенильное, пиридиное, пиримидиное или пиазининое кольцо, при этом каждое кольцо необязательно замещено при членах кольца, представляющих собой атомы углерода, не более чем 5 заместителями, независимо выбранными из R^w ;

R^w представляет собой OCF_3 , SCF_3 , CF_3 , $SOCF_3$ или SO_2CF_3 .

20

Вариант осуществления DD. Соединение в соответствии с вариантом осуществления ВВ, где

R^2 представляет собой H;

R^3 представляет собой H или галоген;

R^4 выбран из U-2 – U-49;

25

R^v представляет собой C_1 - C_6 алкил;

R^5 представляет собой H;

30

Q представляет собой фенильное, пиридиное, пиримидиное или пиазининое кольцо, при этом каждое кольцо необязательно замещено при членах кольца, представляющих собой атомы углерода, не более чем 5 заместителями, независимо выбранными из R^w .

Вариант осуществления EE. Соединение в соответствии с вариантом осуществления СС, где

R^3 представляет собой галоген;

R^4 выбран из U-2, U-3, U-4, U-5, U-7, U-9, U-11, U-12, U-13, U-16, U-21, U-25, U-26, U-27, U-28, U-29, U-31, U-32, U-35, U-36, U-37, U-44, U-48 и U-49;

R^5 представляет собой H;

5 Q представляет собой фенильное, пиридиное, пиримидиное или пиазининое кольцо, при этом каждое кольцо обязательно замещено при членах кольца, представляющих собой атомы углерода, не более чем 5 заместителями, независимо выбранными из R^w .

10 Вариант осуществления FF. Соединение в соответствии с вариантом осуществления EE, где

R^3 представляет собой F;

R^4 выбран из U-9 и U-44;

15 Q представляет собой фенильное кольцо, обязательно замещенное при членах кольца, представляющих собой атомы углерода, не более чем 5 заместителями, независимо выбранными из R^w .

Вариант осуществления GG. Соединение в соответствии с вариантом осуществления FF, где

R^4 выбран из группы, состоящей из U-9.

20

Вариант осуществления HH. Соединение в соответствии с вариантом осуществления FF, где

R^4 выбран из группы, состоящей из U-44.

25 Вариант осуществления AAA. Соединение формулы 1, где

R^1 представляет собой SR^6 ;

A представляет собой CR^3 ;

R^2 представляет собой H, галоген, CN, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_3 - C_4 циклоалкил, C_3 - C_4 галогенциклоалкил, C_1 - C_4 алкокси или C_1 -

30

C_4 галогеналкокси;

R^3 представляет собой H, галоген, CN, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_3 - C_4 циклоалкил, C_3 - C_4 галогенциклоалкил, C_1 - C_4 алкокси или C_1 - C_4 галогеналкокси;

- 5 R^4 представляет собой 5-6-членное гетероциклическое кольцо, при этом каждое кольцо содержит члены кольца, выбранные из атомов углерода и от 1 до 4 гетероатомов, независимо выбранных из не более чем 2 атомов O, не более чем 2 атомов S и не более чем 4 атомов N, при этом не более чем 2 члена кольца независимо выбраны из C(=O), C(=S), S(=O) и S(=O)₂, при этом каждое кольцо или кольцевая система необязательно замещены не более чем 5 заместителями, независимо выбранными из R^v , и g представляет собой количество заместителей;
- 10 каждый R^v независимо представляет собой H, галоген, C₁-C₆алкил, C₁-C₆галогеналкил, C₁-C₆алкокси или C₁-C₆галогеналкокси;
- g равняется 1, 2, 3, 4 или 5;
- R^5 представляет собой H, галоген, CN, C₁-C₄алкил, C₁-C₄галогеналкил, C₃-C₄циклоалкил, C₃-C₄галогенциклоалкил, C₁-C₄алкокси или C₁-C₄галогеналкокси;
- 15 R^6 представляет собой C₁-C₄алкил;
- Q представляет собой шестичленное ароматическое кольцо с 0-2 N в кольце, при этом каждое кольцо необязательно замещено при членах кольца, представляющих собой атомы углерода, не более чем 5 заместителями, независимо выбранными из R^w ;
- 20 R^w независимо представляет собой циано, галоген, C₁-C₆алкил, C₁-C₆алкокси, C₁-C₆галогеналкокси, C₁-C₆галогеналкил, C₂-C₆алкенил, C₂-C₆галогеналкенил, C₂-C₆алкинил, C₂-C₆галогеналкинил, C₁-C₆алкилтио, C₁-C₆галогеналкилтио, C₁-C₆алкилсульфинил, C₁-C₆галогеналкилсульфинил, C₁-C₆алкилсульфонил или C₁-C₆галогеналкилсульфонил;
- 25 s равняется 1, 2, 3, 4 или 5;
- n равняется 0, 1 или 2.

Вариант осуществления ВВВ. Соединение в соответствии с вариантом осуществления ААА, где

- 30 R^2 представляет собой H, галоген или C₁-C₄алкил;
- R^3 представляет собой H, галоген, C₁-C₄алкил, C₁-C₄галогеналкил, C₁-C₄алкокси или C₁-C₄галогеналкокси;
- R^4 выбран из U-2 – U-49 или U52 – U61, показанных в приложении 1;
- g равняется 1 или 2;

R^5 представляет собой H, галоген, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_1 - C_4 алкокси или C_1 - C_4 галогеналкокси;

R^6 представляет собой Me;

R^w представляет собой C_1 - C_6 галогеналкокси, C_1 - C_6 галогеналкил, C_2 - C_6 галогеналкенил, C_2 - C_6 галогеналкинил, C_1 - C_6 галогеналкилтио, C_1 - C_6 галогеналкилсульфинил, C_1 - C_6 галогеналкилсульфонил;

5

s равняется 1 или 2.

Вариант осуществления CCC. Соединение в соответствии с вариантом осуществления ВВВ, где

10

R^2 представляет собой H;

R^3 представляет собой H или галоген;

R^4 выбран из U-2 – U-49;

R^v представляет собой H;

15

г равняется 2;

R^5 представляет собой H;

Q представляет собой фенильное, пиридицильное, пиримидинильное или пиазинильное кольцо, при этом каждое кольцо необязательно замещено при членах кольца, представляющих собой атомы углерода, не более чем 5 заместителями, независимо выбранными из R^w ;

20

R^w представляет собой OCF_3 , SCF_3 , CF_3 , $SOCF_3$ или SO_2CF_3 .

Вариант осуществления DDD. Соединение в соответствии с вариантом осуществления ВВВ, где

25

R^2 представляет собой H;

R^3 представляет собой H или галоген;

R^4 выбран из U-2 – U-49;

R^v представляет собой C_1 - C_6 алкил;

R^5 представляет собой H;

30

Q представляет собой фенильное, пиридицильное, пиримидинильное или пиазинильное кольцо, при этом каждое кольцо необязательно замещено при членах кольца, представляющих собой атомы углерода, не более чем 5 заместителями, независимо выбранными из R^w ;

Вариант осуществления EEE. Соединение в соответствии с вариантом осуществления CCC, где

R^3 представляет собой галоген;

5 R^4 выбран из U-2, U-3, U-4, U-5, U-7, U-9, U-11, U-12, U-13, U-16, U-21, U-25, U-26, U-27, U-28, U-29, U-31, U-32, U-35, U-36, U-37, U-44, U-48 и U-49;

R^5 представляет собой H;

10 Q представляет собой фенильное, пиридиальное, пиримидиальное или пиазиниальное кольцо, при этом каждое кольцо необязательно замещено при членах кольца, представляющих собой атомы углерода, не более чем 5 заместителями, независимо выбранными из R^w .

Вариант осуществления FFF. Соединение в соответствии с вариантом осуществления EEE, где

R^3 представляет собой F;

15 R^4 выбран из U-9 и U-44;

Q представляет собой фенильное кольцо, необязательно замещенное при членах кольца, представляющих собой атомы углерода, не более чем 5 заместителями, независимо выбранными из R^w .

20 Вариант осуществления GGG. Соединение в соответствии с вариантом осуществления FFF, где

R^4 выбран из группы, состоящей из U-9.

25 Вариант осуществления HHH. Соединение в соответствии с вариантом осуществления FFF, где

R^4 выбран из группы, состоящей из U-44.

Конкретные варианты осуществления включают соединения формулы 1, выбранные из группы, состоящей из

30 3-фтор-4-[фтор-[4-(трифторметокси)фенил]метил]-5-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)пиридина;

3-хлор-4-[фтор-[4-(трифторметокси)фенил]метил]-5-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)пиридина;

35 3-фтор-4-[метокси-[4-(трифторметокси)фенил]метил]-5-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)пиридина;

3-фтор-4-[фтор-[4-[(трифторметил)тио]фенил]метил]-5-(2-оксазолил)пиридина;

3-фтор-4-[фтор-[4-[(трифторметил)тио]фенил]метил]-5-(2*H*-1,2,3-триазол-2-ил)пиридина;

5 3-хлор-4-[фтор-[4-[(трифторметил)тио]фенил]метил]-5-(2*H*-1,2,3-триазол-2-ил)пиридина;

3-фтор-4-[фтор-[4-(трифторметил)фенил]метил]-5-(2*H*-1,2,3-триазол-2-ил)пиридина;

3-фтор-4-[фтор-[4-(трифторметокси)фенил]метил]-5-(2-оксазолил)пиридина;

10 3-фтор-4-[фтор-[4-[(трифторметил)сульфинил]фенил]метил]-5-(2*H*-1,2,3-триазол-2-ил)пиридина;

3-фтор-4-[фтор-[4-(трифторметокси)фенил]метил]-5-(5-оксазолил)пиридина;

3-фтор-4-[фтор-[4-(трифторметокси)фенил]метил]-5-(3-метил-1,2,4-оксадиазол-5-ил)пиридина;

15 3-фтор-4-[метокси-[4-(трифторметокси)фенил]метил]-5-(2*H*-1,2,3-триазол-2-ил)пиридина;

3-хлор-4-[метокси-[4-(трифторметокси)фенил]метил]-5-(2*H*-1,2,3-триазол-2-ил)пиридина;

3-бром-4-[фтор-[4-[(трифторметил)тио]фенил]метил]-5-(2*H*-1,2,3-триазол-2-ил)пиридина и

20 3-фтор-4-[метокси-[4-[(трифторметил)тио]фенил]метил]-5-(1,2,4-оксадиазол-3-ил)пиридина.

Более конкретные варианты осуществления включают соединения формулы 1, выбранные из группы, состоящей из

25 3-фтор-4-[фтор-[4-(трифторметокси)фенил]метил]-5-(2*H*-1,2,3-триазол-2-ил)пиридина;

3-хлор-4-[фтор-[4-(трифторметокси)фенил]метил]-5-(2*H*-1,2,3-триазол-2-ил)пиридина;

30 3-фтор-4-[метокси-[4-(трифторметокси)фенил]метил]-5-(2*H*-1,2,3-триазол-2-ил)пиридина;

3-фтор-4-[фтор-[4-[(трифторметил)тио]фенил]метил]-5-(2-оксазолил)пиридина;

3-фтор-4-[фтор-[4-[(трифторметил)тио]фенил]метил]-5-(2*H*-1,2,3-триазол-2-ил)пиридина;

35 3-бром-4-[фтор-[4-[(трифторметил)тио]фенил]метил]-5-(2*H*-1,2,3-триазол-2-ил)пиридина.

Более конкретные варианты осуществления включают соединения формулы 1, выбранные из группы, состоящей из

- 3-фтор-4-[фтор-[4-(трифторметокси)фенил]метил]-5-(2*H*-1,2,3-триазол-2-ил)пиридина;
- 3-хлор-4-[фтор-[4-(трифторметокси)фенил]метил]-5-(2*H*-1,2,3-триазол-2-ил)пиридина;
- 3-хлор-4-[фтор-[4-[(трифторметил)тио]фенил]метил]-5-(2*H*-1,2,3-триазол-2-ил)пиридина;
- 3-фтор-4-[метокси-[4-(трифторметокси)фенил]метил]-5-(2*H*-1,2,3-триазол-2-ил)пиридина;
- 3-фтор-4-[фтор-[4-[(трифторметил)тио]фенил]метил]-5-(2-оксазол-2-ил)пиридина;
- 3-фтор-4-[фтор-[4-[(трифторметил)тио]фенил]метил]-5-(2*H*-1,2,3-триазол-2-ил)пиридина;
- 3-бром-4-[фтор-[4-[(трифторметил)тио]фенил]метил]-5-(2*H*-1,2,3-триазол-2-ил)пиридина.

Более конкретные варианты осуществления включают соединения формулы 1, выбранные из группы, состоящей из

- 3-фтор-4-[фтор-[4-(трифторметил)фенил]метил]-5-(2*H*-1,2,3-триазол-2-ил)пиридина;
- 3-фтор-4-[фтор-[4-(трифторметокси)фенил]метил]-5-(2-оксазол-2-ил)пиридина;
- 3-фтор-4-[фтор-[4-[(трифторметил)сульфинил]фенил]метил]-5-(2*H*-1,2,3-триазол-2-ил)пиридина;
- 3-фтор-4-[фтор-[4-(трифторметокси)фенил]метил]-5-(5-оксазол-2-ил)пиридина;
- 3-фтор-4-[фтор-[4-(трифторметокси)фенил]метил]-5-(3-метил-1,2,4-оксадиазол-5-ил)пиридина;
- 3-хлор-4-[метокси-[4-(трифторметокси)фенил]метил]-5-(2*H*-1,2,3-триазол-2-ил)пиридина и
- 3-фтор-4-[метокси-[4-[(трифторметил)тио]фенил]метил]-5-(1,2,4-оксадиазол-3-ил)пиридина;
- 3-фтор-4-[метокси-[4-(трифторметокси)фенил]метил]-5-(2*H*-1,2,3-триазол-2-ил)пиридина.

Вариант осуществления Y1. Композиция, содержащая соединение формулы 1 или любое соединение в соответствии с предыдущими вариантами осуществления и по меньшей мере один дополнительный компонент, выбранный из группы, состоящей из поверхностно-активных веществ, твердых разбавителей и жидких разбавителей, при этом указанная композиция необязательно дополнительно содержит по меньшей мере одно дополнительное биологически активное соединение или средство.

Вариант осуществления Y2. Композиция в соответствии с вариантом осуществления Y1, где по меньшей мере одно дополнительное биологически активное соединение или средство выбрано из группы, состоящей из абамектина, ацефата, ацеквиноцила, ацетамиприда, акринатрина, афидопиропена, амидофлумета, амитраза, авермектина, азадирахтина, азинфос-метила, бенфуракарба, бенсултапа, бифентрина, бифеназата, бистрифлуруна, бората, бромантранилипрола, бупрофезина, карбарила, карбофурана, картапа, карзола, хлорантранилипрола, хлорфенапира, хлорфлуазуруна, хлорпирифоса, хлорпирифос-метила, кромафенозида, клофентезина, клотианидина, циантранилипрола, цикланилипрола, циклопротрина, циклоксаприда, цифлуметофена, цифлутрина, бета-цифлутрина, цигалодиамида, цигалотрина, гамма-цигалотрина, лямбда-цигалотрина, циперметрина, альфа-циперметрина, дзета-циперметрина, цирوماзина, дельтаметрина, диафентиуруна, диазинона, дихлорантранилипрола, диелдрин, дифлубензуруна, димефлутрина, димегипо, диметоата, динотефурана, диофенолана, эмаектина, эндосульфана, эсфенвалерата, этипрола, этофенпрокса, этоксазола, фенбутатина оксида, фенитрогиона, фенотиокарба, феноксикарба, фенпропатрина, фенвалерата, фипронила, флометоквина, флоникамида, флубендиамида, флуцитрината, флуфенерима, флуфеноксуруна, флуфеноксистеробина, флуенсульфона, флуопирама, флупирадифуруна, флювалината, тау-флювалината, фонофоса, форметаната, фостиазата, галофенозида, гептафлутрина, гексафлумуруна, гекситиазокса, гидраметилнона, имидаклоприда, индоксакарба, инсектицидных мыл, изофенфоса, люфенуруна, малатиона, меперфлутрина, метафлумизона, метальдегида, метамидофоса, метидатиона, метиокарба, метомила, метопрена, метоксихлора, метоксифенозида, метофлутрина, монокротофоса, монофтортрина, никотина, *N*-[1,1-диметил-2-(метилтио)этил]-7-фтор-2-(3-пиридинил)-2*H*-индазол-4-карбоксамид, *N*-[1,1-диметил-2-(метилсульфинил)этил]-7-фтор-2-(3-пиридинил)-2*H*-индазол-4-карбоксамид, *N*-[1,1-диметил-2-(метилсульфонил)этил]-7-фтор-2-(3-пиридинил)-2*H*-индазол-4-карбоксамид, *N*-(1-метилциклопропил)-2-(3-пиридинил)-2*H*-индазол-4-карбоксамид, *N*-[1-(дифторметил)циклопропил]-2-(3-пиридинил)-2*H*-индазол-4-карбоксамид, нитенпирама, нитиазина, новалуруна, новифлумуруна, оксамила,

паратиона, паратион-метила, перметрина, фората, фозалона, фосмета, фосфамидона,
 пиримикарба, профенофоса, профлутрина, пропаргита, протрифенбута, пифлубумида,
 пиметрозина, пирафлупрола, пиретрина, пиридабена, пиридалила, пирифлуквиназона,
 приминостробина, пирипрола, пирипроксифена, ротенона, рианодина, силафлуофена,
 5 спинеторама, спиносада, спиродиклофена, спиромезифена, спиротетрамата,
 сульпрофоса, сульфоксафлора, тебуфенозида, тебуфенпирада, тефлубензурана,
 тефлутрина, тетрахлорантранилипрола, тетрахлорвинфоса, тетраметрина,
 тетраметилфлутрина, тиаклоприда, тиаметоксама, тиодикарба, тиосултап-натрия,
 тиоксазафена, толфенпирада, тралометрина, триазамата, трихлорфона,
 10 трифлумезопирима, трифлумурана, дельта-эндотоксинов *Bacillus thuringiensis*,
 энтомопатогенных бактерий, энтомопатогенных вирусов и энтомопатогенных грибов.

Вариант осуществления УЗ. Композиция в соответствии с вариантом
 осуществления У2, где по меньшей мере одно дополнительное биологически активное
 соединение или средство выбрано из группы, состоящей из абамектина, ацетамиприда,
 15 акринатрина, афидопиропена, амитраза, авермектина, азадирахтина, бенфуракарба,
 бенсултапа, бифентрина, бупрофезина, карбарила, картапа, хлорантранилипрола,
 хлорфенапира, хлорпирифоса, клотианидина, циантранилипрола, цикланилипрола,
 циклопротрина, цифлутрина, бета-цифлутрина, цигалотрина, гамма-цигалотрина,
 лямбда-цигалотрина, циперметрина, альфа-циперметрина, дзета-циперметрина,
 20 цирوماзина, дельтаметрина, диелдрин, динотефурана, диофенолана, эмамектин,
 эндосульфана, эсфенвалерата, этипрола, этофенпрокса, этоксазола, фенитротриона,
 фенотиокарба, феноксикарба, фенвалерата, фипронила, флометоквина, флоникамида,
 флубендиамида, флуфеноксурона, флуфеноксистробина, флуенсульфона, флупипрола,
 флупирадифурана, флювалината, форметаната, фостиазата, гептафлутрина,
 25 гексафлумурана, гидраметилнона, имидаклоприда, индоксакарба, люфенурана,
 меперфлутрина, метафлумизона, метиокарба, метомила, метопрена, метоксифенозида,
 метофлутрина, монофтортрина, нитенпирама, нитиазина, новалурона, оксамила,
 пифлубумида, пиметрозина, пиретрина, пиридабена, пиридалила, приминостробина,
 пирипроксифена, рианодина, спинеторама, спиносада, спиродиклофена,
 30 спиромезифена, спиротетрамата, сульфоксафлора, тебуфенозида, тетраметрина,
 тетраметилфлутрина, тиаклоприда, тиаметоксама, тиодикарба, тиосултап-натрия,
 тралометрина, триазамата, трифлумезопирима, трифлумурана, дельта-эндотоксинов
Bacillus thuringiensis, всех штаммов *Bacillus thuringiensis* и всех штаммов вирусов
 ядерного полиэдроса.

Вариант осуществления Y4. Композиция в соответствии с любым из вариантов осуществления Y1 – Y3, дополнительно содержащая жидкое удобрение.

Вариант осуществления Y5. Композиция в соответствии с вариантом осуществления Y4, где жидкое удобрение имеет водную основу.

5 Вариант осуществления Y6. Состав для увлажнения почвы, содержащий композицию в соответствии с любым из вариантов осуществления Y1 – Y3.

Вариант осуществления Y7. Композиция для распыления, содержащая композицию в соответствии с любым из вариантов осуществления Y1 – Y3 и пропеллент.

10 Вариант осуществления Y8. Композиция-приманка, содержащая композицию в соответствии с любым из вариантов осуществления Y1 – Y3, один или несколько пищевых материалов, необязательно аттрактант и необязательно увлажняющее средство.

Вариант осуществления Y9. Устройство-ловушка для обеспечения контроля
15 беспозвоночного вредителя, содержащая: композицию-приманку в соответствии с вариантом осуществления Y8 и корпус, приспособленный для помещения указанной композиции-приманки, где корпус имеет по меньшей мере одно отверстие, размер которого обеспечивает возможность беспозвоночному вредителю проходить через
20 отверстие таким образом, что беспозвоночный вредитель может получить доступ к указанной композиции-приманке из места за пределами корпуса, и где корпус дополнительно приспособлен для размещения в участке потенциальной или известной активности беспозвоночного вредителя или рядом с ним.

Вариант осуществления Y10. Композиция, содержащая композицию в соответствии с любым из вариантов осуществления Y1 – Y3, где композиция
25 представляет собой твердую композицию, выбранную из пылевидных препаратов, порошков, гранул, пеллет, приллированных препаратов, пастилок, таблеток и наполненных пленок.

Вариант осуществления Y11. Композиция в соответствии с вариантом осуществления Y10, где композиция является диспергируемой в воде или
30 растворимой в воде.

Вариант осуществления Y12. Жидкий или сухой состав, содержащий композицию в соответствии с любым из вариантов осуществления Y1 – Y3, для применения в системе капельного орошения, при вспахивании во время высаживания,
35 в ручном опрыскивателе, ранцевом опрыскивателе, штанговом опрыскивателе,

наземном опрыскивателе, для внесения с воздуха, с помощью беспилотного летательного аппарата или для обработки семян.

5 Вариант осуществления Y13. Жидкий или сухой состав в соответствии с вариантом осуществления Y12, где указанный состав распыляется в сверхмалом объеме.

10 Следует отметить, что соединения по настоящему изобретению характеризуются благоприятными метаболическими и/или остаточными профилями почвы и проявляют активность, обеспечивающую контроль спектра агрономических и неагрономических беспозвоночных вредителей.

15 Особо следует отметить, что по причинам спектра контроля беспозвоночного вредителя и экономической важности защита агрономических сельскохозяйственных культур от ущерба или повреждения, вызванного беспозвоночными вредителями, посредством обеспечения контроля беспозвоночных вредителей является вариантами осуществления настоящего изобретения. Соединения по настоящему изобретению вследствие их благоприятных свойств перемещения или системности в растениях также обеспечивают защиту листьев или других частей растения, которые непосредственно не контактируют с соединением формулы 1 или композицией, содержащей соединение.

25 Также заслуживают внимания в качестве вариантов осуществления настоящего изобретения композиции, содержащие соединение в соответствии с любым из предыдущих вариантов осуществления, а также в соответствии с любыми другими вариантами осуществления, описанными в данном документе, и в соответствии с любыми их комбинациями и по меньшей мере один дополнительный компонент, выбранный из группы, состоящей из поверхностно-активного вещества, твердого разбавителя и жидкого разбавителя, при этом указанные композиции необязательно дополнительно содержат по меньшей мере одно дополнительное биологически активное соединение или средство.

30 Кроме того, заслуживают внимания в качестве вариантов осуществления настоящего изобретения композиции для обеспечения контроля беспозвоночного вредителя, содержащие соединение в соответствии с любым из предыдущих вариантов осуществления, а также в соответствии с любыми другими вариантами осуществления, описанными в данном документе, и в соответствии с любыми их комбинациями и по меньшей мере один дополнительный компонент, выбранный из

35

группы, состоящей из поверхностно-активного вещества, твердого разбавителя и жидкого разбавителя, при этом указанные композиции необязательно дополнительно содержат по меньшей мере одно дополнительное биологически активное соединение или средство. Варианты осуществления настоящего изобретения дополнительно предусматривают способы обеспечения контроля беспозвоночного вредителя, включающие приведение в контакт беспозвоночного вредителя или его окружающей среды с биологически эффективным количеством соединения в соответствии с любым из предыдущих вариантов осуществления (например, в виде композиции, описанной в данном документе).

10 Варианты осуществления настоящего изобретения также предусматривают композицию, содержащую соединение по любому из предыдущих вариантов осуществления, в форме жидкого состава для увлажнения почвы. Варианты осуществления настоящего изобретения дополнительно предусматривают способы обеспечения контроля беспозвоночного вредителя, предусматривающие приведение 15 почвы в контакт с жидкой композицией в виде средства для увлажнения почвы, содержащей биологически эффективное количество соединения в соответствии с любым из предыдущих вариантов осуществления.

Варианты осуществления настоящего изобретения также предусматривают композицию для распыления для обеспечения контроля беспозвоночного вредителя, 20 содержащую биологически эффективное количество соединения в соответствии с любым из предыдущих вариантов осуществления и пропеллент. Варианты осуществления настоящего изобретения дополнительно предусматривают композицию-приманку для обеспечения контроля беспозвоночного вредителя, содержащую биологически эффективное количество соединения в соответствии с 25 любым из предыдущих вариантов осуществления, один или несколько пищевых материалов, необязательно аттрактант и необязательно увлажняющее средство. Варианты осуществления настоящего изобретения также предусматривают устройство для обеспечения контроля беспозвоночного вредителя, содержащее указанную композицию-приманку и корпус, приспособленный для помещения указанной 30 композиции-приманки, где корпус имеет по меньшей мере одно отверстие, размер которого обеспечивает возможность беспозвоночному вредителю проходить через отверстие таким образом, что беспозвоночный вредитель может получить доступ к указанной композиции-приманке из места за пределами корпуса, и где корпус дополнительно приспособлен для размещения в участке потенциальной или известной 35 активности беспозвоночного вредителя или рядом с ним.

Варианты осуществления настоящего изобретения также предусматривают способы обеспечения защиты семени от беспозвоночного вредителя, предусматривающие приведение семени в контакт с биологически эффективным количеством соединения в соответствии с любым из предыдущих вариантов осуществления.

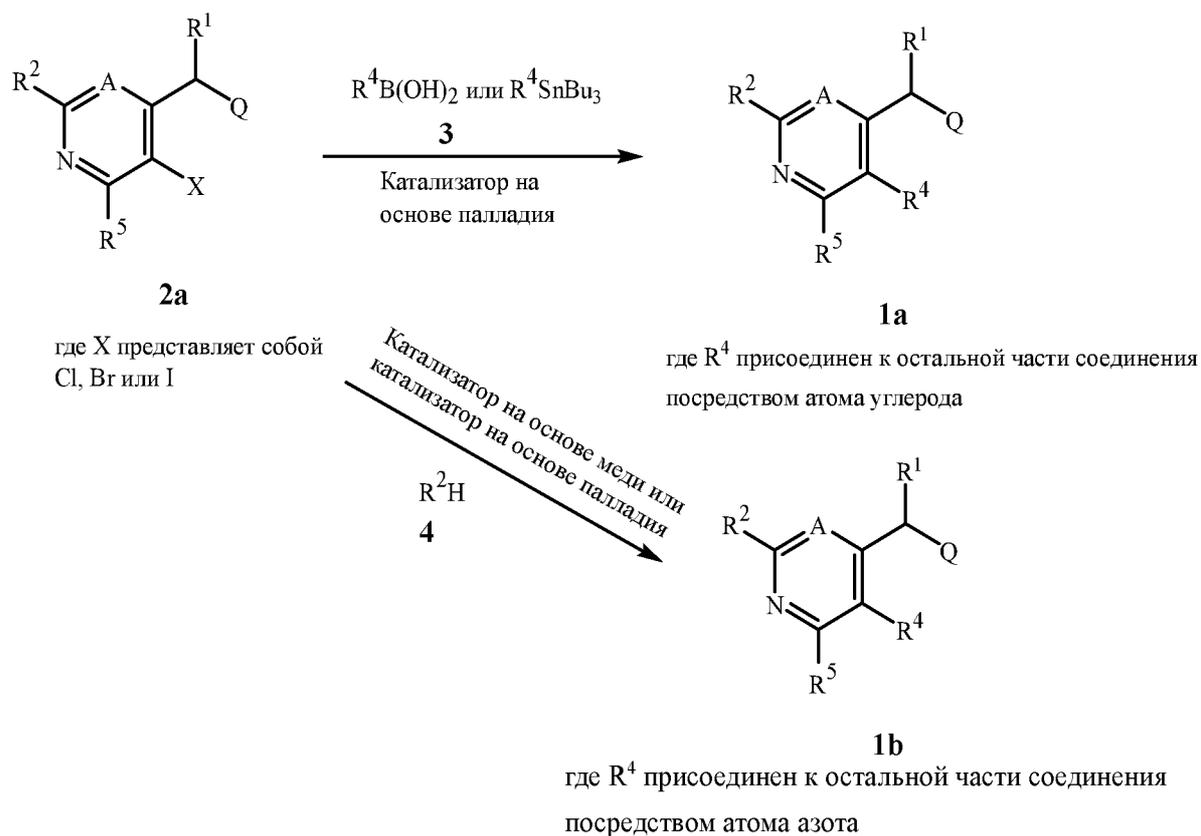
Варианты осуществления настоящего изобретения также предусматривают способы обеспечения защиты животного от беспозвоночного паразитического вредителя, предусматривающие введение животному паразитоцидно эффективного количества соединения в соответствии с любым из предыдущих вариантов осуществления.

Варианты осуществления настоящего изобретения также включают способы обеспечения контроля беспозвоночного вредителя, предусматривающие приведение в контакт беспозвоночного вредителя или его окружающей среды с биологически эффективным количеством соединения формулы **1**, его *N*-оксида или соли (например, в виде композиции, описанной в данном документе) при условии, что способы не являются способами медицинского лечения организма человека или животного посредством терапии.

Настоящее изобретение также относится к таким способам, где беспозвоночного вредителя или окружающую его среду приводят в контакт 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 веществ, твердых разбавителей и жидких разбавителей, при этом указанная композиция необязательно дополнительно содержит биологически эффективное количество по меньшей мере одного дополнительного биологически активного соединения или средства, при условии, что способы не являются способами медицинского лечения организма человека или животного посредством терапии.

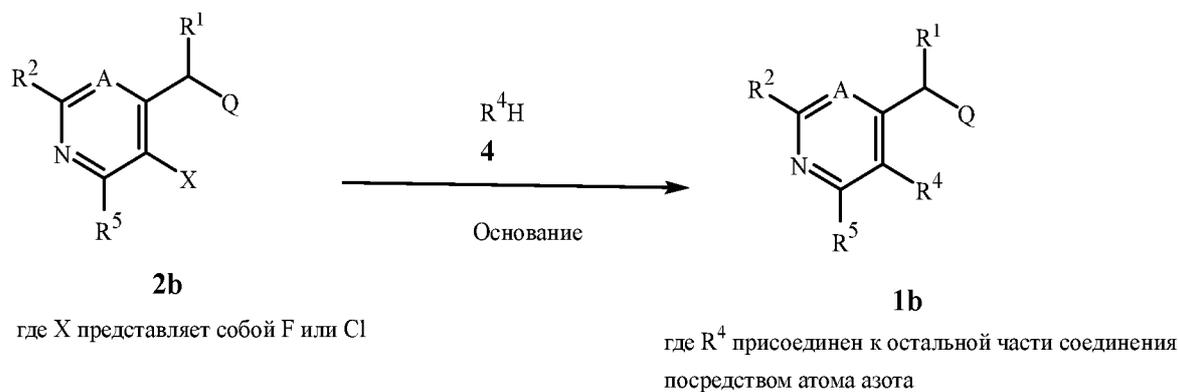
Одно или несколько из следующих способов и вариаций, описанных на схемах 1-11, можно применять для получения соединений формулы **1**. Определения R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , A и Q в соединениях формул **1-18** ниже определены выше в разделе "Сущность изобретения", если не указано иное. Соединения формул **1a – 1d** представляют собой различные подмножества соединений формулы **1**, и все заместители для формул **1a-1d** определены выше для формулы **1**, если не указано иное. Температура окружающей среды или комнатная температура определена как приблизительно 20-25°C.

Как показано на схеме 1, соединения формулы **1a** (соединения формулы **1**, где R⁴ присоединен к остальной части молекулы посредством атома углерода) можно получать путем приведения в контакт соединений формулы **2a**, где X представляет собой Cl, Br или I, с бороновыми кислотами или оловоорганическими соединениями формулы **3** в присутствии палладиевого катализатора. В качестве катализаторов для способа по настоящему изобретению являются пригодными широкое разнообразие палладие содержащих соединений и комплексов. Примеры палладие содержащих соединений и комплексов, пригодных в качестве катализаторов в способе, представленном на схеме 1, включают Pd(OAc)₂ (ацетат палладия(II)), PdCl₂ (хлорид палладия(II)), PdCl₂(PPh₃)₂ (дихлорид бис(трифенилфосфин)палладия(II)), Pd(PPh₃)₄ (тетракис(трифенилфосфин)палладий(0)), Pd(C₅H₇O₂)₂ (ацетилацетонат палладия(II)) и Pd₂(dba)₃, трис(дибензилиденацетон)дипалладий(0). Также, как показано на схеме 1, соединения формулы **1b** (соединения формулы **1**, где R⁴ присоединен к остальной части молекулы посредством атома азота) можно получать путем приведения соединений формулы **2a** (где X представляет собой Cl, Br или I) в контакт с соединениями формулы **4** (гетероциклическое соединение с NH в качестве члена кольца, где H может быть заменен на другую функциональную группу в ходе химической реакции) в присутствии медного катализатора или палладиевого катализатора. Недавние обзорные статьи и книги об этом типе преобразования функциональных групп; см., например, F. Bellina et al., *Synthesis* **2004**, *15*, 2419–2440; P. Espinet and A. M. Echavarren, *Angewandte Chemie, International Edition* **2004**, *43*, 4704–4734; и J. J. Li, G. W. Gribble, editors, *Palladium in Heterocyclic Chemistry: A Guide for the Synthetic Chemist*. 2000. K. W. Anderson et al., *Angewandte Chemie, International Edition* **2006**, *45*, 6523–6527.



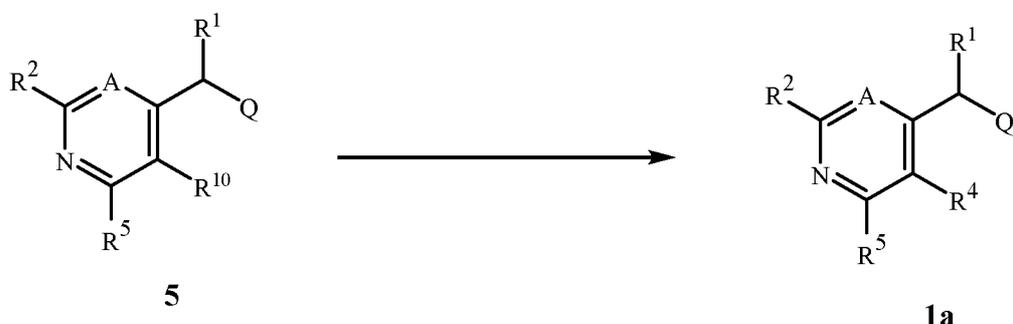
Как показано на схеме 2, соединения формулы **1b** также можно получать путем приведения в контакт соединений формулы **2b** (где X представляет собой F или Cl) с соединениями формулы **4** в присутствии основания, такого как K₂CO₃ или Cs₂CO₃. Обоснованно считается, что широкое разнообразие известных общих процедур может быть легко адаптировано специалистом в данной области техники к способу, представленному на схеме 2, например, см., J. D. Culshaw et al., *Synlett* **2012**, 23, 1816–1820. Способ, представленный на схеме 2, проиллюстрирован в примере синтеза 1, стадия С.

Схема 2



В качестве альтернативы, как показано на схеме 3, соединения формулы **1a** можно получать путем построения гетероциклического кольца с помощью соединений формулы **5**, где R¹⁰ представляет собой CN, COCH₃ или CHO. Способы образования гетероциклического кольца посредством таких функциональных групп являются известными в литературе. Обоснованно считается, что разнообразие известных общих процедур может быть легко адаптировано специалистом в данной области техники к способу, представленному на схеме 3, например, см., публикацию международного патента WO 2012/002577; публикацию международного патента WO 2012/087938; М. Н. Gezinci et al.; *J. Med. Chem.* **2001**, *44*, 1560-1563; К. Gobbis, *J. Heterocyclic Chem.* **2009**, *46*, 1271-1279. Способ, представленный на схеме 3, проиллюстрирован в примере синтеза 2, стадия D.

Схема 3

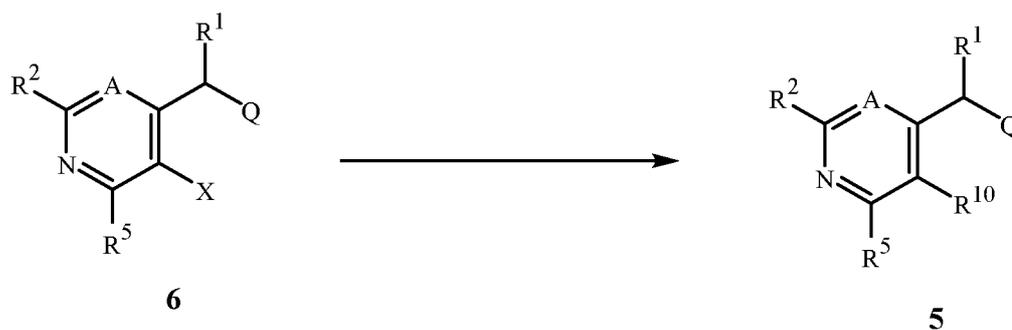


где R¹⁰ представляет собой CN, COCH₃, CHO или любые другие группы, которые могут обеспечивать похожие реакции с образованием требуемых гетероциклов

где R₄ присоединен к остальной части соединения посредством атома углерода

Как показано на схеме 4, соединение формулы **5** можно получать путем преобразования группы X в соединении формулы **6** в группу R¹⁰ в соединении формулы **5** посредством реакций преобразования функциональных групп. Разнообразие общих процедур является общеизвестным в литературе, например, см., М. Hatsuda, М. Seki, *Tetrahedron*, **2005**, *61*, 9908-9917; D. Xu et al., *Tetrahedron Letters*, **2008**, 6104-6107; А. Brennfuehrer, et al., *Tetrahedron*, **2007**, *63*, 6252-6258. Способ, представленный на схеме 4, проиллюстрирован в примере синтеза 2, стадия С.

Схема 4



где X представляет собой Br или I

где R¹⁰ представляет собой CN, COCH₃, CHO или любые другие группы, которые могут обеспечивать похожие реакции с образованием требуемых гетероциклов

Как показано на схеме 5, соединения формулы **6** можно получать путем приведения в контакт соответствующих спиртов формулы **7** с фторирующими реагентами, такими как трифторид (диэтиламино)серы (DAST) или трифторид бис(2-метоксиэтил)аминосеры (Deохо-Fluor) в галогеналкановых растворителях, таких как дихлорметан или хлороформ, при температуре от -78°C до комнатной температуры. Общая процедура является известной из уровня техники, например, см., Lal, G. S. et al. *J. Org. Chem.* **1999**, *64*, 7048. Способ, представленный на схеме 5, проиллюстрирован в примере синтеза 1, стадия В.

10

Схема 5



где R¹ представляет собой F

6

15

Как показано на схеме 6, соединения формулы **1c** (где R¹ представляет собой OR⁶) можно получать путем осуществления реакции соответствующих спиртов формулы **7** с соединениями формулы **8**, представляющими собой R⁶Br или R⁶I, в присутствии основания. Соединения формулы **1d** (где R¹ представляет собой SR⁶) можно получать путем преобразования соответствующих спиртов формулы **7** в их соответствующие хлоридные соединения с применением SOCl₂ с последующим осуществлением реакции хлоридных соединений с тиоловыми соединениями

формулы **9**, представляющими собой R^6SH . Данный способ является общеизвестным в литературе, например, см., Qingzhong Hu et al. *J. Med. Chem.* **2010**, *53*, 5749; публикация международного патента WO 2009/034976. Способ, представленный на схеме 6, проиллюстрирован в примере синтеза **2**, стадия В.

5

Схема 6



1c где R^1 представляет собой OR^6

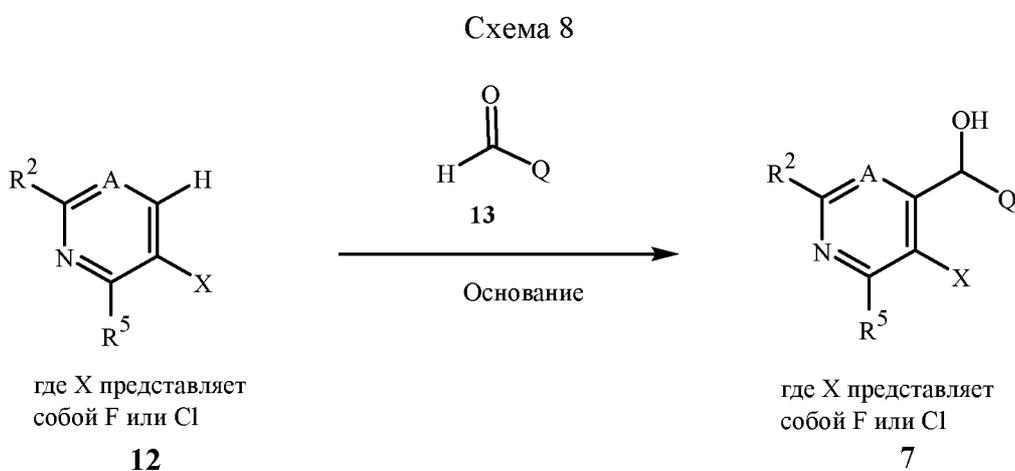
1d где R^1 представляет собой SR^6

Как показано на схеме 7, соединения формулы **7** легко можно получать посредством нуклеофильного присоединения к соединениям формулы **11** альдегидов формулы **10**. Нуклеофилы формулы **11** можно образовывать с помощью разных химических подходов. Например, с помощью реакции обмена металл–галоген галогенароматического соединения QX' (где X' предпочтительно представляет собой Br или I) с бромидом *n*-бутиллития или изопропилмагния, как правило, при температуре от приблизительно -100 до приблизительно -20°C можно образовывать нуклеофилы формулы **11** *in situ*. Широкое разнообразие общих процедур проведения реакции обмена металл–галоген с последующей реакцией с электрофилами является известным из уровня техники и легко может быть адаптировано для данного способа. Родственные общие процедуры см., например, в M. Schlosser, *Angew. Chem. Int. Ed.* **2004**, *43*, 2 и P. Knochel et al., *Synthesis*, **2002**, 565. Кроме того, нуклеофилы формулы **11** можно получать посредством реакции Гриньяра соответствующего бромида или йодида, QBr или QI , с магнием. Некоторые нуклеофилы формулы **11** являются коммерчески доступными, например, бромид 4-трет-бутилфенилмагния или бромид 4-(трифторметокси)фенилмагния. Большинство альдегидов формулы **10** являются коммерчески доступными или являются известными соединениями в химической литературе.

Схема 7



Как показано на схеме 8, обработка соединений формулы **12** (где X представляет собой F или Cl) основанием, таким как диизопропиламид лития, комплекс хлорида 2,2,6,6-тетраметилпиперидинилмагния и хлорида лития и т. д., в эфирных растворителях, таких как THF, диэтиловый эфир или диоксаны, при температуре от -100°C до -10°C будет обеспечивать образование требуемых анионов *in situ*. В результате гашения указанных выше анионов с помощью альдегидов формулы **13** можно получать соединения формулы **7**. Данный способ является общеизвестным в литературе, см. например, R. J. Mattson, et al. *J. Org. Chem.*, **1990**, *55*, 3410. Способ, представленный на схеме 8, проиллюстрирован в примерах синтеза 1 и 2, стадия А.



Как показано на схеме 9, соединения формулы **7** также можно получать путем восстановления соответствующих карбонильных соединений формулы **14**. В результате обработки соединений формулы **14** в растворителях, таких как метанол, этанол или простые эфиры (такие как тетрагидрофуран), разными восстановителями, такими как борогидрид натрия, боран-диметилсульфид, можно получать соединения формулы **7**. В качестве альтернативы, восстановление карбонильных соединений формулы **14** можно осуществлять путем каталитического гидрирования. Известно несколько общих процедур для таких преобразований из уровня техники; см.,

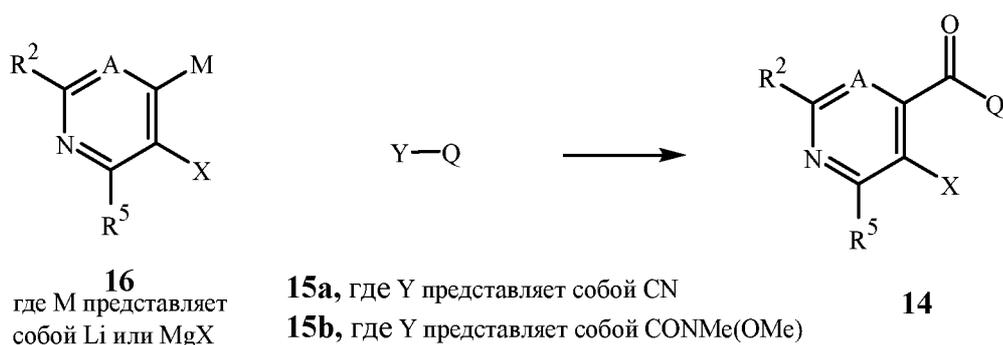
например, D. Douglas, et al., *J. Med. Chem* **2009**, 52, 4694; M. Moriyasu, et al., *Synlett* **1997**, 3, 273.

Схема 9



5 Как показано на схеме 10, соединения формулы **14** можно получать из CN-замещенных ароматических соединений формулы **15a** (где Y представляет собой CN) или амидов Вайнреба формулы **15b** (где Y представляет собой CONMeOMe). В результате реакций соединений формулы **16** с соединениями формулы **15a** или **15b** можно получать карбонильные соединения формулы **14**. Соединения формулы **16** можно получать с применением подобной химической реакции, которая обеспечивает образование соответствующих анионов *in situ*, как описано на схеме 8. Для сопутствующих ссылок см., например: публикацию заявки на патент США US 2008/280891 и Bela. et al. *European J. Org. Chem.* 2004 17, 3623-3632. Многие соединения формулы **17** и **15** являются коммерчески доступными или легко получаемыми с помощью способов синтеза из литературы.

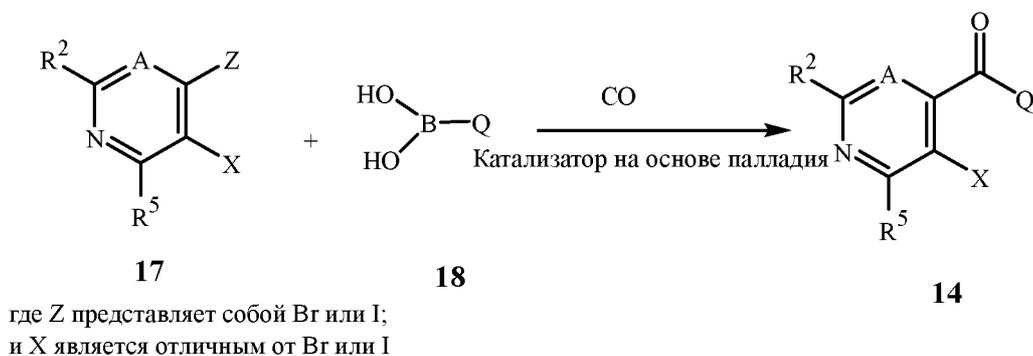
Схема 10



В качестве альтернативы, как показано на схеме 11, соединения формулы **14** также можно получать из 4-галогенпиридиновых или пиримидиновых соединений формулы **17** (где Z представляет собой Br или I, и X является отличным от Br или I). Катализируемая палладием реакция перекрестного сочетания соединений формулы **17**, монооксида углерода и бороновых кислот формулы **18** может обеспечивать альтернативный путь получения соединений формулы **14**. В результате обработки

смеси 4-галогенпиридиновых или пиримидиновых соединений формулы **17** и бороновых кислот формулы **18** в присутствии палладиевого катализатора (такого как дихлорид бис(трифенилфосфин)палладия(II) или тетракис(трифенилфосфин)палладий(0)), основанием (таким как карбонат калия, карбонат натрия или карбонат цезия) при температуре, составляющей от приблизительно 80 до 150°C, в эфирных растворителях (таких как тетрагидрофуран или диоксан) в атмосфере монооксида углерода при давлении от 1 до 50 бар можно получать требуемые карбонильные соединения формулы **14**. Подробная экспериментальная процедура приведена в Couve-Bonnair et. al., *Tetrahedron Lett.* **2001**, *42*, 3689-3691. Большинство соединений формулы **17** и бороновых кислот формулы **18** являются коммерчески доступными или легко получаемыми в соответствии с химической литературой.

Схема 11



Известно, что некоторые реагенты и условия реакций, описанные выше для получения соединений формулы **1**, могут быть не совместимыми с некоторыми функциональными группами, присутствующими в промежуточных соединениях. В таких случаях ряд реакций внедрения защитной группы/удаления защитной группы или взаимные превращения функциональных групп во время синтеза помогут получить требуемые продукты. Применение и выбор защитных групп будут очевидны специалисту в области химического синтеза (см., например, Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. *Protective Groups in Organic Synthesis*, 2nd ed.; Wiley: New York, 1991). Специалист в данной области техники поймет, что в некоторых случаях после введения указанного реагента, изображенного на любой отдельной схеме, может быть необходимо провести дополнительные обычные стадии синтеза, не описанные подробно, для завершения синтеза соединений формулы **1**. Специалист в данной области техники также поймет, что может быть необходимо осуществлять комбинацию стадий, проиллюстрированных на схемах выше, в порядке, отличном от

такого, который подразумевается представленной конкретной последовательностью, для получения соединений формулы 1.

5 Специалист в данной области техники также поймет, что соединения формулы 1 и промежуточные соединения, описанные в данном документе, можно подвергать различным реакциям с электрофильными соединениями, нуклеофильными соединениями, радикалами, металлоорганическими соединениями, реакциям окисления и восстановления для присоединения заместителей или изменения существующих заместителей.

10 Без дополнительного уточнения считается, что специалист в данной области техники с применением предшествующего описания может осуществить на практике настоящее изобретение в его наиболее полной степени. Следующие примеры синтеза, следовательно, следует рассматривать как исключительно иллюстративные и абсолютно не ограничивающие настоящее изобретение каким-либо образом. Стадии в
15 следующих примерах синтеза иллюстрируют процедуру для каждой стадии в общем синтетическом преобразовании, и исходный материал для каждой стадии может быть необязательно получен посредством конкретного препаративного процесса, процедура осуществления которого описана в других примерах или стадиях. Температура окружающей среды или комнатная температура определена как приблизительно 20-25°C. Процентные значения приведены по весу, за исключением смесей растворителей
20 для хроматографии, или где указано иное. Части и процентные доли для хроматографических смесей растворителей приведены по объему, если не указано иное. MPLC означает жидкостную хроматографию среднего давления на силикагеле. Спектры ^1H ЯМР приведены в ppm со слабопольным сдвигом от тетраметилсилана; "s" означает синглет, "d" означает дублет, "dd" означает дублет дублетов, "ddd"
25 означает дублет дублета дублетов, "t" означает триплет, "m" означает мультиплет, и "br s" означает широкий синглет. В случае массовых спектральных данных указанное числовое значение представляет собой молекулярную массу исходного молекулярного иона (M), образованного путем добавления H^+ (с молекулярной массой, равной 1) к молекуле с получением пика M+1, наблюдаемого с помощью масс-спектрометрии с
30 применением химической ионизации при атмосферном давлении (AP^+).

На схемах 1-11 проиллюстрированы способы получения соединений формулы 1, содержащих разные заместители. Соединения формулы 1, содержащие заместители, отличные от тех, которые, в частности, упомянуты для схем 1-11, можно получать

посредством общих способов, известных в области синтетической органической химии, в том числе способов, аналогичных тем, которые описаны для схем 1-11.

ПРИМЕР СИНТЕЗА 1

- 5 Получение 3-фтор-4-[фтор-[4-(трифторметилсульфинил)фенил]метил]-5-(триазол-2-ил)пиридина (соединение 67)

Стадия А. Получение (3,5-дифтор-4-пиридил)-[4-(трифторметилсульфанил)фенил]метанола

- 10 В перемешиваемый раствор 3,5-дифторпиридина (1,20 г, 10,4 ммоль) в THF (20 мл) медленно добавляли свежеполученный раствор диизопропиламида лития (11,4 ммоль в 10 мл THF и н-гексанах) при -20°C . После перемешивания в течение 1 ч. при температуре от -20 до -10°C в реакционную смесь добавляли раствор 4-(трифторметилсульфанил)бензальдегида (2,15 г, 10,4 ммоль) в THF (10 мл) при -20°C .
- 15 После перемешивания в течение еще 1 ч. при температуре от -20 до -10°C реакционную смесь гасили насыщенным водным раствором NH_4Cl , затем разбавляли водой и экстрагировали этилацетатом. Объединенные органические фазы промывали водой и насыщенным водным раствором NaCl , высушивали с помощью безводного сульфата натрия и концентрировали. Остаток очищали с помощью колоночной
- 20 хроматографии на силикагеле с применением смеси гексаны/этилацетат в качестве элюента с получением указанного в заголовке продукта в виде бледного белого твердого вещества (1,36 г, 4,2 ммоль).

^1H ЯМР (CDCl_3) δ 8,34 (s, 2H), 7,66 (d, 2H), 7,48 (d, 2H), 6,29 (s, 1H).

- 25 Стадия В. Получение 3,5-дифтор-4-[фтор-[4-(трифторметилсульфанил)фенил]метил]пиридина

- В перемешиваемый раствор (3,5-дифтор-4-пиридил)-[4-(трифторметилсульфанил)фенил]метанола (т. е. продукта стадии А) (650 мг, 2,02 ммоль) в дихлорметане (25 мл) добавляли трифторид бис(2-метоксиэтил)аминосеры (0,55 мл, 2,96 ммоль) при -78°C . После перемешивания в течение 2 ч. реакционную смесь медленно разбавляли насыщенным водным раствором NaHCO_3 и экстрагировали дихлорметаном. Объединенные органические фазы промывали водой и насыщенным водным раствором NaCl , высушивали с помощью безводного сульфата натрия и концентрировали. Остаток очищали с помощью
- 35 колоночной хроматографии на силикагеле с применением смеси гексаны/этилацетат

(80:20 до 40:60) в качестве элюента с получением указанного в заголовке соединения, представляющего собой соединение по настоящему изобретению, в виде бледно-желтого масла (490 мг, 1,52 ммоль).

^1H ЯМР (CDCl_3) δ 8,41 (d, 2H), 7,70 (d, 2H), 7,49 (d, 2H), 6,88 (d, 1H).

5

Стадия С. Получение 3-фтор-4-[фтор-[4-(трифторметилсульфанил)фенил]метил]-5-(триазол-2-ил)пиридина

Перемешивали смесь 3,5-дифтор-4-[фтор-[4-(трифторметилсульфанил)фенил]метил]пиридина (т. е. продукта стадии В) (300 мг, 0,93 ммоль), 1,2,3-триазола (64 мг, 0,93 ммоль) и K_2CO_3 (205 мг, 1,49 ммоль) в DMF (4 мл) при 100°C в течение 2 ч. Затем реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры, разделяли между водой и этилацетатом. Органическую фазу промывали водой и насыщенным водным раствором NaCl, высушивали с помощью безводного сульфата натрия и концентрировали. Остаток очищали с помощью колоночной хроматографии на силикагеле с применением смеси гексаны/этилацетат в качестве элюента, с получением указанного в заголовке продукта в виде белого твердого вещества (80 мг, 0,22 ммоль).

15

^1H ЯМР (CDCl_3) δ 8,96 (s, 1H), 8,57 (s, 1H), 7,96 (s, 2H), 7,68 (d, 2H), 7,60 (d, 2H), 7,24 (d, 1H).

20

Стадия D. Получение 3-фтор-4-[фтор-[4-(трифторметилсульфинил)фенил]метил]-5-(триазол-2-ил)пиридина

В перемешиваемый раствор 3-фтор-4-[фтор-[4-(трифторметилсульфанил)фенил]метил]-5-(триазол-2-ил)пиридина (т. е. продукта со стадии С) (100 мг, 0,27 ммоль) в дихлорметане (3 мл) добавляли 3-хлорпероксибензойную кислоту (91 мг, чистота менее 77%) при 0°C . Реакционную смесь медленно нагревали до комнатной температуры и перемешивали в течение 3 ч. Затем реакционную смесь гасили водным раствором NaHSO_3 и разделяли между водой и дихлорметаном. Органическую фазу промывали водой и насыщенным водным раствором NaCl, высушивали с помощью безводного сульфата натрия и концентрировали. Остаток очищали с помощью колоночной хроматографии на силикагеле с применением смеси гексаны/этилацетат в качестве элюента с получением указанного в заголовке продукта в виде бесцветного липкого масла (30 мг, 0,08 ммоль).

30

^1H ЯМР (CDCl_3) δ 9,00 (s, 1H), 8,59 (s, 1H), 7,98 (s, 2H), 7,83 (s, 4H), 7,30 (d, 1H).

ПРИМЕР СИНТЕЗА 2

Получение 3-[5-фтор-4-[метокси-[4-(трифторметилсульфанил)фенил]метил]-3-
5 пиридил]-1,2,4-оксадиазола (соединение 83)

Стадия А. Получение (3-бром-5-фтор-4-пиридил)-[4-(трифторметилсульфанил)фенил]метанола

В перемешиваемый раствор 3-бром-5-фторпиридина (4,40 г, 25 ммоль) в THF
10 (20 мл) медленно добавляли свежеполученный раствор диизопропиламида лития (26 ммоль в 20 мл THF и н-гексанов) при -20°C . После перемешивания в течение 1 ч. при температуре от -20 до -10°C в реакционную смесь добавляли раствор 4-(трифторметилсульфанил)бензальдегида (4,85 г, 23,5 ммоль) в THF (10 мл) при -20°C . После перемешивания в течение еще 1 ч. при температуре от -20 до -10°C
15 реакционную смесь гасили насыщенным водным раствором NH_4Cl , затем разбавляли водой и экстрагировали этилацетатом. Объединенные органические фазы промывали водой и насыщенным водным раствором NaCl , высушивали с помощью безводного сульфата натрия и концентрировали. Остаток очищали с помощью колоночной хроматографии на силикагеле с применением смеси гексаны/этилацетат в качестве
20 элюента с получением указанного в заголовке продукта в виде бледно-желтого масла (6,95 г, 18,2 ммоль).

^1H ЯМР (CDCl_3) δ 8,56 (s, 1H), 8,36 (s, 1H), 7,65 (d, 2H), 7,47 (d, 2H), 6,39 (d, 1H), 3,66 (d, 1H).

Стадия В. Получение 3-бром-5-фтор-4-[метокси-[4-(трифторметилсульфанил)фенил]метил]пиридина

В перемешиваемый раствор (3-бром-5-фтор-4-пиридил)-[4-(трифторметилсульфанил)фенил]метанола (т. е. продукта стадии А) (1,26 г, 3,30 ммоль) в сухом THF (10 мл) добавляли гидрид натрия (165 мг, 4,12 ммоль, 60% в минеральном масле) при 0°C . Полученную смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 1 ч. и затем обрабатывали метилйодидом (0,24 мл, 3,96 ммоль). После перемешивания при комнатной температуре в течение еще 1,5 ч. реакционную смесь обрабатывали водой и экстрагировали смесью этилацетат/гексаны (1:1). Объединенные органические фазы промывали водой и насыщенным водным

раствором хлорида натрия, высушивали с помощью безводного сульфата натрия и концентрировали. Остаток очищали с помощью колоночной хроматографии на силикагеле с применением смеси гексаны/этилацетат (от 90:10 до 60:40) в качестве элюента с получением указанного в заголовке соединения в виде бледно-желтого масла (1,10 г, 2,80 ммоль).

^1H ЯМР (CDCl_3) δ 8,60 (s, 1H), 8,37 (s, 1H), 7,63 (d, 2H), 7,52 (d, 2H), 5,95 (s, 1H), 3,47 (s, 3H).

Стадия С. Получение 5-фтор-4-[метокси-[4-

10 (трифторметилсульфанил)фенил]метил]пиридин-3-карбонитрила

Подвергали реакции смесь 3-бром-5-фтор-4-[метокси[4-(трифторметилсульфанил)фенил]-метил]пиридина (т. е. продукта стадии В) (1,0 г, 2,52 ммоль), $\text{Zn}(\text{CN})_2$ (325 мг, 2,76 ммоль), $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$ (291 мг, 0,25 ммоль) в *N,N*-диметилформамиде (5 мл) во флаконе в атмосфере азота под микроволновым облучением при 150°C в течение 10 мин. Затем реакционную смесь разделяли между водой и этилацетатом. Органический слой промывали водой и насыщенным водным раствором хлорида натрия, высушивали с помощью безводного сульфата натрия и концентрировали. Остаток очищали с помощью колоночной хроматографии на силикагеле с применением смеси гексаны/этилацетат (от 90:10 до 60:40) в качестве элюента с получением указанного в заголовке соединения в виде желтого масла (0,80 г, 2,42 ммоль).

^1H ЯМР (CDCl_3) δ 8,72 (s, 1H), 8,63 (s, 1H), 7,67 (d, 2H), 7,59 (d, 2H), 5,79 (s, 1H), 3,50 (s, 3H).

25 Стадия D. Получение 3-[5-фтор-4-[метокси-[4-

(трифторметилсульфанил)фенил]метил]-3-пиридил]-1,2,4-оксадиазола

Перемешивали смесь 5-фтор-4-[метокси-[4-(трифторметилсульфанил)фенил]метил]пиридин-3-карбонитрила (т. е. продукта стадии С) (0,27 г, 0,82 ммоль), гидроксилamina (0,25 мл, 3,78 ммоль, 50% в H_2O) в EtOH (5 мл) при комнатной температуре в течение 48 ч. Затем реакционную смесь концентрировали при пониженном давлении. К остатку добавляли триметилортоформиат (0,5 мл) и одну каплю концентрированной хлористоводородной кислоты. Затем смесь перемешивали при 80°C в течение 1 ч. Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры, затем разделяли между водой и этилацетатом. Органический слой промывали водой и насыщенным водным раствором хлорида натрия,

высушивали с помощью безводного сульфата натрия и концентрировали. Остаток очищали с помощью колоночной хроматографии на силикагеле с применением смеси гексаны/этилацетат (от 90:10 до 60:40) в качестве элюента с получением указанного в заголовке соединения в виде бледно-желтого масла (0,17 г, 0,46 ммоль).

5 ^1H ЯМР (CDCl_3) δ 8,96 (s, 1H), 8,91 (s, 1H), 8,57 (s, 1H), 7,62 (d, 2H), 7,57 (d, 2H), 6,29 (s, 1H), 3,39 (s, 3H).

ПРИМЕР СИНТЕЗА 3

10 Получение 3-фтор-4-[(R)-метокси-[4-(трифторметокси)фенил]метил]-5-(триазол-2-ил)пиридина (соединение 125)

Стадия А. Получение (3,5-дифтор-4-пиридил)-[4-(трифторметокси)фенил]метанола

В раствор соединения, представляющего собой 3,5-дифторпиридин (40 г, 0,347 моль, 1,0 экв.), в THF (400 мл) медленно добавляли 2 М LDA в THF (191,3 мл, 0,381 моль, 1,1 экв.) при -78°C в атмосфере N_2 . Затем реакционную смесь перемешивали в течение 30 мин., затем добавляли соединение, представляющее собой 15 4-(трифторметокси)бензальдегид (72,4 г, 0,381 моль, 1,1 экв.), при -78°C и перемешивали в течение 2 ч. при -78°C . Реакцию отслеживали с помощью TLC, реакционную смесь гасили с помощью насыщ. водн. NH_4Cl , экстрагировали с помощью EtOAc (3×500 мл), затем высушивали над безводным Na_2SO_4 и 20 концентрировали при пониженном давлении. Полученное неочищенное вещество очищали с помощью колоночной хроматографии с применением 100-200 силикагеля, элюировали с помощью смеси 40% этилацетат/петролейный эфир с получением указанного в заголовке продукта в виде грязно-белого полутвердого вещества (70 г, выход 66%).

25 ^1H ЯМР ($d_6\text{-DMSO}$) δ 8,49 (s, 2H), 7,51 (d, 2H), 7,35 (d, 2H), 6,59 (d, 1H), 6,16 (d, 1H).

Стадия В. Получение (3,5-дифтор-4-пиридил)-[4-(трифторметокси)фенил]метанона

30 В раствор соединения, представляющего собой (3,5-дифтор-4-пиридил)-[4-(трифторметокси)фенил]метанол (т. е. продукт стадии А) (70,0 г, 0,229 моль, 1,0 экв.), в дихлорметане (700 мл) добавляли активированный MnO_2 (199 г, 2,29 моль, 10 экв.) при к. т. в атмосфере N_2 , затем перемешивали в течение 16 ч. Реакцию отслеживали с помощью TLC, реакционную смесь фильтровали через слой целита и промывали дихлорметаном (200 мл). Растворитель концентрировали при пониженном давлении с 35 получением неочищенного твердого вещества. Полученное неочищенное вещество

очищали с помощью колоночной хроматографии с применением 100-200 силикагеля, элюировали с помощью смеси 30% этилацетат/петролейный эфир с получением указанного в заголовке соединения в виде грязно-белого твердого вещества (65 г, выход 93%).

5 ^1H ЯМР (d_6 -DMSO) δ 8,80 (s, 2H), 8,07 (d, 2H), 7,60 (d, 2H).

Стадия С. Получение [3-фтор-5-(триазол-2-ил)-4-пиридил]-[4-(трифторметокси)фенил]метанона

В раствор соединения, представляющего собой (3,5-дифтор-4-пиридил)-[4-(трифторметокси)фенил]метанон (т. е. продукт стадии В) (65 г, 0,214 моль, 1,0 экв.), в DMF (650 мл) добавляли K_2CO_3 (29,6 г, 0,214 моль, 1,0 экв.) и 1,2,3-триазол (14,8 г, 0,214 моль, 1,0 экв.) при к. т. в атмосфере N_2 . Затем реакционную смесь перемешивали в течение 48 ч. Реакцию отслеживали с помощью TLC. Реакционную смесь выливали в ледяную воду (1000 мл) и экстрагировали с помощью EtOAc (3×300 мл). Затем органический слой промывали соевым раствором (2×200 мл) и ледяной водой (200 мл), затем высушивали над безводным Na_2SO_4 и концентрировали при пониженном давлении. Полученное неочищенное вещество очищали с помощью колоночной хроматографии с применением 100-200 силикагеля, элюировали с получением указанного в заголовке продукта в виде грязно-белого твердого вещества (19 г, выход 25%).

20 ^1H ЯМР (d_6 -DMSO) δ 9,29 (s, 1H), 8,91 (s, 1H), 8,11 (s, 2H), 8,00 (d, 2H), 7,51 (d, 2H).

Стадия D. Получение (R)-[3-фтор-5-(триазол-2-ил)-4-пиридил]-[4-(трифторметокси)фенил]метанола

В раствор (S)-(-)-а,а-дифенил-2-пирролидинметанола (2,73 г, 0,011 моль, 0,2 экв.) в THF (190 мл) добавляли $\text{B}(\text{OMe})_3$ (12,4 г, 0,012 ммоль, 0,22 экв.) при к. т., затем перемешивали в течение 1 ч. при к. т. в атмосфере N_2 . Затем медленно добавляли борандиметилсульфид (6,16 г, 0,081 моль, 1,5 экв.) при 0°C , в то же время наблюдали расслаивание и выделение тепла. Затем добавляли соединение, представляющее собой [3-фтор-5-(триазол-2-ил)-4-пиридил]-[4-(трифторметокси)фенил]метанон (т. е. продукт стадии С) (19 г, 0,054 моль, 1,0 экв.) (растворенный в THF 30 мл) при $0-5^\circ\text{C}$, затем обеспечивали нагревание до к. т. и перемешивали в течение 3 ч. Реакцию отслеживали с помощью TLC. После завершения реакции смесь охлаждали до 0°C , затем реакционную смесь медленно по

каплям гасили с помощью 2 н. HCl (80 мл), в то же время наблюдали сильное выделение газа и выделение тепла, затем экстрагировали этилацетатом (3 × 200 мл), органический слой высушивали над безводным Na₂SO₄ и концентрировали с получением неочищенного вещества. Полученное неочищенное вещество очищали с помощью колоночной хроматографии с применением 100-200 силикагеля, элюировали с помощью смеси 30% этилацетат/петролейный эфир с получением указанного в заголовке продукта в виде бесцветной жидкости (8,2 г, выход 43%). При анализе с помощью хиральной HPLC на колонке Chiralpak IF (4,6 × 250 мм) ⁵указывали, что продукт характеризовался 95% *ee* R-конфигурации. Абсолютная конфигурация R присваивалась в соответствии с литературой, см.: Moriyasu Masui & Takayuki Shioiri, *Synlett*, **1997**, 273-274.

Стадия Е. Получение 3-фтор-4-[(R)-метокси-[4-(трифторметокси)фенил]метил]-5-(триазол-2-ил)пиридина

В раствор соединения (R)-[3-фтор-5-(триазол-2-ил)-4-пиридил]-[4-(трифторметокси)фенил]метанола (8,2 г, 0,023 моль, 1,0 экв.) в THF добавляли порциями NaH (1,0 г, 0,046 моль, 2,0 экв.) при 0°C, в то же время наблюдали расслаивание, затем перемешивали в течение 5 мин. при 0°C, затем добавляли MeI (4,93 г, 0,034 моль, 1,5 экв.) при 0°C. Затем полученное перемешивали в течение 2 ч. при к. т. Реакцию отслеживали с помощью TLC. Реакционную смесь выливали в ледяную воду (50 мл) и экстрагировали этилацетатом (2 × 100 мл). Затем органический слой высушивали над безводным Na₂SO₄ и концентрировали при пониженном давлении. Полученное неочищенное твердое вещество очищали с помощью колоночной хроматографии с применением 100-200 силикагеля, элюировали с помощью смеси 20% этилацетат/петролейный эфир с получением указанного в заголовке продукта в виде бесцветной жидкости (6,0 г, выход 70,5%). При анализе с помощью хиральной HPLC показывали, что продукт характеризовался 93% *ee*, [α]²⁵ = -175,6° (MeOH, 0,4%).

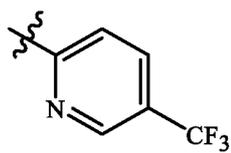
¹H ЯМР (d₆-DMSO) δ 8,81 (s, 1H), 8,78 (s, 1H), 8,32 (s, 2H), 7,51 (d, 2H), 7,37 (d, 2H), 5,66 (s, 1H), 3,21 (s, 3H).

С помощью процедур, описанных в данном документе, вместе со способами, известными из уровня техники, можно получать следующие соединения из таблиц 1 – 42N. В следующих таблицах применяются следующие сокращения: *t* означает третичный, *s* означает вторичный, *n* означает нормальный, *i* означает изо, *c* означает

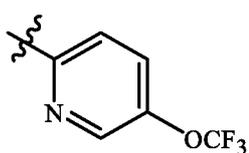
цикло, Me означает метил, Et означает этил, Pr означает пропил, *i*-Pr означает изопропил, Bu означает бутил, Ph означает фенил, OMe означает метокси, OEt означает этокси, SMe означает метилтио, SEt означает этилтио, -CN означает циано, Ph означает фенил, Py означает пиридинил, -NO₂ означает нитро, TMS означает триметилсилил, S(O)Me означает метилсульфинил, и S(O)₂Me означает метилсульфонил.

В таблицах 1A – 98I ссылаются на фрагменты Q-1 – Q-19, показанные ниже. Структуры фрагментов Q-1 – Q-19 проиллюстрированы в приложении 3. Волнистая линия означает точку присоединения фрагмента к остальной части молекулы.

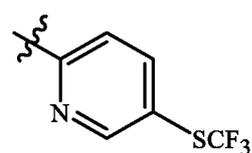
Приложение 3



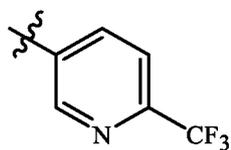
Q-1



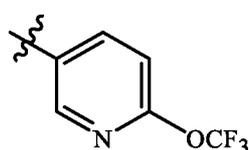
Q-2



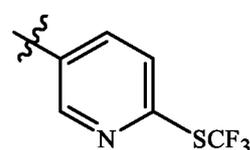
Q-3



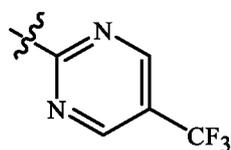
Q-4



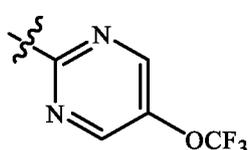
Q-5



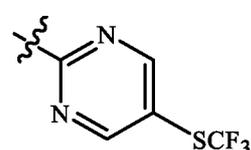
Q-6



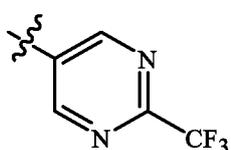
Q-7



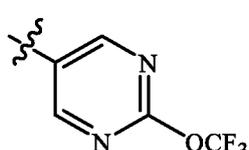
Q-8



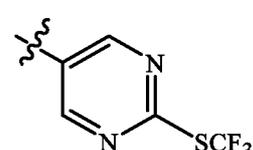
Q-9



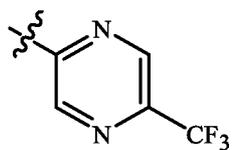
Q-10



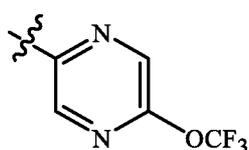
Q-11



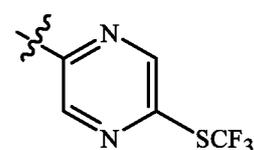
Q-12



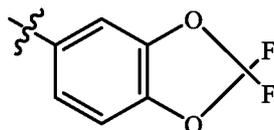
Q-13



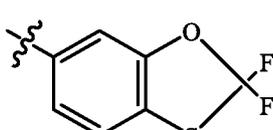
Q-14



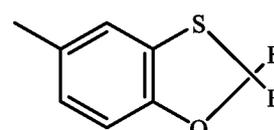
Q-15



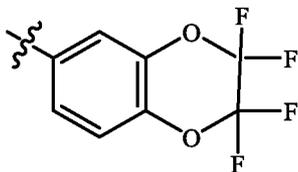
Q-16



Q-17



Q-18



Q-19

5

Таблицы 1А – 42А касаются структуры, показанной ниже.

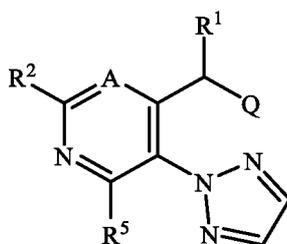


ТАБЛИЦА 1А

10 R¹ представляет собой F, А представляет собой СН, R² представляет собой Н, и R⁵ представляет собой Н.

Q	Q	Q
4-Хлорфенил	3-(CF ₃)фенил	3-Cl, 4-(CF ₃)фенил
4-Бромфенил	3-(OCF ₃)фенил	3-Br, 4-(CF ₃)фенил
4-Йодфенил	3-(<i>s</i> -Bu)фенил	3-Me, 4-(CF ₃)фенил
4-Нитрофенил	3-(<i>t</i> -Bu)фенил	2,6-diF, 4-(CF ₃)фенил
4-Цианофенил	3-(CMe ₂ CH ₂ CH ₃)фенил	2,6-diCl, 4-(CF ₃)фенил
4-(CF ₃)фенил	3-(<i>S</i> - <i>i</i> -Pr)фенил	2-F, 4-(OCF ₃)фенил
4-(OCF ₃)фенил	3-(SCH ₂ CF ₃)фенил	2-Cl, 4-(OCF ₃)фенил
4-(<i>s</i> -Bu)фенил	3-(CF(CF ₃) ₂)фенил	2-Me, 4-(OCF ₃)фенил
4-(<i>t</i> -Bu)фенил	2-F, 4-(<i>t</i> -Bu)фенил	3-F, 4-(OCF ₃)фенил
4-(CMe ₂ CH ₂ CH ₃)фенил	2-Cl, 4-(<i>t</i> -Bu)фенил	3-Cl, 4-(OCF ₃)фенил
4-(<i>S</i> - <i>i</i> -Pr)фенил	2-Me, 4-(<i>t</i> -Bu)фенил	3-Br, 4-(OCF ₃)фенил
4-(SCH ₂ CF ₃)фенил	3-F, 4-(<i>t</i> -Bu)фенил	3-Me, 4-(OCF ₃)фенил
4-(SCHF ₂)фенил	3-Cl, 4-(<i>t</i> -Bu)фенил	2,6-diF, 4-(OCF ₃)фенил
4-(S(O)CHF ₂)фенил	3-Br, 4-(<i>t</i> -Bu)фенил	2,6-diCl, 4-(OCF ₃)фенил
4-(SO ₂ CHF ₂)фенил	3-Me, 4-(<i>t</i> -Bu)фенил	2-F, 4-(CF ₂ CF ₃)фенил
4-(CF(CF ₃) ₂)фенил	2,6-diF, 4-(<i>t</i> -Bu)фенил	2-Cl, 4-(CF ₂ CF ₃)фенил
3-Хлорфенил	2,6-diCl, 4-(<i>t</i> -Bu)фенил	2-Me, 4-(CF ₂ CF ₃)фенил
3-Бромфенил	2-F, 4-(CF ₃)фенил	3-F, 4-(CF ₂ CF ₃)фенил
3-Йодфенил	2-Cl, 4-(CF ₃)фенил	3-Cl, 4-(CF ₂ CF ₃)фенил
3-Нитрофенил	2-Me, 4-(CF ₃)фенил	3-Br, 4-(CF ₂ CF ₃)фенил

Q	Q	Q
3-Цианофенил	3-(SCF ₃)фенил	3-Ме, 4-(CF ₂ CF ₃)фенил
4-(SCF ₃)фенил	3-(S(O)CF ₃)фенил	Q-1
4-(S(O)CF ₃)фенил	3-(SO ₂ CF ₃)фенил	Q-2
4-(SO ₂ CF ₃)фенил	3-(CF ₂ CF ₃)фенил	Q-3
4-(CF ₂ CF ₃)фенил	3-(CF ₂ CF ₂ CF ₃)фенил	Q-4
4-(CF ₂ CF ₂ CF ₃)фенил	3-(OCF ₂ CF ₃)фенил	Q-5
4-(OCF ₂ CF ₃)фенил	2-F, 4-(OCF ₂ CF ₃)фенил	Q-6
2-F, 4-(SCF ₃)фенил	2-Cl, 4-(OCF ₂ CF ₃)фенил	Q-7
2-Cl, 4-(SCF ₃)фенил	2-Ме, 4-(OCF ₂ CF ₃)фенил	Q-8
2-Ме, 4-(SCF ₃)фенил	3-F, 4-(OCF ₂ CF ₃)фенил	Q-9
3-F, 4-(SCF ₃)фенил	3-Cl, 4-(OCF ₂ CF ₃)фенил	Q-10
3-Cl, 4-(SCF ₃)фенил	3-Br, 4-(OCF ₂ CF ₃)фенил	Q-11
3-Br, 4-(SCF ₃)фенил	3-Ме, 4-(OCF ₂ CF ₃)фенил	Q-12
3-Ме, 4-(SCF ₃)фенил	2,6-diF, 4-(OCF ₂ CF ₃)фенил	Q-13
2,6-diF, 4-(SCF ₃)фенил	2,6-diCl, 4-(OCF ₂ CF ₃)фенил	Q-14
2,6-diCl, 4-(SCF ₃)фенил	3-F, 4-(CF ₃)фенил	Q-15
		Q-16
		Q-17
		Q-18
		Q-19

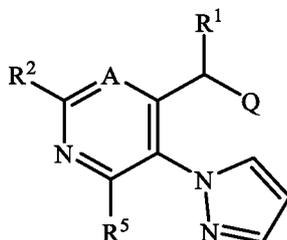
Настоящее изобретение также включает таблицы 2А – 42А, каждая из которых построена так же, как таблица 1А выше, за исключением того, что заголовок строки в таблице 1А (т. е. "А представляет собой СН, R⁴ представляет собой Н и R⁵ представляет собой Н.") ниже структуры Маркуша заменен соответствующим заголовком строки, показанным ниже. Например, в таблице 2А заголовок строки является следующим: "R¹ представляет собой F, А представляет собой CF, R⁴ представляет собой Н, и R⁵ представляет собой Н, и Q определен в таблице 1А выше. Таким образом, в первой записи в таблице 2А конкретно раскрыт 4-[(4-хлорфенил)фторметил]-3-фтор-5-(триазол-2-ил)пиридин.

Таблица	Заголовок таблицы	Таблица	Заголовок таблицы
2А	R1 представляет собой F, А представляет собой CF	23А	R1 представляет собой OCH ₃ , А представляет собой C- <i>i</i> -Pr
3А	R1 представляет собой F, А представляет собой CCl	24А	R1 представляет собой OCH ₃ , А представляет собой C- <i>c</i> -Pr
4А	R1 представляет собой F, А	25А	R1 представляет собой OCH ₃ , А

Таблица	Заголовок таблицы	Таблица	Заголовок таблицы
	представляет собой CBr		представляет собой C-CF ₃
5A	R1 представляет собой F, A представляет собой Cl	26A	R1 представляет собой OCH ₃ , A представляет собой C-OMe
6A	R1 представляет собой F, A представляет собой CMe	27A	R1 представляет собой OCH ₃ , A представляет собой C-OEt
7A	R1 представляет собой F, A представляет собой CEt	28A	R1 представляет собой OCH ₃ , A представляет собой N
8A	R1 представляет собой F, A представляет собой C- <i>n</i> -Pr	29A	R1 представляет собой SCH ₃ , A представляет собой CH
9A	R1 представляет собой F, A представляет собой C- <i>i</i> -Pr	30A	R1 представляет собой SCH ₃ , A представляет собой CF
10A	R1 представляет собой F, A представляет собой C- <i>c</i> -Pr	31A	R1 представляет собой SCH ₃ , A представляет собой CCl
11A	R1 представляет собой F, A представляет собой CCF ₃	32A	R1 представляет собой SCH ₃ , A представляет собой CBr
12A	R1 представляет собой F, A представляет собой COMe	33A	R1 представляет собой SCH ₃ , A представляет собой Cl
13A	R1 представляет собой F, A представляет собой C-OEt	34A	R1 представляет собой SCH ₃ , A представляет собой CMe
14A	R1 представляет собой F, A представляет собой N	35A	R1 представляет собой SCH ₃ , A представляет собой CEt
15A	R1 представляет собой OCH ₃ , A представляет собой CH	36A	R1 представляет собой SCH ₃ , A представляет собой C- <i>n</i> -Pr
16A	R1 представляет собой OCH ₃ , A представляет собой CF	37A	R1 представляет собой SCH ₃ , A представляет собой C- <i>i</i> -Pr
17A	R1 представляет собой OCH ₃ , A представляет собой CCl	38A	R1 представляет собой SCH ₃ , A представляет собой C- <i>c</i> -Pr
18A	R1 представляет собой OCH ₃ , A представляет собой CBr	39A	R1 представляет собой SCH ₃ , A представляет собой C-CF ₃
19A	R1 представляет собой OCH ₃ , A представляет собой Cl	40A	R1 представляет собой SCH ₃ , A представляет собой C-OMe
20A	R1 представляет собой OCH ₃ , A представляет собой CMe	41A	R1 представляет собой SCH ₃ , A представляет собой C-OEt
21A	R1 представляет собой OCH ₃ , A представляет собой CEt	42A	R1 представляет собой SCH ₃ , A представляет собой N
22A	R1 представляет собой OCH ₃ , A представляет собой C- <i>n</i> -Pr		

ТАБЛИЦА 1В

Таблица 1В является идентичной таблице 1А за исключением того, что химическая структура в заголовке таблицы 1В заменена следующей структурой:



5

Например, первое соединение в таблице 1В представляет собой структуру, непосредственно показанную выше, где R¹ представляет собой F, А представляет собой СН, R² представляет собой Н, R⁵ представляет собой Н, и Q представляет собой 4-хлорфенил.

10

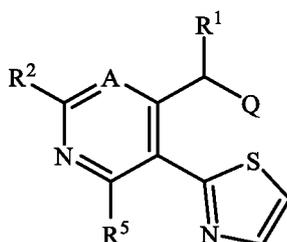
ТАБЛИЦЫ 2В – 42В

Таблицы 2В – 42В построены подобным образом, как и таблицы 2А – 42А.

ТАБЛИЦА 1С

Таблица 1С является идентичной таблице 1А за исключением того, что химическая структура в заголовке таблицы 1В заменена следующей структурой:

15



20

Например, первое соединение в таблице 1С представляет собой структуру, непосредственно показанную выше, где R¹ представляет собой F, А представляет собой СН, R² представляет собой Н, R⁵ представляет собой Н, и Q представляет собой 4-хлорфенил.

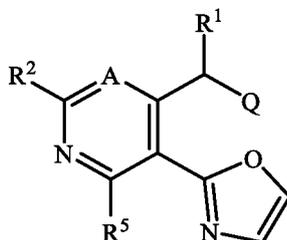
ТАБЛИЦЫ 2С – 42С

25

Таблицы 2С – 42С построены подобным образом, как и таблицы 2А – 42А.

ТАБЛИЦА 1D

Таблица 1D является идентичной таблице 1A за исключением того, что химическая структура в заголовке таблицы 1D заменена следующей структурой:



5

Например, первое соединение в таблице 1D представляет собой структуру, непосредственно показанную выше, где R¹ представляет собой F, A представляет собой CH, R² представляет собой H, R⁵ представляет собой H, и Q представляет собой 4-хлорфенил.

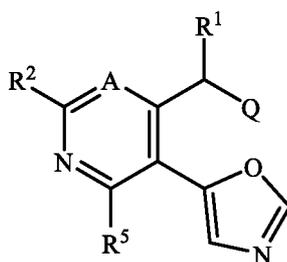
10

ТАБЛИЦЫ 2D – 42D

Таблицы 2D – 42D построены подобным образом, как и таблицы 2A – 42A.

ТАБЛИЦА 1E

Таблица 1E является идентичной таблице 1A за исключением того, что химическая структура в заголовке таблицы 1E заменена следующей структурой:



20

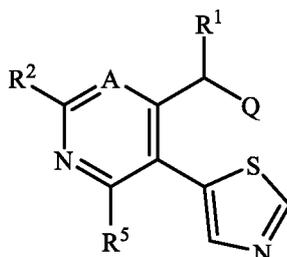
Например, первое соединение в таблице 1D представляет собой структуру, непосредственно показанную выше, где R¹ представляет собой F, A представляет собой CH, R² представляет собой H, R⁵ представляет собой H, и Q представляет собой 4-хлорфенил.

ТАБЛИЦЫ 2E – 42E

Таблицы 2E – 42E построены подобным образом, как и таблицы 2A – 42A.

ТАБЛИЦА 1F

5 Таблица 1F является идентичной таблице 1A за исключением того, что химическая структура в заголовке таблицы 1F заменена следующей структурой:



Например, первое соединение в таблице 1F представляет собой структуру, непосредственно показанную выше, где R¹ представляет собой F, А представляет собой СН, R² представляет собой Н, R⁵ представляет собой Н, и Q представляет собой 4-хлорфенил.

10

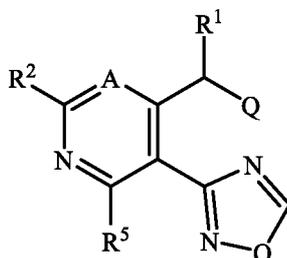
ТАБЛИЦЫ 2F – 42F

Таблицы 2F – 42F построены подобным образом, как и таблицы 2A – 42A.

15

ТАБЛИЦА 1G

Таблица 1G является идентичной таблице 1A за исключением того, что химическая структура в заголовке таблицы 1G заменена следующей структурой:



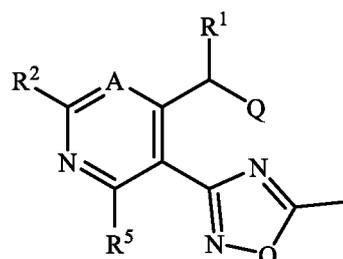
20 Например, первое соединение в таблице 1G представляет собой структуру, непосредственно показанную выше, где R¹ представляет собой F, А представляет собой СН, R² представляет собой Н, R⁵ представляет собой Н, и Q представляет собой 4-хлорфенил.

ТАБЛИЦЫ 2G – 42G

Таблицы 2G – 42G построены подобным образом, как и таблицы 2A – 42A.

ТАБЛИЦА 1H

5 Таблица 1H является идентичной таблице 1A за исключением того, что химическая структура в заголовке таблицы 1H заменена следующей структурой:



10 Например, первое соединение в таблице 1H представляет собой структуру, непосредственно показанную выше, где R¹ представляет собой F, A представляет собой CH, R² представляет собой H, R⁵ представляет собой H, и Q представляет собой 4-хлорфенил.

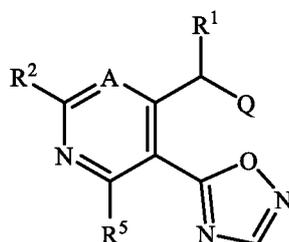
ТАБЛИЦЫ 2H – 42H

Таблицы 2H – 42H построены подобным образом, как и таблицы 2A – 42A.

15

ТАБЛИЦА 1I

Таблица 1I является идентичной таблице 1A за исключением того, что химическая структура в заголовке таблицы 1H заменена следующей структурой:



20

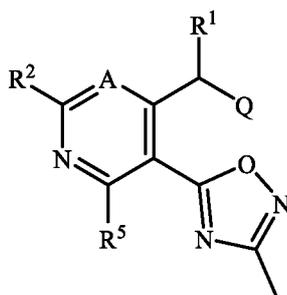
Например, первое соединение в таблице 1I представляет собой структуру, непосредственно показанную выше, где R¹ представляет собой F, A представляет собой CH, R² представляет собой H, R⁵ представляет собой H, и Q представляет собой 4-хлорфенил.

ТАБЛИЦЫ 2I – 42I

Таблицы 2I – 42I построены подобным образом, как и таблицы 2A – 42A.

ТАБЛИЦА 1J

5 Таблица 1J является идентичной таблице 1A за исключением того, что химическая структура в заголовке таблицы 1J заменена следующей структурой:



Например, первое соединение в таблице 1J представляет собой структуру, непосредственно показанную выше, где R¹ представляет собой F, A представляет собой CH, R² представляет собой H, R⁵ представляет собой H, и Q представляет собой 4-хлорфенил.

10

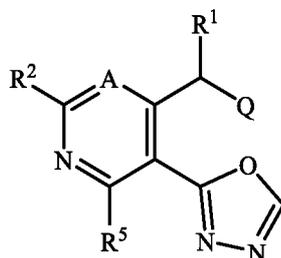
ТАБЛИЦЫ 2J – 42J

Таблицы 2J – 42J построены подобным образом, как и таблицы 2A – 42A.

15

ТАБЛИЦА 1K

Таблица 1K является идентичной таблице 1A за исключением того, что химическая структура в заголовке таблицы 1K заменена следующей структурой:



Например, первое соединение в таблице 1K представляет собой структуру, непосредственно показанную выше, где R¹ представляет собой F, A представляет собой CH, R² представляет собой H, R⁵ представляет собой H, и Q представляет собой 4-хлорфенил.

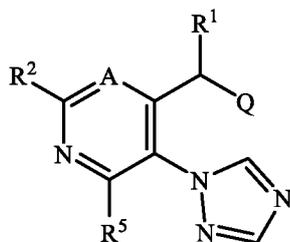
20

ТАБЛИЦЫ 2К – 42К

Таблицы 2К – 42К построены подобным образом, как и таблицы 2А – 42А.

ТАБЛИЦА 1L

5 Таблица 1L является идентичной таблице 1А за исключением того, что химическая структура в заголовке таблицы 1L заменена следующей структурой:



10 Например, первое соединение в таблице 1L представляет собой структуру, непосредственно показанную выше, где R¹ представляет собой F, А представляет собой СН, R² представляет собой H, R⁵ представляет собой H, и Q представляет собой 4-хлорфенил.

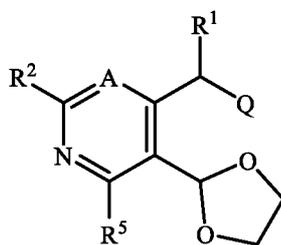
ТАБЛИЦЫ 2L – 42L

Таблицы 2L – 42L построены подобным образом, как и таблицы 2А – 42А.

15

ТАБЛИЦА 1M

Таблица 1M является идентичной таблице 1А за исключением того, что химическая структура в заголовке таблицы 1M заменена следующей структурой:



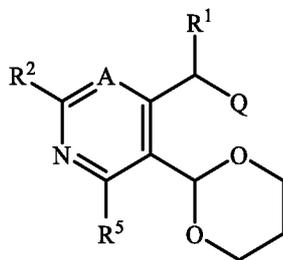
20 Например, первое соединение в таблице 1M представляет собой структуру, непосредственно показанную выше, где R¹ представляет собой F, А представляет собой СН, R² представляет собой H, R⁵ представляет собой H, и Q представляет собой 4-хлорфенил.

ТАБЛИЦЫ 2M – 42M

25 Таблицы 2M – 42M построены подобным образом, как и таблицы 2А – 42А.

ТАБЛИЦА 1N

Таблица 1N является идентичной таблице 1A за исключением того, что химическая структура в заголовке таблицы 1N заменена следующей структурой:



5

Например, первое соединение в таблице 1N представляет собой структуру, непосредственно показанную выше, где R¹ представляет собой F, A представляет собой CH, R² представляет собой H, R⁵ представляет собой H, и Q представляет собой 4-хлорфенил.

10

ТАБЛИЦЫ 2N – 42N

Таблицы 2N – 42N построены подобным образом, как и таблицы 2A – 42A.

15

Соединение по настоящему изобретению в общем будет применяться в качестве активного ингредиента для контроля беспозвоночных вредителей в композиции, т. е. составе, с по меньшей мере одним дополнительным компонентом, выбранным из группы, состоящей из поверхностно-активных веществ, твердых разбавителей и жидких разбавителей, которые выполняют функцию носителя. Ингредиенты состава или композиции выбираются таким образом, что они соответствуют физическим свойствам активного ингредиента, способу нанесения и факторам окружающей среды, таким как тип почвы, влажность и температура.

20

25

Применимые составы предусматривают как жидкие, так и твердые композиции. Жидкие композиции предусматривают растворы (в том числе эмульгируемые концентраты), суспензии, эмульсии (в том числе микроэмульсии, эмульсии типа "масло в воде", текучие концентраты и/или суспензии) и т. п., которые необязательно можно уплотнять с получением гелей. Общие типы водных жидких композиций представляют собой растворимый концентрат, концентрат суспензии, капсульную суспензию, концентрированную эмульсию, микроэмульсию, эмульсию типа "масло в воде", текучий концентрат и суспензию. Общие типы неводных жидких композиций представляют собой эмульгируемый концентрат,

микроэмульгируемый концентрат, диспергируемый концентрат и масляную дисперсию.

Общие типы твердых композиций представляют собой пылевидные препараты, порошки, гранулы, пеллеты, приллированные препараты, пастилки, таблетки, 5 наполненные пленки (в том числе покрытия для семян) и т. п., которые могут быть вододиспергируемыми ("смачиваемыми") или водорастворимыми. Пленки и покрытия, образованные из пленкообразующих растворов или текучих суспензий, в частности, являются применимыми для обработки семян. Активный ингредиент может быть (микро)инкапсулированным и дополнительно составленным в суспензию 10 или твердый состав; в качестве альтернативы, весь состав активного ингредиента может быть инкапсулирован (или "покрыт"). Посредством инкапсуляции можно контролировать или замедлять высвобождение активного ингредиента. В эмульгируемой грануле объединены преимущества как состава, представляющего собой эмульгируемый концентрат, так и сухого гранулированного состава. 15 Концентрированные композиции в основном используются в качестве промежуточных соединений для дальнейшего составления.

Распыляемые составы, как правило, разбавляются в подходящей среде перед распылением. Такие жидкие и твердые составы составляются таким образом, что они легко разбавляются в среде для распыления, обычно воде, но иногда в другой 20 подходящей среде, такой как ароматический или парафиновый углеводород или растительное масло. Объемы для распыления могут находиться в диапазоне от приблизительно одного до нескольких тысяч литров на гектар, но более часто находятся в диапазоне от приблизительно десяти до нескольких сотен литров на гектар. Распыляемые составы могут быть смешаны в баке с водой или другой 25 подходящей средой для обработки листьев посредством применения в отношении воздуха или земли или для применения в отношении среды произрастания растения. Жидкие и сухие составы можно вносить в определенном количестве непосредственно в системы капельного орошения или вносить в определенном количестве при вспахивании во время высаживания. Жидкие и твердые составы можно наносить на 30 семена сельскохозяйственных культур и другой требуемой растительности в качестве обработок семян перед высаживанием для защиты развивающихся корней и других подземных частей растений и/или листьев за счет системного поглощения.

Составы, как правило, будут содержать эффективные количества активного ингредиента, разбавителя и поверхностно-активного вещества в пределах следующих

приблизительных диапазонов, сумма которых составляет не более 100 процентов по весу.

	Весовой процент		
	<u>Активный</u> <u>ингредиент</u>	<u>Разбавител</u> <u>ь</u>	<u>Поверхностн</u> <u>о-активное</u> <u>вещество</u>
Вододиспергируемые и водорастворимые гранулы, таблетки и порошки	0,001–90	0–99,999	0–15
Масляные дисперсии, суспензии, эмульсии, растворы (в том числе эмульгируемые концентраты)	1–50	40–99	0–50
Пылевидные препараты	1–25	70–99	0–5
Гранулы и пеллеты	0,001–99	5–99,999	0–15
Концентрированные композиции	90–99	0–10	0–2

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

Жидкие разбавители предусматривают, например, воду, *N,N*-диметилалканамиды (например, *N,N*-диметилформамид), лимонен, диметилсульфоксид, *N*-алкилпирролидоны (например, *N*-метилпирролидинон), алкилфосфаты (например, триэтилфосфат), этиленгликоль, триэтиленгликоль, пропиленгликоль, дипропиленгликоль, полипропиленгликоль, пропиленкарбонат, бутиленкарбонат, парафины (например, белые минеральные масла, нормальные

парафины, изопарафины), алкилбензолы, алкилнафталины, глицерин, триацетат глицерина, сорбит, ароматические углеводороды, деароматизированные алифатические углеводороды, алкилбензолы, алкилнафталины, кетоны, такие как циклогексанон, 2-гептанон, изофорон и 4-гидрокси-4-метил-2-пентанон, ацетаты, такие как изоамилацетат, гексилацетат, гептилацетат, октилацетат, нонилацетат, тридецилацетат и изоборнилацетат, другие сложные эфиры, такие как алкилированные сложные эфиры лактата, двухосновные сложные эфиры алкил- и арилбензоатов, γ -бутиролактон, и спирты, которые могут быть линейными, разветвленными, насыщенными или ненасыщенными, такие 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, тетрагидрофурфуриловый спирт, диацетоновый спирт, крезол и бензиловый спирт. Жидкие разбавители также предусматривают сложные эфиры глицерина и насыщенных и ненасыщенных жирных кислот (как правило,

C_6-C_{22}), такие как масла из семян и плодов растений (например, масла оливы, клещевины, семени льна, кунжута, кукурузы (маиса), арахиса, подсолнечника, виноградной косточки, сафлора, семени хлопка, сои, семени рапса, кокоса и ядра кокосового ореха), жиры животного происхождения (например, говяжий жир, свиной жир, топленый свиной жир, жир печени трески, рыбий жир) и их смеси. Жидкие разбавители также включают алкилированные жирные кислоты (например, метилированные, этилированные, бутилированные), где жирные кислоты можно получать путем гидролиза сложных эфиров глицерина из растительных и животных источников и можно очищать путем дистилляции. Типичные жидкие разбавители описаны в Marsden, *Solvents Guide*, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950.

Твердые и жидкие композиции по настоящему изобретению часто содержат одно или несколько поверхностно-активных веществ. При добавлении в жидкость поверхностно-активные вещества (также известные как "поверхностно-активные средства"), как правило, изменяют, чаще всего снижают поверхностное натяжение жидкости. В зависимости от природы гидрофильных и липофильных групп в молекуле поверхностно-активного вещества поверхностно-активные вещества можно использовать в качестве смачивающих средств, диспергирующих веществ, эмульгаторов или антивспенивающих средств.

Поверхностно-активные вещества можно классифицировать на неионогенные, анионные или катионные. Неионогенные поверхностно-активные вещества,

применимые в композициях по настоящему изобретению, включают без ограничения 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; 5 этоксилаты аминов, алканоламиды и этоксилированные алканоламиды; алкоксилированные триглицериды, такие как этоксилированное соевое, касторовое и рапсовое масла; алкоксилаты алкилфенолов, такие как этоксилаты октилфенола, этоксилаты нонилфенола, этоксилаты динонилфенола и этоксилаты додецилфенола (полученные из фенолов и этиленоксида, пропиленоксида, бутиленоксида или их смесей); 10 блок-полимеры, полученные из этиленоксида или пропиленоксида, и блок-полимеры обратного типа, где концевые блоки получены из пропиленоксида; этоксилированные жирные кислоты; этоксилированные сложные эфиры жирных кислот и масел; этоксилированные сложные метиловые эфиры; этоксилированный тристирилфенол (в том числе полученные из этиленоксида, пропиленоксида, 15 бутиленоксида или их смесей); сложные эфиры жирных кислот, сложные эфиры глицерина, производные на основе ланолина, полиэтоксилированные сложные эфиры, 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 20 производные сорбитана, такие как сложные эфиры сорбитана; полимерные поверхностно-активные вещества, такие как статистические сополимеры, блок-сополимеры, алкидные смолы PEG (полиэтиленгликоля), привитые или гребнеобразные полимеры и звездообразные полимеры; полиэтиленгликоли (PEGs); сложные эфиры полиэтиленгликоля и жирных кислот; поверхностно-активные 25 вещества на основе силикона и производные сахаров, такие как сложные эфиры сахарозы, алкилполиглизозиды и алкилполисахариды.

Применимые анионные поверхностно-активные вещества включают без ограничения алкиларилсульфоновые кислоты и их соли; карбоксилированные этоксилаты спирта или алкилфенола; производные дифенилсульфоната; лигнин и 30 производные лигнина, такие как лигносульфонаты; малеиновую или янтарную кислоты или их ангидриды; олефинсульфонаты; сложные фосфатные эфиры, такие как сложные фосфатные эфиры алкоксилатов спиртов, сложные фосфатные эфиры алкоксилатов алкилфенолов и сложные фосфатные эфиры этоксилатов стирилфенола; поверхностно-активные вещества на основе белков; производные саркозина; сульфат 35 эфира стирилфенола; сульфаты и сульфонаты масел и жирных кислот; сульфаты и

сульфонаты этоксилированных алкилфенолов; сульфаты спиртов; сульфаты этоксилированных спиртов; сульфонаты аминов и амидов, такие как *N,N*-алкилтаураты; сульфонаты бензола, кумола, толуола, ксилола и додецил- и тридецилбензолов; сульфонаты конденсированных нафталинов; сульфонаты нафталина и алкилнафталина; сульфонаты фракционированного нефтепродукта; сульфосукцинаматы и сульфосукцинаты и их производные, такие как соли диалкилсульфосукцината.

Применимые катионные поверхностно-активные вещества включают без ограничения амиды и этоксилированные амиды; амины, такие как *N*-алкилпропандиамины, трипропиленстриамины и дипропилентетраамины, и этоксилированные амины, этоксилированные диамины и пропоксилированные амины (полученные из аминов и этиленоксида, пропиленоксида, бутиленоксида или их смесей); соли аминов, такие как ацетаты аминов, и соли диаминов; соли четвертичного аммония, такие как четвертичные соли, этоксилированные четвертичные соли и дичетвертичные соли, и оксиды аминов, такие как оксиды алкилдиметиламина и оксиды бис-(2-гидроксиэтил)-алкиламина.

Также применимыми в композициях по настоящему изобретению являются смеси неионогенных и анионных поверхностно-активных веществ или смеси неионогенных и катионных поверхностно-активных веществ. Неионогенные, анионные и катионные поверхностно-активные вещества и пути их рекомендуемого применения раскрыты в различных опубликованных источниках, включая *McCutcheon's Emulsifiers and Detergents*, ежегодные американские и международные издания, публикуемые McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; Sisely and Wood, *Encyclopedia of Surface Active Agents*, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964, и A. S. Davidson and B. Milwidsky, *Synthetic Detergents*, Seventh Edition, John Wiley and Sons, New York, 1987.

Композиции по настоящему изобретению также могут содержать вспомогательные вещества и добавки для составления, известные специалистам в данной области техники как вспомогательные средства для составления (некоторые из которых можно рассматривать как функционирующие в качестве твердых разбавителей, жидких разбавителей или поверхностно-активных веществ). Такие вспомогательные вещества и добавки для составления могут обеспечивать контроль: рН (буферы), пенообразования во время обработки (пеногасители, такие как полиорганосилоксаны), осаждения активных ингредиентов (суспенсирующие средства), вязкости (тиксотропные загустители), роста микроорганизмов в контейнере

(противомикробные средства), замораживания продукта (антифризы), цвета (дисперсии красителя/пигмента), вымывания (пленкообразователи или адгезивные средства), испарения (замедлители испарения) и других свойств состава. Пленкообразователи включают, например, поливинилацетаты, сополимеры поливинилацетата, сополимер поливинилпирролидона и винилацетата, поливиниловые спирты, сополимеры поливинилового спирта и воски. Примеры вспомогательных веществ и добавок для составления включают те, которые перечислены в *McCutcheon's Volume 2: Functional Materials*, ежегодных международных и североамериканских изданиях, публикуемых McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co., и публикации согласно РСТ WO 03/024222.

Соединение формулы 1 и любые другие активные ингредиенты, как правило, включают в композиции по настоящему изобретению путем растворения активного ингредиента в растворителе или путем измельчения в жидком или сухом разбавителе. Растворы, в том числе эмульгируемые концентраты, можно получать посредством простого смешивания ингредиентов. Если растворитель в жидкой композиции, предназначенной для применения в качестве эмульгируемого концентрата, является несмешивающимся с водой, то, как правило, добавляется эмульгатор для эмульгирования содержащего активный ингредиент растворителя при разбавлении водой. Взвеси активного ингредиента со значениями диаметра частиц, составляющими не более 2000 мкм, можно подвергать влажному измельчению с применением мельницы со средой с получением частиц со средними значениями диаметра, составляющими ниже 3 мкм. Водные взвеси можно превращать в готовые концентраты суспензии (см., например, патент США № 3060084) или дополнительно обрабатывать путем высушивания посредством распыления с образованием вододиспергируемых гранул. Для сухих составов обычно требуются способы сухого измельчения, посредством которого получают частицы со средними значениями диаметра частиц, находящимися в диапазоне от 2 до 10 мкм. Пылевидные препараты и порошки можно получать посредством смешивания и обычно гомогенизации (например с помощью молотковой мельницы или струйной мельницы). Гранулы и pellets можно получать посредством напыления активного материала на предварительно сформированные гранулированные носители или посредством методик агломерации. См. Browning, "Agglomeration", *Chemical Engineering*, December 4, 1967, pp 147–48, *Perry's Chemical Engineer's Handbook*, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, страницы 8-57 и далее, и WO 91/13546. Pellets можно получать, как

описано в патенте США № 4172714. Вододиспергируемые и водорастворимые гранулы можно получать, как описано в патенте США № 4144050, патенте США № 3920442 и в патенте Германии № 3246493. Таблетки можно получать, как описано в патентах США № 5180587, № 5232701 и № 5208030. Пленки можно получать, как описано в патенте Великобритании № 2095558 и патенте США № 3299566.

Для дополнительной информации, относящейся к области составления, см. T. S. Woods, "The Formulator's Toolbox – Product Forms for Modern Agriculture" в *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. См. также патент США № 3235361, от кол. 6, строка 16 до кол. 7, строка 19 и примеры 10-41; патент США № 3309192, от кол. 5, строка 43 до кол. 7, строка 62 и примеры 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138-140, 162-164, 166, 167 и 169-182; патент США № 2891855, от кол. 3, строка 66 до кол. 5, строка 17 и примеры 1-4; Klingman, *Weed Control as a Science*, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pp 81–96; Hance et al., *Weed Control Handbook*, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989, и *Developments in formulation technology*, PJB Publications, Richmond, UK, 2000.

В следующих примерах все составы получены традиционными путями. Номера соединений относятся к соединениям в таблицах индексов А – В. Без дополнительного уточнения полагают, что специалист в данной области техники, применяя предшествующее описание, может осуществить на практике настоящее изобретение в его наиполнейшей степени. Следующие примеры, следовательно, следует рассматривать как исключительно иллюстративные и абсолютно не ограничивающие настоящее изобретение каким-либо образом. Процентные доли приведены по весу, за исключением случаев, где указано иное.

Пример А

Концентрированный концентрат

Соединение 8	98,5%
аэрогель на основе диоксида кремния	0,5%
синтетический аморфный мелкодисперсный диоксид кремния	1,0%

Пример ВСмачиваемый порошок

Соединение 14	65,0%
сложный эфир додецилфенола и полиэтиленгликоля	2,0%
лигнинсульфонат натрия	4,0%
алюмосиликат натрия	6,0%
монтмориллонит (кальцинированный)	23,0%

Пример СГранула

Соединение 19	10,0%
аттапульгитовые гранулы (вещество с низкой летучестью, 0,71/0,30 мм; № 25-50 сита согласно U.S.S.)	90,0%

Пример DЭкструдированная пеллета

Соединение 78	25,0%
безводный сульфат натрия	10,0%
неочищенный лигнинсульфонат кальция	5,0%
алкилнафталинсульфонат натрия	1,0%
кальциевый/магниевый бентонит	59,0%

Пример EЭмульгируемый концентрат

Соединение 3	10,0%
гексолеат полиоксиэтиленсорбита	20,0%
сложный метиловый эфир C ₆ -C ₁₀ -жирной кислоты	70,0%

5

Пример FМикроэмульсия

Соединение 86	5,0%
сополимер поливинилпирролидона и винулацетата	30,0%
алкилполигликозид	30,0%
глицерилмоноолеат	15,0%
вода	20,0%

Пример GОбработка семян

Соединение 20	20,00%
сополимер поливинилпирролидона и винулацетата	5,00%
воск на основе монтановой кислоты	5,00%
лигнинсульфонат кальция	1,00%
блок-сополимеры	1,00%
полиоксиэтилена/полиоксипропилена	
стеариловый спирт (РОЕ 20)	2,00%
полиорганосилан	0,20%
красный краситель для окрашивания	0,05%
вода	65,75%

Пример HУдобрение в виде палочки

Соединение 32	2,5%
сополимер пирролидона и стирола	4,8%
трисстирилфенил-16-этоксилат	2,3%
тальк	0,8%
кукурузный крахмал	5,0%
удобрение с медленным высвобождением	36,0%
каолин	38,0%
вода	10,6%

Пример IКонцентрат суспензии

Соединение 67	35%
блок-сополимер бутилполиоксиэтилена/полипропилена	4,0%
сополимер стеариновой кислоты/полиэтиленгликоля	1,0%
стирол-акриловый полимер	1,0%
ксантановая камедь	0,1%
пропиленгликоль	5,0%
противовспенивающее средство на основе силикона	0,1%
1,2-бензизотиазолин-3-он	0,1%
вода	53,7%

Пример JЭмульсия в воде

Соединение 34	10,0%
блок-сополимер бутилполиоксиэтилена/полипропилена	4,0%
сополимер стеариновой кислоты/полиэтиленгликоля	1,0%
стирол-акриловый полимер	1,0%
ксантановая камедь	0,1%
пропиленгликоль	5,0%
противовспенивающее средство на основе силикона	0,1%
1,2-бензизотиазолин-3-он	0,1%
ароматический углеводород на основе нефтепродукта	20,0
вода	58,7%

Пример KМасляная дисперсия

Соединение 39	25%
гексаолеат полиоксиэтиленсорбита	15%
органически модифицированная бентонитовая глина	2,5%
сложный метиловый эфир жирной кислоты	57,5%

Пример LСуспензия

Соединение 16	10,0%
имидаклоприд	5,0%
блок-сополимер бутилполиоксиэтилена/полипропилена	4,0%
сополимер стеариновой кислоты/полиэтиленгликоля	1,0%
стирол-акриловый полимер	1,0%
ксантановая камедь	0,1%
пропиленгликоль	5,0%
противовспенивающее средство на основе силикона	0,1%
1,2-бензизотиазолин-3-он	0,1%
ароматический углеводород на основе нефтепродукта	20,0%
вода	53,7%

5 Соединения по настоящему изобретению проявляют активность в отношении широкого спектра беспозвоночных вредителей. Эти вредители включают

беспозвоночных, населяющих различные среды, такие как, например, листья, корни растений, почва, собранный урожай сельскохозяйственных культур или другие продукты питания, строительные конструкции или покровы животных. Эти вредители включают, например, беспозвоночных, питающихся листьями (включая листья, стебли, цветки и плоды), семенами, древесиной, текстильными волокнами или кровью или тканями животных, таким образом вызывающих повреждение или ущерб, например, выращиваемых или хранящихся агрономических сельскохозяйственных культур, лесов, тепличных культур, декоративных растений, саженцев, хранящихся продуктов питания или волокнистых продуктов, или домов или других строений или их содержимого, или нанося вред здоровью животных или общественному здоровью. Специалисты в данной области техники поймут, что не все соединения одинаково эффективны против всех стадий роста всех вредителей.

Данные соединения и композиции по настоящему изобретению, таким образом, являются агрономически пригодными для обеспечения защиты полевых культур от беспозвоночных вредителей-фитофагов, а также неагрономически пригодными для обеспечения защиты других садовых культур и растений от беспозвоночных вредителей-фитофагов. Данная применимость предусматривает обеспечение защиты сельскохозяйственных культур и других растений (т. е. как агрономических, так и неагрономических), которые содержат генетический материал, введенный посредством генной инженерии (т. е. трансгенный) или модифицированный посредством мутагенеза для обеспечения признаков, обеспечивающих преимущество. Примеры таких признаков включают устойчивость к гербицидам, устойчивость к вредителям-фитофагам (например, насекомым, клещам, видам тли, паукам, нематодам, улиткам, фитопатогенным грибам, бактериям и вирусам), улучшение роста растений, повышенную устойчивость к неблагоприятным условиям роста, таким как высокие или низкие температуры, низкая или высокая влажность почвы и высокое засоление, повышение эффективности цветения или плодоношения, более высокий выход урожая, более быстрое созревание, более высокое качество и/или пищевая ценность собранного продукта или улучшение показателей хранения или обработки собранных продуктов. Трансгенные растения можно модифицировать для экспрессии нескольких признаков. Примеры растений, характеризующихся признаками, полученными посредством генной инженерии или мутагенеза, включают сорта кукурузы, хлопка, сои и картофеля, экспрессирующие инсектицидный токсин *Bacillus thuringiensis*, такие как YIELD GARD[®], KNOCKOUT[®], STARLINK[®], BOLLGARD[®],

NuCOTN[®] и NEWLEAF[®], INVICTA RR2 PRO[™], и устойчивые к гербицидам сорта кукурузы, хлопка, сои и рапса, такие как ROUNDUP READY[®], LIBERTY LINK[®], IMI[®], STS[®] и CLEARFIELD[®], а также сельскохозяйственные культуры, экспрессирующие *N*-ацетилтрансферазу (GAT) для обеспечения устойчивости к гербициду глифосату, или сельскохозяйственные культуры, содержащие ген HRA, обеспечивающий устойчивость к гербицидам, ингибирующим ацетолактатсинтазу (ALS). Соединения и композиции по настоящему изобретению могут проявлять усиленные эффекты вместе с признаками, введенными посредством генной инженерии или модифицированными посредством мутагенеза, с повышением таким образом фенотипической экспрессии или эффективности признаков или с повышением эффективности контроля беспозвоночных вредителей с помощью соединений и композиций по настоящему изобретению. В частности, соединения и композиции могут проявлять усиленные эффекты вместе с фенотипической экспрессией белков или других естественных продуктов, токсичных для беспозвоночных вредителей, с получением более сильного по сравнению с аддитивным контролем таких вредителей.

Композиции по настоящему изобретению могут также необязательно содержать питательные вещества для растений, например композицию удобрения, содержащую по меньшей мере одно питательное вещество для растений, выбранное из азота, фосфора, калия, серы, кальция, магния, железа, меди, бора, марганца, цинка и молибдена. Следует отметить композиции, содержащие по меньшей мере одну композицию удобрения, содержащую по меньшей мере одно питательное вещество для растений, выбранное из азота, фосфора, калия, серы, кальция и магния. Композиции по настоящему изобретению, которые дополнительно содержат по меньшей мере одно питательное вещество для растений, могут находиться в форме жидкостей или твердых веществ. Следует отметить твердые составы в форме гранул, маленьких палочек или таблеток. Твердые составы, содержащие композицию удобрения, могут быть получены посредством смешивания соединения или композиции по настоящему изобретению с композицией удобрения вместе с ингредиентами для составления с последующим получением состава посредством таких способов, как грануляция или экструзия. В качестве альтернативы твердые составы могут быть получены путем распыления раствора или суспензии соединения или композиции по настоящему изобретению в летучем растворителе на ранее полученную композицию удобрений в форме смесей со стабильными размерами,

например гранул, небольших палочек или таблеток, и затем выпаривания растворителя.

Неагрономические пути применения означают контроль беспозвоночных вредителей на территориях, отличных от полей сельскохозяйственных растений.

5 Неагрономические пути применения соединений и композиций по настоящему изобретению включают контроль беспозвоночных вредителей в хранящихся зернах, бобах и других пищевых продуктах, а также в текстильных изделиях, таких как одежда и ковры. Неагрономические пути применения соединений и композиций по настоящему изобретению также включают контроль беспозвоночных вредителей в декоративных растениях, лесах, во дворах, вдоль обочин дорог и на полосах отвода железных дорог, а также на газонах, таких как лужайки, поля для гольфа и пастбища. Неагрономические пути применения соединений и композиций по настоящему изобретению также включают контроль беспозвоночных вредителей в домах и других зданиях, которые могут быть заняты людьми и/или домашними животными, животными, выращиваемыми на ферме, ранчо, животными в зоопарках или другими животными. Неагрономические пути применения соединений и композиций по настоящему изобретению также включают контроль вредителей, таких как термиты, которые могут повредить древесину или другие конструкционные материалы, применяемые в зданиях.

20 Неагрономические пути применения соединений и композиций по настоящему изобретению также включают обеспечение защиты здоровья человека и животных путем обеспечения контроля беспозвоночных вредителей, которые являются паразитами или передают инфекционные заболевания. Контроль паразитов у животных включает контроль внешних паразитов, паразитирующих на поверхности тела животного-хозяина (например, на плечах, подмышках, животе, внутренней части бедер), и внутренних паразитов, паразитирующих внутри тела животного-хозяина (например, в желудке, кишечнике, легком, венах, под кожей, в лимфатической ткани). К внешним паразитам или вредителям, передающим заболевания, относятся, например, клещи-тромбикуиды, иксодовые клещи, вши, комары, мухи, клещи и блохи. К внутренним паразитам относятся сердечные черви, круглые черви и гельминты. Соединения и композиции по настоящему изобретению являются подходящими для системного и/или несистемного контроля поражения или заражения животных паразитами. Соединения и композиции по настоящему изобретению являются особенно подходящими для борьбы с внешними паразитами или вредителями, которые переносят болезни. Соединения и композиции по настоящему изобретению

являются подходящими для борьбы с паразитами, поражающими сельскохозяйственных рабочих животных, таких как крупный рогатый скот, овцы, козы, лошади, свиньи, ослы, верблюды, буйволы, кролики, куры, индейки, утки, гуси и пчелы; домашних животных и одомашненных животных, таких как собаки, кошки, домашние птицы и аквариумные рыбки; а также так называемых подопытных животных, таких как хомяки, морские свинки, крысы и мыши. В результате борьбы с этими паразитами снижаются смертность и снижение продуктивности (в отношении мяса, молока, шерсти, шкур, яиц, меда и т. д.), так что применение композиции, содержащей соединение по настоящему изобретению, обеспечивает возможность более экономичного и простого содержания животных.

Примеры агрономических или неагрономических беспозвоночных вредителей включают яйца, личинки и взрослых особей представителей отряда Lepidoptera, таких как гусеницы, совки, пяденицы и представители подсемейства Heliothinae семейства Noctuidae (например, совка розовая стеблевая (*Sesamia inferens* Walker), совка кукурузная стеблевая (*Sesamia nonagrioides* Lefebvre), совка южная (*Spodoptera eridania* Cramer), совка травяная (*Spodoptera frugiperda* J. E. Smith), совка малая (*Spodoptera exigua* Hübner), совка хлопковая (*Spodoptera littoralis* Boisduval), совка желто-бурая полосатая (*Spodoptera ornithogalli* Guenée), совка-ипсилон (*Agrotis ipsilon* Hufnagel), совка бархатных бобов (*Anticarsia gemmatalis* Hübner), плодоярка зеленая (*Lithophane antennata* Walker), совка капустная (*Barathra brassicae* Linnaeus), совка соевая (*Pseudoplusia includens* Walker), совка ни (*Trichoplusia ni* Hübner), совка табачная (*Heliothis virescens* Fabricius)); мотыльки, чехлоноски, гусеницы, строящие паутинное гнездо, конусовидные гусеницы, гусеницы бабочки-капустницы и вредители, скелетирующие листья, из семейства Pyralidae (например, мотылек кукурузный (*Ostrinia nubilalis* Hübner), гусеница, повреждающая цитрусовые (*Amyelois transitella* Walker), огневка кукурузная (*Crambus caliginosellus* Clemens), огневки-травянки (Pyralidae: *Crambinae*), например, луговой мотылек (*Herpetogramma licarsisalis* Walker), огневка сахарного тростника (*Chilo infuscatellus* Snellen), огневка томатная малая (*Neoleucinodes elegantalis* Guenée), листовертка травяная (*Cnaphalocrocis medinalis* Guenée), огневка виноградная (*Desmia funeralis* Hübner), огневка (*Diaphania nitidalis* Stoll), огневка капустная (*Hellula hydralis* Guenée), огневка желтая стеблевая (*Scirpophaga incertulas* Walker), огневка белая стеблевая (*Scirpophaga innotata* Walker), огневка, повреждающая верхние побеги (*Scirpophaga nivella* Fabricius), огневка темноголовая рисовая (*Chilo polychrysus* Meyrick), огневка желтая рисовая (*Chilo suppressalis* Walker), капустница (*Crociodomia binotalis* Zeller));

листовертки, листовертки-почкоеды, вредители семян и плодоярки из семейства Tortricidae (например, плодоярка яблонная (*Cydia pomonella* Linnaeus), плодоярка виноградная (*Paralobesia viteana* Clemens), плодоярка восточная персиковая (*Grapholita molesta* Busck), плодоярка ложная яблонная (*Cryptophlebia leucotreta* Meyrick), плодоярка цитрусовая (*Gymnandrosoma aurantiamum* Lima), листовертка краснополосая (*Argyrotaenia velutinana* Walker), листовертка скошеннополосая (*Choristoneura rosaceana* Harris), плодоярка светло-коричневая яблонная (*Epiphyas postvittana* Walker), листовертка двухлетняя виноградная (*Eupoecilia ambiguella* Hübner), вертунья почковая (*Pandemis pyrusana* Kearfott), листовертка всеядная (*Platynota stultana* Walsingham), листовертка смородиновая (*Pandemis cerasana* Hübner), листовертка кривоусая ивовая (*Pandemis heparana* Denis & Schiffermüller)); и многие другие важные с экономической точки зрения чешуекрылые (например, капустная моль (*Plutella xylostella* Linnaeus), розовый хлопковый червь (*Pectinophora gossypiella* Saunders), непарник (*Lymantria dispar* Linnaeus), плодоярка персиковая (*Carposina niponensis* Walsingham), моль фруктовая полосатая (*Anarsia lineatella* Zeller), моль картофельная (*Phthorimaea operculella* Zeller), моль-пестрянка плодовая (*Phyllonorycter blancardella* Fabricius), азиатская яблонная моль-пестрянка (*Lithocolletis ringoniella* Matsumura), листовертка рисовая (*Lerodea eufala* Edwards), моль кружковая боярышниковая (*Leucoptera scitella* Zeller)); яйца, нимфы и взрослых особей представителей отряда Blattodea, в том числе тараканов из семейств Blattellidae и Blattidae (например, таракана черного (*Blatta orientalis* Linnaeus), таракана азиатского (*Blattella asahinai* Mizukubo), таракана рыжего (*Blattella germanica* Linnaeus), таракана коричневого полосатого (*Supella longipalpa* Fabricius), таракана американского (*Periplaneta americana* Linnaeus), таракана коричневого (*Periplaneta brunnea* Burmeister), таракана мадейского (*Leucophaea maderae* Fabricius)), таракана дымчато-коричневого (*Periplaneta fuliginosa* Serville), таракана австралийского (*Periplaneta australasiae* Fabr.), таракана мраморного (*Nauphoeta cinerea* Olivier) и таракана гладкого (*Symploce pallens* Stephens)); яйца, личинки, питающиеся листьями, фруктами, корнями, семенами и везикулярной тканью, и взрослых особей представителей отряда Coleoptera, в том числе долгоносиков из семейств Anthribidae, Bruchidae и Curculionidae (например, долгоносика хлопкового (*Anthonomus grandis* Boheman), долгоносика рисового водяного (*Lissorhoptrus oryzophilus* Kuschel), долгоносика амбарного (*Sitophilus granarius* Linnaeus), долгоносика рисового (*Sitophilus oryzae* Linnaeus)), долгоносика мятлика однолетнего (*Listronotus maculicollis* Dietz), долгоносика мятликового (*Sphenophorus parvulus* Gyllenhal), долгоносика

рыскающего (*Sphenophorus venatus vestitus* Chittenden), долгоносика Скалистых гор (*Sphenophorus cicatristriatus* Fahraeus)); земляных блошек, огуречных жуков, личинок, повреждающих корни, листоедов, картофельных жуков и молей-пестрянок семейства Chrysomelidae (например, жука колорадского (*Leptinotarsa decemlineata* Say), жука западного кукурузного (*Diabrotica virgifera* LeConte)); хрущей и других жуков из семейства Scarabaeidae (например, хрущика японского (*Popillia japonica* Newman), хрущика восточного (*Anomala orientalis* Waterhouse, хрущика северного (*Cyclocephala borealis* Arrow), хрущика южного (*Cyclocephala immaculata* Olivier или *C. lurida* Bland), жука-навозника и личинку майского хруща (*Aphodius* spp.), хруща черного газонного (*Ataenius spretulus* Haldeman), хруща блестящего зеленого (*Cotinis nitida* Linnaeus), хрущика садового азиатского (*Maladera castanea* Arrow), майских/июньских жуков (*Phyllophaga* spp.) и хруща европейского (*Rhizotrogus majalis* Razoumowsky)); кожеедов из семейства Dermestidae; проволочников семейства Elateridae; жуков-короедов из семейства Scolytidae и мучных хрущаков из семейства Tenebrionidae.

15 Кроме того, агрономические и неагрономические вредители включают: яйца, взрослых особей и личинки представителей отряда Dermaptera, в том числе уховерток из семейства Forficulidae (например, уховертку европейскую (*Forficula auricularia* Linnaeus), уховертку черную (*Chelisoches morio* Fabricius)); яйца, неполовозрелых особей, взрослых особей и нимф отряда Hemiptera, таких как клопы-слепняки из семейства Miridae, цикады из семейства Cicadidae, цикадки (например, *Empoasca* spp.) из семейства Cicadellidae, постельные клопы (например, *Cimex lectularius* Linnaeus) из семейства Cimicidae, насекомые из семейств Fulgoridae и Delphacidae, горбатки из семейств Membracidae, псиллиды из семейства Liviidae, Psyllidae и Triozidae, белокрылки из семейства Aleyrodidae, тли из семейства Aphididae, филлоксеры из семейства Phylloxeridae, войлочники из семейства Pseudococcidae, щитовки из семейства Coccidae, Diaspididae и Margarodidae, клопы-кружевницы из семейства Tingidae, клопы-щитники из семейства Pentatomidae, клопы-черепашки (например, пшеничный клоп-черепашка (*Blissus leucopterus hirtus* Montandular) и южный клоп-черепашка (*Blissus insularis* Barber)) и другие наземники из семейства Lygaeidae, пенницы из семейства Cercopidae, клопы-ромбовики из семейства Coreidae, и красноклопы и красноклопы хлопковые из семейства Pyrrhocoridae.

Агрономические и неагрономические вредители также включают: яйца, личинки, нимф и взрослых особей представителей отряда Acari (клещи), таких как клещи паутиные и клещи красные семейства Tetranychidae (например, европейский красный клещ (*Panonychus ulmi* Koch), клещ двупятнистый паутиный (*Tetranychus*

urticae Koch), клещ паутиновый Макдэниела (*Tetranychus mcdanieli* McGregor)); плоские клещи из семейства Tenuipalpidae (например, клещ плоский цитрусовый (*Brevipalpus lewisi* McGregor)); галловые и почковые клещи семейства Eriophyidae и другие питающиеся листвой клещи и клещи, причиняющие вред здоровью человека и животных, т. е. пылевые клещи семейства Epidermoptidae, железницы семейства Demodecidae, зерновые клещи семейства Glycyphagidae; иксодовые клещи семейства Ixodidae, общеизвестные как твердые иксодовые клещи (например, клещ черноногий (*Ixodes scapularis* Say), австралийский парализующий клещ (*Ixodes holocyclus* Neumann), иксодовый клещ собачий (*Dermacentor variabilis* Say), клещ-одиночка (*Amblyomma americanum* Linnaeus)) и иксодовые клещи семейства Argasidae, общеизвестные как мягкие иксодовые клещи (например, клещ орнитодорус (*Ornithodoros turicata* Duges), клещ персидский обыкновенный (*Argas radiatus* Raillet)); конские клещи и чесоточные зудни из семейств Psoroptidae, Pyemotidae и Sarcoptidae; яйца, взрослых особей и неполовозрелых особей представителей отряда Orthoptera, в том числе кузнечиков, саранчу и сверчков (например, мигрирующих кузнечиков (например, *Melanoplus sanguinipes* Fabricius, *M. differentialis* Thomas), американских кузнечиков (например, *Schistocerca americana* Drury), саранчу пустынную (*Schistocerca gregaria* Forsskal), саранчу перелетную (*Locusta migratoria* Linnaeus), саранчу кустовую (*Zonocerus* spp.), сверчка домового (*Acheta domesticus* Linnaeus), медведку (например, медведку бурую (*Scapteriscus vicinus* Scudder) и медведку южную (*Scapteriscus borellii* Giglio-Tos)); яйца, взрослых особей и молодых особей представителей отряда Diptera, в том числе минирующих мушек (например, *Liriomyza* spp., таких как томатный листовой минер (*Liriomyza sativae* Blanchard)), мелких двукрылых насекомых, пестрокрылок (Tephritidae), мушек шведских (например, *Oscinella frit* Linnaeus), личинок насекомых, живущих в почве, мух комнатных (например, *Musca domestica* Linnaeus), журчалок домашних (например, *Fannia canicularis* Linnaeus, *F. femoralis* Stein), жигалок осенних (например, *Stomoxys calcitrans* Linnaeus), мух обыкновенных полевых, жигалок коровьих малых, падальных мух (например, *Chrysomya* spp., *Phormia* spp.) и других мухообразных летающих вредителей, слепней (например, *Tabanus* spp.), оводов (например, *Gasterophilus* spp., *Oestrus* spp.), бычьих оводов (например, *Hypoderma* spp.), оленьих мух (например, *Chrysops* spp.), рунцов (например, *Melophagus ovinus* Linnaeus) и других Brachycera, комаров (например, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp.), мошек (например, *Prosimulium* spp., *Simulium* spp.), мокрецов, москитов, сциарид и других представителей Nematocera; яйца, взрослых особей и неполовозрелых особей

представителей отряда Thysanoptera, в том числе трипсов луковых (*Thrips tabaci* Lindeman), трипсов обыкновенных (*Frankliniella* spp.) и других поедающих листья трипсов; насекомых-вредителей из отряда Hymenoptera, в том числе муравьев из семейства Formicidae, в том числе муравья-древоточца флоридского (*Camponotus floridanus* Buckley), муравья-древоточца красного (*Camponotus ferrugineus* Fabricius), муравья-древоточца черного (*Camponotus pennsylvanicus* De Geer), муравья белого (*Technomyrmex albipes* F. Smith), муравья крупноголового (*Pheidole* sp.), муравья-призрака (*Tapinoma melanocephalum* Fabricius); муравья фараонового (*Monomorium pharaonis* Linnaeus), муравья огненного малого (*Wasmannia auropunctata* Roger), муравья огненного (*Solenopsis geminata* Fabricius), муравья огненного импортного красного (*Solenopsis invicta* Buren), муравья аргентинского (*Iridomyrmex humilis* Mayr), сумасшедшего муравья (*Paratrechina longicornis* Latreille), муравья дернового (*Tetramorium caespitum* Linnaeus), кукурузного муравья (*Lasius alienus* Förster) и домашнего муравья (*Tapinoma sessile* Say). Другие представители Hymenoptera включают пчел (в том числе пчел-плотников), шершней, настоящих ос, роющих ос и пилильщиков (*Neodiprion* spp.; *Cephus* spp.); насекомые-вредители из отряда Isoptera включают термитов из семейств Termitidae (например, *Macrotermes* sp., *Odontotermes obesus* Rambur), Kalotermitidae (например, *Cryptotermes* sp.) и Rhinotermitidae (например, *Reticulitermes* sp., *Coptotermes* sp., *Heterotermes tenuis* Hagen), восточного подземного термита (*Reticulitermes flavipes* Kollar), западного подземного термита (*Reticulitermes hesperus* Banks), тайваньского подземного термита (*Coptotermes formosanus* Shiraki), западно-индийского термита в сухой древесине (*Incisitermes immigrans* Snyder), порошкового термита (*Cryptotermes brevis* Walker), термита в сухой древесине (*Incisitermes snyderi* Light), юго-восточных подземных термитов (*Reticulitermes virginicus* Banks), западных термитов в сухой древесине (*Incisitermes minor* Hagen), древесных термитов, таких как *Nasutitermes* sp. и других экономически важных термитов; насекомых-вредителей из отряда Thysanura включают таких, как чешуйница (*Lepisma saccharina* Linnaeus) и термобия домашняя (*Thermobia domestica* Packard); насекомые-вредители из отрядов Mallophaga и Phthiraptera включают вошь головную (*Pediculus humanus capitis* De Geer), вошь платяную (*Pediculus humanus* Linnaeus), вошь куриную (*Menacanthus stramineus* Nitzsch), власоеда собачьего (*Trichodectes canis* De Geer), пухоеда куриного пестробрюхого (*Goniocotes gallinae* De Geer), вошь овечью (*Bovicola ovis* Schrank), вошь коровью коротконогую (*Haematopinus eurysternus* Nitzsch), вошь рогатого скота длинноносую (*Linognathus vituli* Linnaeus) и других сосущих и грызущих паразитических вшей, поражающих

человека и животных; насекомые-вредители отряда Siphonoptera включают блоху крысиную южную (*Xenopsylla cheopis* Rothschild), блоху кошачью (*Ctenocephalides felis* Bouché), блоху собачью (*Ctenocephalides canis* Curtis), блоху куриную (*Ceratophyllus gallinae* Schrank), блоху присасывающуюся (*Echidnophaga gallinacea* Westwood), блоху человеческую (*Pulex irritans* Linnaeus) и других блох, поражающих млекопитающих и птиц. Дополнительные охватываемые членистоногие вредители включают пауков из отряда Araneae, таких как коричневый паук-отшельник (*Loxosceles reclusa* Gertsch & Mulaik) и паук черная вдова (*Latrodectus mactans* Fabricius), а также многоножек из отряда Scutigeroforma, таких как мухоловка обыкновенная (*Scutigera coleoptrata* Linnaeus).

Примеры беспозвоночных вредителей хранящегося зерна включают точильщика зернового большого (*Prostephanus truncatus* Horn), точильщика зернового (*Rhyzopertha dominica* Fabricius), долгоносика рисового (*Sitophilus oryzae* Linnaeus), долгоносика кукурузного (*Sitophilus zeamais* Motschulsky), зерновку китайскую (*Callosobruchus maculatus* Fabricius), хрущака каштанового (*Tribolium castaneum* Herbst), долгоносика амбарного (*Sitophilus granarius* Linnaeus), моль индийскую мучную (*Plodia interpunctella* Hübner), огневку мельничную (*Ephestia kuehniella* Zeller) и мукоеда малого или рыжего (*Cryptolestes ferrugineus* Stephens).

Соединения по настоящему изобретению могут обладать активностью в отношении представителей классов Nematoda, Cestoda, Trematoda и Acanthocephala, включая важных с экономической точки зрения представителей отрядов Strongylida, Ascaridida, Oxyurida, Rhabditida, Spirurida и Enoplida, таких как без ограничения важные с экономической точки зрения сельскохозяйственные вредители (т. е. яванские галловые нематоды из рода *Meloidogyne*, ранящие нематоды из рода *Pratylenchus*, корневые нематоды из рода *Trichodorus* и т. д.) и вредители, причиняющие вред здоровью животных и человека (т. е. все важные с экономической точки зрения трематоды, ленточные черви и круглые черви, такие как *Strongylus vulgaris* у лошадей, *Toxocara canis* у собак, *Haemonchus contortus* у овец, *Dirofilaria immitis* Leidy у собак, *Anoplocephala perfoliata* у лошадей, *Fasciola hepatica* Linnaeus у жвачных животных и т. д.).

Соединения по настоящему изобретению могут обладать активностью против вредителей отряда Lepidoptera (например, *Alabama argillacea* Hübner (совки хлопковой), *Archips argyrospila* Walker (листовертки плодовых деревьев), *A. rosana* Linnaeus (листовертки европейской) и других видов *Archips*, *Chilo suppressalis* Walker (точильщика рисового стеблевого), *Snaphalocrocis medinalis* Guenée (листовертки

рисовой), *Crambus caliginosellus* Clemens (огневки кукурузной корневой), *Crambus teterrellus* Zincken (огневки мятлика), *Cydia pomonella* Linnaeus (плодожорки яблонной), *Earias insulana* Boisduval (совки шиповатой), *Earias vittella* Fabricius (совки пятнистой), *Helicoverpa armigera* Hübner (совки хлопковой), *Helicoverpa zea* Boddie
 5 (совки кукурузной), *Heliothis virescens* Fabricius (совки табачной), *Herpetogramma licarsisalis* Walker (лугового мотылька), *Lobesia botrana* Denis & Schiffermüller (листовертки виноградной), *Pectinophora gossypiella* Saunders (розового хлопкового червя), *Phyllocnistis citrella* Stainton (минирующей цитрусовой моли), *Pieris brassicae* Linnaeus (белянки капустной), *Pieris rapae* Linnaeus (репницы), *Plutella xylostella*
 10 Linnaeus (капустной моли), *Spodoptera exigua* Hübner (совки малой), *Spodoptera litura* Fabricius (азиатской хлопковой совки, гроздевой листовертки), *Spodoptera frugiperda* J. E. Smith (совки травяной), *Trichoplusia ni* Hübner (совки капустной) и *Tuta absoluta* Meugick (томатной минирующей моли)).

Соединения по настоящему изобретению обладают значительной активностью в
 15 отношении представителей отряда Hemiptera, в том числе *Acyrtosiphon pisum* Harris (тли гороховой), *Aphis craccivora* Koch (тли люцерновой), *Aphis fabae* Scopoli (тли бобовой), *Aphis gossypii* Glover (тли хлопковой, тли бахчевой), *Aphis pomi* De Geer (тли яблоневого), *Aphis spiraeicola* Patch (тли таволговой), *Aulacorthum solani* Kaltentbach (тли картофельной), *Chaetosiphon fragaefolii* Cockerell (тли земляничной), *Diuraphis noxia*
 20 Kurdjumov/Mordvilko (русской пшеничной тли), *Dysaphis plantaginea* Passerini (тли яблоневого розовой), *Eriosoma lanigerum* Hausmann (тли яблоневого кровяной), *Hyalopterus pruni* Geoffroy (тли мучнистой сливовой), *Lipaphis pseudobrassicae* Davis (тли горчичной листовой), *Metopolophium dirrhodum* Walker (тли розанно-злаковой), *Macrosiphum euphorbiae* Thomas (тли картофельной большой), *Myzus persicae* Sulzer
 25 (тли персиковой, тли зеленой персиковой), *Nasonovia ribisnigri* Mosley (тли салатной), *Pemphigus* spp. (корневых тлей и галловых тлей), *Rhopalosiphum maidis* Fitch (тли кукурузной листовой), *Rhopalosiphum padi* Linnaeus (тли черемуховой), *Schizaphis graminum* Rondani (тли злаковой), *Sitobion avenae* Fabricius (тли большой злаковой), *Therioaphis maculata* Buckton (тли клеверной), *Toxoptera aurantii* Boyer de Fonscolombe
 30 (тли цитрусовой), и *Toxoptera citricidus* Kirkaldy (тли цитрусовой коричневой); *Adelges* spp. (хермесов); *Phylloxera devastatrix* Pergande (филлоксеры гикори); *Bemisia tabaci* Gennadius (белокрылки табачной, белокрылки бататовой), *Bemisia argentifolii* Bellows & Perring (белокрылки магнолиевой), *Dialeurodes citri* Ashmead (белокрылки цитрусовой) и *Trialeurodes vaporariorum* Westwood (белокрылки тепличной);
 35 *Empoasca fabae* Harris (цикадки картофельной), *Laodelphax striatellus* Fallén (цикадки

малой коричневой), *Macrosteles quadrilineatus* Forbes (цикадки астровой), *Nephotettix cincticeps* Uhler (цикадки рисовой зеленой), *Nephotettix nigropictus* Stål (цикадки рисовой), *Nilaparvata lugens* Stål (цикадки коричневой), *Peregrinus maidis* Ashmead (цикадки кукурузной), *Sogatella furcifera* Horváth (цикадки белоспинной), *Tagosodes orizicolus* Muir (дельфацида рисового), *Typhlocyba pomaria* McAtee, цикадки белой яблоневого, *Erythroneura* spp. (виноградных цикадок); *Magacidada septendecim* Linnaeus (цикадки периодической); *Icerya purchasi* Maskell (червеца австралийского желобчатого), *Quadraspidiotus perniciosus* Comstock (щитовки калифорнийской); *Planococcus citri* Risso (мучнистого червеца виноградного); *Pseudococcus* spp. (комплекса других мучнистых червецов); *Cacopsylla pyricola* Foerster (медяницы грушевой), *Trioza diospyri* Ashmead (листоблошки хурмовой).

Соединения по настоящему изобретению также обладают активностью в отношении представителей отряда Hemiptera, в том числе *Acrosternum hilare* Say (клопа-щитника), *Anasa tristis* De Geer (клопа-ромбовика печального), *Blissus leucopterus leucopterus* Say (клопа-черепашки), *Cimex lectularius* Linnaeus (клопа постельного) *Corythucha gossypii* Fabricius (клопа хлопкового), *Cyrtopeltis modesta* Distant (клопа томатного), *Dysdercus suturellus* Herrich-Schäffer (красноклопа хлопкового), *Euschistus servus* Say (щитника коричневого), *Euschistus variolarius* Palisot de Beauvois (щитника однопятнистого), *Graptostethus* spp. (комплекса наземников), *Halyomorpha halys* Stål (клопа коричнево-мраморного), *Leptoglossus corculus* Say (клопа-краевика семян сосны), *Lygus lineolaris* Palisot de Beauvois (клопа полевого), *Nezara viridula* Linnaeus (щитника южного зеленого), *Oebalus pugnax* Fabricius (щитника рисового), *Oncopeltus fasciatus* Dallas (клопа-солдатика), *Pseudatomoscelis seriatus* Reuter (слепняка хлопкового). Другие отряды насекомых, контролируемые соединениями по настоящему изобретению, включают Thysanoptera (например, *Frankliniella occidentalis* Pergande (трипса цветочного западного), *Scirtothrips citri* Moulton (трипса цитрусового), *Scirtothrips variabilis* Beach (трипса соевого) и *Thrips tabaci* Lindeman (трипса лукового); и отряд Coleoptera (например, *Leptinotarsa decemlineata* Say (жука колорадского), *Epilachna varivestis* Mulsant (зерновку бобовую мексиканскую) и проволочников из родов *Agriotes*, *Athous* или *Limonius*).

Следует отметить применение соединений по настоящему изобретению для обеспечения контроля западного цветочного трипса (*Frankliniella occidentalis*). Следует отметить применение соединений по настоящему изобретению для обеспечения контроля цикадки картофельной (*Empoasca fabae*). Следует отметить применение соединений по настоящему изобретению для обеспечения контроля

хлопковой бахчевой тли (*Aphis gossypii*). Следует отметить применение соединений по настоящему изобретению для обеспечения контроля тли персиковой зеленой (*Myzus persicae*). Следует отметить применение соединений по настоящему изобретению для обеспечения контроля белокрылки бататовой (*Bemisia tabaci*).

5 Соединения по настоящему изобретению также могут быть пригодны для повышения интенсивности роста сельскохозяйственного растения. Данный способ предусматривает приведение в контакт сельскохозяйственной культуры (например, листьев, цветков, плодов или корней) или семян, из которых выращивают сельскохозяйственное растение, с соединением формулы 1 в количестве, достаточном
10 для достижения требуемого эффекта повышения интенсивности роста растений (т. е. в биологически эффективном количестве). Как правило, соединение формулы 1 применяют в виде составленной композиции. Хотя соединение формулы 1 зачастую применяют непосредственно в отношении сельскохозяйственного растения или его семени, его можно также применять в отношении места произрастания
15 сельскохозяйственного растения, т. е. в отношении окружающей сельскохозяйственное растение среды, в частности, в отношении участка окружающей среды, находящегося достаточно близко, чтобы обеспечить перемещение соединения формулы 1 к сельскохозяйственному растению. Место произрастания, относящееся к этому способу, чаще всего включает среду для выращивания (т. е. среду,
20 обеспечивающую питательные вещества растению), обычно почву, в которой выращивают растение. Обработка сельскохозяйственного растения для повышения интенсивности роста сельскохозяйственного растения, таким образом, предусматривает приведение в контакт сельскохозяйственного растения, семени, из которого выращивают сельскохозяйственное растение, или места произрастания
25 сельскохозяйственного растения с биологически эффективным количеством соединения формулы 1.

Повышенная интенсивность роста сельскохозяйственных культур может привести к одному или нескольким из следующих наблюдаемых эффектов: (a) оптимальная посадка сельскохозяйственных культур, о чем свидетельствуют
30 превосходное прораствание семян, всходы сельскохозяйственных культур и количество насаждений сельскохозяйственных культур; (b) усиленный рост сельскохозяйственных культур, о чем свидетельствуют быстрый и устойчивый рост листьев (например, измеряемый индексом площади листа), высота растения, количество побегов (например, для риса), масса корней и общий сухой вес
35 вегетативной массы сельскохозяйственных культур; (c) повышение урожайности

культур, о чем свидетельствуют время до цветения, продолжительность цветения, количество цветков, общее накопление биомассы (т. е. количество урожая) и/или пригодность для продажи продукции в виде фруктов или зерновых культур (т. е. качество урожая); (d) повышенная способность сельскохозяйственной культуры быть устойчивой к заражению растений болезнями и поражению вредителями, представляющими собой членистоногих, нематод или моллюсков, или предупреждать их; и (e) повышенная способность сельскохозяйственной культуры быть устойчивой к стрессам окружающей среды, таким как воздействие экстремальных температур, неоптимальная влажность или воздействие фитотоксичных химикатов.

10 Соединения по настоящему изобретению могут повышать интенсивность роста обработанных растений по сравнению с необработанными растениями путем уничтожения или предотвращения иным образом питания беспозвоночных вредителей-фитофагов в окружающей среде растений. При отсутствии такого контроля беспозвоночных вредителей-фитофагов вредители снижают интенсивность
15 роста растений, потребляя ткани или сок растений или передавая патогены растений, такие как вирусы. Даже в отсутствие беспозвоночных вредителей-фитофагов соединения по настоящему изобретению могут повышать интенсивность роста растений за счет изменения метаболизма растений. Как правило, интенсивность роста сельскохозяйственного растения будет наиболее значительно увеличиваться при
20 обработке растения соединением по настоящему изобретению, если растение выращивается в неидеальной среде, т. е. в среде, предусматривающей один или несколько аспектов, неблагоприятных в отношении достижения растением полного генетического потенциала, который оно проявляло бы в идеальной среде.

Следует отметить способ повышения интенсивности роста
25 сельскохозяйственного растения, где сельскохозяйственное растение выращивают в среде, содержащей беспозвоночных вредителей-фитофагов. Также следует отметить способ повышения интенсивности роста сельскохозяйственного растения, где сельскохозяйственное растение выращивают в среде, не содержащей беспозвоночных вредителей-фитофагов. Также следует отметить способ повышения интенсивности
30 роста сельскохозяйственного растения, где сельскохозяйственное растение выращивают в среде, содержащей количество влаги меньше оптимального количества для поддержки роста сельскохозяйственного растения. Следует отметить способ повышения интенсивности роста сельскохозяйственного растения, где растение представляет собой рис. Также следует отметить способ повышения интенсивности
35 роста сельскохозяйственного растения, где растение представляет собой маис

(кукурузу). Также следует отметить способ повышения интенсивности роста сельскохозяйственного растения, где растение представляет собой сою.

Соединения по настоящему изобретению также можно смешивать с одним или несколькими другими биологически активными соединениями или средствами, в том числе инсектицидами, фунгицидами, нематоцидами, бактерицидами, акарицидами, гербицидами, антидотами гербицидов, регуляторами роста, такими как ингибиторы линьки насекомых и стимуляторы корнеобразования, хемотренизаторы, химическими сигнальными веществами, репеллентами, аттрактантами, феромонами, стимуляторами питания, другими биологически активными соединениями или энтомопатогенными бактериями, вирусами или грибами с образованием многокомпонентного пестицида, обеспечивающего еще более широкий спектр агрономической и неагрономической применимости. Таким образом, настоящее изобретение также относится к композиции, содержащей биологически эффективное количество соединения формулы 1, по меньшей мере один дополнительный компонент, выбранный из группы, состоящей из поверхностно-активных веществ, твердых разбавителей и жидких разбавителей, и по меньшей мере одно дополнительное биологически активное соединение или средство. Для смесей по настоящему изобретению другие биологически активные соединения или средства можно составлять вместе с соединениями по настоящему изобретению, в том числе соединениями формулы 1, с образованием предварительной смеси, или другие биологически активные соединения или средства можно составлять отдельно от соединений по настоящему изобретению, в том числе соединений формулы 1, и при этом два состава объединяют вместе перед применением (например, в баке для опрыскивания) или, в качестве альтернативы, применяют последовательно.

Примерами таких биологически активных соединений или средств, с которыми можно составлять соединения по настоящему изобретению, являются инсектициды, такие как абаментин, ацефат, ацеквиноцил, ацетамиприд, акринатрин, афидопиропен ($[(3S,4R,4aR,6S,6aS,12R,12aS,12bS)-3-[(\text{циклопропилкарбонил})\text{окси}]-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b\text{-декагидро-6,12-дигидрокси-4,6a,12b-триметил-11-оксо-9-(3-пиридинил)-2H,11H-нафто[2,1-b]пирано[3,4-e]пиран-4-ил]метилциклопропанкарбоксилат}$), амидофлумет, амитраз, авермектин, азадирахтин, азинфос-метил, бенфуракарб, бенсултап, бифентрин, бифеназат, бистрифлурон, борат, бупрофезин, кадусафос, карбарил, карбофуран, картап, карзол, хлорантранилипрол, хлорфенапир, хлорфлуазурон, хлорпирифос, хлорпирифос-метил, кромафенозид, клофентезин, клотианидин, циантранилипрол (3-бром-1-(3-хлор-2-пиридинил)-*N*-[4-

циано-2-метил-6-[(метиламино)карбонил]фенил]-1*H*-пиразол-5-карбоксамид),
цикланилипрол (3-бром-*N*-[2-бром-4-хлор-6-[[1-циклопропилэтил)амино]карбонил]фенил]-1-(3-хлор-2-пиридинил)-1*H*-пиразол-5-карбоксамид), циклопротрин, циклоксаприд ((5*S*,8*R*)-1-[(6-хлор-3-пиридинил)метил]-2,3,5,6,7,8-гексагидро-9-нитро-5,8-эпокси-1*H*-имидазо[1,2-*a*]азепин) цифлуметофен,
5 цикфлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, гамма-цигалотрин, лямбда-цигалотрин, циперметрин, альфа-циперметрин, дзета-циперметрин, цирوماзин, дельтаметрин, диафентиурон, диазинон, диелдрин, дифлубензурон, димефлутрин, димегипо, диметоат, динотефуран, диофенолан, эмаектин, эндосульфат, эсфенвалерат, этипрол,
10 этофенпрокс, этоксазол, фенбутатина оксид, фенитротрион, фенотиокарб, феноксикарб, фенпропатрин, фенвалерат, фипронил, флометоквин (2-этил-3,7-диметил-6-[4-(трифторметокси)фенокси]-4-хинолинилметилкарбонат), флоникамид, флубендиамид, флуцитринат, флуфенерим, флуфеноксурон, флуфеноксистробин (метил-(*αE*)-2-[[2-хлор-4-(трифторметил)фенокси]метил]-*α*-(метоксиметилен)бензолацетат),
15 флуфенсульфон (5-хлор-2-[(3,4,4-трифтор-3-бутен-1-ил)сульфонил]тиазол), флугексафон, флуопирам, флупипрол (1-[2,6-дихлор-4-(трифторметил)фенил]-5-[(2-метил-2-пропен-1-ил)амино]-4-[(трифторметил)сульфинил]-1*H*-пиразол-3-карбонитрил), флупирадифурон (4-[[6-хлор-3-пиридинил)метил](2,2-дифторэтил)амино]-2(5*H*)-фуранон), флювалинат, тау-флювалинат, фонофос,
20 форметанат, фостиазат, галофенозид, гептафлутрин ([2,3,5,6-тетрафтор-4-(метоксиметил)фенил]метил-2,2-диметил-3-[(1*Z*)-3,3,3-трифтор-1-пропен-1-ил]циклопропанкарбоксилат), гексафлумурон, гекситиазокс, гидраметилнон, имидаклоприд, индоксакарб, инсектицидные мыла, изофенфос, люфенурон, малатион, меперфлутрин ([2,3,5,6-тетрафтор-4-(метоксиметил)фенил]метил-(1*R*,3*S*)-3-(2,2-дихлорэтилен)-2,2-диметилциклопропанкарбоксилат), метафлумизон, метальдегид,
25 метамидофос, метидатион, метиодикарб, метомил, метопрен, метоксихлор, метофлутрин, метоксифенозид, метофлутрин, монокротофос, монофтортрин ([2,3,5,6-тетрафтор-4-(метоксиметил)фенил]метил-3-(2-циано-1-пропен-1-ил)-2,2-диметилциклопропанкарбоксилат), никотин, нитенпирам, нитиазин, новалурон,
30 новифлумурон, оксамил, паратион, паратион-метил, перметрин, фонат, фозалон, фосмет, фосфамидон, пиримикарб, профенофос, профлутрин, пропаргит, протрифенбут, пифлубумид (1,3,5-триметил-*N*-(2-метил-1-оксопропил)-*N*-[3-(2-метилпропил)-4-[2,2,2-трифтор-1-метокси-1-(трифторметил)этил]фенил]-1*H*-пиразол-4-карбоксамид), пиметрозин, пирафлупрол, пиретрин, пиридабен, пиридалил,
35 пирифлуквиназон, пириминостробин (метил-(*αE*)-2-[[[2-[(2,4-дихлорфенил)амино]-6-

(трифторметил)-4-пиримидинил]окси]метил]- α -(метоксиметилен)бензолацетат),
 пирипрол, пирипроксифен, ротенон, рианодин, силафлуофен, спинеторам, спиносид,
 спиродиклофен, спиромезифен, спиротетрамат, сульпрофос, сульфоксафлор (*N*-
 [метилоксидо[1-[6-(трифторметил)-3-пиридинил]этил]- λ^4 -сульфанилиден]цианамид),
 5 тебуфенозид, тебуфенпирад, тефлубензурон, тефлутрин, тербуфос, тетрафторвинфос,
 тетраметрин, тетраметилфлутрин ([2,3,5,6-тетрафтор-4-(метоксиметил)фенил]метил-
 2,2,3,3-тетраметилциклопропанкарбоксилат), тетранилипрол, тиаклоприд,
 тиаметоксам, тиодикарб, тиосултап-натрий, тиоксазафен (3-фенил-5-(2-тиенил)-1,2,4-
 оксадиазол), толфенпирад, тралометрин, триазамат, трихлорфон, трифлумезопирим
 10 (внутренняя соль 2,4-диоксо-1-(5-пиримидинилметил)-3-[3-(трифторметил)фенил]-2*H*-
 пиридо[1,2-*a*]пиримидиния), трифлумурон, дельта-эндотоксины *Bacillus thuringiensis*,
 энтомопатогенные бактерии, энтомопатогенные вирусы и энтомопатогенные грибы.

Следует отметить такие инсектициды, как абамектин, ацетамиприд, акринатрин,
 афидопиропен, амитраз, авермектин, азадирахтин, бенфуракарб, бенсултап,
 15 бифентрин, бупрофезин, кадусафос, карбарил, картап, хлорантранилипрол,
 хлорфенапир, хлорпирифос, клотианидин, циантранилипрол, цикланилипрол,
 циклопротрин, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, гамма-цигалотрин, лямбда-
 цигалотрин, циперметрин, альфа-циперметрин, дзета-циперметрин, циромазин,
 дельтаметрин, диелдрин, динотефуран, диофенолан, эмаектин, эндосульфат,
 20 эсфенвалерат, этипрол, этофенпрокс, этоксазол, фенитроцион, фенотиокарб,
 феноксикарб, фенвалерат, фипронил, флометоквин, флоникамид, флубендиамид,
 флуфеноксурон, флуфеноксистробин, флуфенсульфон, флупипрол, флупирадифурон,
 флювалинат, форметанат, фостиазат, гептафлутрин, гексафлумурон, гидраметилнон,
 имидаклоприд, индоксакарб, люфенурон, меперфлутрин, метафлумизон, метиодикарб,
 25 метомил, метопрен, метоксифенозид, метофлутрин, монофторотрин, нитенпирам,
 нитиазин, новалурон, оксамил, пифлубумид, пиметрозин, пиретрин, пиридабен,
 пиридалил, пириминостробин, пирипроксифен, рианодин, спинеторам, спиносид,
 спиродиклофен, спиромезифен, спиротетрамат, сульфоксафлор, тебуфенозид,
 тетраметрин, тетраметилфлутрин, тиаклоприд, тиаметоксам, тиодикарб, тиосултап-
 30 натрий, тралометрин, триазамат, трифлумезопирим, трифлумурон, дельта-
 эндотоксины *Bacillus thuringiensis*, все штаммы *Bacillus thuringiensis* и все штаммы
 вирусов ядерного полиэдроа.

Один вариант осуществления биологических средств для смешивания с
 соединениями по настоящему изобретению включает энтомопатогенные бактерии,
 35 такие как *Bacillus thuringiensis*, и инкапсулированные дельта-эндотоксины *Bacillus*

thuringiensis, такие как биоинсектициды MVP® и MVPII®, полученные с помощью процесса CellCap® (CellCap®, MVP® и MVPII® являются товарными знаками Mucogen Corporation, Индианаполис, Индиана, США); энтомопатогенные грибы, такие как гриб зеленый мускардин; и энтомопатогенные (как встречающиеся в природе, так и генетически модифицированные) вирусы, в том числе бакуловирус, вирус ядерного полиэдроза (NPV), такой как вирус ядерного полиэдроза *Helicoverpa zea* (HzNPV), вирус ядерного полиэдроза *Anagrapha falcifera* (AfNPV); и вирус гранулеза (GV), такой как вирус гранулеза *Cydia pomonella* (CpGV).

Один вариант осуществления биологических средств для смешивания с соединениями по настоящему изобретению включает одно из или комбинацию (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*, *Photorhabdus*, *Phyllobacterium*, *Pseudomonas*, *Rhizobium*, *Serratia*, *Sphingobacterium*, *Stenotrophomonas*, *Streptomyces*, *Variovorax*, или *Xenorhabdus*, например, бактерий *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) грибов, таких как гриб зеленый мускардин; (iii) вирусов, в том числе бакуловируса, вируса ядерного полиэдроза, такого как вирус ядерного полиэдроза *Helicoverpa zea*, вирус ядерного полиэдроза *Anagrapha falcifera*; вируса гранулеза, такого как вирус гранулеза *Cydia pomonella*.

Особо следует отметить такую комбинацию, в которой другой активный ингредиент для контроля беспозвоночных вредителей относится к другому химическому классу или характеризуется другим местом приложения действия, чем у соединения формулы 1. В некоторых случаях комбинация с по меньшей мере одним другим активным ингредиентом для контроля беспозвоночных вредителей, характеризующимся аналогичным спектром контроля, но отличным местом приложения действия, в частности, будет преимущественной для регулирования устойчивости. Таким образом, композиция по настоящему изобретению может дополнительно содержать биологически эффективное количество по меньшей мере одного дополнительного активного ингредиента для контроля беспозвоночных вредителей, характеризующегося аналогичным спектром контроля, но

принадлежащего к другому химическому классу или характеризующегося другим местом приложения действия. Эти дополнительные биологически активные соединения или средства включают без ограничения ингибиторы ацетилхолинэстеразы (AChE), такие как карбаматы, представляющие собой метомил, оксамил, тиодикарб, триазамат, и органофосфаты, представляющие собой хлорпирифос; антагонисты GABA-регулируемых хлоридных каналов, такие как циклодиены, представляющие собой диелдрин и эндосульфат, и фенилпиразолы, представляющие собой этипрол и фипронил; модуляторы натриевых каналов, такие как пиретроиды, представляющие собой бифентрин, цифлутрин, *бета*-цифлутрин, цигалотрин, *лямбда*-цигалотрин, циперметрин, дельтаметрин, димефлутрин, эсфенвалерат, метофлутрин и профлутрин; агонисты никотинового ацетилхолинового рецептора (nAChR), такие как неоникотиноиды, представляющие собой ацетамиприд, клотианидин, динотефуран, имидаклоприд, нитенпирам, нитиазин, тиаклоприд и тиаметоксам, сульфоксимин, представляющий собой сульфоксафлор, бутенолид, представляющий собой флупирадифурон, и мезоионное соединение, представляющее собой трифлумезопирим; аллостерические активаторы никотинового ацетилхолинового рецептора (nAChR), такие как спиносин, представляющие собой спинеторам и спиносид; активаторы хлоридных каналов, такие как авермектины, представляющие собой абамектин и эмаектин; имитаторы ювенильного гормона, такие как диофенолан, метопрен, феноксикарб и пирипроксифен; модуляторы хордотонального органа, такие как пиметрозин, пирифлуквиназон и флоникамид; ингибиторы роста клещей, такие как этоксазол; ингибиторы митохондриальной АТФ-синтазы, такие как пропаргит; разобщители окислительного фосфорилирования, действующие путем прерывания протонного градиента, такие как хлорфенапир; блокаторы каналов никотинового ацетилхолинового рецептора (nAChR), такие как аналоги нерестиоксина, представляющие собой картап; ингибиторы биосинтеза хитина, такие как бензоилмочевины, представляющие собой флуфеноксурон, гексафлумурон, луфенурон, новалурон, новифлумурон, и трифлумурон, и бупрофезин; средства, нарушающие линьку двукрылых, такие как циромазин; агонисты рецептора экдизона, такие как диацилгидразины, представляющие собой метоксифенозид и тебуфенозид; агонисты рецептора октопамина, такие как амитраз; ингибиторы транспорта электронов митохондриального комплекса III, такие как гидраметилнон и бифеназат; ингибиторы транспорта электронов митохондриального комплекса I, такие как пиридабен; блокаторы потенциал-зависимых натриевых каналов, такие как индоксикарб; ингибиторы ацетил-CoA-карбоксилазы, такие как производные

тетроновой и тетрамовой кислоты, представляющие собой спироциклофен, спиромезифен и спиротетрамат; ингибиторы транспорта электронов митохондриального комплекса II, такие как β -кетонитрилы, представляющие собой циенопирафен и цифлуметофен; модуляторы рецептора рианодина, такие как антраниловые диамиды, представляющие собой хлорантранилипрол и циантранилипрол, диамиды, такие как флубендиамид, и лиганды рецептора рианодина, такие как рианодин; соединения, в которых целевой сайт, ответственный за биологическую активность, является неизвестным или не охарактеризован, такие как азадирахтин и пиридалил; микробные разрушители мембран средней кишки насекомых, такие как *Bacillus thuringiensis* и продуцируемые ими дельта-эндотоксины и *Bacillus sphaericus*; и биологические средства, в том числе вирусы ядерного полиэдроза (NPV) и другие природные или генетически модифицированные инсектицидные вирусы.

Дополнительными примерами биологически активных соединений или средств, с которыми можно составлять соединения по настоящему изобретению, являются фунгициды, такие как ацибензолар-S-метил, альдиморф, аметоктрадин, аминокпирифен, амисулбром, анилазин, азаконазол, азоксистробин, беналаксил (в том числе беналаксил-М), беноданил, беномил, бентиаваликарб (в том числе бентиаваликарб-изопропил), бензовиндифлупир, бетоксазин, бинапакрил, бифенил, битертанол, биксафен, бластицидин-S, боскалид, бромуконазол, бупиримат, бутиобат, карбоксин, карпропамид, каптафол, каптан, карбендазим, хлоронеб, хлороталонил, хлзолинат, гидроксид меди, оксихлорид меди, сульфат меди, кумоксистробин, циазофамид, цифлуфенамид, цимоксанил, ципроконазол, ципродинил, дихлобентиазокс, дихлофлуанид, диклоцимет, дикломезин, диклоран, диэтофенкарб, дифеноконазол, дифлуметорим, диметиримол, диметоморф, димоксистробин, диниконазол (в том числе диниконазол-М), динокап, дипиметитрон, дитианон, дитиоланы, додеморф, додин, эконазол, этаконазол, эдифенфос, эноксастробин (также известный как энестробурин), эпоксиконазол, этабоксам, этиримол, этридиазол, фамоксадон, фенамидон, фенаминстробин, фенаримол, фенбуконазол, фенфурам, фенгексамид, феноксанил, фенпиклонил, фенпикоксамид, фенпропидин, фенпропиморф, фенпиразамин, ацетат фентина, гидроксид фентина, 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, иминоктадина албесилат, иминоктадина триацетат, инпирфлуксам, иодикарб, ипконазол, ипфентрифлюконазол, ипфлуфеноквин, изофетамид, ипробенфос, ипродион, 5 ипроваликарб, изофлуципрам, изопротиолан, изопиразам, изотианил, касугамицин, крезоксим-метил, ланкотрион, манкозоб, мандипропамид, мандестробин, манеб, мапанипирин, мефентрифлюконазол, мепронил, мептилдинокап, металаксил (в том числе металаксил-М/мефеноксам), метконазол, метасульфокарб, метирам, метоминостробин, метилтетрапрол, метрафенон, миклобутанил, нафтитин, неоазозин 10 (метан-арсонат трехвалентного железа), нуаримол, октилинон, офурас, оризастробин, оксадиксил, оксатиапипролин, оксолиновая кислота, окспоконазол, оксикарбоксин, окситетрациклин, пенконазол, пенцикурон, пенфлуфен, пентиопирад, перфуразоат, фосфористая кислота (в том числе ее соли, например, фосетил-алюминий), пикоксистробин, пипералин, полиоксин, пробеназол, прохлораз, процимидон, 15 пропамокарб, пропиконазол, пропинеб, проквиназид, протиокарб, протиоконазол, пидифлуметофен (Aderidyn®), пираклостробин, пираметостробин, пирапропоин, пираоксистробин, пиразифлумид, пиразофос, пирибенкарб, пирибутакарб, пиридахлометил, пирифенокс, пириофенон, перизоксазол, пириметанил, пирифенокс, пирролнитрин, пироквилон, квинконазол, квинметионат, квинофумелин, квиноксифен, 20 квинтозен, силтиофам, седаксан, симеконазол, спироксамин, стрептомицин, сера, тебуконазол, тебуфлоквин, теклофталам, теклофталам, текназен, тербинафин, тетраконазол, тиабендазол, тифлузамид, тиофанат, тиофанат-метил, тирам, тиадинил, толклофос-метил, толпрокарб, толифлуанид, триадимефон, триадименол, триаримол, триазоксид, трехосновный сульфат меди, триклопирикарб, тридеморф, 25 трифлуксистробин, трифлумизол, тримопрамид, трициклазол, трифлуксистробин, трифорин, тритиконазол, униконазол, валидамицин, валифеналат (также известный как валифенал), винклозолин, цинеб, цирам, зоксамид и 1-[4-[4-[5-(2,6-дифторфенил)-4,5-дигидро-3-изоксазолил]-2-тиазолил]-1-пиперидинил]-2-[5-метил-3-(трифторметил)-1*H*-пиразол-1-ил]этанойат; нематоциды, такие как флуопирам, 30 спиротетрамат, тиодикарб, фостиазат, абамектин, ипродион, флуенсульфон, диметилдисульфид, тиоксазафен, 1,3-дихлорпропен (1,3-D), метам (натрия и калия), дазомет, хлорпикрин, фенамифос, этопрофос, кадусафос, тербуфос, имициафос, оксамил, карбофуран, тиоксазафен, *Bacillus firmus* и *Pasteuria nishizawae*; бактерициды, такие как стрептомицин; акарициды, такие как амитраз, хинометионат, 35 хлорбензилат, цигексатин, дикофол, диенохлор, этоксазол, феназакин, оксид

фенбутатина, фенпропатрин, фенпироксимат, гекситиазокс, пропаргит, пиридабен и тебуфенпирад.

В некоторых случаях комбинации соединения по настоящему изобретению с другими биологически активными (в частности, в отношении контроля беспозвоночных вредителей) соединениями или средствами (т. е. активными ингредиентами) может приводить к усиленному эффекту. Снижение количества активных ингредиентов, высвобождаемых в окружающую среду с обеспечением эффективного контроля вредителей, всегда является необходимым. Если усиленный эффект, представляющий собой контроль беспозвоночных вредителей, возникает при нормах применения, обеспечивающих удовлетворительные с агрономической точки зрения уровни контроля беспозвоночных вредителей, то такие комбинации могут быть преимущественными для снижения цены производства сельскохозяйственных культур и уменьшения нагрузки на окружающую среду.

Соединения по настоящему изобретению и композиции на их основе могут применяться в отношении растений, генетически трансформированных для экспрессии белков, токсичных для беспозвоночных вредителей (таких как дельта-эндотоксины *Bacillus thuringiensis*). Такое применение может обеспечить более широкий спектр защиты растений и может быть предпочтительным для контроля устойчивости. Усиленный эффект может обеспечиваться при экзогенном применении соединений, обеспечивающих контроль беспозвоночных вредителей, по настоящему изобретению в комбинации с экспрессируемыми белковыми токсинами.

Общие источники, касающиеся данных защитных средств, применяемых в области сельского хозяйства (т. е. инсектицидов, фунгицидов, нематоцидов, акарицидов, гербицидов и биологических средств), включают *The Pesticide Manual, 13th Edition*, C. D. S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2003 и *The BioPesticide Manual, 2nd Edition*, L. G. Copping, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2001.

Соединения по настоящему изобретению могут быть объединены или составлены с полинуклеотидами, в том числе без ограничения ДНК, РНК и/или химически модифицированными нуклеотидами, влияющими на количество конкретной мишени посредством регуляции по типу отрицательной связи, интерференции, подавления или сайленсинга генетически получаемого транскрипта, что оказывает гербицидный эффект.

Для вариантов осуществления, в которых применяют один или несколько из таких различных компонентов для смешивания, весовое соотношение таких

различных компонентов для смешивания (в общем) и соединения формулы 1 составляет, как правило, от приблизительно 1:3000 до приблизительно 3000:1. Стоит отметить весовые соотношения от приблизительно 1:300 до приблизительно 300:1 (например, соотношения от приблизительно 1:30 до приблизительно 30:1).

5 Специалист в данной области может легко определить путем простого экспериментирования биологически эффективные количества активных ингредиентов, необходимых для требуемого спектра биологической активности. Будет очевидно, что включение таких дополнительных компонентов может расширять спектр контролируемых беспозвоночных вредителей сверх спектра, подлежащего контролю с
10 помощью соединения формулы 1 отдельно.

В таблице А перечислены конкретные комбинации соединения формулы 1 с другими средствами для контроля беспозвоночных вредителей, которые иллюстрируют смеси, композиции и способы по настоящему изобретению. В первом столбце таблицы А перечислены конкретные средства для контроля беспозвоночных
15 вредителей (например, "абамектин" в первой строке). Во втором столбце таблицы А перечислены механизм действия (если известен) или химический класс средств для контроля беспозвоночных вредителей. В третьей колонке таблицы А перечислен(перечислены) вариант(варианты) осуществления(осуществления)
диапазонов весовых соотношений для норм внесения, при которых средство для
20 контроля беспозвоночных вредителей может быть применено, относительно соединения формулы 1 (например, "от 50:1 до 1:50" абамектина относительно соединения формулы 1 по весу). Таким образом, например, в первой строке таблицы А конкретно раскрыта комбинация соединения формулы 1, с абамектином, которая может применяться при весовом соотношении от 50:1 до 1:50. Остальные строки
25 таблицы А следует истолковывать подобным образом. Кроме того, следует отметить, что в таблице А перечислены конкретные комбинации соединения формулы 1 с другими средствами для контроля беспозвоночных вредителей, которые иллюстрируют смеси, композиции и способы по настоящему изобретению, и включены дополнительные варианты осуществления диапазонов весовых
30 соотношений для норм внесения.

Таблица А

Средство для контроля беспозвоночных вредителей	Механизм действия или химический класс	Типичное весовое соотношение
Абамектин	Активатор хлоридных каналов	От 50:1 до 1:50
Ацетамиприд	Агонист никотиновых ацетилхолиновых рецепторов (nAChR)	От 150:1 до 1:200
Амитраз	Агонисты октопаминовых рецепторов	От 200:1 до 1:100
Авермектин	Макроциклические лактоны	От 50:1 до 1:50
Азадирахтин	Неизвестный сайт действия	От 100:1 до 1:120
Бета-цифлутрин	Модуляторы натриевых каналов	От 150:1 до 1:200
Бифентрин	Модуляторы натриевых каналов	От 100:1 до 1:10
Бупрофезин	Ингибиторы биосинтеза хитина	От 500:1 до 1:50
Картап	Блокатор каналов никотиновых ацетилхолиновых рецепторов (nAChR)	От 100:1 до 1:200
Хлорантранилипрол	Модулятор рианодиновых рецепторов	От 100:1 до 1:120
Хлорфенапир	Разобшители окислительного фосфорилирования	От 300:1 до 1:200
Хлорпирифос	Ингибитор ацетилхолинэстеразы	От 500:1 до 1:200
Клотианидин	Агонист никотиновых ацетилхолиновых рецепторов (nAChR)	От 100:1 до 1:400
Циантранилипрол	Модулятор рианодиновых рецепторов	От 100:1 до 1:120
Цифлутрин	Модулятор натриевых каналов	От 150:1 до 1:200
Цигалотрин	Модулятор натриевых каналов	От 150:1 до 1:200
Циперметрин	Модулятор натриевых каналов	От 150:1 до 1:200
Циромазин	Средство, нарушающее линьку двукрылых	От 400:1 до 1:50
Дельтаметрин	Модуляторы натриевых каналов	От 50:1 до 1:400
Диелдрин	Антагонист GABA-регулируемых хлоридных каналов	От 200:1 до 1:100
Динотефуран	Агонист никотиновых ацетилхолиновых рецепторов (nAChR)	От 150:1 до 1:200
Диофенолан	Имитатор ювенильного гормона	От 150:1 до 1:200

Средство для контроля беспозвоночных вредителей	Механизм действия или химический класс	Типичное весовое соотношение
Эмамектин	Активатор хлоридных каналов	От 50:1 до 1:10
Эндосульфан	Антагонист GABA-регулируемых хлоридных каналов	От 200:1 до 1:100
Эсфенвалерат	Модулятор натриевых каналов	От 100:1 до 1:400
Этипрол	Антагонист GABA-регулируемых хлоридных каналов	От 200:1 до 1:100
Фенотиокарб		От 150:1 до 1:200
Феноксикарб	Имитатор ювенильного гормона	От 500:1 до 1:100
Фенвалерат	Модулятор натриевых каналов	От 150:1 до 1:200
Фипронил	Антагонист GABA-регулируемых хлоридных каналов	От 150:1 до 1:100
Флоникамид	Селективные блокаторы питания равнокрылых	От 200:1 до 1:100
Флубендиамид	Модулятор рианодиновых рецепторов	От 100:1 до 1:120
Флуфеноксурон	Ингибитор биосинтеза хитина	От 200:1 до 1:100
Гексафлумурон	Ингибитор биосинтеза хитина	От 300:1 до 1:50
Гидраметилнон	Ингибиторы транспорта электронов митохондриального комплекса III	От 150:1 до 1:250
Имидаклоприд	Агонист никотиновых ацетилхолиновых рецепторов (nAChR)	От 1000:1 до 1:1000
Индоксакарб	Блокатор потенциал-зависимых натриевых каналов	От 200:1 до 1:50
Лямбда-цигалотрин	Модулятор натриевых каналов	От 50:1 до 1:250
Люфенурон	Ингибитор биосинтеза хитина	От 500:1 до 1:250
Метафлумизон	Блокатор потенциал-зависимых натриевых каналов	От 200:1 до 1:200
Метомил	Ингибитор ацетилхолинэстеразы	От 500:1 до 1:100
Метопрен	Имитатор ювенильного гормона	От 500:1 до 1:100
Метоксифенозид	Агонист экдизоновых рецепторов	От 50:1 до 1:50
Нитенпирам	Агонист никотиновых	От 150:1 до 1:200

Средство для контроля беспозвоночных вредителей	Механизм действия или химический класс	Типичное весовое соотношение
	ацетилхолиновых рецепторов (nAChR)	
Нитиазин	Агонист никотиновых ацетилхолиновых рецепторов (nAChR)	От 150:1 до 1:200
Новалурон	Ингибитор биосинтеза хитина	От 500:1 до 1:150
Оксамил	Ингибиторы ацетилхолинэстеразы	От 200:1 до 1:200
Пиметрозин	Селективные блокаторы питания равнокрылых	От 200:1 до 1:100
Пиретрин	Модулятор натриевых каналов	От 100:1 до 1:10
Пиридабен	Ингибитор транспорта электронов митохондриального комплекса I	От 200:1 до 1:100
Пиридалил	Неизвестный сайт действия	От 200:1 до 1:100
Пирипроксифен	Имитатор ювенильного гормона	От 500:1 до 1:100
Рианодин	Лиганд рианодиновых рецепторов	От 100:1 до 1:120
Спинеторам	Аллостерический активатор никотиновых ацетилхолиновых рецепторов (nAChR)	От 150:1 до 1:100
Спиносад	Аллостерические активаторы никотиновых ацетилхолиновых рецепторов (nAChR)	От 500:1 до 1:10
Спиродиклофен	Ингибитор ацетил-СоА-карбоксилазы	От 200:1 до 1:200
Спиромезифен	Ингибитор ацетил-СоА-карбоксилазы	От 200:1 до 1:200
Тебуфенозид	Агонист экдизоновых рецепторов	От 500:1 до 1:250
Тиаклоприд	Агонист никотиновых ацетилхолиновых рецепторов (nAChR)	От 100:1 до 1:200
Тиаметоксам	Агонист никотиновых ацетилхолиновых рецепторов (nAChR)	От 1250:1 до 1:1000
Тиодикарб	Ингибиторы ацетилхолинэстеразы	От 500:1 до 1:400
Тиосултап-натрий	Блокатор каналов никотиновых ацетилхолиновых рецепторов (nAChR)	От 150:1 до 1:100
Тралометрин	Модулятор натриевых каналов	От 150:1 до 1:200

Средство для контроля беспозвоночных вредителей	Механизм действия или химический класс	Типичное весовое соотношение
Триазамат	Ингибиторы ацетилхолинэстеразы	От 250:1 до 1:100
Трифлумезопирим		
Трифлумурон	Ингибитор синтеза хитина	От 200:1 до 1:100
<i>Bacillus thuringiensis</i>	Биологические средства	От 50:1 до 1:10
Дельта-эндотоксин <i>Bacillus thuringiensis</i>	Биологические средства	От 50:1 до 1:10
NPV (например, Gemstar)	Биологические средства	От 50:1 до 1:10

Следует отметить композицию по настоящему изобретению, где по меньшей мере одно дополнительное биологически активное соединение или средство выбрано из средств для контроля беспозвоночных вредителей, перечисленных в таблице А выше.

- 5 Весовые соотношения соединения, в том числе соединения формулы 1, его *N*-оксида или соли, и дополнительного средства для контроля беспозвоночных вредителей, как правило, составляют от 1000:1 до 1:1000, где один вариант осуществления соответствует от 500:1 до 1:500, другой вариант осуществления – от 250:1 до 1:200, и другой вариант осуществления – от 100:1 до 1:50.
- 10 Ниже в таблицах В1 – В6 перечислены варианты осуществления конкретных композиций, содержащих соединение формулы 1 (номер соединения (№ соед.) относится к соединениям в таблице индексов А) и дополнительное средство для контроля беспозвоночных вредителей.

Таблица В1

№ смеси	№ и соед.	Средство для контроля беспозвоночных вредителей	№ смеси	№ и соед.	Средство для контроля беспозвоночных вредителей
В1-1	8 и	Абамектин	В1-38	8 и	Индоксакарб
В1-2	8 и	Ацетамиприд	В1-39	8 и	Лямбда-цигалотрин
В1-3	8 и	Амитраз	В1-40	8 и	Люфенурон
В1-4	8 и	Авермектин	В1-41	8 и	Метафлумизон
В1-5	8 и	Азадирахтин	В1-42	8 и	Метомил

№ смеси	№ и соед.	Средство для контроля беспозвоночных вредителей	№ смеси	№ и соед.	Средство для контроля беспозвоночных вредителей
V1-6	8 и	Бенсултап	V1-43	8 и	Метопрен
V1-7	8 и	Бета-цифлутрин	V1-44	8 и	Метоксифенозид
V1-8	8 и	Бифентрин	V1-45	8 и	Нитенпирам
V1-9	8 и	Бупрофезин	V1-46	8 и	Нитиазин
V1-10	8 и	Картап	V1-47	8 и	Новалурон
V1-11	8 и	Хлорантранилипрол	V1-48	8 и	Оксамил
V1-12	8 и	Хлорфенапир	V1-49	8 и	Фосмет
V1-13	8 и	Хлорпирифос	V1-50	8 и	Пиметрозин
V1-14	8 и	Клотианидин	V1-51	8 и	Пиретрин
V1-15	8 и	Циантранилипрол	V1-52	8 и	Пиридабен
V1-16	8 и	Цифлутрин	V1-53	8 и	Пиридалил
V1-17	8 и	Цигалотрин	V1-54	8 и	Пирипроксифен
V1-18	8 и	Циперметрин	V1-55	8 и	Рианодин
V1-19	8 и	Циромазин	V1-56	8 и	Спинеторам
V1-20	8 и	Дельтаметрин	V1-57	8 и	Спиносад
V1-21	8 и	Диелдрин	V1-58	8 и	Спиродиклофен
V1-22	8 и	Динотефуран	V1-59	8 и	Спиромезифен
V1-23	8 и	Диофенолан	V1-60	8 и	Спиротетрамат
V1-24	8 и	Эмаектин	V1-61	8 и	Сульфоксафлор
V1-25	8 и	Эндосульфан	V1-62	8 и	Тебуфенозид
V1-26	8 и	Эсфенвалерат	V1-63	8 и	Тефлутрин
V1-27	8 и	Этипрол	V1-64	8 и	Тиаклоприд
V1-28	8 и	Фенотиокарб	V1-65	8 и	Тиаметоксам
V1-29	8 и	Феноксикарб	V1-66	8 и	Тиодикарб
V1-30	8 и	Фенвалерат	V1-67	8 и	Тиосултап-натрий
V1-31	8 и	Фипронил	V1-68	8 и	Толфенпирад
V1-32	8 и	Флоникамид	V1-69	8 и	Тралометрин
V1-33	8 и	Флубендиамид	V1-70	8 и	Триазамат
V1-34	8 и	Флуфеноксурон	V1-71	8 и	Трифлумезопирим
V1-35	8 и	Гексафлумурон	V1-72	8 и	Трифлумурон
V1-36	8 и	Гидраметилнон	V1-73	8 и	<i>Bacillus thuringiensis</i>
V1-37	8 и	Имидаклоприд	V1-74	8 и	Дельта-эндотоксин <i>Bacillus thuringiensis</i>

№ смеси	№ и соед. Средство для контроля беспозвоночных вредителей	№ смеси	№ и соед. Средство для контроля беспозвоночных вредителей
		B1-75	8 и NPV (например, Gemstar)

Таблица В2

Таблица В2 является идентичной таблице В1 за исключением того, что каждая ссылка на соединение 8 в столбце, озаглавленном "№ соед." заменена ссылкой на соединение 14. Например, первая смесь в таблице В2 обозначена как В2-1 и представляет собой смесь соединения 14 и дополнительного средства для контроля беспозвоночных вредителей, представляющего собой аба멕тин.

Таблица В3

Таблица В3 является идентичной таблице В1 за исключением того, что каждая ссылка на соединение 8 в столбце, озаглавленном "№ соед." заменена ссылкой на соединение 19. Например, первая смесь в таблице В3 обозначена как В3-1 и представляет собой смесь соединения 19 и дополнительного средства для контроля беспозвоночных вредителей, представляющего собой аба멕тин.

Таблица В4

Таблица В4 является идентичной таблице В1 за исключением того, что каждая ссылка на соединение 8 в столбце, озаглавленном "№ соед." заменена ссылкой на соединение 78. Например, первая смесь в таблице В4 обозначена как В4-1 и представляет собой смесь соединения 78 и дополнительного средства для контроля беспозвоночных вредителей, представляющего собой аба멕тин.

Таблица В5

Таблица В5 является идентичной таблице В1 за исключением того, что каждая ссылка на соединение 8 в столбце, озаглавленном "№ соед." заменена ссылкой на соединение 3. Например, первая смесь в таблице В5 обозначена как В5-1 и представляет собой смесь соединения 3 и дополнительного средства для контроля беспозвоночных вредителей, представляющего собой аба멕тин.

Таблица В6

Таблица В6 является идентичной таблице В1 за исключением того, что каждая ссылка на соединение 8 в столбце, озаглавленном "№ соед." заменена ссылкой на соединение 86. Например, первая смесь в таблице В6 обозначена как В6-1 и

представляет собой смесь соединения 86 и дополнительного средства для контроля беспозвоночных вредителей, представляющего собой абамектин.

В конкретных смесях, перечисленных в таблицах В1 – В6, как правило, объединено соединение формулы 1 с другим средством от беспозвоночных вредителей в соотношениях, указанных в таблице А.

Ниже в таблицах С1 – С6 перечислены конкретные смеси, содержащие соединение формулы 1 (номер соединения (№ соед.) относится к соединениям в таблице индексов А) и дополнительное средство для контроля беспозвоночных вредителей. В таблицах С1 – С19 дополнительно перечислены конкретные весовые соотношения, типичные для смесей в таблицах С1 – С19. Например, первая запись о весовом соотношении в первой строке таблицы С1 конкретно раскрывает смесь соединения 1 из таблицы индексов А с абамектином, применяемую в весовом соотношении, представляющем собой 100 частей соединения 1 и 1 часть абамектина.

15

Таблица С1

№ смеси	№ соед.	и	Средство для контроля беспозвоночных вредителей	Типичные соотношения в смесях (по весу)								
				100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
С1-1	8	и	Абамектин	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
С1-2	8	и	Ацетамиприд	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
С1-3	8	и	Амитраз	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
С1-4	8	и	Авермектин	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
С1-5	8	и	Азадирахтин	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
С1-6	8	и	Бенсултап	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
С1-7	8	и	Бета-цифлутрин	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
С1-8	8	и	Бифентрин	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
С1-9	8	и	Бупрофезин	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
С1-10	8	и	Картап	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
С1-11	8	и	Хлорантранилипрол	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
С1-12	8	и	Хлорфенапир	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
С1-13	8	и	Хлорпирифос	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
С1-14	8	и	Клотианидин	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
С1-15	8	и	Циантранилипрол	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
С1-16	8	и	Цифлутрин	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
С1-17	8	и	Цигалотрин	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
С1-18	8	и	Циперметрин	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
С1-19	8	и	Циромазин	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100

C1-20	8	и	Дельтаметрин	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-21	8	и	Диелдрин	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-22	8	и	Динотефуран	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-23	8	и	Диофенолан	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-24	8	и	Эмабектин	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-25	8	и	Эндосульфан	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-26	8	и	Эсфенвалерат	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-27	8	и	Этипрол	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-28	8	и	Фенотиокарб	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-29	8	и	Феноксикарб	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-30	8	и	Фенвалерат	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-31	8	и	Фипронил	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-32	8	и	Флоникамид	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-33	8	и	Флубендиамид	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-34	8	и	Флуфеноксурон	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-35	8	и	Гексафлумурон	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-36	8	и	Гидраметилнон	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-37	8	и	Имидаклоприд	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-38	8	и	Индоксакарб	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-39	8	и	Лямбда-цигалотрин	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-40	8	и	Люфенурон	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-41	8	и	Метафлумизон	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-42	8	и	Метомил	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-43	8	и	Метопрен	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-44	8	и	Метоксифенозид	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-45	8	и	Нитенпирам	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-46	8	и	Нитиазин	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-47	8	и	Новалурон	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-48	8	и	Оксамил	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-49	8	и	Фосмет	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-50	8	и	Пиметрозин	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-51	8	и	Пиретрин	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-52	8	и	Пиридабен	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-53	8	и	Пиридалил	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-54	8	и	Пирипроксифен	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-55	8	и	Рианодин	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-56	8	и	Спинеторам	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-57	8	и	Спиносад	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-58	8	и	Спиродиклофен	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-59	8	и	Спиромезифен	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100

C1-60	8	и	Спиротетрамат	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-61	8	и	Сульфоксафлор	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-62	8	и	Тебуфенозид	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-63	8	и	Тефлутрин	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-64	8	и	Тиаклоприд	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-65	8	и	Тиаметоксам	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-66	8	и	Тиодикарб	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-67	8	и	Тиосулгип-натрий	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-68	8	и	Толфенирад	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-69	8	и	Тралометрин	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-70	8	и	Триазамат	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-71	8	и	Трифлумезопирим	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-72	8	и	Трифлумурон	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-73	8	и	<i>Bacillus thuringiensis</i>	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-74	8	и	Дельта-эндотоксин <i>Bacillus thuringiensis</i>	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-75	8	и	NPV (например, Gemstar)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100

Таблица С2

Таблица С2 является идентичной таблице С1 за исключением того, что каждая ссылка на соединение 8 в столбце, озаглавленном "№ соедин." заменена ссылкой на соединение 14. Например, первая запись о весовом соотношении в первой строке таблицы С2 конкретно раскрывает смесь соединения 14 с абамактином, применяемую в весовом соотношении, представляющем собой 100 частей соединения 1 и 1 часть абамактина.

Таблица С3

Таблица С3 является идентичной таблице С1 за исключением того, что каждая ссылка на соединение 8 в столбце, озаглавленном "№ соедин." заменена ссылкой на соединение 19. Например, первая запись о весовом соотношении в первой строке таблицы С3 конкретно раскрывает смесь соединения 19 с абамактином, применяемую в весовом соотношении, представляющем собой 100 частей соединения 1 и 1 часть абамактина.

Таблица С4

Таблица С4 является идентичной таблице С1 за исключением того, что каждая ссылка на соединение 8 в столбце, озаглавленном "№ соедин." заменена ссылкой на соединение 78. Например, первая запись о весовом соотношении в первой строке таблицы С4 конкретно раскрывает смесь соединения 78 с абамектином, применяемую в весовом соотношении, представляющем собой 100 частей соединения 1 и 1 часть абамектина.

Таблица С5

Таблица С5 является идентичной таблице С1 за исключением того, что каждая ссылка на соединение 8 в столбце, озаглавленном "№ соедин." заменена ссылкой на соединение 3. Например, первая запись о весовом соотношении в первой строке таблицы С5 конкретно раскрывает смесь соединения 3 с абамектином, применяемую в весовом соотношении, представляющем собой 100 частей соединения 1 и 1 часть абамектина.

Таблица С6

Таблица С6 является идентичной таблице С1 за исключением того, что каждая ссылка на соединение 8 в столбце, озаглавленном "№ соедин." заменена ссылкой на соединение 86. Например, первая запись о весовом соотношении в первой строке таблицы С6 конкретно раскрывает смесь соединения 86 с абамектином, применяемую в весовом соотношении, представляющем собой 100 частей соединения 1 и 1 часть абамектина.

Ниже в таблицах D1 – D6 перечислены варианты осуществления конкретных композиций, содержащих соединение формулы 1 (номер соединения (№ соедин.) относится к соединениям в таблице индексов А) и дополнительный фунгицид.

Таблица D1

№ смеси	№ соедин.	и	фунгицид	№ смеси	№ соедин.	и	фунгицид
D1-1	8	и	Пробеназол	D1-17	8	и	Дифеноконазол
D1-2	8	и	Тиадинил	D1-18	8	и	Ципроконазол
D1-3	8	и	Изотианил	D1-19	8	и	Пропиконазол
D1-4	8	и	Пироквилон	D1-20	8	и	Феноксанил
D1-5	8	и	Метоминостробин	D1-21	8	и	Феримзон
D1-6	8	и	Флутоланил	D1-22	8	и	Фталид
D1-7	8	и	Валидамицин	D1-23	8	и	Касугамицин

№ смеси	№ и соед.	и фунгицид	№ смеси	№ и соед.	и фунгицид
D1-8	8	и Фураметпир	D1-24	8	и Пикоксистробин
D1-9	8	и Пенцикурон	D1-25	8	и Пентиопирад
D1-10	8	и Симеконазол	D1-26	8	и Фамоксадон
D1-11	8	и Оризастробин	D1-27	8	и Цимоксанил
D1-12	8	и Трифлуксистробин	D1-28	8	и Проквиназид
D1-13	8	и Изопропиолан	D1-29	8	и Флузилазол
D1-14	8	и Азоксистробин	D1-30	8	и Манкозеп
D1-15	8	и Трициклазол	D1-31	8	и Гидроксид меди
D1-16	8	и Гексаконазол	D1-32	8	и Оксатиапипролин

Таблица D2

Таблица D2 является идентичной таблице D1 за исключением того, что каждая ссылка на соединение 8 в столбце, озаглавленном "№ соед." заменена ссылкой на соединение 14. Например, первая смесь в таблице D2 обозначена как D2-1 и представляет собой смесь соединения 14 и дополнительного фунгицида, представляющего собой пробеназол.

Таблица D3

Таблица D3 является идентичной таблице D1 за исключением того, что каждая ссылка на соединение 8 в столбце, озаглавленном "№ соед." заменена ссылкой на соединение 19. Например, первая смесь в таблице D3 обозначена как D3-1 и представляет собой смесь соединения 19 и дополнительного фунгицида, представляющего собой пробеназол.

Таблица D4

Таблица D4 является идентичной таблице D1 за исключением того, что каждая ссылка на соединение 8 в столбце, озаглавленном "№ соед." заменена ссылкой на соединение 78. Например, первая смесь в таблице D4 обозначена как D4-1 и представляет собой смесь соединения 78 и дополнительного фунгицида, представляющего собой пробеназол.

Таблица D5

Таблица D5 является идентичной таблице D1 за исключением того, что каждая ссылка на соединение 8 в столбце, озаглавленном "№ соед." заменена ссылкой на соединение 3. Например, первая смесь в таблице D5 обозначена как D5-1 и

представляет собой смесь соединения 3 и дополнительного фунгицида, представляющего собой пробеназол.

Таблица D6

5 Таблица D6 является идентичной таблице D1 за исключением того, что каждая ссылка на соединение 8 в столбце, озаглавленном "№ соедин." заменена ссылкой на соединение 86. Например, первая смесь в таблице D6 обозначена как D6-1 и представляет собой смесь соединения 86 и дополнительного фунгицида, представляющего собой пробеназол.

10 Беспозвоночных вредителей в агрономических и неагрономических путях применения контролируют путем нанесения одного или нескольких соединений по настоящему изобретению, обычно в форме композиции, в биологически эффективном количестве в окружающую среду вредителей, включая агрономический и/или неагрономический очаг заражения, на защищаемый участок или непосредственно на
15 вредителей, подлежащих контролю.

Таким образом, в настоящем изобретении предусматривается способ обеспечения контроля беспозвоночных вредителей в агрономических и/или неагрономических путях применения, предусматривающий приведение в контакт беспозвоночного вредителя или его окружающей среды с биологически эффективным
20 количеством одного или нескольких соединений по настоящему изобретению, или с композицией, содержащей по меньшей мере одно такое соединение, или с композицией, содержащей по меньшей мере одно такое соединение и биологически эффективное количество по меньшей мере одного дополнительного биологически активного соединения или средства. Примеры подходящих композиций, содержащих
25 соединение по настоящему изобретению и биологически эффективное количество по меньшей мере одного дополнительного биологически активного соединения или средства, включают гранулированные композиции, где дополнительное активное соединение присутствует в той же грануле, что и соединение по настоящему изобретению, или в гранулах отдельно от гранул с соединением по настоящему
30 изобретению.

Для достижения контакта с соединением или композицией по настоящему изобретению для защиты полевой культуры от беспозвоночных вредителей соединение или композицию обычно применяют в отношении семян сельскохозяйственной культуры перед посадкой, в отношении листвы (например,

листьев, стеблей, цветков, плодов) сельскохозяйственных растений или в отношении почвы или другой среды для выращивания до посадки сельскохозяйственной культуры или после нее.

Один вариант осуществления способа приведения в контакт представляет собой
5 распыление. В качестве альтернативы, гранулированную композицию, содержащую соединение по настоящему изобретению, можно применять в отношении листвы растений или почвы. Соединения по настоящему изобретению также могут быть эффективно доставлены путем поглощения растениями при приведении растения в
10 контакт с композицией, содержащей соединение по настоящему изобретению, применяемое в виде жидкого состава для увлажнения почвы, гранулированного состава для почвы, при обработке ящика для рассады или при погружении пересаживаемых растений. Следует отметить композицию по настоящему изобретению в форме жидкого состава для увлажнения почвы. Также следует отметить способ обеспечения контроля беспозвоночных вредителей,
15 предусматривающий приведение в контакт беспозвоночного вредителя или его окружающей среды с биологически эффективным количеством соединения по настоящему изобретению или с композицией, содержащей биологически эффективное количество соединения по настоящему изобретению. Кроме того, следует отметить способ, где окружающей средой является почва, и композицию применяют в
20 отношении почвы в виде состава для увлажнения почвы. Следует также отметить, что соединения по настоящему изобретению также эффективны при локальном применении в отношении очага заражения. Другие способы приведения в контакт включают применение соединения или композиции по настоящему изобретению с помощью растворов для непосредственного распыления и растворов для распыления с
25 последствием, растворов для авиационного распыления, гелей, покрытий для семян, микроинкапсулированных препаратов, препаратов для системного поглощения, приманок, ушных бирок, болюсов, туманообразующих средств, фумигантов, аэрозолей, пылевидных препаратов и многого другого. Один вариант осуществления способа приведения в контакт предусматривает гранулу, палочку или таблетку
30 удобрения со стабильными размерами, содержащую соединение или композицию по настоящему изобретению. Соединениями по настоящему изобретению также могут быть пропитаны материалы для изготовления устройств для обеспечения контроля беспозвоночных (например, противомоскитной сетки).

Соединения по настоящему изобретению пригодны для обработки всех
35 растений, частей растений и семян. Разновидности и сорта растений и семян могут

быть получены с помощью традиционных методов размножения и селекции или с помощью методов генной инженерии. Генетически модифицированными растениями или семенами (трансгенными растениями или семенами) являются такие, у которых гетерологичный ген (трансген) стабильно интегрирован в геном растения или семени.

5 Трансген, определяемый его конкретным положением в геноме растения, называется событием трансформации или трансгенным объектом.

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 (засухе, 10 низкой температуре, засоленности почвы и т. д.) или имеют другие желаемые характеристики. Растения и семена могут быть генетически модифицированы, чтобы проявлять такие признаки, как, например, устойчивость к гербицидам, устойчивость к насекомым, модифицированные профили масел или устойчивость к засухе.

15 Пригодные генетически модифицированные растения и семена, содержащие объект трансформации одного гена или комбинацию объектов трансформации, перечислены в таблице Z. Дополнительную информацию касательно генетических модификаций, перечисленных в таблице Z, можно получать из следующих баз данных:

<http://www2.oecd.org/biotech/byidentifier.aspx>

20 <http://www.aphis.usda.gov>

<http://gmoinfo.jrc.ec.europa.eu>

В таблице Z применяются следующие сокращения: тол. означает толерантность, уст. означает устойчивость, SU означает сульфонилмочевину, ALS означает ацетолактатсинтазу, HPPD означает 4-гидроксифенилпируватдиоксигеназу, NA 25 означает нет данных.

Таблица Z

Сельскохозяйственная культура	Название объекта	Код объекта	Признак(признаки)	Ген(гены)
Люцерна	J101	MON-00101-8	Тол. к глифосату	cp4 epsps (aroA:CP4)
Люцерна	J163	MON-ØØ163-7	Тол. к глифосату	cp4 epsps (aroA:CP4)
Канола*	23-18-17 (объект 18)	CGN-89465-2	Высокое содержание масла, содержащего лауриновую кислоту	te

Канола*	23-198 (объект 23)	CGN-89465-2	Высокое содержание масла, содержащего лауриновую кислоту	te
Канола*	61061	DP-Ø61Ø61-7	Тол. к глифосату	gat4621
Канола*	73496	DP-Ø73496-4	Тол. к глифосату	gat4621
Канола*	GT200 (RT200)	MON-89249-2	Тол. к глифосату	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Канола*	GT73 (RT73)	MON-ØØØ73-7	Тол. к глифосату	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Канола*	HCN10 (Торас 19/2)	NA	Тол. к глюфосинату	bar
Канола*	HCN28 (Т45)	ACS-BNØØ8-2	Тол. к глюфосинату	pat (syn)
Канола*	HCN92 (Торас 19/2)	ACS-BNØØ7-1	Тол. к глюфосинату	bar
Канола*	MON88302	MON-883Ø2-9	Тол. к глифосату	cp4 epsps (aroA:CP4)
Канола*	MPS961	NA	Разложение фитата	phyA
Канола*	MPS962	NA	Разложение фитата	phyA
Канола*	MPS963	NA	Разложение фитата	phyA
Канола*	MPS964	NA	Разложение фитата	phyA
Канола*	MPS965	NA	Разложение фитата	phyA
Канола*	MS1 (B91-4)	ACS-BNØØ4-7	Тол. к глюфосинату	bar
Канола*	MS8	ACS-BNØØ5-8	Тол. к глюфосинату	bar
Канола*	OXY-235	ACS-BNØ11-5	Тол. к оксинилу	bxn
Канола*	PHY14	NA	Тол. к глюфосинату	bar
Канола*	PHY23	NA	Тол. к глюфосинату	bar
Канола*	PHY35	NA	Тол. к глюфосинату	bar
Канола*	PHY36	NA	Тол. к глюфосинату	bar
Канола*	RF1 (B93-101)	ACS-BNØØ1-4	Тол. к глюфосинату	bar
Канола*	RF2 (B94-2)	ACS-BNØØ2-5	Тол. к глюфосинату	bar
Канола*	RF3	ACS-BNØØ3-6	Тол. к глюфосинату	bar
Бобовое растение	EMBRAPA 5.1	EMB-	Уст. к заболеваниям	ac1 (смысловая и

		PV051-1		антисмысловая последовательности)
Бадриджан (баклажан)	EE-1		Уст. к насекомым	cry1Ac
Гвоздика	11 (7442)	FLO- 07442-4	Тол. к SU; модифицированный цвет цветов	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
Гвоздика	11363 (1363A)	FLO- 11363-1	Тол. к SU; модифицированный цвет цветов	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Гвоздика	1226A (11226)	FLO- 11226-8	Тол. к SU; модифицированный цвет цветов	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Гвоздика	123.2.2 (40619)	FLO- 40619-7	Тол. к SU; модифицированный цвет цветов	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
Гвоздика	123.38.2 (40644)	FLO- 40644-4	Тол. к SU; модифицированный цвет цветов	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
Гвоздика	123.8.12	FLO- 40689-6	Тол. к SU; модифицированный цвет цветов	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Гвоздика	123.8.8 (40685)	FLO- 40685-1	Тол. к SU; модифицированный цвет цветов	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Гвоздика	1351A (11351)	FLO- 11351-7	Тол. к SU; модифицированный цвет цветов	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Гвоздика	1400A (11400)	FLO- 11400-2	Тол. к SU; модифицированный цвет цветов	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Гвоздика	15	FLO- 00015-2	Тол. к SU; модифицированный цвет цветов	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
Гвоздика	16	FLO- 00016-3	Тол. к SU; модифицированный цвет цветов	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
Гвоздика	4	FLO- 00004-9	Тол. к SU; модифицированный цвет цветов	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
Гвоздика	66	FLO-	Тол. к SU;	surB; acc

		ØØØ66-8	замедленное увядание	
Гвоздика	959A (11959)	FLO- 11959-3	Тол. к SU; модифицированный цвет цветов	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Гвоздика	988A (11988)	FLO- 11988-7	Тол. к SU; модифицированный цвет цветов	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Гвоздика	26407	IFD-26497- 2	Тол. к SU; модифицированный цвет цветов	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Гвоздика	25958	IFD-25958- 3	Тол. к SU; модифицированный цвет цветов	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Цикорий	RM3-3	NA	Тол. к глюфосинату	bar
Цикорий	RM3-4	NA	Тол. к глюфосинату	bar
Цикорий	RM3-6	NA	Тол. к глюфосинату	bar
Хлопчатник	19-51a	DD- Ø1951A-7	Тол. к гербицидам, влияющим на ALS	S4-HrA
Хлопчатник	281-24-236	DAS- 24236-5	Тол. к глюфосинату; уст. к насекомым	pat (syn); cry1F
Хлопчатник	3006-210-23	DAS- 21Ø23-5	Тол. к глюфосинату; уст. к насекомым	pat (syn); cry1Ac
Хлопчатник	31707	NA	Тол. к оксинилу; уст. к насекомым	bxn; cry1Ac
Хлопчатник	31803	NA	Тол. к оксинилу; уст. к насекомым	bxn; cry1Ac
Хлопчатник	31807	NA	Тол. к оксинилу; уст. к насекомым	bxn; cry1Ac
Хлопчатник	31808	NA	Тол. к оксинилу; уст. к насекомым	bxn; cry1Ac
Хлопчатник	42317	NA	Тол. к оксинилу; уст. к насекомым	bxn; cry1Ac
Хлопчатник	BNLA-601	NA	Уст. к насекомым	cry1Ac
Хлопчатник	BXN10211	BXN10211- 9	Тол. к оксинилу	bxn; cry1Ac
Хлопчатник	BXN10215	BXN10215- 4	Тол. к оксинилу	bxn; cry1Ac
Хлопчатник	BXN10222	BXN10222- 2	Тол. к оксинилу	bxn; cry1Ac
Хлопчатник	BXN10224	BXN10224-	Тол. к оксинилу	bxn; cry1Ac

Хлопчатник	COT102	4 SYN- IR102-7	Уст. к насекомым	vip3A(a)
Хлопчатник	COT67B	SYN- IR67B-1	Уст. к насекомым	cry1Ab
Хлопчатник	COT202		Уст. к насекомым	vip3A
Хлопчатник	Объект 1	NA	Уст. к насекомым	cry1Ac
Хлопчатник	GMF Cry1A	GTL- GMF311-7	Уст. к насекомым	cry1Ab-Ac
Хлопчатник	GHB119	BCS- GH005-8	Уст. к насекомым	cry2Ac
Хлопчатник	GHB614	BCS- GH002-5	Тол. к глифосату	2merpsps
Хлопчатник	GK12	NA	Уст. к насекомым	cry1Ab-Ac
Хлопчатник	LLCotton25	ACS- GH001-3	Тол. к глюфосинату	bar
Хлопчатник	MLS 9124	NA	Уст. к насекомым	cry1C
Хлопчатник	MON1076	MON- 89924-2	Уст. к насекомым	cry1Ac
Хлопчатник	MON1445	MON- 01445-2	Тол. к глифосату	cp4 epsps (aroA:CP4)
Хлопчатник	MON15985	MON- 15985-7	Уст. к насекомым	cry1Ac; cry2Ab2
Хлопчатник	MON1698	MON- 89383-1	Тол. к глифосату	cp4 epsps (aroA:CP4)
Хлопчатник	MON531	MON- 00531-6	Уст. к насекомым	cry1Ac
Хлопчатник	MON757	MON- 00757-7	Уст. к насекомым	cry1Ac
Хлопчатник	MON88913	MON- 88913-8	Тол. к глифосату	cp4 epsps (aroA:CP4)
Хлопчатник	Nqwe Chi 6 Bt	NA	Уст. к насекомым	NA?
Хлопчатник	SKG321	NA	Уст. к насекомым	cry1A; CpTI
Хлопчатник	T303-3	BCS- GH003-6	Уст. к насекомым; тол. к глюфосинату	cry1Ab; bar
Хлопчатник	T304-40	BCS- GH004-7	Уст. к насекомым; тол. к глюфосинату	cry1Ab; bar
Хлопчатник	CE43-67B		Уст. к насекомым	cry1Ab
Хлопчатник	CE46-02A		Уст. к насекомым	cry1Ab
Хлопчатник	CE44-69D		Уст. к насекомым	cry1Ab
Хлопчатник	1143-14A		Уст. к насекомым	cry1Ab

Хлопчатник	1143-51B		Уст. к насекомым	cry1Ab
Хлопчатник	T342-142		Уст. к насекомым	cry1Ab
Хлопчатник	PV-GHGT07 (1445)		Тол. к глифосату	cp4 epsps (aroA:CP4)
Хлопчатник	EE-GH3		Тол. к глифосату	merpsps
Хлопчатник	EE-GH5		Уст. к насекомым	cry1Ab
Хлопчатник	MON88701	MON- 88701-3	Тол. к дикамбе и глюфосинату	Модифицированный dmo; bar
Хлопчатник	OsCr11		Гипоаллергенный	Модифицированный Cry j
Полевица болотная	ASR368	SMG- 368ØØ-2	Тол. к глифосату	cp4 epsps (aroA:CP4)
Эвкалипт	20-C		Тол. к солям	codA
Эвкалипт	12-5C		Тол. к солям	codA
Эвкалипт	12-5B		Тол. к солям	codA
Эвкалипт	107-1		Тол. к солям	codA
Эвкалипт		1/9/2001	Тол. к солям	codA
Эвкалипт		2/1/2001	Тол. к солям	codA
Эвкалипт			Тол. к холоду	des9
Лен	FP967	CDC- FL001-2	Тол. к гербицидам, влияющим на ALS	als
Чечевица	RH44		Тол. к имидазолинону	als
Маис	3272	SYN- E3272-5	Модифицированная альфа-амилаза	amy797E
Маис	5307	SYN- 05307-1	Уст. к насекомым	ecry3.1Ab
Маис	59122	DAS- 59122-7	Уст. к насекомым; тол. к глюфосинату	cry34Ab1; cry35Ab1; pat
Маис	676	RH-000676- 7	Тол. к глюфосинату; контроль опыления	pat; dam
Маис	678	RH-000678- 9	Тол. к глюфосинату; контроль опыления	pat; dam
Маис	680	RH-000680- 2	Тол. к глюфосинату; контроль опыления	pat; dam
Маис	98140	DP-098140- 6	Тол. к глифосату; тол. к гербициду, влияющему на ALS	gat4621; zm-hra
Маис	Bt10	NA	Уст. к насекомым; тол. к глюфосинату	cry1Ab; pat
Маис	Bt176 (176)	SYN-	Уст. к насекомым;	cry1Ab; bar

Маис	BVLA430101	EV176-9 NA	тол. к глюфосинату Разложение фитата	phyA2
Маис	CBH-351	ACS- ZM004-3	Уст. к насекомым; тол. к глюфосинату	cry9C; bar
Маис	DAS40278-9	DAS40278- 9	Тол. к 2,4-D	aad-1
Маис	DBT418	DKB- 89614-9	Уст. к насекомым; тол. к глюфосинату	cry1Ac; pinII; bar
Маис	DLL25 (B16)	DKB- 89790-5	Тол. к глюфосинату	bar
Маис	GA21	MON- 00021-9	Тол. к глифосату	merpsps
Маис	GG25		Тол. к глифосату	merpsps
Маис	GJ11		Тол. к глифосату	merpsps
Маис	FI117		Тол. к глифосату	merpsps
Маис	GAT-ZM1		Тол. к глюфосинату	pat
Маис	LY038	REN- 00038-3	Повышенное содержание лизина	cordapA
Маис	MIR162	SYN- IR162-4	Уст. к насекомым	vip3Aa20
Маис	MIR604	SYN- IR604-5	Уст. к насекомым	mcry3A
Маис	MON801 (MON80100)	MON801	Уст. к насекомым; тол. к глифосату	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Маис	MON802	MON- 80200-7	Уст. к насекомым; тол. к глифосату	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Маис	MON809	PH-MON- 809-2	Уст. к насекомым; тол. к глифосату	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Маис	MON810	MON- 00810-6	Уст. к насекомым; тол. к глифосату	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Маис	MON832	NA	Тол. к глифосату	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Маис	MON863	MON- 00863-5	Уст. к насекомым	cry3Bb1
Маис	MON87427	MON- 87427-7	Тол. к глифосату	cp4 epsps (aroA:CP4)
Маис	MON87460	MON- 87460-4	Тол. к засухе	cspB
Маис	MON88017	MON- 88017-3	Уст. к насекомым; тол. к глифосату	cry3Bb1; cp4 epsps (aroA:CP4)
Маис	MON89034	MON-	Уст. к насекомым	cry2Ab2; cry1A.105

Маис	MS3	89034-3 ACS- ZM001-9	Тол. к глюфосинату; контроль опыления	bar; барназа
Маис	MS6	ACS- ZM005-4	Тол. к глюфосинату; контроль опыления	bar; барназа
Маис	NK603	MON- 00603-6	Тол. к глифосату	cp4 epsps (aroA:CP4)
Маис	T14	ACS- ZM002-1	Тол. к глюфосинату	pat (syn)
Маис	T25	ACS- ZM003-2	Тол. к глюфосинату	pat (syn)
Маис	TC1507	DAS- 01507-1	Уст. к насекомым; тол. к глюфосинату	cry 1Fa2; pat
Маис	TC6275	DAS- 06275-8	Уст. к насекомым; тол. к глюфосинату	mozcry 1F; bar
Маис	VIP1034		Уст. к насекомым; тол. к глюфосинату	vip3A; pat
Маис	43A47	DP- 043A47-3	Уст. к насекомым; тол. к глюфосинату	cry 1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
Маис	40416	DP-040416- 8	Уст. к насекомым; тол. к глюфосинату	cry 1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
Маис	32316	DP-032316- 8	Уст. к насекомым; тол. к глюфосинату	cry 1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
Маис	4114	DP-004114- 3	Уст. к насекомым; тол. к глюфосинату	cry 1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
Дыня	Melon A	NA	Замедленное созревание/увядание	sam-k
Дыня	Melon B	NA	Замедленное созревание/увядание	sam-k
Папайя	55-1	CUH- CP551-8	Уст. к заболеваниям	prsv cp
Папайя	63-1	CUH- CP631-7	Уст. к заболеваниям	prsv cp
Папайя	Huanong № 1	NA	Уст. к заболеваниям	prsv ger
Папайя	X17-2	UFL- X17CP-6	Уст. к заболеваниям	prsv cp
Петуния	Petunia-CHS	NA	Модифицированное качество продукта	Подавление CHS
Слива	C-5	ARS- PLMC5-6	Уст. к заболеваниям	prpv cp
Канола**	ZSR500	NA	Тол. к глифосату	cp4 epsps (aroA:CP4);

Канола**	ZSR502	NA	Тол. к глифосату	goxv247 cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Канола**	ZSR503	NA	Тол. к глифосату	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Тополь	Vt poplar	NA	Уст. к насекомым	cry1Ac; API
Тополь	Гибридный клон тополя 741	NA	Уст. к насекомым	cry1Ac; API
Тополь	trg300-1		Высокое содержание целлюлозы	AaXEG2
Тополь	trg300-2		Высокое содержание целлюлозы	AaXEG2
Картофель	1210 amk	NA	Уст. к насекомым	cry3A
Картофель	2904/1 kgs	NA	Уст. к насекомым	cry3A
Канола**	ZSR500	NA	Тол. к глифосату	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Канола**	ZSR502	NA	Тол. к глифосату	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Картофель	ATBT04-27	NMK- 89367-8	Уст. к насекомым	cry3A
Картофель	ATBT04-30	NMK- 89613-2	Уст. к насекомым	cry3A
Картофель	ATBT04-31	NMK- 89170-9	Уст. к насекомым	cry3A
Картофель	ATBT04-36	NMK- 89279-1	Уст. к насекомым	cry3A
Картофель	ATBT04-6	NMK- 89761-6	Уст. к насекомым	cry3A
Картофель	BT06	NMK- 89812-3	Уст. к насекомым	cry3A
Картофель	BT10	NMK- 89175-5	Уст. к насекомым	cry3A
Картофель	BT12	NMK- 89601-8	Уст. к насекомым	cry3A
Картофель	BT16	NMK- 89167-6	Уст. к насекомым	cry3A
Картофель	BT17	NMK- 89593-9	Уст. к насекомым	cry3A
Картофель	BT18	NMK- 89906-7	Уст. к насекомым	cry3A
Картофель	BT23	NMK-	Уст. к насекомым	cry3A

Картофель	EH92-527-1	89675-1 BPS- 25271-9	Модифицированный крахмал/углевод	gbss (антисмысловая последовательность)
Картофель	HLMT15-15	NA	Уст. к насекомым и заболеваниям	cry3A; pvy cp
Картофель	HLMT15-3	NA	Уст. к насекомым и заболеваниям	cry3A; pvy cp
Картофель	HLMT15-46	NA	Уст. к насекомым и заболеваниям	cry3A; pvy cp
Картофель	RBMT15-101	NMK- 89653-6	Уст. к насекомым и заболеваниям	cry3A; pvy cp
Картофель	RBMT21-129	NMK- 89684-1	Уст. к насекомым и заболеваниям	cry3A; plrv orf1; plrv orf2
Картофель	RBMT21-152	NA	Уст. к насекомым и заболеваниям	cry3A; plrv orf1; plrv orf2
Картофель	RBMT21-350	NMK- 89185-6	Уст. к насекомым и заболеваниям	cry3A; plrv orf1; plrv orf2
Картофель	RBMT22-082	NMK- 89896-6	Уст. к насекомым и заболеваниям; тол. к глифосату	cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4)
Картофель	RBMT22-186	NA	Уст. к насекомым и заболеваниям; тол. к глифосату	cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4)
Картофель	RBMT22-238	NA	Уст. к насекомым и заболеваниям; тол. к глифосату	cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4)
Картофель	RBMT22-262	NA	Уст. к насекомым и заболеваниям; тол. к глифосату	cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4)
Картофель	SEMT15-02	NMK- 89935-9	Уст. к насекомым и заболеваниям	cry3A; pvy cp
Картофель	SEMT15-07	NA	Уст. к насекомым и заболеваниям	cry3A; pvy cp
Картофель	SEMT15-15	NMK- 89930-4	Уст. к насекомым и заболеваниям	cry3A; pvy cp
Картофель	SPBT02-5	NMK- 89576-1	Уст. к насекомым	cry3A
Картофель	SPBT02-7	NMK- 89724-5	Уст. к насекомым	cry3A
Рис	7Ccp#242-95-7		Гипоаллергенный	7csp
Рис	7Ccp#10	NA	Гипоаллергенный	7csp

Рис	GM Shanyou 63	NA	Уст. к насекомым	cry1Ab; cry1Ac
Рис	Huahui-1/TT51-1	NA	Уст. к насекомым	cry1Ab; cry1Ac
Рис	LLRICE06	ACS- OS001-4	Тол. к глюфосинату	bar
Рис	LLRICE601	BCS- OS003-7	Тол. к глюфосинату	bar
Рис	LLRICE62	ACS- OS002-5	Тол. к глюфосинату	bar
Рис	Tarom molaii + cry1Ab	NA	Уст. к насекомым	cry1Ab (усеченный)
Рис	GAT-OS2		Тол. к глюфосинату	bar
Рис	GAT-OS3		Тол. к глюфосинату	bar
Рис	PE-7		Уст. к насекомым	Cry1Ac
Рис	7Cp#10	NA	Гипоаллергенный	7cp
Рис	KPD627-8		Высокое содержание триптофана	OASA1D
Рис	KPD722-4		Высокое содержание триптофана	OASA1D
Рис	KA317		Высокое содержание триптофана	OASA1D
Рис	HW5		Высокое содержание триптофана	OASA1D
Рис	HW1		Высокое содержание триптофана	OASA1D
Рис	B-4-1-18		Полукарликовый со стоячими листьями	Δ OsBRI1
Рис	G-3-3-22		Полукарликовый	OSGA2ox1
Рис	AD77		Уст. к заболеваниям	DEF
Рис	AD51		Уст. к заболеваниям	DEF
Рис	AD48		Уст. к заболеваниям	DEF
Рис	AD41		Уст. к заболеваниям	DEF
Рис	13pNasNaatAprt1		Тол. к низкому содержанию железа	HvNAS1; HvNAAT- A; APRT
Рис	13pAprt1		Тол. к низкому содержанию железа	APRT
Рис	gHvNAS1- gHvNAAT-1		Тол. к низкому содержанию железа	HvNAS1; HvNAAT- A; HvNAAT-B
Рис	gHvIDS3-1		Тол. к низкому содержанию железа	HvIDS3
Рис	gHvNAAT1		Тол. к низкому содержанию железа	HvNAAT-A; HvNAAT-B

Рис	gHvNAS1-1		Тол. к низкому содержанию железа	HvNAS1
Рис	NIA-OS006-4		Уст. к заболеваниям	WRKY45
Рис	NIA-OS005-3		Уст. к заболеваниям	WRKY45
Рис	NIA-OS004-2		Уст. к заболеваниям	WRKY45
Рис	NIA-OS003-1		Уст. к заболеваниям	WRKY45
Рис	NIA-OS002-9		Уст. к заболеваниям	WRKY45
Рис	NIA-OS001-8		Уст. к заболеваниям	WRKY45
Рис	OsCr11		Гипоаллергенный	Модифицированный Cry j
Рис	17053		Тол. к глифосату	cp4 epsps (aroA:CP4)
Рис	17314		Тол. к глифосату	cp4 epsps (aroA:CP4)
Роза	WKS82/130-4-1	IFD-52401-4	Модифицированный цвет цветов	5AT; bp40 (f3'5'h)
Роза	WKS92/130-9-1	IFD-52901-9	Модифицированный цвет цветов	5AT; bp40 (f3'5'h)
Соя	260-05 (G94-1, G94-19, G168)	NA	Модифицированные масло/жирная кислота	gm-fad2-1 (сайленсинг локуса)
Соя	A2704-12	ACS-GM005-3	Тол. к глюфосинату	pat
Соя	A2704-21	ACS-GM004-2	Тол. к глюфосинату	pat
Соя	A5547-127	ACS-GM006-4	Тол. к глюфосинату	pat
Соя	A5547-35	ACS-GM008-6	Тол. к глюфосинату	pat
Соя	CV127	BPS-CV127-9	Тол. к имидазолинону	csr1-2
Соя	DAS68416-4	DAS68416-4	Тол. к глюфосинату	pat
Соя	DP305423	DP-305423-1	Модифицированные масло/жирная кислота; тол. к гербициду, влияющему на ALS	gm-fad2-1 (сайленсинг локуса); gm-hra
Соя	DP356043	DP-356043-5	Модифицированные масло/жирная кислота; тол. к глифосату	gm-fad2-1 (сайленсинг локуса); gat4601
Соя	FG72	MST-	Тол. к глифосату и	2mepsps; hppdPF

Соя	GTS 40-3-2 (40-3-2)	FG072-3 MON-04032-6	HPPD Тол. к глифосату	W336 cp4 epsps (aroA:CP4)
Соя	GU262	ACS-GM003-1	Тол. к глюфосинату	pat
Соя	MON87701	MON-87701-2	Уст. к насекомым	cry1Ac
Соя	MON87705	MON-87705-6	Модифицированные масло/жирная кислота; тол. к глифосату	fatb1-A (смысловая и антисмысловая последовательности); fad2-1A (смысловая и антисмысловая последовательности); cp4 epsps (aroA:CP4)
Соя	MON87708	MON-87708-9	Тол. к дикамбе и глифосату	dmo; cp4 epsps (aroA:CP4)
Соя	MON87769	MON-87769-7	Модифицированные масло/жирная кислота; тол. к глифосату	Pj.D6D; Nc.Fad3; cp4 epsps (aroA:CP4)
Соя	MON89788	MON-89788-1	Тол. к глифосату	cp4 epsps (aroA:CP4)
Соя	W62	ACS-GM002-9	Тол. к глюфосинату	bar
Соя	W98	ACS-GM001-8	Тол. к глюфосинату	bar
Соя	MON87754	MON-87754-1	Высокое содержание масла	dgat2A
Соя	DAS21606	DAS-21606	Тол. к арилоксиалканоату и глюфосинату	Модифицированный aad-12; pat
Соя	DAS44406	DAS-44406-6	Тол. к арилоксиалканоату, глифосату и глюфосинату	Модифицированный aad-12; 2mepsps; pat
Соя	SYHT04R	SYN-0004R-8	Тол. к мезотриону	Модифицированный avhppd
Соя	9582.814.19.1		Уст. к насекомым и тол. к глюфосинату	cry1Ac, cry1F, PAT
Тыква	CZW3	SEM-ØCZW3-2	Уст. к заболеваниям	cmv cp, zumv cp, wmv cp

Тыква	ZW20	SEM- 0ZW20-7	Уст. к заболеваниям	zmvv cp, wmv cp
Сахарная свекла	GTSB77 (T9100152)	SY- GTSB77-8	Тол. к глифосату	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Сахарная свекла	H7-1	KM- 000H71-4	Тол. к глифосату	cp4 epsps (aroA:CP4)
Сахарная свекла	T120-7	ACS- BV001-3	Тол. к глюфосинату	pat
Сахарная свекла	T227-1		Тол. к глифосату	cp4 epsps (aroA:CP4)
Сахарный тростник	NXI-1T		Тол. к засухе	EcbetA
Подсолнечник	X81359		Тол. к имидазолинону	als
Сладкий перец	PK-SP01	NA	Уст. к заболеваниям	cmv cp
Табак	C/F/93/08-02	NA	Тол. к оксинилу	bxn
Табак	Vector 21-41	NA	Сниженное содержание никотина	NtQPT1 (антисмысловая последовательность)
Томат	1345-4	NA	Замедленное созревание/увядание	acc (усеченный)
Томат	35-1-N	NA	Замедленное созревание/увядание	sam-k
Томат	5345	NA	Уст. к насекомым	cry IAc
Томат	8338	CGN- 89322-3	Замедленное созревание/увядание	accd
Томат	B	SYN- 0000B-6	Замедленное созревание/увядание	pg (смысловая или антисмысловая)
Томат	Da	SYN- 0000DA-9	Замедленное созревание/увядание	pg (смысловая или антисмысловая)
Подсолнечник	X81359		Тол. к имидазолинону	als
Томат	Da Dong № 9	NA	Модифицированный продукт	NA
Томат	F (1401F, h38F, 11013F,7913F)	SYN- 0000F-1	Замедленное созревание/увядание	pg (смысловая или антисмысловая)
Томат	FLAVR SAVR™	CGN- 89564-2	Замедленное созревание/увядание	pg (смысловая или антисмысловая)
Томат	Huafan № 1	NA	Замедленное созревание/увядание	anti-efe
Томат	PK-TM8805R (8805R)	NA	Уст. к заболеваниям	cmv cp

Пшеница	MON71800	MON-71800-3	Тол. к глифосату	ср4 epsps (aroA:CP4)
---------	----------	-------------	------------------	----------------------

* Аргентинская, ** польская, # баклажан

Обработка генетически модифицированных растений и семян соединениями по настоящему изобретению может приводить к усиленным эффектам. Например, показатели снижения норм внесения, расширения спектра активности, повышенной устойчивости к биотическим/абиотическим стрессам или повышенной стабильности при хранении могут быть больше ожидаемых из-за простых аддитивных эффектов применения соединений по настоящему изобретению в отношении генетически модифицированных растений и семян.

Соединения по настоящему изобретению также являются пригодными для обработки семян для обеспечения защиты семян от беспозвоночных вредителей. В контексте настоящего изобретения и формулы изобретения обработка семян означает приведение семян в контакт с биологически эффективным количеством соединения по настоящему изобретению, которое обычно составлено в виде композиции по настоящему изобретению. Такая обработка семян защищает семена от беспозвоночных почвенных вредителей и, как правило, также может защитить корни и другие части растений, контактирующие с почвой, у проростка, развивающегося из прорастающего семени. Обработка семян также может обеспечивать защиту листвы путем переноса соединения по настоящему изобретению или второго активного ингредиента в развивающееся растение. Обработка семян может применяться ко всем типам семян, включая те, из которых будут прорасти растения, генетически трансформированные для экспрессии специфических признаков. Иллюстративные примеры включают растения, экспрессирующие токсичные для беспозвоночных вредителей белки, такие как токсин *Bacillus thuringiensis*, или экспрессирующие белки, придающие устойчивость к гербицидам, такие как глифосатацетилтрансфераза, которая обеспечивает устойчивость к глифосату. Обработка семян соединениями по настоящему изобретению также может повысить интенсивность роста растений, растущих из обработанных семян.

Один из способов обработки семян заключается в опрыскивании или опылении семян соединением по настоящему изобретению (т. е. в виде составленной композиции) перед посевом семян. Композиции, составленные для обработки семян, обычно содержат пленкообразователь или адгезионное средство. Следовательно, как

правило, композиция для покрытия семян по настоящему изобретению содержит биологически эффективное количество соединения формулы 1, его *N*-оксида или соли и пленкообразователь или адгезионное средство. Семена можно покрыть путем распыления текучего концентрата суспензии непосредственно на слой семян в галтовочном барабане и последующей сушки семян. В качестве альтернативы, на семена можно распылять другие типы составов, такие как смачиваемые порошки, растворы, суспензии, эмульгируемые концентраты и эмульсии в воде. Данный способ особенно применим для нанесения пленочных покрытий на семена. Специалисту в данной области доступны различные машины и способы нанесения покрытий. Подходящие способы включают приведенные в P. Kusters et al., *Seed Treatment: Progress and Prospects*, 1994 BCPC Monograph No. 57 и в упомянутых там литературных источниках.

Соединения формулы 1 и композиции на их основе, как по отдельности, так и в комбинации с другими инсектицидами и фунгицидами, являются особенно пригодными для обработки семян сельскохозяйственных культур, в том числе без ограничения маиса или кукурузы, сои, хлопчатника, зерновых культур (например, пшеницы, овса, ячменя, ржи и риса), картофеля, овощей и масличного рапса.

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

Фунгициды, с которыми соединения формулы 1 можно составлять для получения смесей, пригодных для обработки семян, включают амисулбром, азоксистробин, боскалид, карбендазим, карбоксин, цимоксанил, ципроконазол, дифеноконазол, диметоморф, флуазинам, флудиоксонил, флуквинконазол, 5 флуопиколид, флуоксастробин, флутриафол, флуксапироксад, ипконазол, ипродион, металаксил, мефеноксам, метконазол, миклобутанил, паклобутразол, пенфлуфен, пикоксистробин, протиокконазол, пиракlostробин, седаксан, силтиофам, тебуконазол, тиабендазол, тиофанат-метил, тирам и трифлуксистробин и тритиконазол.

Композиции, содержащие соединения формулы 1, пригодные для обработки 10 семян, могут дополнительно содержать бактерии, такие как *Bacillus pumilus* (например, штамм GB34) и *Bacillus firmus* (например, изолят 1582), инокулянты на основе клубеньковых бактерий/средства, обеспечивающие распространение клубеньковых бактерий, изофлавоноиды и липохитоолигосахариды.

Обработанное семя обычно содержит соединение по настоящему изобретению в 15 количестве от приблизительно 0,1 г до 1 кг на 100 кг семян (т. е. от приблизительно 0,0001 до 1% по весу семени перед обработкой). Текучая суспензия, составленная для обработки семян, обычно содержит от приблизительно 0,5 до приблизительно 70% 20 активного ингредиента, от приблизительно 0,5 до приблизительно 30% пленкообразующего адгезивного вещества, от приблизительно 0,5 до приблизительно 20% диспергирующего средства, от 0 до приблизительно 5% загустителя, от 0 до 20% диспергирующего средства, от 0 до приблизительно 5% загустителя, от 0 до приблизительно 5% пигмента и/или красителя, от 0 до приблизительно 2% пеногасителя, от 0 до приблизительно 1% консерванта и от 0 до приблизительно 75% летучего жидкого разбавителя.

Соединения по настоящему изобретению могут быть включены в композицию- 25 приманку, которая поглощается беспозвоночным вредителем или используется внутри такого устройства, как ловушка, приманочная станция и т. п. Такая композиция-приманка может находиться в форме гранул, которые содержат (а) активные ингредиенты, а именно биологически эффективное количество соединения формулы 1 его *N*-оксида или соли, (b) один или несколько пищевых материалов; необязательно 30 (с) аттрактант и необязательно (d) одно или несколько увлажняющих средств. Следует отметить гранулы или композиции-приманки, которые содержат приблизительно 0,001-5% активных ингредиентов, приблизительно 40-99% пищевого материала и/или аттрактанта и необязательно приблизительно 0,05-10% увлажняющих средств, которые являются эффективными для обеспечения контроля почвенных 35 беспозвоночных вредителей при очень низких нормах внесения, в частности, при

дозах активного ингредиента, которые являются летальными при поглощении, а не при прямом контакте. Некоторые пищевые материалы могут выполнять функцию как источника пищи, так и аттрактанта. Пищевые материалы предусматривают углеводы, белки и липиды. Примерами пищевых материалов являются растительная мука, сахар, крахмалы, животный жир, растительное масло, дрожжевые экстракты и твердые вещества молока. Примерами аттрактантов являются отдушки и ароматизаторы, такие как экстракты фруктов или растений, душистое вещество или другой компонент животного или растительного происхождения, феромоны или другие средства, которые, как известно, привлекают целевого беспозвоночного вредителя. Примерами увлажняющих средств, то есть средств, удерживающих влагу, являются гликоли и другие полиолы, глицерин и сорбит. Следует отметить композицию-приманку (и способ применения такой композиции-приманки), используемую для контроля по меньшей мере одного беспозвоночного вредителя, выбранного из группы, состоящей из муравьев, термитов и тараканов. Устройство для обеспечения контроля беспозвоночного вредителя может содержать композицию-приманку по настоящему изобретению и корпус, приспособленный для помещения композиции-приманки, где корпус имеет по меньшей мере одно отверстие, размер которого обеспечивает возможность беспозвоночному вредителю проходить через отверстие таким образом, что беспозвоночный вредитель может получить доступ к композиции-приманке из места за пределами корпуса, и где корпус дополнительно приспособлен для размещения в участке потенциальной или известной активности беспозвоночного вредителя или рядом с ним.

Соединения по настоящему изобретению можно использовать без других вспомогательных веществ, но наиболее часто используемым будет состав, содержащий один или несколько активных ингредиентов с подходящими носителями, разбавителями и поверхностно-активными веществами и, возможно, в комбинации с пищей в зависимости от предполагаемого конечного применения. Один из способов применения предусматривает распыление соединения по настоящему изобретению в водной дисперсии или растворе в рафинированном масле. Комбинации с маслами для распыления, концентрированными маслами для распыления, адгезивными средствами распространения, вспомогательными веществами, другими растворителями и пиперонилбутоксидом, часто усиливают эффективность соединения. Для путей неагрономического применения такие спреи можно наносить из контейнеров для распыления, таких как баллон, бутылка или другой контейнер, либо с помощью насоса, либо посредством высвобождения его из контейнера под давлением, например

баллона со спреем в виде аэрозоля под давлением. Такие композиции для распыления могут принимать различные формы, например, спреи, туманы, пены, пары или дым. Такие композиции для распыления, таким образом, могут дополнительно содержать пропелленты, пенообразователи и т. п., в зависимости от обстоятельств. Следует
5 отметить композицию для распыления, содержащую биологически эффективное количество соединения или композиции по настоящему изобретению и носитель. Один вариант осуществления такой композиции для распыления содержит биологически эффективное количество соединения или композиции по настоящему изобретению и пропеллент. Типичные пропелленты включают без ограничения метан,
10 этан, пропан, бутан, изобутан, бутен, пентан, изопентан, неопентан, пентен, гидрофторуглероды, хлорфторуглероды, диметиловый эфир и смеси вышеперечисленного. Следует отметить композицию для распыления (и способ с применением такой композиции для распыления, распределяемой из контейнера для распыления), используемую для контроля по меньшей мере одного беспозвоночного
15 вредителя, выбранного из группы, состоящей из комаров, мошек, жигалок, оленьих слепней, слепней, роющих ос, настоящих ос, шершней, клещей, пауков, муравьев, мушек и т. п., включая их по отдельности или в комбинациях.

Один вариант осуществления настоящего изобретения относится к способу обеспечения контроля беспозвоночных вредителей, предусматривающему
20 разбавление пестицидной композиции по настоящему изобретению (соединение формулы 1, составленное с поверхностно-активными веществами, твердыми разбавителями и жидкими разбавителями или составленная смесь соединения формулы 1 и по меньшей мере одного другого пестицида) водой и необязательно добавление вспомогательного вещества с образованием разбавленной композиции, и
25 приведение в контакт беспозвоночного вредителя или его окружающей среды с эффективным количеством указанной разбавленной композиции.

Хотя композиция для распыления, образованная посредством разбавления водой пестицидной композиции по настоящему изобретению в достаточной концентрации, может обеспечить достаточную эффективность для обеспечения контроля
30 беспозвоночных вредителей, к баковым смесям для распыления также могут быть добавлены отдельно составленные вспомогательные продукты. Эти дополнительные вспомогательные вещества обычно известны как "вспомогательные вещества для распыления" или "вспомогательные вещества для баковых смесей" и предусматривают любое вещество, смешанное в баке для распыления для улучшения характеристик
35 пестицида или изменения физических свойств смеси для распыления.

Вспомогательные вещества могут представлять собой поверхностно-активные вещества, эмульгирующие средства, масла на основе нефтепродуктов, полученные из сельскохозяйственных культур, масла из семян, полученных от сельскохозяйственных культур, подкислители, буферы, загустители или антивспенивающие средства.

5 Вспомогательные вещества используются для повышения эффективности (например, биологической доступности, адгезии, проникновения, однородности покрытия и длительности защиты) или минимизации или устранения проблем нанесения посредством распыления, связанных с несовместимостью, пенообразованием, сносом, испарением, улетучиванием и разложением. Для достижения оптимальной
10 эффективности вспомогательные вещества выбираются с учетом свойств активного ингредиента, состава и мишени (например, сельскохозяйственных культур, насекомых-вредителей).

Среди вспомогательных веществ для распыления, масла, включая масла сельскохозяйственных культур, концентраты масел сельскохозяйственных культур,
15 концентраты растительных масел и метилированные концентраты масел из семян наиболее часто используются для повышения эффективности пестицидов, возможно посредством обеспечения более равномерных и однородных отложений при распылении. В ситуациях, где фитотоксичность, потенциально вызванная маслами или другими не смешивающимися с водой жидкостями, вызывает беспокойство,
20 композиции для распыления, полученные из композиции по настоящему изобретению, обычно не будут содержать вспомогательных веществ для распыления на масляной основе. Однако в ситуациях, где фитотоксичность, вызванная вспомогательными веществами для распыления на масляной основе, является коммерчески незначительной, композиции для распыления, полученные из композиции по
25 настоящему изобретению, могут также содержать вспомогательные вещества для распыления на масляной основе, которые потенциально могут дополнительно повысить эффективность контроля беспозвоночных вредителей, а также устойчивость к осадкам.

Продукты, обозначенные как "масло сельскохозяйственной культуры", обычно
30 содержат от 95 до 98% парафина или нефтяного масла на основе сырой нефти и от 1 до 2% одного или нескольких поверхностно-активных веществ, действующих в качестве эмульгаторов. Продукты, обозначенные как "концентраты масел сельскохозяйственных культур", обычно состоят из 80-85% эмульгируемого масла на основе нефтепродуктов и 15-20% неионогенных поверхностно-активных веществ.
35 Продукты, правильно обозначенные как "концентраты растительных масел", обычно

состоят из 80-85% растительного масла (т. е. масла семян или фруктов, чаще всего из хлопка, льна, сои или подсолнечника) и 15-20% неионогенных поверхностно-активных веществ. Эффективность вспомогательного вещества можно улучшить посредством замены растительного масла метиловыми эфирами жирных кислот, которые обычно получают из растительных масел. Примеры метилированных концентратов масел из семян предусматривают концентрат MSO® (UAP-Loveland Products, Inc.) и метилированное масло для распыления Premium MSO (Helena Chemical Company).

Количество вспомогательных веществ, добавляемых к смесям для распыления, обычно не превышает приблизительно 2,5% по объему, и более типично количество составляет от приблизительно 0,1 до приблизительно 1% по объему. Нормы внесения вспомогательных веществ, добавляемых к смесям для распыления, обычно составляют от приблизительно 1 до 5 л на гектар. Иллюстративные примеры вспомогательных веществ для распыления включают Adigor® (Syngenta) 47% метилированное рапсовое масло в жидких углеводородах, Silwet® (Helena Chemical Company), модифицированный полиалкиленоксидом гептаметилтрисилоксан и смесь Assist® (BASF) из 17% поверхностно-активного вещества в 83% минеральном масле на основе парафина.

Пути неагрономического применения включают обеспечение защиты животного, в частности, позвоночного, более конкретно гомойотермного позвоночного (например, млекопитающего или птицы) и наиболее конкретно млекопитающего, от беспозвоночного паразитического вредителя путем введения паразитоцидно эффективного (т. е. биологически эффективного) количества соединения по настоящему изобретению, как правило, в форме композиции, составленной для ветеринарного применения, животному, подлежащему защите. Следовательно, следует отметить способ обеспечения защиты животного, предусматривающий введение животному паразитоцидно эффективного количества соединения по настоящему изобретению. Указанные в настоящем изобретении и формуле изобретения термины "паразитоцидный" и "паразитоцидно" означают наблюдаемые эффекты в отношении беспозвоночного паразитического вредителя с обеспечением защиты животного от вредителя. Паразитоцидные эффекты, как правило, относятся к уменьшению случаев возникновения или активности целевого беспозвоночного паразитического вредителя. Такие эффекты в отношении вредителя включают некроз, гибель, замедленный рост, уменьшенную подвижность или сниженную способность оставаться на животном-хозяине или внутри него, пониженную способность к

питанию и ингибирование размножения. Такие эффекты в отношении беспозвоночных паразитических вредителей обеспечивают контроль (в том числе предупреждение, понижение или устранение) паразитического поражения или заражения животного. Примеры беспозвоночных паразитических вредителей, контроль которых осуществляется путем введения паразитоцидно эффективного количества соединения по настоящему изобретению животному, подлежащему защите, включают эктопаразитов (членистоногих, клещей и т. д.) и эндопаразитов (гельминтов, например, нематод, трематод, цестод, колючеголовых и т. д.). В частности, соединения по настоящему изобретению эффективны против эктопаразитов, включающих мух, таких как *Haematobia (Lyperosia) irritans* (жигалка коровья малая), *Stomoxys calcitrans* (жигалка осенняя), *Simulium* spp. (мошки), *Glossina* spp. (мухи цеце), *Hydrotaea irritans* (зубоножка плантационная), *Musca autumnalis* (муха полевая), *Musca domestica* (муха комнатная), *Morellia simplex* (вид рода *Morellia*), *Tabanus* spp. (слепень), *Hypoderma bovis*, *Hypoderma lineatum*, *Lucilia sericata*, *Lucilia cuprina* (мясная муха зеленая), *Calliphora* spp. (мясная муха), *Protophormia* spp., *Oestrus ovis* (овод овечий), *Culicoides* spp. (мокрецы), *Hippobosca equine*, *Gastrophilus instestinalis*, *Gastrophilus haemorrhoidalis* и *Gastrophilus naslis*; вшей, таких как *Bovicola (Damalinia) bovis*, *Bovicola equi*, *Haematopinus asini*, *Felicola subrostratus*, *Heterodoxus spiniger*, *Lignonathus setosus* и *Trichodectes canis*; рунцов, таких как *Melophagus ovinus*; клещей, таких как *Psoroptes* spp., *Sarcoptes scabiei*, *Chorioptes bovis*, *Demodex equi*, *Cheyletiella* spp., *Notoedres cati*, *Trombicula* spp. и *Otodectes cyanotis* (клещи ушные); иксодовых клещей, таких как *Ixodes* spp., *Boophilus* spp., *Rhipicephalus* spp., *Amblyomma* spp., *Dermacentor* spp., *Hyalomma* spp. и *Haemaphysalis* spp.; и блох, таких как *Ctenocephalides felis* (блоха кошачья) и *Ctenocephalides canis* (блоха собачья).

Неагрономические пути применения в ветеринарном секторе осуществляют традиционными способами, такими как кишечное введение в форме, например, таблеток, капсул, напитков, препаратов для обливания, гранулятов, паст, болюсов, процедур посредством питания или суппозиторий; или парентеральное введение, такое как инъекция (в том числе внутримышечная, подкожная, внутривенная, внутрибрюшинная) или импланты; назальное введение; местное введение, например, в форме затопления или погружения, распыления, промывания, нанесения покрытия порошком или применение в отношении небольшого участка животного, и с помощью изделий, таких как шейные ошейники, ушные бирки, пояски на хвост, пояски на конечности или шлейки, которые содержат соединения или композиции по настоящему изобретению.

Как правило, паразитоцидная композиция в соответствии с настоящим изобретением содержит смесь соединения формулы 1, его *N*-оксида или соли с одним или несколькими фармацевтически или ветеринарно приемлемыми носителями, содержащими вспомогательные средства и вспомогательные вещества, выбранные с
5 учетом предполагаемого пути введения (например, перорального, местного или парентерального введения, такого как инъекция) и в соответствии со стандартной практикой. Кроме того, подходящий носитель выбирают на основе совместимости с одним или несколькими активными ингредиентами в композиции, в том числе таких факторов, как стабильность относительно pH и содержание влаги. Следовательно,
10 следует отметить композицию для обеспечения защиты животного от беспозвоночного паразитического вредителя, содержащую паразитоцидно эффективное количество соединения по настоящему изобретению и по меньшей мере один носитель.

Для парентерального введения, включающего внутривенную, внутримышечную
15 и подкожную инъекцию, соединение по настоящему изобретению может быть составлено в виде суспензии, раствора или эмульсии в масляных или водных средах-носителях и может содержать дополнительные средства, такие как суспендирующие, стабилизирующие и/или диспергирующие средства. Фармацевтические композиции для инъекции включают водные растворы водорастворимых форм активных
20 ингредиентов (например, соли активного соединения), предпочтительно в физиологически совместимых буферах, содержащих другие вспомогательные средства и вспомогательные вещества, известные в области фармацевтического составления.

Для перорального введения в форме растворов (наиболее доступная форма для
25 поглощения), эмульсий, суспензий, паст, гелей, капсул, таблеток, болюсов, порошков, гранул, средства, удерживаемого в рубце, и кормовых/водяных блоков/блоков-лизунцов соединение по настоящему изобретению может быть составлено со связующими/наполнителями, известными из уровня техники как подходящие для перорального введения композиций, такими как сахара (например, лактоза, сахароза,
30 маннит, сорбит), крахмал (например, маисовый крахмал, пшеничный крахмал, рисовый крахмал, картофельный крахмал), целлюлоза и производные (например, метилцеллюлоза, карбоксиметилцеллюлоза, этилгидроксицеллюлоза), производные белков (например, зеин, желатин) и синтетические полимеры (например, поливиниловый спирт, поливинилпирролидон). При необходимости можно добавлять
35 смазочные средства (например, стеарат магния), разрыхлители (например, поперечно

сшитый поливинилпирролидинон, агар, альгиновая кислота) и красители или пигменты. Пасты и гели часто также содержат клейкие вещества (например, арабийскую камедь, альгиновую кислоту, бентонит, целлюлозу, ксантановую камедь, коллоидный алюмосиликат магния) для способствования удерживанию композиции в
5 контакте с ротовой полостью и препятствования легкости извлечения.

Если паразитоцидные композиции находятся в форме кормовых концентратов, то носитель, как правило, выбирают из высококачественного корма, кормовых злаков или белковых концентратов. Такие содержащие кормовой концентрат композиции могут, в дополнение к паразитоцидным активным ингредиентам, содержать добавки,
10 улучшающие здоровое состояние или рост животного, улучшающие качество мяса животных, предназначенных для забоя, или другим образом пригодные для животноводческого хозяйства. Такие добавки могут включать, например, витамины, антибиотики, химиотерапевтические средства, бактериостатические факторы, фунгистатические средства, кокцидиостатические средства и гормоны.

Было обнаружено, что соединения по настоящему изобретению обладают благоприятными фармакокинетическими и фармакодинамическими свойствами, обеспечивающими системную доступность после перорального введения и проглатывания. Следовательно, после проглатывания животным, подлежащим защите,
15 паразитоцидно эффективные значения концентрации соединений по настоящему изобретению в кровотоке защищают обработанное животное от кровососущих вредителей, таких как блохи, иксодовые клещи и вши. Следовательно, следует отметить композицию для обеспечения защиты животного от беспозвоночного паразитического вредителя в форме для перорального введения (т. е. содержащую в
20 дополнение к паразитоцидно эффективному количеству соединения по настоящему изобретению один или несколько носителей, выбранных из связующих и наполнителей, подходящих для перорального введения, и носителей, представляющих собой кормовой концентрат).

Составы для местного введения, как правило, находятся в форме порошка, крема, суспензии, спрея, эмульсии, пены, пасты, аэрозоля, мази, бальзама или геля.
30 Более типично, состав для местного применения представляет собой водорастворимый раствор, который может быть представлен в форме концентрата, который разбавляют перед применением. Паразитоцидные композиции, подходящие для местного введения, как правило, содержат соединение по настоящему изобретению и один или несколько подходящих для местного применения носителей. При вариантах
35 применения паразитоцидной композиции местно в отношении внешней части

животного в виде полосы или точки (т. е. "точечная" обработка) активный ингредиент мигрирует по поверхности животного с покрытием его большей части или всей площади внешней поверхности. В результате обработанное животное является особенно защищенным от беспозвоночных вредителей, которые кормятся эпидермисом животного, таких как иксодовые клещи, блохи и вши. Следовательно, составы для местного локализованного введения часто содержат по меньшей мере один органический растворитель для облегчения транспорта активного ингредиента по коже и/или проникания в эпидермис животного. Растворители, обычно применяемые в качестве носителей в таких составах, включают пропиленгликоль, парафины, ароматические соединения, сложные эфиры, такие как изопропилмирилат, гликолевые простые эфиры и спирты, такие как этанол и *n*-пропанол.

Норма внесения, необходимая для эффективного контроля (т. е. "биологически эффективное количество"), будет зависеть от таких факторов, как вид беспозвоночного, подлежащего контролю, жизненный цикл вредителя, его стадия жизни, размер, местонахождение, время года, культура-хозяин или животное-хозяин, пищевое поведение, брачное поведение, влажность окружающей среды, температура и т. д. В нормальных обстоятельствах нормы внесения, составляющие от приблизительно 0,01 до 2 кг активных ингредиентов на гектар, достаточны для контроля вредителей в агрономических экосистемах, но может быть достаточно всего 0,0001 кг/га или может потребоваться до 8 кг/га. Для путей неагрономического применения эффективные нормы применения будут находиться в диапазоне от приблизительно 1,0 до 50 мг/квадратный метр, но может быть достаточно всего 0,1 мг/квадратный метр, или может потребоваться до 150 мг/квадратный метр. Специалист в данной области техники может легко определить биологически эффективное количество, необходимое для требуемого уровня контроля беспозвоночных вредителей.

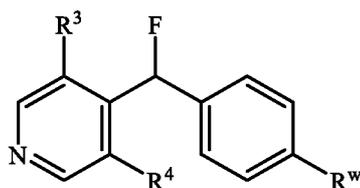
В целом, для ветеринарного применения соединение формулы 1, его *N*-оксид или соль вводят в паразитоцидно эффективном количестве животному, подлежащему защите от беспозвоночных паразитических вредителей. Паразитоцидно эффективное количество представляет собой количество активного ингредиента, необходимое для получения наблюдаемого эффекта, обеспечивающего уменьшение случаев возникновения или активности целевого беспозвоночного паразитического вредителя. Специалист в данной области техники поймет, что паразитически эффективная доза может варьировать для разных соединений и композиций по настоящему изобретению, требуемого паразитического эффекта и продолжительности, вида

целевого беспозвоночного вредителя, животного, подлежащего защите, механизма применения и т. п., и количество, необходимое для получения конкретного результата, может быть определено посредством простого экспериментирования.

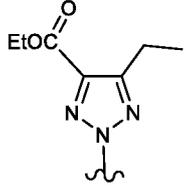
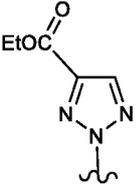
5 Для перорального введения гомойотермным животным суточная доза соединения по настоящему изобретению, как правило, находится в диапазоне от приблизительно 0,01 мг/кг до приблизительно 100 мг/кг, более типично от приблизительно 0,5 мг/кг до приблизительно 100 мг/кг веса тела животного. Для местного (например, кожного) введения средства для погружения и спреи, как правило, содержат от приблизительно 0,5 ppm до приблизительно 5000 ppm, более
10 типично от приблизительно 1 ppm до приблизительно 3000 ppm соединения по настоящему изобретению.

Конкретные соединения формулы 1, полученные с помощью способов и вариаций, описанных на предыдущих схемах 1-11 и примерах синтеза 1-2, показаны в таблицах индексов А и В ниже. См. таблицу индексов С для данных 1Н ЯМР. В случае
15 массовых спектральных (MS) данных указанное числовое значение представляет собой молекулярную массу наиболее распространенного изотопа исходного иона (M+1), образованного путем добавления H⁺ (молекулярная масса 1) к молекуле, наблюдаемого с помощью масс-спектрометрии с применением химической ионизации при атмосферном давлении (AP⁺). В следующей таблице индексов применяются
20 следующие сокращения. Соед. означает соединение, *t* означает третичный, *c* означает цикло, Me означает метил, Et означает этил, Pr означает пропил, *i*-Pr означает изопропил, Bu означает бутил, *c*-Pr означает циклопропил, *c*-Pn означает циклопентил, *c*-Hx означает циклогексил, *t*-Bu означает *третичный* бутил, Ph означает фенил, OMe означает метокси, SMe означает метилтио, и SO₂Me означает метилсульфонил.
25 Волнистая линия в структурном фрагменте означает точку присоединения фрагмента к остальной части молекулы. Сокращение "пр." означает "пример", и за ней следует число, указывающее, в каком примере синтеза получено соединение.

ТАБЛИЦА ИНДЕКСОВ А



<u>№</u> <u>соед.</u>	<u>R</u> ³	<u>R</u> ⁴	<u>R</u> ^w	<u>Данные</u> <u>MS</u>
1	F	Пиразол-1-ил	-SCF ₃	372
2	F	1H-1,2,4-триазол-1-ил	-SCF ₃	373
3	F	2H-1,2,3-триазол-2-ил	-SCF ₃	373
4	F	3-(Трифторметил)-1H- пиразол-1-ил	-SCF ₃	440
5	F	3-Метил-1H-пиразол-1- ил	-SCF ₃	386
6	F	4-Метил-1H-пиразол-1- ил	-SCF ₃	386
7	F	1H-1,2,4-триазол-1-ил	-SCF ₃	357
8	F	2H-1,2,3-триазол-2-ил	-OCF ₃	357
9	H	2H-1,2,3-триазол-2-ил	-OCF ₃	339
10	H	1H-1,2,3-триазол-1-ил	-OCF ₃	339
11	H	Пиразол-1-ил	-OCF ₃	338
12	H	1H-1,2,4-триазол-1-ил	-OCF ₃	339
13	H	2H-1,2,3-триазол-2-ил	-OCF ₂ CHF ₂	389
14	Cl	2H-1,2,3-триазол-2-ил	-OCF ₃	373
15	Cl	1H-1,2,4-триазол-1-ил	-OCF ₃	373
17	Br	2H-1,2,3-триазол-2-ил	-OCF ₃	417
18	F	1H-1,2,4-триазол-1-ил	-CF ₃	341
19	F	2H-1,2,3-триазол-2-ил	-OCF ₃	369
20	F	2H-1,2,3-триазол-2-ил	-CF ₃	341
21	F	Пиразол-1-ил	-CF ₃	340
22	F	Фуран-2-ил	-OCF ₃	356
23	F	Фуран-3-ил	-OCF ₃	356
24	Cl	2λ ² -Тетразол-5-ил	-OCF ₃	374

25	F	1-Метил-1 <i>H</i> -имидазол-2-ил	-OCF ₃	370
26	F	1 <i>H</i> -Пиррол-2-ил	-OCF ₃	355
27	Br		-OCF ₃	517
28	Br		-OCF ₃	489
29	Br	4,5-Дибром-2 <i>H</i> -1,2,3-триазол-2-ил	-OCF ₃	*
30	F	1,3,4-Оксадиазол-2-ил	-OCF ₃	358
31	F	5-Метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил	-OCF ₃	372
32	F	Оксазол-2-ил	-OCF ₃	357
33	F	Тиазол-2-ил	-OCF ₃	373
34	F	Оксазол-5-ил	-OCF ₃	357
35	-OMe	Оксазол-5-ил	-OCF ₃	369
36	F	Тиазол-2-ил	-OCF ₃	*
38	Me	2 <i>H</i> -1,2,3-триазол-2-ил	-OCF ₃	353
39	F	3-Метил-1,2,4-оксадиазол-5-ил	-OCF ₃	*
40	F	1 <i>H</i> -1,2,4-триазол-3-ил	-OCF ₃	357
41	F	Изоксазол-5-ил	-OCF ₃	357
42	F	1 <i>H</i> -Пиразол-5-ил	-OCF ₃	357
43	F	2 <i>H</i> -1,2,3-триазол-2-ил	- C(OMe)(CF ₃) ₂	453
44	F	1-Этил-1 <i>H</i> -пиразол-4-ил	-OCF ₃	384
45	F	Тиофен-2-ил	-OCF ₃	372
46	F	Тиофен-3-ил	-OCF ₃	372
47	Me	1 <i>H</i> -1,2,3-триазол-1-ил	-OCF ₃	353
48	CN	2 <i>H</i> -1,2,3-триазол-2-ил	-OCF ₃	*
49	F	Тиазол-4-ил	-OCF ₃	373

50	Cl	Тиазол-2-ил	-OCF ₃	389
51	Cl	Оксазол-2-ил	-OCF ₃	373
53	<i>ц</i> - Пропил	2 <i>H</i> -1,2,3-триазол-2-ил	-OCF ₃	379
54	F	2 <i>H</i> -1,2,3-триазол-2-ил	-SO ₂ CF ₃	405
55	F	1-Этил-1 <i>H</i> -пиразол-5-ил	-OCF ₃	384
56	F	1-Изопропил-1 <i>H</i> - пиразол-4-ил	-OCF ₃	398
57	F	1-Этил-1 <i>H</i> -пиразол-3-ил	-OCF ₃	384
58	F	1-(2,2,2-Трифторэтил)- 1 <i>H</i> -пиразол-4-ил	-OCF ₃	438
59	F	1-Метил-1 <i>H</i> -пиразол-3- ил	-OCF ₃	370
60	Cl	Оксазол-5-ил	-OCF ₃	373
61	F	4 <i>H</i> -1,2,4-триазол-4-ил	-SCF ₃	372
62	F	1-Изопропил-1 <i>H</i> - пиразол-3-ил	-OCF ₃	398
63	F	1-(2,2,2-Трифторэтил)- 1 <i>H</i> -пиразол-3-ил	-OCF ₃	438
64	Br	2 <i>H</i> -1,2,3-триазол-2-ил	-SO ₂ CF ₃	465
67	F	2 <i>H</i> -1,2,3-триазол-2-ил	-SOCF ₃	389
68	H	1 <i>H</i> -1,2,3-триазол-1-ил	-SCF ₃	355
69	H	2 <i>H</i> -1,2,3-триазол-2-ил	-SCF ₃	355
73	F	Пиразол-1-ил	-SOCF ₃	388
77	F	Тиазол-2-ил	-SCF ₃	389
78	F	Оксазол-2-ил	-SCF ₃	373
85	Br	Пиразол-1-ил	-SCF ₃	432
86	Br	2 <i>H</i> -1,2,3-триазол-2-ил	-SCF ₃	433
87	Br	1 <i>H</i> -1,2,3-триазол-1-ил	-SCF ₃	433
88	Cl	Пиразол-1-ил	-OCF ₃	372
89	Cl	2 <i>H</i> -1,2,3-триазол-2-ил	-SCF ₃	389
90	Cl	2 <i>H</i> -1,2,3-триазол-2-ил	-SO ₂ CF ₃	405
91	Cl	2 <i>H</i> -1,2,3-триазол-2-ил	-SO ₂ CF ₃	421
92	F	2 <i>H</i> -1,2,3-триазол-2-ил	Br	351
93	F	3-Метил-1,2,4-	SCF ₃	388

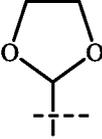
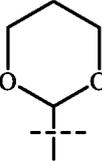
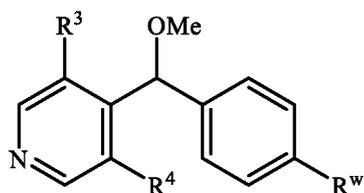
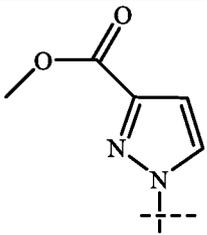
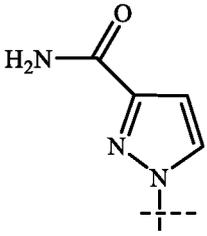
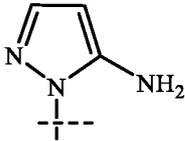
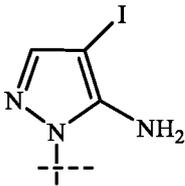
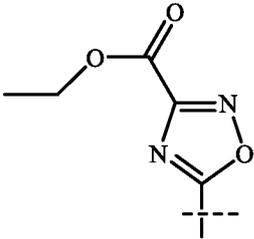
		оксадиазол-5-ил		
94	F	3-Метил-1,2,4- оксадиазол-5-ил	SOCF3	404
95	I	2 <i>H</i> -1,2,3-триазол-2-ил	SCF3	481
96	F		SCF3	378
97	I	2 <i>H</i> -1,2,3-триазол-2-ил	SOCF3	497
98	F		SCF3	392
99	I	2 <i>H</i> -1,2,3-триазол-2-ил	CF2H	431
100	F	Оксазол-5-ил	SCF3	373
101	F	Оксазол-5-ил	SOCF3	389
102	Cl	Пиразол-1-ил	SCF3	388
103	Cl	3-Метил-1,2,4- оксадиазол-5-ил	SCF3	404
104	Cl	3-Метил-1,2,4- оксадиазол-5-ил	SOCF3	420
105	Cl	Оксазол-5-ил	SCF3	389
106	Cl	1,2,4-Оксадиазол-5-ил	SCF3	390
107	Cl	Оксазол-5-ил	SOCF3	405
108	Br	2 <i>H</i> -1,2,3-триазол-2-ил	t-Bu	389
109	Cl	2 <i>H</i> -1,2,3-триазол-2-ил	Br	367
110	Cl	2 <i>H</i> -1,2,3-триазол-2-ил	t-Bu	345
111	F	Тиофен-2-ил	SCF3	388
112	F	Тиофен-2-ил	SCF3	388
113	F	2-Метилтиофен-3-ил	SCF3	402
114	F	3-Метилтиофен-4-ил	SCF3	402
115	F	4-Метил-2 <i>H</i> -1,2,3- триазол-2-ил	SCF3	387
116	F	4-Метил-1 <i>H</i> -1,2,3- триазол-1-ил	SCF3	387

ТАБЛИЦА ИНДЕКСОВ В



<u>№</u> <u>соед.</u>	<u>R³</u>	<u>R⁴</u>	<u>R^w</u>	<u>Данные MS</u>
16	Cl	2H-1,2,3-триазол-2-ил	-OCF ₃	385
37	F	Пиразол-1-ил	-OCF ₃	368
52	Cl	Пиразол-1-ил	-OCF ₃	384
65	Br	2H-1,2,3-триазол-2-ил	-OCF ₃	429
66	Br	Пиразол-1-ил	-OCF ₃	428
70	F	Пиразол-1-ил	-SCF ₃	384
71	F	1H-1,2,4-триазол-1-ил	-SCF ₃	385
72	F	Пиразол-1-ил	-SOCF ₃	400
74	F	1H-1,2,4-триазол-1-ил	-SOCF ₃	401
75	F	Тиазол-2-ил	-SCF ₃	401
76	F	Оксазол-2-ил	-SCF ₃	385
79	F	5-Метил-1,2,4-оксадиазол-3-ил	-SCF ₃	400
80	F	2,5-Дигидро-5-оксо-1,2,4-оксадиазол-3-ил	-SCF ₃	402
81	F	5-Трифторметил-1,2,4-оксадиазол-3-ил	-SCF ₃	454
82	F	3-Метил-5-изоксазол-ил	-SCF ₃	399
83	F	1,2,4-Оксадиазол-3-ил	-SCF ₃	386
84	F	2,5-Дигидро-5-тиоксо-1,2,4-оксадиазол-3-ил	-SCF ₃	418
117	F	2H-1,2,3-триазол-2-ил	Br	363
118	F	2H-1,2,3-триазол-2-ил	SCF ₂ H	367
119	I	Пиразол-1-ил	SCF ₃	492
120	I	2H-1,2,3-триазол-2-ил	SCF ₃	493
121	F	3-Нитрилпиразол-1-ил	SCF ₃	409

122	F		SCF3	442
123	F	2 <i>H</i> -1,2,3-триазол-2-ил	SCF3	385
124	F	2 <i>H</i> -1,2,3-триазол-2-ил	OCF3	369/ <i>S</i> -энантиомер**
125	F	2 <i>H</i> -1,2,3-триазол-2-ил	OCF3	369/ <i>R</i> -энантиомер
126	Cl	1 <i>H</i> -1,2,3-триазол-1-ил	OCF3	385
127	Cl	2 <i>H</i> -1,2,3-триазол-2-ил	SCF3	401
128	Cl	1 <i>H</i> -1,2,3-триазол-1-ил	SCF3	401
129	I	2 <i>H</i> -1,2,3-триазол-2-ил	OCF3	477
130	Cl	2 <i>H</i> -1,2,3-триазол-2-ил	SCF3	401/ <i>R</i> -энантиомер
131	Cl	2 <i>H</i> -1,2,3-триазол-2-ил	SCF3	401/ <i>S</i> -энантиомер
132	F		SCF3	
133	Br	2 <i>H</i> -1,2,3-триазол-2-ил	SCF3	445
134	Br	1 <i>H</i> -1,2,3-триазол-1-ил	SCF3	445
135	F	3-Метил-1,2,4-оксадиазол-5-ил	SCF3	400
136	F		SCF3	399
137	F	3-Метил-1,2,4-оксадиазол-5-ил	OCF3	384
138	F	1,2,4-Оксадиазол-5-ил	OCF3	370
139	F	1,2,4-Оксадиазол-5-ил	<i>t</i> -Bu	342
140	F		SCF3	525

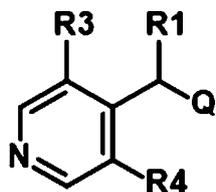
141	F	2 <i>H</i> -1,2,3-триазол-2-ил	OCH ₃	315
142	Cl	3-Метил-1,2,4-оксадиазол-5-ил	OCF ₃	400
143	F	4-Метил-2 <i>H</i> -1,2,3-триазол-2-ил	SCF ₃	399
144	Cl		OCF ₃	458
145	H	2 <i>H</i> -1,2,3-триазол-2-ил	OCF ₃	351
146	Cl	3-Метил-1,2,4-оксадиазол-5-ил	SCF ₃	416

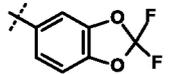
**[α]₂₅ = +153,54°

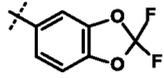
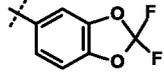
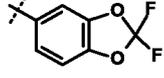
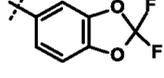
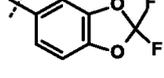
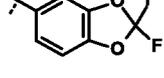
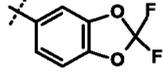
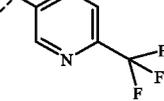
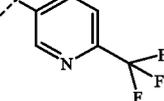
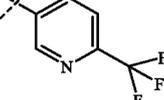
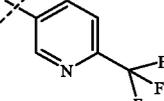
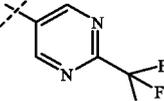
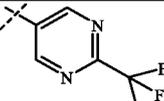
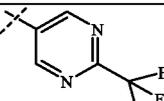
[C=0,30%, МЕОН]

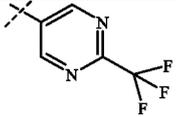
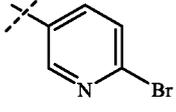
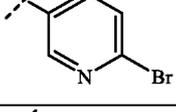
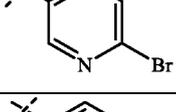
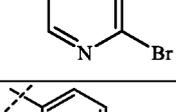
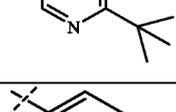
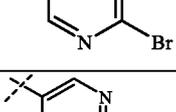
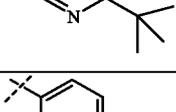
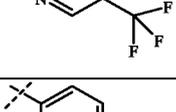
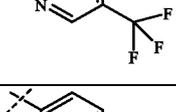
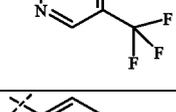
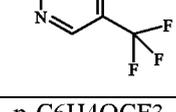
ТАБЛИЦА ИНДЕКСОВ С

5



№ соед.	A	R4	R1	Q	Данные MS
147	C-Br	2 <i>H</i> -1,2,3-триазол-2-ил	F		414

148	C-Br	1 <i>H</i> -1,2,3-триазол-1-ил	F		414
149	C-Cl	1 <i>H</i> -1,2,3-триазол-1-ил	F		369
150	C-Cl	2 <i>H</i> -1,2,3-триазол-2-ил	F		369
151	C-F	Пиразол-1-ил	F		352
152	C-F	2 <i>H</i> -1,2,3-триазол-2-ил	F		353
153	C-Cl	Пиразол-1-ил	F		367
154	C-F	Пиразол-1-ил	OEt	p-C ₆ H ₄ OCF ₃	*
155	C-F	Пиразол-1-ил	OMe		*
156	C-F	Пиразол-1-ил	F		341
157	C-F	Пиразол-1-ил	OMe		353
158	C-F	2 <i>H</i> -1,2,3-триазол-2-ил	OMe		354
159	C-F	2 <i>H</i> -1,2,3-триазол-2-ил	OMe		342
160	C-F	Пиразол-1-ил	OMe		354
161	C-F	2 <i>H</i> -1,2,3-триазол-2-ил	OMe		355
162	C-F	Пиразол-1-ил	F		342

163	C-F	2H-1,2,3-триазол-2-ил	F		343
164	C-F	Пиразол-1-ил	OMe		363
165	C-F	Пиразол-1-ил	F		351
166	C-F	2H-1,2,3-триазол-2-ил	F		352
167	C-F	2H-1,2,3-триазол-2-ил	OMe		364
168	C-Cl	2H-1,2,3-триазол-2-ил	F		346
169	C-Cl	2H-1,2,3-триазол-2-ил	F		368
170	C-Cl	2H-1,2,3-триазол-2-ил	F		347
171	C-F	Пиразол-1-ил	F		341
172	C-F	2H-1,2,3-триазол-2-ил	F		342
173	C-F	Пиразол-1-ил	OMe		353
174	C-F	2H-1,2,3-триазол-2-ил	OMe		354
175	N	2H-1,2,3-триазол-2-ил	OMe	p-C6H4OCF3	352
176	N	Пиразол-1-ил	OMe	p-C6H4OCF3	353
177	N	Пиразол-1-ил	OMe	p-C6H4CF3	335

* См. таблицу индексов D для данных ^1H ЯМР.

ТАБЛИЦА ИНДЕКСОВ D

№ соедин.	Данные ¹ H ЯМР (раствор CDCl ₃ , если не указано иное) ^a
29	δ 8,62 (s, 1H), 8,45 (s, 1H), 7,49 (d, 2H), 7,25 (d, 2H), 6,95 (d, 1H).
36	δ 8,80 (s, br. 1H), 8,55 (s, br. 1H), 8,01 (d, 1H), 7,63 (d, 2H), 7,56 (d, 1H), 7,55 (d, 1H), 7,22 (d, 1H).
39	δ 9,13 (s, 1H), 8,68 (s, 1H), 7,71 (d, 1H), 7,56 (d, 1H), 7,23 (d, 1H), 2,52 (s, 3H).
48	δ 9,29 (s, 1H), 8,99 (s, 1H), 7,96 (s, 2H), 7,44 (d, 2H), 7,40 (d, 1H), 7,23 (d, 1H).
154	δ 8,50 (s, 1H), 8,47 (s, 1H), 7,78 (s, 1H), 7,68 (s, 1H), 7,44 (d, 2H), 7,14 (d, 2H), 6,51 (s, 1H), 5,69 (s, 1H), 3,47 (q, 2H), 1,19 (t, 3H).
155	δ ppm 3,32 (s, 3 H), 5,55 (s, 1 H), 6,55 (s, 1 H), 6,97 (d, J=8,35 Гц, 1 H), 7,10 (d, J=8,05 Гц, 1 H), 7,25 - 7,28 (m, 1 H), 7,70 (d, J=2,57 Гц, 1 H), 7,82 (s, 1 H), 8,47 (s, 1 H), 8,51 (s, 1 H).

^a Данные ¹H ЯМР приведены в ppm со слабопольным сдвигом от тетраметилсилана. Образование пар обозначено с помощью (s)-синглет, (d)-дублет, (t)-триплет, (m)-мультиплет, (dd)-дублет дублетов, (dt)-дублет триплетов, (br s)-широкий синглет, (br t)-широкий триплет.

5

Следующие тесты демонстрируют эффективность контроля конкретных вредителей с применением соединений по настоящему изобретению. "Эффективность контроля" представляет собой подавление развития беспозвоночных вредителей (в том числе смертность), которое вызывает в значительной степени сниженную способность к кормлению. Контроль защиты от вредителя, предоставляемый соединениями, однако, не ограничен этими видами. См. таблицы индексов А и В для описаний соединений.

10

БИОЛОГИЧЕСКИЕ ПРИМЕРЫ

Методика составления и опрыскивания для тестов А-Н

15

Тестируемые соединения составляли с применением раствора, содержащего 10% ацетона, 90% воды и 300 ppm Activator 90®, неионогенного поверхностно-активного вещества (Loveland Products, Лавленд, Колорадо, США). Составленные соединения применяли в виде 1 мл жидкости посредством форсунки в положении 1,27 см (0,5 дюйма) над верхней частью каждого тестируемого образца. Тестируемые соединения распыляли при указанных нормах и каждый тест повторяли три раза.

20

Тест А

Для оценки контроля капустной моли (*Plutella xylostella* (L.)) тестируемый образец состоял из небольшого открытого контейнера с 12-14-дневным растением горчицы внутри. Его предварительно заражали ~50 новорожденными личинками, которые помещали в тестируемый образец с помощью крупного зерна из кукурузных початков с применением инокулятора. Личинки перемешались на тестируемое растение после помещения в тестируемый образец.

Тестируемые соединения составляли и распыляли при 250 ppm. После распыления составленного тестируемого соединения обеспечивали высыхание каждого тестируемого образца в течение 1 часа и затем сверху закрывали черной крышкой с сеткой. Тестируемые образцы выдерживали в течение 6 дней в камере для выращивания при 25°C и относительной влажности 70%. Затем визуально оценивали повреждение растения, нанесенное насекомыми при питании, на основании количества поглощенных листьев, и личинок оценивали в отношении смертности.

Из протестированных при 250 ppm соединений формулы 1 следующие обеспечивали уровни эффективности контроля от очень хорошего до отличного (40% или менее повреждений, наносимых насекомыми при питании, и/или 100% смертность): 1, 3, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 29, 30, 32, 33, 34, 36, 39, 45, 48, 50, 51, 53, 55, 59, 60, 78, 89, 92, 100, 103, 104, 105, 118, 120, 123, 125, 130, 133, 147, 155, 162, 166, 171, 172, 175.

Тест В

Для оценки контроля цикадки кукурузной (*Peregrinus maidis* (Ashmead)) посредством контактных и/или системных способов тестируемый образец состоял из небольшого открытого контейнера с 3-4-дневным растением кукурузы (маиса) внутри.

Перед внесением тестируемого соединения поверх почвы добавляли белый песок.

Тестируемые соединения составляли и распыляли при 250 и/или 50 ppm и/или 10 ppm. После распыления составленного тестируемого соединения обеспечивали высыхание тестируемых образцов в течение 1 ч., после чего их заражали после обработки ~15-20 нимфами (возраст 18-21 дней). Черную крышку с сеткой помещали на верхнюю часть каждого тестируемого образца и тестируемые образцы выдерживали в течение 6 дней в камере для выращивания при 22-24°C и относительной влажности 50-70%. Затем каждый тестируемый образец визуально оценивали в отношении смертности насекомых.

Из протестированных при 250 ppm соединений формулы 1 следующие приводили к по меньшей мере 80% смертности: 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14,

15, 16, 17, 18, 20, 21, 22, 23, 25, 26, 30, 31, 32, 33, 34, 36, 37, 38, 39, 49, 67, 69, 70, 75, 76, 77, 78, 79, 81, 82, 83, 85, 86, 88, 89, 90, 92, 93, 94, 95, 96, 98, 103, 104, 105, 106, 108, 109, 110, 111, 112, 113, 114, 120, 123, 125, 127, 130, 138, 139, 147, 156, 157, 158, 159, 161, 163, 166, 168, 169, 170, 172, 173, 174, 175.

5 Из протестированных при 50 ppm соединений формулы 1 следующие приводили к по меньшей мере 80% смертности: 1, 2, 3, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 25, 26, 29, 30, 31, 32, 33, 34, 36, 37, 38, 39, 40, 41, 43, 45, 46, 48, 49, 50, 51, 55, 56, 57, 62, 63, 64, 65, 67, 69, 70, 76, 77, 78, 79, 83, 85, 86, 88, 89, 90, 92, 93, 94, 95, 96, 98, 103, 104, 105, 106, 108, 109, 110, 111, 112, 113, 114, 120, 123,
10 125, 127, 130, 138, 139, 147, 156, 157, 158, 159, 161, 163, 166, 168, 169, 170, 172, 173, 174, 175.

Из протестированных при 10 ppm соединений формулы 1 следующие приводили к по меньшей мере 80% смертности: 22, 30, 32, 33, 38, 41, 43, 45, 46, 48, 49, 50, 51, 62, 69, 70, 78, 89, 92, 93, 94, 95, 96, 98, 103, 106, 109, 110, 111, 112, 113, 114, 123,
15 125, 127, 130, 147, 156, 159, 163, 169, 172, 173, 174.

Тест С

Для оценки контроля цикадки картофельной (*Empoasca fabae* (Harris)) посредством контактных и/или системных способов тестируемый образец состоял из небольшого открытого контейнера с 5-6-дневным растением фасоли сорта Soleil
20 (появились первичные листья) внутри. Поверх почвы добавляли белый песок и перед внесением тестируемого соединения отрезали один из первичных листьев.

Тестируемые соединения составляли и распыляли при 250 ppm. После распыления составленного тестируемого соединения обеспечивали высыхание тестируемых образцов в течение 1 часа, после чего их заражали после обработки 5
25 цикадками картофельными (взрослые особи возрастом 18-21 дней). Черную крышку с сеткой помещали на верхнюю часть тестируемого образца и тестируемые образцы выдерживали в течение 6 дней в камере для выращивания при 20°C и относительной влажности 70%. Затем каждый тестируемый образец визуально оценивали в отношении смертности насекомых.

30 Из протестированных при 250 ppm соединений формулы 1 следующие приводили к по меньшей мере 80% смертности: 4, 8, 9, 11, 14, 21, 32, 33, 36, 37, 69.

Тест D

Для оценки контроля тли персиковой зеленой (*Myzus persicae* (Sulzer)) посредством контактных и/или системных способов тестируемый образец состоял из

небольшого открытого контейнера с 12-15-дневным растением редиса внутри. Его предварительно заражали посредством помещения на лист тестируемого растения 30-40 тлей на части листа, отрезанного от культурного растения (способ с отрезанием листа). Тли перемещались на тестируемое растение по мере высыхания части листа.

5 После предварительного заражения почву с тестируемым образцом покрывали слоем песка.

Тестируемые соединения составляли и распыляли при 250 и/или 50 ppm. После распыления составленного тестируемого соединения обеспечивали высыхание каждого тестируемого образца в течение 1 часа и затем сверху закрывали черной
10 крышкой с сеткой. Тестируемые образцы выдерживали в течение 6 дней в камере для выращивания при 19-21°C и относительной влажности 50-70%. Затем каждый тестируемый образец визуально оценивали в отношении смертности насекомых.

Из протестированных при 250 ppm соединений формулы 1 следующие приводили к по меньшей мере 80% смертности: 1, 2, 3, 5, 7, 8, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17,
15 18, 19, 20, 21, 22, 23, 25, 29, 30, 34, 36, 37, 38, 39, 48, 54, 67, 68, 69, 70, 71, 72, 74, 77, 78, 79, 81, 83, 86, 87. 1, 2, 3, 5, 7, 8, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 25, 29, 30, 34, 36, 37, 38, 39, 48, 54, 67, 68, 69, 70, 71, 72, 74, 77, 78, 79, 81, 83, 86, 87, 88, 89, 90, 91, 93, 94, 95, 96, 97, 103, 104, 118, 123, 125, 127, 130, 147, 159, 163.

20 Из протестированных при 50 ppm соединений формулы 1 следующие приводили к по меньшей мере 80% смертности: 2, 3, 7, 8, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 29, 34, 39, 48, 54, 67, 69, 71, 74, 78, 86, 89, 90, 91, 93, 94, 95, 103, 104, 118, 123, 125, 127, 130, 147, 159.

25

Тест Е

Для оценки контроля хлопковой бахчевой тли (*Aphis gossypii* Glover) посредством контактных и/или системных способов тестируемый образец состоял из небольшого открытого контейнера с 5-дневным растением окры внутри. Его
30 предварительно заражали 30-40 насекомыми на части листа в соответствии со способом с отрезанием листа и почву тестируемого образца покрывали слоем песка.

Тестируемые соединения составляли и распыляли при 250 и/или 50 ppm. После опрыскивания тестируемые образцы выдерживали в камере для выращивания растений в течение 6 дней при 19°C и относительной влажности 70%. Затем каждый тестируемый образец визуально оценивали в отношении смертности насекомых.

Из протестированных при 250 ppm соединений формулы 1 следующие приводили к по меньшей мере 80% смертности: 1, 2, 3, 7, 8, 9, 11, 12, 14, 16, 17, 19, 20, 21, 22, 29, 32, 33, 34, 36, 37, 38, 39, 41, 45, 49, 50, 51, 52, 54, 56, 57, 59, 60, 62, 64, 67, 68, 69, 70, 71, 72, 73, 74, 75, 76, 77, 78, 79, 83, 84, 85, 86, 88, 89, 90, 91, 92, 93, 94, 95, 96, 97, 5 100, 102, 103, 104, 105, 106, 109, 111, 112, 113, 118, 123, 125, 127, 130, 133, 147, 148, 154, 156, 157, 158, 159, 160, 161, 163, 166, 169, 171, 172, 174, 175, 176.

Из протестированных при 50 ppm соединений формулы 1 следующие приводили к по меньшей мере 80% смертности: 1, 3, 8, 9, 11, 12, 14, 16, 17, 19, 20, 21, 22, 29, 32, 33, 34, 36, 37, 38, 39, 45, 50, 51, 54, 67, 68, 69, 70, 71, 73, 74, 76, 78, 83, 85, 86, 88, 89, 90, 10 91, 92, 93, 94, 95, 96, 97, 100, 102, 103, 104, 105, 106, 109, 111, 112, 113, 118, 123, 125, 127, 130, 133, 147, 148, 154, 156, 157, 158, 159, 160, 161, 163, 166, 169, 171, 172, 174, 175, 176.

Тест F

15 Для оценки контроля белокрылки бататовой (*Bemisia tabaci* (Gennadius)) посредством контактных и/или системных способов тестируемый образец состоял из небольшого открытого контейнера с 12-14-дневным растением хлопчатника внутри. Перед применением спрея обе семядоли удаляли с растения, оставляя один настоящий листок для анализа. Обеспечивали откладывание яиц взрослыми особями белокрылок 20 на растение, а затем их удаляли с тестируемого образца. Растения хлопчатника, зараженные по меньшей мере 15 яйцами, подвергали испытанию с опрыскиванием.

Тестируемые соединения составляли и распыляли при 250 и/или 50 ppm. После опрыскивания обеспечивали высыхание тестируемых образцов в течение 1 часа. Затем цилиндры удаляли и образцы переносили в камеру для выращивания и выдерживали в 25 течение 13 дней при 28°C и относительной влажности 50-70%. Затем каждый тестируемый образец визуально оценивали в отношении смертности насекомых.

Из протестированных при 250 ppm соединений формулы 1 следующие приводили к по меньшей мере 70% смертности: 1, 3, 12, 13, 14, 15, 17, 19, 29, 36, 37, 39, 67, 69, 71, 78, 88, 89, 90, 91, 92, 93, 94, 95, 108, 109, 117, 118, 120, 123, 125, 127, 133, 30 134, 147, 155, 156, 168, 172.

Из протестированных при 50 ppm соединений формулы 1 следующие приводили к по меньшей мере 70% смертности: 1, 13, 14, 19, 69, 71, 78, 88, 89, 90, 91, 92, 93, 94, 95, 108, 109, 117, 118, 120, 123, 125, 127, 133, 134, 147, 155, 156, 168, 172.

Тест G

Для оценки контроля западного цветочного трипса (*Frankliniella occidentalis* Pergande) посредством контактных и/или системных способов тестируемый образец состоял из небольшого открытого контейнера с 5-7-дневным растением фасоли сорта Soleil внутри.

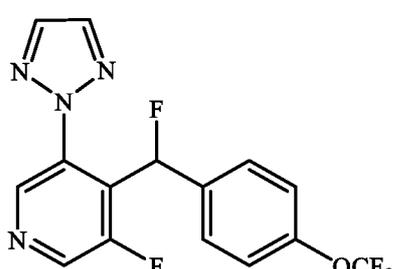
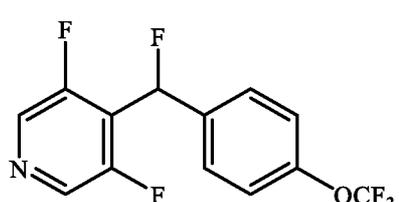
Тестируемые соединения составляли и распыляли при 250 ppm. После опрыскивания обеспечивали высыхание тестируемых образцов в течение 1 часа и затем к каждому образцу добавляли приблизительно 60 трипсов (взрослых особей и нимфы). Черную крышку с сеткой помещали сверху и тестируемые образцы выдерживали в течение 6 дней при 25°C и относительной влажности 45-55%. Затем каждый тестируемый образец визуально оценивали в отношении повреждения растения и смертности насекомых.

Из протестированных при 250 ppm соединений формулы 1 следующие обеспечивали уровни эффективности контроля от очень хорошего до отличного (30% или менее повреждений растения и/или 100% смертность): 1, 19, 29, 32, 33, 36, 41, 50.

ДОПОЛНИТЕЛЬНЫЙ ПРИМЕРЭффективность контроля и давление паров

Значения эффективности контроля и давление паров для соединений 8 и А показаны в дополнительной таблице 1.

Дополнительная таблица 1

Соединение		8				А			
Структура									
Эффективность контроля		СМА	GPA	СРН	PLH	СМА	GPA	СРН	PLH
	250 ppm	80	100	100	93	72	L	92	L
	50 ppm	96	100	100	0	67	L	100	L
	10 ppm	88	94	95				53	
	2 ppm	79	100	89				4	
Давление паров		6,04E-06				1,45E-03			

СМА представляет собой тлю хлопковую бахчевую; GPA представляет собой тлю персиковую зеленую; CPH представляет собой цикадку кукурузную; PLH представляет собой цикадку картофельную.

5 Протоколы испытания для эффективности контроля для обоих соединений являются такими, как описано в разделе "Биологические примеры".

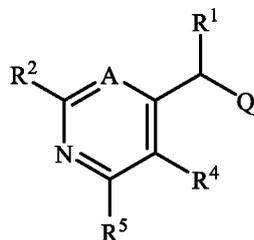
Процедуры для получения значений давления паров для обоих соединений были следующими.

10 Получали раствор тестируемого соединения в ацетонитриле при концентрации 50 мкг/мл, а затем анализировали с помощью газовой хроматографии/масс-спектрометрии (GC/MS). Применяли линейную корреляцию значений времени удерживания относительно известных значений давления паров стандартных соединений с получением расчетного значения давления паров тестируемых соединений путем применения интерполяции. Обнаружение и время удерживания заявляемых соединений подтверждали путем интерпретации массового спектра.

15 Неожиданно результаты показывают, что соединение **8** по настоящему изобретению демонстрирует в значительной степени большую эффективность контроля, чем соединение **A**, в отношении видов СМА, GPA и CPН при не менее чем 2 ppm и PLH при 250 ppm. Результаты также показывают, что давление паров соединения **8** является значительно ниже, чем таковое для соединения **A**, почти в 1000
20 раз ниже. Следует отметить, что единственное структурное отличие между соединениями **8** и **A** состоит в том, что соединение **8** формулы **1** в качестве R⁴ содержит 5-членное гетероциклическое кольцо триазол-1-ил, тогда как соединение **A** в качестве R⁴ содержит F, что исключает соединение **A** из объема настоящего изобретения. Без привязки к этой теории предполагается, что R⁴ в виде
25 гетероциклического кольца, обеспечивающего меньшую летучесть соединения, может по меньшей мере частично объяснять более высокую эффективность контроля.

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Соединение, выбранное из формулы 1, его *N*-оксиды или соль,



1

5 где

R^1 представляет собой F, OR^6 или $S(O)_nR^6$;

A представляет собой N или CR^3 ;

R^2 представляет собой H, галоген, CN, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_3 -
 C_4 циклоалкил, C_3 - C_4 галогенциклоалкил, C_1 - C_4 алкокси или C_1 -

10

C_4 галогеналкокси;

R^3 представляет собой H, галоген, CN, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_3 -
 C_4 циклоалкил, C_3 - C_4 галогенциклоалкил, C_1 - C_4 алкокси или C_1 -

C_4 галогеналкокси;

R^4 представляет собой 5-6-членное гетероциклическое кольцо, при этом каждое
 15 кольцо содержит члены кольца, выбранные из атомов углерода и от 1 до 4
 гетероатомов, независимо выбранных из не более чем 2 атомов O, не более
 чем 2 атомов S и не более чем 4 атомов N, при этом не более чем 2 члена
 кольца независимо выбраны из $C(=O)$, $C(=S)$, $S(=O)$ и $S(=O)_2$, при этом
 каждое кольцо необязательно замещено не более чем 5 заместителями,

20

независимо выбранными из R^v , и г представляет собой количество
 заместителей;

каждый R^v независимо представляет собой H, циано, галоген, C_1 - C_6 алкил, C_1 -
 C_6 алкокси, C_1 - C_6 галогеналкокси, C_1 - C_6 галогеналкил, C_2 - C_6 алкенил, C_2 -
 C_6 галогеналкенил, C_2 - C_6 алкинил, C_2 - C_6 галогеналкинил, C_3 - C_6 циклоалкил,

25

C_3 - C_6 галогенциклоалкил, C_2 - C_6 цианоалкил, C_1 - C_6 гидроксиалкил, C_4 -
 C_{10} алкилциклоалкил, C_4 - C_{10} циклоалкилалкил, C_3 - C_6 циклоалкенил, C_3 -
 C_6 галогенциклоалкенил, C_2 - C_6 алкоксиалкил, C_4 - C_{10} циклоалкоксиалкил, C_3 -

- C_{10} алкоксиалкоксиалкил, C_2 - C_6 алкилтиоалкил, C_2 - C_6 алкилсульфинилалкил,
 C_3 - C_6 циклоалкокси, C_3 - C_6 галогенциклоалкокси, C_4 - C_{10} циклоалкилалкокси,
 C_2 - C_6 алкенилокси, C_2 - C_6 галогеналкенилокси, C_2 - C_6 алкоксиалкокси, C_2 -
5 C_6 алкилкарбонилокси, C_1 - C_6 алкилтио, C_1 - C_6 галогеналкилтио, C_3 -
 C_6 циклоалкилтио, C_1 - C_6 алкилсульфинил, C_1 - C_6 галогеналкилсульфинил, C_1 -
 C_6 алкилсульфонил, C_1 - C_6 галогеналкилсульфонил, C_3 -
 C_6 циклоалкилсульфонил, C_1 - C_6 алкиламино, C_2 - C_6 диалкиламино, C_1 -
 C_6 галогеналкиламино, C_2 - C_6 галогендиалкиламино или C_3 -
 C_6 циклоалкиламино;
- 10 r равняется 1, 2, 3, 4 или 5;
 R^5 представляет собой H, галоген, CN, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_3 -
 C_4 циклоалкил, C_3 - C_4 галогенциклоалкил, C_1 - C_4 алкокси или C_1 -
 C_4 галогеналкокси;
- 15 R^6 представляет собой C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_3 - C_4 циклоалкил или C_3 -
 C_4 галогенциклоалкил;
- 20 Q представляет собой шестичленное ароматическое кольцо, содержащее члены
 кольца, выбранные из атомов углерода и не более чем 2 атомов азота, при
 этом каждое кольцо обязательно замещено по членам кольца,
 представляющим собой атомы углерода, не более чем 5 заместителями,
 независимо выбранными из одного или нескольких R^w ; и s представляет
 собой количество заместителей;
- R^w независимо представляет собой H, циано, галоген, C_1 - C_6 алкил, C_1 -
 C_6 галогеналкил, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 галогеналкокси, C_2 - C_6 алкенил, C_2 -
 C_6 галогеналкенил, C_2 - C_6 алкинил, C_2 - C_6 галогеналкинил, C_3 - C_6 циклоалкил,
 25 C_3 - C_6 галогенциклоалкил, C_2 - C_6 цианоалкил, C_1 - C_6 гидроксиалкил, C_4 -
 C_{10} алкилциклоалкил, C_4 - C_{10} циклоалкилалкил, C_3 - C_6 циклоалкенил, C_3 -
 C_6 галогенциклоалкенил, C_2 - C_6 алкоксиалкил, C_4 - C_{10} циклоалкоксиалкил, C_3 -
 C_{10} алкоксиалкоксиалкил, C_2 - C_6 алкилтиоалкил, C_2 - C_6 алкилсульфинилалкил,
 C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 галогеналкокси, C_3 - C_6 циклоалкокси, C_3 -
 30 C_6 галогенциклоалкокси, C_4 - C_{10} циклоалкилалкокси, C_2 - C_6 алкенилокси, C_2 -
 C_6 галогеналкенилокси, C_2 - C_6 алкоксиалкокси, C_2 - C_6 алкилкарбонилокси, C_1 -
 C_6 алкилтио, C_1 - C_6 галогеналкилтио, C_3 - C_6 циклоалкилтио, C_1 -
 C_6 алкилсульфинил, C_1 - C_6 галогеналкилсульфинил, C_3 -

С₆циклоалкилсульфинил, С₁-С₆алкилсульфонил, С₁-
 С₆галогеналкилсульфонил, С₃-С₆циклоалкилсульфонил, С₁-С₆алкиламино,
 С₂-С₆диалкиламино, С₁-С₆галогеналкиламино, С₂-С₆галогендиалкиламино
 или С₃-С₆циклоалкиламино; или два R^w при смежных атомах углерода
 5 вместе могут образовывать кольцо циклического эфира -OCF₂O-, -OCH₂O-,
 -OCF₂S-, -OCH₂CH₂-, OCF₂CF₂O-;

s равняется 1, 2, 3, 4 или 5;

n равняется 0, 1 или 2;

10 при условии, что

- 1) если R¹ представляет собой F, R² представляет собой H, A представляет собой
 CR³, где R³ представляет собой F, R⁴ представляет собой 1-пиразол, и R⁵
 представляет собой H, Q является отличным от 4-OCF₃-фенила; и
- 2) R⁴ является отличным от пиридинила.

15

2. Соединение по п. 1, представляющее собой

соединение формулы 1, где

R¹ представляет собой F;

A представляет собой CR³;

20 R² представляет собой H, галоген, CN, С₁-С₄алкил, С₁-С₄галогеналкил, С₃-
 С₄циклоалкил, С₃-С₄галогенциклоалкил, С₁-С₄алкокси или С₁-
 С₄галогеналкокси;

R³ представляет собой H, галоген, CN, С₁-С₄алкил, С₁-С₄галогеналкил, С₃-
 С₄циклоалкил, С₃-С₄галогенциклоалкил, С₁-С₄алкокси или С₁-

25 С₄галогеналкокси;

R⁴ представляет собой 5-6-членное гетероциклическое кольцо, при этом каждое

кольцо содержит члены кольца, выбранные из атомов углерода и от 1 до 4

гетероатомов, независимо выбранных из не более чем 2 атомов O, не более
 чем 2 атомов S и не более чем 4 атомов N, при этом не более чем 2 члена

30 кольца независимо выбраны из C(=O), C(=S), S(=O) и S(=O)₂, при этом

каждое кольцо или кольцевая система необязательно замещены не более

чем 5 заместителями, независимо выбранными из R^v, и г представляет собой
 количество заместителей;

каждый R^v независимо представляет собой H, галоген, C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 галогеналкил, C_1 - C_6 алкокси или C_1 - C_6 галогеналкокси;

r равняется 1, 2, 3, 4 или 5;

R^5 представляет собой H, галоген, CN, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_3 - C_4 циклоалкил, C_3 - C_4 галогенциклоалкил, C_1 - C_4 алкокси или C_1 - C_4 галогеналкокси;

Q представляет собой шестичленное ароматическое кольцо с 0-2 N в кольце, при этом каждое кольцо необязательно замещено при членах кольца, представляющих собой атомы углерода, не более чем 5 заместителями, независимо выбранными из R^w ;

R^w независимо представляет собой циано, галоген, C_1 - C_6 алкил, C_1 - C_6 алкокси, C_1 - C_6 галогеналкокси, C_1 - C_6 галогеналкил, C_2 - C_6 алкенил, C_2 - C_6 галогеналкенил, C_2 - C_6 алкинил, C_2 - C_6 галогеналкинил, C_1 - C_6 алкилтио, C_1 - C_6 галогеналкилтио, C_1 - C_6 алкилсульфинил, C_1 - C_6 галогеналкилсульфинил, C_1 - C_6 алкилсульфонил или C_1 - C_6 галогеналкилсульфонил;

s равняется 1, 2, 3, 4 или 5;

n равняется 0, 1 или 2.

3. Соединение по п. 2, где

R^2 представляет собой H, галоген или C_1 - C_4 алкил;

R^3 представляет собой H, галоген, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_1 - C_4 алкокси или C_1 - C_4 галогеналкокси;

R^4 выбран из U-2 – U-49 или U52 – U61, показанных в приложении 1;

r равняется 1 или 2;

R^5 представляет собой H, галоген, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_1 - C_4 алкокси или C_1 - C_4 галогеналкокси;

R^w представляет собой C_1 - C_6 галогеналкокси, C_1 - C_6 галогеналкил, C_2 - C_6 галогеналкенил, C_2 - C_6 галогеналкинил, C_1 - C_6 галогеналкилтио, C_1 - C_6 галогеналкилсульфинил, C_1 - C_6 галогеналкилсульфонил;

s равняется 1 или 2.

4. Соединение по п. 3, где

R^2 представляет собой H;

R^3 представляет собой H или галоген;

R^4 выбран из U-2 – U-49;

R^v представляет собой H;

R^5 представляет собой H или галоген;

5 Q представляет собой фенильное, пиридиное, пиримидиное или пиразинное кольцо, при этом каждое кольцо необязательно замещено при членах кольца, представляющих собой атомы углерода, не более чем 5 заместителями, независимо выбранными из R^w ;

R^w представляет собой OCF_3 , SCF_3 , CF_3 , CF_2CF_3 , $SOCF_3$ или SO_2CF_3 .

10

5. Соединение по п. 3, где

R^2 представляет собой C_1 - C_4 алкил;

R^3 представляет собой H или галоген;

R^4 выбран из U-2 – U-49;

15 R^v представляет собой H;

r равняется 2;

R^5 представляет собой H;

20 Q представляет собой фенильное, пиридиное, пиримидиное или пиразинное кольцо, при этом каждое кольцо необязательно замещено при членах кольца, представляющих собой атомы углерода, не более чем 5 заместителями, независимо выбранными из R^w ;

R^w представляет собой OCF_3 , SCF_3 , CF_3 , CF_2CF_3 , $SOCF_3$ или SO_2CF_3 .

6. Соединение формулы 1, где

25 R^1 представляет собой OR^6 ;

A представляет собой CR^3 ;

R^2 представляет собой H, галоген, CN, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_3 - C_4 циклоалкил, C_3 - C_4 галогенциклоалкил, C_1 - C_4 алкокси или C_1 - C_4 галогеналкокси;

30 R^3 представляет собой H, галоген, CN, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_3 - C_4 циклоалкил, C_3 - C_4 галогенциклоалкил, C_1 - C_4 алкокси или C_1 - C_4 галогеналкокси;

R^4 представляет собой 5-6-членное гетероциклическое кольцо, при этом каждое кольцо содержит члены кольца, выбранные из атомов углерода и от 1 до 4 гетероатомов, независимо выбранных из не более чем 2 атомов O, не более чем 2 атомов S и не более чем 4 атомов N, при этом не более чем 2 члена кольца независимо выбраны из C(=O), C(=S), S(=O) и S(=O)₂, при этом

5 каждое кольцо или кольцевая система необязательно замещены не более чем 5 заместителями, независимо выбранными из R^v , и r представляет собой количество заместителей;

каждый R^v независимо представляет собой H, галоген, C₁-C₆алкил, C₁-C₆галогеналкил, C₁-C₆алкокси или C₁-C₆галогеналкокси;

10

r равняется 1, 2, 3, 4 или 5;

R^5 представляет собой H, галоген, CN, C₁-C₄алкил, C₁-C₄галогеналкил, C₃-C₄циклоалкил, C₃-C₄галогенциклоалкил, C₁-C₄алкокси или C₁-C₄галогеналкокси;

15

R^6 представляет собой C₁-C₄алкил;

Q представляет собой шестичленное ароматическое кольцо с 0-2 N в кольце, при этом каждое кольцо необязательно замещено при членах кольца, представляющих собой атомы углерода, не более чем 5 заместителями, независимо выбранными из R^w ;

20

R^w независимо представляет собой циано, галоген, C₁-C₆алкил, C₁-C₆алкокси, C₁-C₆галогеналкокси, C₁-C₆галогеналкил, C₂-C₆алкенил, C₂-C₆галогеналкенил, C₂-C₆алкинил, C₂-C₆галогеналкинил, C₁-C₆алкилтио, C₁-C₆галогеналкилтио, C₁-C₆алкилсульфинил, C₁-C₆галогеналкилсульфинил, C₁-C₆алкилсульфонил или C₁-C₆галогеналкилсульфонил;

25

s равняется 1, 2, 3, 4 или 5;

n равняется 0, 1 или 2.

7. Соединение по п. 6, где

R^2 представляет собой H, галоген или C₁-C₄алкил;

30

R^3 представляет собой H, галоген, C₁-C₄алкил, C₁-C₄галогеналкил, C₁-C₄алкокси или C₁-C₄галогеналкокси;

R^4 выбран из U-2 – U-49 или U52 – U61, показанных в приложении 1;

r равняется 1 или 2;

R^5 представляет собой H, галоген, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_1 - C_4 алкокси или C_1 - C_4 галогеналкокси;

R^6 представляет собой Me;

R^w представляет собой C_1 - C_6 галогеналкокси, C_1 - C_6 галогеналкил, C_2 -

5 C_6 галогеналкенил, C_2 - C_6 галогеналкинил, C_1 - C_6 галогеналкилтио, C_1 - C_6 галогеналкилсульфинил, C_1 - C_6 галогеналкилсульфонил;

s равняется 1 или 2.

8. Соединение по п. 7, где

10 R^2 представляет собой H;

R^3 представляет собой H или галоген;

R^4 выбран из U-2 – U-49;

R^v представляет собой H;

r равняется 2;

15 R^5 представляет собой H или галоген;

Q представляет собой фенильное, пиридицильное, пиримидинильное или пиразинильное кольцо, при этом каждое кольцо необязательно замещено при членах кольца, представляющих собой атомы углерода, не более чем 5 заместителями, независимо выбранными из R^w ;

20 R^w представляет собой OCF_3 , SCF_3 , CF_3 , CF_2CF_3 , $SOCF_3$ или SO_2CF_3 .

9. Соединение формулы 1, где

R^1 представляет собой SR^6 ;

A представляет собой CR^3 ;

25 R^2 представляет собой H, галоген, CN, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_3 - C_4 циклоалкил, C_3 - C_4 галогенциклоалкил, C_1 - C_4 алкокси или C_1 - C_4 галогеналкокси;

R^3 представляет собой H, галоген, CN, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_3 - C_4 циклоалкил, C_3 - C_4 галогенциклоалкил, C_1 - C_4 алкокси или C_1 - C_4 галогеналкокси;

30 R^4 представляет собой 5-6-членное гетероциклическое кольцо, при этом каждое кольцо содержит члены кольца, выбранные из атомов углерода и от 1 до 4 гетероатомов, независимо выбранных из не более чем 2 атомов O, не более

чем 2 атомов S и не более чем 4 атомов N, при этом не более чем 2 члена кольца независимо выбраны из C(=O), C(=S), S(=O) и S(=O)₂, при этом каждое кольцо или кольцевая система необязательно замещены не более чем 5 заместителями, независимо выбранными из R^v, и r представляет собой количество заместителей;

каждый R^v независимо представляет собой H, галоген, C₁-C₆алкил, C₁-C₆галогеналкил, C₁-C₆алкокси или C₁-C₆галогеналкокси;

r равняется 1, 2, 3, 4 или 5;

R⁵ представляет собой H, галоген, CN, C₁-C₄алкил, C₁-C₄галогеналкил, C₃-C₄циклоалкил, C₃-C₄галогенциклоалкил, C₁-C₄алкокси или C₁-C₄галогеналкокси;

R⁶ представляет собой C₁-C₄алкил;

Q представляет собой шестичленное ароматическое кольцо с 0-2 N в кольце, при этом каждое кольцо необязательно замещено при членах кольца, представляющих собой атомы углерода, не более чем 5 заместителями, независимо выбранными из R^w;

R^w независимо представляет собой циано, галоген, C₁-C₆алкил, C₁-C₆алкокси, C₁-C₆галогеналкокси, C₁-C₆галогеналкил, C₂-C₆алкенил, C₂-C₆галогеналкенил, C₂-C₆алкинил, C₂-C₆галогеналкинил, C₁-C₆алкилтио, C₁-C₆галогеналкилтио, C₁-C₆алкилсульфинил, C₁-C₆галогеналкилсульфинил, C₁-C₆алкилсульфонил или C₁-C₆галогеналкилсульфонил;

s равняется 1, 2, 3, 4 или 5;

p равняется 0, 1 или 2.

25 10. Соединение по п. 9, где

R² представляет собой H, галоген или C₁-C₄алкил;

R³ представляет собой H, галоген, C₁-C₄алкил, C₁-C₄галогеналкил, C₁-C₄алкокси или C₁-C₄галогеналкокси;

R⁴ выбран из U-2 – U-49 или U52 – U61, показанных в приложении 1;

30 R^v представляет собой H, галоген, C₁-C₆алкил, C₁-C₆алкокси, C₁-C₆галогеналкокси или C₁-C₆галогеналкил,

r равняется 1 или 2;

R^5 представляет собой H, галоген, C_1 - C_4 алкил, C_1 - C_4 галогеналкил, C_1 - C_4 алкокси или C_1 - C_4 галогеналкокси;

R^6 представляет собой Me;

R^w представляет собой C_1 - C_6 галогеналкокси, C_1 - C_6 галогеналкил, C_2 -

5 C_6 галогеналкенил, C_2 - C_6 галогеналкинил, C_1 - C_6 галогеналкилтио, C_1 - C_6 галогеналкилсульфинил, C_1 - C_6 галогеналкилсульфонил;

s равняется 1 или 2.

11. Соединение по п. 10, где

10 R^2 представляет собой H;

R^3 представляет собой H или галоген;

R^4 выбран из U-2 – U-49;

R^v представляет собой H;

r равняется 2;

15 R^5 представляет собой H;

Q представляет собой фенильное, пиридиное, пиримидинное или пиразинное кольцо, при этом каждое кольцо необязательно замещено при членах кольца, представляющих собой атомы углерода, не более чем 5 заместителями, независимо выбранными из R^w ;

20 R^w представляет собой OCF_3 , SCF_3 , CF_3 , CF_2CF_3 , $SOCF_3$ или SO_2CF_3 .

12. Соединение формулы 1, где соединение выбрано из группы, состоящей из 3-фтор-4-[фтор-[4-(трифторметокси)фенил]метил]-5-(2H-1,2,3-триазол-2-

ил)пиридина;

25 3-хлор-4-[фтор-[4-(трифторметокси)фенил]метил]-5-(2H-1,2,3-триазол-2-

ил)пиридина;

3-фтор-4-[метокси-[4-(трифторметокси)фенил]метил]-5-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)пиридина;

3-фтор-4-[фтор-[4-[(трифторметил)тио]фенил]метил]-5-(2-оксазолил)пиридина;

30 3-фтор-4-[фтор-[4-[(трифторметил)тио]фенил]метил]-5-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)пиридина;

3-хлор-4-[фтор-[4-[(трифторметил)тио]фенил]метил]-5-(2H-1,2,3-триазол-2-ил)пиридина;

3-фтор-4-[фтор-[4-(трифторметил)фенил]метил]-5-(2*H*-1,2,3-триазол-2-ил)пиридина;

3-фтор-4-[фтор-[4-(трифторметокси)фенил]метил]-5-(2-оксазолил)пиридина;

5 3-фтор-4-[фтор-[4-[(трифторметил)сульфинил]фенил]метил]-5-(2*H*-1,2,3-триазол-2-ил)пиридина;

3-фтор-4-[фтор-[4-(трифторметокси)фенил]метил]-5-(5-оксазолил)пиридина;

3-фтор-4-[фтор-[4-(трифторметокси)фенил]метил]-5-(3-метил-1,2,4-оксадиазол-5-ил)пиридина;

10 3-фтор-4-[метокси-[4-(трифторметокси)фенил]метил]-5-(2*H*-1,2,3-триазол-2-ил)пиридина;

3-хлор-4-[метокси-[4-(трифторметокси)фенил]метил]-5-(2*H*-1,2,3-триазол-2-ил)пиридина;

3-бром-4-[фтор-[4-[(трифторметил)тио]фенил]метил]-5-(2*H*-1,2,3-триазол-2-ил)пиридина и

15 3-фтор-4-[метокси-[4-[(трифторметил)тио]фенил]метил]-5-(1,2,4-оксадиазол-3-ил)пиридина.

13. Соединение по п. 12, где соединение выбрано из группы, состоящей из

20 3-фтор-4-[фтор-[4-(трифторметокси)фенил]метил]-5-(2*H*-1,2,3-триазол-2-ил)пиридина;

3-хлор-4-[фтор-[4-(трифторметокси)фенил]метил]-5-(2*H*-1,2,3-триазол-2-ил)пиридина;

3-хлор-4-[фтор-[4-[(трифторметил)тио]фенил]метил]-5-(2*H*-1,2,3-триазол-2-ил)пиридина;

25 3-фтор-4-[метокси-[4-(трифторметокси)фенил]метил]-5-(2*H*-1,2,3-триазол-2-ил)пиридина;

3-фтор-4-[фтор-[4-[(трифторметил)тио]фенил]метил]-5-(2-оксазолил)пиридина;

3-фтор-4-[фтор-[4-[(трифторметил)тио]фенил]метил]-5-(2*H*-1,2,3-триазол-2-ил)пиридина;

30 3-бром-4-[фтор-[4-[(трифторметил)тио]фенил]метил]-5-(2*H*-1,2,3-триазол-2-ил)пиридина.

14. Композиция, содержащая соединение формулы 1 или по любому из предыдущих пунктов и по меньшей мере один дополнительный компонент, выбранный из группы, состоящей из поверхностно-активных веществ, твердых разбавителей и жидких разбавителей, при этом указанная композиция необязательно
5 дополнительно содержит по меньшей мере одно дополнительное биологически активное соединение или средство.

15. Композиция по п. 14, где по меньшей мере одно дополнительное биологически активное соединение или средство выбрано из группы, состоящей из
10 абамектина, ацефата, ацеквиноцила, ацетамиприда, акринатрина, афидопиропена, амидофлумета, амитраза, авермектина, азадирахтина, азинфос-метила, бенфуракарба, бенсультапа, бифентрина, бифеназата, бистрифлулона, бората, бромантранилипрола, бупрофезина, карбарила, карбофурана, картапа, карзола, хлорантранилипрола, хлорфенапира, хлорфлуазулона, хлорпирифоса, хлорпирифос-метила, кромафенозида,
15 клофентезина, клотианидина, циантранилипрола, цикланилипрола, циклопротрина, циклоксаприда, цифлуметофена, цифлутрина, бета-цифлутрина, цигалодиамида, цигалотрина, гамма-цигалотрина, лямбда-цигалотрина, циперметрина, альфа-циперметрина, дзета-циперметрина, цирوماзина, дельтаметрина, диафентиурина, диазинона, дихлорантранилипрола, диелдрин, дифлубензулона, димефлутрина,
20 димегипо, диметоата, динотефурана, диофенолана, эмаектина, эндосульфана, эсфенвалерата, этипрола, этофенпрокса, этоксазола, фенбутатина оксида, фенитротриона, фенотиокарба, феноксикарба, фенпропатрина, фенвалерата, фипронила, флометоквина, флоникамида, флубендиамида, флуцитрината, флуфенерима, флуфеноксурона, флуфеноксистробина, флуенсульфона, флуопирама,
25 флупирадифулона, флювалината, тау-флювалината, фонофоса, форметаната, фостиазата, галофенозида, гептафлутрина, гексафлумурина, гекситиазокса, гидраметилнона, имидаклоприда, индоксиакрба, инсектицидных мыл, изофенфоса, люфенурина, малатиона, меперфлутрина, метафлумизона, метальдегида, метамидофоса, метидатиона, метиокарба, метомила, метопрена, метоксихлора,
30 метоксифенозида, метофлутрина, монокротофоса, монофтортрина, никотина, *N*-[1,1-диметил-2-(метилтио)этил]-7-фтор-2-(3-пиридинил)-2*H*-индазол-4-карбоксамид, *N*-[1,1-диметил-2-(метилсульфинил)этил]-7-фтор-2-(3-пиридинил)-2*H*-индазол-4-карбоксамид, *N*-[1,1-диметил-2-(метилсульфонил)этил]-7-фтор-2-(3-пиридинил)-2*H*-индазол-4-карбоксамид, *N*-(1-метилциклопропил)-2-(3-пиридинил)-2*H*-индазол-4-

карбоксамид, *N*-[1-(дифторметил)циклопропил]-2-(3-пиридирил)-2*H*-индазол-4-карбоксамид, нитенпирама, нитиазина, новалурона, новифлумурина, оксамила, паратиона, паратион-метила, перметрина, фората, фозалона, фосмета, фосфамидона, пиримикарба, профенофоса, профлутрина, пропаргита, протрифенбута, пифллубумида, 5 пиметрозина, пирафлупрола, пиретрина, пиридабена, пиридалила, пирифлуквиназона, пириминостробина, пирипрола, пирипроксифена, ротенона, рианодина, силафлуофена, спинеторама, спиносада, спиродиклофена, спиромезифена, спиротетрамата, сульпрофоса, сульфоксафлора, тебуфенозида, тебуфенпирада, тефлубензурина, тефлутрина, 10 тетрачлорантранилипрола, тетрачлорвинфоса, тетраметрина, тетраметилфлутрина, тиаклоприда, тиаметоксама, тиодикарба, тиосултап-натрия, тиоксазафена, толфенпирада, тралометрина, триазамата, трихлорфона, трифлумезопирима, трифлумурина, дельта-эндотоксинов *Bacillus thuringiensis*, энтомопатогенных бактерий, энтомопатогенных вирусов и энтомопатогенных грибов.

15 16. Композиция для обеспечения защиты животного от беспозвоночного паразитического вредителя, содержащая паразитоцидно эффективное количество соединения формулы **1** или по любому из предыдущих пунктов и по меньшей мере один носитель.

20 17. Способ обеспечения контроля беспозвоночного вредителя, предусматривающий приведение в контакт беспозвоночного вредителя или его окружающей среды с биологически эффективным количеством соединения, композиции или состава по любому из пп. 1-16.

25 18. Способ по п. 17, где беспозвоночный вредитель предусматривает щитников из семейства Pentatomidae.

30 19. Обработанное семя, содержащее соединение формулы **1** или по любому из предыдущих пунктов в количестве, составляющем от приблизительно 0,0001 до 1% по весу семени перед обработкой.