

(19)



Евразийское
патентное
ведомство

(11) 042683

(13) B1

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОМУ ПАТЕНТУ

(45) Дата публикации и выдачи патента
2023.03.14

(51) Int. Cl. A01N 43/56 (2006.01)
C07D 401/04 (2006.01)

(21) Номер заявки
202092882

(22) Дата подачи заявки
2019.05.20

(54) СОЕДИНЕНИЕ, ОБЛАДАЮЩЕЕ ПЕСТИЦИДНЫМ ДЕЙСТВИЕМ, А ТАКЖЕ КОМПОЗИЦИИ И СПОСОБЫ, СВЯЗАННЫЕ С НИМИ

(31) 62/682,248

(56) EP-A1-2674423
US-A1-2012110702

(32) 2018.06.08

(33) US

(43) 2021.04.19

(86) PCT/US2019/033099

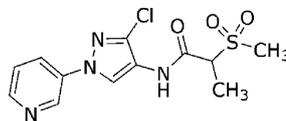
(87) WO 2019/236274 2019.12.12

(71)(73) Заявитель и патентовладелец:
КОРТЕВА АГРИСАЙЕНС ЭЛЭЛСИ
(US)

(72) Изобретатель:
Чжан Юй, Траллингер Тони К.,
Клиттич Карла Дж. Р., Хантер Рики
(US)

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

(57) Изобретение относится к соединению N-(3-хлор-1-(пиридин-3-ил)-1H-пиразол-4-ил)-2-(метилсульфонил)пропанамид, обладающему пестицидным действием в отношении вредителей типов Arthropoda, Mollusca и Nematoda, и к пестицидным композициям, содержащим такое соединение. Данные пестицидные композиции можно применять, например, в качестве акарицидов, инсектицидов, майтицидов, моллюскоцидов и нематоцидов.



B1

042683

042683

B1

Перекрестная ссылка на родственные заявки

Данная заявка испрашивает преимущество и приоритет предварительной заявки на патент США с регистрационным номером 62/682248, которая была подана 8 июня 2018 г. Полное содержание вышеуказанной заявки, таким образом, включено посредством ссылки в данную заявку.

Область техники, к которой относится изобретение

Настоящее изобретение относится к области соединений, обладающих пестицидным действием в отношении вредителей типов Arthropoda, Mollusca и Nematoda, к способам получения таких соединений, к пестицидным композициям, содержащим такие соединения, и к способам применения таких пестицидных композиций в отношении таких вредителей. Данные пестицидные композиции можно применять, например, в качестве акарицидов, инсектицидов, майтицидов, моллюскоцидов и нематоцидов.

Предпосылки изобретения

"Многие из наиболее опасных заболеваний человека передаются насекомыми-переносчиками" (Riveго и соавт.). "Исторически малярия, лихорадка денге, желтая лихорадка, чума, филяриатоз, эпидемический сыпной тиф, трипаносомоз, лейшманиоз и другие трансмиссивные заболевания были причиной большого количества заболеваний и смертей людей на протяжении 17-го - начала 20-го столетий, чем все другие причины в совокупности" (Gubler). Трансмиссивные заболевания являются причиной приблизительно 17% паразитарных и инфекционных заболеваний в мире. Малярия сама по себе вызывает более 800000 смертей в год, 85% из которых происходит у детей возрастом до пяти лет. Каждый год происходит от приблизительно 50 до приблизительно 100 миллионов случаев лихорадки денге. Также каждый год возникает 250000-500000 случаев геморрагической формы лихорадки денге (Matthews). Контроль переносчиков инфекции выполняет важнейшую функцию в предотвращении и контроле инфекционных заболеваний. Тем не менее, стойкость к инсектицидам, включая стойкость к нескольким инсектицидам, появилась у всех видов насекомых, которые являются основными переносчиками заболеваний человека (Riveго и соавт.). За последнее время более 550 видов членистоногих развили стойкость по меньшей мере к одному пестициду (Whalon и соавт.). Кроме того, случаи стойкости насекомых продолжают значительно превышать число случаев стойкости к гербицидам и фунгицидам (Sparks и соавт.).

Каждый год насекомые, патогены растений и сорняки уничтожают более 40% всех произведенных пищевых продуктов. Данная потеря имеет место, несмотря на использование пестицидов и применение широкого спектра нехимических средств для борьбы, таких как чередование культур, и биологических средств для борьбы. Если бы хоть некоторую часть данных пищевых продуктов можно было спасти, их можно было бы использовать, чтобы накормить более трех миллиардов человек в мире, которые голодают (Pimental).

Паразитические нематоды растений относятся к одним из наиболее распространенных вредителей и зачастую являются одними из наиболее скрытых и дорогостоящих в отношении борьбы с ними. Было подсчитано, что потери, связанные с нематодами, составляют от приблизительно 9% в развитых странах до приблизительно 15% в слаборазвитых странах. Тем не менее, в Соединенных Штатах Америки наблюдения за различными сельскохозяйственными культурами в 35 штатах показали, что потери, вызванные нематодами, достигают 25% (Nicol и соавт.).

Отмечается, что брюхоногие (слизни и улитки) являются менее экономически важными вредителями, чем другие членистоногие или нематоды, но в некоторых зонах они могут значительно снижать урожай, оказывая сильное влияние на качество собираемых продуктов, а также переносить заболевания человека, животных и растений. Хотя лишь несколько десятков видов брюхоногих являются серьезными региональными вредителями, небольшое количество видов являются значительными вредителями на мировом уровне. В частности, брюхоногие оказывают влияние на широкий спектр сельскохозяйственных и плодовых культур, таких как пропашные, пастбищные и волокнистые культуры, овощи, кустовые ягоды и плоды деревьев, травы и декоративные растения (Speiser).

Термиты вызывают повреждение всех типов частных и общественных строений, а также сельскохозяйственных и лесных ресурсов. В 2005 г. было подсчитано, что ежегодно термиты наносят ущерб на сумму более 50 миллиардов долларов США по всему миру (Korb).

Следовательно, по многим причинам, включая причины, указанные выше, существует постоянная потребность в дорогостоящей (состоянием на 2010 г. оценивается в приблизительно 256 миллионов долларов США на пестицид), времязатратной (в среднем приблизительно 10 лет на пестицид) и сложной разработке новых пестицидов (CropLife America).

Некоторые ссылки, цитируемые в настоящем изобретении

- CropLife America, The Cost of New Agrochemical Product Discovery, Development & Registration, and Research & Development predictions for the Future, 2010.
- Drewes, M., Tietjen, K., Sparks, T.C., High-Throughput Screening in Agrochemical Research, *Modern Methods in Crop Protection Research*, часть I, *Methods for the Design and Optimization of New Active Ingredients*, под ред. Jeschke, P., Kramer, W., Schirmer, U., and Matthias W., с. 1-20, 2012.
- Gubler, D., Resurgent Vector-Borne Diseases as a Global Health Problem, *Emerging Infectious Diseases*, том 4, № 3, с. 442-450, 1998 г.
- Korb, J., Termites, *Current Biology*, том 17, № 23, 2007 г.
- Matthews, G., Integrated Vector Management: Controlling Vectors of Malaria and Other Insect Vector Borne Diseases, Гл. 1, с. 1, 2011 г.
- Nicol, J., Turner S., Coyne, L., den Nijs, L., Hockslan, L., Tahna-Maafi, Z., Current Nematode Threats to World Agriculture, *Genomic and Molecular Genetics of Plant - Nematode Interactions*, с. 21-43, 2011 г.
- Pimental, D., Pest Control in World Agriculture, *Agricultural Sciences* - том II, 2009 г.
- Rivero, A., Vezilier, J., Weill, M., Read, A., Gandon, S., Insect Control of Vector-Borne Diseases: When is Insect Resistance a Problem? *Public Library of Science Pathogens*, том 6, № 8, с. 1-9, 2010 г.
- Sparks T.C., Nauen R., IRAC: Mode of action classification and insecticide resistance management, *Pesticide Biochemistry and Physiology* (2014), доступный онлайн, 4 декабря 2014 г.
- Speiser, B., Molluscicides, *Encyclopedia of Pest Management*, Гл. 219, с. 506-508, 2002 г.
- Whalon, M., Mota-Sanchez, D., Hollingworth, R., Analysis of Global Pesticide Resistance in Arthropods, *Global Pesticide Resistance in Arthropods*, Гл. 1, с. 5-33, 2008 г.

Определения, используемые в настоящем изобретении

Примеры, приведенные в данных определениях, как правило, являются неисключительными и не должны рассматриваться как ограничивающие настоящее изобретение. Подразумевается, что заместитель должен соответствовать правилам химического связывания и ограничениям стерической совместимости в отношении конкретного соединения, к которой он присоединен. Данные определения следует использовать только для целей настоящего раскрытия.

Выражение "активный ингредиент" означает материал, обладающий активностью, пригодный для борьбы с вредителями и/или который пригоден для способствования проявлению лучшей активности других материалов для борьбы с вредителями, при этом примеры таких материалов включают без ограничения акарициды, альгициды, антифиданты, авициды, бактерициды, отпугивающие птиц вещества, хемотренизаторы, фунгициды, антитоксины гербицидов, гербициды, приманки для насекомых, отпугивающие насекомых вещества, инсектициды, отпугивающие млекопитающих вещества, средства для дезориентации самцов, моллюскоциды, нематоциды, активаторы роста растений, регуляторы роста растений, родентициды, синергисты и вируциды (см. alanwood.net). Конкретные примеры таких материалов включают без ограничения материалы, перечисленные в группе альфа активных ингредиентов.

Выражение "группа альфа активных ингредиентов" (далее "AIGA") означает в совокупности следующие материалы:

(1) (3-этоксипропил)ртути бромид, 1,2-дибромэтан, 1,2-дихлорэтан, 1,2-дихлорпропан, 1,3-дихлорпропан, 1-МСП, 1-метилциклопропан, 1-нафтол, 2-(октилтио)этанол, 2,3,3-ТРА, 2,3,5-тригидроксибензойная кислота, 2,3,6-ТВА, 2,4,5-Т, 2,4,5-ТВ, 2,4,5-ТР, 2,4-Д, 2,4-ДВ, 2,4-ДЕВ, 2,4-ДЕР, 2,4-ДЕС, 2,4-ДР, 2,4-МСРА, 2,4-МСПВ, 2iP, 2-метоксиэтилмеркурхлорид, 2-фенилфенол, 3,4-ДА, 3,4-ДВ, 3,4-ДР, 3,6-дихлорпиколиновая кислота, 4-аминопиридин, 4-СРА, 4-СРВ, 4-СРР, 4-гидроксифенетиловый спирт, 8-гидроксихинолинсульфат, 8-фенилмеркуроксихинолин, абамектин, абамектин-аминометил, абсцизовая кислота, АСС, ацефат, ацеквиноцил, ацетамиприд, ацетион, ацетохлор, ацетофенат, ацетофос, ацетопрол, ацибензолар, ацифлуорфен, аклонифен, АСН, акреп, акринатрин, акролеин, акрилонитрил, ацинонапир, аципетакс, афидопиропен, афоксоланер, алахлор, аланап, аланикарб, албендазол, альдикарб, альдикарб сульфат, альдиморф, альдоксикарб, альдрин, аллетрин, аллицин, аллидохлор, аллозамидин, аллоксидим, аллиловый спирт, алликсикарб, алорак, альфа-циперметрин, альфа-эндосульфат, альфаметрин, алтретамин, фосфид алюминия, фосфид алюминия, аметоктрадин, аметридион, аметрин, аметрин, амибузин, амикарбазон, амикартиазол, амидитион, амидофлумет, амидосульфурон, аминокарб, аминоклопирахлор, аминокпиралид, аминокпирифен, аминотриазол, амипрофос-метил, амипрофос, амипрофос-метил, амисулбром, амитон, амитраз, амитрол, сульфат аммония, амобам, аморфный силикагель, аморфный диоксид кремния, ампропилфос, АМС, анабазин, анцимидол, анилазин, анилофос, анизурон, антрахинон, анту, афолат, арамит, арпрокарб, оксид мышьяка, асомат, аспиридин, асулам, атидатион, атратон, атразин, ауеофунгин, авермектин В1, АВГ, авиглицин, азаконазол, азадирахтин, азафенидин, аза-

метифос, азидитион, азимсульфурон, азинфосетил, азинфос-этил, азинфосметил, азинфос-метил, ази-протрин, азипротрин, азитирам, азобензол, азоциклотин, азотоат, азоксистеробин, бахмедеш, барбан, барбанат, гексафторосиликат бария, полисульфид бария, гексафторосиликат бария, бартрин, медь углекислая основная, хлорокись меди, основной сульфат меди, ВСРС, бефлубутамид, бефлубутамид-М, беналаксил, беналаксил-М, беназолин, бенкарбазон, бенклотиаз, фенридазон-пропил, бендиокарб, бендиоксид, бенефин, бенфлуралин, бенфуракарб, бенфуресат, сафлуфенацил, беноданил, беномил, беноксакор, беноксафос, бенквинокс, бенсульфурон, бенсулид, бенсултап, бенталурон, бентазон, бентазон, бентиаваликарб, бентиазол, бентиокарб, бентранил, бензадокс, бензалкония хлорид, бензамакрил, бензамизол, бензаморф, гексахлорид бензола, бензфендизон, бензимин, бензипрам, бензобициклон, бензоэпин, бензофенап, бензофлуор, бензогидроксамовая кислота, бензомат, бензофосфат, бензотиадиазол, бензовиндифлупир, бензоксимат, бензоилпроп, бензпиримоксан, бензтиазурон, топрамезон, бензилбензоат, бензиладенин, берберин, бета-цифлутрин, бета-циперметрин, бетоксазин, ВНС, биалафос, бициклопирон, бифеназат, бифенокс, бифентрин, бифуцзюньчи, биланафос, бинапакрил, бинцинсяо, биоаллетрин, биоэтанометрин, биоперметрин, биоресметрин, бифенил, бисазир, бисмертиазол, бисмертиазол-медь, гидраргафен (бисфенилртуть-метилendi(х-нафталин-у-сульфонат)), биспирибак, бистрифлуорон, бисултап, битертанол, битионол, бикасафен, бикслозон, бластицидин-S, бура, бордосская смесь, борная кислота, боскалид, ВPPS, брассинолид, брассинолид-этил, бревикомин, бродифакум, брофенпрокс, брофенвалерат, брофланилид, брофлутринат, бромацил, бромациолол, бромхлофос, брометалин, брометрин, бромфенвинфос, бромацетамид, бромобонил, бромобутид, бромоциклен, бромоциклен, бром-DDT, бромофеноксим, бромофос, бромметан, бромофос, бромофос-этил, бромопропилат, бромоталонил, бромоксинил, бромпиразон, бромуконазол, бронопол, BRP, ВТН, букарполат, буфенкарб, буминафос, бупиримат, бупрофезин, бургундская смесь, бусульфан, бусульфан, бутаккарб, бутакхлор, бутафенацил, бутам, бутамифос, бутан-фипронил, бутатиофос, бутенахлор, бутен-фипронил, бутетрин, бутидазол, бутиобат, бутиурон, бутифос, бутоккарбоксим, бутонат, бутопириноксил, бутоксикарбоксим, бутралин, бутризол, бутроксидим, бутурон, бутиламин, бутилат, бутонат, бутилен-фипронил, какодидовая кислота, кадусафос, кафенстрол, кальциферол, арсенат кальция, хлорат кальция, цианамид кальция, цианид кальция, полисульфид кальция, калвинфос, камбендихлор, камфехлор, камфора, каптафол, каптан, карбам, карбаморф, карбанолат, карбарил, карбарил, карбасулам, карбатион, карбендазим, карбендазол, карбетамид, карбофенотион, карбофуран, сероуглерод, четыреххлористый углерод, карбонилсульфид, карбофенотион, карбофос, карбосульфат, карбоксазол, карбоксид, карбоксин, карфентразон, карпропамид, картап, карвакрол, карвон, САРР, СДАА, СДЕА, СДЕС, целлоцидин, СЕРС, цералур, бенквинокс, сабадилла, чешантовая смесь, квиналфос, квиналфос-метил, хинометионат, хинометионат, беналаксил-М, хитозан, хлобентиазон, хлومتоксибен, хлоралоза, хлорамбен, хлорамин фосфор, хлорамфеникол, хлораниформетан, хлоранил, хлоранокрил, хлорантранилипрол, хлоразифоп, хлоразин, хлорбензид, хлорбензулон, хлорбициклен, хлорбромурон, хлорбуфам, хлордан, хлордекон, хлордимеформ, хлоремпентрин, каретазан, этефон, хлорэтоксифос, хлоретурон, хлорфенак, хлорфенапир, хлорфеназол, хлорфенетол, монурон, хлорфенпроп, хлорфенсон, хлорфенсульфид, хлорфенвинфос, диметилвинфос, хлорфлуазурон, хлорфлуразол, хлорфлурекол, хлорфлуурен, хлорфлурунол, хлоридазон, хлоримурон, барбан, хлорпрофам, хлормерфос, хлормекват, сулькотрион, хлومتоксинил, хлорнидин, хлорнитрофен, хлоруксусная кислота, хлоробензилат, хлординитронафталины, хлорфенсон, хлороформ, хлоромебуформ, хлорометиурон, хлоронеб, хлорофацинон, трихлорфон, хлорпикрин, хлоропон, хлоропраллетрин, хлорпропилат, хлороталонил, хлоротолурон, хлороксифенидим, хлороксурон, хлороксинил, хлорфониум, хлорфоксим, хлорпразофос, хлорпрокарб, хлорпрофам, хлорпирифос, хлорпирифос-метил, хлорквинокс, хлорсульфурон, хлортал, хлортиамид, хлортиофос, хлоротолурон, хлостолинат, хитозан, колекальциферол, хлорид холина, хромафенозид, циклогексимид, тринексапак, циметакарб, цинерин I, цинерин II, цинерины, цинидон-этил, цинметилин, циносульфурон, синтофен, циобутид, цисанилид, цисметрин, клацифос, профоксидим, кленпирин, кленпирин, клетодим, климбазол, клиодинат, клодинафоп, клоетокарб, клофенцет, клофенотан, клофентезин, клофенвинфос, клофибровая кислота, клофоп, кломазон, кломепроп, никлосамид, клопроп, клопроксидим, клопиралид, клоквинтосет, клорансулам, клозантел, клотианидин, клотримазол, клоксифонак, вангард, вангард, СМА, СММР, СМР, СМУ, кодлелур, колекальциферол, колофонат, 8-хинолинолат меди, ацетат меди, ацетоарсенит меди, арсенат меди, медь углекислая основная, гидроксид меди, нафтенат меди, олеат меди, хлорокись меди, силикат меди, сульфат меди, основной сульфат меди, хромат меди и цинка, кумахлор, варфарин, кумафос, кумафурил, кумафос, куматетралил, куметоксистеробин, кумитоат, кумоксистеробин, СРМС, СРМФ, СРРС, кредазин, крезол, крезоловая кислота, кримидин, кротамитон, кротоксифос, кротоксифос, круфомат, криолит, куелур, куфранеб, кумилурон, кумилурон, купробам, оксид меди, куркуменол, СММР, цианамид, цианатрин, цианазин, цианофенфос, цианоген, цианофос, циантоат, циантранилипрол, триокситриазин, циазофамид, цибутрин, циклафурамид, цикланилид, цикланилипрол, циклетрин, циклоат, циклогексимид, циклопат, циклопротрин, циклопиранил, циклопириморат, циклосульфамурон, циклоксидим, циклулон, циенопирафен, цифлуфенамид, цифлуметофен, цифлутрин, цигалодиамида, цигалофоп, цигалотрин, цихексатин, цимиазол, цимоксанил, циометринил, ципендазол, циперметрин, циперкват, цифенотрин, ципразин, ципразол, ципроконазол, ципродинил, ципрофурам, ципромид, ципросульфамид, циромазин, цитиоат, додин, даимурон, далапон,

даминозид, даютун, тиазон, DBCP, d-камфора, DCB, DCIP, DCPA (Япония), DCPA (США), DCPTA, DCU, DDD, DDPP, DDT, DDVP, дебакарб, декафентин, дельтаметрин, декарбофуран, диэтилтолуамид, дегидроацетовая кислота, дикват, делахлор, диоксатион, дельтаметрин, демефион, демефион-О, демефион-S, деметон, деметон-метил, деметон-О, деметон-О-метил, деметон-S, деметон-S-метил, деметон-S-метилсульфон, деметон-S-метилсульфон, DEP, биоаллетрин, ротенон, десмедифам, десметрин, десметрин, d-фаньпилуцюзэбинцзюйчжи, диафентиурон, диалифор, диалифос, диаллат, диаллат, диамидафос, дикамба, диатомовая земля, диатомит, диазинон, налед, дибутилфталат, дибутилсукцинат, дикамба, дикаптон, дихлобенил, дихлобентиазокс, дихлофентион, дихлофлуанид, дихлон, дихлоральмочевина, дихлорбензурон, диурон, дихлорфлурекол, дихлорфлуренол, дихлормат, дихлормид, дихлорметан, дихлорофен, дихлорпроп, дихлорпроп-Р, дихлорвос, дихлозолин, дихлозолин, диклобутразол, диклоцимет, диклофоп, дикломезин, диклоран, дихлоромезотиаз, диклосулам, дикофол, диклофан, дикумарол, дикрезил, дикротофос, хлоранокрил, дикумарол, дицикланил, дициклонон, диелдрин, диенохлор, диетамкват, диетатил, этион, этион, диэтофенкарб, диетолат, этион, диэтилпирокарбонат, диэтилтолуамид, дифенакум, дифеноконазол, дифенопентеп, дифеноксурон, дифензокват, дифетиалон, дифловидазин, дифлубензурон, дифлуфениканил, дифлуфениканил, дифлуфензопир, дифлуметорим, дикегулак, дилор, диматиф, димефлутрин, димефокс, димефурон, тиосултап-динатрий, димепиперат, диметахлон, диметан, диметаккарб, диметахлон, диметахлор, диметаметрин, диметенамид, диметенамид-Р, диметипин, диметиримол, диметоат, диметоморф, диметрин, диметилкарбат, диметилдисульфид, диметилфталат, диметилвинфос, диметилан, димексано, димидазон, димоксистробин, димпропиридаз, диазинон, даимурон, динекс, пиризоксазол, диниконазол, диниконазол-М, динитрамин, динитрофенолы, динобутон, динокап, динокап-4, динокап-6, диноктон, динофенат, динопентон, динопроп, диносам, диносеб, диносурфен, динотефуран, динотерб, динотербон, диофенолан, диоксабензофос, диоксакарб, диоксатион, диокатион, дифацин, дифацинон, дифенадион, дифенамид, дифенамид, дифенилсульфон, дифениламин, тетрасул, дикегулак, дипропалин, дипропетрин, трихлорфон, дипиметитрон, дипиритион, дикват, тетраборат динатрия, тиосултап-динатрий, диспарлюр, дисугран, дизул, дисульфирам, дисульфотон, диталимфос, дитианон, дитикрофос, дитиозэфир, дитиометон, дитиопир, диурон, диксантоген, d-лимонен, DMDS, DMPA, DNOC, додеморф, додидин, додин, дофенапин, додин, доминикалур, дорамектин, DPC, дразоксолон, DSMA, d-транс-аллетрин, d-транс-ресметрин, дуфулин, даимурон, EBER, EBP, кадусафос, экдистерон, этридиазол, EDB, EDC, EDDP, эдифенфос, эглиназин, эмаектин, EMPC, эмпентрин, энаденин, эндосульфен, эндотал, эндотал, эндотион, эндрин, энестробурион, имазалил, эноксастробин, хлорфенсон, EPN, эпоколеон, эпофенонан, эпоксиконазол, эприномектин, эпроназ, эпсилон-метофлутрин, эпсилон-момфлуоротрин, EPTC, эрбон, эргокальциферол, эрлуцзияньцаоань, эсдепаллетрин, эсфенвалерат, ESP, эспрокарб, этаселасил, этаконазол, этафос, этем, этабоксам, этахлор, эталфлуралин, этаметсульфурон, этапрохлор, этефон, этидимурон, этиофенкарб, этилат, этион, этиозин, этипрол, этиримол, этоат-метил, этобензанид, этофумезат, этогексадиол, этопроп, этопрофос, этоксифен, этоксикин, этоксисульфурон, этихлорат, этилформиат, этилпирофосфат, этилан, этил-DDD, этилен, этилендибромид, этилендихлорид, окись этилена, этилицин, 2,3-дигидроксипропил меркапид этилртути, этилмеркурацетат, этилмеркуробромид, этилмеркурхлорид, этилмеркурфосфат, этинофен, ЕТМ, этнипромид, этобензанид, этофенпрокс, этоксазол, этридиазол, этримфос, этримфос, эвгенол, EXD, фамоксадон, фамфур, хлорфенак, фенамидон, фенаминосульф, фенаминстробин, фенамифос, фенапанил, фенаримол, фенасулам, феназафлор, феназаквин, фенбуконазол, фенбутатин оксид, фенхлоразол, фенхлорфос, фенклофос, фенклорим, фенетакарб, фенфлутрин, фенфурам, фенгексамид, фенидин, фенитропан, фенитротрион, фензон, фэньцзюньтун, фенобукарб, фенолово, фенопроп, фенотиокарб, феноксакрим, феноксанил, феноксапроп, феноксапроп-Р, феноксасульфен, феноксикарб, фенпиклонил, фенпикоксамид, фенпиритрин, фенпропатрин, фенпропидин, фенпропиморф, фенпиразамин, фенпироксимат, фенквинотрион, фенридазон, фензон, фенсульфотион, фентеракол, фентиапроп, фентион, фентион-этил, фентиапроп, фентин, фентразамид, фентрифанил, фенурон, фенурон-ТСА, фенвалерат, фербам, феримзон, фосфат железа, сульфат железа, фипронил, флампроп, флампроп-М, флазасульфурон, флокумафен, флометоквин, флоникамид, флорасулам, флорпираукифен, флорилпикоксамид, флауакрипирим, флауаиндолизин, флауазифоп, флауазифоп-Р, флауазинам, флауазолат, флауазурон, флубендиамид, флубензимин, флуброцитринат, флукарбазон, флусетосульфурон, флухлоралин, флукофуран, флуциклоксурон, флуцитринат, флудиоксонил, флуенетил, флуенетил, флуенсульфон, флуфенацет, флуфенерим, флуфеникан, флуфеноксурон, флуфеноксистробин, флуфенпрокс, флуфенпир, флуфензин, флуфипрол, флугексафон, флуиндапир, флуметрин, флуметоввер, флуметралин, флуметсулам, флумезин, флумиклорак, флумиоксазин, флумипропин, флуморф, флуометурон, флуопиколид, флуопимомид, флуопирам, флуорбензид, флуоридамид, фторацетамид, фторуксусная кислота, флуорохлоридон, флуородифен, флуорогликофен, фторомид, фторомид, флуоромидин, флуоронитрофен, флуороксипир, флуотиурон, флуотримазол, флуоксапипролин, флуоксастробин, флупоксам, флупропацил, флупропадин, флупропанат, флупирадиурон, флупиримин, флупирсульфурон, флуквинконазол, флураланер, флуразол, флурекол, флуренол, флуридон, флуорохлоридон, флуоромидин, флуороксипир, флуорпримидол, флуорсуламид, флуортамон, флузилазол, флусульфамид, дифловидазин, флутиацет, флутиамид, флутианил, флутоланил, флутриафол, флувалалинат, флуксаметамид, флуксапипроксиад, флукофенин, фолпел, фолпет, фомесафен, фонофос, форамсульфурон, форхлорфенурон, формальдегид, форметанат,

формотион, формпаранат, фосамин, фосетил, фосметилан, фоспират, фостиазат, фоститетан, фронталин, фталид, фуберидазол, фуцаоцин, фуцаоми, фуцзюньманьчжи, этоксифен-этил, кумафурил, фунайхэцаолин, фуфентиомочевина, фурулан, фурулаксил, фураметрин, фураметпир, фуран тебуфенонид, фуратиокарб, фуркарбанил, фурконазол, фурконазол-цис, фуретрин, фурфурол, фурилазол, фурумексиклокс, фуруфанат, фурилоксифен, гамма-ВНС, гамма-цигалотрии, гамма-НСН, генит, гибберелловая кислота, гиббериллин АЗ, гиббереллины, глифтор, глитор, хлоралоза, глюфосинат, глюфосинат-Р, глиодин, глиоксим, глифосат, глифосин, госсиплур, грандлур, гризеофулвин, гуазатин, гуазатин, галакринат, галауоксифен, галфенпрокс, галофенонид, галосафен, галосульфурон, галоксидин, галоксифоп, галоксифоп-Р, галоксифоп-Р, НСА, НСВ, НСН, алтретамин, хемпа, НЕОД, гептахлор, гептафлутрин, гептенофос, гептопаргил, гербимицин, гербимицин А, гетерофос, гексахлор, гексахлоран, гексахлорацетон, гексахлорбензол, гексахлорбутадиеп, гексахлорофен, гексаконазол, гексафлумурон, фентрифанил, гексафлурап, гексалур, гексамид, гексазиноп, гексилтиофос, гекситиазокс, ННДН, голосулф, брассинолид-этил, хуаньцаово, хуаньчунцзин, хуанцаолин, хуаньцзюньцзо, гидраметилнон, гидраргафен, гашеная известь, цианамид, цианистый водород, гидропрен, гидроксизоксазол, гимексазол, хиквинкарб, IAA, IBA, IPR, икаридин, имазаил, имазаметабенз, имазамокс, имазапик, имазапир, имазакин, имазапир, имазосульфурон, имибенконазол, имициафос, имидаклоприд, имидаклолиз, иминоктадин, имипротрин, инабенфид, инданофан, индазифлам, индоксакарб, инезин, инфузорная земля, инпирфлуксам, иодобонил, иодокарб, йодфенфос, йодометан, йодосульфурон, иофенсульфурон, иоксинил, ипазин, IPC, ипконазол, ипфенкарбазон, ипфентрифлуконазол, ипфлуфенонкин, ипробенфос, ипродион, ипроваликарб, ипримидам, ипсдиенол, ипсенол, IPSP, IPX, изамидофос, исазофос, изобензан, изокарбамид, изокарбамид, изокарбофос, изоцил, изоциклосерам, изодрин, изофенфос, изофенфос-метил, изофетамид, изофлуципрам, изолан, изометиозин, изонорурон, изопамфос, изополинат, изопрокарб, изоцил, изопропалин, флуазолат, изопротиолан, изопротурон, изопиразам, изопиримол, изотиоат, изотианил, изоурон, изоваледион, изоксабен, изоксахлортол, изоксадифен, изоксафлутол, изоксапирифоф, изоксатион, изоурон, ивермектин, изоксабен, изопамфос, изопамфос, японилур, жапотрины, жасмолин I, жасмолин II, жасмоновая кислота, цзяхуанчунцзун, цзяцзиценсяолин, цзясяньцзюньчжи, цзецаовань, цзецаоиси, валидамицин А, иодофенфос, ювенильный гормон I, ювенильный гормон II, ювенильный гормон III, кадетрин, каппа-бифентрин, каппа-тефлутрин, карбутилат, каретазан, касугамицин, кэцзюньлинь, келеван, кетоспирадокс, кизельгур, кинетин, кинопрен, киралаксил, крезоксим-метил, куйцаоиси, лактофен, лямбда-цигалотрин, ланкотрион, латилур, арсенат свинца, ленацил, лепимектин, лептофос, бифеназат, полисульфид кальция, линдан, линеатин, линурон, лиримфос, литлур, луплур, лотиланер, люфенурон, цигалодиамид, клацифос, трихлопирикарб, меперфлутрин, клацифос, литидатион, М-74, М-81, МАА, фосфид магния, малатион, малатион, гидразид малеиновой кислоты, малонобен, мальтодекстрин, МАМА, манкоппер, манкозеп, мандестробин, мандипропамид, манеп, матрин, мазидокс, МСС, МСР, МСРА, МСРА-тиоэтил, МСРВ, МСРР, мепенил, мекарбам, мекарбинзид, мекарфон, мекопроп, мекопроп-Р, медуформ, медуотерб, медулур, медунасет, медуноксам, медуфепир, медуфентрифлуконазол, медулуидид, мегатомовая кислота, мелиссильовый спирт, дикумарол, МЕМС, меназон, МЕР, мепанипирим, меперфлутрин, медуенат, медуфософан, мепикват, мепропил, мептиллинокап, меркаптодиметур, меркаптофос, меркаптофос тиол, меркаптоион, хлористая ртуть, окись ртути, хлористая ртуть, мерфос, мерфос оксид, мезопрэзин, мезосульфурон, мезотрион, медусульфен, медусульфенфос, медусульфен, метакрезол, метафлумизон, металаксил, металаксил-М, метальдегид, метам, метамифоп, метамитрон, метафос, метаксон, метазахлор, метазосульфурон, метазоксолон, меткамифен, метконазол, метепа, метфлуразон, метабензтиазурон, метакрифос, металлпропалин, метам, метамидофос, метасульфоккарб, метазол, метфуруксам, метибензулон, метидатион, метиобенкарб, метиокарб, метиопирисульфурон, метиотепа, метиозолин, метиурон, метокрототофос, метолкарб, метометон, метомил, метопрен, метопротрин, метопротрин, метоквин-бутил, метотрин, метоксиклор, метоксифенонид, метоксифенон, метилафолат, метилбромид, метилэвгенол, метилйодид, метилизотиоцианат, метилпаратион, метилацетофос, метилхлороформ, метилдитиокарбаминаовая кислота, метилдимрон, метиленхлорид, метилизофенфос, метилмеркаптофос, метилмеркаптофос оксид, метилмеркаптофос тиоловый, метилртути бензоат, метилртути дициандиамид, пентахлорфенонксид метилртути, метилнеодеканамид, метилнитрофос, метилтриазотион, метиозолин, метирам, метирам-цинк, метобензулон, метобромурон, метофлутрин, метолахлор, метолкарб, трибенурон, метоминостробин, метосулам, метоксадиазон, метоксурон, метрафенон, метирам, метрибузин, метрифонат, метрифонат, метсульфовакс, метсульфурон, метилтетрапрол, мевинфос, мексакарбат, мечувэй, мэшуань, пентметрин, милбемектин, милбемицин оксим, мильнеб, пириминостробин, мипафокс, МIPС, мирекс, MNAF, могочунь, молинат, молосултап, момфлуоротрин, моналид, монисуорон, моноамитраз, монохлоруксусная кислота, монокротофос, монолинуорон, тиосултап-мононатрий, моносулфирам, моносульфурон, моносултап, монурон, монурон-ТСА, морфамкват, мороксидин, морфотион, морзид, моксидектин, MPMC, MSMA, MTMC, мускалур, миклобутанил, миклозолин, мирициловый спирт, N-(этилртуть)-п-толуолсульфонанилид, NAA, NAAm, набам, нафталофос, налед, нафталин, нафталиацетамид, ангидрид нафтойной кислоты, нафталофос, нафтоксиуксусные кислоты, нафтилуксусные кислоты, нафтилиндан-1,3-дионы, нафтилоксиуксусные кислоты, напроанилид, напропамид, напропамид-М, напалам, натамицин, NBPOS, небурон, небурон, недрин, анабазин, никлорфос, никлофен, никлосамид, никобифен, никосульфурон, никотин, никотинсульфат, нифлуридил,

никкомицины, NIP, нипираклофен, нипиралофен, нитенпирам, нитиазин, нитралин, нитрапирин, нитри-лакарб, нитрофен, нитрофлуорфен, нитростирен, нитротал-изопропил, норбормид, нонанол, норбормид, норурон, норфлуразон, норникотин, норурон, новалурон, новифлумурон, NPA, нуаримол, нуранон, ОСН, октахлордипропиловый эфир, октилинон, о-дихлорбензол, офурас, ометоат, о-фенилфенол, орбенкарб, орфралур, орбенкарб, орто-дихлорбензол, ортосульфамурон, орикталур, орисастробин, оризалин, остол, остол, острамон, оватрон, овекс, оксабетринил, оксадиаргил, оксадиазон, оксадиксил, оксамат, оксамил, оксапиразон, оксапиразон, оксасульфурон, оксатиапипролин, оксазикломефон, оксасозулфил, оксиновая медь, оксин-Си, оксолиновая кислота, окспоконазол, оксикарбоксин, оксидеметон-метил, оксидепрофос, оксидисульфотон, оксиенаденин, оксифлуорфен, оксиматрин, окситетрациклин, окситиоквинокс, PAC, паклбутразол, пайчундин, паллетрин, PAP, пара-дихлорбензол, парафлуорон, паракват, паратион, паратион-метил, паринол, парижская зелень, PCNB, PCP, PCP-Na, п-дихлорбензол, PDJ, пебулат, пединекс, пефуразоат, пеларгоновая кислота, пенконазол, пенцикурон, пендиметалин, плифенат, пенфлуфен, пенфлуорон, пендиметалин, пеноксулам, пентахлорфенол, пентахлорфениллаурат, пентанохлор, пентиопирад, пентметрин, пентоксазон, мирекс, перфлуидон, перметрин, петоксамид, PNC, фенамакрил, фенамакрил-этил, фенаминосулфид, феназин оксид, фенетакарб, фенизофам, фенкаптон, фенмедифам, фенмедифам-этил, фенобензулон, фенотиол, фенотрин, фенпроксид, фентоат, фенилмеркуромомочевина, фенилмеркурацетат, фенилмеркурхлорид, производное фенилртути и пирокатехина, фенилмеркурнитрат, фенилмеркурсалицилат, форат, фосацетим, фозалон, фозаметин, фосацетим, фосацетин, фостин, фосдифен, фосетил, фосфолан, фосфолан-метил, фосглицин, фосмет, фоснихлор, фосфамид, фосфамидон, фосфин, фосфинотрицин, фосфокарб, фосфор, фостин, фоксим, фоксим-метил, фталид, фталофос, фталтрин, пикарбутразокс, икаридин, пихлорам, пиколинафен, пикоксистробин, натамицин, пиндон, пиноксаден, пипералин, пиперазин, пиперонилбутоксид, пиперонил циклонен, пиперофос, пипроктанил, пипроктанил, пипротал, пириметафос, пиримикарб, пириминил, пиримиоксифос, пиримифос-этил, пиримифос-метил, пиндон, пивалдион, плифенат, PMA, PMP, полибутены, поликарбамат, полихлоркамфен, полиэтоксихинолин, полиоксин D, полиоксины, полиоксорим, политиалан, арсенит калия, азид калия, цианат калия, этилксантат калия, нафтенат калия, полисульфид калия, тиоцианат калия, pp'-DDT, праллетрин, прекоцен I, прекоцен II, прекоцен III, претилахлор, примидофос, примисульфурон, пробеназол, прохлораз, проклонол, проциазин, процимидон, продиамин, профенофос, профлуазол, профлуралин, профлутрин, профоксидим, профурит-аминий, проглиназин, прогексадион, прогидрожасмон, промацил, промекарб, прометон, прометрин, прометрин, промурит, пронамид, пронитридин, пропахлор, пропафос, пропамидин, пропамокарб, пропанил, пропафос, пропаквизафоп, пропаргит, пропартрин, пропазин, пропетамфос, профам, пропиконазол, пропидин, пропиниб, пропизохлор, пропоксур, пропоксикарбазон, пропилизом, пропирисульфурон, пропизамид, проквиназид, просулер, просульфалин, просульфоккарб, просульфурон, протидатион, протидокарб, протидокназол, протидофос, протоат, протрифенбут, проксан, примидофос, принахлор, псорален, псорален, пиданон, пидифлуметофен, пифлбумид, пиметрозин, пиракарболид, пираклофос, пираклонил, пиракlostробин, пирафлуфен, пирафлупрол, пирамат, пираметостробин, пираоксистробин, пирапропон, пирасульфотол, пиразифлумид, пиразолат, пиразолилат, пиразон, пиразофос, пиразосульфурон, пиразотион, пиразоксифен, пиресметрин, пиретрин I, пиретрин II, пиретрины, пирибамбенз-изопропил, пирибамбенз-пропил, пирибенкарб, пирибензоксим, пирибутикарб, пирихлор, пиридабен, пиридахлометил, пиридафол, пиридалил, пиридафентион, пиридафентион, пиридат, пиридинитрил, пирифенокс, пирифлуквиназон, пирифталид, пириметафос, пириметанил, пиримикарб, пиримидифен, пириминобак, пириминостробин, пиримифос-этил, пиримифос-метил, пиримисульфам, пиримитат, пиринурон, пириофенон, пирипрол, пирипропанол, пирипроксифен, пиризоксазол, пириитиобак, пириолан, пириоквилон, пириоксасульфен, пириоксулам, пириоксихлор, пириоксифур, флутиацет, цинкулин, квассия, квинацетол, квиналфос, квиналфос-метил, квиназамид, квинкларак, квинконазол, квинмерак, квинокламин, квинофумелин, хинометионат, квинонамид, квинотион, квиноксифен, квинтиофос, квинтозен, квизалофоп, квизалофоп-Р, цювэньчжи, цюйиндин, рабензазол, рафоксанид, R-диниконазол, ребемид, реглон, римсульфурон, рескалур, ресметрин, родетанил, родожапонин-III, рибавирин, римсульфурон, ризазол, R-металаксил, родетанил, фенхлорфос, ротенон, риания, сабадилла, сафлуфенацил, сайцзюньмао, сайсэньтун, салициланилид, салифлуофен, сангвинарин, сантонин, S-биоаллетрин, шрадан, скиллирозид, себутилазин, секбуметон, седаксан, селеамектин, семиамитраз, сезамекс, сезамолин, дизул, сетоксидим, карбарил, шуаньцзянцаолин, шуаньцзяннаньцаолин, гидропрен, сидурон, тетраметилфлутрин, сиглур, силафлуофен, силатран, силикатный аэрогель, силикагель, силтиофам, силтиофам, силтиофан, фенопроп, симазин, симеконазол, симетон, симетрин, симетрин, синтофен, кинопрен, гашеная известь, SMA, метопрен, S-метолахлор, арсенит натрия, азид натрия, хлорат натрия, цианид натрия, фторид натрия, фтор-ацетат натрия, гексафторсиликат натрия, нафтенат натрия, о-фенилфеноксид натрия, ортофенилфенол натрия, пентахлорфенолят натрия, пентахлорфенолят натрия, полисульфид натрия, кремнефтористый натрий, тетрадиокарбонат натрия, натрий роданистый, пентанохлор, софамид, спинеторам, спиносид, спиридиклофен, спирумезифен, спирипидион, спириротетрамат, спируксамин, стирофос, стрептомицин, стрихнин, сулкатол, сулкофурон, сулькотрион, сульфаллат, сульфепирам, сульфлурамид, этидимурон, сульфометурон, сульфосат, сульфосульфурон, сульфотеп, сульфотеп, сульфоксафлор, сульфоксид, сульфоксим, сера, серная кислота, сульфурилфторид, сулгликапин, сульфосат, сульпрофос,

сультропен, свеп, тау-флювалинат, таврон, тазимкарб, ТВТО, ТВЗ, ТСА, ТСВА, ТСМТВ, ТСНВ, TDE, тебуконазол, тебуфенозид, тебуфенпирад, тебуфлуквин, тебупиримфос, тебутам, тебутиурон, теклофтам, текназен, текорам, тедион, тефлubenзурон, тефлутрин, тефурилтрион, темботрион, темефос, темефос, тепа, ТЕРР, тепралоксидим, тепролоксидим, тераллетрин, тербацил, тербукарб, тербухлор, тербуфос, тербуметон, тербутилазин, тербутол, тербутрин, тербутрин, квинтозен, окситетрациклин, окситетрациклин, тетсикласис, тетфлупиролимет, тетрахлорантранилипрол, тетрахлорэтан, тетрахлорвинфос, тетраконазол, тетрадифон, тетрадисул, тетрафлурон, тетраметрин, тетраметилфлутрин, тетрамин, тетранактин, тетранилипрол, тетрапион, тетрасул, сульфат таллия, сульфат таллия, тенилхлор, тета-циперметрин, тиабендазол, тиаклоприд, тиадиазин, тиадифлуор, тиаметоксам, тиаметурон, тиапронил, тиазифлуорон, тиазфлуорон, тиазон, тиазопир, тикрофос, тициофен, тидиазимин, тидиазулон, тиенкарбазон, тифенсульфулон, тифлузамид, тиомерсал, форат, тиобенкарб, тиокарбоксим, тиохлорфенфим, тиохлорфенфим, динитророданбензолы, тиоциклам, эндосульфам, тиодиазол-медь, тиодикарб, тиофаноккарб, тиофанокс, тиофлуоксимат, тиохемпа, тиомерсал, тиометон, тионазин, тиофанат, тиофанат-этил, тиофанат-метил, тиофос, тиоквинокс, тиосемикарбазид, тиосултап, тиотепа, тиоксамил, тирам, тирам, туринггенсин, тиабендазол, тиадинил, тиафеназил, тиаозеань, ТiBA, тифатол, тиокарбазил, тиоклорим, тиоксазафен, тиоксимид, тирпат, ТМТD, толклофос-метил, толфенпирад, толпрокарб, толпиралат, толифлуанид, толилфлуанид, толилмеркурацетат, кумафурил, топрамезон, токсафен, ТPN, тралкоксидим, тралоцитрин, тралометрин, тралопирил, трансфлутрин, трансперметрин, третамин, триаконтанол, триадимефон, триадименол, триафамон, триаллат, триаллат, триамифос, триапентенол, триаратен, триаримол, триасульфурон, триазамат, триазбутил, триазилам, триазофос, триазотион, триазоксид, трехосновный хлорид меди, трехосновный сульфат меди, трибенурон, трибуфос, трибутилолова оксид, трикамба, трихламид, трихлопир, трихлорфон, трихлорметафос-3, трихлоронат, трихлоронат, трихлортринитробензолы, трихлорфон, трихлопир, трихлопирикарб, трикрезол, трициклазол, цихексантин, тридеморф, тридифан, триэтазин, трифенморф, трифенофос, трифлуксистеробин, трифлуксисульфурон, трифлудимоксазин, трифлумезопирим, трифлумизол, трифлумурон, трифлуралин, трифлусульфурон, трифон, трифонсим, трифорин, тригидрокситриазин, тримедлур, триметакарб, триметурон, тринексапак, фентин, трипреп, трипропиндан, триптолид, тритак, тритиалан, тритиконазол, тритосульфурон, трунк-колл, трибуфос, тиклопирозофлор, униканозол, униканозол-Р, урбацид, уредена, валерат, валидамицин, валидамицин А, валифеналат, валон, ванидотион, вангард, ванилипрол, вернолат, винклозолин, витамин D3, варфарин, сяочунлююлинь, синьцзюньань, фенаминстробин, эноксастробин, ХМС, ксилахлор, ксиленолы, ксилкарб, цимиазол, ишицзин, зариламид, зеатин, цзэнсяоань, диетолат, зета-циперметрин, нафтенат цинка, фосфид цинка, цинк-тиазол, цинк-тиазол, трихлорфенолит цинка, трихлорфеноксид цинка, цинеб, цирам, золапрофос, варфарин, зоксамид, пираметостробин, кафенстрол, пираоксистеробин, цзомихуанлун, α -хлоргидрин, α -экдизон, α -мултистриатин, α -нафталинуксусные кислоты и β -экдизон;

(2) следующие соединения в табл. 1.

Таблица 1

Структура № M - активные ингредиенты

№M	Структура
M1	<p>R = CH, N R₁ = H, Me</p>
M2	
M3	
M4	

При использовании в настоящем изобретении каждое из вышеуказанного является активным ингредиентом. Для получения большей информации обратитесь за материалами, перечисленными в "Ката-

лог общих названий пестицидов", находящемся на Alanwood.net, и различных изданиях "Справочника пестицидов", включая онлайн-издание, находящееся на bcpdata.com.

Особенно предпочтительный выбор активных ингредиентов представляет собой 1,3-дихлорпропен, хлорантранилипрол, хлорпирифос, циантранилипрол, гексафлумурон, метомил, метоксифенозид, новифлумурон, оксамил, спинеторам, спиносид, сульфоксафлор и трифлумезопирим (далее "AIGA-2").

Кроме того, другой особенно предпочтительный выбор активных ингредиентов представляет собой ацекиноцил, ацетамиприд, ацетопрол, авермектин, азинфос-метил, бифеназат, бифентрин, карбарил, карбофуран, хлорфенапир, хлорфлуазурон, хромафенозид, клотианидин, цифлутрин, циперметрин, дельтаметрин, диафентиурон, эмамектин бензоат, эндосульфат, эсфенвалерат, этипрол, этоксазол, фипронил, флониамид, флуакипирим, гамма-цигалотрин, галофенозид, индосакарб, лямбда-цигалотрин, луфенурон, малатион, метомил, новалурон, перметрин, пиридалил, пиримидифен, спироциклофен, тебуфенозид, тиаклоприд, тиаметоксам, тиодикарб, толфенпирад и зета-циперметрин (далее "AIGA-3").

Термин "биопестицид" означает микробное биологическое средство для борьбы с вредителями, которое, как правило, применяется аналогичным образом, что и химические пестициды. Обычно они являются бактериальными, но также существуют примеры грибковых средств борьбы, включая *Trichoderma spp.* и *Ampelomyces quisqualis*. Одним широко известным примером биопестицида является вид *Bacillus*, бактериальное заболевание *Lepidoptera*, *Coleoptera* и *Diptera*. Биопестициды включают продукты на основе энтомопатогенных грибов (например, *Metarhizium anisopliae*), энтомопатогенных нематод (например, *Steinernema feltiae*) и энтомопатогенных вирусов (например, грануловируса *Cydia pomonella*). Другие примеры энтомопатогенных организмов включают без ограничения бакуловирусы, простейшие и микроспоридии. Во избежание сомнений, биопестициды являются активными ингредиентами.

Термин "место обитания" означает среду обитания, место размножения, растение, семя, почву, материал или среду, где вредитель растёт, может расти или может присутствовать. Например, место обитания может представлять собой: зону, где выращивают сельскохозяйственные культуры, деревья, плодовые деревья, злаковые культуры, виды кормовых растений, вьющиеся растения, травяные растения и/или декоративные растения; зону, где постоянно находятся одомашненные животные; внутренние и внешние поверхности зданий (таких как места, где хранят зерно); строительные материалы, используемые для зданий (такие как пропитанная древесина); и почва вокруг зданий.

Выражение "MoA-материал" означает активный ингредиент с механизмом действия ("MoA"), указанным в Классификации MoA версии 8.3 от IRAC, находящейся на сайте irac-online.org, где описаны следующие группы.

(1) Ингибиторы ацетилхолинэстеразы (AChE), включают следующие активные ингредиенты: аланикарб, альдикарб, бендиокарб, бенфуракарб, бутоксикарб, бутоксикарб, карбарил, карбофуран, карбосульфат, этиофенкарб, фенобукарб, форметанат, фуратиокарб, изопрокарб, метиокарб, метомил, метолкарб, оксамил, пиримикарб, пропоксур, тиодикарб, тиофанокс, триазамат, триметакарб, ХМС, ксилкарб, ацефат, азаметифос, азинфос-этил, азинфос-метил, кадусафос, хлорэтоксифос, хлорфенвинфос, хлормефос, хлорпирифос, хлорпирифос-метил, кумафос, цианофос, деметон-S-метил, диазинон, дихлорвос/DDVP, дикротофос, диметоат, диметилвинфос, дисульфотон, EPN, этион, этопрофос, фамфур, фенамифос, фенитротрион, фентион, фосиазат, гептенофос, изофенфос, изоксатион, малатион, мекарбам, метамидофос, метидатион, мевинфос, монокротофос, налед, ометоат, оксидеметон-метил, паратион, паратион-метил, фентоат, фозалон, форат, фосмет, фосфамидон, фоксим, профенофос, пропетамфос, протиофос, пираклофос, пиридафентион, квиналфос, сульфотеп, тебупиримфос, темефос, тербуфос, тетрахлофвинфос, тиометон, триазофос, трихлорфон, вимидотион, пиримифос-метил, имицифос и изопропил-о-(метоксиаминотио-фосфорил)салицилат.

(2) Антагонисты GABA-зависимых хлоридных каналов включают следующие активные ингредиенты: хлордан, эндосульфат, этипрол и фипронил.

(3) Модуляторы натриевых каналов включают следующие активные ингредиенты: акринатрин, аллетрин, d-цис-транс-аллетрин, d-транс-аллетрин, бифентрин, биоаллетрин, биоаллетрин-S-циклопентенил, биоресметрин, циклопротрин, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, лямбда-цигалотрин, гамма-цигалотрин, циперметрин, альфа-циперметрин, бета-циперметрин, тета-циперметрин, зета-циперметрин, цифенотрин [(1R)-транс-изомеры], дельтаметрин, эмпентрин [(EZ)-(1R)-изомеры], эсфенвалерат, этофенпрокс, фенпропатрин, фенвалерат, флуцитринат, флуметрин, тау-флювалинат, кадетрин, пиретрины (романтик), галфенпрокс, фенотрин [(1R)-транс-изомер], праллетрин, ресметрин, силафлуофен, тефлутрин, тетраметрин, тетраметрин [(1R)-изомеры], тралометрин, трансфлутрин, перметрин, DDT и метоксихлор.

(4) Агонисты никотинового ацетилхолинового рецептора (nAChR) включают следующие активные ингредиенты:

(4A) ацетамиприд, клотианидин, динотефуран, имидаклоприд, нитенпирам, тиаклоприд, тиаметоксам,

(4B) никотин,

(4C) сульфоксафлор,

(4D) флупирадифурон и

- (4E) трифлумезопирим.
- (5) Аллостерические активаторы никотинового ацетилхолинового рецептора (nAChR) включают следующие активные ингредиенты: спинеторам и спиносад.
- (6) Активаторы хлоридных каналов включают следующие активные ингредиенты: абамектин, эма-мектин-бензоат, лепимектин и милбемектин.
- (7) Миметики ювенильного гормона включают следующие активные ингредиенты: гидропрен, кинопрен, метопрен, феноксикарб и пирипроксифен.
- (8) Различные неспецифические ингибиторы (относящиеся к нескольким сайтам) включают следующие активные ингредиенты: метилбромид, хлорпикрин, криолит, сульфурилфторид, буру, борную кислоту, октаборат натрия, борат натрия, метаборат натрия, антимонилтарtrat калия, диазомет и метам.
- (9) Модуляторы каналов TRPV хордотональных органов включают следующие активные ингредиенты: афидопиропен, пиметрозин и пирифлуквиназон.
- (10) Ингибиторы роста клещей включают следующие активные ингредиенты: клофентезин, гекситазокс, дифловидазин и этоксазол.
- (11) Микробные разрушители мембран средней кишки насекомых включают следующие активные ингредиенты: *B.t. var. israelensis*, *B.t. var. aizawai*, *B.t. var. kurstaki*, *B.t. var. tenebrionensis* и *Bacillus sphaericus*.
- (12) Ингибиторы митохондриальной АТФ-синтазы включают следующие активные ингредиенты: тетрадифон, пропаргит, азоциклотин, цигексатин, фенбутатин-оксид и диафентиурон.
- (13) Разобщающие средства окислительного фосфорилирования, действующие посредством нарушения протонного градиента, включают следующие активные ингредиенты: хлорфенапир, DNOC и сульфлурамид.
- (14) Блокаторы каналов никотинового ацетилхолинового рецептора (nAChR) включают следующие активные ингредиенты: бенсултап, картапа гидрохлорид, тиоциклам и тиосултап-натрий.
- (15) Ингибиторы биосинтеза хитина, тип 0, включают следующие активные ингредиенты: бистрифлурон, хлорфлуазурон, дифлубензурон, флуциклоксурон, флуфеноксурон, гексафлумурон, люфенурон, новалурон, новифлумурон, тефлубензурон и трифлумурон.
- (16) Ингибиторы биосинтеза хитина, тип 1, включают следующий активный ингредиент: бупрофезин.
- (17) Средство, нарушающее линьку двукрылых, включает следующий активный ингредиент: циромазин.
- (18) Агонисты рецептора экдизона включают следующие активные ингредиенты: хромафенозид, галофенозид, метоксифенозид и тебуфенозид.
- (19) Агонисты рецептора октопамина включают следующий активный ингредиент: амитраз.
- (20) Ингибиторы транспорта электронов с помощью митохондриального комплекса III включают следующие активные ингредиенты: гидраметилон, ацеквиноцил, бифеназат и флауакрипирим.
- (21) Ингибиторы транспорта электронов с помощью митохондриального комплекса I включают следующие активные ингредиенты: феназаквин, фенпироксимат, пиримидифен, пиридабен, тебуфенпират, толфенпират и ротенон.
- (22) Блокаторы потенциалозависимых натриевых каналов включают следующие активные ингредиенты: индоксакарб и метафлумизон.
- (23) Ингибиторы ацетил-СоА-карбоксилазы включают следующие активные ингредиенты: спиро-диклофен, спиромезифен и спиротетрамат.
- (24) Ингибиторы транспорта электронов с помощью митохондриального комплекса IV включают следующие активные ингредиенты: фосфид алюминия, фосфид кальция, фосфин, фосфид цинка и цианид.
- (25) Ингибиторы транспорта электронов с помощью митохондриального комплекса II включают следующие активные ингредиенты: циенопирафен, цифлуметофен и пифлубумид.
- (28) Модуляторы рецептора рианодина включают следующие активные ингредиенты: хлорантранилипрол, циантранилипрол и флубендиамид.
- (29) Модуляторы хордотональных органов с неопределенным целевым сайтом включают следующий активный ингредиент: флоникамид.

Группы 26 и 27 не определены в данной версии схемы классификации. Кроме того, существует группа UN, которая содержит активные ингредиенты неизвестного или неопределенного механизма действия. Данная группа включает следующие активные ингредиенты: азадирахтин, бензоксимат, бромпропилат, хинометионат, дикофол, пептид GS-омега/каппа HXTX-Hv1a, сернистую известь, пиридалил и серу.

Термин "вредитель" означает организм, который приносит ущерб людям или деятельности человека (например, касающейся сельскохозяйственных культур, пищевых продуктов, домашнего скота и т.д.), при этом указанный организм относится к типам Arthropoda, Mollusca или Nematoda. Конкретными примерами являются муравьи, тли, клопы постельные, жуки, щетинохвостки, гусеницы, тараканы, сверчки,

уховертки, блохи, мухи, кузнечики, червовидные личинки, шершни, цикадки настоящие, цикадки, вши, саранча, личинки насекомых, войлочники, клещи, моли, нематоды, слепняки, фулгориоды, листоблошки, сидячебрюхие, щитовки, чешуйницы, слизни, улитки, пауки, ногохвостки, щитники, симфилы, термиты, трипсы, иксодовые клещи, осы, белокрылки и проволочники.

Дополнительными примерами вредителей являются следующие.

(1) Подтипы Chelicerata, Myriapoda и Hexapoda.

(2) Классы: Arachnida, Symphyla и Insecta.

(3) Отряд Anoplura. Неисключительный перечень конкретных родов включает без ограничения *Haematopinus* spp., *Hoplopleura* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Polyplax* spp., *Solenopotes* spp. и *Neohaematopinus* spp. Неисключительный перечень конкретных видов включает без ограничения *Haematopinus asini*, *Haematopinus suis*, *Linognathus setosus*, *Linognathus ovillus*, *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus humanus*, и *Pthirus pubis*.

(4) Отряд Coleoptera. Неисключительный перечень конкретных родов включает без ограничения *Acanthoscelides* spp., *Agriotes* spp., *Anthonomus* spp., *Apion* spp., *Apogonia* spp., *Araecerus* spp., *Aulacophora* spp., *Bruchus* spp., *Cerosterna* spp., *Cerotoma* spp., *Ceutorhynchus* spp., *Chaetocnema* spp., *Colaspis* spp., *Ctenicera* spp., *Curculio* spp., *Cyclocephala* spp., *Diabrotica* spp., *Dinoderus* spp., *Gnathocerus* spp., *Hemicoelus* spp., *Heterobostrichus* spp., *Hypera* spp., *Ips* spp., *Lyctus* spp., *Megascelis* spp., *Meligethes* spp., *Mezium* spp., *Niptus* spp., *Otiorynchus* spp., *Pantomorus* spp., *Phyllophaga* spp., *Phyllotreta* spp., *Ptinus* spp., *Rhizotrogus* spp., *Rhynchites* spp., *Rhynchophorus* spp., *Scolytus* spp., *Sphenophorus* spp., *Sitophilus* spp., *Tenebrio* spp. и *Tribolium* spp. Неисключительный перечень конкретных видов включает без ограничения *Acanthoscelides obtectus*, *Agrilus planipennis*, *Ahasverus advena*, *Alphitobius diaperinus*, *Anoplophora glabripennis*, *Anthonomus grandis*, *Anthrenus verbasci*, *Anthrenus falvipes*, *Ataenius spretulus*, *Atomaria linearis*, *Attagenus unicolor*, *Bothynoderes punctiventris*, *Bruchus pisorum*, *Callosobruchus maculatus*, *Carpophilus hemipterus*, *Cassida vittata*, *Cathartus quadricollis*, *Cerotoma trifurcata*, *Ceutorhynchus assimilis*, *Ceutorhynchus napi*, *Conoderus scalaris*, *Conoderus stigmus*, *Conotrachelus nenuphar*, *Cotinis nitida*, *Crioceris asparagi*, *Cryptolestes ferrugineus*, *Cryptolestes pusillus*, *Cryptolestes turcicus*, *Cylindrocaptus adspersus*, *Deporaus marginatus*, *Dermestes lardarius*, *Dermestes maculatus*, *Epilachna varivestis*, *Euvrilletta peltata*, *Faustinus cubae*, *Hylobius pales*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypothenemus hampei*, *Lasioderma serricorne*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Limonius canus*, *Liogenys fuscus*, *Liogenys suturalis*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lophocateres pusillus*, *Lyctus planicollis*, *Maecolaspis joliveti*, *Melanotus communis*, *Meligethes aeneus*, *Melolontha melolontha*, *Necrobia rufipes*, *Oberea brevis*, *Oberea linearis*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus mercator*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Oulema melanopus*, *Oulema oryzae*, *Phyllophaga cuyabana*, *Polycaon stoutti*, *Popillia japonica*, *Prostephanus truncatus*, *Rhyzopertha dominica*, *Sitona lineatus*, *Sitophilus granarius*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Stegobium paniceum*, *Tenebroides mauritanicus*, *Tribolium castaneum*, *Tribolium confusum*, *Trogoderma granarium*, *Trogoderma variabile*, *Xestobium rufovillosum*, и *Zabrus tenebrioides*.

(5) Отряд Dermaptera. Неисключительный перечень конкретных видов включает без ограничения *Forficula auricularia*.

(6) Отряд Blattaria. Неисключительный перечень конкретных видов включает без ограничения *Blattella germanica*, *Blattella asahinai*, *Blatta orientalis*, *Blatta lateralis*, *Parcoblatta pennsylvanica*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta australasiae*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Pycnoscelus surinamensis*, и *Supella longipalpa*.

(7) Отряд Diptera. Неисключительный перечень конкретных родов включает без ограничения *Aedes* spp., *Agromyza* spp., *Anastrepha* spp., *Anopheles* spp., *Bactrocera* spp., *Ceratitis* spp., *Chrysops* spp., *Cochliomyia* spp., *Contarinia* spp., *Culex* spp., *Culicoides* spp., *Dasineura* spp., *Delia* spp., *Drosophila* spp., *Fannia* spp., *Hylemya* spp., *Liriomyza* spp., *Musca* spp., *Phorbia* spp., *Pollenia* spp., *Psychoda* spp., *Simulium* spp., *Tabanus* spp. и *Tipula* spp. Неисключительный перечень конкретных видов включает без ограничения *Agromyza frontella*, *Anastrepha suspensa*, *Anastrepha ludens*, *Anastrepha obliqua*, *Bactrocera cucurbitae*, *Bactrocera dorsalis*, *Bactrocera invadens*, *Bactrocera zonata*, *Ceratitis capitata*, *Dasineura brassicae*, *Delia platura*, *Fannia canicularis*, *Fannia scalaris*, *Gasterophilus intestinalis*, *Gracillia perseae*, *Haematobia irritans*, *Hypoderma lineatum*, *Liriomyza brassicae*, *Liriomyza sativa*, *Melophagus ovinus*, *Musca autumnalis*, *Musca domestica*, *Oestrus ovis*, *Oscinella frit*, *Pegomya betae*, *Piophilina casei*, *Psila rosae*, *Rhagoletis cerasi*, *Rhagoletis pomonella*, *Rhagoletis mendax*, *Sitodiplosis mosellana*, и *Stomoxys calcitrans*.

(8) Отряд Hemiptera. Неисключительный перечень конкретных родов включает без ограничения *Adelges* spp., *Aulacaspis* spp., *Aphrophora* spp., *Aphis* spp., *Bemisia* spp., *Ceroplastes* spp., *Chionaspis* spp., *Chrysomphalus* spp., *Coccus* spp., *Empoasca* spp., *Euschistus* spp., *Lepidosaphes* spp., *Lagynotomus* spp., *Lygus* spp., *Macrosiphum* spp., *Nephotettix* spp., *Nezara* spp., *Nilaparvata* spp., *Philaenus* spp., *Phytocoris* spp., *Piezodorus* spp., *Planococcus* spp., *Pseudococcus* spp., *Rhopalosiphum* spp., *Saissetia* spp., *Therioaphis* spp., *Toumeyella* spp., *Toxoptera* spp., *Trialeurodes* spp., *Triatoma* spp. и *Unaspis* spp. Неисключительный перечень конкретных видов включает без ограничения *Acrosternum hilare*, *Acyrtosiphon pisum*, *Aleyrodes proletella*, *Aleurodicus dispersus*, *Aleurothrix floccosus*, *Amrasca biguttula biguttula*, *Aonidiella aurantii*, *Aphis fabae*, *Aphis gossypii*, *Aphis glycines*, *Aphis pomi*, *Aulacorthum solani*, *Bactericera cockerelli*, *Bagrada hilaris*, *Bemisia argentifolii*, *Bemisia tabaci*, *Blissus leucopterus*, *Boisea trivittata*, *Brachycorynella asparagi*, *Brevinnia*

rehi, *Brevicoryne brassicae*, *Cacopsylla pyri*, *Cacopsylla pyricola*, *Calocoris norvegicus*, *Ceroplastes rubens*, *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Coccus pseudomagnoliarum*, *Dagbertus fasciatus*, *Dichelops furcatus*, *Diuraphis noxia*, *Diaphorina citri*, *Dysaphis plantaginea*, *Dysdercus suturellus*, *Edessa meditaabunda*, *Empoasca vitis*, *Eriosoma lanigerum*, *Erythroneura elegantula*, *Eurygaster maura*, *Euschistus conspersus*, *Euschistus heros*, *Euschistus servus*, *Halyomorpha halys*, *Helopeltis antonii*, *Hyalopterus pruni*, *Helopeltis antonii*, *Helopeltis theivora*, *Icerya purchasi*, *Idioscopus nitidulus*, *Jacobiasca formosana*, *Laodelphax striatellus*, *Lecanium corni*, *Leptocorisa oratorius*, *Leptocorisa varicornis*, *Lygus hesperus*, *Maconellicoccus hirsutus*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Macrosiphum granarium*, *Macrosiphum rosae*, *Macrosteles quadrilineatus*, *Mahanarva frimbiolata*, *Megacopta cribraria*, *Metopolophium dirhodum*, *Mictis longicornis*, *Myzus persicae*, *Nasonovia ribisnigri*, *Nephotetix cincticeps*, *Neurocolpus longirostris*, *Nezara viridula*, *Nilaparvata lugens*, *Paracoccus marginatus*, *Paratrioza cockerelli*, *Parlatoria pergandii*, *Parlatoria ziziphi*, *Peregrinus maidis*, *Phylloxera vitifoliae*, *Physokermes piceae*, *Phytocoris californicus*, *Phytocoris relativus*, *Piezodorus guildinii*, *Planococcus citri*, *Planococcus ficus*, *Poeciloscaphus lineatus*, *Psallus vaccinicola*, *Pseudacysta perseae*, *Pseudococcus brevipes*, *Quadraspidiotus perniciosus*, *Rhopalosiphum maidis*, *Rhopalosiphum padi*, *Saissetia oleae*, *Scaptocoris castanea*, *Schizaphis graminum*, *Sitobion avenae*, *Sogatella furcifera*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Trialeurodes abutiloneus*, *Unaspis yanonensis*, и *Zulia entrerriana*.

(9) Отряд Hymenoptera. Неисключительный перечень конкретных родов включает без ограничения *Acromyrmex* spp., *Atta* spp., *Camponotus* spp., *Diprion* spp., *Dolichovespula* spp., *Formica* spp., *Monomorium* spp., *Neodiprion* spp., *Paratrechina* spp., *Pheidole* spp., *Pogonomyrmex* spp., *Polistes* spp., *Solenopsis* spp., *Technomyrmex* spp., *Tetramorium* spp., *Vespula* spp., *Vespa* spp. и *Xylocopa* spp. Неисключительный перечень конкретных видов включает без ограничения *Athalia rosae*, *Atta texana*, *Caliroa cerasi*, *Cimbex americana*, *Iridomyrmex humilis*, *Linepithema humile*, *Mellifera Scutellata*, *Monomorium minimum*, *Monomorium pharaonis*, *Neodiprion sertifer*, *Solenopsis invicta*, *Solenopsis geminata*, *Solenopsis molesta*, *Solenopsis richteri*, *Solenopsis xyloni*, *Tapinoma sessile*, и *Wasmannia auropunctata*.

(10) Отряд Isoptera. Неисключительный перечень конкретных родов включает без ограничения *Coptotermes* spp., *Cornitermes* spp., *Cryptotermes* spp., *Heterotermes* spp., *Kaloterms* spp., *Incisitermes* spp., *Macrotermes* spp., *Marginitermes* spp., *Microcerotermes* spp., *Procornitermes* spp., *Reticulitermes* spp., *Schedorhinotermes* spp. и *Zootermopsis* spp. Неисключительный перечень конкретных видов включает без ограничения *Coptotermes acinaciformis*, *Coptotermes curvignathus*, *Coptotermes frenchi*, *Coptotermes formosanus*, *Coptotermes gestroi*, *Cryptotermes brevis*, *Heterotermes aureus*, *Heterotermes tenuis*, *Incisitermes minor*, *Incisitermes snyderi*, *Microtermes obesi*, *Nasutitermes corniger*, *Odontotermes formosanus*, *Odontotermes obesus*, *Reticulitermes banyulensis*, *Reticulitermes grassei*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes hageni*, *Reticulitermes hesperus*, *Reticulitermes santonensis*, *Reticulitermes speratus*, *Reticulitermes tibialis*, и *Reticulitermes virginicus*.

(11) Отряд Lepidoptera. Неисключительный перечень конкретных родов включает без ограничения *Adoxyphyes* spp., *Agrotis* spp., *Argyrotaenia* spp., *Cacoecia* spp., *Caloptilia* spp., *Chilo* spp., *Chrysodeixis* spp., *Colias* spp., *Crambus* spp., *Diaphania* spp., *Diatraea* spp., *Earias* spp., *Ephestia* spp., *Epimecis* spp., *Feltia* spp., *Gortyna* spp., *Helicoverpa* spp., *Heliothis* spp., *Indarbela* spp., *Lithocolletis* spp., *Loxagrotis* spp., *Malacosoma* spp., *Nemapogon* spp., *Peridroma* spp., *Phyllonorycter* spp., *Pseudaletia* spp., *Plutella* spp., *Sesamia* spp., *Spodoptera* spp., *Synanthedon* spp. и *Yponomeuta* spp. Неисключительный перечень конкретных видов включает без ограничения *Achaea janata*, *Adoxyphyes orana*, *Agrotis ipsilon*, *Alabama argillacea*, *Amorbia cuneana*, *Amyelois transitella*, *Anacamptodes defectaria*, *Anarsia lineatella*, *Anomis sabulifera*, *Anticarsia gemmatalis*, *Archips argyrospila*, *Archips rosana*, *Argyrotaenia citrana*, *Autographa gamma*, *Bonagota cranaodes*, *Borbo cinnara*, *Bucculatrix thurberiella*, *Capua reticulana*, *Carposina niponensis*, *Chlumetia transversa*, *Choristoneura rosaceana*, *Cnaphalocrocis medinalis*, *Conopomorpha cramerella*, *Corcyra cephalonica*, *Cossus cossus*, *Cydia caryana*, *Cydia funebrana*, *Cydia molesta*, *Cydia nigricana*, *Cydia pomonella*, *Darna diducta*, *Diaphania nitidalis*, *Diatraea saccharalis*, *Diatraea grandiosella*, *Earias insulana*, *Earias vittella*, *Ecdytolopha aurantium*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Ephestia cautella*, *Ephestia elutella*, *Ephestia kuehniella*, *Epinotia aporema*, *Epiphyas postvittana*, *Erionota thrax*, *Estigmene acrea*, *Eupoecilia ambiguella*, *Euxoa auxiliaris*, *Galleria mellonella*, *Grapholita molesta*, *Hedylepta indicata*, *Helicoverpa armigera*, *Helicoverpa zea*, *Heliothis virescens*, *Hellula undalis*, *Keiferia lycopersicella*, *Leucinodes orbonalis*, *Leucoptera coffeella*, *Leucoptera malifoliella*, *Lobesia botrana*, *Loxagrotis albicosta*, *Lymantria dispar*, *Lyonetia clerkella*, *Mahasena corbetti*, *Mamestra brassicae*, *Manduca sexta*, *Maruca testulalis*, *Metisa plana*, *Mythimna unipuncta*, *Neoleucinodes elegantalis*, *Nymphula depunctalis*, *Operophtera brumata*, *Ostrinia nubilalis*, *Oxydia vesulia*, *Pandemis cerasana*, *Pandemis heparana*, *Papilio demodocus*, *Pectinophora gossypiella*, *Peridroma saucia*, *Perileucoptera coffeella*, *Phthorimaea operculella*, *Phyllocnistis citrella*, *Phyllonorycter blancardella*, *Pieris rapae*, *Plathypena scabra*, *Platynota idaeusalis*, *Plodia interpunctella*, *Plutella xylostella*, *Polychrosis viteana*, *Prays endocarpa*, *Prays oleae*, *Pseudaletia unipuncta*, *Pseudoplusia includens*, *Rachiplusia nu*, *Scirpophaga incertulas*, *Sesamia inferens*, *Sesamia nonagrioides*, *Setora nitens*, *Sitotroga cerealella*, *Sparganothis pilleriana*, *Spodoptera exigua*, *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera eridania*, *Thecla basilides*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*, *Trichoplusia ni*, *Tuta absoluta*, *Zeuzera coffeae*, и *Zeuzera pyrina*.

(12) Отряд Mallophaga. Неисключительный перечень конкретных родов включает без ограничения

Anaticola spp., Bovicola spp., Chelopistes spp., Goniodes spp., Menacanthus spp. и Trichodectes spp. Неисключительный перечень конкретных видов включает без ограничения Bovicola bovis, Bovicola caprae, Bovicola ovis, Chelopistes meleagridis, Goniodes dissimilis, Goniodes gigas, Menacanthus stramineus, Menopon gallinae, и Trichodectes canis.

(13) Отряд Orthoptera. Неисключительный перечень конкретных родов включает без ограничения Melanoplus spp. и Pterophylla spp. Неисключительный перечень конкретных видов включает без ограничения Acheta domesticus, Anabrus simplex, Gryllotalpa africana, Gryllotalpa australis, Gryllotalpa brachyptera, Gryllotalpa hexadactyla, Locusta migratoria, Microcentrum retinerve, Schistocerca gregaria, и Scudderia furcata.

(14) Отряд Psocoptera. Неисключительный перечень конкретных видов включает без ограничения Liposcelis decolor, Liposcelis entomophila, Lachesilla quercus, и Trogium pulsatorium.

(15) Отряд Siphonaptera. Неисключительный перечень конкретных видов включает без ограничения Ceratophyllus gallinae, Ceratophyllus niger, Ctenocephalides canis, Ctenocephalides felis, и Pulex irritans.

(16) Отряд Thysanoptera. Неисключительный перечень конкретных родов включает без ограничения Caliothrips spp., Frankliniella spp., Scirtothrips spp. и Thrips spp. Неисключительный перечень конкретных видов включает без ограничения Caliothrips phaseoli, Frankliniella bispinosa, Frankliniella fusca, Frankliniella occidentalis, Frankliniella schultzei, Frankliniella tritici, Frankliniella williamsi, Heliothrips haemorrhoidalis, Rhipiphorothrips cruentatus, Scirtothrips citri, Scirtothrips dorsalis, Taeniothrips rhopalantennalis, Thrips hawaiiensis, Thrips nigropilosus, Thrips orientalis, Thrips palmi, и Thrips tabaci.

(17) Отряд Thysanura. Неисключительный перечень конкретных родов включает без ограничения Lepisma spp. и Thermobia spp.

(18) Отряд Acarina. Неисключительный перечень конкретных родов включает без ограничения Acarus spp., Aculops spp., Argus spp., Voophilus spp., Demodex spp., Dermacentor spp., Eritrimerus spp., Eriophyes spp., Ixodes spp., Oligonychus spp., Panonychus spp., Rhizoglyphus spp. и Tetranychus spp. Неисключительный перечень конкретных видов включает без ограничения Acarapis woodi, Acarus siro, Aceria mangiferae, Aculops lycopersici, Aculus pelekassi, Aculus schlechtendali, Amblyomma americanum, Brevipalpus obovatus, Brevipalpus phoenicis, Dermacentor variabilis, Dermatophagoides pteronyssinus, Eotetranychus carpini, Liponyssoides sanguineus, Notoedres cati, Oligonychus coffeae, Oligonychus ilicis, Ornithonyssus bacoti, Panonychus citri, Panonychus ulmi, Phyllocoptura oleivora, Polyphagotarsonemus latus, Rhipicephalus sanguineus, Sarcoptes scabiei, Tegolophus perseiflorae, Tetranychus urticae, Tyrophagus longior, и Varroa destructor.

(19) Отряд Araneae. Неисключительный перечень конкретных родов включает без ограничения Loxosceles spp., Latrodectus spp. и Atrax spp. Неисключительный перечень конкретных видов включает без ограничения Loxosceles reclusa, Latrodectus mactans, и Atrax robustus.

(20) Класс Symphyla. Неисключительный перечень конкретных видов включает без ограничения Scutigerebella immaculata.

(21) Подкласс Collembola. Неисключительный перечень конкретных видов включает без ограничения Bourletiella hortensis, Onychiurus armatus, Onychiurus fimetarius, и Sminthurus viridis.

(22) Тип Nematoda. Неисключительный перечень конкретных родов включает без ограничения Aphelenchoides spp., Belonolaimus spp., Criconemella spp., Ditylenchus spp., Globodera spp., Heterodera spp., Hirschmanniella spp., Hoplolaimus spp., Meloidogyne spp., Pratylenchus spp. и Radopholus spp. Неисключительный перечень конкретных видов включает без ограничения Dirofilaria immitis, Globodera pallida, Heterodera glycines, Heterodera zeae, Meloidogyne incognita, Meloidogyne javanica, Onchocerca volvulus, Pratylenchus penetrans, Radopholus similis, и Rotylenchulus reniformis.

(23) Тип Mollusca. Неисключительный перечень конкретных видов включает без ограничения Agion vulgaris, Cornu aspersum, Deroceras reticulatum, Limax flavus, Milax gagates, и Potacea canaliculata.

Особенно предпочтительная группа вредителей, подлежащих контролю, представляет собой вредителей, питающихся соком растений. Вредители, питающиеся соком растений, как правило, имеют протыкающие и/или всасывающие ротовые органы и питаются соком и внутренними растительными тканями растений. Примеры вредителей, питающихся соком растений и представляющих особую проблему для сельского хозяйства, включают без ограничения тли, цикадки, щитовки, трипсы, листоблошки, фонарницы, войлочники, щитники и белокрылки. Конкретные примеры отрядов, к которым принадлежат вредители, питающиеся соком растений и представляющие проблему для сельского хозяйства, включают без ограничения Anoplura и Hemiptera. Конкретные примеры Hemiptera, которые представляют проблему для сельского хозяйства, включают без ограничения Aulacaspis spp., Aphrophora spp., Aphis spp., Bemisia spp., Coccus spp., Euschistus spp., Lygus spp., Macrosiphum spp., Nezara spp., Rhopalosiphum spp., Sogatella spp., Nilaparvata spp., Laodelphax spp. и Nephotettix spp.

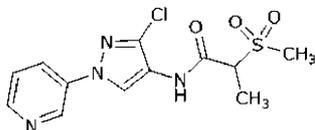
Другой особенно предпочтительной группой вредителей, подлежащих контролю, являются жующие вредители. Жующие вредители, как правило, имеют ротовые части, которые позволяют им пережевывать ткань растений, включая корни, стебли, листья, почки и репродуктивные ткани (включая без ограничения цветы, плоды и семена). Примеры жующих вредителей, представляющих особую проблему для сельского хозяйства, включают без ограничения гусениц, жуков, кузнечиков и саранчу. Конкретные примеры отрядов, к которым принадлежат жующие вредители, представляющие проблему для сельского

хозяйства, включают без ограничения Coleoptera, Lepidoptera и Orthoptera. Конкретные примеры Coleoptera, которые представляют проблему для сельского хозяйства, включают без ограничения Anthonomus spp., Cerotoma spp., Chaetocnema spp., Colaspis spp., Cyclocephala spp., Diabrotica spp., Nypera spp., Phyllophaga spp., Phyllotreta spp., Sphenophorus spp., Sitophilus spp.

Фраза "пестицидно эффективное количество" означает количество пестицида, необходимое для достижения заметного эффекта в отношении вредителя, например, эффектов некроза, гибели, замедления развития, предотвращения появления, уничтожения, истребления или другого уменьшения случаев появления и/или активности вредителя в месте обитания. Данный эффект может наступать, когда популяции вредителей покинули место обитания, вредители обезврежены в месте обитания или вокруг места обитания, и/или вредители уничтожены в месте обитания или вокруг места обитания. Разумеется, возможна комбинация данных эффектов. Как правило, размеры популяции, активность вредителей или как размеры популяции, так и активность вредителей необходимо снижать более чем на пятьдесят процентов, предпочтительно более чем на 90% и наиболее предпочтительно более чем на 99%. Как правило, пестицидно эффективное количество для сельскохозяйственных целей составляет от приблизительно 0,0001 г на гектар до приблизительно 5000 г на гектар, предпочтительно от приблизительно 0,0001 г на гектар до приблизительно 500 г на гектар и еще более предпочтительно от приблизительно 0,0001 г на гектар до приблизительно 50 г на гектар. В качестве альтернативы против вредителей можно использовать от приблизительно 150 г на гектар до приблизительно 250 г на гектар.

Подробное описание изобретения

В данном документе раскрыто соединение N-(3-хлор-1-(пиридин-3-ил)-1H-пиразол-4-ил)-2-(метилсульфонил)пропанамида:



Формула один, также известная как F1

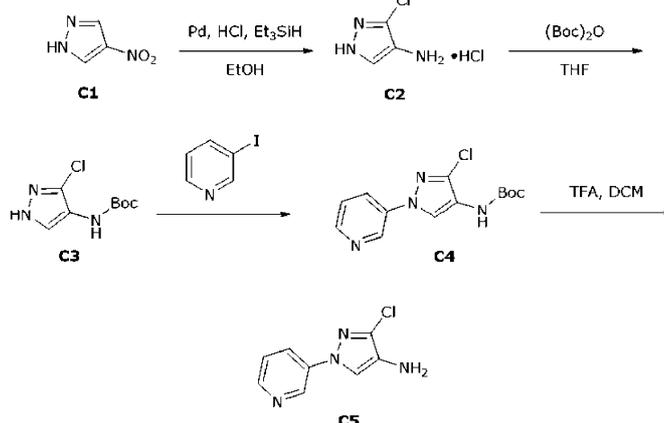
Формула один может существовать в различных геометрических или оптических изомерных или различных таутомерных формах. Могут присутствовать один или несколько центров хиральности, в таком случае формула один может быть представлена в виде чистых энантиомеров, смесей энантиомеров, чистых диастереомеров или смесей диастереомеров. Специалистам в данной области техники будет понятно, что один стереоизомер может быть более активным, чем другие стереоизомеры. Отдельные стереоизомеры можно получать посредством известных процедур селективного синтеза, посредством традиционных процедур синтеза с применением разделенных исходных материалов или посредством традиционных процедур разделения. Могут присутствовать центры таутомеризации. Настоящее изобретение охватывает все такие изомеры, таутомеры и их смеси во всех соотношениях. Структуры, раскрытые в настоящем изобретении, для ясности могут быть изображены только в одной геометрической форме, но предполагается, что они отображают все геометрические формы соединения.

Синтез формулы один (F1).

Исходные материалы, реагенты и растворители, которые получали из коммерческих источников, применяли без дополнительной очистки. Безводные растворители получали в упаковке Sure/Seal™ от Aldrich и применяли в том виде, в котором получали. Значения температуры плавления определяли на капиллярном приборе для определения значений температуры плавления Thomas Hoover Unimelt или на автоматической системе для определения значений температуры плавления OptiMelt от Stanford Research Systems и не корректировали. Примеры, в которых используется "комнатная температура", проводили в лабораториях с регулируемым климатом при значениях температуры в диапазоне от приблизительно 20 до приблизительно 24°C. Соединениям даны их известные названия, полученные в соответствии с программами определения названия в ISIS Draw, ChemDraw или ACD Name Pro. Если в таких программах невозможно назвать соединение, такое соединение называют с помощью традиционных правил определения названия. Спектральные данные ¹H ЯМР представлены в ppm (δ), и их регистрировали при 300, 400, 500 или 600 МГц; спектральные данные ¹³C ЯМР представлены в ppm (δ), и их регистрировали при 75, 100 или 150 МГц; и спектральные данные ¹⁹F ЯМР представлены в ppm (δ), и их регистрировали при 376 МГц, если не указано иное.

Специалисту в данной области техники будет понятно, что возможным является обеспечение синтеза необходимых соединений путем осуществления некоторых стадий путей синтеза в порядке, отличном от описанного порядка. Специалисту в данной области техники также будет понятно, что возможным является осуществление взаимопревращений стандартных функциональных групп или реакций замещения в необходимых соединениях с введением или модификацией заместителей.

Пример 1. Получение 3-хлор-1-(пиридин-3-ил)-1Н-пиразол-4-амина (C5):



Стадия 1 - получение гидрохлорида 3-хлор-1Н-пиразол-4-амина (C2).

К трехгорлой круглодонной колбе объемом 2 литра (л) подсоединяли верхнеприводную мешалку, датчик температуры, капельную воронку и впускной элемент для азота. В данную трехгорлую колбу добавляли этанол (600 миллилитров (мл)) и 4-нитро-1Н-пиразол (C1; 50,6 грамма (г), 447 миллимолей (ммоль)). К данному раствору добавляли одной порцией концентрированную хлористоводородную кислоту (HCl; 368 мл) (примечание: быстрый экзотермический эффект от 15 до 39°C) и полученную смесь продували азотом (N_2) в течение 5 минут (мин). Добавляли палладий на оксиде алюминия (5% вес/вес) (2,6 г) и смесь перемешивали при комнатной температуре, кроме того, добавляли по каплям триэтилсилан (208 г, 1789 ммоль) в течение 4 часов (ч). Реакционную смесь, которая начинала медленно саморазогреваться от 35 до 55°C в течение 2 ч, перемешивали в общей сложности 16 ч. Смесь фильтровали под вакуумом через слой Celite® и собирали двухфазную смесь. Двухфазную смесь переносили в делительную воронку, собирали нижний водный слой и выпаривали его на роторном испарителе (60°C, 50 мм рт. ст.) досуха с помощью ацетонитрила (3×350 мл). Полученное желтое твердое вещество суспендировали в ацетонитриле (150 мл) и оставляли отстаиваться в течение 2 ч при комнатной температуре, а затем 1 ч при 0°C в холодильнике. Твердые вещества фильтровали и промывали ацетонитрилом (100 мл) с получением указанного в заголовке соединения в виде белого твердого вещества (84 г, выход 97%, чистота 80%); т. пл. 190-193°C;

^1H ЯМР (400 МГц, DMSO-d_6) δ 10,46-10,24 (br s, 2H), 8,03 (s, 0,54H), 7,75 (s, 0,46H), 5,95 (br s, 1H); ^{13}C -ЯМР (101 МГц, DMSO-d_6) δ 128,24, 125,97, 116,71.

Стадия 2 - получение трет-бутил-(3-хлор-1Н-пиразол-4-ил)карбамата (C3).

В круглодонную колбу объемом 2 л добавляли гидрохлорид 3-хлор-1Н-пиразол-4-амина (C2; 100 г, 649 ммоль) и тетрагидрофуран (THF; 500 мл). К данной смеси последовательно добавляли ди-трет-бутилдикарбонат (156 г, 714 ммоль), бикарбонат натрия (120 г, 1429 ммоль) и воду (50,0 мл). Смесь перемешивали в течение 16 ч, разбавляли водой (500 мл) и этилацетатом (EtOAc; 500 мл) и переносили в делительную воронку. Получалось три слоя: а) нижний слой - белый студенистый осадок; б) средний слой - светло-желтая водная жидкость; и с) верхний слой - органическая жидкость каштанового цвета. Фазы разделяли, собирая вместе нижний и средний слои (т.е. водную фазу). Водную фазу экстрагировали с помощью EtOAc (2×200 мл), а органические экстракты объединяли, промывали солевым раствором (200 мл), высушивали над безводным сульфатом натрия, фильтровали и концентрировали путем выпаривания на роторном испарителе с получением густого масла каштанового цвета (160 г). Густое масло суспендировали в гексане (1000 мл) и перемешивали при 55°C в течение 2 ч. В результате этого получали светло-коричневую суспензию. Смесь охлаждали до 0°C и твердое вещество собирали посредством вакуумной фильтрации и промывали гексаном (2×10 мл). Образец высушивали на воздухе до постоянной массы с получением указанного в заголовке соединения в виде светло-коричневого твердого вещества (103 г, выход 72%, чистота 80%); т. пл. 137-138°C;

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 10,69 (s, 1H), 7,91 (s, 1H), 1,52 (s, 9H).

Стадия 3 - получение трет-бутил-(3-хлор-1-(пиридин-3-ил)-1Н-пиразол-4-ил)карбамата (C4).

Сухую трехгорлую круглодонную колбу объемом 2 л оборудовали механической мешалкой, впускным элементом для азота, термометром и обратным холодильником. В данную колбу добавляли 3-йодпиридин (113 г, 551 ммоль), трет-бутил-(3-хлор-1Н-пиразол-4-ил)карбамат (C3; 100 г, 459 ммоль), измельченный в порошок фосфат калия (195 г, 919 ммоль) и хлорид меди (3,09 г, 23 ммоль). Последовательно добавляли ацетонитрил (1 л) и N^1, N^2 -диметилэтан-1,2-диамин (101 г, 1149 ммоль) и смесь нагревали до 81°C в течение 4 ч. Смесь охлаждали до комнатной температуры и фильтровали через слой Celite®. Фильтрат переносили в колбу Эрленмейера объемом 4 л, оборудованную механической мешалкой, и разбавляли водой до тех пор, пока общий объем не составлял примерно 4 л. Смесь перемешивали в течение 30 мин. при комнатной температуре и полученное в результате твердое вещество собирали

посредством вакуумной фильтрации. Твердое вещество промывали водой и высушивали в печи в течение нескольких дней *in vacuo* при 40°C до постоянного веса с получением указанного в заголовке соединения в виде желтовато-коричневого твердого вещества (117,8 г, выход 87%, чистота 80%): т. пл. 140-143°C;

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,96 (s, 1H), 8,53 (dd, $J=4,7, 1,2$ Гц, 1H), 8,36 (s, 1H), 7,98 (ddd, $J=8,3, 2,7, 1,4$ Гц, 1H), 7,38 (dd, $J=8,3, 4,8$ Гц, 1H), 6,37 (s, 1H), 1,54 (s, 9H);

ESIMS масса/заряд 338 ($[\text{M}-\text{t-Bu}]^+$), 220 ($[\text{M}-\text{O}-\text{t-Bu}]^+$).

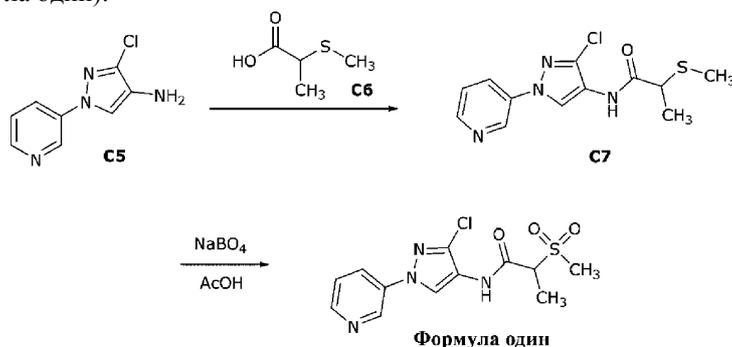
Стадия 4 - получение 3-хлор-1-(пиридин-3-ил)-1H-пиразол-4-амина (C5).

Трифторуксусную кислоту (TFA; 6,79 мл) добавляли к трет-бутил(3-хлор-1-(пиридин-3-ил)-1H-пиразол-4-ил)карбамату (C4; 2 г, 6,79 ммоль) в дихлорметане (DCM; 6,79 мл) и смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 2 ч. Добавляли толуол (12 мл) и реакционную смесь концентрировали *in vacuo* почти досуха. Концентрированную реакционную смесь выливали в делительную воронку, содержащую насыщенный водный раствор бикарбоната натрия, и экстрагировали с помощью DCM (3×10 мл). Объединенные органические слои концентрировали с получением указанного в заголовке соединения в виде белого твердого вещества (0,954 г, 72%): т. пл. 137,9-139,9°C;

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,84 (d, $J=2,4$ Гц, 1H), 8,50 (dd, $J=4,7, 1,4$ Гц, 1H), 7,95 (ddd, $J=8,3, 2,7, 1,5$ Гц, 1H), 7,52 (s, 1H), 7,37 (ddd, $J=8,4, 4,7, 0,7$ Гц, 1H), 3,18 (s, 2H);

ESIMS масса/заряд 196 ($[\text{M}+\text{H}]^+$).

Пример 2. Получение N-(3-хлор-1-(пиридин-3-ил)-1H-пиразол-4-ил)-2-(метилсульфонил)-пропанамида (формула один):



Стадия 1 - получение N-(3-хлор-1-(пиридин-3-ил)-1H-пиразол-4-ил)-2-(метилтио)пропанамида (C7).

К суспензии 3-хлор-1-(пиридин-3-ил)-1H-пиразол-4-амина (C5; 0,1 г, 0,514 ммоль) и 2-(метилтио)пропановой кислоты (C6; 0,185 г, 1,541 ммоль) в DCM (1,713 мл) добавляли последовательно N,N-диметилпиридин-4-амин (0,220 г, 1,798 ммоль) и N1-((этилимино)метил)-N3,N3-диметилпропан-1,3-диамин гидрохлорид (0,305 г, 1,593 ммоль). Реакционную смесь перемешивали при температуре окружающей среды в течение 18 ч и концентрировали. Очистка с помощью хроматографии на силикагеле (0-100% EtOAc/гексаны) обеспечивала получение указанного в заголовке соединения в виде белого твердого вещества (116 мг, 72%): т. пл. 129-132°C;

^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,98 (d, $J=2,4$ Гц, 1H), 8,63 (s, 1H), 8,58-8,53 (m, 1H), 8,03-7,96 (m, 1H), 7,43-7,37 (m, 1H), 3,59-3,48 (m, 1H), 2,18 (s, 3H), 1,59 (d, $J=7,3$ Гц, 3H);

ESIMS масса/заряд 297 ($[\text{M}+1]^+$).

Стадия 2 - получение N-(3-хлор-1-(пиридин-3-ил)-1H-пиразол-4-ил)-2-(метилсульфонил)-пропанамида (формула один).

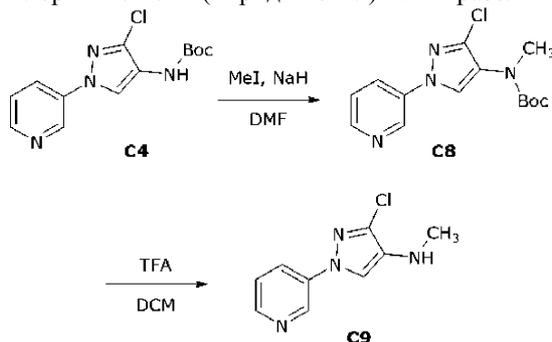
В круглодонную колбу объемом 100 мл добавляли N-(3-хлор-1-(пиридин-3-ил)-1H-пиразол-4-ил)-2-(метилтио)пропанамида (C7; 882 мг, 2,97 ммоль), уксусную кислоту (6,0 мл) и тетрагидрат пербората натрия (915 мг, 5,94 ммоль). Реакционную смесь перемешивали в течение ночи в инертной атмосфере в нагревательном блоке, нагретом до 50°C. Затем реакционную смесь выливали в солевой раствор и экстрагировали с помощью DCM (3×20 мл). Объединенные органические экстракты высушивали над сульфатом магния, фильтровали и концентрировали. Очистка полученного в результате остатка с помощью хроматографии на силикагеле (0-10% метанол в DCM) обеспечивала получение указанного в заголовке соединения в виде белой пены (734 мг, 74%):

^1H ЯМР (400 МГц, $\text{DMSO}-d_6$) δ 10,41 (s, 1H), 9,07 (d, $J=2,7$ Гц, 1H), 8,94 (s, 1H), 8,55 (dd, $J=4,7, 1,4$ Гц, 1H), 8,23 (ddd, $J=8,4, 2,8, 1,4$ Гц, 1H), 7,55 (ddd, $J=8,4, 4,8, 0,7$ Гц, 1H), 4,41 (q, $J=7,0$ Гц, 1H), 3,07 (s, 3H), 1,57 (d, $J=7,1$ Гц, 3H);

ESIMS масса/заряд 329 ($[\text{M}+\text{H}]^+$); IR (тонкая пленка) 1680 cm^{-1} .

Синтез сравнительных соединений.

Пример 3. Получение 3-хлор-N-метил-1-(пиридин-3-ил)-1H-пиразол-4-амина (C9):



Стадия 1 - получение трет-бутил-(3-хлор-1-(пиридин-3-ил)-1H-пиразол-4-ил)(метил)карбамата (C8).

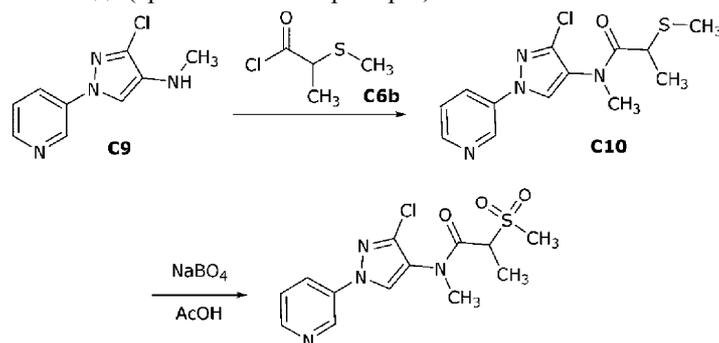
К раствору трет-бутил-3-хлор-1-(пиридин-3-ил)-1H-пиразол-4-илкарбамата (C4; 1,0 г, 3,39 ммоль) в N,N-диметилформамиде (16,96 мл) при 0°C добавляли гидрид натрия (0,163 г, 4,07 ммоль). Через 30 мин колбу нагревали до температуры окружающей среды и реакционную смесь перемешивали еще 30 мин. В колбу добавляли йодметан (0,232 мл, 3,73 ммоль) и реакционную смесь перемешивали при температуре окружающей среды в течение 2 ч. Реакцию гасили добавлением насыщенного раствора хлорида аммония. Реакционную смесь дважды экстрагировали трет-бутилметиловым эфиром. Органический слой высушивали над сульфатом натрия, фильтровали и концентрировали. Очистка с помощью хроматографии на колонке с силикагелем (0-100% EtOAc/гексаны) обеспечивала получение указанного в заголовке соединения в виде желтого масла (983 мг, 94%): ¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 8,91 (d, J=2,5 Гц, 1H), 8,64-8,48 (m, 1H), 8,01 (d, J=7,5 Гц, 1H), 7,90 (s, 1H), 7,41 (dd, J=8,3, 4,8 Гц, 1H), 3,23 (s, 3H), 1,58-1,25 (m, 9H); ESIMS масса/заряд 309 ([M+H]⁺); IR (тонкая пленка) 1693 см⁻¹.

Стадия 2 - получение 3-хлор-N-метил-1-(пиридин-3-ил)-1H-пиразол-4-амина (C9).

К трет-бутил-3-хлор-1-(пиридин-3-ил)-1H-пиразол-4-ил(метил)карбамату (C8; 1,65 г, 5,34 ммоль) в DCM (5,4 мл) добавляли трифторуксусную кислоту (TFA; 5,4 мл) и раствор перемешивали при комнатной температуре в течение 1 ч. Добавляли толуол и реакционную смесь концентрировали *in vacuo* почти досуха. Концентрированную реакционную смесь выливали в делительную воронку, содержащую насыщенный раствор бикарбоната натрия и экстрагировали смесь с помощью EtOAc (3×20 мл). Экстракты объединяли, высушивали над сульфатом магния, фильтровали и концентрировали досуха. Указанное в заголовке соединение выделяли в виде бледно-желтого твердого вещества (0,92 г, 83%): т. пл. 108-118°C;

¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 8,88 (d, J=2,4 Гц, 1H), 8,48 (dd, J=4,7, 1,4 Гц, 1H), 7,96 (ddd, J=8,3, 2,7, 1,4 Гц, 1H), 7,41-7,29 (m, 2H), 2,87 (s, 3H); EIMS масса/заряд 208.

Пример 4. Получение N-(3-хлор-1-(пиридин-3-ил)-1H-пиразол-4-ил)-N-метил-2-(метилсульфонил)пропанамида (сравнительный пример 1, также известный как CE1):



Сравнительный пример 1

Стадия 1 - получение N-(3-хлор-1-(пиридин-3-ил)-1H-пиразол-4-ил)-N-метил-2-(метилтио)пропанамида (C10).

К раствору 2-(метилтио)пропановой кислоты (C6; 481 мг, 4,00 ммоль) в DCM (6 мл) добавляли оксалилхлорид (0,384 мл, 4,40 ммоль) и одну каплю диметилформаида. Наблюдали сильное выделение пузырьков и перемешивание продолжали в течение 30 мин. Неочищенную реакционную смесь на основе ацилхлорида (C6b) концентрировали *in vacuo* почти досуха. Концентрированную реакционную смесь (C6b) растворяли в DCM (3 мл) и добавляли медленно (в течение ~5 мин) к ледяному раствору 3-хлор-N-метил-1-(пиридин-3-ил)-1H-пиразол-4-амина (C9; 417 мг, 2 ммоль) и N-этил-N-изопропилпропан-2-амина (0,751 мл, 4,40 ммоль) в DCM (3 мл). Полученный темно-оранжевый раствор медленно нагревали до комнатной температуры в течение 0,5 ч и перемешивали при температуре окружающей среды в течение 1,5 ч. Реакционную смесь гасили путем добавления насыщенного раствора бикарбоната натрия. Ре-

акционную смесь экстрагировали с помощью DCM (3×10 мл). Очистка остатка с помощью хроматографии на силикагеле (0-100% EtOAc/гексан) обеспечивала получение указанного в заголовке соединения в виде белого твердого вещества (495 мг, 76%): т. пл. 128-133°C;

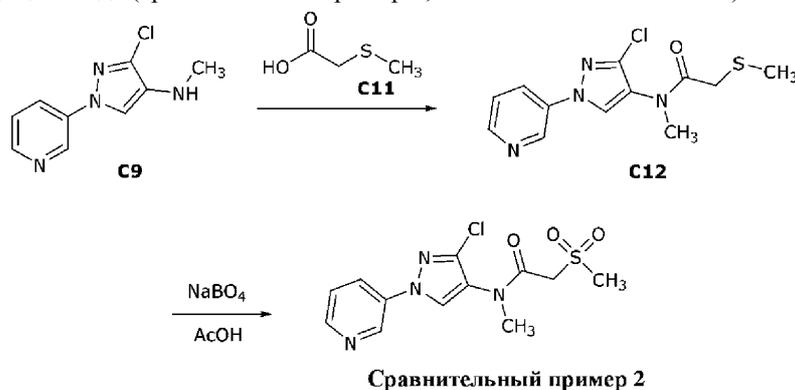
^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,94 (d, $J=2,4$ Гц, 1H), 8,62 (d, $J=3,8$ Гц, 1H), 8,15 (s, 1H), 8,03 (d, $J=8,3$ Гц, 1H), 7,46 (dd, $J=8,3, 4,8$ Гц, 1H), 3,34 (q, $J=6,8$ Гц, 1H), 3,26 (s, 3H), 2,10 (s, 3H), 1,45 (d, $J=6,9$ Гц, 3H); ESIMS масса/заряд 311 ($[\text{M}+1]^+$).

Стадия 2 - получение N-(3-хлор-1-(пиридин-3-ил)-1H-пиразол-4-ил)-N-метил-2-(метилсульфонил)пропанамида (сравнительный пример 1).

В сосуд объемом 20 мл добавляли последовательно N-(3-хлор-1-(пиридин-3-ил)-1H-пиразол-4-ил)-N-метил-2-(метилтио)пропанамида (C10; 306 мг, 0,985 ммоль), уксусную кислоту (2 мл) и тетрагидрат пербората натрия (333 мг, 2,17 ммоль). Раствор нагревали при 65°C в течение 3 ч, охлаждали и гасили путем медленного добавления насыщенного раствора бикарбоната натрия. Раствор экстрагировали с помощью DCM (3×10 мл) и объединенные органические экстракты высушивали и концентрировали. Очистка полученной смеси с помощью хроматографии на силикагеле (0-10% метанола в DCM) обеспечивала получение указанного в заголовке соединения в виде грязно-белого твердого вещества (221 мг, 62%): ^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,97 (dd, $J=2,7, 0,7$ Гц, 1H), 8,64 (dd, $J=4,7, 1,5$ Гц, 1H), 8,22 (s, 1H), 8,00 (ddd, $J=8,4, 2,7, 1,5$ Гц, 1H), 7,45 (ddd, $J=8,4, 4,8, 0,8$ Гц, 1H), 4,14-3,94 (m, 1H), 3,33 (s, 3H), 3,02 (d, $J=0,8$ Гц, 3H), 1,65 (d, $J=7,0$ Гц, 3H);

ESIMS масса/заряд 343 ($[\text{M}+1]^+$); IR (тонкая пленка) 1657 cm^{-1} .

Пример 5. Получение N-(3-хлор-1-(пиридин-3-ил)-1H-пиразол-4-ил)-N-метил-2-(метилсульфонил)ацетамида (сравнительный пример 2, также известный как CE2):



Стадия 1 - получение N-(3-хлор-1-(пиридин-3-ил)-1H-пиразол-4-ил)-N-метил-2-(метилтио)-ацетамида (C12).

В сосуд объемом 20 мл добавляли последовательно 3-хлор-N-метил-1-(пиридин-3-ил)-1H-пиразол-4-амин (C9; 417 мг, 2 ммоль), 2-(метилтио)уксусную кислоту (C11; 318 мг, 3 ммоль), N1-((этилимино)метил)-N3,N3-диметилпропан-1,3-диамина гидрохлорид (767 мг, 4 ммоль), N,N-диметилпиридин-4-амин (611 мг, 5 ммоль) и дихлорэтан (6 мл). Раствор перемешивали при комнатной температуре в течение 18 ч и концентрировали. Очистка с помощью хроматографии на силикагеле (0-100% EtOAc/гексаны) обеспечивала получение указанного в заголовке соединения в виде бледно-желтого масла (517 мг, 83%):

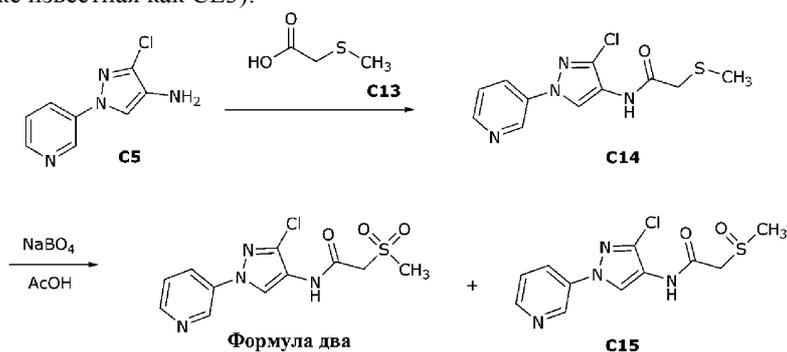
^1H ЯМР (400 МГц, CDCl_3) δ 8,95 (d, $J=2,5$ Гц, 1H), 8,62 (dd, $J=4,8, 1,4$ Гц, 1H), 8,13 (s, 1H), 8,04 (ddd, $J=8,3, 2,7, 1,4$ Гц, 1H), 7,50-7,43 (m, 1H), 3,26 (s, 3H), 3,12 (s, 2H), 2,24 (s, 3H); ^{13}C ЯМР (101 МГц, CDCl_3) δ 170,00, 148,61, 140,15, 140,03, 135,68, 126,56, 126,42, 125,33, 124,15, 37,16, 34,94, 16,22; ESIMS масса/заряд 297 ($[\text{M}+1]^+$).

Стадия 2 - получение N-(3-хлор-1-(пиридин-3-ил)-1H-пиразол-4-ил)-N-метил-2-(метилсульфонил)ацетамида (сравнительный пример 2).

В сосуд объемом 7 мл добавляли последовательно N-(3-хлор-1-(пиридин-3-ил)-1H-пиразол-4-ил)-N-метил-2-(метилтио)ацетамид (C12; 262 мг, 0,883 ммоль), уксусную кислоту (1,5 мл) и тетрагидрат пербората натрия (299 мг, 1,942 ммоль). Смесь перемешивали при 65°C в течение 2 ч, затем гасили путем добавления насыщенного раствора бикарбоната натрия. Реакционную смесь экстрагировали с помощью DCM (3×10 мл). Объединенные органические экстракты высушивали и концентрировали. Очистка полученной в результате смеси с помощью хроматографии на силикагеле (0-10% метанола в DCM) обеспечивала получение указанного в заголовке соединения в виде белого полутвердого вещества (192 мг, 62,8%): ^1H ЯМР (500 МГц, CDCl_3) δ 8,97 (d, $J=2,6$ Гц, 1H), 8,64 (dd, $J=4,9, 1,3$ Гц, 1H), 8,24 (s, 1H), 8,00 (ddd, $J=8,4, 2,8, 1,4$ Гц, 1H), 7,45 (dd, $J=8,4, 4,8$ Гц, 1H), 3,96 (s, 2H), 3,33 (s, 3H), 3,20 (s, 3H);

ESIMS масса/заряд 329 ($[\text{M}+1]^+$); IR (тонкая пленка) 1664 cm^{-1} .

Пример 6. Получение N-(3-хлор-1-(пиридин-3-ил)-1H-пиразол-4-ил)-2-(метилсульфонил)ацетамида (формула два, также известная как СЕЗ):



Стадия 1 - получение N-(3-хлор-1-(пиридин-3-ил)-1H-пиразол-4-ил)-2-(метилтио)ацетамида (C14).

К суспензии 3-хлор-1-(пиридин-3-ил)-1H-пиразол-4-амина (C5; 1,0 г, 5,14 ммоль), N,N-диметилпиридин-4-амина (628 мг, 5,14 ммоль) и 2-(метилтио)уксусной кислоты (C13; 654 мг, 6,17 ммоль) в дихлорэтано (6 мл) добавляли N1-((этилимино)метилен)-N3,N3-диметилпропан-1,3-диамин гидрохлорид (1,477 мг, 7,71 ммоль). Реакционную смесь перемешивали при температуре окружающей среды в течение 24 ч. Смесь разбавляли с помощью DCM и промывали насыщенным водным раствором хлорида аммония и соевым раствором, высушивали над сульфатом магния и концентрировали *in vacuo* с получением коричневой смолы. Очистка смолы с помощью хроматографии на силикагеле (DCM-метанол) обеспечивала получение указанного в заголовке соединения в виде белого твердого вещества (1,268 г, 87%):

¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 9,06-8,90 (m, 1H), 8,74 (s, 1H), 8,64 (s, 1H), 8,57-8,45 (m, 1H), 8,05-7,90 (m, 1H), 7,46-7,33 (m, 1H), 3,41 (s, 2H), 2,24 (s, 3H);

ESIMS масса/заряд 283 ([M+H]⁺).

Стадия 2 - получение N-(3-хлор-1-(пиридин-3-ил)-1H-пиразол-4-ил)-2-(метилсульфонил)ацетамида (формула два).

К раствору N-(3-хлор-1-(пиридин-3-ил)-1H-пиразол-4-ил)-2-(метилтио)ацетамида (C14; 160 мг, 0,566 ммоль) в уксусной кислоте (1,5 мл) добавляли тетрагидрат пербората натрия (183 мг, 1,188 ммоль). Реакционную смесь перемешивали при 60°C в течение 2 ч. Реакционную смесь охлаждали и затем выливали в избыточное количество насыщенного раствора бикарбоната натрия и экстрагировали с помощью DCM. Очистка полученного в результате остатка с помощью хроматографии на силикагеле (0-10% метанола в DCM) обеспечивала получение указанного в заголовке соединения в виде белого твердого вещества (101 мг, 53,9%) и N-(3-хлор-1-(пиридин-3-ил)-1H-пиразол-4-ил)-2-(метилсульфинил)ацетамида (C15) в виде белого твердого вещества (40 мг, 22,5%).

N-(3-хлор-1-(пиридин-3-ил)-1H-пиразол-4-ил)-2-(метилсульфонил)ацетамид (формула два):

¹H ЯМР (300 МГц, CDCl₃) δ 8,95 (dd, J=2,7, 0,8 Гц, 1H), 8,66 (d, J=0,6 Гц, 1H), 8,53 (dd, J=4,8, 1,4 Гц, 1H), 8,04 (ddd, J=8,4, 2,7, 1,4 Гц, 1H), 7,45 (ddd, J=8,3, 4,8, 0,7 Гц, 1H), 4,23 (q, J=0,8 Гц, 2H), 3,21 (t, J=0,8 Гц, 3H);

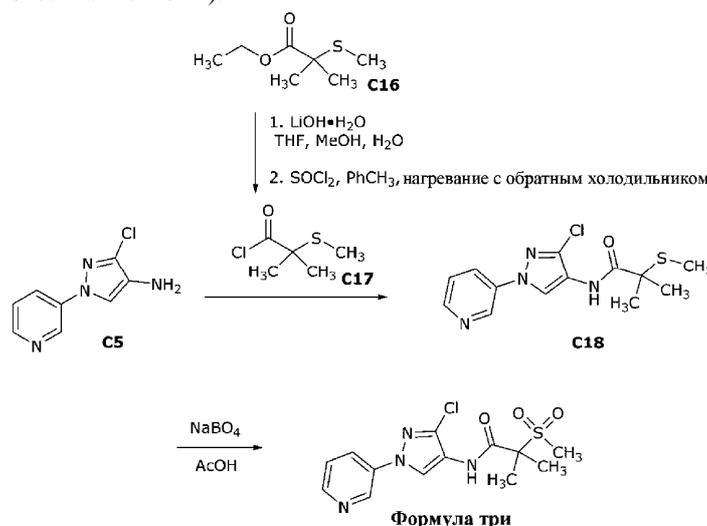
ESIMS масса/заряд 315 ([M+H]⁺); IR (тонкая пленка) 1677 см⁻¹.

N-(3-хлор-1-(пиридин-3-ил)-1H-пиразол-4-ил)-2-(метилсульфинил)ацетамид (C15):

¹H ЯМР (300 МГц, CDCl₃) δ 8,95 (dd, J=2,7, 0,8 Гц, 1H), 8,65 (d, J=0,7 Гц, 1H), 8,53 (dd, J=4,8, 1,4 Гц, 1H), 8,04 (ddd, J=8,4, 2,7, 1,5 Гц, 1H), 7,45 (ddd, J=8,4, 4,8, 0,8 Гц, 1H), 3,93 (d, J=13,9 Гц, 1H), 3,71 (d, J=13,8 Гц, 1H), 2,80 (s, 3H);

ESIMS масса/заряд 299 ([M+H]⁺); IR (тонкая пленка) 1673 см⁻¹.

Пример 7. Получение N-(3-хлор-1-(пиридин-3-ил)-1H-пиразол-4-ил)-2-(метилсульфонил)ацетамида (формула три, также известная как СЕ4):



Стадия 1 - получение 2-метил-2-(метилтио)пропаноила хлорида (С17).

В круглодонную колбу объемом 100 мл загружали этил-2-метил-2-(метилтио)пропаноат (С16; 500 мг, 3,08 ммоль), гидрат гидроксида лития (400 мг, 9,53 ммоль), THF (6,0 мл), метанол (2,0 мл) и воду (2,0 мл). Обеспечивали перемешивание реакционной смеси при комнатной температуре в течение ночи. Реакционную смесь подкисляли с помощью 2-нормального (н.) раствора HCl и экстрагировали с помощью EtOAc (3×15 мл). Объединенные органические экстракты высушивали над сульфатом магния, фильтровали и концентрировали.

Указанное в заголовке соединение можно получить из указанной выше кислоты, как в Liu, Aiping; Ren, Yeguo; Huang, Lu; Pei, Hui; Hu, Zhibin; Lin, Xuemei; Cheng, Sixi; Huang, Mingzhi; Zhu, Xiaoxing; Wei, Tianlong CN 101928271, 2010. Его выделяли (без очистки) в виде бесцветного твердого вещества (394 мг, 83%):

¹H ЯМР (500 МГц, DMSO-d₆) δ 2,05 (s, 3H), 1,39 (s, 6H); ¹³C ЯМР (126 МГц, DMSO-d₆) δ 174,01, 45,08, 24,31, 11,73; IR (тонкая пленка) 3394, 1652, 1204, 1040, 1024, 995 см⁻¹.

Стадия 2 - получение N-(3-хлор-1-(пиридин-3-ил)-1H-пиразол-4-ил)-2-метил-2-(метилтио)пропанамида (С18).

В круглодонную колбу объемом 50 мл загружали хлорид 2-метил-2-(метилтио)пропаноила со стадии 1 (С17; 200 мг, 1,310 ммоль), 3-хлор-1-(пиридин-3-ил)-1H-пиразол-4-амин (С5; 255 мг, 1,310 ммоль) и дихлорэтан (6,552 мл). N-этил-N-изопропилпропан-2-амин (456 мкл, 2,62 ммоль) добавляли в инертной атмосфере. Обеспечивали перемешивание реакционной смеси при комнатной температуре в течение 3 ч и концентрировали. Реакцию гасили путем выливания реакционной смеси в солевой раствор и ее экстрагировали с помощью DCM (2×15 мл). Объединенные органические экстракты высушивали над сульфатом магния, фильтровали и концентрировали. Очистка полученного в результате остатка с помощью хроматографии на силикагеле (0-80% EtOAc/гексаны) обеспечивала получение указанного в заголовке соединения в виде светло-оранжевого остатка (191 мг, 46,4%):

¹H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ 9,37 (s, 1H), 9,07 (dd, J=2,8, 0,7 Гц, 1H), 8,78 (s, 1H), 8,55 (dd, J=4,7, 1,4 Гц, 1H), 8,22 (ddd, J=8,3, 2,7, 1,4 Гц, 1H), 7,56 (ddd, J=8,4, 4,8, 0,8 Гц, 1H), 2,10 (s, 3H), 1,53 (s, 6H); ¹³C ЯМР (126 МГц, DMSO-d₆) δ 171,99, 147,05, 138,78, 136,62, 134,86, 125,02, 124,85, 123,72, 119,01, 47,13, 24,99, 11,65; IR (тонкая пленка) 1675, 1484, 1388, 1353, 947, 800, 702 см⁻¹; ESIMS масса/заряд 311 ([M+H]⁺).

Стадия 3 - получение N-(3-хлор-1-(пиридин-3-ил)-1H-пиразол-4-ил)-2-метил-2-(метилсульфонил)пропанамида (формула три).

В сосуд объемом 25 мл загружали N-(3-хлор-1-(пиридин-3-ил)-1H-пиразол-4-ил)-2-метил-2-(метилтио)пропанамида (С18; 75 мг, 0,241 ммоль), добавляли тетрагидрат пербората натрия (74 мг, 0,483 ммоль) и уксусную кислоту (2,0 мл). Реакционную смесь перемешивали в нагревательном блоке при 50°C в течение 3 ч. Реакционную смесь разбавляли водой (7 мл) и экстрагировали с помощью DCM (3×7 мл). Объединенные органические экстракты высушивали над сульфатом магния, фильтровали и концентрировали. Очистка полученного в результате остатка с помощью хроматографии на силикагеле (0-75% EtOAc/гексаны) обеспечивала получение указанного в заголовке соединения в виде белого твердого вещества (47 мг, 56,2%):

¹H ЯМР (400 МГц, DMSO-d₆) δ 9,50 (s, 1H), 9,07 (d, J=2,6 Гц, 1H), 8,83 (s, 1H), 8,56 (dd, J=4,7, 1,4 Гц, 1H), 8,23 (ddd, J=8,4, 2,8, 1,4 Гц, 1H), 7,68-7,49 (m, 1H), 3,10 (s, 3H), 1,66 (s, 6H); ¹³C ЯМР (101 МГц, DMSO-d₆) δ 167,92, 148,27, 139,99, 137,59, 135,89, 126,34, 126,09, 124,77, 119,33, 67,49, 36,97, 19,76; IR

(тонкая пленка) 1678, 1292, 1108, 946, 800, 701 см⁻¹; ESIMS масса/заряд 343 ([M+H]⁺).

Биологические анализы.

Следующие биологические анализы проводили в отношении тли персиковой зеленой (*Myzus persicae*) и белокрылки табачной (*Bemisia tabaci*), которые являются хорошим видами-индикаторами для широкого ряда вредителей, питающихся соком растений. Результаты, полученные с этими двумя видами-индикаторами, показывают широкую применимость формулы один при контроле вредителей, питающихся соком растений.

Тестируемые растворы.

F1, CE1, CE2, CE3 и CE4 (по 2 мг каждого) растворяли в 2 мл растворителя, представляющего собой смесь ацетон/метанол (1:1), с получением исходных растворов с концентрацией 1000 ppm для каждого тестируемого соединения. Исходные растворы разбавляли в 5 раз с помощью 0,025% Tween® 20 в воде с получением тестируемых растворов с концентрацией 200 ppm для каждого тестируемого соединения. Последующие 4-кратные разведения в воде, содержащей 0,025% Tween® 20 и 10% ацетон/метанол (1:1), использовали для получения необходимых концентраций для установления зависимости реакции от дозы. Для каждого анализа использовали минимум 5 концентраций каждой тестируемого соединения.

Биологический анализ 1: тля персиковая зеленая (*Myzus persicae*, MYZUPE) ("GPA").

GPA является наиболее значительным вредителем-тлей на персиковых деревьях, вызывающим снижение интенсивности роста, сморщивание листьев и отмирание различных тканей. Она также опасна тем, что выступает в качестве переносчика вирусов растений, таких как вирус Y картофеля и вирус скручивания листьев картофеля, на представителей семейства пасленовых/картофеля Solanaceae и различных вирусов мозаики на многие другие пищевые культуры. GPA поражает такие растения как брокколи, лопух, капуста кочанная, морковь, цветная капуста, дайкон, баклажан, виды зеленой фасоли, салат-латук, макадамия, папайя, виды перца, виды батата, виды томата, кресс водяной и цуккини, помимо прочих сельскохозяйственных культур. GPA также поражает многие декоративные культуры, такие как гвоздика, хризантема, цветущая капуста белокочанная, пуансеттия и виды розы. GPA развила стойкость в отношении многих пестицидов. В настоящее время этот вредитель находится на третьем месте по количеству зарегистрированных случаев стойкости насекомых (Sparks et al.). Следовательно, в связи с вышеуказанными факторами важен контроль этого вредителя. Кроме того, соединения, с помощью которых осуществляют контроль этого вредителя (GPA), известного как питающийся соком вредитель, пригодны при борьбе с другими вредителями, которые питаются соком растений.

Тестируемые растворы формулы один и сравнительные примеры, полученные согласно описанному выше, тестировали в отношении GPA с применением следующей процедуры.

В качестве тестового субстрата использовали проростки капусты кочанной, выращенные в 3-дюймовых горшках, с 2-3 небольшими (3-5 см) истинными листьями. Проростки инфицировали с помощью 20-50 GPA (на стадиях бескрылой взрослой особи и нимфы) за один день перед химической обработкой. Четыре горшка с отдельными проростками использовали для каждой обработки. Использовали ручной распылитель аспираторного типа для распыления раствора на обе стороны листьев капусты кочанной вплоть до стекания. Контрольные растения (проверка растворителя) обрызгивали только разбавителем (0,025% Tween® 20 и 10% ацетон/метанол (1:1) в воде). Обработанные растения выдерживали в камере для выдерживания в течение трех дней при примерно 25°C и относительной влажности (RH) окружающей среды перед оценением. Оценку проводили под микроскопом путем подсчета числа живых особей тли на растение через три дня после обработки. Процент контроля измеряли с помощью поправочной формулы Аббота (W. S. Abbott, "A Method of Computing the Effectiveness of an Insecticide" J. Econ. Entomol. 18 (1925), pp. 265-267) следующим образом:

$$\text{Скорректированный \% контроля} = 100 * (X - Y) / X,$$

где X=число живых особей тли на контрольных растениях с растворителем, а Y=число живых особей тли на обработанных растениях. Результаты приведены в табл. 2 ниже.

Биологический анализ 2: белокрылка табачная (*Bemisia tabaci*, BEMITA) ("SPW").

Белокрылка табачная является основным опасным вредителем хлопчатника. Она также является серьезным вредителем многих овощных культур, таких как виды дыни, капустные культуры, виды томата и кочанный салат, а также декоративных растений. SPW вызывает повреждение как в результате непосредственного поедания, так и в результате передачи вируса. SPW представляет собой насекомое, питающееся соком растения, и его питание обуславливает удаление питательных веществ из растения. Это может привести к задержке роста, потере листьев, снижению урожайности и опаданию коробочек хлопчатника. SPW вырабатывают большие количества медвяной росы, которая поддерживает рост сажистой плесени на листьях растений. SPW также является переносчиком вирусов, таких как вирус скрученности листьев хлопчатника и вирус желтой курчавости листьев томата.

Тестируемые растворы формулы один и сравнительные примеры, полученные согласно описанному выше, тестировали в отношении SPW с применением следующей процедуры.

Саженьцы хлопчатника, выращенные в 3-дюймовых горшках, подрезанные так, чтобы остался только один настоящий лист, использовали в качестве субстрата для испытаний. Взрослым особям *B. tabaci*

давали возможность колонизировать данные растения и откладывать яйца в течение 24 ч, после чего всех взрослых особей удаляли с растений с помощью сжатого воздуха. Растения осматривали на предмет развития яиц и в процессе появления личинок (появление >25% на основании визуального осмотра с использованием микроскопа) растения опрыскивали с применением тестируемых растворов и способов, описанных выше для тли персиковой зеленой (GPA). Обработанные растения, до того как провести оценивание, выдерживали в камере для выдерживания при температуре примерно 25°C и относительной влажности (RH) окружающей среды. Оценку проводили под микроскопом путем подсчета числа развившихся нимф 2-3 стадий на растение через 7-9 дней после обработки. Процент контроля измеряли с помощью поправочной формулы Абботта (W. S. Abbott, "A Method of Computing the Effectiveness of an Insecticide" J. Econ. Entomol. 18 (1925), p. 265-267) следующим образом:

$$\text{Скорректированный \% контроля} = 100 * (X - Y) / X,$$

где X=число живых нимф на контрольных растениях с растворителем, а Y=число живых нимф на обработанных растениях. Результаты приведены в табл. 2 ниже.

Рассмотрение биологических анализов.

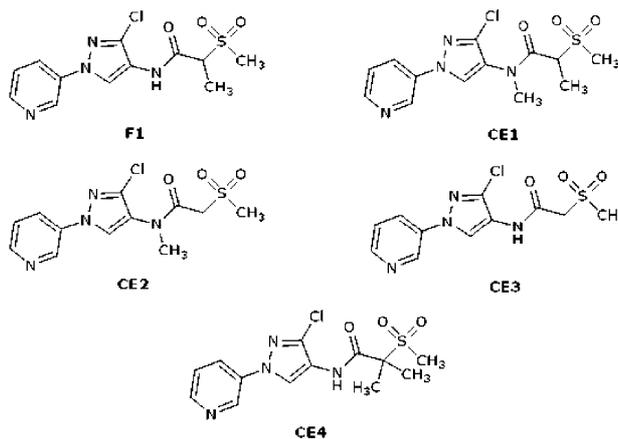


Таблица 2

Соединение	№	<i>Bemisia tabaci</i>		№	<i>Myzus persicae</i>	
		Среднее значение LC ₅₀ PPM	%		Среднее значение LC ₅₀ PPM	%
CE1	2	5,61	15	2	0,29	314
CE2	1	21,01	331	2	0,52	643
F1	2	4,87		6	0,07	
CE3	2	25,35	421	3	0,05	-29
CE4	2	9,72	100	2	2,17	3000

В табл. 2 показаны результаты биологических анализов на примере F1, CE1, CE2, CE3 и CE4. В столбце "№" показано число повторностей каждого проведенного биологического анализа. Среднее значение LC₅₀ указано в частях на миллион. В столбце "%" показано процентное увеличение требуемого среднего значения LC₅₀. Например, в биологических анализах *Myzus persicae* при сравнении CE4 и F1 процентное увеличение составляет $((2,17-0,07)/0,07)*100=3000\%$, а это означает, что для достижения такого же эффекта требуется гораздо больше CE4 по сравнению с F1.

В свете вышеуказанных биологических анализов средний % всех биологических анализов составляет $((15+331+421+100+314+643+(-29)+3000)/8)$, что составляет приблизительно 599%. Это указывает на то, что в среднем требуется примерно на 599% больше пестицида, чтобы он был столь же эффективным, как F1. Это неожиданно, учитывая протестированные соединения.

Приемлемые с точки зрения сельского хозяйства соли присоединения кислоты, производные солей, сольваты, сложноэфирные производные, полиморфы, изотопы и радионуклиды.

Формулу один можно составлять в приемлемые с точки зрения сельского хозяйства соли присоединения кислоты. В качестве неограничивающего примера, аминная функциональная группа может образовывать соли с хлористоводородной, бромистоводородной, серной, фосфорной, уксусной, бензойной, лимонной, малоновой, салициловой, яблочной, фумаровой, щавелевой, янтарной, винной, молочной, глюконовой, аскорбиновой, малеиновой, аспарагиновой, бензолсульфоновой, метансульфоновой, этансульфоновой, гидроксиметансульфоновой и гидроксизтансульфоновой кислотами.

Формулу один можно составлять в производные солей. В качестве неограничивающего примера, производные солей можно получать путем приведения свободного основания в контакт с достаточным

количеством требуемой кислоты с получением соли. Свободное основание можно регенерировать путем обработки соли подходящим разбавленным водным раствором основания, таким как разбавленный водный раствор гидроксида натрия, карбоната калия, аммиака и бикарбоната натрия. В качестве примера, во многих случаях пестицид, такой как 2,4-D, делают более растворимым в воде путем его превращения в его диметиламинную соль.

Формулу один можно составлять в стабильные комплексы с растворителем таким образом, что комплекс остается ненарушенным после удаления не задействованного в комплексе растворителя. Такие комплексы часто называют "сольватами". Однако особенно желательно получать стабильные гидраты с водой в качестве растворителя.

Формулу один можно получать в виде различных кристаллических полиморфов. Полиморфизм является важным для разработки агрохимикатов, поскольку различные кристаллические полиморфы или структуры одного соединения могут иметь весьма различные физические свойства и биологические характеристики.

Формулу один можно получать с различными изотопами. Особенно важными являются соединения, содержащие ^2H (также известный как дейтерий) или ^3H (также известный как тритий) вместо ^1H . Формулу один можно получать с различными радионуклидами. Особенно важными являются соединения, содержащие ^{14}C (также известный как радиоактивный изотоп углерода). Формулу один, содержащую дейтерий, тритий или ^{14}C , можно использовать в биологических исследованиях, обеспечивая прослеживание в химических и физиологических процессах, и исследованиях периода полураспада, а также исследованиях MoA.

Комбинации.

В другом варианте осуществления настоящего изобретения формулу один можно применять в комбинации (например, в сложной смеси или при одновременном или последовательном применении) с одним или несколькими активными ингредиентами.

В другом варианте осуществления настоящего изобретения формулу один можно применять в комбинации (например, в сложной смеси или при одновременном или последовательном применении) с одним или несколькими активными ингредиентами, при этом каждый характеризуется MoA, что является идентичным, аналогичным или предпочтительно отличным от MoA формулы один.

В другом варианте осуществления формулу один можно применять в комбинации (например, в сложной смеси или при одновременном или последовательном применении) с одним или несколькими соединениями, обладающими акарицидными, альгицидными, авицидными, бактерицидными, фунгицидными, гербицидными, инсектицидными, моллюскоцидными, нематоцидными, родентицидными и/или вируцидными свойствами.

В другом варианте осуществления формулу один можно применять в комбинации (например, в сложной смеси или при одновременном или последовательном применении) с одним или несколькими соединениями, которые представляют собой антифиданты, отпугивающие птиц вещества, хемостерилизаторы, антидоты гербицидов, приманки для насекомых, отпугивающие насекомых вещества, отпугивающие млекопитающих вещества, средства для дезориентации самцов, активаторы роста растений, регуляторы роста растений, стимуляторы или усилители жизнеспособности растений, ингибиторы нитрификации и/или синергисты.

В другом варианте осуществления формулу один можно также применять в комбинации (например, в сложной смеси или при одновременном или последовательном применении) с одним или несколькими биопестицидами.

В другом варианте осуществления в комбинациях пестицидных композиций формулу один и активный ингредиент можно применять в широком ряде весовых соотношений. Например, в двухкомпонентной смеси как весовое соотношение формулы один и активного ингредиента можно использовать весовые соотношения из табл. 3. Однако, в общем, предпочтительными являются весовые соотношения от менее чем приблизительно 10:1 до приблизительно 1:10.

Таблица 3

Весовые соотношения формула один : активный ингредиент
От 100:1 до 1:100
От 50:1 до 1:50
От 20:1 до 1:20
От 10:1 до 1:10
От 5:1 до 1:5
От 3:1 до 1:3
От 2:1 до 1:2
1:1

Весовые соотношения соединения формулы один и активного ингредиента также могут быть представлены как $X:Y$; где X - весовые части формулы один, а Y - весовые части активного ингредиента. Диапазон числовых значений весовых частей для X составляет $0 < X \leq 100$, а весовых частей для Y составляет $0 < Y \leq 100$ и показан графически в табл. 4. В качестве неограничивающего примера весовое соотношение формулы один и активного ингредиента может составлять 20:1.

Таблица 4

активный ингредиент (Y), весовые части	100	X, Y		X, Y			X, Y			
	50	X, Y	X, Y	X, Y			X, Y	X, Y		
	20	X, Y		X, Y	X, Y		X, Y		X, Y	
	15	X, Y	X, Y					X, Y	X, Y	X, Y
	10	X, Y		X, Y						
	5	X, Y	X, Y	X, Y				X, Y		
	3	X, Y	X, Y		X, Y	X, Y		X, Y	X, Y	X, Y
	2	X, Y		X, Y	X, Y		X, Y		X, Y	
	1	X, Y								
		1	2	3	5	10	15	20	50	100

Формула один, также известная как F1, (X) - весовые части

Диапазоны весовых соотношений формулы один и активного ингредиента могут быть представлены как от $X_1:Y_1$; до $X_1:Y_1$, где X и Y определены выше.

В одном варианте осуществления диапазона весовых соотношений может составлять от $X_1:Y_1$; до $X_2:Y_2$, где $X_1 > Y_1$, и $X_2 < Y_2$. В качестве неограничивающего примера, диапазон весовых соотношений формулы один и активного ингредиента может составлять от 3:1 до 1:3, включая конечные точки.

В другом варианте осуществления диапазон весовых соотношений может составлять от $X_1:Y_1$; до $X_2:Y_2$, где $X_1 > Y_1$, и $X_2 > Y_2$. В качестве неограничивающего примера, диапазон весовых соотношений формулы один и активного ингредиента может составлять от 15:1 до 3:1, включая конечные точки.

В другом варианте осуществления диапазон весовых соотношений может составлять от $X_1:Y_1$; до $X_2:Y_2$, где $X_1 < Y_1$, и $X_2 < Y_2$. В качестве неограничивающего примера диапазон весовых соотношений формулы один и активного ингредиента может составлять от приблизительно 1:3 до приблизительно 1:20, включая конечные точки.

Составы.

Пестицид часто непригоден для применения в его чистой форме. Обычно необходимо добавлять другие вещества, чтобы пестицид можно было применять в необходимой концентрации и в подходящей форме, обеспечивая удобство применения, эксплуатации, транспортировки, хранения и максимальную пестицидную активность. Таким образом, пестициды составляют, например, в приманки, концентрированные эмульсии, пылевидные препараты, эмульгируемые концентраты, препараты для окуливания, гели, гранулы, микрокапсулы, препараты для обработки семян, суспензионные концентраты, суспензии, таблетки, водорастворимые жидкости, диспергируемые в воде гранулы или сухие жидкотекучие вещества, смачиваемые порошки и крайне малообъемные растворы.

Чаще всего пестициды применяют в виде водных суспензий или эмульсий, полученных из концентрированных составов таких пестицидов. Такие водорастворимые, суспендируемые в воде или эмульгируемые составы могут быть твердыми веществами, обычно известными как смачиваемые порошки, диспергируемыми в воде гранулами, жидкостями, обычно известными как эмульгируемые концентраты, или водными суспензиями. Смачиваемые порошки, которые можно прессовать с получением диспергируемых в воде гранул, содержат тщательно перемешанную смесь пестицида, носителя и поверхностно-активных веществ. Концентрация пестицида обычно составляет от приблизительно 10 до приблизительно 90% по весу. Носитель обычно выбирают из видов аттапульгитовой глины, видов монтмориллонитовой глины, видов диатомовой земли или очищенных силикатов. Эффективные поверхностно-активные вещества, составляющие от приблизительно 0,5 до приблизительно 10% смачиваемого порошка, выбирают из сульфированных лигнинов, конденсированных нафталинсульфонатов, нафталинсульфонатов, алкилбензолсульфонатов, алкилсульфатов и неионогенных поверхностно-активных веществ, таких как аддукты этиленоксида и алкилфенолов.

Эмульгируемые концентраты пестицидов содержат целесообразную концентрацию пестицида, такую как от приблизительно 50 до приблизительно 500 г на литр жидкости, растворенного в носителе, который представляет собой либо смешиваемый с водой растворитель, либо смесь не смешиваемого с водой органического растворителя и эмульгаторов. Пригодные органические растворители включают ароматические соединения, в частности, ксилолы и нефтяные фракции, в частности, высококипящие нафталиновые и олефиновые фракции нефти, такие как тяжелый обогащенный ароматическими соединениями лигроин. Можно также применять другие органические растворители, такие как терпеновые растворители, в том числе производные канифоли, алифатические кетоны, такие как циклогексанон, и сложные спирты, такие как 2-этокситанол. Подходящие эмульгаторы для эмульгируемых концентратов

выбирают из традиционных анионных и неионогенных поверхностно-активных веществ.

Водные суспензии предусматривают суспензии нерастворимых в воде пестицидов, диспергированных в водном носителе при концентрации в диапазоне от приблизительно 5 до приблизительно 50% по весу. Суспензии получают путем тонкого размола пестицида и энергичного примешивания его в носитель, состоящий из воды и поверхностно-активных веществ. Ингредиенты, такие как неорганические соли и синтетические или природные камеди, также можно добавлять для повышения плотности и вязкости водного носителя. Часто наиболее эффективным является одновременное измельчение и смешивание пестицида путем приготовления водной смеси и ее гомогенизации в таком устройстве, как песчаная мельница, шаровая мельница или гомогенизатор поршневого типа. Пестицид в суспензии может быть микроинкапсулирован в пластичный полимер.

Масляные дисперсии (OD) предусматривают суспензии нерастворимых в органическом растворителе пестицидов, тонко диспергированных в смеси органического растворителя и эмульгаторов при концентрации в диапазоне от приблизительно 2 до приблизительно 50% по весу. Один или несколько пестицидов можно растворять в органическом растворителе. Пригодные органические растворители включают ароматические соединения, в частности, ксилолы и нефтяные фракции, в частности, высококипящие нафталиновые и олефиновые фракции нефти, такие как тяжелый обогащенный ароматическими соединениями лигроин. Другие растворители могут включать растительные масла, масла из семян и сложные эфиры растительных масел и масел из семян. Подходящие эмульгаторы для масляных дисперсий выбирают из традиционных анионных и неионогенных поверхностно-активных веществ. Загустители или гелеобразующие средства добавляют в состав масляных дисперсий для модификации реологических свойств или свойств текучести жидкости и для предотвращения разделения и осаждения диспергированных частиц или капель.

Пестициды можно также применять в виде гранулированных композиций, которые являются особенно пригодными для применений в отношении почвы. Гранулированные композиции обычно содержат от приблизительно 0,5 до приблизительно 10% пестицида по весу, диспергированного в носителе, который содержит глину или аналогичное вещество. Такие композиции обычно получают путем растворения пестицида в подходящем растворителе и нанесения его на гранулированный носитель, который был предварительно сформован в частицы соответствующего размера, в диапазоне от приблизительно 0,5 до приблизительно 3 мм. Такие композиции также можно составлять путем получения теста или пасты из носителя и соединения, а затем дробления и высушивания с получением гранулированных частиц необходимого размера. Другая форма гранул представляет собой эмульгируемую в воде гранулу (EG). Это состав, состоящий из гранул, подлежащих применению в качестве традиционной эмульсии активного(-ых) ингредиента(-ов) по типу "масло в воде", либо растворенного(-ых), либо разведенного(-ых) в органическом растворителе, после разрушения и растворения в воде. Эмульгируемые в воде гранулы содержат один или несколько активных ингредиентов, либо растворенных, либо разведенных в подходящем органическом растворителе, которые абсорбируются водорастворимой полимерной оболочкой или некоторым другим типом растворимой или нерастворимой матрицы.

Пылевидные препараты, содержащие пестицид, получают посредством тщательного смешивания пестицида в порошкообразной форме с подходящим пылевидным используемым в сельском хозяйстве носителем, таким как каолиновая глина, измельченный вулканист и т.п. Пылевидные препараты могут соответственно содержать от приблизительно 1 до приблизительно 10% пестицида. Пылевидные препараты можно применять в качестве средства для протравливания семян или в качестве средства для внекорневого внесения с помощью опылителя.

Также на практике применяют пестицид в форме раствора в подходящем органическом растворителе, обычно минеральном масле, таком как инсектицидные масла, которые широко применяют в агрохимии.

Пестициды также можно применять в форме аэрозольной композиции. В таких композициях пестицид растворяют или диспергируют в носителе, который является смесью газов-вытеснителей. Аэрозольную композицию упаковывают в контейнер, из которого смесь распределяется через распылительный клапан.

Пестицидные приманки образуют при смешивании пестицида с пищей или аттрактантом или с ними обоими. Когда вредители съедают приманку, они при этом поглощают пестицид. Приманкам можно придавать форму гранул, гелей, жидкотекучих порошков, жидкостей или твердых веществ. Приманки можно применять в местах скопления вредителей.

Препараты для окуливания представляют собой пестициды, которые имеют относительно высокое давление паров и, таким образом, могут существовать в виде газа в концентрациях, достаточных для уничтожения вредителей в почве или замкнутых пространствах. Токсичность препарата для окуливания пропорциональна его концентрации и времени воздействия. Они характеризуются надлежащей способностью к диффузии и действуют путем проникновения в дыхательную систему вредителя или при абсорбции через кутикулу вредителя. Препараты для окуливания применяют для борьбы с вредителями в хранящихся продуктах под газонепроницаемыми листьями, в герметичных комнатах или зданиях или в специальных камерах.

Пестициды могут быть микроинкапсулированы путем суспендирования частиц или капель пестицида в полимерах различных типов. Путем изменения химических свойств полимера или изменения факторов при обработке можно получать микрокапсулы с различными размерами, растворимостью, значениями толщины стенки и степенями проницаемости. Эти факторы определяют скорость, с которой активный ингредиент высвобождается из них, что, в свою очередь, влияет на остаточные характеристики, скорость действия и запах продукта. Микрокапсулы можно составлять в виде суспензионных концентратов или диспергируемых в воде гранул.

Концентраты, представляющие собой масляные растворы, получают путем растворения пестицида в растворителе, который будет удерживать пестицид в растворе. Масляные растворы пестицида обычно обеспечивают более быстрое снижение численности и смерть вредителей, чем другие составы, из-за того, что сами растворители имеют пестицидное действие, и растворение воскообразной оболочки покрова повышает скорость поглощения пестицида. Другие преимущества масляных растворов включают лучшую стабильность при хранении, лучшее проникание в бороздки и лучшую адгезию к жирным поверхностям.

Другой вариант осуществления представляет собой эмульсию типа "масло в воде", где эмульсия содержит масляные шарики, каждый из которых имеет пластинчатое жидкокристаллическое покрытие и диспергирован в водной фазе, где каждый масляный шарик содержит по меньшей мере одно соединение, которое является активной с точки зрения сельского хозяйства, и отдельно покрыт монопластинчатым или олигопластинчатым слоем, содержащим: (1) по меньшей мере одно неионогенное липофильное поверхностно-активное средство, (2) по меньшей мере одно неионогенное гидрофильное поверхностно-активное средство и (3) по меньшей мере одно ионогенное поверхностно-активное средство, где шарики имеют средний диаметр частиц, составляющий менее 800 нм.

Другие компоненты составов.

Обычно, когда формулу один применяют в составе, такой состав также может содержать другие компоненты. Такие компоненты включают без ограничения (это неполный и не взаимоисключающий список) увлажнители, средства, способствующие распределению, клейкие вещества, смачивающие вещества, буферы, связывающие средства, средства, снижающие унос, средства, обуславливающие совместимость, пеногасители, очищающие средства и эмульгаторы. Несколько компонентов описано далее.

Увлажняющее средство представляет собой вещество, которое при добавлении в жидкость повышает распределение или проникающую способность жидкости путем снижения межфазного натяжения между жидкостью и поверхностью, по которой она распределяется. Увлажняющие средства применяют из-за двух основных функций в агрохимических составах: при обработке и изготовлении для повышения скорости смачиваемости порошков в воде с получением концентратов для растворимых жидкостей или суспензионных концентратов; и при смешивании продукта с водой в распылителе для снижения времени смачивания смачиваемых порошков и для улучшения проникания воды в диспергируемые в воде гранулы. Примерами увлажняющих средств, применяемых в составах смачиваемого порошка, суспензионного концентрата и диспергируемых в воде гранул, являются лаурилсульфат натрия; диоктилсульфосукцинат натрия; алкилфенолэтоксилаты и этоксилаты алифатических спиртов.

Диспергирующее средство представляет собой вещество, которое абсорбируется на поверхности частиц, помогает сохранять состояние дисперсии частиц и предотвращает их повторную агрегацию. Диспергирующие средства добавляют в агрохимические составы для облегчения диспергирования и суспендирования при изготовлении и для обеспечения повторного диспергирования частиц в воде в распылителе. Они широко применяются в смачиваемых порошках, суспензионных концентратах и диспергируемых в воде гранулах. Поверхностно-активные вещества, которые применяют в качестве диспергирующих средств, обладают способностью сильно абсорбироваться на поверхности частицы и обеспечивать заряженный или стерический барьер для перегруппировки частиц. Наиболее часто применяемыми поверхностно-активными веществами являются анионные, неионогенные или смеси двух типов. Для составов смачиваемого порошка наиболее распространенными диспергирующими средствами являются лигносульфонаты натрия. Для суспензионных концентратов очень высокую адсорбцию и стабилизацию получают с применением полиэлектролитов, таких как конденсаты формальдегида сульфоната нафталина натрия. Также применяют тристирилфенол-этоксилат-фосфатные сложные эфиры. Неионогенные вещества, такие как конденсаты алкиларилэтиленоксида и блок-сополимеры ЕО-РО, иногда объединяют с анионными веществами в качестве диспергирующих средств для суспензионных концентратов. В последние годы новые типы очень высокомолекулярных полимерных поверхностно-активных веществ были разработаны в качестве диспергирующих средств. Они имеют очень длинные гидрофобные "скелеты" и большое число этиленоксидных цепочек, образующих "зубья" "гребня" поверхностно-активного вещества. Эти высокомолекулярные полимеры могут придавать крайне надлежащую длительную стабильность суспензионным концентратам из-за того, что гидрофобные скелеты имеют много точек крепления на поверхностях частиц. Примерами диспергирующих средств, применяемых в агрохимических составах, являются лигносульфонаты натрия; конденсаты формальдегида сульфоната нафталина натрия; тристирилфенол-этоксилат-фосфатные сложные эфиры; этоксилаты алифатических спиртов; алкилэтоксилаты; блок-сополимеры ЕО-РО и привитые сополимеры.

Эмульгирующее средство представляет собой вещество, которое стабилизирует суспензию капель одной жидкой фазы в другой жидкой фазе. Без эмульгирующего средства две жидкости будут разделяться на две несмешиваемые жидкие фазы. Наиболее часто применяемые смеси эмульгаторов содержат алкилфенол или алифатический спирт с двенадцатью или более этиленоксидными звеньями и растворимую в масле кальциевую соль додецилбензолсульфоновой кислоты. Диапазон значений гидрофильно-липофильного баланса ("HLB") от приблизительно 8 до приблизительно 18 будет, как правило, обеспечивать надлежащие стабильные эмульсии. Стабильность эмульсии можно иногда улучшать путем добавления небольшого количества поверхностно-активного вещества на основе блок-сополимера EO-PO.

Солубилизирующее средство представляет собой поверхностно-активное вещество, которое будет образовывать мицеллы в воде при значениях концентрации выше критической концентрации мицеллообразования. Мицеллы затем способны растворять или солубилизовать нерастворимые в воде материалы внутри гидрофобной части мицеллы. Типы поверхностно-активных веществ, обычно применяемых для солубилизации, представляют собой неионогенные вещества, сорбитанмоноолеаты, этоксилаты сорбитанмоноолеата и сложные эфиры метилолеата.

Поверхностно-активные вещества иногда применяют либо отдельно, либо с другими добавками, такими как минеральные или растительные масла, в качестве вспомогательных веществ для смесей распылителей для улучшения биологических характеристик пестицида в отношении мишени. Типы поверхностно-активных веществ, применяемых для повышения биоактивности, зависят в целом от природы и механизма действия пестицида. Однако они часто представляют собой неионогенные вещества, такие как алкилэтоксилаты, этоксилаты линейных алифатических спиртов и этоксилаты алифатических аминов.

Носитель или разбавитель в сельскохозяйственном составе представляет собой материал, добавляемый в пестицид для придания продукту требуемой эффективности. Носители обычно представляют собой материалы с высокой абсорбирующей способностью, тогда как разбавители обычно представляют собой материалы с низкой абсорбирующей способностью. Носители и разбавители применяют в составах пылевидных препаратов, смачиваемых порошков, гранул и диспергируемых в воде гранул.

Органические растворители применяют, главным образом, в составах эмульгируемых концентратов, эмульсий типа "масло в воде", суспензий, масляных дисперсий и составах в сверхнизком объеме и, в меньшей степени, в гранулированных составах. Иногда применяют смеси растворителей. Первыми основными группами растворителей являются алифатические парафиновые масла, такие как керосин или очищенные парафины. Вторая основная группа (и наиболее распространенная) содержит ароматические растворители, такие как ксилол и высокомолекулярные фракции C9 и C10 ароматических растворителей. Хлорированные углеводороды являются пригодными в качестве соразтворителей для предотвращения кристаллизации пестицидов, когда состав эмульгируют в воде. Спирты иногда применяют в качестве соразтворителей для повышения силы растворителя. Другие растворители могут включать растительные масла, масла из семян и сложные эфиры растительных масел и масел из семян.

Загустители или гелеобразующие вещества применяют, главным образом, в составе суспензионных концентратов, масляных дисперсий, эмульсий и суспензий для модификации реологических свойств или свойств текучести жидкости и для предотвращения разделения и осаждения диспергированных частиц или капель. Загущающие, гелеобразующие и противоосаждающие средства обычно распределяют на две категории, а именно нерастворимые в воде частицы и растворимые в воде полимеры. Можно получать составы суспензионного концентрата и масляной дисперсии с применением глин и форм диоксида кремния. Примеры этих типов материалов включают без ограничения монтмориллонит, бентонит, алюмосиликат магния и аттапульгит. Растворимые в воде полисахариды в водных суспензионных концентратах применяли в качестве загущающе-гелеобразующих средств в течение многих лет. Типы полисахаридов, наиболее часто применяемых, представляют собой натуральные экстракты семян и морских водорослей или синтетические производные целлюлозы. Примеры таких типов материалов включают без ограничения гуаровую камедь; камедь бобов рожкового дерева; каррагенан; альгинаты; метилцеллюлозу; карбоксиметилцеллюлозу натрия (SCMC) и гидроксиэтилцеллюлозу (HEC). Другие типы противоосаждающих средств основаны на видах модифицированного крахмала, полиакрилатах, поливиниловом спирте и полиэтиленоксиде. Другим подходящим противоосаждающим средством является ксантановая камедь.

Микроорганизмы могут вызывать порчу составленных продуктов. Ввиду этого, для устранения или снижения степени их воздействия применяют консерванты. Примеры таких средств включают без ограничения пропионовую кислоту и ее натриевую соль, сорбиновую кислоту и ее натриевую и калиевую соли, бензойную кислоту и ее натриевую соль, натриевую соль п-гидроксibenзойной кислоты, метил-п-гидроксibenзоат и 1,2-бензизотиазолин-3-он (BIT).

Присутствие поверхностно-активных веществ часто вызывает вспенивание составов на водной основе при операциях смешивания при получении и нанесении посредством распылителя. Для снижения склонности к образованию пены часто добавляют пеногасители либо на стадии получения, либо перед заливкой в бутылки. Как правило, есть два типа пеногасителей, а именно силиконовые и несилконовые. Силиконовые обычно представляют собой водные эмульсии диметилполисилоксана, тогда как несилконовые пеногасители представляют собой нерастворимые в воде масла, такие как октанол и нонанол,

или диоксид кремния. В обоих случаях функция пеногасителя состоит в вытеснении поверхностно-активного средства с поверхности раздела фаз воздух-вода.

"Экологичные" средства (например, вспомогательные вещества, поверхностно-активные вещества, растворители) могут снижать общую степень воздействия на окружающую среду составов для защиты сельскохозяйственных культур. Экологичные средства являются биоразлагаемыми и, как правило, получены из природных и/или экологичных источников, например, источников, относящихся к растениям и животным. Конкретными примерами являются растительные масла, масла из семян и их сложные эфиры, также алкоксилированные алкилполиглюкозиды.

Области применения.

Формулу один можно применять в отношении любого места обитания. Конкретные места обитания для использования таких соединений включают места обитания, где растут люцерна, виды миндаля, виды яблони, ячмень, виды фасоли, канола, кукуруза, хлопчатник, виды крестоцветных, разновидности цветов, виды кормовых растений (райграс многолетний пастбищный, суданская трава, высокая овсяница, мятлик луговой и клевер), виды плодовых деревьев, салат-латук, виды овса, масличные культуры, виды апельсина, виды арахиса, виды груши, виды перца, виды картофеля, рис, сорго, виды сои, виды земляники, сахарный тростник, виды сахарной свеклы, виды подсолнечника, табак, виды томата, пшеница (например, твердая краснозерная озимая пшеница, мягкая краснозерная озимая пшеница, белозерная озимая пшеница, твердая краснозерная яровая пшеница и яровая пшеница-дурум) и другие ценные сельскохозяйственные культуры, или где будут посажены их семена.

Формулу один также можно применять там, где выращиваются растения, такие как сельскохозяйственные культуры, и где имеют место низкие уровни (или даже нет фактического присутствия) вредителей, которые могут приносить ущерб таким растениям в коммерческих масштабах. Использование таких соединений в таком месте обитания приносит пользу растениям, которые будут расти в этом месте обитания. Такие преимущества могут включать без ограничения способствовать росту лучшей корневой системы растения; способствовать тому, что растение лучше выдерживает тяжелые условия роста; улучшение здорового состояния растения; повышение урожая растения (например, увеличенную биомассу и/или повышенное содержание ценных ингредиентов); повышение жизненной силы растения (например, улучшенный рост растений и/или более зеленые листья); повышение качества растений (например, повышенное содержание или улучшенный состав определенных ингредиентов) и повышение стойкости растения в отношении абиотического и/или биотического стресса.

Формулу один можно применять с сульфатом аммония при выращивании различных растений, поскольку это может обеспечивать дополнительные преимущества.

Формулу один можно наносить на растения, обеспечивать ее введение в растения или применять вокруг растений, генетически модифицированных для экспрессии специальных признаков, таких как белки *Bacillus thuringiensis* (например, Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry1A.105, Cry2Ab, Vip3A, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34Ab1/Cry35Ab1), других инсектицидных токсинов, или таких, которые экспрессируют стойкость в отношении гербицидов, или таких, которые имеют "пакетированные" привнесенные гены, экспрессирующие инсектицидные токсины, стойкость в отношении гербицидов, повышение питательности или любые другие полезные признаки.

Формулу один можно применять в отношении лиственной и/или плодоносной частей растений для борьбы с вредителями. Либо такие соединения будут вступать в непосредственный контакт с вредителем, либо вредитель будет поглощать такие соединения при поедании растения или при втягивании сока или других питательных веществ из растения.

Формулу один можно также применять в отношении почвы, и в случае применения таким образом можно контролировать вредителей, питающихся корнями и стеблями. Корни могут поглощать такие соединения, при этом перенося их в лиственные части растения для борьбы с наземными жующими и питающимися соком вредителями.

Системное перемещение пестицидов в растениях можно использовать для борьбы с вредителем на одной части растения путем применения (например, путем опрыскивания места обитания) соединения формулы один в отношении другой части растения. Например, контроль питающихся листьями насекомых можно обеспечивать путем капельного орошения или внесения в борозду, путем обработки почвы, например, путем полива почвы перед высаживанием или после высаживания, или путем обработки семян растения перед высаживанием.

Формулу один можно применять с приманками. Обычно, в случае приманок, приманки помещают в землю, где, например, термиты могут контактировать с приманкой и/или привлекаться ею. Приманки также можно использовать на поверхности здания (горизонтальной, вертикальной или наклонной поверхности), где, например, муравьи, термиты, тараканы и мухи могут контактировать с приманкой и/или привлекаться ею.

Формула один может быть инкапсулирована внутри капсулы или помещена на ее поверхность. Размер капсул может быть в диапазоне от нанометров (диаметр приблизительно 100-900 нанометров) до микрометров (диаметр приблизительно 10-900 микрон).

Формулу один можно применять в отношении яиц вредителей. Из-за уникальной способности яиц

некоторых вредителей выдерживать некоторые пестициды может потребоваться повторное применение таких соединений для борьбы с вновь появляющимися. Формулу один можно применять в качестве препаратов для обработки семян. Обработку семян можно использовать в отношении всех типов семян, в том числе тех, из которых будут прорасти генетически модифицированные растения с экспрессией специальных признаков. Иллюстративные примеры включают такие, которые экспрессируют белки, токсичные в отношении беспозвоночных вредителей, например, белки *Bacillus thuringiensis*, или другие инсектицидные токсины, такие, которые экспрессируют стойкость в отношении гербицидов, как, например, семена "Roundup Ready", или такие, которые имеют "пакетированные" привнесенные гены, экспрессирующие инсектицидные токсины, стойкость в отношении гербицидов, повышение питательности, засухоустойчивость или любые другие полезные признаки. Кроме того, такие варианты обработки семян с помощью формулы один могут дополнительно повышать способность растения лучше выдерживать тяжелые условия роста. Это обеспечивает получение более здорового, более жизнеспособного растения, что может приводить к большей урожайности во время сбора урожая. Обычно пригодно от приблизительно 0,0025 формулы один на семя до приблизительно 2,0 мг формулы один на семя, пригодны количества, составляющие от 0,01 формулы один на семя до приблизительно 1,75 мг формулы один на семя, пригодны количества, составляющие от 0,1 формулы один на семя до приблизительно 1,5 мг формулы один на семя, пригодны количества, составляющие от 0,25 формулы один на семя до приблизительно 0,75 мг формулы один на семя. В общем пригодным является количество, составляющее приблизительно 0,5 мг формулы один на семя.

Формулу один можно применять с одним или несколькими активными ингредиентами в почвоулучшителе.

Формулу один можно применять для контроля эндопаразитов и эктопаразитов в секторе ветеринарии или в области содержания животных, отличных от человека. Такие соединения можно применять путем перорального введения, например, в форме таблеток, капсул, напитков, гранул, путем применения в отношении кожи, например, в форме погружения, распыления, выливания, нанесения и присыпания порошком, и путем парентерального введения, например, в форме инъекции.

Формулу один также можно успешно использовать в животноводстве, например, для крупного рогатого скота, цыплят, гусей, коз, свиней, овец и индюков. Их также можно использовать преимущественно для домашних животных, таких как лошади, собаки и кошки. Конкретными вредителями, контроль которых обеспечивают, будут мухи, блохи и клещи, которые докучают таким животным. Подходящие составы вводят перорально животным с питьевой водой или кормом. Дозы и составы, которые подходят, зависят от видов.

Формулу один также можно применять для контроля паразитических червей, в частности кишечных, у перечисленных выше животных.

Формулу один также можно использовать в терапевтических способах для медицинского ухода за людьми. Такие способы включают без ограничения пероральное введение, например, в форме таблеток, капсул, напитков, гранул, и нанесение на кожу.

Формулу один также можно применять в отношении инвазивных вредителей. Вредители по всему миру мигрировали на новые места (для такого вредителя) и затем становились новыми инвазивными видами в таком новом месте. Такие соединения также можно применять на таких новых инвазивных видах для их контроля в таком новом месте.

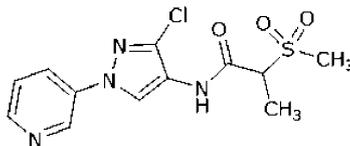
Ежегодно вирусы растений приводят к потере урожая сельскохозяйственных культур по всему миру, которая оценивается в 60 миллиардов долларов США. Многие вирусы растений должны передаваться переносчиком, чаще всего насекомыми, примерами которых являются цикадки и фонарницы. Тем не менее показано, что нематоды также переносят вирусы. Нематоды переносят вирусы растений, питаясь корнями. Формулу один также можно применять в отношении растения для подавления вредителей, переносящих вирус растения, так что это снижает вероятность передачи таких вирусов растения от вредителя к растению.

Следовательно, с учетом вышеуказанного представлены следующие дополнительные неисключительные пункты (D).

Заголовки в данном документе предназначены лишь для удобства и не должны использоваться для толкования какой-либо их части.

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Соединение N-(3-хлор-1-(пиридин-3-ил)-1Н-пиразол-4-ил)-2-(метилсульфонил)пропанамид, имеющее следующую формулу:



и его сельскохозяйственно приемлемые соли.

2. Пестицидная композиция, содержащая соединение по п.1 и носитель.



Евразийская патентная организация, ЕАПВ

Россия, 109012, Москва, Малый Черкасский пер., 2
