



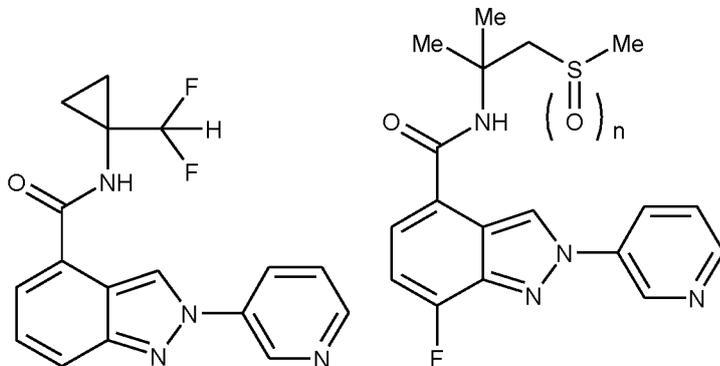
УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **128289** (13) **C2**
(51) МПК**C07D 401/04** (2006.01)**A01N 43/40** (2006.01)**A01N 43/52** (2006.01)НАЦІОНАЛЬНИЙ ОРГАН
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ ВЛАСНОСТІ
ДЕРЖАВНА ОРГАНІЗАЦІЯ
"УКРАЇНСЬКИЙ НАЦІОНАЛЬНИЙ
ОФІС ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ ТА ІННОВАЦІЙ"**(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВІНАХІД**

(21) Номер заявки:	a 2021 00558	(72) Винахідник(и):	Чжан Веньмін (US)
(22) Дата подання заявки:	12.07.2019	(73) Володілець (володільці):	ЕФЕМСІ КОРПОРЕЙШН, 2929 Walnut Street, Philadelphia, Pennsylvania 19104, United States of America (US)
(24) Дата, з якої є чинними права інтелектуальної власності:	30.05.2024	(74) Представник:	Мамуня Олександр Сергійович, реєстр. №357
(31) Номер попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції:	62/698,035, 62/778,992	(56) Перелік документів, взятих до уваги експертизою:	WO 2015/038503 A1, 19.03.2015 WO 2016/144351 A1, 15.09.2016
(32) Дата подання попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції:	14.07.2018, 13.12.2018		
(33) Код держави-учасниці Паризької конвенції, до якої подано попередню заявку:	US, US		
(41) Публікація відомостей про заявку:	10.03.2021, Бюл.№ 10		
(46) Публікація відомостей про державну реєстрацію:	29.05.2024, Бюл.№ 22		
(86) Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору РСТ	PCT/US2019/041547, 12.07.2019		

(54) ПЕСТИЦИДНІ СУМІШІ, ЯКІ МІСТЯТЬ ІНДАЗОЛИ

(57) Реферат:



Розкриті сполука 1 і сполуки формули 2. Також розкриті композиції, які містять сполуку 1 або сполуки формули 2, або їх комбінації, та способи боротьби з безхребетним шкідником, які включають взаємодію безхребетного шкідника або його оточення з біологічно ефективною кількістю сполуки або композиції за винаходом.

UA 128289 C2

За даною заявкою запитується пріоритет за попередньою заявкою U.S. № 62/698035, поданою 14 липня 2018 р., і за попередньою заявкою U.S. 62/778992, поданою 13 грудня 2018 р.

Галузь техніки, до якої належить винахід

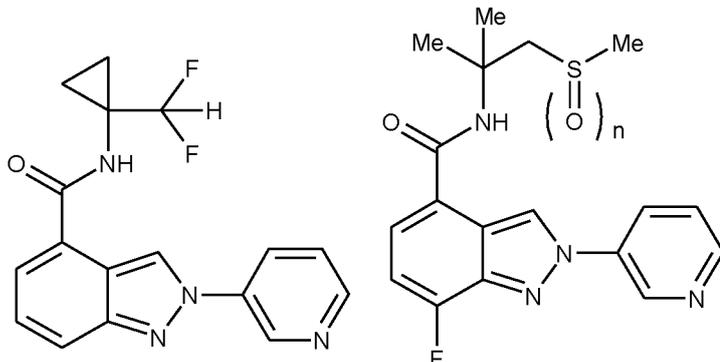
Даний винахід стосується деяких заміщених індазолів, композицій, які містить їх, придатних для сільськогосподарського або несільськогосподарського застосування, і способів їх застосування для боротьби з безхребетними шкідниками, такими як членистоногі, у сфері сільського господарства і в несільськогосподарській сфері.

Рівень техніки

Боротьба із безхребетними шкідниками для забезпечення високої врожайності сільськогосподарської культури. Пошкодження безхребетними шкідниками сільськогосподарських культур, які ростуть і зберігаються, може спричинити значне зниження продуктивності і тим самим призвести до збільшення витрат споживача. Боротьба з безхребетними шкідниками в лісовому господарстві, тепличних культурах, декоративних рослинах, культурах у розсадниках, харчових продуктах, які зберігаються, і продуктах із воволна, у худоби, у побуті, в дерні, продуктах із деревини і для охорони здоров'я людей та тварин також є важливою. Для цієї мети в продажу є численні продукти, але зберігається необхідність у нових сполуках, які є більш ефективними, менш дорогими, менш токсичними, екологічно більш безпечними або такими, що мають інші центри впливу. У публікації заявки РСТ WO 2015/038503 A1 розкриті споріднені індазоли.

Суть винаходу

Даний винахід стосується сполуки 1 або сполуки формули 2, композицій, які їх містять, і їх застосування для боротьби з безхребетними шкідниками:



Сполука 1

Сполука 2

25

де n дорівнює 0, 1 або 2.

Даний винахід також стосується композиції, яка містить сполуку 1 або сполуку формули 2, або комбінацію будь-якої з вказаних вище сполук.

Даний винахід також стосується композиції, яка містить сполуку 1 або сполуку формули 2 і щонайменше один додатковий компонент, вибраний з групи, яка складається з наступних: поверхнево-активні речовини, тверді розріджувачі і рідкі розріджувачі. У одному варіанті здійснення даний винахід також стосується композиції для боротьби з безхребетним шкідником, яка включає сполуку 1 або сполуку формули 2 і щонайменше один додатковий компонент, вибраний з групи, яка складається з наступних: поверхнево-активні речовини, тверді розріджувачі і рідкі розріджувачі, вказана композиція необов'язково додатково включає щонайменше одну додаткову біологічно активну сполуку або засіб.

Даний винахід стосується способу боротьби з безхребетним шкідником, який включає взаємодію безхребетного шкідника або його оточення з біологічно ефективною кількістю сполуки 1 або сполуки формули 2 (наприклад, у вигляді композиції, описаної в даному винаході). Даний винахід також стосується такого способу, де безхребетний шкідник або його оточення взаємодіє з композицією, яка містить біологічно ефективну кількість сполуки 1 або сполуки формули 2 і щонайменше один додатковий компонент, вибраний з групи, яка складається з наступних: поверхнево-активні речовини, тверді розріджувачі і рідкі розріджувачі, вказана композиція необов'язково додатково містить біологічно ефективну кількість щонайменше однієї додаткової біологічно активної сполуки або засобу.

Даний винахід також стосується способу захисту насіння від безхребетного шкідника, який включає взаємодію насіння з біологічно ефективною кількістю сполуки 1 або сполуки формули 2

сільськогосподарської рослини. "Збільшення потужності" означає збільшення росту або накопичення біомаси в сільськогосподарській рослині порівняно з необробленою контрольною сільськогосподарською рослиною. Термін "врожайність сільськогосподарської культури" означає повернення матеріалу сільськогосподарської культури за кількістю і якістю, отримане після збирання сільськогосподарської рослини. "Збільшення врожайності сільськогосподарської культури" означає збільшення врожайності сільськогосподарської культури порівняно з необробленою контрольною сільськогосподарською рослиною.

Термін "біологічно ефективна кількість" означає кількість біологічно активної сполуки (наприклад, сполуки 1 або сполуки формули 2), достатню для здійснення біологічного впливу при нанесенні на (тобто при взаємодії з нею) безхребетного шкідника, з яким проводять боротьбу, або середовище, яке його оточує, або на рослину, насіння, з якого виростає рослина, або місце росту рослини (наприклад, середовище для вирощування) для захисту рослини від пошкодження безхребетним шкідником або для іншого бажаного ефекту (наприклад, збільшення потужності рослини).

Варіанти здійснення даного винаходу, описані в Суті винаходу, включають описані нижче.

Варіант здійснення 1. Сполука 1.

Варіант здійснення 2. Сполука формули 2, де n дорівнює 0, 1 або 2.

Варіант здійснення 3. Сполука формули 2, де n дорівнює 0.

Варіант здійснення 4. Сполука формули 2, де n дорівнює 1.

Варіант здійснення 5. Сполука формули 2, де n дорівнює 2.

Варіант здійснення 6. Сполука, де сполукою є сполука, вибрана з групи, яка включає

N-[1-(дифторметил)циклопропіл]-2-(3-піридиніл)-2H-індазол-4-карбоксамід; N-[1,1-диметил-2-(метилтіо)етил]-7-фтор-2-(3-піридиніл)-2H-індазол-4-карбоксамід; N-[1,1-диметил-2-(метилсульфініл)етил]-7-фтор-2-(3-піридиніл)-2H-індазол-4-карбоксамід; і N-[1,1-диметил-2-(метилсульфоніл)етил]-7-фтор-2-(3-піридиніл)-2H-індазол-4-карбоксамід; або комбінацію будь-яких їх вказаних вище сполук.

Варіант здійснення 7. Композиція, яка містить сполуку 1 або сполуку формули 2 і щонайменше один додатковий компонент, вибраний з групи, яка складається з наступних: поверхнево-активні речовини, тверді розріджувачі і рідкі розріджувачі, вказана композиція необов'язково додатково включає щонайменше одну додаткову біологічно активну сполуку або засіб.

Варіант здійснення 8. Композиція, яка включає сполуку 1 або сполуку формули 2 і щонайменше один додатковий компонент, вибраний з групи, яка складається з наступних: поверхнево-активні речовини, тверді розріджувачі і рідкі розріджувачі, вказана композиція необов'язково додатково включає щонайменше одну додаткову біологічно активну сполуку або засіб, де щонайменше одну додаткову біологічно активну сполуку або засіб вибирають із групи, яка складається з наступних: абамектин, ацефат, ацехіноцил, ацетаміприн, акринатрин, афідопіропен, амідофлумет, амітраз, авермектин, азадирахтин, азінфос-метил, бенфуракарб, бенсултап, біфентрин, біфеназат, бістрифлурон, борат, бупрофезин, карбарил, карбофуран, картап, карзол, хлорантраніліпрол, хлорфенапір, хлорфлуазурон, хлорпірифос, хлорпірифос-метил, хромафенозид, клофентезин, клотіанідин, ціантраніліпрол, цикланіліпрол, циклопротрин, циклоксаприд, цифлуметофен, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, гамма-цигалотрин, лямбда-цигалотрин, циперметрин, альфа-циперметрин, дзета-циперметрин, циромазин, дельтаметрин, діафентіурон, діазинон, діельдрин, дифлубензурон, димефлутрин, димегіпо, диметоат, динотефуран, діофенолан, емаектин, ендосульфат, есфенвалерат, етипрол, етофенпрокс, етоксазол, фенбутатиноксид, фенітротіон, фенотіокарб, феноксикарб, фенпропатрин, фенвалерат, фіпроніл, флометоквін, флонікамід, флубендіамід, флуцитринат, флуфенерим, флуфеноксурон, флуфеноксистеробін, флуфенсульфон, флуопірам, флупіпрол, флупірадифуран, флувалінат, тау-флувалінат, фонофос, форметанат, фостіазат, галофенозид, гептафлутрин, гексафлумурон, гекситіазокс, гідраметилнон, імідаклоприд, індоксакарб, інсектицидні мила, ізофенфос, лufenуран, малатіон, меперфлутрин, метафлумізон, метальдегід, метамідофос, метидатіон, метіодикарб, метоміл, метопрен, метоксихлор, метофлутрин, монокротофос, монофлутрин, метоксифенозид, нітенпірам, нітіазин, новалурон, новіфлумурон, оксаміл, паратіон, паратіон-метил, перметрин, фонат, фозалон, фосмет, фосфамідон, піримікарб, профенофос, профлутрин, пропаргіт, протрифенбут, піфлубумід, піметрозин, пірафлупрол, піретрин, піридабен, піридаліл, пірифлухіназон, піриміностробін, пірипрол, пірипроксифен, ротенон, ріанодин, силафлуофен, спінеторам, спіносад, спіродиклофен, спіромезифен, спіротетрамат, сульпрофос, сульфоксафлор, тебуфенозид, тебуфенпірад, тефлубензурон, тефлутрин, тербуфос, тетрахлорвінфос, тетраметрин, тетраметилфлутрин, тіаклоприд, тіаметоксам, тіодикарб, тіосултап-натрій, толфенпірад,

тралометрин, триазамат, трихлорфон, трифлумурон, всі штами *Bacillus thuringiensis*, ентомопатогенні бактерії, всі штами вірусів ядерного поліедрозу, ентомопатогенні віруси і ентомопатогенні гриби.

Варіант здійснення 9. Композиція, яка містить сполуку 1 або сполуку формули 2 і щонайменше один додатковий компонент, вибраний з групи, яка складається з наступних: поверхнево-активні речовини, тверді розріджувачі і рідкі розріджувачі, вказана композиція необов'язково додатково включає щонайменше одну додаткову біологічно активну сполуку або засіб, де щонайменше одну додаткову біологічно активну сполуку або засіб вибирають із групи, яка складається з наступних: абамектин, ацетаміпрід, акринатрин, афідопіропен, амітраз, авермектин, азадирахтин, бенфуракарб, бенсултап, біфентрин, 3-бром-1-(3-хлор-2-піридиніл)-N-[4-ціано-2-метил-6-[(метиламіно)карбоніл]феніл]-1H-піразол-5-карбоксамід, бупрофезин, карбарил, картап, хлорантраніліпрол, хлорфенапір, хлорпірифос, клотіанідин, ціантраніліпрол, цикланіліпрол, циклопротрин, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, лямбда-цигалотрин, гамма-цигалотрин, циперметрин, альфа-циперметрин, дзета-циперметрин, циромазин, дельтаметрин, діельдрин, динотефуран, діофенолан, емаектин, ендосульфат, есфенвалерат, етипрол, етофенпрокс, етоксазол, фенітротіон, фенотіокарб, феноксикарб, фенвалерат, фіпроніл, флометоквін, флонікамід, флубендіамід, флуфеноксурон, флуфеноксистробін, флуфенсульфон, флупіпрол, флупірадіфурон, флувалінат, форметанат, фостіазат, гептафлутрин, гексафлумурон, гідраметилнон, імідаклопрід, індоксакарб, луфенурон, меперфлутрин, метафлумізон, методикарб, метоміл, метопрен, метоксифенозид, метофлутрин, монофлутрин, нітенпірам, нітіазин, новалурон, оксаміл, піфлубумід, піметрозин, піретрин, піридабен, піридаліл, піриміностробін, пірипроксифен, ріанодин, спінеторам, спіносад, спіродиклофен, спіромезифен, спіротетрамат, сульфоксафлор, тебуфенозид, тетраметрин, тіаклопрід, тіаметоксам, тіодикарб, тіосултап-натрій, тралометрин, тетраметилфлутрин, триазамат, трифлумурон, всі штами *Bacillus thuringiensis* і всі штами вірусів ядерного поліедрозу.

Варіант здійснення 10. Спосіб боротьби із безхребетним шкідником, який включає взаємодію безхребетного шкідника або його оточення з біологічно ефективною кількістю сполуки 1 або сполуки формули 2.

Варіант здійснення 11. Оброблене насіння, яке включає сполуку 1 або сполуку формули 2 в кількості, що дорівнює приблизно від 0,0001 до 1 мас.% в перерахунку на насіння до обробки.

Потрібно зазначити, що сполуки, які пропонуються в даному винаході, мають сприятливі характеристики метаболізму і/або збереженості в ґрунті і мають активність для боротьби зі спектром сільськогосподарських і несільськогосподарських безхребетних шкідників.

Потрібно особливо зазначити, що з точки зору спектра боротьби з безхребетними шкідниками і важливості з економічної точки зору сільськогосподарських культур від ураження або пошкодження, викликаного безхребетними шкідниками, шляхом боротьби з безхребетними шкідниками є варіантами здійснення даного винаходу. Сполуки, які пропонуються в даному винаході, внаслідок їх сприятливих характеристик перенесення або системності в рослинах також захищають листяні або інші частини рослин, які безпосередньо не взаємодіють зі сполукою 1 або сполукою формули 2, або з композицією, яка включає сполуку.

Також потрібно зазначити, що варіантами здійснення даного винаходу є композиції, які включають сполуку будь-якого з попередніх варіантів здійснення, а також будь-яких інших варіантів здійснення, описаних в даному винаході, і будь-які їх комбінації, і щонайменше один додатковий компонент, вибраний з групи, яка складається з наступних: поверхнево-активна речовина, твердий розріджувач і рідкий, вказані композиції необов'язково додатково включають щонайменше одну додаткову біологічно активну сполуку або засіб.

Також потрібно зазначити, що варіантами здійснення даного винаходу є композиції для боротьби з безхребетним шкідником, які включають сполуку будь-якого з попередніх варіантів здійснення, а також будь-яких інших варіантів здійснення, описаних в даному винаході, і будь-які їх комбінації, і щонайменше один додатковий компонент, вибраний з групи, яка складається з наступних: поверхнево-активна речовина, твердий розріджувач і рідкий, вказані композиції необов'язково додатково включають щонайменше одну додаткову біологічно активну сполуку або засіб. Варіанти здійснення даного винаходу додатково включають способи боротьби з безхребетним шкідником, які включають взаємодію безхребетного шкідника або його оточення з біологічно ефективною кількістю сполуки будь-якого з попередніх варіантів здійснення (наприклад, у вигляді композиції, описаної в даному винаході).

Варіанти здійснення даного винаходу також включають композицію, яка включає сполуку будь-якого з попередніх варіантів здійснення у вигляді рідкого препарату для просочення ґрунту. Варіанти здійснення даного винаходу додатково включають способи боротьби з

безхребетним шкідником, які включають взаємодію ґрунту з рідкою композицією для зрошування ґрунту, що включає біологічно ефективну кількість сполуки будь-якого з попередніх варіантів здійснення.

5 Варіанти здійснення даного винаходу також включають композицію для обприскування для боротьби з безхребетним шкідником, яка включає біологічно ефективну кількість сполуки будь-якого з попередніх варіантів здійснення і пропелент. Варіанти здійснення даного винаходу також включають композицію приманки для боротьби з безхребетним шкідником, що включає біологічно ефективну кількість сполуки будь-якого з попередніх варіантів здійснення, одну або більшу кількість поживних речовин, необов'язково атрактант і необов'язково вологоутримувальний засіб. Варіанти здійснення даного винаходу також включають пристрій для боротьби з безхребетним шкідником, що включає композицію приманки і кожух для розміщення вказаної композиції приманки, де кожух містить щонайменше один отвір такого розміру, щоб безхребетний шкідник міг проникати через отвір, так щоби безхребетний шкідник міг отримати доступ до вказаної композиції приманки з положення за межами кожуха, і де кожух додатково пристосований для розміщення на ділянці можливої або встановленої активності безхребетного шкідника або поблизу нього.

Варіанти здійснення даного винаходу також включають способи захисту насіння від безхребетного шкідника, які включають взаємодію насіння з біологічно ефективною кількістю сполуки будь-якого з попередніх варіантів здійснення.

20 Варіанти здійснення даного винаходу також включають способи захисту тварини від паразитичного безхребетного шкідника, які включають введення тварині паразитицидно ефективною кількістю сполуки будь-якого з попередніх варіантів здійснення.

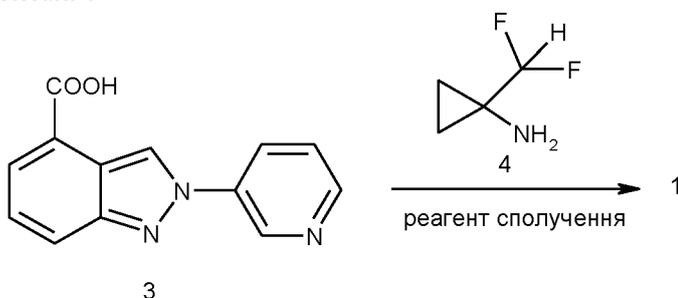
Варіанти здійснення даного винаходу також включають способи боротьби з безхребетним шкідником, які включають взаємодію безхребетного шкідника або його оточення з біологічно ефективною кількістю сполуки 1 або сполуки формули 2 (наприклад, у вигляді композиції, описаної в даному винаході), за умови, що способи не є способами медичного лікування організму людини або тварини шляхом терапії.

Даний винахід також стосується таких способів, де безхребетний шкідник або його оточення взаємодіє з композицією, яка містить біологічно ефективну кількість сполуки 1 або сполуки формули 2 і щонайменше один додатковий компонент, вибраний з групи, яка складається з наступних: поверхнево-активні речовини, тверді розріджувачі і рідкі розріджувачі, вказана композиція необов'язково додатково містить біологічно ефективну кількість щонайменше однієї додаткової біологічно активної сполуки або засобу, за умови, що способи не є способами медичного лікування організму людини або тварини шляхом терапії.

35 Сполуку 1 або сполуку формули 2 можна отримати за наступними методиками і варіантами, описаними на схемах 1 і 2. Використані наступні аббревіатури: DMF означає N, N-диметилформамід, DCC означає N, N'-дициклогексилкарбодіімід і HATU означає 1-[бис(диметиламіно)метиле́н]-1H-1,2,3-тріазоло[4,5-b]піридиній 3-оксид гексафторфосфат.

40 Сполуку 1 можна отримати зі сполуки 3 за методикою, наведеною на схемі 1. В цій методиці сполуку 1 дістають за реакцією утворення амідного зв'язку карбоксигрупи сполуки 3 з аміногрупою сполуки 4 в присутності реагенту сполучення для утворення амідного зв'язку, такого як DCC або HATU. Типові реагенти і умови проведення реакції, див. Jones, J. The Chemical Synthesis of Peptides, International Series of Monographs on Chemistry, Oxford University: Oxford, 1994.

45 Схема 1



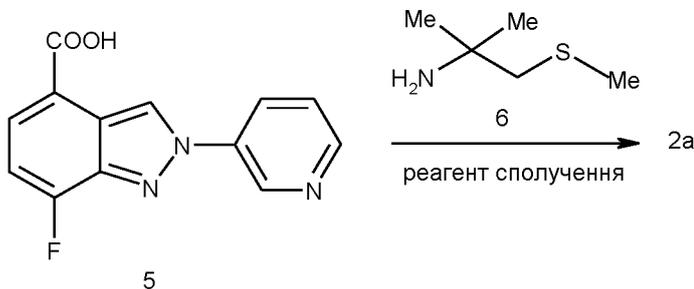
Сполука 3 (CAS Registry Number 2001277-98-9) відома в даній галузі техніки.

50 Сполуку формули 2, де n дорівнює 0 (сполука 2a), можна отримати зі сполуки 5 за методикою, наведеною на схемі 2. Методика, наведена на схемі 2, аналогічна методиці,

описаній для отримання сполуки 1 на схемі 1. В цій методиці сполуку формули 2 дістають з реакції утворення амідного зв'язку карбоксигрупи сполуки 5 з аміногрупою сполуки 6 в присутності реагенту сполучення для утворення амідного зв'язку, такого як DCC або HATU.

5

Схема 2



Сполуку формули 2, де n дорівнює 1 або 2 (тобто сульфоксид 2b або сульфон 2c відповідно), можна отримати окисненням сульфідів 2a. Багато методик і реагентів відомі в даній галузі техніки для окиснення сульфідів у сульфоксиди і сульфони. Приклади таких окиснювальних реагентів включають мета-хлорпербензойну кислоту і періодат натрію.

10

Відомо, що деякі реагенти і умови проведення реакції, описані вище для отримання сполуки 1 або сполук формули 2, можуть не бути сумісними з деякими функціональними групами, які містяться в проміжних продуктах. У цих випадках включення послідовності введення/видалення захисних груп або взаємоперетворення функціональних груп при синтезі сприяє отриманню шуканих продуктів. Застосування і вибір захисних груп очевидні для фахівця у хімічному синтезі (див., наприклад, Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. *Protective Groups in Organic Synthesis*, 2nd ed.; Wiley: New York, 1991). Фахівець у даній галузі техніки повинен знати, що в деяких випадках після введення реагентів, наведених на окремих схемах, може бути необхідне проведення додаткових стандартних стадій синтезу, не описаних детально, для завершення синтезу сполуки 1 або сполуки формули 2. Спеціаліст у даній галузі техніки також повинен знати, що може бути необхідне проведення комбінацій стадій, представлених на наведених вище схемах, в порядку, відмінному від вказаного у конкретній послідовності, наведеній для отримання сполуки 1 або сполук формули 2.

15

20

25

Фахівець у даній галузі техніки також повинен знати, що сполуку 1 і сполуки формули 2 та проміжні продукти, описані в даному винаході, можна ввести в різні реакції - електрофільні, нуклеофільні, радикальні, металоорганічні, окиснення і відновлення для додавання замісників або зміни наявних замісників.

30

Без додаткового уточнення передбачається, що фахівець у даній галузі техніки з використанням попереднього опису може використати даний винахід у його найбільшій мірі. Тому подальші приклади синтезу потрібно вважати ілюстративними, а не такими, які як-небудь обмежують даний винахід. Стадії подальших прикладів синтезу ілюструють методику для кожної стадії усього синтетичного перетворення і вихідну речовину для кожної стадії необов'язково отримують за конкретною препаративною методикою, яка описана в інших прикладах або стадіях. Вмісти у відсотках є масовими за винятком сумішей хроматографічних розчинників або якщо вказано інше. Вмісти в частинах і відсотках для сумішей хроматографічних розчинників є об'ємними, якщо не вказано інше. Спектри ^1H NMR наведені в част./млн і зняті в слабопольному напрямку від тетраметилсилану; "s" означає синглет, "d" означає дублет, "t" означає триплет, "q" означає кuartет, "m" означає мультиплет, "dd" означає дублет дублетів, "dt" означає дублет триплетів, "br s" означає широкий синглет. DMF означає N, N-диметилформамід. Номери сполук відповідають таблиці індексів А.

35

40

Приклад синтезу 1

Отримання N-[1-(дифторметил)циклопропіл]-2-(3-піридиніл)-2H-індазол-4-карбоксаміду (сполука 1)

45

Стадія А: Отримання N-[1-(дифторметил)циклопропіл]-2-(3-піридиніл)-2H-індазол-4-карбоксаміду

Розчин 2-(3-піридиніл)-2H-індазол-4-карбонової кислоти (100 мг, 0,42 ммоль, CAS Registry Number 2001277-98-9), HATU (190 мг, 0,5 ммоль), 1-(дифторметил)циклопропанамінгідрохлориду (71 мг, 0,5 ммоль) в DMF (2 мл) обробляли триетиламіном (174 мкл, 1,25 ммоль). Реакційну суміш перемішували протягом ночі при кімнатній температурі. Потім реакційну суміш відразу очищували з допомогою колонкової хроматографії із оберненою фазою [колонка C18, елювали з допомогою 10%-100% MeCN/MeOH (1:1) у воді] і отримували

50

шукану сполуку, яка пропонується в даному винаході (105 мг, вихід 76%). ¹H NMR (500 MHz, DMSO-d₆) δ част./млн 9,35-9,39 (m, 2H) 9,14 (s, 1H) 8,67-8,68 (m, 1H) 8,55-8,58 (m, 1H) 7,94-7,97 (m, 1H), 7,73-7,75 (m, 1H), 7,63-7,67 (m, 1H), 7,41-7,45 (m, 1H), 6,21 (t, 1H), 1,13-1,17 (m, 2H), 1,02-1,06 (m, 2H).

5 Приклад синтезу 2

Отримання N-[1,1-диметил-2-(метилтіо)етил]-7-фтор-2-(3-піридиніл)-2H-індазол-4-карбоксаміду (сполука 2a)

Стадія А: Отримання N-[1,1-диметил-2-(метилтіо)етил]-7-фтор-2-(3-піридиніл)-2H-індазол-4-карбоксаміду (сполука 2a)

10 Розчин 7-фтор-2-(3-піридиніл)-2H-індазол-4-карбонової кислоти (10 г, 39 ммоль), НАТУ (17,7 г, 47 ммоль), 2-метил-1-метилсульфанілпропан-2-аміну (7 г, 58 ммоль) в DMF (100 мл) обробляли триетиламіном (16 мл, 117 ммоль). Реакційну суміш перемішували протягом 4 год. при кімнатній температурі. Реакційну суміш розбавляли з допомогою EtOAc (300 мл) і промивали водою (6×100 мл). Органічний шар відділяли і концентрували у вакуумі. Отриману неочищену тверду речовину очищували з допомогою хроматографії з нормальною фазою (силікагель, елюювали з допомогою 70-100% EtOAc в гексані) і отримували шукану сполуку, яка пропонується в даному винаході (9,9 г, вихід 71%). ¹H NMR (500 MHz, DMSO-d₆) δ част./млн 9,37-9,43 (m, 2H), 8,69-8,72 (m, 1H), 8,56-8,60 (m, 1H), 8,00 (s, 1H), 7,64-7,70 (m, 2 H), 7,22-7,27 (m, 1H), 3,11 (s, 2H), 2,09 (s, 3H), 1,47 (s, 6H).

20 Сполуку 2b (N-[1,1-диметил-2-(метилсульфініл)етил]-7-фтор-2-(3-піридиніл)-2H індазол-4-карбоксамід) і сполуку 2c (N-[1,1-диметил-2-(метилсульфоніл)етил]-7-фтор-2-(3-піридиніл)-2H індазол-4-карбоксамід можна отримати окисненням сполуки 2a.

25 Сполуку, яка пропонується в даному винаході, звичайно використовують як активний інгредієнт для боротьби з безхребетним шкідником у композиції, тобто в препараті щонайменше з одним додатковим компонентом, вибраним з групи, яка складається з наступних: поверхнево-активні речовини, тверді розріджувачі і рідкі розріджувачі, який служить як носій. Інгредієнти препарату або композиції вибирають так, щоб вони були узгоджені з фізичними характеристиками активного інгредієнта, режимом нанесення і факторами навколишнього середовища, такими як тип, вологість і температура ґрунту.

30 Придатні препарати включають рідкі і тверді композиції. Рідкі композиції включають розчини (включаючи концентрати, які емульгуються), суспензії, емульсії (включаючи мікроемульсії, емульсії типу масло-у-воді, сипкі концентрати і/або суспензії) і т. п., які необов'язково можна загустити в гелі. Загальними типами водних рідких композицій є розчинний концентрат, концентрат суспензії, суспензія капсул, концентрована емульсія, мікроемульсія, емульсія масло-у-воді, сипкий концентрат і суспензії. Загальними типами неводних рідких композицій є концентрат, який емульгується, концентрат, який мікроемульгується, концентрат, який диспергується, і масляна дисперсія.

40 Загальними типами твердих композицій є дусти, порошки, гранули, пелети, котуни, пастилки, таблетки, заповнені плівки (включаючи покриття насіння) і т. п., які можуть бути такими, що диспергуються у воді ("що змочуються"), або розчинними у воді. Плівки і покриття, утворені з плівкоутворювальних розчинів або плинних суспензій, є особливо придатними для обробки насіння. Активний інгредієнт можна (мікро)капсулювати і потім перетворити в суспензію або твердий препарат; альтернативно, увесь препарат активного інгредієнта можна капсулювати (або "нанести покриття"). Капсулювання може регулювати або затримувати вивільнення активного інгредієнта. Гранули, які емульгуються, об'єднують переваги препарату концентрату, який емульгується, і сухого гранульованого препарату. Висококонцентровані композиції в основному використовують як проміжні продукти для іншого препарату.

50 Препарати для обприскування звичайно до обприскування вміщують у придатне середовище. Такі рідкі і тверді препарати звичайно готують так, щоб їх можна було легко розбавити в середовищі для обприскування, звичайно у воді, але іноді в іншому придатному середовищі, такому як ароматичний або парафіновий вуглеводень або рослинна олія. Об'єми для обприскування можуть знаходитися в діапазоні від приблизно одного до декількох тисяч літрів на гектар, але частіше вони знаходяться в діапазоні від приблизно 10 до декількох тисяч літрів на гектар. Препарати для обприскування можуть бути змішані в баку з водою або іншим придатним середовищем для некореневої обробки шляхом повітряного або наземного нанесення або для нанесення на середовище, в якому вирощують рослини. Рідкі і сухі препарати можна дозувати прямо в системи краплинного зрошення або дозувати в борозни при посіві. Рідкі і тверді препарати можна наносити на насіння культур і іншу бажану рослинність як засіб для обробки насіння до висівання для захисту коріння, що розвивається, і

60 інших підземних частин рослини і/або листя шляхом системного поглинання.

Препарати звичайно містять ефективні кількості активного інгредієнта, розріджувача і поверхнево-активної речовини в наступних використовуваних зразкових діапазонах значень, до яких додають розріджувач до 100 мас.%.

	Мас.%		
	Активний інгредієнт	Розріджувач	Поверхнево-активна речовина
Гранули, таблетки і порошки, які диспергуються у воді і розчинні у воді	0,001-90	0-99,999	0-15
Масляні дисперсії, суспензії, емульсії, розчини (включаючи концентрати, які емульгуються)	1-50	40-99	0-50
Дусти	1-25	70-99	0-5
Гранули і пелети	0,001-99	5-99,999	0-15
Висококонтровані композиції	90-99	0-10	0-2

5

Тверді розріджувачі включають, наприклад, глини, такі як бентоніт, монтморилоніт, атапульгіт і каолін, гіпс, целюлоза, діоксид титану, оксид цинку, крохмаль, декстрин, цукри (наприклад, лактоза, сахароза), діоксид кремнію, тальк, слюду, діатомову землю, сечовину, карбонат кальцію, карбонат і бікарбонат і сульфат натрію. Типові тверді розріджувачі описані у

10

Watkins et al., Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers, 2nd Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jersey.

Рідкі розріджувачі включають, наприклад, воду, N, N-диметилалканаміди (наприклад, N, N-диметилформамід), лимонен, диметилсульфоксид, N-алкілпіролідони (наприклад, N-метилпіролідон), алкілфосфати (наприклад, триетилфосфат), етиленгліколь, триетиленгліколь, пропіленгліколь, дипропіленгліколь, поліпропіленгліколь, пропіленкарбонат, бутиленкарбонат, парафіни (наприклад, білі мінеральні масла, нормальні парафіни, ізопарафіни), алкілбензоли, алкілнафталини, гліцерин, гліцеринтриацетат, сорбіт, ароматичні вуглеводні, деароматизовані аліфатичні сполуки, алкілбензоли, алкілнафталини, кетони, такі як циклогексанон, 2-гептанон, ізофорон і 4-гідрокси-4-метил-2-пентанон, ацетати, такі як ізоамілацетат, гексилацетат, гептилацетат, октилацетат, нонілацетат, тридецилацетат і ізоборнілацетат, інші складні ефіри, такі як алкіловані лактати, двозаміщені складні ефіри, алкіл- і арилбензоати, γ -бутиролактон і спирти, які можуть бути лінійними, розгалуженими, насиченими або ненасиченими, такі як метанол, етанол, н-пропанол, ізопропіловий спирт, н-бутанол, ізобутиловий спирт, н-гексанол, 2-етилгексанол, н-октанол, деканол, ізодециловий спирт, ізооктадеканол, цетиловий спирт, лауриловий спирт, тридециловий спирт, олеїловий спирт, циклогексанол, тетрагідрофурфуриловий спирт, діацетоновий спирт, крезол і бензиловий спирт. Рідкі розріджувачі також включають складні ефіри гліцерину і насичених і ненасичених жирних кислот (звичайно C6-C22), такий як олії з насіння рослин і плодові олії (наприклад, олії оливи, касторова, льняна, кунжутна, кукурудзяна (маїсова), арахісова, соняшникова, виноградна, сафлорова, бавовняна, соєва, рапсова, кокосова і пальмоядрова), жири з тваринних джерел (наприклад, яловичий жир, свинячий жир, ляд, жир печінки тріски, риб'ячий жир) і їх суміші. Рідкі розріджувачі також включають алкіловані жирні кислоти (наприклад, метиловані, етиловані, бутиловані), де жирні кислоти можна отримати шляхом гідролізу складних ефірів гліцерину з рослинних і тваринних джерел і можна очистити за допомогою переганання. Типові рідкі розріджувачі описані в Marsden, Solvents Guide, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950.

15

20

25

30

35

Тверді і рідкі композиції, які пропонуються в даному винаході, часто включають одну або більшу кількість поверхнево-активних речовин. При додаванні до рідини поверхнево-активні речовини (також відомі, як "поверхнево-активні агенти") звичайно змінюють, найчастіше

40

знижують поверхневий натяг рідини. Залежно від природи гідрофільних і ліпофільних груп у молекулі поверхнево-активної речовини поверхнево-активні речовини можна використовувати як змочувальні агенти, диспергувальні агенти, емульгатори або пінопригнічувальні агенти. Поверхнево-активні речовини можна розділити на неіоногенні, аніоногенні або катіоногенні. Неіоногенні поверхнево-активні речовини, застосовні для композицій, які пропонуються в даному винаході, включають, але не обмежуються тільки ними: алкоксилати спиртів, такі як алкоксилати спиртів на основі природних і синтетичних спиртів (які можуть бути розгалуженими або лінійними) і отримують зі спиртів і етиленоксиду, пропіленоксиду, бутиленоксиду або їх суміші; амінетоксилати, алканоламіди і етоксировані алканоламіди; алкоксировані тригліцериди,

45

такі як етоксировані соєва, касторова і рапсова олії; алкілфенолалкоксилати, такі як октилфенолетоксилати, нонілфенолетоксилати, динонілфенолетоксилати і додецилфенолетоксилати (які отримуються з фенолів і етиленоксиду, пропіленоксиду, бутіленоксиду або їх суміші); блок-співполімери, які отримуються з етиленоксиду або пропіленоксиду і обернені блок-співполімери, де кінцеві блоки отримують із пропіленоксиду; етоксировані жирні кислоти; етоксировані жирні ефіри й олії; етоксировані метилові ефіри; етоксирований тристирилфенол (включаючи ті, що отримуються з етиленоксиду, пропіленоксиду, бутіленоксиду або їх суміші); ефіри жирних кислот, складні ефіри гліцерину, похідні на основі ланоліну, поліетоксировані складні ефіри, такі як поліетоксировані сорбітанові ефіри жирних кислот, поліетоксировані сорбітанові ефіри жирних кислот і поліетоксировані ефіри гліцерину і жирних кислот; інші похідні сорбітану, такі як сорбітанові складні ефіри; полімерні поверхнево-активні речовини, такі як статистичні співполімери, блок-співполімери, алкідні рег (поліетиленгліколь) смоли, прищеплені або гребінчасті полімери і зіркоподібні полімери; поліетиленгліколі (regs); поліетиленгліколеві ефіри жирних кислот; поверхнево-активні речовини на основі силіконів; і похідні цукри, такі як складні ефіри сахарози, алкілполіглікозиди і алкілполісахариди.

Придатні аніоногенні поверхнево-активні речовини включають, але не обмежуються тільки ними: алкіларилсульфонові кислоти і їх солі; карбоксировані спирти або алкілфенолетоксилати; похідні дифенілсульфонату; лігнін і похідні лігніну, такі як лігносульфонати; малеїнові або бурштинові кислоти або їх ангідриди; олефісульфонати; фосфати, такі як фосфати алкоксилатів спиртів, фосфати алкілфенолалкоксилатів і фосфати стирилфенолетоксилатів; поверхнево-активні речовини на основі білків; похідні саркозину; сульфат ефіру стирилфенолу; сульфати і сульфонати олій і жирних кислот; сульфати і сульфонати етоксированих алкілфенолів; сульфати спиртів; сульфати етоксированих спиртів; сульфонати амінів і амідів, такі як N, N-алкілтаурати; сульфонати бензолу, кумолу, толуолу, ксилолу, і додецил- і тридецилбензоли; сульфонати конденсованого нафталіну; сульфонати нафталіну і алкілнафталіну; сульфонати фракціонованої нафти; сульфосукцинамати; і сульфосукцинати і їх похідні, такі як солі діалкілсульфосукцинатів.

Придатні катіоногенні поверхнево-активні речовини включають, але не обмежуються тільки ними: аміді і етоксировані аміді; аміни, такі як N-алкілпропандіаміни, трипропілентриаміни і дипропілентетрааміни, і етоксировані аміни, етоксировані діаміни і пропоксировані аміни (що отримуються з амінів і етиленоксиду, пропіленоксиду, бутіленоксиду або їх суміші); солі амінів, такі як амінацетати і солі діамінів; четвертинні амонієві солі, такі як четвертинні солі, етоксировані четвертинні солі і дичетвертинні солі; і аміноксиди, такі як алкілдиметиламіноксиди і біс-(2-гідроксіетил)-алкіламіноксиди.

Також придатними для композицій, які пропонуються в даному винаході, є суміші неіоногенних і аніоногенних поверхнево-активних речовин або суміші неіоногенних і катіоногенних поверхнево-активних речовин. Неіоногенні, аніоногенні і катіоногенні поверхнево-активні речовини і рекомендації з їх застосування наведені в різних публікаціях, включаючи McCutcheon's Emulsifiers and Detergents, annual American and International Editions published by McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; Sisely and Wood, Encyclopedia of Surface Active Agents, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964; и A. S. Davidson and B. Milwidsky, Synthetic Detergents, Seventh Edition, John Wiley and Sons, New York, 1987.

Композиції, які пропонуються в даному винаході, також можуть містити допоміжні речовини для приготування препаратів і добавки, відомі фахівцям у даній галузі техніки, як допоміжні речовини для приготування препаратів (деякі з яких також можна вважати діючими як тверді розріджувачі, рідкі розріджувачі або поверхнево-активні речовини). Такі допоміжні речовини для приготування препаратів і добавки можуть регулювати: рН (буфери), спінення під час обробки (протиспінювачі, такі як поліорганосилоксани), осадження активних інгредієнтів (суспендувальні агенти), в'язкість (тиксотропні загусники), ріст мікробів у контейнері (протимікробні засоби), замерзання продукту (антифризи), колір (барвники/дисперсії пігментів), змивання (плівкоутворювачі або клейкі засоби), випаровування (уповільнювачі випаровування) й інші характеристики препаратів. Плівкоутворювачі включають, наприклад, полівінілацетати, співполімери полівінілацетату, співполімер полівінілпіролідон-вінілацетат, полівінілові спирти, співполімери полівінілового спирту і воски. Приклади допоміжних речовин і добавок для препаратів включають вказані в McCutcheon's Volume 2: Functional Materials, annual International and North American editions published by McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; і PCT Publication WO 03/024222.

Сполуку 1 або сполуку формули 2 і будь-які інші активні інгредієнти звичайно включають у композиції, які пропонуються в даному винаході, шляхом розчинення активного інгредієнта в

розчиннику або шляхом розмелювання у рідкому або сухому розріджувачі. Розчини, включаючи концентрати, які емульгуються, можна отримати простим змішуванням інгредієнтів. Якщо розчинник рідкої композиції, призначеної для використання як концентрат, який емульгується, не змішується з водою, звичайно додають емульгатор для емульгування, що містить активну речовину розчинника при розбавленні водою. Зависі активного інгредієнта, що мають частинки діаметром до 2000 мкм, можна піддавати мокрому розмелюванню з використанням середовищ для розмелювання і отримати частинки зі середнім діаметром менше 3 мкм. Водні зависі можна перетворити в готові концентрати суспензії (див., наприклад, U.S. 3060084) або додатково обробити шляхом розпилювального сушіння і отримати гранули, які диспергуються у воді. Для сухих препаратів звичайно необхідні методики сухого розмелювання, які дають частинки зі середнім діаметром в діапазоні від 2 до 10 мкм. Дисти і порошки можна отримати змішуванням і звичайно розмелюванням (наприклад, в молотковому млині або струминному млині). Гранули і пелети можна отримати шляхом обприскування активною речовиною попередньо сформованих гранульованих носіїв або за методиками агломерації. Див. Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, December 4, 1967, pp 147-48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, pages 8-57 і following, і WO 91/13546. Пелети можна отримати, як описано в U.S. 4172714. Гранули, які диспергуються у воді, і розчинні у воді гранули можна отримати, як описано в U.S. 4144050, U.S. 3920442 і DE 3246493. Таблетки можна отримати, як описано в U.S. 5180587, U.S. 5232701 і U.S. 5208030. Плівки можна отримати, як описано в GB 2095558 і U.S. 3299566.

Додаткову інформацію в галузі приготування препаратів див. T. S. Woods, "The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture" in Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge, T. Brooks and T. R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, pp. 120-133. Див. також U.S. 3235361, стовпчик 6, рядок 16 до стовпчика 7, рядок 19 і приклади 10-41; U.S. 3309192, стовпчик 5, рядок 43 до стовпчика 7, рядок 62 і приклади 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138-140, 162-164, 166, 167 і 169-182; U.S. 2891855, стовпчик 3, рядок 66 до стовпчика 5, рядок 17 і приклади 1-4; Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pp 81-96; Hance et al., Weed Control Handbook, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989; і Developments in formulation technology, PJB Publications, Richmond, UK, 2000.

У подальших прикладах всі речовини отримані звичайними шляхами. Без додаткового уточнення передбачається, що фахівець у даній галузі техніки з використанням попереднього опису може використати даний винахід в його найбільшій мірі. Тому подальші приклади синтезу потрібно вважати ілюстративними, а не такими, що як-небудь обмежують даний винахід. Вмісти у відсотках є масовими, якщо вказано інше.

Приклад А

Висококонцентрований концентрат

Сполука 1	98,5%
аерогель діоксиду кремнію	0,5%
синтетичний аморфний тонкодисперсний діоксид кремнію	1,0%

Приклад В

Порошок, який змочується

Сполука 2a	65,0%
додецилфеноловий ефір	
поліетиленгліколю	2,0%
лігнінсульфонат натрію	4,0%
силікоалюмінат натрію	6,0%
монтморилоніт (прожарений)	23,0%

Приклад С

Гранула

Сполука 2b	10,0%
атапульгіт гранули (низький вміст летких речовин, 0,71/0,30 мм; U.S.S. сита № 25-50)	90,0%

40

	Приклад D	
	Екструдована пелета	
	Сполука 2с	25,0%
	безводний сульфат натрію	10,0%
	неочищений лігнінсульфонат кальцію	5,0%
	алкілнафталінсульфонат натрію	1,0%
	бентоніт кальцію/магнію	59,0%
	Приклад E	
	Концентрат, який емульгується	
	Сполука 1	10,0%
	поліоксіетиленсорбітгексолеат	20,0%
	метиловий ефір С6-С10 жирної кислоти	70,0%
	Приклад F	
	Мікроемульсія	
	Сполука 2а	5,0%
	співполімер полівінілпіролідон-вінілацетат	30,0%
	алкілполіглікозид	30,0%
	гліцерилмоноолеат	15,0%
	вода	20,0%
	Приклад G	
	Засіб для обробки насіння	
	Сполука 2b	20,00%
	співполімер полівінілпіролідон-вінілацетат	5,00%
	кислий гірський віск	5,00%
	лігнінсульфонат кальцію	1,00%
	блок-співполімери	
	поліоксіетилен/поліоксипропілен	1,00%
	стеариловий спирт (РОЕ 20)	2,00%
	поліорганосилан	0,20%
	чевроний барвник	0,05%
	вода	65,75%
5	Приклад H	
	Тверде добриво	
	Сполука 2с	2,5%
	співполімер піролідон-стирол	4,8%
	тристирилфеніл-16-етоксилат	2,3%
	тальк	0,8%
	кукурудзяний крохмаль	5,0%
	добриво уповільненої дії	36,0%
	каолін	38,0%
	вода	10,6%
	Приклад I	
	Концентрат суспензії	
	Сполука 1	35%
	блок-співполімер	
	бутилполіоксіетилен/поліпропілен	4,0%
	співполімер стеаринова кислота/поліетиленгліколь	1,0%
	стирол-акриловий співполімер	1,0%
	ксантанова камедь	0,1%
	пропіленгліколь	5,0%
	протиспінювач на основі силікону	0,1%
	1,2-бензіотіазолін-3-он	0,1%
	вода	53,7%

Приклад J

Емульсія у воді

Сполука 2a	10,0%
блок-співполімер	
бутилполіоксіетилен/поліпропілен	4,0%
співполімер стеаринова	
кислота/поліетиленгліколь	1,0%
стирол-акриловий співполімер	1,0%
ксантанова камедь	0,1%
пропіленгліколь	5,0%
протиспінювач на основі силікону	0,1%
1,2-бензізотіазолін-3-он	0,1%
ароматичний вуглеводень нафти	20,0
вода	58,7%

Приклад K

Масляна дисперсія

Сполука 2b	25%
поліоксіетиленсорбітгексаолеат	15%
органічно модифікована	
бентонітова глина	2,5%
метиловий ефір жирної кислоти	57,5%

Приклад L

Суспоемульсія

Сполука 2c	10,0%
імідаклоприд	5,0%
блок-співполімер	
бутилполіоксіетилен/поліпропілен	4,0%
співполімер стеаринова	
кислота/поліетиленгліколь	1,0%
стирол-акриловий співполімер	1,0%
ксантанова камедь	0,1%
пропіленгліколь	5,0%
протиспінювач на основі силікону	0,1%
1,2-бензізотіазолін-3-он	0,1%
ароматичний вуглеводень нафти	20,0%
вода	53,7%

- Сполуки, які пропонуються в даному винаході, мають активність відносно широкого спектра безхребетних шкідників. Ці шкідники включають безхребетних, які мешкають в різних середовищах, таких як, наприклад, листя, коріння рослин, ґрунт, зібрані культури або інші харчові продукти, будівлі або покрив тіла тварин. Ці шкідники включають, наприклад, безхребетних, які харчуються листям (включаючи листя, стебла, квітки і плоди), насінням, деревиною, текстильними волокнами або кров'ю або тканинами тварин, і які тим самим викликають пошкодження або ураження, наприклад, сільськогосподарських культур, які ростуть або зберігаються, лісів, тепличних культур, декоративних рослин, культур у розсадниках, харчових продуктів, що зберігаються, або волоконних продуктів, або будинків або інших споруд або їх вмісту, або шкідливі для здоров'я тварин або громадської охорони здоров'я. Фахівці в даній галузі техніки повинні розуміти, що не всі сполуки є однаково ефективними відносно всіх стадій росту всіх шкідників.

- Таким чином, ці сполуки і композиції, які пропонуються в даному винаході, застосовні в сільському господарстві для захисту польових культур від трав'янистих безхребетних шкідників і також не в сільському господарстві для захисту інших садових культур і рослин від трав'янистих безхребетних шкідників. Це застосування включає захист сільськогосподарських культур і інших рослин (тобто і сільськогосподарських, і несільськогосподарських), які містять генетичний матеріал, введений за допомогою генної інженерії (тобто трансгенний) або модифікований мутагенезом для надання сприятливих ознак. Приклади таких ознак включають стійкість до гербіцидів, стійкість до рослинної шкідників (наприклад, комах, кліщів, попелиць, павуків, нематод, равликів, фітопатогенних грибів, бактерій і вірусів), поліпшений ріст рослини, поліпшену стійкість до несприятливих умов росту, таких як високі або низькі температури, низька або висока вологість ґрунту і висока солоність, поліпшене цвітіння або плодоносіння, більш високий зібраний урожай, більш швидке дозрівання, більш висока якість і/або поживна

цінність зібраного продукту або поліпшені характеристики зберігання або обробки зібраних продуктів. Трансгенні рослини можна модифікувати для експресування багатьох ознак. Приклади рослин, що мають ознаки, надані за допомогою генної інженерії або мутагенезу, включають сорти кукурудзи, бавовнику, сої і картоплі, які експресують інсектицидний токсин *Bacillus thuringiensis*, такі як YIELD GARD®, KnockOut®, StarLink®, Bollgard®, NuCOTN® і NewLeaf®, INVICTA RR2 PRO™, і стійкі до гербіцидів сорти кукурудзи, бавовнику, сої і рапсу, такі як Roundup Ready®, Liberty Link®, IMI®, STS® і Clearfield®, а також сільськогосподарські культури, які експресують N-ацетилтрансферазу (GAT) з наданням стійкості до гербіциду гліфосату, або сільськогосподарські культури, що містять ген HRA, який надає стійкість до гербіцидів, які інгібують ацетолактатсинтазу (ALS). Сполуки і композиції, які пропонуються в даному винаході, можуть взаємодіяти синергетично з ознаками, введеними за допомогою генної інженерії або модифікованими мутагенезом, тим самим посилюючи експресію фенотипу або ефективність ознак або посилюючи ефективність боротьби з безхребетним шкідником сполук і композицій, які пропонуються в даному винаході. Зокрема, сполуки і композиції, які пропонуються в даному винаході, можуть взаємодіяти синергетично з фенотипічною експресією білків або інших натуральних продуктів, токсичних для безхребетних шкідників, і забезпечити перевищувальну адитивну боротьбу з цими шкідниками.

Композиції, які пропонуються в даному винаході, також необов'язково можуть включати поживні речовини для рослин, наприклад, композицію добрива, що включає щонайменше одну поживну речовину для рослин, вибрану з групи, яка включає азот, фосфор, калій, сірку, кальцій, магній, залізо, мідь, бор, марганець, цинк і молібден. Потрібно відмітити композиції, які включають щонайменше одну композицію добрива, яка включає щонайменше одну поживну речовину для рослин, вибрану з групи, яка включає азот, фосфор, калій, сірку, кальцій і магній. Композиції, які пропонуються в даному винаході, які додатково включають щонайменше одну поживну речовину для рослин, можуть знаходитися у формі рідин або твердих речовин. Потрібно відмітити тверді препарати у формі гранул, невеликих шматочків або таблеток. Тверді препарати, які включають композицію добрива, можна отримати змішуванням сполуки або композиції, що пропонується в даному винаході, з композицією добрива разом з інгредієнтами для приготування препаратів і з подальшим приготуванням препарату за методиками, такими як гранулювання або екструзія. Альтернативно, тверді препарати можна отримати шляхом нанесення обприскуванням розчину або суспензії сполуки або композиції, що пропонується в даному винаході, в леткому розчиннику на попередньо приготовану композицію добрива у формі сумішей зі стабільними розмірами, наприклад, гранул, невеликих шматочків або таблеток з подальшим випарюванням розчинника.

Несільськогосподарське застосування означає боротьбу з безхребетним шкідником на ділянках, крім полів сільськогосподарських рослин. Несільськогосподарське застосування сполук і композицій, які пропонуються в даному винаході, включає боротьбу з безхребетними шкідниками в зерні, що зберігається, квасолі і інших харчових речовин, і в текстильних матеріалах, таких як одяг і килими. Несільськогосподарське застосування сполук і композицій, які пропонуються в даному винаході, також включає боротьбу з безхребетним шкідником у декоративних рослинах, лісах, на залізничних шляхах, на узбіччях доріг і смугах відведення залізничних шляхів, і в дерні, такому як газони, поле для гольфу і вигони. Несільськогосподарське застосування сполук і композицій, які пропонуються в даному винаході, також включає боротьбу з безхребетним шкідником у будинках і інших будівлях, в яких можуть жити люди і/або домашні тварини, фермах, фермерських господарствах, зоопарках або на інших тваринах. Несільськогосподарське застосування сполук і композицій, які пропонуються в даному винаході, також включає боротьбу зі шкідниками, такими як терміти, які можуть пошкоджувати деревину або інші будівельні матеріали, що використовуються в будівлях.

Несільськогосподарське застосування сполук і композицій, які пропонуються в даному винаході, також включає захист здоров'я людей і тварин шляхом боротьби з безхребетними шкідниками, які є паразитичними або переносять інфекційні хвороби. Боротьба з паразитами тварин включає боротьбу із зовнішніми паразитами, які паразитують на поверхні тіла тварини-хазяїна (наприклад, плечах, пахвах, животі, внутрішній частині стегон), і внутрішніми паразитами, які паразитують всередині тіла тварини-хазяїна (наприклад, у шлунку, кишечнику, легені, венах, під шкірою, у лімфатичній тканині). Зовнішні паразитичні або такі, що переносять захворювання, шкідники включають, наприклад, кліщів-тромбікулідів, коростяних кліщів, вошей, комарів, мух, кліщів і бліх. Внутрішні паразити включають серцевих черв'яків, анкілостом і гельмінтів. Сполуки і композиції, які пропонуються в даному винаході, є придатними для системної і/або несистемної боротьби із зараженням або інфікуванням тварин паразитами. Сполуки і композиції, які пропонуються в даному винаході, є особливо придатними для

боротьби із зовнішніми паразитичними або такими, що переносять захворювання, шкідниками. Сполуки і композиції, які пропонуються в даному винаході, є придатними для боротьби з паразитами, які заражають сільськогосподарських тварин, таких як велика рогата худоба, вівці, кози, коні, свині, осли, верблуди, буйволи, кролики, кури, індик, качки, гуси і бджоли; кімнатні тварини і домашні тваринні, такі як собаки, кішки, кімнатні птахи і акваріумні риби; а також так звані піддослідні тварини, такі як хом'яки, морські свинки, щури і миші. Шляхом боротьби з цими паразитами зменшується смертність і в меншій мірі погіршуються робочі характеристики (з точки зору кількості отриманого м'яса, молока, вовни, шкіри, яєць, меду і т. д.), так що нанесення композиції, яка включає сполуку, що пропонується в даному винаході, робить більш економічним і простим утримування тварин.

Приклади сільськогосподарських або несільськогосподарських безхребетних шкідників включають яйця, личинки і дорослих особин ряду Lepidoptera, таких як похідні черв'яки, совки, п'ядуни і геліотинові сімейства Noctuidae (наприклад, рожевий стебловий точильник (*Sesamia inferens* Walker), вогнівка кукурудзяна стеблова (*Sesamia nonagrioides* Lefebvre), південні похідні черв'яки (*Spodoptera eridania* Cramer), совка трав'яна (*Spodoptera frugiperda* J. E. Smith), совка мала (*Spodoptera exigua* Hubner), совка азіатська бавовняна (*Spodoptera littoralis* Boisduval), совка смугаста жовто-бура (*Spodoptera ornithogalli* Guenee), совка-іпсилон (*Agrotis ipsilon* Hufnagel), гусінь, яка шкодить соєвим культурам (*Anticarsia gemmatalis* Hubner), плодожерка зелена (*Lithophane antennata* Walker), совка капуста (*Barathra brassicae* Linnaeus), п'ядун соєвий (*Pseudoplusia includens* Walker), совка ні (*Trichoplusia ni* Hübner), тютюнова листовійка (*Heliothis virescens* Fabricius)); точильники, чохликові молі, гусінь, яка будує павутинні гнізда, сопевогми, гусінь капуста (*Pyralidae*), які скелетують листя (наприклад, метелик кукурудзяний (*Ostrinia nubilalis* Hubner), гусінь, що шкодить цитрусовим (*Amyelois transitella* Walker), вогнівка кукурудзяна (*Crambus caliginosellus* Clemens), лугові метелики (*Pyralidae: Crambinae*), такі як луговий метелик (*Herpetogramma licarsisalis* Walker), точильник стебел цукрової тростини (*Chilo infuscatellus* Snellen), томатна вогнівка (*Neoleucinodes elegantalis* Guenee), рисова вогнівка (*Snaphalocrocis medinalis*), вогнівка виноградна (*Desmia funeralis* Hubner), метелик-вогнівка (*Diaphania nitidalis* Stoll), вогнівка капуста (*Helluala hydralis* Guenee), жовтий стебловий точильник (*Scirpophaga incertulas* Walker), вогнівка стеблова рисова (*Scirpophaga infuscatellus* Snellen), білий стебловий точильник (*Scirpophaga innotata* Walker), точильник верхніх пагонів (*Scirpophaga nivella* Fabricius), точильник рисовий чорноголовий смугастий (*Chilo polychrysus* Meyrick), точильник рисовий стебловий (*Chilo suppressalis* Walker), серцева капуста (*Crociodomia binotalis* English)); листовійки, листовійки-брунькоїди, плодожерки і плодові черв'яки сімейства Tortricidae (наприклад, плодожерка яблунева (*Cydia pomonella* Linnaeus), листовійка виноградна (*Endopiza viteana* Clemens), плодожерка східна персикова (*Grapholita molesta* Busck), несправжня яблунева плодожерка (*Cryptophlebia leucotreta* Meyrick), совка цитрусова (*Ecdytolopha aurantiana* Lima), листовійка цитрусова (*Argyrotaenia velutinana* Walker), скошеносмугова листовійка (*Choristoneura rosaceana* Harris), світло-коричнева міль яблунева (*Eriphyas postvittana* Walker), дворічна виноградна листовійка (*Euroecilia ambiguella* Hubner), смородинова листовійка (*Pandemis pyrusana* Kearfott), всеїдна листовійка (*Platynota stultana* Walsingham), кривовуса смородинова листовійка (*Pandemis cerasana* Hubner), листовійка кривовуса вербова (*Pandemis heparana* Denis & Schiffermuller)); і багато інших, важливих з економічної точки зору, лускокрилих (наприклад, міль капуста (*Plutella xylostella* Linnaeus), рожевий коробковий черв'як (*Pectinophora gossypiella* Saunders), шовкопряд непарний (*Lymantria dispar* Linnaeus), персикова плодожерка (*Carposina niponensis* Walsingham), міль фруктова смугаста (*Anarsia lineatella* Zeller), картопляна міль (*Phthorimaea operculella* Zeller), яблунева міль-пістрянка (*Lithocolletis blancardella* Fabricius), азіатська міль яблунева мінуюча (*Lithocolletis ringoniella* Matsumura), вогнівка рисова (*Lerodea eufala* Edwards), міль яблунева мінуюча (*Leucoptera scitella* Zeller)); яйця, німфи і дорослі особини ряду Blattodea, зокрема тарганові сімейств Blattellidae і Blattidae (наприклад, тарган чорний (*Blatta orientalis* Linnaeus), тарган азіатський (*Blattella asahinai* Mizukubo), тарган рудий (*Blattella germanica* Linnaeus), меблевий тарган (*Supella longipalpa* Fabricius), тарган американський (*Periplaneta americana* Linnaeus), коричневий тарган (*Periplaneta brunnea* Burmeister), мадейський тарган (*Leucophaea maderae* Fabricius), димчато-коричневий тарган (*Periplaneta fuliginosa* Service), тарган австралійський (*Periplaneta australasiae* Fabr.), сирій тарган (*Nauphoeta cinerea* Olivier) і гладкий тарган (*Symploce pallens* Stephens)); яйця, личинки і дорослі особини, що харчуються листям, що харчуються плодами, що харчуються корінням, що харчуються насінням і що харчуються пухирчастою тканиною, ряду Coleoptera, зокрема зернівки сімейств Anthribidae, Bruchidae і Curculionidae (наприклад, довгоносик бавовняний (*Anthonomus grandis* Boheman), довгоносик рисовий водяний (*Lissorhoptrus oryzophilus* Kuschel), довгоносик комірний звичайний

(*Sitophilus granarius* Linnaeus), довгоносик рисовий (*Sitophilus oryzae* Linnaeus)), довгоносик тонконога однорічного (*Listronotus maculicollis* Dietz), довгоносик тонконога (*Sphenophorus parvulus* Gyllenhal), довгоносик, що нишпорить (*Sphenophorus venatus vestitus*), довгоносик Денвера (*Sphenophorus cicatristriatus* Fahraeus)); земляні блішки, блішки картопляні, личинки, які пошкоджують коріння, листоїди, картопляні блішки і мінуючі мушки сімейства Chrysomelidae (наприклад, колорадський жук (*Leptinotarsa decemlineata* Say), західний кукурудзяний жук (*Diabrotica virgifera virgifera* LeConte)); хрущі й інші жуки сімейства Scarabaeidae (наприклад, хрущик японський (*Popillia japonica* Newman), хрущик східний (*Anomala orientalis* Waterhouse, *Echomala orientalis* (Waterhouse) Baraud), північний кукурудзяний жук (*Cyclocephala borealis* Arrow), південний кукурудзяний жук (*Cyclocephala immaculata* Olivier або *C. lurida* Bland), гнойовик і личинка хруща (*Aphodius* spp.), чорний газонний жук роду *Ataenius* (*Ataenius spretulus* Haldeman), хрущ блискучий зелений (*Cotinis nitida* Linnaeus), хрущик азіатський садовий (*Maladera castanea* Arrow), травневий/червневий жуки (*Phyllophaga* spp.) і європейський хрущ (*Rhizotrogus majalis* Razoumowsky)); шкіроїди звичайні килимові сімейства Dermestidae; дротяники сімейства Elateridae; короїди сімейства Scolytidae і борошняні хрущаки сімейства Tenebrionidae.

Крім того, сільськогосподарські і несільськогосподарські шкідники включають: яйця, дорослих особин і личинки ряду Dermaptera, зокрема щипавки сімейства Forficulidae (наприклад, європейська щипавка (*Forficula auricularia* Linnaeus), чорна щипавка (*Chelisoches morio* Fabricius)); яйця, незрілих, дорослих особин і німф рядів Hemiptera і Homoptera, таких як сліпняки сімейства Miridae, цикади сімейства Cicadidae, цикадки (наприклад, *Empoasca* spp.) сімейства Cicadellidae, клопи постільні (наприклад, *Cimex lectularius* Linnaeus) сімейства Cimicidae, цикадові сімейств Fulgoroidae і Delphacidae, горбатки сімейства Membracidae, справжні листоблішки сімейства Psyllidae, білокрилки сімейства Aleyrodidae, попелиці сімейства Aphididae, філоксери сімейства Phylloxeridae, червці сімейства Pseudococcidae, рівнокрилі сімейств Coccidae, Diaspididae і Margarodidae, клопи-мереживниці сімейства Tingidae, щитники сімейства Pentatomidae, земляні клопи (наприклад, пшеничний клоп-черепашка (*Blissus leucopterus hirtus* Montandon) і південний клоп-черепашка (*Blissus insularis* Barber)) і інші наземники сімейства Lygaeidae, пінниці сімейства Cercopidae, клопи-ромбовики сумні сімейства Coreidae і клопи постільні і червоноклопи бавовняні сімейства Pyrrhocoridae.

Сільськогосподарські і несільськогосподарські шкідники також включають: яйця, личинки, німф і дорослих особин ряду Acari (кліщі), таких як кліщі павутинні і червоні кліщі сімейства Tetranychidae (наприклад, кліщ червоний плодовий (*Panonychus ulmi* Koch), кліщик павутинний двоплямистий (*Tetranychus urticae* Koch), кліщ Мақданієля (*Tetranychus mcdanieli* McGregor)); плоскі кліщі сімейства Tenuipalpidae (наприклад, оранжевий кліщ (*Brevipalpus lewisi* McGregor)); галові і брунькові кліщі сімейства Eriophyidae і інші кліщі, що харчуються листям, і кліщі, що впливають на здоров'я людей і тварин, тобто пилові кліщі сімейства Epidermoptidae, залізничні сімейства Demodicidae, зернові кліщі сімейства Glycyphagidae; коростяні кліщі сімейства Ixodidae, загальновідомі, як тверді кліщі (наприклад, чорноногий кліщ (*Ixodes scapularis* Say), австралійський паралітичний кліщ (*Ixodes holocyclus* Neumann), собачий іксодовий кліщ (*Dermacentor variabilis* Say), іксодовий кліщ *Amblyomma* (*Amblyomma americanum* Linnaeus)) і аргасові кліщі сімейства Argasidae, загальновідомі, як аргасиди (наприклад, аргасовий кліщ (*Ornithodoros turicata*), звичайний персидський кліщ (*Argas radiatus*)); кінські і коростяні кліщі сімейств Psoroptidae, Psymotidae і Sarcoptidae; яйця, дорослих і незрілих особин ряду Orthoptera, зокрема коники, сарана і цвіркуни (наприклад, міграційні коники (наприклад, *Melanoplus sanguinipes* Fabricius, *M. differentialis* Thomas), сарана американська (наприклад, *Schistocerca americana* Drury), сарана африканська (*Schistocerca gregaria* Forskal), сарана перелітна (*Locusta migratoria* Linnaeus), саранові (*Zonocerus* spp.), цвіркун домашній (*Acheta domesticus* Linnaeus), вовчки звичайні (наприклад, вовчок бурий (*Scapteriscus vicinus* Scudder) і вовчок південний (*Scapteriscus borellii* Giglio-Tos)); яйця, дорослих і незрілих особин ряду Diptera, зокрема мінуючі мушки (наприклад, *Liriomyza* spp., такі як томатний листовий мінер (*Liriomyza sativae* Blanchard)), мошки, плодові мушки (Tephritidae), шведські мушки (наприклад, *Oscinella frit* Linnaeus), ґрунтові личинки, мухи кімнатні (наприклад, *Musca domestica* Linnaeus), малі мухи кімнатні (наприклад, *Fannia canicularis* Linnaeus, *F. femoralis* Stein), жигалки звичайні (наприклад, *Stomoxys calcitrans* Linnaeus), мухи звичайні польові, жигалки коров'ячі малі, мухи м'ясні сині (наприклад, *Chrysomya* spp., *Phormia* spp.) і інші мускусні мухи-шкідники, гедзі (наприклад, *Tabanus* spp.), носоглоткові оводи (наприклад, *Gastrophilus* spp., *Oestrus* spp.), оводи бичачі (наприклад, *Hypoderma* spp.), оленячі гедзі (наприклад, *Chrysops* spp.), кровососки (наприклад, *Melophagus ovinus* Linnaeus) і інші Brachycera, комарі (наприклад, *Aedes* spp., *Culex* spp.), мошки (наприклад, *Prosimulium* spp., *Simulium* spp.),

мокриці, москіти, плодові комарикі і інші Nematocera; яйця, дорослих і незрілих особин ряду Thysanoptera, зокрема трипс цибулевий (*Thrips tabaci* Lindeman), трипс звичайний (*Frankliniella* spp.) і інші трипси, які харчуються листям; комах-шкідників ряду Hymenoptera, зокрема мурашки сімейства Formicidae, зокрема флоридська мураха-шашіль (*Camponotus floridanus* Buckley), червона мураха-шашіль (*Camponotus ferrugineus* Fabricius), пенсильванська мураха-шашіль (*Camponotus pennsylvanicus* De Geer), білонога мураха (*Technomyrmex albipes* fr. Smith), великоголова мураха (*Pheidole* sp.), мураха-привид (*Tapinoma melanoccephalum* Fabricius); мураха хатня (*Monomorium pharaonis* Linnaeus), мала вогняна мураха (*Wasmannia auropunctata* Roger), мураха вогняна (*Solenopsis geminata* Fabricius), мураха вогняна імпортна червона (*Solenopsis invicta* Buren), мураха аргентинська (*Iridomyrmex humilis* Mayr), медова мураха (*Paratrechina longicornis* Latreille), мураха дернова (*Tetramorium caespitum* Linnaeus), мураха садова блідонога (*Lasius alienus* Forster) і мураха домашня пахуча (*Tapinoma sessile* Say). Інші Hymenoptera, зокрема бджоли (зокрема бджоли-теслярі), шершні, справжні оси, оси і трачі (*Neodiprion* spp.; *Cerphus* spp.); комах-шкідників ряду Isoptera, зокрема терміти сімейства Termitidae (наприклад, *Macrotermes* sp., *Odontotermes obesus* Rambur), сімейств Kalotermitidae (наприклад, *Cryptotermes* sp.) і Rhinotermitidae (наприклад, *Reticulitermes* sp., *Coptotermes* sp., *Heterotermes tenuis* Hagen), терміт жовтоногий (*Reticulitermes flavipes* Kollar), західний ринотерміт (*Reticulitermes hesperus* Banks), китайський підземний терміт (*Coptotermes formosanus* Shiraki), терміт індійський деревний (*Incisitermes immigrans* Snyder), терміт суходеревний (*Cryptotermes brevis* Walker), терміт суходеревний (*Incisitermes snyderi* Light), темний південно-східний підземний терміт (*Reticulitermes virginicus* Banks), західний суходеревний терміт (*Incisitermes minor* Hagen), деревні терміти, такі як *Nasutitermes* sp. і інші важливі з економічної точки зору терміти; комах-шкідників ряду Thysanura, таких як лусківниці (*Lepisma saccharina* Linnaeus) і лусківниця домашня (*Thermobia domestica* Packard); комах-шкідників ряду Mallophaga і зокрема воша головна (*Pediculus humanus capitis* De Geer), воша платтяна (*Pediculus humanus* Linnaeus), пухоїд двоштитковий курячий (*Menacanthus stramineus* Nitzsch), пухоїд собачий (*Trichodectes canis* De Geer), пухоїд курячий строкаточеревний (*Goniocotes gallinae* De Geer), волосоїд овечий (*Bovicola ovis* Schrank), воша коров'яча коротконога (*Haematopinus eurysternus* Nitzsch), воша великої рогатої худоби довгоноса кровосисна (*Linognathus vituli* Linnaeus) і інші сисні і гризучі паразитарні воші, які нападають на людей і тварин; комах-шкідників ряду Siphonoptera, зокрема блоха щуряча південна (*Xenopsylla cheopis* Rothschild), блоха котяча (*Ctenocephalides felis* Bouche), блоха собача (*Ctenocephalides canis* Curtis), блоха куряча (*Ceratophyllus gallinae* Schrank), блоха, яка присмоктується (*Echidnophaga gallinacea* Westwood), блоха людська (*Pulex irritans* Linnaeus) і інші блохи, що вражають ссавців і птахів. Додаткові охоплювані членистоногі шкідники включають: павукоподібних ряду Araneae, таких як коричневий павук-відлюдник (*Loxosceles reclusa* Gertsch & Mulaik) і південна чорна вдова (*Latrodectus mactans* Fabricius) і стоноги ряду Scutigeraomorpha, такі як звичайна мушкетерка (*Scutigera coleoptrata* Linnaeus).

Приклади безхребетних шкідників зерна, яке зберігається, включають: великий точильник зерновий (*Prostephanus truncatus*), точильник зерновий (*Rhyzopertha dominica*), довгоносик рисовий (*Stiophilus oryzae*), кукурудзяний довгоносик (*Stiophilus zeamais*), зернівка чотириплямиста (*Callosobruchus maculatus*), хрущак каштановий (*Tribolium castaneum*), довгоносик комірний звичайний (*Stiophilus granarius*), міль індійська борошняна (*Plodia interpunctella*), вогнівка млинова (*Ephestia kuehniella*) і малий або іржаво-червоний борошноїд (*Cryptolestis ferrugineus*).

Сполуки, які пропонуються в даному винаході, можуть мати активність відносно представників класів Nematoda, Cestoda, Trematoda і Acanthocephala, включаючи важливих з економічної точки зору представників рядів Strongylida, Ascaridida, Oxyurida, Rhabditida, Spirurida і Euplida, таких як, але не обмежуючись тільки ними, важливі з економічної точки зору сільськогосподарські шкідники (тобто яванські галові нематоди роду *Meloidogyne*, нематоди, які ранять, роду *Pratylenchus*, нематоди, що викликають тупокінцевість коріння, роду *Trichodorus* і т. п.) і шкідливі для здоров'я тварин та людей шкідники (тобто усі важливі з економічної точки зору трематоди, стрічкові черв'яки і круглі черв'яки, такі як *Strongylus vulgaris* у коней, *Toxocara canis* у собак, *Haemonchus contortus* у овець, *Dirofilaria immitis* Leidy у собак, *Anoplocephala perfoliata* у коней, *Fasciola hepatica* Linnaeus у жуйних тварин і т. п.).

Сполуки, які пропонуються в даному винаході, можуть мати активність відносно шкідників ряду Lepidoptera (наприклад, *Alabama argillacea* Hubner (совка азіатська бавовняна), *Archips argyospila* Walker (листовійка плодових дерев), *A. rosana* Linnaeus (листовійка різана) і інших *Archips* species, *Chilo suppressalis* Walker (точильник рисовий стебловий), *Snaphalocrosis medinalis* Guenee (листовійка рисова), *Crambus caliginosellus* Clemens (вогнівка кукурудзяна),

Crambus teterrellus Zincken (вогнівка), Cydia pomonella Linnaeus (плодожерка яблунева), Earias insulana Boisduval (совка бавовняна єгипетська), Earias vittella Fabricius (совка плямиста), Helicoverpa armigera Hubner (совка бавовняна), Helicoverpa zea Boddie (совка кукурудзяна), Heliothis virescens Fabricius (тютюнова листовійка), Herpetogramma licarsisalis Walker (луговий метелик), Lobesia botrana Denis & Schiffermuller (листовійка виноградна), Pectinophora gossypiella Saunders (рожевий коробковий черв'як), Phyllocnistis citrella Stainton (цитрусова мінуюча міль), Pieris brassicae Linnaeus (білан капустяний), Pieris rapae Linnaeus (білан ріповий), Plutella xylostella Linnaeus (міль капустяна), Spodoptera exigua Hubner (совка мала), Spodoptera litura Fabricius (тютюнова совка, cluster caterpillar), Spodoptera frugiperda J. E. Smith (совка трав'яна), Trichoplusia ni Hubner (совка ні) і Tuta absoluta Meyrick (південноамериканська томатна міль)).

Сполуки, які пропонуються в даному винаході, мають значну активність відносно представників ряду Homoptera, включаючи наступні: Acyrthosiphon pisum Harris (попелиця горохова), Aphis craccivora Koch (попелиця люцернова), Aphis fabae Scopolii (попелиця бурякова), Aphis gossypii Glover (попелиця бавовняна, попелиця баштанна), Aphis pomi De Geer (попелиця яблунева), Aphis spiraecola Patch (попелиця таволгова), Aulacorthum solani Kaltentbach (попелиця картопляна звичайна), Chaetosiphon fragaefolii Cockerell (попелиця суниццева), Diuraphis noxia Kurdjumov/Mordvilko (попелиця ячмінна), Dysaphis plantaginea Raaserini (попелиця рожева), Eriosoma lanigerum Hausmann (попелиця кров'яна яблунева), Hyalopterus pruni Geoffroy (попелиця борошниста сливова), Lipaphis erysimi Kaltentbach (попелиця хибнокапустяна), Metopolophium dirrhodum Walker (попелиця розово-злакова), Macrosiphum euphorbiae Thomas (попелиця картопляна), Myzus persicae Sulzer (попелиця персиково-картопляна, попелиця персикова зелена), Nasonovia ribisnigri Mosley (попелиця салатна зелена), Pemphigus spp. (кореневі попелиці і галові попелиці), Rhopalosiphum maidis Fitch (попелиця кукурудзяна), Rhopalosiphum padi Linnaeus (попелиця черемхова звичайна), Schizaphis graminum Rondani (попелиця злакова звичайна), Sitobion avenae Fabricius (попелиця злакова), Therioaphis maculata Buckton (попелиця конюшинова), Toxoptera aurantii Boyer de Fonscolombe (попелиця померанцева) і Toxoptera citricida Kirkaldy (попелиця цитрусова); Adelges spp. (хермеси); Phylloxera devastatrix Pergande (філоксера гікорі); Bemisia tabaci Gennadius (tobacco білокрилка, тютюнова білокрилка), Bemisia argentifolii Bellows & Perring (тютюнова білокрилка), Dialeurodes citri Ashmead (білокрилка цитрусова) і Trialeurodes vaporariorum Westwood (білокрилка теплична); Empoasca fabae Harris (цикадка картопляна), Laodelphax striatellus Fallen (малий коричневий дельфацид), Macrolestes quadrilineatus Forbes (астрова цикадка), Nephrotettix cincticeps Uhler (цикадка зелена), Nephrotettix nigropictus Stal (рисова цикадка), Nilaparvata lugens Stal (коричневий дельфацид), Peregrinus maidis Ashmead (цикадка кукурудзяний), Sogatella furcifera Horvath (білоспинна цикадка), Sogatodes orizicola Muir (дельфацид рисовий), Typhlocyba romaria McAtee цикадка яблунева, Erythroneoura spp. (цикадки виноградні); Magicidada septendecim Linnaeus (періодична цикада); Icerya purchasi Maskell (червець австралійський жолобчастий), Quadraspidotus perniciosus Comstock (щитівка каліфорнійська); Planococcus citri Risso (борошнистий червець виноградний); Pseudococcus spp. (other mealybug complex); Sacopsylla pyricola Foerster (мідянка грушева), Trioza diospyri Ashmead (листоблішка хурмова).

Сполуки, які пропонуються в даному винаході, також мають активність відносно представників ряду Hemiptera, включаючи наступні: Acrosternum hilare Say (клоп-щитник), Anasa tristis De Geer (клоп-ромбовик сумний), Blissus leucopterus leucopterus Say (земляний клоп), Cimex lectularius Linnaeus (клоп постільний) Corythuca gossypii Fabricius (клоп бавовняний), Cyrtopeltis modesta Distant (клоп томатний), Dysdercus suturellus Herrich-Schaffer (червоноклоп бавовняний), Euchistus servus Say (щитник коричневий), Euchistus variolarius Palisot de Beauvois (клоп-щитник одноплямистий), Graptosthetus spp. (сукупність клопів-наземників), Halymorpha halys Stal (коричнево-мармуровий клоп), Leptoglossus corculus Say (клоп-крайовик насіння сосни), Lygus lineolaris Palisot de Beauvois (клоп луговий), Nezara viridula Linnaeus (південний зелений овочевий клоп), Oebalus pugnax Fabricius (щитник рисовий), Oncopeltus fasciatus Dallas (клоп молочайний великий), Pseudatomoscelis seriatus Reuter (блішка бавовняна). Інші ряди комах, з якими забезпечують боротьбу сполуки, які пропонуються в даному винаході, включають Thysanoptera (наприклад, Frankliniella occidentalis Pergande (трипс квітковий західний), Scirtothrips citri Moulton (трипс цитрусовий), Sericothrips variabilis Beach (трипс соєвий) і Thrips tabaci Lindeman (трипс цибулевий); і ряд Coleoptera (наприклад, Leptinotarsa decemlineata Say (колорадський жук), Epilachna varivestis Mulsant (Мексиканський жук) і дротяники роду Agriotes, Athous або Limonius.)

Потрібно зазначити, що в деякі сучасні системи класифікації Homoptera вміщують у підряд

ряду Hemiptera.

Потрібно відмітити застосування сполук, які пропонуються в даному винаході, для боротьби з трипсом квітковим західним (*Frankliniella occidentalis*). Потрібно відмітити застосування сполук, які пропонуються в даному винаході, для боротьби з цикадкою картопляною (*Empoasca fabae*).

5 Потрібно відмітити застосування сполук, які пропонуються в даному винаході, для боротьби з попелицею баштанною (*Aphis gossypii*). Потрібно відмітити застосування сполук, які пропонуються в даному винаході, для боротьби з попелицею персиковою зеленою (*Muzus persicae*). Потрібно відмітити застосування сполук, які пропонуються в даному винаході, для боротьби з тютюновою білокрилкою (*Bemisia tabaci*).

10 Сполуки, які пропонуються в даному винаході, також можуть бути застосовні для збільшення потужності сільськогосподарської рослини. Цей спосіб включає взаємодію сільськогосподарської рослини (наприклад, листя, квіток, плодів або коріння) або насіння, з якого виростає сільськогосподарська рослина, зі сполукою 1 або сполукою формули 2 в кількості, достатній для забезпечення бажаного впливу на потужність рослини (тобто в біологічно ефективній кількості). Звичайно сполуку 1 або сполуку формули 2 наносять у приготіваній композиції. Хоча сполуку 1 або сполуку формули 2 часто наносять прямо на сільськогосподарську рослину або її насіння, її також можна наносити на ділянку росту сільськогосподарської рослини, тобто середовище розташування сільськогосподарської рослини, зокрема, на ділянку середовища, що знаходиться в безпосередній близькості, для забезпечення можливості міграції сполуки 1 або сполуки формули 2 на сільськогосподарську рослину. Ділянка росту, яка стосується цього способу, найчастіше включає середовище росту (тобто середовище, що надає рослині поживні речовини), звичайно ґрунт, в якому виростає рослина. Таким чином, обробка сільськогосподарської рослини для збільшення потужності сільськогосподарської рослини включає взаємодію сільськогосподарської рослини, насіння, з якого виростає сільськогосподарська рослина, або ділянки росту сільськогосподарської рослини з біологічно ефективною кількістю сполуки 1 або сполуки формули 2.

Збільшена потужність культури може привести до одного або більшої кількості наступних ефектів, що спостерігаються: (а) оптимальне вкорінення сільськогосподарської культури, про що свідчить чудове проростання насіння, схожість сільськогосподарської культури і густина сільськогосподарської культури; (b) посилений ріст сільськогосподарської культури, про що свідчить швидкий і потужний ріст листя (наприклад, який вимірюється індексом площі листя), висота рослин, кількість пагонів (наприклад, для рису), багато коріння і загальна маса в сухому стані рослинної маси сільськогосподарської культури; (c) поліпшена врожайність сільськогосподарських культур, про що свідчить час до цвітіння, тривалість цвітіння, кількість квіток, повна накопичена біомаса (тобто величина урожаю) і/або ринкова рентабельність отриманих плодів і зерна (тобто якість урожаю); (d) поліпшена здатність сільськогосподарської культури переносити або попереджати зараження хворобами рослин і членистоногими, нематодами або молюсками - шкідниками; і (e) поліпшена здатність сільськогосподарської культури переносити екологічні стреси, такі як вплив екстремальних теплових умов, субоптимальної вологості або фітотоксичних хімікатів.

40 Сполуки, які пропонуються в даному винаході, можуть збільшувати потужність оброблених рослин порівняно з необробленими рослинами шляхом знищення або запобігання, що проводиться іншим чином, годуванню травоядних безхребетних шкідників в оточенні рослин. За відсутності такої боротьби з травоядними безхребетними шкідниками шкідники зменшують потужність рослини шляхом поїдання тканин або соку рослини, або перенесення патогенів рослин, таких як віруси. Навіть за відсутності травоядних безхребетних шкідників, сполуки, які пропонуються в даному винаході, можуть збільшувати потужність рослини шляхом зміни метаболізму рослин. Звичайно потужність сільськогосподарської рослини найбільш значно збільшується при обробці рослини сполукою, що пропонується в даному винаході, якщо рослина росте в неідеальному середовищі, тобто середовищі, що включає один або більшу кількість аспектів, шкідливих для досягнення рослиною повного генетичного потенціалу, який вона виявляє в ідеальному середовищі.

Потрібно відмітити спосіб збільшення потужності сільськогосподарської рослини, в якому сільськогосподарська рослина росте в середовищі, що включає травоядних безхребетних шкідників. Також потрібно відмітити спосіб збільшення потужності сільськогосподарської рослини, в якому сільськогосподарська рослина росте в середовищі, що не включає травоядних безхребетних шкідників. Також потрібно відмітити спосіб збільшення потужності сільськогосподарської рослини, в якому сільськогосподарська рослина росте в середовищі, що містить меншу кількість вологи, ніж ідеальне для підтримання росту сільськогосподарської рослини. Потрібно відмітити спосіб збільшення потужності сільськогосподарської рослини, в

якому сільськогосподарською культурою є рис. Також потрібно відмітити спосіб збільшення потужності сільськогосподарської рослини, в якому сільськогосподарською культурою є маїс (кукурудза). Також потрібно відмітити спосіб збільшення потужності сільськогосподарської рослини, в якому сільськогосподарською культурою є соя.

5 Сполуки, які пропонуються в даному винаході, також можна змішати з однією або великою кількістю інших біологічно активних сполук або засобів, включаючи інсектициди, фунгіциди, нематоциди, бактерициди, акарициди, гербіциди, антидоти гербіцидів, регулятори росту, такі як інгібітори линяння комах і стимулятори вкорінення, хемостерилізатори, сигнальні біологічно активні речовини, репеленти, атрактанти, феромони, стимулятори годування, інші біологічно активні сполуки або ентомопатогенні бактерії, віруси або гриби, з утворенням багатокomпонентного пестициду, який має навіть більш широкий спектр сільськогосподарського і несільськогосподарського застосування. Таким чином, даний винахід також стосується композиції, яка містить біологічно ефективну кількість сполуки 1 або сполуки формули 2, щонайменше один додатковий компонент, вибраний з групи, яка складається з наступних: 10 поверхнево-активні речовини, тверді розріджувачі і рідкі розріджувачі, і щонайменше одну додаткову біологічно активну сполуку або засіб. Для сумішей, що пропонуються в даному винаході, інші біологічно активні сполуки або засоби можна приготувати разом зі сполуками, що пропонуються в даному винаході, включаючи сполуку 1 або сполуку формули 2, з утворенням преміксу, або інші біологічно активні сполуки або засоби можна приготувати окремо від сполук, що пропонуються в даному винаході, включаючи сполуку 1 або сполуку формули 2 і два препарати об'єднати до нанесення (наприклад, в баку для обприскування) або, альтернативно, нанести послідовно.

 Прикладами таких біологічно активних сполук або засобів, разом з якими можна приготувати сполуки, які пропонуються в даному винаході, є інсектициди, такі як абамектин, ацефат, ацехіноцил, ацетаміпрід, акринатрин, афідопіропен ((3S,4R,4aR,6S,6aS,12R,12aS,12bS)-3-[[циклопропілкарбоніл)окси]-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-декагідро-6,12-дигідрокси-4,6a,12b-триметил-11-оксо-9-(3-піридиніл)-2H,11H-нафто[2,1-b]пірано[3,4-e]піран-4-іл]метилциклопропанкарбоксилат), амідофлумет, амітраз, авермектин, азадирахтин, азинфосметил, бенфуракарб, бенсултап, біфентрин, біфеназат, бістрифлурон, борат, бупрофезин, кадусафос, карбарил, карбофуран, картап, карзол, хлорантраніліпрол, хлорфенапір, хлорфлуазурон, хлорпірифос, хлорпірифос-метил, хромафенозид, клофентезин, клотіанідин, ціантраніліпрол (3-бром-1-(3-хлор-2-піридиніл)-N-[4-ціано-2-метил-6-[[метиламіно)карбоніл]феніл]-1H-піразол-5-карбоксамід), цикланіліпрол (3-бром-N-[2-бром-4-хлор-6-[[1-циклопропілетил)аміно]карбоніл]феніл]-1-(3-хлор-2-піридиніл)-1H-піразол-5-карбоксамід), циклопротрин, циклоксапрід ((5S,8R)-1-[(6-хлор-3-піридиніл)метил]-2,3,5,6,7,8-гексагідро-9-нітро-5,8-Епоксі-1H-імідазо[1,2-a]азепін) цифлуметофен, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, гамма-цигалотрин, лямбда-цигалотрин, циперметрин, альфа-циперметрин, дзета-циперметрин, циромазин, дельтаметрин, діафентіурон, діазинон, діельдрин, дифлубензурон, димефлутрин, димегіпо, диметоат, динотефуран, діофенолан, емаектин, ендосульфат, есфенвалерат, етипрол, етофенпрокс, етоксазол, фенбутатиноксид, фенітроціон, фенотіокарб, феноксикарб, фенпропатрин, фенвалерат, фіпроніл, флометоквін (2-етил-3,7-диметил-6-[4-(трифторметокси)фенокси]-4-хінолінілметилкарбонат), флонікамід, флубендіамід, флуцитринат, флуфенерим, флуфеноксурон, флуфеноксистробін (метил-(αE)-2-[[2-хлор-4-(трифторметил)фенокси]метил]-α-(метоксиметилен)бензолацетат), флуфенсульфон (5-хлор-2-[(3,4,4-трифтор-3-бутен-1-іл)сульфоніл]тіазол), флугексафон, флуопірам, флупіпрол (1-[2,6-дихлор-4-(трифторметил)феніл]-5-[(2-метил-2-пропен-1-іл)аміно]-4-[[трифторметил)сульфініл]-1H-піразол-3-карбонітрил), флупірадіфурон (4-[[6-хлор-3-піридиніл)метил](2,2-дифторетил)аміно]-2(5H)-фуранон), флувалінат, тау-флувалінат, фонофос, форметанат, фостіазат, галофенозид, гептафлутрин ([2,3,5,6-тетрафтор-4-(метоксиметил)феніл]метил-2,2-диметил-3-[(1Z)-3,3,3-трифтор-1-пропен-1-іл]циклопропанкарбоксилат), гексафлумурон, гекситіазокс, гідраметилнон, імідаклопрід, індоксакарб, інсектицидні мила, ізофенфос, луфенурон, малатіон, меперфлутрин ([2,3,5,6-тетрафтор-4-(метоксиметил)феніл]метил (1R,3S)-3-(2,2-дихлоретеніл)-2,2-диметилциклопропанкарбоксилат), метафлумізон, метальдегід, метамідофос, метидатіон, метіодикарб, метоміл, метопрен, метоксихлор, метофлутрин, метоксифенозид, метофлутрин, монокротофос, монофторотрин ([2,3,5,6-тетрафтор-4-(метоксиметил)феніл]метил-3-(2-ціано-1-пропен-1-іл)-2,2-диметилциклопропанкарбоксилат), нікотин, нітенпірам, нітіазин, новалурон, новіфлумурон, оксаміл, паратіон, паратіон-метил, перметрин, форафос, фозалон, фосмет, фосфамідон, піримікарб, профенофос, профлутрин, пропаргіт, протрифенбут, піфлубумід (1,3,5-триметил-N-(2-метил-1-оксопропіл)-N-[3-(2-метилпропіл)-4-[2,2,2-трифтор-1-метокси-1-

(трифторметил)етил]феніл]-1Н-піразол-4-карбоксамід), піметрозин, пірафлупрол, піретрин, піридабен, піридаліл, пірифлухіназон, піриминостробін (метил-(α E)-2-[[[2-[(2,4-дихлорфеніл)аміно]-6-(трифторметил)-4-піримідиніл]окси]метил]- α -(метоксиметил)бензолацетат), пірипрол, пірипроксифен, ротенон, ріанодин, силафлуофен, спінеторам, спіносад, спіродиклофен, спіромезифен, спіротетрамат, сульпрофос, сульфоксафлор (N-[метилокси]до[1-[6-(трифторметил)-3-піридиніл]етил]- Λ^4 -сульфаніліден]ціанамід), тебуфенозид, тебуфенпірад, тефлубензурон, тефлутрин, тербуфос, тетрафлорвінфос, тетраметрин, тетраметилфлутрин ([2,3,5,6-тетрафтор-4-(метоксиметил)феніл]метил-2,2,3,3-тетраметилциклопропанкарбоксилат), тетраніліпрол, тіаклоприд, тіаметоксам, тіодикарб, тіосултап-натрій, тіоксазафен (3-феніл-5-(2-тієніл)-1,2,4-оксадіазол), толфенпірад, тралометрин, триазамат, трихлорфон, трифлумезопірим (2,4-діоксо-1-(5-піримідинілметил)-3-[3-(трифторметил)феніл]-2Н-піридо[1,2-а]піримідинієва внутрішня сіль), трифлумурон, *Bacillus thuringiensis* дельта-ендотоксини, ентомопатогенні бактерії, ентомопатогенні віруси і ентомопатогенні гриби.

Потрібно відмітити інсектициди, такі як абамектин, ацетаміприд, акринатрин, афідопіропен, амітраз, авермектин, азадирахтин, бенфуракарб, бенсултап, біфентрин, бупрофезин, кадусафос, карбарил, картап, хлорантраніліпрол, хлорфенапір, хлорпірифос, клотіанідин, ціантраніліпрол, цикланіліпрол, циклопротрин, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, гамма-цигалотрин, лямбда-цигалотрин, циперметрин, альфа-циперметрин, дзета-циперметрин, циромазин, дельтаметрин, діельдрин, динотефуран, діофенолан, емаектин, ендосульфат, есфенвалерат, етипрол, етофенпрокс, етоксазол, фенітротіон, фенотіокарб, феноксикарб, фенвалерат, фіпроніл, флометоквін, флонікамід, флубендіамід, флуфеноксурон, флуфеноксистробін, флуфенсульфон, флупіпрол, флупірадіфурон, флувалінат, форметанат, фостіазат, гептафлутрин, гексафлумурон, гідраметилнон, імідаклоприд, індоксакарб, луфенурон, меперфлутрин, метафлумізон, метіодикарб, метоміл, метопрен, метоксифенозид, метофлутрин, монофторотрин, нітенпірам, нітіазин, новалурон, оксаміл, піфлубумід, піметрозин, піретрин, піридабен, піридаліл, піриминостробін, пірипроксифен, ріанодин, спінеторам, спіносад, спіродиклофен, спіромезифен, спіротетрамат, сульфоксафлор, тебуфенозид, тетраметрин, тетраметилфлутрин, тіаклоприд, тіаметоксам, тіодикарб, тіосултап-натрій, тралометрин, триазамат, трифлумезопірим, трифлумурон, *Bacillus thuringiensis* дельта-ендотоксини, всі штами *Bacillus thuringiensis* і всі штами вірусів ядерного поліедрозу.

Один варіант здійснення біологічних засобів для змішування зі сполуками, які пропонуються в даному винаході, включає ентомопатогенні бактерії, такі як *Bacillus thuringiensis*, і капсульовані дельта-ендотоксини *Bacillus thuringiensis*, такі як біоінсектициди MVP® і MVP II®, отримані за технологією CellCap® (CellCap®, MVP® і MVP II® є торговельними марками фірми Mucogen Corporation, Indianapolis, Indiana, USA); ентомопатогенні гриби, такі як зелені мускаринові гриби; і ентомопатогенні (природні і генетично модифіковані) віруси, включаючи бакуловірус, вірус ядерного поліедрозу (NPV), такий як вірус ядерного поліедрозу *Helicoverpa zea* (HzNPV), вірус ядерного поліедрозу *Anagrapha falcifera* (AfNPV); і вірус гранульозу (GV), такий як вірус гранульозу *Cydia pomonella* (CpGV).

Інший варіант здійснення біологічних засобів для змішування зі сполуками, які пропонуються в даному винаході, включає одне або комбінацію наступних (i) бактерія штаму Actinomycetes, Agrobacterium, Arthrobacter, Alcaligenes, Aureobacterium, Azobacter, Bacillus, Beijerinckia, Bradyrhizobium, Brevibacillus, Burkholderia, Chromobacterium, Clostridium, Clavibacter, Comamonas, Corynebacterium, Curtobacterium, Enterobacter, Flavobacterium, Gluconobacter, Hydrogenophaga, Klebsiella, Methylobacterium, Paenibacillus, Pasteuria, Photorhabdus, Phyllobacterium, Pseudomonas, Мікориза, Serratia, Sphingobacterium, Stenotrophomonas, Streptomyces, Variovorax або Xenorhabdus, наприклад, бактерія *Bacillus amyloliquefaciens*, *Bacillus cereus*, *Bacillus firmus*, *Bacillus*, licheniformis, *Bacillus pumilus*, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus subtilis*, *Bacillus thuringiensis*, *Bradyrhizobium japonicum*, *Chromobacterium subtsugae*, *Pasteuria nishizawae*, *Pasteuria penetrans*, *Pasteuria usage*, *Pseudomonas fluorescens* и *Streptomyces lydicus*; (ii) гриби, такі як гриби зелений мускардин; (iii) вірус, включаючи бакуловірус, вірус ядерного поліедрозу, такий як вірус ядерного поліедрозу *Helicoverpa zea*, вірус ядерного поліедрозу *Anagrapha falcifera*; вірус гранульозу, такий як вірус гранульозу *Cydia pomonella*.

Потрібно особливо відмітити таку комбінацію, в якій інший активний інгредієнт, що забезпечує боротьбу з безхребетним шкідником, належать до іншого хімічного класу або має інший центр впливу, ніж сполука 1 або сполука формули 2. В деяких випадках комбінація щонайменше з одним іншим активним інгредієнтом, який забезпечує боротьбу з безхребетним шкідником, що має схожий спектр боротьби, але інший центр впливу, є особливо корисною для боротьби з резистентністю. Таким чином, композиція, яка пропонується в даному винаході,

може додатково включати біологічно ефективну кількість щонайменше одного додаткового активного інгредієнта, який забезпечує боротьбу з безхребетним шкідником, що має схожий спектр боротьби, але належить до іншого хімічного класу або має інший центр впливу. Ці додаткові біологічно активні сполуки або засоби включають, але не обмежуються тільки ними,

5 інгібітори ацетилхолінестерази (AChE), такі як карбамати метоміл, оксаміл, тіодикарб, триазамат, і фосфорорганічні сполуки хлорпірифос; регульовані за допомогою GABA антагоністи хлоридних каналів, такі як циклодієни діельдрин і ендосульфат, і фенілпіразоли етипрол і фіпроніл; модулятори натрієвих каналів, такі як піретроїди біфентрин, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, лямбда-цигалотрин, циперметрин, дельтаметрин, димефлутрин,

10 есфенвалерат, метофлутрин і профлутрин; агоністи нікотинового ацетилхолінового рецептора (nAChR), такі як неонікотиноїди ацетаміпрід, клотіанідин, динотефуран, імідаклопрід, нітенпірам, нітіазин, тіаклопрід, і тіаметоксам, і сульфоксафлор; алостеричні активатори нікотинового ацетилхолінового рецептора (nAChR), такі як спінозини спінеторам і спіносад; активатори хлоридних каналів, такі як авермектини абамектин і емаектин; імітатори ювенільного гормону, такі як діофенолан, метопрен, феноксикарб і пірипроксифен; селективні

15 блокатори живлення рівнокрилик, такі як піметрозин і флонікамід; інгібітори росту кліщів, такі як етоксазол; інгібітори мітохондріальної АТФ-синтази, такі як пропаргіт; роз'єднувачі окиснювального фосфорилування шляхом порушення протонного градієнта, такі як хлорфенапір; блокатори каналів нікотинового ацетилхолінового рецептора (nAChR), такі як аналог нерейстоксину картап; інгібітори біосинтезу хітину, такі як бензоілсечовини флуфеноксурон, гексафлумурон, лufenурон, новалурон, новіфлумурон і трифлумурон, і бупрофезин; засоби, які порушують линяння двокрилик, такі як циромазин; агоністи екдизонового рецептора, такі як діацилгідразини метоксифенозид і тебуфенозид; агоністи октопамінового рецептора, такі як амітраз; інгібітори мітохондріального комплексу III

20 перенесення електронів, такі як гідраметилнон; інгібітори мітохондріального комплексу I перенесення електронів, такі як піридабен; блокатори потенціалозалежних натрієвих каналів, такі як індоксакарб; інгібітори ацетил-CoA-карбоксілази, такі як тетронова і тетрамінова кислоти спіродиклофен, спіромезифен і спіротетрамат; інгібітори мітохондріального комплексу II

25 перенесення електронів, такі як β-кетонітрили цієнопірафен і цифлуметофен; модулятори ріанідинового рецептора, такі як діаміди антранілу хлорантраніліпрол, ціантраніліпрол і ціантраніліпрол, діаміди, такі як флубендіамід, і ліганди ріанідинового рецептора, такі як ріанодин; сполуки, для яких цільовий сайт, відповідальний за біологічну активність, невідомий або неохарактеризований, такі як азадирахтин, біфеназат, піридаліл, пірифлухіназон і трифлумезопірим; мікробіологічні дезінтегратори мембран середньої кишки комах, такі як *Bacillus thuringensis* і продуковані ними дельта-ендотоксини і *Bacillus sphaericus*; і біологічні агенти, включаючи віруси ядерного поліедрозу (NPV) і інші природні або генетично

30 модифіковані інсектицидні віруси.

Іншими прикладами біологічно активних сполук або засобів, з якими можна приготувати сполуки, які пропонуються в даному винаході, є: фунгіциди, такі як ацибензолар-S-метил,

40 альдиморф, аметоктрадин, амисулбром, анілазин, азаконазол, азоксистробін, беналаксил (включаючи беналаксил-M), беноданіл, беноміл, бентіавалікарб (включаючи бентіавалікарб-ізопропіл), бензовіндифлупір, бетоксазин, бінапакрил, біфеніл, бітертанол, біксафен, бластицидин-S, боскалід, бромуконазол, бупіримат, бутіобат, карбоксин, карпропамід, каптафол, каптан, карбендазим, хлороніб, хлороталоніл, хлосолінат, гідроксид міді, оксихлорид

45 міді, сульфат міді, кумоксистробін, ціазофамід, цифлуфенамід, цимоксаніл, ципроконазол, ципродиніл, дихлофлуанід, диклоцимет, дикломезин, диклоран, дієтофенкарб, дифенокназол, дифлуметорим, диметиримол, диметоморф, димоксистробін, диніконазол (включаючи диніконазол-M), динокап, дитіанон, дитіолани, додеморф, додин, еконазол, етаконазол, едифенфос, еноксастробін (також відомий, як енестроурин), епоксиконазол, етабоксам,

50 етиримол, етридіазол, фамоксадон, фенамідон, фенамінстробін, фенаримол, фенбуконазол, фенфурам, фенгексамід, феноксаніл, фенпіклоніл, фенпропідин, фенпропіморф, фенпіразамін, ацетат фентину, гідроксид фентину, фербам, феримзон, флометоквін, флуазинам, флудіоксоніл, флуфеноксистробін, флуморф, флуопіколід, флуопірам, флуоксастробін, флухінконазол, флусилазол, флусульфамід, флутаніл, флутоланіл, флутриафол,

55 флуксапіроксад, фолпет, фталід (також відомий, як фталід), фуберідазол, фуралаксил, фураметпір, гексаконазол, гімексазол, гуазатин, імазаліл, імібенконазол, іміноктадин албезилат, іміноктадинтриацетат, йодикарб, іпконазол, ізофетамід, іпробенфос, іпродіон, іпровалікарб, ізопротиолан, ізопіразам, ізотіаніл, касугаміцин, крезоксим-метил, манкозєб, мандипропамід, мандестробін, манєб, мапаніпирин, мепроніл, мептилдинокап, металаксил (включаючи

60 металаксил-M/мефеноксам), метконазол, метасульфоккарб, метирам, метоміностробін,

метрафенон, міклобутаніл, нафтитин, нео-асозин (метанарсонат заліза(III)), нуаримол, октилінон, офурац, орисастробін, оксадиксил, оксатіопіпролін, оксолінова кислота, окспоконазол, оксикарбоксин, окситетрациклін, пенконазол, пенцикурон, пенфлуфен, пентіопірад, перфуроазоат, фосфорна кислота (включаючи її солі, наприклад, фосетил-алюміній), пікоксистробін, піпералін, поліоксин, пробеназол, прохлораз, процимідон, пропамокарб, пропіконазол, пропінеб, проквіназид, протіокарб, протіоконазол, піраклостробін, піраметостробін, піраоксистробін, піразофос, пірибенкарб, пірибутакарб, пірифенокс, піріофенон, перізоксазол, піриметаніл, пірифенокс, піролнітрин, пірохілон, хінконазол, хінметіонат, хіноксифен, квінтоцен, силтіофам, седаксан, симеконазол, спіроксамін, стрептоміцин, сірка, тебуконазол, тебуфлорин, теклофталам, теклофталам, текназен, тербінафін, тетраконазол, тіабендазол, тифлузамід, тіофанат, тіофанат-метил, тирам, тіадиніл, толклофос-метил, толпрокарб, толілфлуанід, тріадимефон, тріадименол, тріаримол, тріазоксид, триосновний сульфат міді, триклопірикарб, тридеморф, трифлуксистробін, трифлумізол, триморфамід трициклазол, трифлуксистробін, трифорин, тритиконазол, уніконазол, валідаміцин, валіфеналат (також відомий, як валіфенал), вінклозолін, зинеб, зирам, зоксамід і 1-[4-[4-[5-(2,6-дифторфеніл)-4,5-дигідро-3-ізоксазоліл]-2-тіазоліл]-1-піперидиніл]-2-[5-метил-3-(трифторметил)-1H-піразол-1-іл]етанон; нематоциди, такі як флуопірам, спіротетрамат, тіодикарб, фостіазат, абамектин, іпродіон, флуенсульфон, диметилдисульфід, тіоксазафен, 1,3-дихлорпропен (1,3-D), метам (натрій- і калій-), дазомет, хлорпикрин, фенаміфос, етопрофос, кадусафос, тербуфос, іміціафос, оксаміл, карбофуран, тіоксазафен, *Bacillus firmus* і *Pasteuria nishizawae*; бактерициди, такі як стрептоміцин; акарициди, такі як амітраз, хінометіонат, хлорбензилат, цигексатин, дикофол, дієнохлор, етоксазол, феназахін, фенбутатиноксид, фенпропатрин, фенпіроксимат, гекситіазокс, пропаргіт, піридабен і тебуфенпірад.

У деяких випадках комбінації сполуки, яка пропонується в даному винаході, з іншими біологічно активними (особливо для боротьби з безхребетним шкідником) сполуками або засобами (тобто активними інгредієнтами) можуть привести до більшого, ніж адитивний (тобто синергетичного) ефекту. Завжди бажане зменшення кількості активних інгредієнтів, які вивільняються в середовищі, із забезпеченням ефективної боротьби зі шкідником. Якщо синергізм активних інгредієнтів, які забезпечують боротьбу з безхребетним шкідником, виявляється при нормах витрати, які приводять до агрономічно задовільних ступенів боротьби з безхребетним шкідником, такі комбінації можуть бути корисними для зменшення вартості продукції сільськогосподарської культури і зменшення навантаження на навколишнє середовище.

Сполуки, які пропонуються в даному винаході, і композиції, які містять їх, можна наносити на рослини, генетично трансформовані для експресії білків, токсичних для безхребетних шкідників (таких як дельта-ендотоксини *Bacillus thuringiensis*). Таке нанесення може забезпечити більш широкий спектр захисту рослин і корисне для боротьби з резистентністю. Вплив екзогенного нанесення сполук, які пропонуються в даному винаході, на боротьбу з безхребетним шкідником може бути синергетичним з експресованими білковими токсинами.

Загальна література з цих сільськогосподарських засобів захисту (тобто інсектицидів, фунгіцидів, нематоцидів, акарицидів, гербіцидів і біологічних засобів) включає *The Pesticide Manual*, 13th Edition, C. D. S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2003 and *The BioPesticide Manual*, 2nd Edition, L. G. Copping, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2001.

Боротьбу з безхребетними шкідниками проводять у сільському господарстві і не в сільському господарстві шляхом нанесення однієї або більшої кількості сполук, що пропонуються в даному винаході, звичайно у формі композиції, в біологічно ефективній кількості на середовище, в якому знаходяться шкідники, включаючи сільськогосподарську і/або несільськогосподарську ділянку зараження, на ділянку, що захищається, або прямо на шкідників, з якими проводять боротьбу.

Таким чином, даний винахід включає спосіб боротьби з безхребетним шкідником у сільському господарстві і/або не в сільському господарстві, що включає взаємодію безхребетного шкідника або його оточення з біологічно ефективною кількістю однієї або більшої кількості сполук, які пропонуються в даному винаході, або з композицією, яка включає щонайменше одну таку сполуку, або з композицією, яка включає щонайменше одну таку сполуку і біологічно ефективну кількість щонайменше однієї додаткової біологічно активної сполуки або засобу. Приклади придатних композицій, які включають сполуку, що пропонується в даному винаході, і біологічно ефективну кількість щонайменше однієї додаткової біологічно активної сполуки або засобу включають гранульовані композиції, в яких додаткова активна сполука міститься в тій же гранулі, що і сполука, яка пропонується в даному винаході, або в

гранулах, відділених від цих сполук, які пропонуються в даному винаході.

Для забезпечення взаємодії зі сполукою або композицією, що пропонується в даному винаході, для захисту польової культури від безхребетних шкідників, сполуку або композицію звичайно наносять на насіння сільськогосподарської культури до висівання, на листя

5

(наприклад, листя, стебла, квітки, плоди) сільськогосподарських рослин або на ґрунт або інше середовище для вирощування до або після висівання сільськогосподарської культури.

Одним варіантом здійснення способу взаємодії є обприскування. Альтернативно, гранульовану композицію, яка включає сполуку, що пропонується в даному винаході, можна наносити на листя рослини або ґрунт. Сполуки, які пропонуються в даному винаході, також можна ефективно доставляти за допомогою споживання рослиною шляхом взаємодії рослини з композицією, яка включає сполуку, що пропонується в даному винаході, що наноситься у формі рідкого препарату для зрошування ґрунту, гранульованого препарату на ґрунт, обробки ящика з розсадою або занурення саджанців. Потрібно відмітити композицію, яка пропонується в даному винаході, у формі рідкого препарату для зрошування ґрунту. Також потрібно відмітити спосіб боротьби з безхребетним шкідником, який включає взаємодію безхребетного шкідника або середовища, яке його оточує, з біологічно ефективною кількістю сполуки, що пропонується в даному винаході, або з композицією, що включає біологічно ефективну кількість сполуки, що пропонується в даному винаході. Також потрібно відмітити цей спосіб, в якому навколишнім середовищем є ґрунт і композицію наносять на ґрунт у формі препарату для зрошування ґрунту. Також потрібно зазначити, що сполуки, які пропонуються в даному винаході, також є ефективними при місцевому нанесенні на заражену ділянку. Інші способи взаємодії включають нанесення сполуки або композиції, що пропонується в даному винаході, шляхом прямого обприскування і обприскування розчином з післядією, обприскування з літаків, використання гелей, нанесення покриття на насіння, використання мікрокапсульованих препаратів, системного споживання, використання приманок, вушних бирок, болюсів, туманоутворювачів, фумігантів, аерозолів, дустів і багато іншого. Один варіант здійснення способу взаємодії являє собою гранулу, паличку або таблетку добрива, яка має стабільний розмір, що включає сполуку або композицію, яка пропонується в даному винаході. Сполуками, які пропонуються в даному винаході, також можна просочити матеріали для виготовлення пристроїв для боротьби безхребетними (наприклад, протимоскітні сітки).

10

15

20

25

30

Сполуки, які пропонуються в даному винаході, застосовні для обробки всіх рослин, частин рослини і насіння. Варієтети і сорти рослини та насіння можна отримати за звичайними методиками розмноження і схрещування або за методиками генної інженерії. Генетично модифіковані рослини або насіння (трансгенні рослини або насіння) є такими, в яких гетерологічний ген (трансген) був стабільно вбудований у геном рослини або насіння. Трансген, який визначається за його конкретним положенням у геномі рослини, називається трансформацією або трансгенною подією.

35

Генетично модифіковані сорти рослин і насіння, які можна обробити в контексті даного винаходу, включають такі, які стійкі відносно одного або більшої кількості біотичних стресів (шкідників, таких як нематоди, комахи, кліщі, гриби і т. п.) або абіотичних стресів (засухи, низької температури, солоності ґрунту і т. п.), або які мають інші бажані характеристики. Рослини і насіння можна генетично модифікувати для надання ознак, наприклад, переносимості гербіциду, стійкості до комах, модифікованих профілів олій або переносимості засухи.

40

Обробка генетично модифікованих рослин і насіння сполуками, які пропонуються в даному винаході, може привести до таких, що перевищують адитивні, або синергетичних ефектів. Наприклад, зменшення норм витрати, розширення спектра активності, поліпшена переносимість біотичних/абіотичних стресів або підвищена стабільність при зберіганні можуть бути більшими, ніж очікувані внаслідок простих адитивних наслідків нанесення сполук, які пропонуються в даному винаході, на генетично модифіковані рослини і насіння.

45

Сполуки, які пропонуються в даному винаході, також застосовні в засобах для обробки насіння для захисту насіння від безхребетних шкідників. У даному винаході і формулі винаходу обробка насіння означає взаємодію насіння з біологічно ефективною кількістю сполуки, що пропонується в даному винаході, яку звичайно готують у вигляді композиції, що пропонується в даному винаході. Ця обробка насіння захищає насіння від безхребетних ґрунтових шкідників і звичайно також може захищати коріння й інші частини паростка, який контактує з ґрунтом, розвиненого з пророслого насіння. Обробка насіння також може забезпечити захист листя завдяки переміщенню сполуки, яка пропонується в даному винаході, або другого активного інгредієнта в рослині, яка росте. Засоби для обробки насіння можна наносити на всі типи насіння, включаючи те, з якого проростають рослини, генетично модифіковані для експресування спеціальних ознак. Типові приклади включають рослини, які експресують білки,

50

55

60

токсичні для безхребетних шкідників, такі як токсин *Bacillus thuringiensis*, або які експресують стійкість до гербіциду, таку як гліфосатацетилтрансфераза, яка надає стійкість до гліфосату. Засоби для обробки насіння, які містять сполуки, які пропонуються в даному винаході, також можуть збільшити потужність рослини, що виростають із насіння.

5 Однією методикою обробки насіння є обприскування або запилювання насіння сполукою, яка пропонується в даному винаході (тобто у вигляді приготованої композиції), до висівання насіння. Композиції, приготовані для обробки насіння, звичайно включають плівкоутворювач або клейкий агент. Тому звичайно композиція для нанесення на насіння, що пропонується в даному винаході, включає біологічно ефективну кількість сполуки 1 або сполуки формули 2 і плівкоутворювач або клейкий агент. На насіння шляхом обприскування можна нанести плинний концентрат суспензії у шарі насіння, що перевертається, і потім висушити насіння. Альтернативно, на насіння шляхом обприскування можна нанести препарати інших типів, такі як змочувані порошки, розчини, суспензії, концентрати, які емульгуються, і емульсії у воді. Ця процедура є особливо придатною для нанесення плівкових покриттів на насіння. Для фахівця в даній галузі техніки доступні різні машини і методи нанесення покриттів. Придатні методики включають наведені в P. Kusters et al., *Seed Treatment: Progress and Prospects*, 1994 BCPC Mongraph No. 57, і цитовані в ній літературі.

20 Сполука 1 або сполука формули 2 і композиції, які містять їх, окремо і в комбінації з іншими інсектицидами, нематоцидами і фунгіцидами є особливо придатними для обробки насіння сільськогосподарських культур, включаючи, але не обмежуючись тільки ними, маїс або кукурудзу, сою, бавовник, злаки (наприклад, пшеницю, овес, ячмінь, жито і рис), картоплю, овочі і олійний рапс.

25 Інші інсектициди, з якими можна приготувати сполуку 1 або сполуку формули 2 з отриманням сумішей, придатних для обробки насіння, включають абамектин, ацетаміпрід, акринатрин, амітраз, авермектин, азадирахтин, бенсултап, біфентрин, бупрофезин, кадусафос, карбарил, карбофуран, картап, хлорантраніліпрол, хлорфенапір, хлорпірифос, клотіанідин, ціантраніліпрол, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, гамма-цигалотрин, лямбда-цигалотрин, циперметрин, альфа-циперметрин, дзета-циперметрин, циромазин, дельтаметрин, діельдрин, динотефуран, діофенолан, емаектин, ендосульфат, есфенвалерат, етипрол, етофенпрокс, етоксазол, фенотіокарб, феноксикарб, фенвалерат, фіпроніл, флонікамід, флубендіамід, флуфеноксурон, флувалінат, форметанат, фостіазат, гексафлумурон, гідраметилнон, імідаклопрід, індоксакарб, луфенурон, метафлумізон, метіокарб, метоміл, метопрен, метоксифенозид, нітенпірам, нітіазин, новалурон, оксаміл, піметрозин, піретрин, піридабен, піридаліл, пірипроксифен, ріанодин, спінеторам, спіносад, спіродиклофен, спіромезифен, спіротетрамат, сульфоксафлор, тебуфенозид, тетраметрин, тіаклопрід, тіаметоксам, тіодикарб, тіосултап-натрій, тралометрин, триазамат, трифлумурон, *Bacillus thuringiensis* дельта-ендотоксини, всі штами *Bacillus thuringiensis* і всі штами вірусів ядерного поліедрозу.

40 Фунгіциди, з якими можна приготувати сполуку 1 або сполуку формули 2 з отриманням сумішей, придатних для обробки насіння, включають амісулбром, азоксистробін, боскалід, карбендазим, карбоксин, цимоксаніл, ципроконазол, дифеноконазол, диметоморф, флуазинам, флудіоксоніл, флухінконазол, флуопіколід, флуоксастробін, флутриафол, флуксапіроксад, іпконазол, іпродіон, металаксил, мефеноксам, метконазол, міклобутаніл, паклобутразол, пенфлуфен, пікоксистробін, протіконазол, піраклостробін, седаксан, силтіофам, тебуконазол, тіабендазол, тіофанат-метил, тирам, трифлуксистробін і тритиконазол.

50 Композиції, які включають сполуку 1 або сполуку формули 2, придатні для обробки насіння, можуть додатково включати бактерії і гриби, які мають здатність забезпечувати захист від шкідливих впливів фітопатогенних грибів або бактерій і/або тварин, які знаходяться в ґрунті, таких як нематоди. Бактерії, що мають нематоцидну здатність, можуть включати, але не обмежуються тільки ними, *Bacillus firmus*, *Bacillus cereus*, *Bacillus subtilis* і *Pasteuria penetrans*. Придатним штамом *Bacillus firmus* є штам CNCM I-1582 (GB-126), який продається під назвою BioNem™. Придатним штамом *Bacillus cereus* є штам NCMM I-1592. Обидва штами *Bacillus* розкриті в US 6406690. Іншими придатними бактеріями, які мають нематоцидну здатність, є *B. amyloliquefaciens* IN937a і *B. subtilis* штам GB03. Бактерії, що мають фунгіцидну здатність, можуть включати, але не обмежуються тільки ними, *B. pumilus* штам GB34. Види грибів, що мають нематоцидну здатність, можуть включати, але не обмежуються тільки ними, *Myrothecium verrucaria*, *Raecilomyces lilacinus* і *Purpureocillium lilacinum*.

60 Засоби для обробки насіння також можуть включати один або більшу кількість нематоцидних засобів природного походження, таких як подразнювальний білок гарпін, який виділяють з деяких бактеріальних патогенів рослин, таких як *Erwinia amylovora*. Прикладом є

технологія обробки насіння Harpin-N-Tek під назвою N-Hibit™ Gold CST.

Засоби для обробки насіння також можуть включати один або більшу кількість видів бульбочкових бактерій бобових, таких як мікосимбіотичні азотфіксуючі бактерії *Bradyrhizobium japonicum*. Ці інокулянти можуть необов'язково включати один або більшу кількість ліпохітоолігосахаридів (LCOs), які є факторами утворення бульбочок (Nod), продукованими мікоризами під час ініціювання утворення бульбочок на корінні бобових. Наприклад, технологія обробки насіння торговельної марки Optimize® включає LCO Promoter Technology™ у комбінації з інокулятом.

Засоби для обробки насіння також можуть включати один або більшу кількість ізофлавононів, які можуть збільшувати ступінь колонізації коріння мікоризами. Мікоризи поліпшують ріст рослини шляхом збільшення споживання корінням поживних речовин, таких як вода, сульфати, нітрат, фосфати і метали. Приклади ізофлавононів включають, але не обмежуються тільки ними, геністеїн, біоханін А, формононетин, дайдзеїн, гліцитеїн, гесперитин, нарингенін і пратензеїн. Формононетин виготовляється як активний інгредієнт в мікоризних інокулятах, таких як PNC Colonize® AG.

Засоби для обробки насіння також можуть включати один або більшу кількість активаторів рослин, які індукують системно набуту стійкість рослин після взаємодії з патогеном. Прикладом активатора рослини, який індукує такі захисні механізми, є ацибензолар-S-метил.

Оброблене насіння звичайно включає сполуку, що пропонується в даному винаході, в кількості, що дорівнює приблизно від 0,1 г до 1 кг на 100 кг насіння (тобто приблизно від 0,0001 до 1 мас.% в перерахунку на насіння до обробки). Плинна суспензія, приготована для обробки насіння, звичайно включає від приблизно 0,5 до приблизно 70% активного інгредієнта, від приблизно 0,5 до приблизно 30% плівкоутворювального клею, від приблизно 0,5 до приблизно 20% диспергувального агента, від 0 приблизно до 5% загусника, від 0 приблизно до 5% пігмента і/або барвника, від 0 приблизно до 2% протиспінювального агента, від 0 приблизно до 1% консерванта і від 0 приблизно до 75% леткого рідкого розріджувача.

Сполуки, які пропонуються в даному винаході, також можна включати в композицію приманки, яку поїдає безхребетний шкідник, або використовувати в пристрої, такому як пастка, приналежна установка і т. п. Такі композиції приманки можуть знаходитися у формі гранул, які включають (а) активні інгредієнти, а саме: біологічно ефективну кількість сполуки формули 1, її N-оксиду або солі; (b) один або більшу кількість харчових матеріалів; необов'язково (c) атрактант, і необов'язково (d) один або більшу кількість вологоутримувальних засобів. Потрібно відмітити гранули або композиції приманки, які включають приблизно 0,001-5% активних інгредієнтів, приблизно 40-99% харчового матеріалу і/або атрактанта; і необов'язково приблизно 0,05-10% вологоутримувальних засобів, які є ефективними для боротьби в ґрунті з безхребетними шкідниками при дуже низьких нормах витрати, зокрема, при дозах активного інгредієнта, які летальні при проковтуванні, а не при безпосередньому зіткненні. Деякі харчові матеріали можуть діяти і як джерело їжі, і як атрактант. Харчові матеріали включають вуглеводи, білки і ліпіди. Прикладами харчових матеріалів є рослинне борошно, цукор, крохмалі, тваринний жир, рослинна олія, екстракти дріжджів і сухе молоко. Прикладами атрактантів є одоранти і смакові речовини, такі як плодові або рослинні екстракти, віддушка або інший тваринний або рослинний компонент, феромони або інші агенти, для яких відомо, що вони залучають цільового безхребетного шкідника. Прикладами вологоутримувальних засобів, тобто засобів, які утримують вологу, є гліколі й інші поліоли, гліцерин і сорбіт. Потрібно відмітити композицію приманки (і спосіб застосування такої композиції приманки), що використовується для боротьби щонайменше з одним безхребетним шкідником, вибраним з групи, яка включає мурашок, термітів і тарганових. Пристрій для боротьби з безхребетним шкідником може включати композицію приманки, яка пропонується в даному винаході, і кожух для розміщення композиції приманки, де кожух містить щонайменше один отвір такого розміру, щоб безхребетний шкідник міг проникати через отвір, так щоб безхребетний шкідник міг отримати доступ до вказаної композиції приманки з положення за межами кожуха, і де кожух додатково пристосований для розміщення на ділянці можливої або встановленої активності безхребетного шкідника або поблизу неї.

У одному варіанті здійснення даний винахід стосується способу боротьби з безхребетними шкідниками, який включає розбавлення водою пестицидної композиції, що пропонується в даному винаході (сполука 1 або сполука формули 2, приготована з поверхнево-активними речовинами, твердими розріджувачами і рідкими розріджувачами, або приготована суміш сполуки 1 або сполук формули 2 і щонайменше одного іншого пестициду), і необов'язкове додавання допоміжної речовини з утворенням розбавленої композиції і взаємодію безхребетного шкідника або його оточення з ефективною кількістю вказаної розбавленої

композиції.

Хоча композиція для обприскування, отримана розбавленням водою з отриманням композиції, що пропонується в даному винаході, в достатній концентрації, може забезпечити достатню ефективність боротьби з безхребетними шкідниками, в бакові суміші для обприскування також можна додавати окремо приготовані препарати допоміжних речовин. Ці додаткові допоміжні речовини звичайно називаються "допоміжними речовинами для обприскування" або "допоміжними речовинами для бакової суміші" і включають будь-яку речовину, змішану в баку для обприскування для поліпшення робочих характеристик пестициду або зміни фізичних характеристик суміші для обприскування. Допоміжні речовини можуть являти собою поверхнево-активні речовини, емульгувальні агенти, рослинні олії на основі нафти, олії з насіння сільськогосподарських рослин, підкислювачі, буфери, загусники або пінопригнічувальні агенти. Допоміжні речовини використовують для підвищення ефективності (наприклад, біологічної доступності, адгезії, проникнення, рівномірності покриття і тривалості захисту) або зведення до мінімуму або усунення ускладнень при нанесенні обприскуванням, пов'язаних з несумісністю, спіненням, знесенням, випаровуванням, звітрюванням і розкладанням. Для забезпечення оптимальних робочих характеристик допоміжні речовини вибирають відповідно до характеристик активного інгредієнта, препарату і мети (наприклад, сільськогосподарських культур, комах-шкідників).

Серед допоміжних речовин для обприскування олії, які включають рослинні олії, концентрати олій із культурних рослин, концентрати рослинних олій і концентрати метилованих рослинних олій, найчастіше використовують для підвищення ефективності пестицидів, можливо, шляхом стимулювання більш рівного і рівномірного осадження при обприскуванні. У випадках, коли викликає заклопотаність фітотоксичність, яка може бути зумовлена оліями або іншими рідинами, які не змішуються з водою, композиції для обприскування, які готують з композиції, яка пропонується в даному винаході, звичайно не містять допоміжні речовини для обприскування на олійній основі. Однак у випадках, коли фітотоксичність, викликана допоміжними речовинами для обприскування на олійній основі, з комерційної точки зору несуттєва, композиції для обприскування, отримані з композиції, яка пропонується в даному винаході, також можуть містити допоміжні речовини для обприскування на олійній основі, які можуть додатково забезпечувати посилену боротьбу з безхребетними шкідниками, а також стійкість до дощу.

Продукти, що описуються як "рослинна олія", звичайно містять від 95 до 98% парафінового масла або нафтового масла на основі нафти і від 1 до 2% однієї або більшої кількості поверхнево-активних речовин, які діють як емульгатори. Продукти, які описуються як "концентрати рослинної олії", звичайно містять від 80 до 85% олії, яка емульгується, на основі нафти і від 15 до 20% неіоногенних поверхнево-активних речовин. Продукти, що коректно описуються як "концентрати рослинної олії", звичайно від 80 до 85% рослинної олії (тобто олії з насіння або плодів, найчастіше з бавовни, льону, сої або соняшнику) і від 15 до 20% неіоногенних поверхнево-активних речовин. Характеристики допоміжної речовини можна поліпшити шляхом заміни рослинної олії метиловим ефіром жирних кислот, який звичайно отримують з рослинних олій. Приклади концентратів метилованих рослинних олій включають концентрат MSO® (UAP-Loveland Products, Inc.) і метиловану інсектицидну олію Premium MSO (Helena Chemical Company).

Кількість допоміжних речовин, що додаються в суміші для обприскування, звичайно не перевищує приблизно 2,5 об.% і частіше кількість дорівнює від приблизно 0,1 до приблизно 1 об.%. Норми витрати допоміжних речовин, що додаються в суміші для обприскування, звичайно дорівнюють приблизно від 1 до 5 л на гектар. Типові приклади допоміжних речовин для обприскування включають: Adigor® (Syngenta) 47% метилована рапсова олія в рідких вуглеводнях, Silwet® (Helena Chemical Company) модифікований поліалкіленоксидом гептаметилтрисилоксан і Assist® (BASF) 17% суміші поверхнево-активних речовин у 83% мінеральному маслі на основі парафіну.

Сполуки, які пропонуються в даному винаході, можна наносити без інших допоміжних речовин, але найчастіше наносять препарат, який включає один або більшу кількість активних інгредієнтів з придатними носіями, розріджувачами і поверхнево-активними речовинами і, можливо, в комбінації з їжею залежно від кінцевого призначення. Одна методика нанесення включає обприскування водною дисперсією або розчином у рафінованій олії сполуки, що пропонується в даному винаході. Комбінації з інсектицидними оліями, концентратами інсектицидної олії, розподіляючим засобом, клейкими засобами, допоміжними речовинами, іншими розчинниками і синергетиками, такими як піперонілбутоксид, часто підвищують ефективність сполуки. Для несільськогосподарського застосування таке обприскування можна

провести з контейнерів для обприскування, таких як бак, пляшка або інший контейнер, за допомогою насоса або шляхом вивільнення з контейнера, що знаходиться під тиском, наприклад, аерозольного балона для обприскування, що знаходиться під тиском. Такі композиції для обприскування можуть знаходитися у різних формах, наприклад, спреї, повітряні дисперсії, піни, дими або туман. Таким чином, такі композиції для обприскування можуть додатково включати пропеленти, спінювальні агенти і т. п. залежно від обставин. Потрібно відмітити композицію для обприскування, яка включає біологічно ефективну кількість сполуки або композиції, що пропонується в даному винаході, і носій. Один варіант здійснення таких композицій для обприскування включає біологічно ефективну кількість сполуки або композиції, що пропонується в даному винаході, і пропелент. Типові пропеленти включають, але не обмежуються тільки ними, метан, етан, пропан, бутан, ізобутан, бутен, пентан, ізопентан, неопентан, пентен, гідрофторвуглеці, хлорфторвуглеці, диметилловий ефір і їх суміші. Потрібно відмітити композицію для обприскування (і спосіб використання таких композицій для обприскування, які подаються з контейнера для обприскування), яка використовується для боротьби щонайменше з одним безхребетним шкідником, вибраним з групи, яка включає наступних: комарі, мошки, жигалки звичайні, оленячі гедзі, гедзі, оси, справжні оси, шершні, коростяні кліщі, павуки, мурашки, гнус і т. п., зокрема окремо або в комбінаціях.

Описані нижче дослідження демонструють ефективність боротьби за допомогою сполук, які пропонуються в даному винаході, з конкретними шкідниками. "Ефективність боротьби" означає пригнічення розвитку безхребетного шкідника (включаючи загибель), до якого приводить значне зменшення живлення. Однак захист від шкідників, який забезпечується сполуками, не обмежується цими видами.

Біологічні приклади винаходу

Препарат і методологія обприскування для досліджень A-D

Сполуки, які досліджуються, готували з використанням розчину, що містить 10% ацетону, 90% води і 300 част./млн розподіляючого засобу X-77® Lo-Foam Formula, неіоногенної поверхнево-активної речовини, яка містить алкіларилполіоксіетилен, вільні жирні кислоти, гліколи і ізопропанол (Loveland Industries, Inc. Greeley, Colorado, USA). Приготовані сполуки наносили в 1 мл рідині за допомогою атомізуючого сопла SUJ2 зі спеціальним корпусом 1/8 JJ (Spraying Systems Co. Wheaton, Illinois, USA), розташованого на 1,27 см (0,5 дюйми) вище верху кожного випробувального пристрою. Сполуки, які досліджуються, наносили обприскуванням при вказаних нормах витрати і кожне дослідження повторювали тричі.

Дослідження A

Для дослідження боротьби з попелицею персиковою зеленою (*Myzus persicae* (Sulzer)) внаслідок впливу контактних і/або системних засобів випробувальний пристрій складався з невеликого відкритого контейнера з рослиною редиски у віці 12-15 днів всередині. Її попередньо заражали шляхом вміщення на листок рослини, що досліджується, 30-40 попелиць на шматок листка, відрізаний від культурної рослини (методика відрізання листка). Попелиці пересувалися по рослині, що досліджується, в міру висихання шматка листка. Після попереднього зараження ґрунт у випробувальному пристрої покривали шаром піску.

Сполуки, які досліджуються, готували і наносили обприскуванням в концентраціях 250 і/або 50 част./млн. Після обприскування приготованими сполуками, що досліджуються, кожному випробувальному пристрою давали висихати протягом 1 год. і потім звернувши вміщували чорну кришку з сіткою. Випробувальні пристрої витримували протягом 6 днів у камері для вирощування при 19-21 °C і відносній вологості, що дорівнює 50-70%. Потім для кожного випробувального пристрою візуально визначали смертність комах.

Зі сполук, досліджених в концентрації 250 част./млн, наступні сполуки приводили до смертності, що становить не менше 80%: 1 і 2a.

Зі сполук, досліджених в концентрації 50 част./млн, наступні сполуки приводили до смертності, що становить не менше 80%: 1, 2a, 2b і 2c.

Дослідження B

Для дослідження боротьби з попелицею баштанною (*Aphis gossypii* (Glover)) внаслідок впливу контактних і/або системних засобів випробувальний пристрій складався з невеликого відкритого контейнера з рослиною бавовнику у віці 6-7 днів всередині. Її попередньо заражали за допомогою 30-40 комах на шматку листка за методикою відрізання листка і ґрунт у випробувальному пристрої покривали шаром піску.

Сполуки, які досліджуються, готували і наносили обприскуванням в концентраціях 250 і/або 50 част./млн. Після обприскування випробувальні пристрої витримували в камері для вирощування протягом 6 днів при 19 °C і відносній вологості, що дорівнює 70%. Потім для кожного випробувального пристрою візуально визначали смертність комах.

Зі сполук, досліджених в концентрації 50 част./млн, наступні сполуки приводили до смертності, що становить не менше 80%: 1, 2a, 2b і 2c.

Дослідження С

Для дослідження боротьби з тютюною білокрилкою (*Bemisia tabaci* (Gennadius)) внаслідок впливу контактних і/або системних засобів випробувальний пристрій складався з невеликого відкритого контейнера з рослиною бавовнику у віці 12-14 днів всередині. До нанесення обприскуванням обидві сім'ядолі видаляли з рослини, залишаючи для дослідження тільки один даний листок. Дорослим білокрилкам давали відкласти яйця на рослину і потім їх видаляли з випробувального пристрою. Рослини бавовнику, заражені з допомогою щонайменше 15 яєць, спрямовували для дослідження обприскуванням.

Сполуки, які досліджуються, готували і наносили обприскуванням в концентраціях 250 і/або 50 част./млн. Після обприскування випробувальним пристроєм давали висихати протягом 1 год. Потім циліндри видаляли і пристрої переносили в камеру для вирощування і витримували протягом 13 днів при 28 °С і відносній вологості, що дорівнює 50-70%. Потім для кожного випробувального пристрою візуально визначали смертність комах.

Зі сполук, досліджених в концентрації 250 част./млн, наступні приводили до смертності, що становить не менше 50%: 1 і 2b.

Зі сполук, досліджених у концентрації 50 част./млн, наступні приводили до смертності, що становить не менше 50%: 1.

Дослідження D

Для дослідження боротьби з трипсом квітковим західним (*Frankliniella occidentalis* (Pergande)) внаслідок впливу контактних і/або системних засобів випробувальний пристрій складався з невеликого відкритого контейнера з рослиною квасолі Soleil у віці 5-7 днів всередині.

Сполуки, які досліджуються, готували і наносили обприскуванням в концентраціях 250 і/або 50 част./млн. Після обприскування випробувальним пристроєм давали висихати протягом 1 год. і потім у кожний пристрій вміщували 22-27 дорослих трипсів. Зверху вміщували чорну кришку з сіткою і випробувальні пристрої витримували протягом 6 днів при 25 °С і відносній вологості, що дорівнює 45-55%.

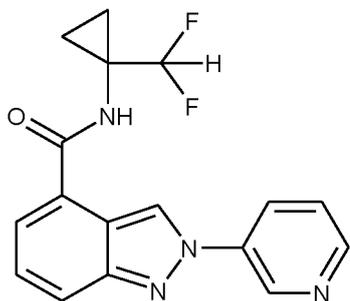
Зі сполук, досліджених в концентрації 250 год./млн, наступні сполуки забезпечували показники ефективності боротьби від доброго до чудового (30% або менше пошкодження рослини і/або 100% смертність): 1, 2a і 2b.

Зі сполук, досліджених в концентрації 50 част./млн, наступні сполуки забезпечували показники ефективності боротьби від доброго до чудового (30% або менше пошкодження рослини і/або 100% смертність): 1, 2a і 2b.

ФОРМУЛА ВІНАХОДУ

1. Сполука 1

40



1.

2. Композиція, яка містить сполуку за п. 1 і щонайменше один додатковий компонент, вибраний з групи, яка складається з наступних: поверхнево-активні речовини, тверді розріджувачі і рідкі розріджувачі, вказана композиція необов'язково додатково містить щонайменше одну додаткову біологічно активну сполуку або засіб.

3. Композиція за п. 2, де щонайменше одна додаткова біологічно активна сполука або засіб вибрані із групи, яка складається з наступних: абамектин, ацефат, ацехіноцил, ацетаміпрід, акринатрин, афідопіропен, амідофлумет, амітраз, авермектин, азадирахтин, азинфос-метил, бенфуракарб, бенсултап, біфентрин, біфеназат, бістрифлурон, борат, бупрофезин, карбарил, карбофуран, картап, карзол, хлорантраніліпрол, хлорфенапір, хлорфлуазурон, хлорпіріфос,

- хлорпірифос-метил, хромафенозид, клофентезин, клотіанідин, ціантраніліпрол, цикланіліпрол, циклопротрин, циклоксапрід, цифлуметофен, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, гамма-цигалотрин, лямбда-цигалотрин, циперметрин, альфа-циперметрин, дзета-циперметрин, циромазин, дельтаметрин, діафентіурон, діазинон, діельдрин, дифлубензурон, димефлутрин, димегіпо, диметоат, динотефуран, діофенолан, емаектин, ендосульфен, есфенвалерат, етипрол, етофенпрокс, етоксазол, фенбутатиноксид, фенітротіон, фенотіокарб, феноксикарб, фенпропатрин, фенвалерат, фіпроніл, флометоквін, флонікамід, флубендіамід, флуцитринат, флуфенерим, флуфеноксурон, флуфеноксистробін, флуфенсульфон, флуопірам, флупіпрол, флупірадіфулон, флувалінат, тау-флувалінат, фонофос, форметанат, фостіазат, галофенозид, гептафлутрин, гексафлумурон, гекситіазокс, гідраметилнон, імідаклопрід, індоксакарб, інсектицидні мила, ізофенфос, луфенурон, малатіон, меперфлутрин, метафлумізон, метальдегід, метамідофос, метидатіон, метіодикарб, метоміл, метопрен, метоксихлор, метофлутрин, монокротофос, монофлутрин, метоксифенозид, нітенпірам, нітіазин, новалурон, новіфлумурон, оксаміл, паратіон, паратіон-метил, перметрин, фонат, фозалон, фосмет, фосфамідон, піримікарб, профенофос, профлутрин, пропаргіт, протрифенбут, піфлубумід, піметрозин, пірафлупрол, піретрин, піридабен, піридаліл, пірифлухіназон, піриміностробін, пірипрол, пірипроксифен, ротенон, ріанодин, силафлуофен, спінеторам, спіносад, спіродиклофен, спіромезифен, спіротетрамат, сульпрофос, сульфоксафлор, тебуфенозид, тебуфенпірад, тефлубензурон, тефлутрин, тербуфос, тетрахлорвінфос, тетраметрин, тетраметилфлутрин, тіаклопрід, тіаметоксам, тіодикарб, тіосултап-натрій, толфенпірад, тралометрин, триазамат, трихлорфон, трифлумурон, всі штами *Bacillus thuringiensis*, ентомопатогенні бактерії, всі штами вірусів ядерного поліедрозу, ентомопатогенні віруси і ентомопатогенні гриби.
4. Композиція за п. 2, де щонайменше одна додаткова біологічно активна сполука або засіб вибрані із групи, яка складається з наступних: абамектин, ацетаміпрід, акринатрин, афідопіропен, амітраз, авермектин, азадирахтин, бенфуракарб, бенсултап, біфентрин, 3-бром-1-(3-хлор-2-піридиніл)-N-[4-ціано-2-метил-6-[(метиламіно)карбоніл]феніл]-1H-піразол-5-карбоксамід, бупрофезин, карбарил, картап, хлорантраніліпрол, хлорфенапір, хлорпірифос, клотіанідин, ціантраніліпрол, цикланіліпрол, циклопротрин, цифлутрин, бета-цифлутрин, цигалотрин, лямбда-цигалотрин, гамма-цигалотрин, циперметрин, альфа-циперметрин, дзета-циперметрин, циромазин, дельтаметрин, діельдрин, динотефуран, діофенолан, емаектин, ендосульфен, есфенвалерат, етипрол, етофенпрокс, етоксазол, фенітротіон, фенотіокарб, феноксикарб, фенвалерат, фіпроніл, флометоквін, флонікамід, флубендіамід, флуфеноксурон, флуфеноксистробін, флуфенсульфон, флупіпрол, флупірадіфулон, флувалінат, форметанат, фостіазат, гептафлутрин, гексафлумурон, гідраметилнон, імідаклопрід, індоксакарб, луфенурон, меперфлутрин, метафлумізон, метіодикарб, метоміл, метопрен, метоксифенозид, метофлутрин, монофлутрин, нітенпірам, нітіазин, новалурон, оксаміл, піфлубумід, піметрозин, піретрин, піридабен, піридаліл, піриміностробін, пірипроксифен, ріанодин, спінеторам, спіносад, спіродиклофен, спіромезифен, спіротетрамат, сульфоксафлор, тебуфенозид, тетраметрин, тіаклопрід, тіаметоксам, тіодикарб, тіосултап-натрій, тралометрин, тетраметилфлутрин, триазамат, трифлумурон, всі штами *Bacillus thuringiensis* і всі штами вірусів ядерного поліедрозу.
5. Спосіб боротьби з безхребетним шкідником, який включає взаємодію безхребетного шкідника або його оточення з біологічно ефективною кількістю сполуки за п. 1.
6. Протруєне насіння, яке містить сполуку за п. 1 в кількості, що дорівнює приблизно від 0,0001 до 1 мас. % у перерахунку на насіння до обробки.