

(19)



(10) **LT 3959 B**

(12) **PATENTO APRAŠYMAS**

(11) Patent numeris: **3959**

(51) Int. Cl.⁵: **C07D 273/04**

(21) Paraiškos numeris: **IP1763**

C07C 251/20

C07D 417/00

C07D 413/00

A01N 43/88

(22) Paraiškos padavimo data: **1994 01 11**

(41) Paraiškos paskelbimo data: **1995 08 25**

(45) Patent paskelbimo data: **1996 05 27**

(72) Išradėjas:

Peter Maienfisch, CH

Laurenz Gsell, CH

(73) Patent savininkas:

CIBA-GEIGY AG, Klybeckstrasse 141, 4002 Basle, CH

(74) Patentinis patikėtinis:

Marius Jakulis-Jason, 3, A.A.A. Baltic Service Company,

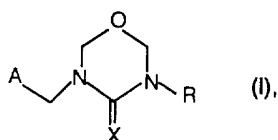
Rūdninkų g. 18/2-12, 2001 Vilnius, LT

(54) Pavadinimas:

Oksadiazino dariniai

(57) Referatas:

Žemiau pateiktos formulės junginiai

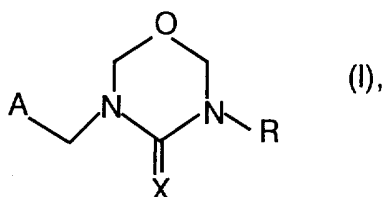


kurioje A žymi neturinčią pakaitų arba turinčią nuo vieno iki keturių pakaitų, aromatinę arba nearomatinę, monociklinę arba dicitklinę, heterociklinę liekaną, be to, nuo vieno iki dviejų A pakaitų gali būti pasirinkti iš grupės, susidedančios iš halogen-C₁-C₃-alkilo, ciklopropilo, halogenciklopropilo, C₂-C₃-alkenilo, C₂-C₃-alkinilo, halogen-C₂-C₃-alkenilo, halogen-C₂-C₃-alkinilo, halogen-C₁-C₃-alkoksi, C₁-C₃-alkiltio, halogen-C₁-C₃-alkiltio, aliloksi, propargiloksi, aliltio, propargiltio, halogenaliloksi, halogenaliltio, ciano ir nitro, ir nuo vieno iki keturių A pakaitų gali būti pasirinkti iš grupės, susidedančios iš C₁-C₃-alkilo, C₁-C₃-alkoksi ir halogeno;

LT 3959 B

R žymi vandenilį, C₁-C₆-alkilą, fenil-C₁-C₄-alkilą, C₃-C₆-cikloalkilą, C₂-C₆-alkenilą arba C₂-C₆-alkinilą; ir
X žymi N-NO₂ arba N-CN,
ir, reikalui esant, jų tautomerai, atsižvelgiant į aplinkybes, laisvoje arba druskų formoje, gali būti panaudoti
kaip agrocheminės biologškai aktyvios medžiagos ir yra gaunami aprašytu būdu.

Išradimo objektas yra žemiau pateiktos formulės junginiai



kur A žymi neturinčią pakaitų arba turinčią nuo vieno iki keturių pakaitų, aromatinę arba nearomatinę, monociklinę arba diciklinę, heterociklinę liekaną, prie to nuo vieno iki dviejų A pakaitų gali būti pasirinkti iš grupės, susidedančios iš halogen- C_1 - C_3 -alkilo, ciklopropilo, halogenciklopropilo, C_2 - C_3 -alkenilo, C_2 - C_3 -alkinilo, halogen- C_2 - C_3 -alkenilo, halogen- C_2 - C_3 -alkinilo, halogen- C_1 - C_3 -alkoksi, C_1 - C_3 -alkiltio, halogen- C_1 - C_3 -alkiltio, aliloksi, propargiloksi, aliltio, propargiltio, halogenaliloksi, halogenaliltio, ciano ir nitro, ir nuo vieno iki keturių A pakaitų gali būti pasirinkti iš grupės, susidedančios iš C_1 - C_3 -alkilo, C_1 - C_3 -alkoksi ir halogeno; R žymi vandenilį, C_1 - C_6 -alkilą, fenil- C_1 - C_4 -alkilą, C_3 - C_6 -cikloalkilą, C_2 - C_6 -alkenilą arba C_2 - C_6 -alkinilą, ir X žymi N- NO_2 arba N-CN, laisvoje arba druskų formoje, esant reikalui, šių junginių tautomerai laisvoje arba druskų formoje, šių junginių ir tautomerų gavimo būdas, kovos su kenkėjais priemonės, kurių biologiškai aktyvios medžiagos yra pasirenkamos iš šių junginių ir tautomerų, atsižvelgiant į aplinkybes, laisvoje formoje arba agrochemiškai naudojamų druskų formoje, šių priemonių gavimo ir panaudojimo būdas, šiomis priemonėmis apdorotos augalų sėklos, kovos su kenkėjais būdas, tarpiniai produktai, laisvoje arba druskų formoje, šių junginių gavimui, esant reikalui, šių tarpinių produktų tautomerai laisvoje arba druskų formoje ir šių tarpinių produktų gavimo būdas ir panaudojimas.

Žinomos kovos su kenkėjais priemonės, kaip prieš nariuotakojus veikiančios biologiškai aktyvios medžiagos, kuriose yra panaudoti tam tikri oksadiazino dariniai, aprašytos US Nr. 3059027, C 07 D 273/04, o taip pat FR Nr. 1450485, C 07 D 273/04 patentų aprašymuose.

Tačiau šių žinomų junginių biologinės savybės kovos su kenkėjais sferoje nėra visai patenkinamos, todėl atsiranda poreikis pasiūlyti kitus junginius, pasižyminčius antikenkėjiškomis savybėmis, ypač tinkamus kovai su vabzdžiais, prie to pagal išradimą šis uždavinys yra sprendžiamas paruošiant pateiktus I formulės junginius.

I formulės junginiai dalinai gali būti tautomerų formoje. Jei pvz., R žymi vandenilį, tai atitinkamai I formulės junginiai gali turėti 3-H-4-imino-perhidro-1,3,5-oksadiazino dalinę struktūrą pusiausvyroje su 4-amino-1,2,5,6-tetrahidro-1,3,5-oksadiazino daline struktūra. Atsižvelgiant į tai, kaip I formulės junginiai, esant reikalui, yra suprantami ir atitinkami tautomerai, netgi jei pastarieji specialiai neminimi kiekvienu atveju.

I formulės junginiai, turintys mažiausiai vieną bazinį centrą, gali sudaryti pvz. konjuguotas druskas. Jos susidaro, pavyzdžiui, su tokiomis stipriomis neorganinėmis rūgštimis, kaip mineralinės rūgštys, pvz., perchlorato rūgštis, sieros rūgštis, azoto rūgštis, nitritinė rūgštis, fosforo rūgštis arba vandenilio halogenido rūgštis, su tokiomis stipriomis organinėmis rūgštimis, kaip, reikalui esant, su halogenu pakeistomis C₁-C₄-alkankarboninėmis rūgštimis, pvz., acto rūgštis, kaip, reikalui esant, su nesočiomis dikarboninėmis rūgštimis, pvz., oksalo, malono, gintaro, maleino, fumaro arba ftalio rūgštys, kaip hidroksikarboninėmis rūgštimis, pvz., askorbino, pieno, obuolių, vynuogių, citrinos, arba benzoinė rūgštis, arba su organinėmis sulfoninėmis rūgštimis, kaip, reikalui esant, pvz. su halogenu pakeistomis C₁-C₄-alkan arba aril sulfoninėmis rūgštimis, pvz. metan arba p-toluensulfoninė rūgštis. Be to I formulės junginiai, turintys mažiausiai vieną rūgštinę grupę, gali sudaryti su bazėmis druskas. Tinkamomis su bazėmis sudarytomis druskomis yra, pavyzdžiui, tokios

metalų druskos, kaip šarminių ir žemės šarminių metalų druskos, pvz., natrio, kalio arba magnio druskos, arba druskos su amoniaku arba organiniu aminu, kaip morfolinas, piperidinas, pirolidinas, su neilgos anglies grandinės mono-, di-, arba trialkilaminu, pvz. etil, dietil, trietil arba dimetil-propilaminas, arba su neilgos anglies grandinės mono-, di- arba trihidroksialkilaminu, pvz., mono-, di- arba trietanolaminas. Atsižvelgiant į aplinkybes, gali susidaryti atitinkamos vidinės druskos. Išradimo rėmuose pirmenybę turi agrochemiškai naudingos druskos, tačiau išradimas apima ir tas druskas, kurios turi trūkumų agrocheminiame panaudojime, pvz. toksiškos bitėms arba žuvims druskos, kurios panaudojamos, pavyzdžiui, laisvų I formulės junginių arba jų agrochemiškai naudojamų druskų išskyrimui arba valymui. Dėl tamprų ryšių tarp I formulės junginių laisvoje ir jų druskų formoje, toliau kaip laisvi I formulės junginiai ir jų druskos, pagal prasmę, esant reikalui, yra suprantamos atitinkamos druskos ir laisvi I formulės junginiai. Tas pats galioja I formulės junginių ir jų druskų tautomerams. Bendru atveju pirmenybę turi, atitinkamai, laisva forma.

Aukščiau ir žemiau pavartotos bendrosios sąvokos turi, jei kitaip neapibrėžta, žemiau pateiktas reikšmes.

Kaip žiedinio pagrindinio karkaso heterociklinės liekanos A heteroatomai, omenyje turimi visi periodinės sistemos elementai, kurie gali sudaryti mažiausiai dvi kovalentines jungtis.

Halogenas - savaime kaip grupė, o taip pat kaip kitų grupių ir junginių struktūrinis elementas, kaip antai halogenalkilo, halogenalkiltio, halogenalkoksi, halogenciklopropilo, halogenalkenilo, halogenaliloksi ir halogenaliltio - yra fluoras, chloras, bromas arba jodas, ypač fluoras, chloras arba bromas, visų pirma fluoras arba chloras, labiausiai chloras.

Anglį turinčios grupės ir junginiai, jei kitaip neapibrėžta, atsižvelgiant į aplinkybes, turi nuo 1 iki 6 anglies atomų, dažniausiai nuo 1 iki 3, labiausia nuo 1 iki 2 anglies atomų.

Cikloalkilas yra ciklopropilas, ciklobutilas, ciklopentilas arba cikloheksilas, dažniausia ciklopropilas.

Alkilas - savaime kaip grupė, o taip pat kitų grupių ir junginių struktūrinis elementas, kaip antai fenilalkilo, halogenalkilo, alkoksi, halogenalkoksi, alkiltio ir halogenalkiltio - yra, atitinkamai atsižvelgiant į tuo atveju atitinkamoje grupėje arba junginyje esančių anglies atomų skaičių, arba tiesios grandinės, t.y. metilas, etilas, propilas, butilas, pentilas arba heksilas, arba šakotas, pvz. izopropilas, izobutilas, antrinis butilas, tretinis butilas, izopentilas, neopentilas arba izoheksilas.

Alkenilas, halogenalkenilas, alkinilas ir halogenalkinilas yra tiesios grandinės arba šakoti ir turi, atitinkamai, dvi arba dažniausia vieną nesočią anglis-anglis jungtį (jungtis). Šių pakaitų dvigubos arba trigubos jungtys nuo I formulės junginio likusios dalies dažniausia yra atskirtos sočiu anglies atomu. Kaip pavyzdžius galima paminėti alilą, metalilą, but-2-enilą, but-3-enilą, propargilą, but-2-inilą ir but-3-inilą.

Anglį turinčios grupės ir junginiai su halogeno pakaitu, kaip halogenalkilas, halogenalkiltio, halogenalkoksi, halogenciklopropil, halogenalkenil, halogenalkinil, halogenaliloksi ir halogenaliltio, gali būti dalinai halogenintos arba perhalogenintos, prie to keliagubo halogeninimo atveju halogeno pakaitalai gali būti vienodi arba skirtingi. Halogenalkilų pavyzdžiai - savaime kaip grupė, o taip pat kitų grupių ir junginių struktūrinis elementas, kaip antai halogenalkiltio ir halogenalkoksi - yra nuo vieno iki trijų fluoro, chloro ir/arba bromo pakaitalų turintis metilas, kaip CHF_2 arba CF_3 ; nuo vieno iki penkių fluoro, chloro ir/arba bromo pakaitalų turintis etilas, kaip CH_2CF_3 , CF_2CF_3 , CF_2CCl_3 , CF_2CHCl_2 , CF_2CHF_2 , CF_2CFCl_2 , CF_2CHBr_2 , CF_2CHClF , CH_2CHBrF arba CClFCHClF ; nuo vieno iki septynių fluoro, chloro ir/arba bromo pakaitalų turintis propilas arba izopropilas, kaip $\text{CH}_2\text{CHBrCH}_2\text{Br}$, $\text{CF}_2\text{CHFCH}_2\text{F}$, $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$, $\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ arba $\text{CH}(\text{CF}_3)_2$; ir nuo vieno iki devynių fluoro, chloro ir/arba bromo pakaitalų turintis butilas arba vienas iš jo izomerų, kaip

$\text{CF}(\text{CF}_3)\text{CHF}\text{CF}_3$, $\text{CF}_2(\text{CF}_2)_2\text{CF}_3$ arba $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_2\text{CF}_3$. Halogenalkenilų pavyzdžiai yra 2,2-difluoreten-1-il, 2,2-dichloreten-1-il, 2-chlorprop-1-en-3-il, 2,3-dichlorprop-1-en-3-il ir 2,3-dibromprop-1-en-3-il. Halogenalkinilų pavyzdžiai yra 2-chlorprop-1-in-3-il, 2,3-dichlorprop-1-in-3-il ir 2,3-dibromprop-1-in-3-il. Halogenciklopropilų pavyzdžiai yra 2-chlorciklopropilas, 2,2-difluorciklopropilas ir 2-chlor-2-fluor-ciklopropilas. Halogenaliloksi pavyzdžiai yra 2-chlorprop-1-en-3-iloksi, 2,3-dichlorprop-1-en-3-iloksi ir 2,3-dibromprop-1-en-3-iloksi. Halogenaliltio pavyzdžiai yra 2-chlorprop-1-en-3-iltio, 2,3-dichlorprop-1-en-3-iltio ir 2,3-dibromprop-1-en-3-iltio.

Fenilalkilas yra prie I formulės junginio prisijungusi alkilo grupė, turinti fenilo pakaitų, kur alkilo grupė dažniausiai turi tiesią grandinę ir fenilo grupė prie alkilinės grupės yra prisijungusi aukštesnėje negu α padėtyje, labiausiai ω padėtyje; pavyzdžiai yra benzilas, 2-feniletilas ir 4-fenilbutilas.

Išradimo ribose turinčios pirmenybę atlikimo formos yra šios:

(1) I formulės junginys, kur

A žymi neturinčią pakaitų arba turinčią nuo vieno iki keturių pakaitų, aromatinę arba nearomatinę, monociklinę arba diciklinę, heterociklinę liekaną, prie to nuo vieno iki dviejų A pakaitų gali būti pasirinkti iš grupės, susidedančios iš halogen- C_1 - C_3 -alkilo, ciklopropilo, halogenciklopropilo, C_2 - C_3 -alkenilo, C_2 - C_3 -alkinilo, halogen- C_2 - C_3 -alkenilo, halogen- C_2 - C_3 -alkinilo, halogen- C_1 - C_3 -alkoksi, C_1 - C_3 -alkiltio, halogen- C_1 - C_3 -alkiltio, aliloksi, propargiloksi, aliltio, propargiltio, halogenaliloksi, halogenaliltio, ciano ir nitro, ir nuo vieno iki keturių A pakaitų gali būti pasirinkti iš grupės, susidedančios iš C_1 - C_3 -alkilo, C_1 - C_3 -alkoksi ir halogeno;

R žymi vandenilį, C_1 - C_6 -alkilą, fenil- C_1 - C_4 -alkilą, C_3 - C_6 -cikloalkilą, C_2 - C_6 -alkenilą arba C_2 - C_6 -alkinilą; ir

X žymi N-NO_2 arba N-CN ;

(2) I formulės junginys, kur A žiedinis pagrindinis karkasas sudarytas iš žiedo su 5 arba 6 nariais, prie kurio gali būti prisijungęs kitas žiedas su 5 arba 6 nariais,

ypač tinka žiedas su 5 nariais arba dažniausia su 6 nariais;

(3) I formulės junginys, kur A žiedinis pagrindinis karkasas yra nesotus, ypač turįs dvigubą jungtį arba dažniausia nuo 2 iki 4,

pirmenybę turinčių konjuguotų dvigubų jungčių,

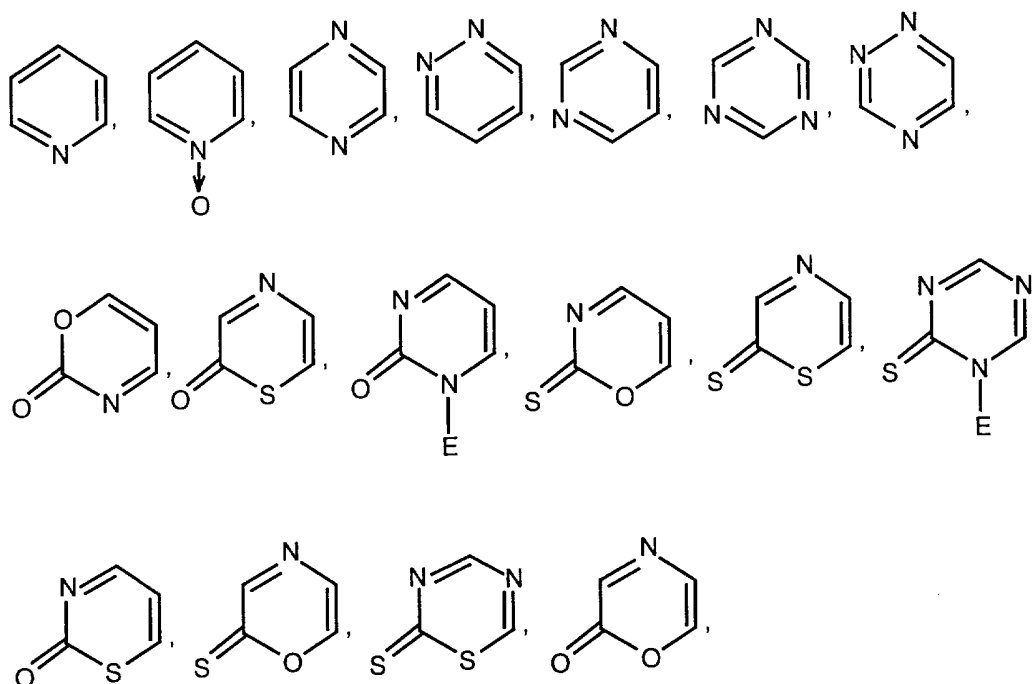
pirmenybę turi junginys su 2, dažniausia konjuguotomis, dvigubomis jungtimis,

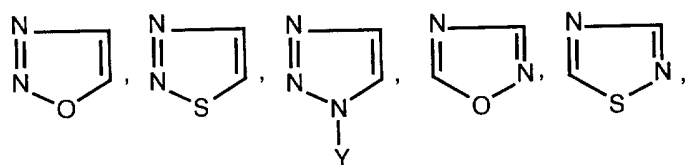
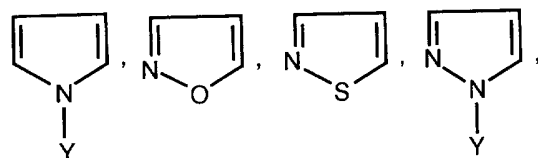
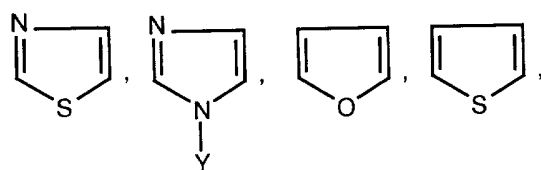
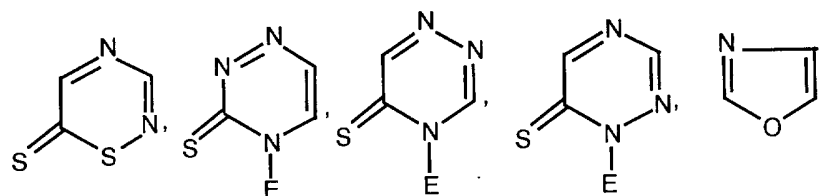
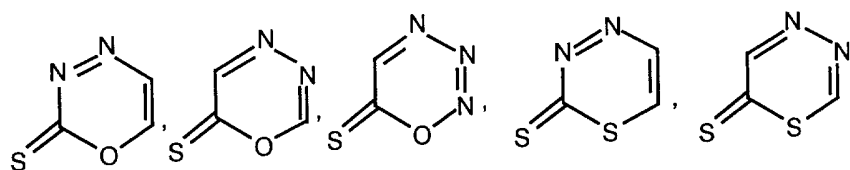
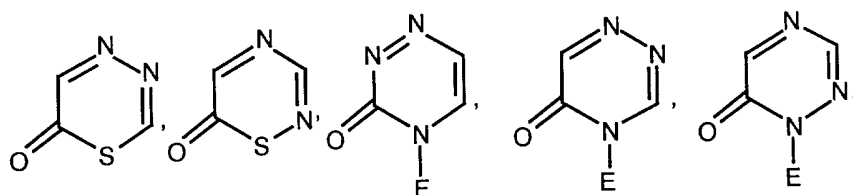
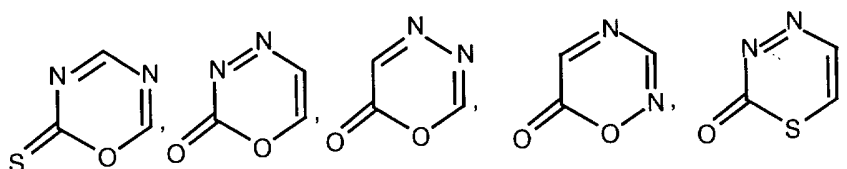
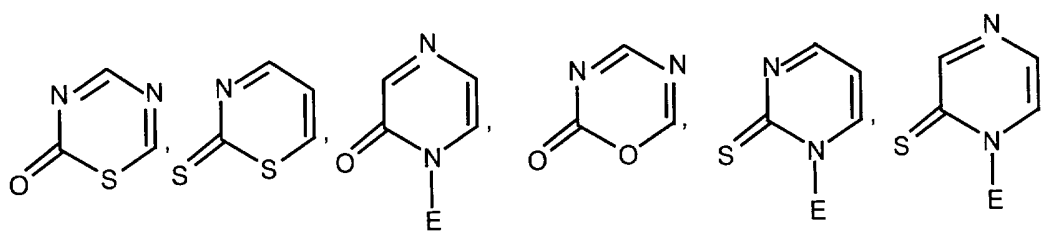
ypač pasižymintis aromatinium charakteriu;

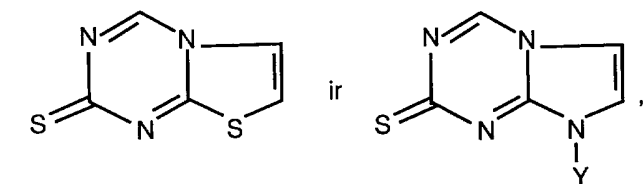
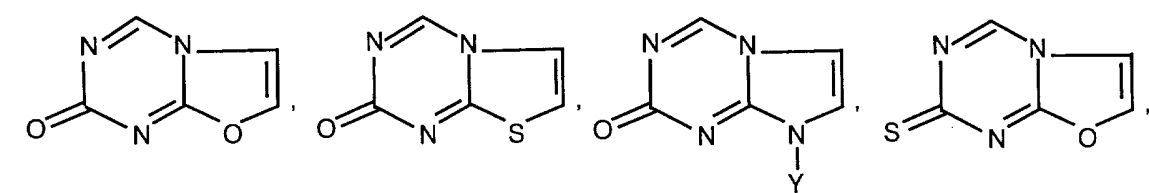
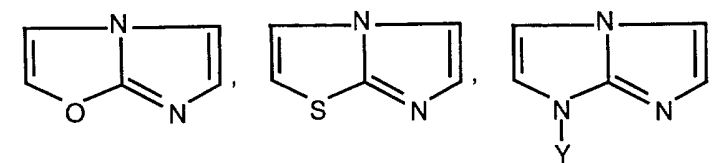
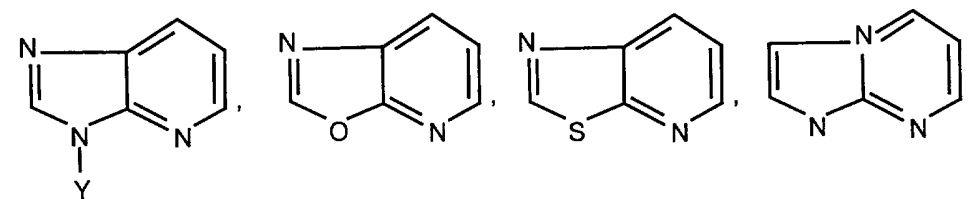
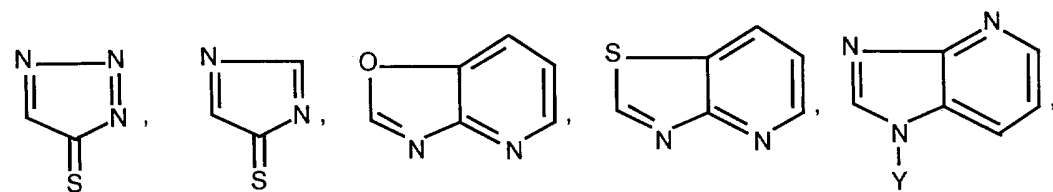
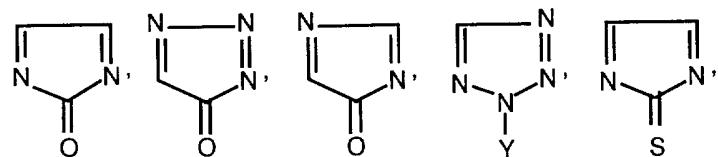
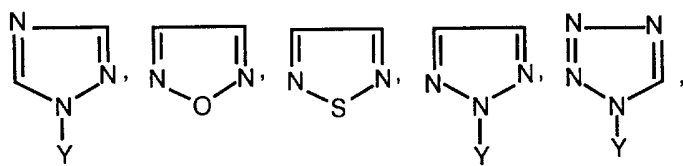
(4) I formulės junginys, kur A žiedinis pagrindinis karkasas turi nuo 1 iki 4, ypač nuo 1 iki 3, visų pirma 1 arba 2 heteroatomus,

ypatingą pirmenybę turi 1 heteroatomas;

(5) I formulės junginys, kur A žiedinis pagrindinis karkasas išrenkamas iš grupės, susidedančios iš žiedinių pagrindinių karkasų







kur E, atitinkamai, yra C₁-C₃-alkilas, Y, atitinkamai, yra vandenilis, C₁-C₃-alkilas arba ciklopropilas ir E arba Y, atitinkamai, nėra A pakaitalai, o yra priskiriami A žiediniam pagrindiniam karkasui;

(6) I formulės junginys, kur A žiedinis pagrindinis karkasas turi 1, 2 arba 3 heteroatomus, išrinktus iš grupės, susidedančios iš deguonies, sieros ir azoto, prie to iš žiediniame pagrindiniame karkase esančių heteroatomų daugiausiai vienas atomas yra deguonies atomas ir iš žiediniame pagrindiniame karkase esančių heteroatomų daugiausiai vienas yra sieros atomas,

ypač turi 1, 2 arba 3 heteroatomus, išrinktus iš grupės, susidedančios iš deguonies, sieros ir azoto, prie to iš pagrindiniame žiediniame karkase esančių heteroatomų daugiausiai vienas yra deguonies arba sieros atomas,

dažniausia mažiausiai vienas azoto atomas.

(7) I formulės junginys, kur A yra susijungęs su likusia I formulės junginio dalimi per savo žiedinio pagrindinio karkaso C atomą;

(8) I formulės junginys, kur A neturi pakaitalų arba turi vieną arba du pakaitus, išrinktus iš grupės, susidedančios iš halogeno, C₁-C₃-alkilo, halogen-C₁-C₃-alkilo, C₁-C₃-alkoksi ir halogen-C₁-C₃-alkoksi, dažniausia neturi pakaitų arba turi vieną arba du pakaitus, išrinktus iš grupės, susidedančios iš halogeno ir C₁-C₃-alkilo;

(9) I formulės junginys, kur A žiedinis pagrindinis karkasas yra piridilo, 1-oksipiridino arba tiazolilo grupė,

dažniausia A žiedinis pagrindinis karkasas yra pirid-3-il, 1-oksido-3-piridinio arba tiazol-5-il grupė,

labiausia A yra pirid-3-il, 2-halogenpirid-5-il, 2,3-dihalogenpirid-5-il, 2-C₁-C₃-alkilpirid-5-il, 1-oksido-3-piridinio, 2-halogen-1-oksido-5-piridinio, 2,3-dihalogen-1-oksido-5-piridinio arba 2-halogentiazol-5-il grupė,

visų pirma, A yra pirid-3-il, 2-halogenpirid-5-il, 2-halogen-1-oksido-5-piridinio arba 2-halogentiazol-5-il grupė,

dažniausia A yra 2-chlorpirid-5-il, 2-metilpirid-5-il, 1-oksido-3-piridinio, 2-chlor-1-oksido-5-piridinio, 2,3-dichlor-1-oksido-5-piridinio arba 2-chlortiazol-5-il grupė,

visų pirma, pirid-3-il, 2-chlorpirid-5-il, 2-chlor-1-oksido-5-piridinio arba 2-chlortiazol-5-il grupė,

labiausiai A yra 2-chlorpirid-5-il arba dažniausia 2-chlortiazol-5-il grupė.

(10) I formulės junginys, kur R yra C₁-C₆-alkilas, fenil-C₁-C₄-alkilas, C₃-C₆-cikloalkilas, C₃-C₄-alkenilas arba C₃-C₄-alkinilas;

visų pirma, C₁-C₆-alkilas, C₃-C₆-cikloalkilas, C₃-C₄-alkenilas arba C₃-C₄-alkinilas, dažniausia C₁-C₆-alkilas, fenil-C₁-C₄-alkilas, C₃-C₄-alkenilas arba C₃-C₄-alkinilas, labiausiai C₁-C₄-alkilas, dažniausia metilas.

(11) I formulės junginys, kur X yra N-NO₂;

(12) I formulės junginys, kur A žymi per savo žiedinio pagrindinio karkaso C atomą su likusia I formulės junginio dalimi susijungusią, neturinčią pakaitų arba turinčią vieną arba du pakaitus, išrinktus iš grupės, susidedančios iš halogeno ir C₁-C₃-alkilo, piridilo, 1-oksido-piridinio arba tiazolilo grupę, R žymi C₁-C₆-alkilą, fenil-C₁-C₄-alkilą, C₃-C₆-cikloalkilą, C₃-C₄-alkenilą arba C₃-C₄-alkinilą ir X žymi N-NO₂ arba N-CN;

(13) I formulės junginys, kur A žymi 2-chlorpirid-5-il, 2-metilpirid-5-il, 1-oksido-3-piridinio, 2-chlor-1-oksido-5-piridinio, 2,3-dichlor-1-oksido-5-piridinio arba 2-chlortiazol-5-il grupę, R žymi C₁-C₄-alkilą ir X žymi N-NO₂;

(14) I formulės junginys, kur A žymi 2-chlortiazol-5-il arba 2-chlorpirid-5-il grupę, R žymi C₁-C₄-alkilą ir X žymi N-NO₂.

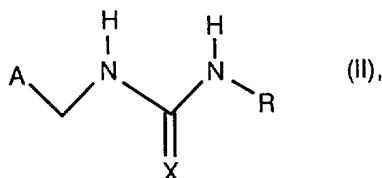
Pagal išradimą ypatingą pirmenybę turi H3 ir H4 pavyzdžiuose išvardinti I formulės junginiai.

Pagal išradimą pirmenybę turi šių pavadinimų junginiai:

- a) 5-(2-chlorpirid-5-ilmetil)-3-metil-4-nitroimino-perhidro-1,3,5-oksadiazinas,
- b) 5-(2-chlortiazol-5-ilmetil)-3-metil-4-nitroimino-perhidro-1,3,5-oksadiazinas,
- c) 3-metil-4-nitroimino-5-(1-oksido-3-piridiniometil)-perhidro-1,3,5-oksadiazinas,
- d) 5-(2-chlor-1-oksido-5-peridiniometil)-3-metil-4-nitroimino-perhidro-1,3,5-oksadiazinas ir
- e) 3-metil-5-(2-metilpirid-5-ilmetil)-4-nitroimino-perhidro-1,3,5-oksadiazinas.

Tolesnis išradimo objektas yra I formulės junginių arba, esant reikalui, jų tautomerų, atsižvelgiant į aplinkybes, laisvoje arba druskų formoje gavimo būdas, besiskiriantis pvz., tuo, kad

- a) žemiau pateiktos formulės junginys



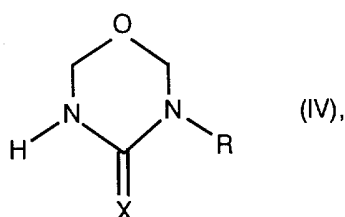
kuris yra žinomas arba gali būti gautas pagal analogiją su atitinkamais žinomais junginiais ir kur A, R ir X žymėjimai yra tokie patys, kaip I formulės atveju, arba jo tautomeras ir/arba jo druska, reaguoja, dažniausia esant bazei arba dar rūgštiniam katalizatoriui, su formaldehidu arba paraformaldehidu arba

- b) I formulės, kur R nėra vandenilis, junginio arba, reikalui esant, jo tautomero ir/arba druskos gavimui, pvz., pagal a) arba c) variantą, gaunamas I formulės, kur R yra vandenilis, junginys arba jo tautomeras ir/arba druska reaguoja, dažniausia esant bazei, su žemiau pateiktos formulės junginiu

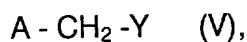


kuris yra žinomas arba gali būti gautas pagal analogiją su atitinkamais žinomais junginiais ir kur R žymėjimai yra tokie patys, išskyrus vandenilį, kaip I formulės atveju ir Y žymi atskylandčią grupę arba

c) žemiau pateiktos formulės junginys



kur R ir X žymėjimai yra tokie patys, kaip I formulės atveju, arba jo tautomeras ir/arba druska reaguoja, esant bazei, su žemiau pateiktos formulės junginiu



kuris yra žinomas arba gali būti gautas pagal analogiją su atitinkamais žinomais junginiais ir kur A žymėjimas yra toks pat, kaip I formulės atveju, ir Y žymi atskylandčią grupę, arba, esant reikalui, su jo tautomeru ir/arba druska

ir/arba, jei norima, pagal gavimo būdą ar kitu būdu gautas I formulės junginys arba jo tautomeras, atsižvelgiant į aplinkybes, laisvoje arba druskos formoje yra pervedamas į kitą I formos junginį arba jo tautomerą, atskiriamas pagal gavimo būdą gautas izomerų mišinys ir norimas izomeras išskiriamas ir/arba pagal gavimo būdą ar kitu būdu gautas laisvas I formulės junginys arba jo tautomeras pervedamas į druską, arba pagal gavimo būdą ar kitu būdu gauta I formulės junginio druska arba jo tautomeras pervedama į laisvą I formulės junginį arba jo tautomerą arba į kitą druską.

Analogiškai tas pats galioja aukščiau ir žemiau pateiktoms pradinėms medžiagoms, jų tautomerams ir/arba druskoms, aukščiau paminėtiems I formulės junginių tautomerams ir/arba druskoms.

Aukščiau ir žemiau aprašytos reakcijos yra vykdomos įprastiniu būdu, pvz., nesant arba paprastai esant tinkamam tirpikliui arba skiedikliui arba jų mišiniui, prie to dirbama, esant reikalui, šaldant kambario temperatūroje arba šildant, pvz., temperatūrų intervale nuo apie -80°C iki reakcijos mišinio virimo temperatūros, dažniausia nuo apie -20°C iki apie $+150^{\circ}\text{C}$, ir, jei reikia, uždaramame inde, po slėgiu, inertinėje atmosferoje ir/arba bevandenėje terpėje. Ypatingai palankios reakcijos sąlygas galima pamatyti pavyzdžiuose.

Aukščiau ir žemiau pateiktos pradinės medžiagos, kurios naudojamos I formulės junginių arba, atsižvelgiant į aplinkybes, jų tautomerų, atitinkamai laisvoje arba druskos formoje gavimui, yra žinomos arba gali būti gautos žinomais metodais, pvz., atsižvelgiant į reikalaujamas charakteristikas.

a) Variantas:

Reakcijos palengvinimui tinkamomis bazėmis yra pvz., šarminių arba žemės šarminių metalų hidroksidai, hidratai, amidai, alkanoliatai, acetatai, karbonatai, dialkilamidai arba alkilsililamidai, alkilaminai, alkilendiaminai, atsižvelgiant į aplinkybes, N-alkilinti, atsižvelgiant į aplinkybes, nesotūs, cikloalkilaminai, beziniai, heterociklenai, amonio hidroksidas, o taip pat karbocikliniai aminai. Kaip pavyzdines bazes reikia paminėti natrio hidroksidą, hidridą, amidą, metanoliatą, acetatą, karbonatą, kalio tretinį butanoliatą, hidroksidą, karbonatą, hidridą, ličio diizopropilamidą, kalio-bis(trimetilsilil)-amidą, kalcio hidridą, trietilaminą, diizopropil-etil-aminą, trietilendiaminą, cikloheksilaminą, N-cikloheksil-N,N-dimetil-aminą, N,N-dietilaniliną, piridiną, 4-(N,N-dimetilamino)piridiną, chinuklidiną, N-metilmorfoliną, benzil-trimetil-amonio hidroksidą, o taip pat 1,5-diazabiciklo/5.4.0/undek-5-en (DBU).

Reakcijos palengvinimui tinkamais rūgštiniais katalizatoriais yra pvz., tokios, katalitiniais kiekiais paimtos rūgštys, kurios prieš tai buvo paminėtos kaip tinkamos konjuguotų druskų sudarymui su I formulės junginiais.

Reakcijos partneriai paprasčiausiai gali reaguoti tarpusavyje, t.y. papildomai nepridedant tirpiklio arba skiediklio, pvz., lydale. Tačiau dažniausia naudinga yra pridėti inertinį tirpiklį arba skiediklį, arba jų mišinį. Kaip tokių tirpiklių arba skiediklių pavyzdžius reikia paminėti: aromatinius, alifatinius ir aliciklinius angliavandenilius ir halogenintus angliavandenilius, kaip benzenas, toluenas, ksilenas, mezitilenas, tetralinas, chlorbenzenas, dichlorbenzenas, brombenzenas, petrolio eteris, heksanas, cikloheksanas, dichlormetanas, trichlormetanas, tetrachlormetanas, dichloretanas, trichloretanas arba tetrachloretanas; esterius, kaip acto rūgšties arba etilo esteris; eterius, kaip dietilo eteris, dipropilo eteris, diizopropilo eteris, dibutilo eteris, tretinis butilmetilo eteris, etilenglikolio monometilo eteris, etilenglikolio monoetilo eteris, etilenglikolio dimetilo eteris, dimetoksidietilo eteris, tetrahidrofuranas arba dioksanas; ketonus, kaip acetonas, metiletilketonas arba metilizobutilketonas; alkoholius, kaip metanolis, etanolis, propanolis, izopropanolis, butanolis, etilenglikolis arba glicerinas; amidus, kaip N,N-dimetilformamidas, N,N-dietilformamidas, N,N-dimetilacetamidas, N-metilpirolidonas arba heksametilfosforo rūgšties triamidas; nitrilus, kaip acetonitrilas arba propiotrinitrilas; ir sulfoksidus, kaip dimetilsulfoksidas. Jei reakcija vykdoma esant bazei, tai tirpikliais arba skiedikliais gali būti pertekliuje paimtos bazės, kaip trietilaminas, piridinas, N-metilmorfolinas arba N,N-dietilanilinas. Jei reakcija vykdoma esant rūgštiniam katalizatoriui, tai tirpikliais arba skiedikliais gali būti pertekliuje paimtos rūgštys, pvz., stiprios organinės karboksirūgštys, kaip, reikalui esant, pvz., turinčios halogeno pakaitą C₁-C₄-alkankarboksirūgštys, pvz., skruzdžių rūgštis, acto rūgštis arba propano rūgštis.

Palankiausiai reakcija vyksta temperatūrų intervale nuo apie 0° C iki apie +180° C, pirmenybę turi temperatūrų intervalas nuo apie +10° C iki apie +130° C, daugeliu atvejų intervale tarp kambario temperatūros ir reakcijos mišinio virimo temperatūros.

Reakcijos metu susidarantis vanduo, atsižvelgiant į aplinkybes, gali būti pašalintas panaudojant vandens atskyrėją, acetropinės distiliacijos pagalba ir panaudojant tinkamą molekulinį sieta.

b) Variantas:

III formulės junginiuose atskyrančios grupės Y yra pvz., hidroksi, C₁-C₈-alkoksi, halogen-C₁-C₈-alkoksi, C₁-C₈-alkanoiloksi, merkaptio, C₁-C₈-alkiltio, halogen-C₁-C₈-alkiltio, C₁-C₈-alkansulfoniloksi, halogen-C₁-C₈-alkansulfoniloksi, benzolsulfoniloksi, toluensulfoniloksi ir halogenas.

HY atskėlimo palengvinimui tinkamomis bazėmis yra pvz., iš a) variante pateiktų bazių rūšies.

Reakcijos partneriai paprasčiausiai gali reaguoti tarpusavyje, t.y. papildomai nepridedant tirpiklio arba skiediklio, pvz., lydale. Tačiau dažniausia naudinga yra pridėti inertinį tirpiklį arba skiediklį, arba jų mišinį. Kaip tokių tirpiklių arba skiediklių pavyzdžius reikia paminėti: aromatinčius, alifatinius ir aliciklinius angliavandenilius ir halogenintus angliavandenilius, kaip benzenas, toluenas, ksilenas, meztilenas, tetralinas, chlorbenzenas, dichlorbenzenas, brombenzenas, petrolio eteris, heksanas, cikloheksanas, dichlormetanas, trichlormetanas, tetrachlormetanas, dichlorešanas, trichlorešanas arba tetrachlorešanas; esterius, kaip acto rūgšties etilo esteris; eterius, kaip dietilo eteris, dipropilo eteris, diizopropilo eteris, dibutilo eteris, tretinis butilmetilo eteris, etilenglikolio monometilo eteris, etilenglikolio monoetilo eteris, etilenglikolio dimetilo eteris, dimetoksietilo eteris, tetrahidrofuranas arba dioksanas; ketonus, kaip acetonas, metiletilketonas arba metilizobutilketonas, alkoholius, kaip

metanolis, etanolis, propanolis, izopropanolis, butanolis, etilenglikolis ir glicerinas; amidus, kaip N,N-dimetilformamidas, N,N-dietilformamidas, N,N-dimetilacetamidas, N-metilpirolidonas arba heksametilfosforo rūgšties triamidas; nitrilus, kaip acetonitrilas arba propionitrilas; ir sulfoksidus, kaip dimetilsilfoksidas. Jei reakcija vykdoma esant bazei, tai tirpikliais arba skiedikliais gali būti pertekliuje paimtos bazės, kaip trietilaminas, piridinas, N-metilmorfolinas arba N,N-dietilanilinas.

Palankiausiai reakcija vyksta temperatūrų intervale nuo apie 0° C iki apie +180° C, pirmenybę turi temperatūrų intervalas nuo apie +10° C iki apie +130° C, daugeliu atvejų intervale tarp kambario temperatūros ir reakcijos mišinio virimo temperatūros.

c) Variantas:

V formulės junginiuose tinkamos atskylandčios grupės Y yra pvz., iš b) variante pateiktųjų rūšių.

Tinkamos bazės, palengvinančios HY atskilimą, yra pvz., iš a) variante pateiktųjų rūšių.

Reakcijos partneriai paprasčiausiai gali reaguoti tarpusavyje, t.y. papildomai nepridedant tirpiklio arba skiediklio, pvz., lydale. Tačiau dažniausia naudinga yra pridėti inertinį tirpiklį arba skiediklį, arba jų mišinį. Tinkami tirpikliai arba skiedikliai yra pvz., iš b) variante pateiktųjų rūšių.

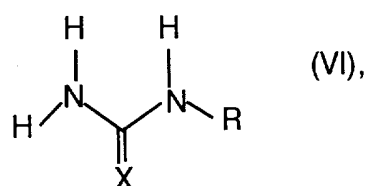
Palankiausia reakciją vykdyti temperatūrų intervale nuo apie -20° C iki apie +180° C, pirmenybę turi intervalas nuo apie +10° C iki +100° C, daugeliu atvejų intervale tarp kambario temperatūros ir reakcijos mišinio virimo temperatūros.

Daugelis būdo c) variante išieginėmis medžiagomis panaudotų IV formulės junginių ir jų tautomerų, atsižvelgiant į aplinkybes, laisvoje arba druskos formoje, yra nauji ir taip pat yra išradimo objektas. Išradimo

ribose ypatingą pirmenybę turi H1 ir H2 pavyzdžiuose išvardinti IV formulės junginiai ir jų tautomerai.

Kitas išradimo objektas yra IV formulės junginių arba jų tautomerų, atsižvelgiant į aplinkybes, laisvoje arba druskų formoje, pvz., besisikiriantis tuo, kad

d) žemiau pateiktos formulės junginys



kuris yra žinomas arba gali būti gautas pagal analogiją su žinomais junginiais ir kur R ir X žymėjimai yra tokie patys, kaip ir I formulės atveju, arba jo tautomeras ir/arba druska reaguoja su formaldehidu arba paraformaldehidu, pvz., analogišku būdu, kaip tai a) variante aprašyta atitinkamai II formulės junginio arba jo tautomero ir/arba druskos reakcijai su formaldehidu arba paraformaldehidu, arba

e) IV formulės junginio, kur R nėra vandenilis, arba jo tautomero ir/arba druskos gavimui IV formulės junginys, kur R yra vandenilis, arba jo tautomeras ir/arba druska, gaunami pvz., pagal d) variantą, reaguoja su pateiktos formulės junginiu



kuris yra žinomas arba gali būti gautas pagal analogiją su žinomais junginiais ir kur R žymėjimai, išskyrus vandenilį, yra tokie patys, kaip ir I formulės atveju, ir Y yra atskylanti grupė, pvz., analogišku būdu kaip tai b) variante aprašyta atitinkamai I formulės junginio arba, esant reikalui, jo tautomero ir/arba druskos reakcijai su III formulės junginiu, ir/arba, jei pageidaujama, pagal gavimo būdą ar kitoku būdu gautas IV formulės

junginys arba jo tautomeras, atitinkamai, laisvoje arba druskos formoje, yra pervedamas į kitą IV formulės junginį arba jo tautomerą, pagal gavimo būdą gautas izomerų mišinys atskiriamas ir išskiriamas, ir/arba pagal gavimo būdą arba kitu būdu gautas IV formulės junginys arba jo tautomeras yra pervedamas į druską, arba pagal gavimo būdą ar kitu būdu gauta IV formulės junginio arba jo tautomero druska yra pervedama į laisvą IV formulės junginį arba jo tautomerą, arba į kitą druską.

Pagal gavimo būdą ar kitu būdu gautas I arba IV formulės junginys žinomu būdu gali būti pervestas į kitą I arba IV formulės junginį, kur vienas arba keli pradinio I arba IV formulės junginio pakaitai įprastu būdu pakeičiami vienu ar keliais kitais atitinkančiais išradimą pakaitais.

Pavyzdžiui:

- I formulės junginyje su neturinčia pakaitų A liekana į A liekaną gali būti įvesti pakaitai; arba

- I formulės junginyje su turinčia pakaitus A liekana A liekanos pakaitai gali būti pakeisti kitais pakaitais.

Atsižvelgiant į aplinkybes, priklausomai nuo tam tinkamų reakcijos sąlygų ir pradinių medžiagų, yra įmanoma vienoje reakcijos stadijoje pakeisti tik vieną pakaitą kitu išradimą atitinkančiu pakaitu, arba toje pačioje reakcijos stadijoje gali būti keli pakaitai pakeisti kitais atitinkančiais išradimą pakaitais.

I arba IV formulės junginiai gali būti gauti žinomu būdu. Taip, pavyzdžiui, I arba IV formulės junginių konjuguotos druskos yra gaunamos apdorojant tinkama rūgštimi arba jonų mainų reagentu, o druskos su bazėmis yra gaunamos tinkama baze arba jonų mainų reagentu.

I arba IV formulės junginių druskos įprastu būdu gali būti pervestos į laisvus I arba IV formulės junginius, konjuguotas druskas, pvz., apdorojant tinkama bazine priemone arba tinkamu jonų mainų reagentu, į druskas su

bazėmis, pvz., apdorojant tinkama rūgštimi arba tinkamu jonų mainų reagentu.

I arba IV formulės junginiai žinomu būdu gali būti pervesti kitomis I arba IV formulės druskomis, konjuguotos druskos, pavyzdžiui, kitomis konjuguotomis druskomis, pvz., apdorojant druską tokia neorganinė rūgštimi, kaip vandenilio chloridas, arba apdorojant tokia tinkama metalo druska, kaip natrio, bario arba sidabro druska, arba apdorojant rūgštimi, pvz., su sidabro acetatu, tinkamame tirpiklyje, kuriame susidaranti neorganinė druska, pvz., sidabro chloridas, yra netirpi ir tuo pačiu reakcijos mišinyje iškrenta į nuosėdas.

Priklausomai nuo gamybos būdo arba reakcijos sąlygų gali būti gauti I arba IV formulės junginiai su druskos sudarančiomis savybėmis laisvoje formoje arba druskų formoje.

I arba IV formulės junginiai ir, atsižvelgiant į aplinkybes, jų tautomerai, atitinkamai, laisvoje arba druskų formoje, gali būti įmanomo izomero formoje arba kaip jų mišinys, pvz., priklausomai nuo skaičiaus, absoliučios ir santykinės molekulėje esančių asimetrinių anglies atomų konfigūracijos ir/arba nuo konfigūracijos molekulėje esančių nearomatinių dvigubų jungčių, kaip grynų izomerai, tokie kaip antipodai ir/arba diastereomerai, kaip eanantiomerų mišiniai, pvz., racematai, diastereomerų mišiniai arba racematų mišiniai; išradimas apima kaip grynus izomerus, taip ir visus įmanomus izomerų mišinius; ir, atitinkamai, tą reikia suprasti, jei stereomeriniai vienetai nėra minimi kiekviename atskirame atvejuje.

Pagal gamybos būdą - priklausomai nuo pradinių medžiagų ir darbo būdo - arba kitaip gaunamų I arba IV formulės junginių, laisvoje arba druskų formoje, diastereomerų mišiniai ir racematų mišiniai dėl sudėtinių dalių fizikinių-cheminių savybių skirtumų gali būti perskirti į grynus diastereomerus arba racematus, pavyzdžiui, frakcinės kristalizacijos, distiliacijos ir/arba chromatografijos pagalba.

Atitinkamai gaunamus enantiomerų mišinius, kaip racematai, galima žinomais metodais padalinti į optinius antipodus, pavyzdžiui, pasinaudojant perkristalinimu iš optiškai aktyvaus tirpiklio, chromatografija ant chiralinių adsorbentų, pvz., aukšto slėgio skysčių chromatografija (HPLC) ant acetilceliuliozės, panaudojant tinkamus mikroorganizmus, skaidant specifiniais imobilizuotais enzimais, susidarant prisijungimo junginiams, pvz., panaudojant chiralinius kraun-eterius, kur kompleksinamas tik vienas enantiomeras, arba pervedant į diastereomerines druskas, pvz., reaguojant baziniam galutiniam racematui su tokia optiškai aktyvia karboksirūgštimi, kaip pvz., kamparo, vyno arba obuolių rūgštis, arba tokia sulforūgštimi, kaip kamparo sulforūgštis, ir atskiriant tuo būdu gauta diastereomerų mišinį, pvz., dėl jų skirtingo tirpumo, frakcine kristalizacija į diastereomeras, iš kurių gali būti išskirtas norimas enantiomeras, veikiant tinkama, pvz., bazine, priemone.

Be atitinkamo izomerų mišinių perskyrimo, gryni diastereomerai, pvz., enantiomerai, pagal išradimą gali būti gauti taip pat ir visų žinomais diastereoselektyvios arba enantioselektyvios sintezės metodais, pvz., kur atitinkantis išradimą būdas su aduktais yra įgyvendinamas atitinkamai pritaikytos stereochemijos pagalba.

Jei atskiri komponentai pasižymi skirtingu biologiniu veikimu, tai naudinga yra sintetinti arba atskirti biologiškai aktyvų izomerą, pvz., enantiomerą arba diastereomerą, arba izomerų mišinį, pvz., enantiomerų arba diastereomerų mišinį.

I arba IV formulės junginiai, laisvoje arba druskų formoje, taip pat gali būti gauti jų hidratų formoje ir/arba kitoje formoje turinčioje tirpiklį, kuris, esant reikalui, buvo panaudotas kietoje formoje esančio junginio kristalizacijai.

Išradimo objektas yra visos gavimo būdo realizavimo formos, kuriose kurioje nors gamybos būdo stadijoje yra naudojamas kaip pradinis produktas arba susidaro kaip tarpinis produktas gaunamasis junginys, arba kaip pradinė forma yra naudojamas šio junginio darinys arba druska

ir/arba racematai arba antipodai ir ypač jei jie susidaro reakcijos sąlygomis.

Pirmenybę turintis išradimo objektas yra H1-H4 gavimo pavyzdžiuose gavimo būdai.

Pagal išradimą I formulės junginio arba jo druskos gavimui naudotos pradinės medžiagos ir tarpiniai produktai, atitinkamai laisvoje arba druskų formoje, kurie yra nauji, o taip pat jų gavimo būdas, jų panaudojimas pradiniais arba tarpiniais produktais I formulės junginio gavime yra taip pat išradimo objektas, ypač tai susiję su IV formulės junginiu.

Išradimą atitinkantys I formulės junginiai, kuriuos palankiai perneša šiltakraujai, žuvis ir augalai, kovos su kenkėjais srityje jau ir nedidelėse panaudojimo koncentracijose pasižymi kaip vertingos prevencinės arba gydomosios biologiškai aktyvios medžiagos su plačiu biocidiniu spektru. Išradimą atitinkančios biologiškai aktyvios medžiagos yra veiksmingos visoms arba atskiroms tokių gyvulinių kenkėjų, kaip vabzdžiai, išsivystymo stadijoms nuo normaliai jautrių iki atsparių formų. Išradimą atitinkančių biologiškai aktyvių medžiagų insekticidinis veikimas gali pasireikšti tiesiogiai, t.y. užmušant kenkėjus, kai mirtis įvyksta iš karto arba po tam tikro laiko, pavyzdžiui, po išsinėrimo, arba netiesiogiai, pvz., sumažėjant kiaušinėlių dėjimui arba mitybai, kur geras veikimas atitinka mažiausiai 50-60 % užmušimo (mirtingumo) laipsnių.

Tokiems paminėtiems gyvuliniams kenkėjams, pavyzdžiui, priklauso:

pavyzdžiui iš *Lepidoptera* eilės

Acleris spp., *Adoxophyes* spp., *Aegeria* spp., *Agrotis* spp., *Alabama argillaceae*, *Amylois* spp., *Anticarsia gemmatilis*, *Archips* spp., *Argyrotaenia* spp., *Autographa* spp., *Busseola fusca*, *Cadra cautella*, *Carposina nipponensis*, *Chilo* spp., *Choristoneura* spp., *Glysia ambiguella*, *Cnaphalocrocis* spp., *Cnephasia* spp., *Cochylis* spp., *Coleophora* spp., *Crociodolomia binotalis*, *Cryptophlebia leucotreta*, *Cydia*

spp., Diatraea spp., Diparopsis castanea, Earias spp., Ephestia spp., Eucosma spp., Eupoecilia ambiguella, Euproctis spp., Euxoa spp., Grapholita spp., Hedya nubiferana, Heliothis spp., Hellula undalis, Hyphantria cunea, Keiferia lycopersicella, Leucoptera scitella, Lithocollethis spp., Lobesia botrana, Lymantria spp., Lyonetia spp., Malacosoma spp., Mamestra brassicae, Manduca sexta, Operophtera spp., Ostrinia nubilalis, Pammene spp., Pandemis spp., Panolis flammea, Pectinophora gossypiella, Phthorimaea operculella, Pieris rapae, Pieris spp., Plutella xylostella, Prays spp., Scirpophaga spp., Sesamia spp., Sparganothis spp., Spodoptera spp., Synanthedon spp., Thaumetopoea spp., Tortrix spp., Trichoplusia ni ir Yponomeuta spp;

pavyzdžiui iš *Coleoptera* eilės

Agriotes spp., Anthonomus spp., Atomaria linearis, Chaetocnema tibialis, Cosmopolites spp., Curculio spp., Dermestes spp., Diabrotica spp., Epilachna spp., Eremnus spp., Leptinotarsa decemlineata, Lissorhoptrus spp., Melolontha spp., Oryzaephilus spp., Otiorhynchus spp., Phlyctinus spp., Popillia spp., Psylliodes spp., Rhizopertha spp., Scarabeidae, Sitophilus spp., Sitotroga spp., Tenebrio spp., Tribolium spp. ir Trogoderma spp;

pavyzdžiui iš *Orthoptera* eilės

Blatta spp., Blattella spp., Gryllotalpa spp., Leucophaea maderae, Locusta spp., Periplaneta spp. ir Schistocerca spp.;

pavyzdžiui iš *Isoptera* eilės

Reticulitermes spp.;

pavyzdžiui iš *Psocoptera* eilės

Liposcelis spp.;

pavyzdžiui iš *Anoplura* eilės

Haematopinus spp., *Linognathus spp.*, *Pediculus spp.*, *Pemhigus spp.* ir *Phylloxera spp.*,

pavyzdžiui iš *Mallophaga* eilės

Damalinae spp. ir *Trichodectes spp.*;

pavyzdžiui iš *Thysanoptera* eilės

Frankliniella spp., *Hercinothrips spp.*, *Taeniothrips spp.*, *Thrips palmi*, *Thrips tabaci* ir *Scirtothrips aurantii*;

pavyzdžiui iš *Heteroptera* eilės

Cimex spp., *Distantiella theobroma*, *Dysdercus spp.*, *Euchistus spp.*, *Eurygaster spp.*, *Leptocorise spp.*, *Nezara spp.*, *Piesma spp.*, *Rhodnius spp.*, *Sahlbergella singularis*, *Scotinophara spp.* ir *Triatoma spp.*;

pavyzdžiui iš *Homoptera* eilės

Aleurothrixus floccosus, *Aleyrodes brassicae*, *Aonidiella spp.*, *Aphididae*, *Aphis spp.*, *Aspidiotus spp.*, *Bemisia tabaci*, *Ceroplaster spp.*, *Chrysomphalus aonidium*, *Chrysomphalus dictyospermi*, *Coccus hesperidum*, *Empoasca spp.*, *Eriosoma larigerum*, *Erythroneura spp.*, *Gascardia spp.*, *Laodelphax spp.*, *Lecanium corni*, *Lepidosaphes spp.*, *Macrosiphus spp.*, *Myzus spp.*, *Nephotettix spp.*, *Nilaparvata spp.*, *Paratoria spp.*, *Pemphigus spp.*, *Planococcus spp.*, *Pseudaulacaspis spp.*, *Pseudococcus spp.*, *Psylla spp.*, *Pulvinaria aethiopica*, *Quadraspidotus spp.*, *Rhopalosiphum spp.*, *Saissetia spp.*, *Scaphoideus spp.*, *Schizaphis spp.*, *Sitobion spp.*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Trioza erytraeae* ir *Unaspis citri*;

pavyzdžiui iš *Hymenoptera* eilės

Acromyrmex, *Atta spp.*, *Cephus spp.*, *Diprion spp.*, *Diprionidae*, *Gilpinia polytoma*, *Hoplocampa spp.*, *Lasius spp.*, *Monomorium pharaonis*, *Neodiprion spp.*, *Solenosis spp.* ir *Vespa spp.*;

pavyzdžiui iš *Diptera* eilės

Aedes spp., Antherigona soccata, Bibio hortulanus, Calliphora erythrocephala, Ceratitis spp., Chrysomyia spp., Culex spp., Cuterebra spp., Dacus spp., Drosophila melanogaster, Fannia spp., Gastrophilus spp., Glossina spp., Hypoderma spp., Hyppobosca spp., Liriomyza spp., Lucilia spp., Melanagromyza spp., Musca spp., Oestrus spp., Orseolia spp., Oscinella frit, Pegomyia hyoscyami, Phorbia spp., Rhagoletis pomonella, Sciara spp., Stomoxys spp., Tabanus spp., Tannia spp. ir Tipula spp.;

pavyzdžiui iš *Siphonaptera* eilės

Ceratophyllus spp. ir Xenopsylla cheopis ir

pavyzdžiui iš *Thysanura* eilės

Lepisma saccharina.

Su išradimą atitinkančiomis biologiškai aktyviomis medžiagomis galima kovoti ypač su augalų, pirmiausia žemės ūkio naudingų ir dekoratyvinių augalų, soduose ir miškuose, arba ant tokių augalų, kaip vaisiai, žiedai, lapai, stiebai, gumbai arba šaknys, esančiais minėtų tipų kenkėjais, t.y. sumažinti jų skaičių arba juos sunaikinti, be to vėliau išaugančios augalų dalys yra dalinai apsaugomos nuo šių kenkėjų.

Iš tikslinių kultūrų labiausiai dėmesys kreipiamas į javus, kaip kviečiai, miežiai, rugiai, avižos, ryžiai, kukurūzai arba soros; runkelius kaip cukriniai arba pašariniai runkeliai; vaisius, pvz., sėklavaisius, kaulavaisius, ir uoginius vaisius, kaip obuoliai, kriaušės, slyvos, persikai, migdolai, vyšnios arba uogos, pvz., žemuogės, avietės arba gervuogės; ankštinius vaisius, kaip pupelės, lęšiai, žirneliai, soja; aliejinius vaisius, kaip rapsas, garstyčios, aguonos, alyvos, saulėgrąžos, kokosai, ricina, kakava arba žemės riešutai; agurkinius, kaip moliūgai, agurkai arba melionai; pluoštinius augalus, kaip medvilnė, linai, kanapės, greipfrutai arba mandarinai; daržoves, kaip špinatai, gūžinės salotos, šparagai, kopūstai, morkos, svogūnai, pomidorai, bulvės arba paprika; laurolapinius augalus,

kaip avokado, cinamonas arba kamparas; o taip pat tabaką, riešutus, kavą, baklažaninius vaisius, cukrašvendres, arbatą, pipirus, vynuoges, apynius, gamtinio kaučiuko augalus, bananų augalus ir dekoratyvinius augalus.

Išradimą atitinkančios biologiškai aktyvios medžiagos ypatingai tinka kovojant su *Aphis craccivora*, *Bemisia tabaci*, *Diabrotica balteata*, *Heliothis virescens*, *Myzus persicae*, *Nephotettix cincticeps* ir *Nilparvata lugens* daržovių, kukurūzų, vaisių, ryžių ir sojos kultūrose.

Kitos išradimą atitinkančių medžiagų panaudojimo sritys yra sandėliuojamų medžiagų atsargų apsauga, o taip pat ypač higienos sektoriuje - naminių ir naudingų gyvulių apsauga nuo nurodyto tipo kenkėjų.

Todėl išradimo objektas taip pat yra tokios kovos su kenkėjais priemonės, pasirinktinai nuo užsibrėžto tikslo ir esamų sąlygų, kaip emulguojami koncentratai, suspensijų koncentratai, tiesiogiai išpurškiami arba praskiedžiami tirpalai, užtepamos pastos, praskiestos emulsijos, purškiami milteliai; tirpūs milteliai, disperguojami milteliai, apgaubiantys milteliai, apdulkinimo priemonės, granuliatas arba kapsulės polimerinėse medžiagose, kurie turi bent vieną išradimą atitinkančią biologiškai aktyvią medžiagą.

Šiose priemonėse biologiškai aktyvi medžiaga gali būti naudojama grynoje formoje, būtent kietos biologiškai aktyvios medžiagos formoje, pvz., kaip specialaus dydžio grūdėliai, arba dažniausia bent su viena tokia receptūrų sudaryme naudojama pagalbine medžiaga, kaip skiediklis, pvz., tirpiklis arba kietas nešiklis arba su paviršiaus aktyviu junginiu (tenzidu).

Iš tirpiklių gali būti paminėti, pvz.: esant reikalui dalinai hidrinti aromatiniai angliavandeniliai, pirmenybę turi tokios alkilbenzenų frakcijos su C₈-C₁₂, kaip ksileno mišiniai, alkilinti naftalenai arba tetrahidronaftalenas, tokie alifatiniai arba cikloalifatiniai angliavandeniniai, kaip parafinai arba cikloheksanas, tokie alkoholiai, kaip etanolis, propanolis arba butanolis,

glikoliai, o taip pat tokie jų eteriai ir esteriai, kaip propilenglikolis, dipropilenglikolio eteris, etilenglikolis arba etilenglikolio monometilo arba monoetilo eteris, tokie ketonai, kaip cikloheksanonas, izoforonas arba diacetano alkoholis, tokie stipriai poliariniai tirpikliai, kaip N-metilpirolid-2-on, dimetilsulfoksidas arba N,N-dimetilformamidas, vanduo, esant reikalui, tokie epoksidinti augaliniai aliejai, kaip, atsižvelgiant į aplinkybes, epoksidinti rapso, ricinos, kokoso riešutų arba sojos aliejai, ir silikoningieji aliejai.

Kaip kieti nešikliai, pvz., apdulkinimo priemonėms ir disperguojamiems milteliams, paprastai naudojami tokių natūralių uolienu miltai, kaip kalcitas, talkas, kaolinas, montmorilonitas arba atapulgitas. Fizinių savybių pagerinimui gali būti pridėtos didelio dispersiškumo laipsnio silicio rūgštys arba didelio dispersiškumo laipsnio sugeriantys polimerizatai. Iš grūdėtų adsorbuojančių granuliuotų nešiklių galima paminėti poringo tipo pemzą, plytų duženas, sepiolitą arba betonitą, ir iš neadsorbuojančių nešiklių - kalcitą arba smėlį. Be to, gali būti panaudota daug neorganinės arba organinės kilmės granuliuotų medžiagų, ypač dolomitas arba susmulkintos augalų liekanos.

Iš paviršiaus aktyvių junginių, priklausomai nuo biologiškai aktyvios medžiagos receptūros sudarymo būdo, paminėtini nejoniniai, katijoniniai ir/arba anijoniniai tenzidai arba tenzidų mišiniai, pasižymintys geromis emulgavimo, dispergavimo ir apgaubimo savybėmis. Į žemiau pateiktus tenzidus reikia žiūrėti tik kaip į pavyzdžius; pridedamoje literatūroje aprašyta daug kitų receptūrų sudaryme naudojamų ir atitinkančių išradimą tenzidų.

Iš nejoninių tenzidų pirmiausia reikia paminėti alifatinių arba cikloalifatinių alkoholių, sočių ir nesočių riebiųjų rūgščių ir alkilfenolių poliglikolio eterio darinius, kurie gali turėti nuo 3 iki 30 glikolio eterio grupių ir nuo 8 iki 20 anglies atomų (alifatinėje) angliavandenilio liekanoje ir nuo 6 iki 18 anglies atomų alkilfenolio alkilo liekanoje. Toliau tinkami yra vandenyje tirpūs,

turintys nuo 20 iki 250 etilenglikolio eterio grupių ir nuo 10 iki 100 propilenglikolio eterio grupių, polietilenoksido aduktai su polipropilenglikoliu, etilendiaminopolipropilenglikoliu ir alkilpolipropilenglikoliu, turinčiu nuo 1 iki 10 anglies atomų alkilo grandinėje. Išvardinti junginiai vienam propilenglikolio vienetui paprastai turi nuo 1 iki 5 etilenglikolio vienetų. Kaip pavyzdžius galima paminėti noninfolpolietoksietanolį, ricinos aliejaus poliglikolio eterį, polipropileno-polietilenoksido aduktus, tributilfenoksipolietoksietanolį, polietilenglikolį ir oktilfenoksipolietoksietanolį. Toliau paminėti polioksietilensorbitano riebiųjų rūgščių esteriai, kaip polioksietilensorbitano trioleatas.

Katijoninių tenzidų atveju turime reikalą, visų pirma, su ketvirtinėmis amonio druskomis, kurios kaip pakaitus turi bent vieną alkilo liekaną su 8-22 C-atomais ir kaip kitus pakaitus - nedidelės molekulinės masės, esant reikalui, halogenintas alkilo, benzilo arba hidroksialkilo liekanas. Druskos dažniausiai būna halogenidų, metilsulfatų arba etilsulfatų formoje. Pavyzdžiai yra stearyl-trimetil-amonio chloridas ir benzil-di-(2-chloretil)-etilamonio bromidas.

Tinkamais anijoniniais tenzidais gali būti kaip vandenyje tirpūs muilai, taip ir sintetiniai paviršiaus aktyvūs junginiai. Kaip muilai tinka tokios aukštesniųjų riebiųjų rūgščių (C_{10} - C_{22}) šarminių, žemės šarminių metalų ir, esant reikalui, amonio, turinčio pakaitus, druskos, kaip oleino arba stearino rūgšties, arba gamtinių riebiųjų rūgščių mišinių, kurie gali būti gauti iš riešutų arba talio aliejaus, natrio arba kalio druskos; toliau reikėtų paminėti riebiųjų rūgščių metil-aurino druskas. Tačiau dažniau naudojami sintetiniai tenzidai, ypač riebieji sulfonatai, riebieji sulfatai, sulfoninti benzimidazolo dariniai arba alkilarilsulfonatai. Riebieji sulfonatai dažniausiai yra šarminių, žemės šarminių metalų arba, esant reikalui, amonio, turinčio pakaitus, druskų formoje, ir, bendru atveju, turi alkilo liekaną su nuo 8 iki 22 C-atomų, kur alkilas turi acilo liekanos alkilinę dalį; kaip pavyzdžius galima paminėti ligninsulforūgšties, sieros rūgšties

dodecilo esterio arba iš gamtinių riebiųjų rūgščių pagaminto riebiųjų alkoholių sulfatų mišinio natrio arba kalcio druskas. Prie jų priskiriami taip pat sieros rūgšties esterių ir riebiųjų alkoholių-etileno oksido aduktų sulforūgščių druskos. Sulfoninti benzimidazolo dariniai dažniausia turi 2 sulforūgšties grupes ir riebiosios rūgšties liekaną su nuo 8 iki 22 C-atomų. Alkilarilsulfonatai yra, pavyzdžiui, dodecilbenzensulforūgšties, dibutilnaftalensulforūgšties arba naftalensulforūgšties-formaldehido kondensacijos produkto natrio, kalcio arba trietanolamonio druskos. Toliau paminėtini atitinkamai fosfatai, kaip p-nonilfenol-(4-14)-etilenoksido adukto fosforo rūgšties esterio druskos arba fosfolipidai.

Priemonės paprastai turi nuo 0,1 iki 99 %, visų pirma, nuo 0,1 iki 95 %, biologiškai aktyvios medžiagos ir nuo 1 iki 99,9 %, visų pirma, nuo 5 iki 99,9 %, bent vienos kietos arba skystos pagalbinės priemonės, be to, paprastai nuo 0 iki 25 %, visų pirma, nuo 0,1 iki 20 %, priemonės gali sudaryti tenzidas (kiekvieną atvejų % reiškia svorio procentus). Kaip pardavimui skirta prekė pirmenybę turi koncentruota priemonė, tuo tarpu galutinis vartotojas paprastai naudoja praskiestą priemonę, kurioje žymiai mažesnė biologiškai aktyvios medžiagos koncentracija. Pirmenybę turinčių priemonių sudėtis yra visų pirma ši (% = svorio procentai):

Emulguojami koncentratai:

Biologiškai aktyvi medžiaga:	nuo 1 iki 90 %, visų pirma, nuo 5 iki 20%
Tenzidas:	nuo 1 iki 30%, visų pirma, nuo 10 iki 20%
Tirpiklis:	nuo 5 iki 98 %, visų pirma, nuo 70 iki 85 %

Apdulkinimo priemonės:

Biologiškai aktyvi medžiaga:	nuo 0,1 iki 10%, visų pirma, nuo 0,1 iki 1%
Kietas nešiklis:	nuo 99,9 iki 90%, visų pirma, nuo 99,9

iki 99%

Suspensijų koncentratai:

Biologiškai aktyvi medžiaga:	nuo 5 iki 75%, visų pirma, nuo 10 iki 50%
Vanduo:	nuo 94 iki 24%, visų pirma, nuo 88 iki 30%
Tenzidas:	nuo 1 iki 40%, visų pirma, nuo 2 iki 30%

Apgaubiantys milteliai:

Biologiškai aktyvi medžiaga:	nuo 0,5 iki 90%, visų pirma, nuo 1 iki 80%
Tenzidas:	nuo 0,5 iki 20%, visų pirma, nuo 1 iki 15%
Kietas nešiklis:	nuo 5 iki 99%, visų pirma, nuo 15 iki 98%

Granuliatai:

Biologiškai aktyvi medžiaga:	nuo 0,5 iki 30%, visų pirma, nuo 3 iki 15%
Kietas nešiklis:	nuo 99,5 iki 70%, visų pirma, nuo 97 iki 85%

Pridedant kitas biologiškai aktyvias insekticidines medžiagas, galima žymiu mastu praplėsti arba pritaikyti atitinkamoms sąlygoms išradimą atitinkančių priemonių veikimą. Iš priedų prie biologiškai aktyvios medžiagos galima pažymėti, pavyzdžiui, šių biologiškai aktyvių medžiagų klasių atstovus: fosforo organinius junginius, nitrofenolius ir jų darinius, formamidinus, ureatus, karbamatus, piretroidus, chlorintus angliavandenilius ir *Bacillus thuringiensis* preparatus.

Išradimą atitinkančios priemonės savo sudėtyje gali turėti ir tokias kitas kietas arba skystas pagalbines medžiagas, kaip stabilizatoriai, pvz., esant reikalui, epoksidinti augaliniai aliejai (pvz., epoksidintas kokoso riešutų,

rapso arba sojos aliejus), putų gesintuvai, pvz., silikono aliejus, konservantus, klampumo reguliatorius, rišamąsias ir/arba sukibimo priemonės, o taip pat trąšas arba kitas biologiškai aktyvias medžiagas specialių efektų gavimui, pvz., akaricidus, baktericidus, fungicidus, nematocidus, moliuskicidus arba selektyvius herbicidus.

Išradimą atitinkančios priemonės gali būti gautos žinomu būdu, nesant pagalbinių medžiagų, pvz., sumalant, sijojant ir/arba presuojant kietą biologiškai aktyvią medžiagą arba biologiškai aktyvių medžiagų mišinį, pvz., iki tam tikro dydžio grūdelių, ir esant bent vienai pagalbinei medžiagai, pvz., kartu sumaišant ir/arba sumalant biologiškai aktyvią medžiagą arba jų mišinį su pagalbine medžiaga (medžiagomis). Išradimą atitinkančios priemonės gavimo būdas ir I formulės junginio panaudojimas šios priemonės gavimui taip pat yra šio išradimo objektas.

Šios priemonės panaudojimo būdai, t.y. tokie kovos su išvardintų tipų kenkėjais būdai, pasirenkami priklausomai nuo užsibrėžtų tikslų ir atitinkamų sąlygų, kaip išpurškimas, išpurškimas aerozolio pavidalu, apdulkinimas, užtepimas, beicavimas, pylimas čiurkšlėmis arba paprastas užpylimas, ir priemonių panaudojimas kovoje su minėto tipo kenkėjais yra tolimesni šio išradimo objektai. Tipinės panaudojimo koncentracijos yra tarp 0,1 ir 1000 m.d., pirmenybę turi nuo 0,1 iki 500 m.d., biologiškai aktyvios medžiagos. Bendru atveju sunaudojimo vienam hektarui kiekis yra nuo 1 iki 2000 g biologiškai aktyvios medžiagos hektarui, visų pirma, nuo 10 iki 1000 g/ha, pirmenybę turi nuo 20 iki 600 g/ha.

Pirmenybę turintis panaudojimo būdas augalų apsaugos srityje yra užnešamas ant augalų lapų (aplikacija ant lapų), kur aplikacijos dažnumas ir naudojamas kiekis yra reguliuojamas priklausomai nuo apnikimo kenkėjais. Tačiau biologiškai aktyvi medžiaga augalą gali pasiekti ir per šaknis (sisteminis poveikis), šiuo atveju augalų buvimo vieta yra sudrėkinama skysta priemone, arba biologiškai aktyvi medžiaga kietame pavidale yra įnešama į augalų buvimo vietą, pvz., į žemę, pvz.,

granuliato pavidale (aplikacija į žemę). Vandeninių ryžių kultūrų atveju tokie granuliatas gali būti dozuojami į užtvindyta ryžių lauka.

Išradimą atitinkančios priemonės tinka taip pat ir augalų sėklų apsaugai, pvz., vaisių, gumbų arba grūdų sėklų, arba daigų apsaugai nuo gyvulinių kenkėjų. Šiuo atveju sėklos gali būti apdorotos šia priemone prieš sėją, pvz., sėklos gali būti beicuotos prieš sėją. Išradimą atitinkančios biologiškai aktyvios medžiagos taip pat gali būti užneštos ant sėklinių grūdų (coating), šiuo atveju sėklos gali būti arba mikromos skystoje priemonėje, arba padengiamos kieta priemone. Priemonė gali būti taip pat aplikuota ir sėklų sėjimo vietoje, pvz., sėjant vagose.

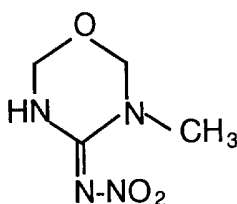
Šie augalinių sėklų apdorojimo būdai ir taip apdorotos sėklos yra tolimesni išradimo objektai.

Žemiau pateikti pavyzdžiai paaiškina išradimą. Tačiau jie neapriboja išradimo. Temperatūros yra duotos Celsijaus laipsniais.

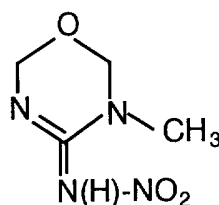
Gavimo pavyzdžiai

H1 pavyzdys

3-metil-4-nitroimino-perhidro-1,3,5-oksadiazinas



arba 3-metil-4-nitroamino-1,2,3,6-tetrahidro-1,3,5-oksadiazinas



I 20 g N-metil-N'-nitro-guanidino, 17 g trietilamino, 100 ml dioksano ir 100 ml tolueno mišinį kambario temperatūroje pridedama 30,5 g paraformaldehido, 16 valandų kaitinama su grįžtamuoju šaldytuvu ir po to išgarinama vakuume. Liekana valoma chromatografinėje kolonėlėje /silikagelis; dichlormetanas/metanolis (95:5)/ ir tuo būdu gaunamas pavadinime nurodytas junginys, kuris lydosi 137-139° C temperatūroje.

H2 pavyzdys

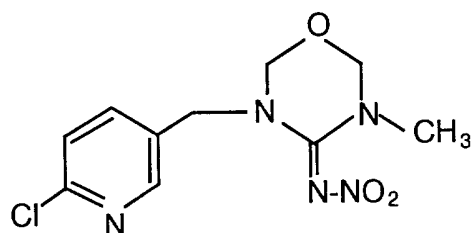
Analogiškai pagal H1 pavyzdžio aprašymą taip pat galima gauti:

3-etil-4-nitroimino-perhidro-1,3,5-oksadiaziną, arba 3-etil-4-nitroamino-1,2,3,6-tetrahidro-1,3,5-oksadiaziną,

4-nitroimino-3-propil-perhidro-1,3,5-oksadiaziną, arba 4-nitroamino-3-propil-1,2,3,6-tetrahidro-1,3,5-oksadiaziną (derva),
 3-butil-4-nitroimino-perhidro-1,3,5-oksadiaziną, arba 3-butil-4-nitroamino-1,2,3,6-tetrahidro-1,3,5-oksadiaziną (lydymosi temperatūra: 80-82°C),
 3-ciklopropil-4-nitroimino-perhidro-1,3,5-oksadiaziną, arba 3-ciklopropil-4-nitroamino-1,2,3,6-tetrahidro-1,3,5-oksadiaziną, 3-alil-4-nitroimino-perhidro-1,3,5-oksadiaziną, arba 3-alil-4-nitroamino-1,2,3,6-tetrahidro-1,3,5-oksadiaziną (derva),
 4-nitroimino-3-propargil-perhidro-1,3,5-oksadiaziną, arba 4-nitroamino-3-propargil-1,2,3,6-tetrahidro-1,3,5-oksadiaziną (lydymosi temperatūra: 102-104°C),
 4-cianoimino-3-metil-perhidro-1,3,5-oksadiaziną, arba 4-cianoamino-3-metil-1,2,3,6-tetrahidro-1,3,5-oksadiaziną (lydymosi temperatūra: 121-122°C),
 4-cianoimino-3-etil-perhidro-1,3,5-oksadiaziną, arba 4-cianoamino-3-etil-1,2,3,6-tetrahidro-1,3,5-oksadiaziną,
 4-cianoimino-3-ciklopropil-perhidro-1,3,5-oksadiaziną, arba 4-cianoamino-3-ciklopropil-1,2,3,6-tetrahidro-1,3,5-oksadiaziną ir
 4-nitroimino-3-(2-feniletil)-perhidro-1,3,5-oksadiaziną, arba 4-nitroamino-3-(2-feniletil)-1,2,3,6-tetrahidro-1,3,5-oksadiaziną (lydymosi temperatūra: 123-125°C).

H3 pavyzdys

5-(2-chlorpirid-5-ilmetil)-3-metil-4-nitroiminoperhidro-1,3,5-oksadiazinas (1 lentelė, junginys Nr. 1.2).



1,44 g 3-metil-4-nitroimino-perhidro-1,3,5-oksadiazino, 2,2g 2-chlor-5-chlormetil-piridino, 3,7 g kalio karbonato ir 20 ml N,N-dimetilformamido mišinys 4 valandas šildomas 50°C temperatūroje, filtruojamas, filtratas išgarinamas vakuume rotaciniame garintuve ir liekana valoma chromatografiškai (silikagelis; dichlormetanas/metanolis (95:5)). Tuo būdu gaunamas pavadinime nurodytas junginys, kuris lydosi 116-118°C temperatūroje.

H4 pavyzdys

Analogišku būdu, kaip tai aprašyta H1-H3 pavyzdžiuose, gali būti gauti ir kiti 1 ir 2 lentelėse pateikti junginiai. Šių lentelių skiltyje „Fiziniai duomenys“ pateikti atitinkamų junginių lydymosi temperatūros.

Receptų pavyzdžiai (% = svorio procentai)

F1 pavyzdys

Emulsijų koncentratai	a)	b)	c)
Biologiškai aktyvi medžiaga Nr. 1.2	25%	40%	50%
Ca-dodecilbenzensulfonatas	5%	8%	6%
Ricinos aliejaus-polietilenglikolio eteris (36 mol EO)	5 %	-	-

35

Tributilfenolio-polietilenglikolio

eteris (30 mol EO)

-

12%

4%

Cikloheksanonas

-

15%

20%

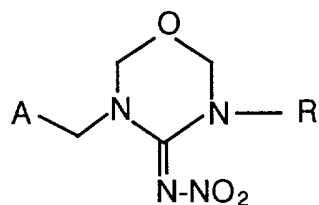
Ksilenų mišinys

65%

25%

20%

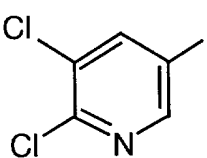
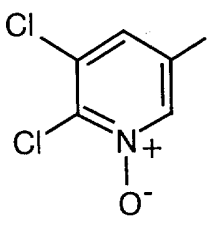
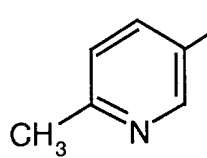
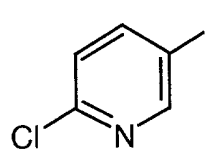
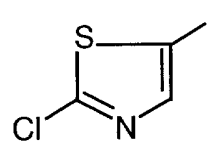
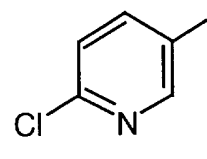
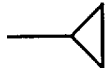
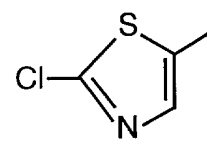
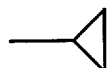
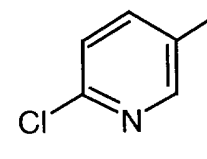
1 lentelė

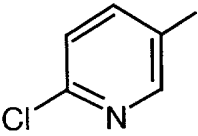
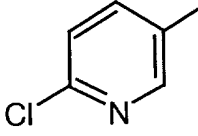
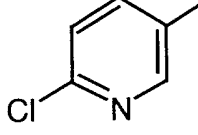
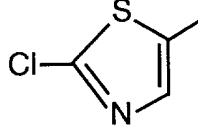
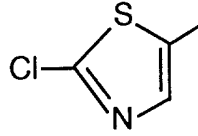
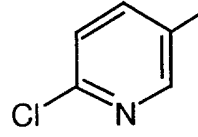
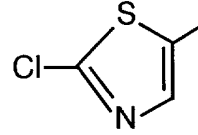


Junginys Nr.	A	R	Fizikiniai duomenys
-----------------	---	---	---------------------

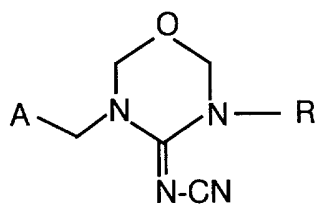
1.1		CH ₃	
1.2		CH ₃	116-118° C
1.3		CH ₃	132-134° C
1.4		CH ₃	210° C (skilimas)
1.5		CH ₃	188-191° C

Junginys Nr.	A	R	Fizikiniai duomenys
-----------------	---	---	---------------------

1.6		CH ₃	
1.7		CH ₃	199° C (skilimas)
1.8		CH ₃	141-144° C
1.9		C ₂ H ₅	
1.10		C ₂ H ₅	
1.11			
1.12			
1.13		n-C ₃ H ₇	Derva

Junginys Nr.	A	R	Fizikiniai duomenys
1.14		n-C ₄ H ₉	Derva
1.15		Alil	Derva
1.16		Propargil	103-108 °C
1.17		n-C ₄ H ₉	71-73 °C
1.18		Propargil	176° C
1.19		CH ₂ CH ₂ -C ₆ H ₅	Derva
1.20		CH ₂ CH ₂ -C ₆ H ₅	Derva

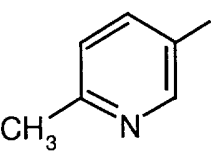
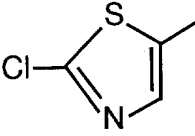
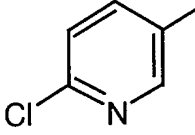
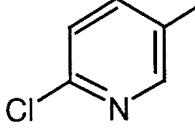
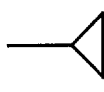
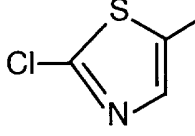
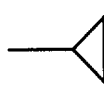
2 lentelė



Junginys Nr.	A	R	Fizikiniai duomenys
-----------------	---	---	---------------------

2.1		CH ₃	
2.2		CH ₃	108-109° C
2.3		CH ₃	92-93° C
2.4		CH ₃	
2.5		CH ₃	
2.6		CH ₃	

Junginys	A	R	Fizikiniai duomenys
Nr.			

2.7		CH ₃
2.8		C ₂ H ₅
2.9		C ₂ H ₅
2.10		
2.11		

Skiedžiant tokius koncentratų vandeniu, gali būti gautos bet kurios norimos koncentracijos emulsijos.

F2 pavyzdys

Tirpalai	a)	b)	c)	d)
Biologiškai aktyvi medžiaga Nr. 1.3	80%	10%	5%	95%
Polietilenglikoliomonometilo eteris	20%	-	-	-
Polietilenglikolis (mol. sv. 400)	-	70%	-	-

N-metil-2-pirolidonas	-	20%	-	-
Epoksidintas kokoso riešutų aliejus	-	-	1%	5%
Benzinas (virimo temperatūrų ribos 160-190° C)	-	-	94%	-

Tirpalai yra tinkami vartoti mažiausių lašelių pavidale.

F3 pavyzdys

Granuliatai	a)	b)	c)	d)
Biologiškai aktyvi medžiaga Nr. 1.2	5%	10%	8%	21%
Kaolinas	94%	-	79%	54%
Didelio dispersiškumo laipsnio silicio rūgštis	1%	-	13%	7%
Atapulgitas	-	90%	-	18%

Biologiškai aktyvi medžiaga ištirpinama dichlorethane, užpurškiama ant nešėjo ir po to tirpiklis išgarinamas vakuume.

F4 pavyzdys

Apdulkinimo priemonės	a)	b)
Biologiškai aktyvi medžiaga Nr. 1.2	2%	5%
Didelio dispersiškumo laipsnio silicio rūgštis	1%	5%
Talkas	97%	-
Kaolinas	-	90%

Sumaišant medžiagas-nešiklius ir biologiškai aktyvią medžiagą gaunama paruošta vartojimui apdulkinimo priemonė.

F5 pavyzdys

Išpurškiami milteliai	a)	b)	c)
Biologiškai aktyvi medžiaga Nr. 1.2	25%	50%	75%
Na-ligninsulfonatas	5%	5%	-
Na-laurilsulfatas	3%	-	5%
Na-diizobutilnaftalinsulfonatas	-	6%	10%
Oktilfenolio-polietilenglikolio eteris (7-8 mol EC)	-	2%	-
Didelio dispersiškumo laipsnio silicio rūgštis	5%	10%	10%
Kaolinas	62%	27%	-

Biologiškai aktyvi medžiaga sumaišoma su priedais ir gerai sumalama tinkamame malūne. Gaunami išpurškiami milteliai, kuriuos galima praskiesti vandeniu iki bet kurios norimos koncentracijos suspensijos.

F6 pavyzdys

Emulsijos koncentratas

Biologiškai aktyvi medžiaga Nr. 1.3	10%
Oktilfenolio-polietilenglikolio eteris (4-5 mol EO)	3%
Ca-dodecilbenzensulfonatas	3%
Ricinos aliejaus-poliglikolio eteris (36 mol EO)	4%
Cikloheksanonas	30%
Ksilenų mišinys	50%

Skiedžiant šį koncentratą vandeniu, gali būti pagamintos bet kurios norimos koncentracijos emulsijos.

F7 pavyzdys

Apdulkinimo priemonės	a)	b)
Biologiškai aktyvi medžiaga Nr. 1.2	5%	8%
Talkas	95%	-
Kaolinas	-	92%

Sumaišius biologiškai aktyvią medžiagą su nešikliu ir sumalus tinkamame malūne, gaunama paruošta vartojimui apdulkinimo priemonė.

F8 pavyzdys

Ekstrūderinis granuliatas

Biologiškai aktyvi medžiaga Nr. 1.3	10%
Na-ligninsulfonatas	2%
Karboksimetilceliuliozė	1%
Kaolinas	87%

Biologiškai aktyvi medžiaga sumaišoma su priedais, sumalama ir sudrėkinama vandeniu. Šis mišinys ekstrūduojamas, granuliuojamas ir po to išdžiovinamas oro srovėje.

F9 pavyzdys

Apgaubiamasis granuliatas

Biologiškai aktyvi medžiaga Nr. 1.2	3%
Polietilenglikolis (mol. sv. 200)	3%
Kaolinas	94%

Maišklyje smulkiai sumalta biologiškai aktyvi medžiaga tolygiai užnešama ant polietilenglikoliu sudrėkinto kaolino. Tuo būdu gaunamas nedulkantis apgaubiamasis granuliatas.

F10 pavyzdys

Suspensijos koncentratas

Biologiškai aktyvi medžiaga Nr. 1.3	40%
Etilenglikolis	10%
Nonilfenolio-polietilenglikolio eteris (15 mol EO)	6%
Na-ligninsulfonatas	10%
Karboksimetilceliuliozė	1%
37%-nis formaldehido vandeninis tirpalas	0,2%
Silikoninis aliejus, 75%-nės vandeninės emulsijos pavidale	0,8%
Vanduo	32%

Smulkiai sumalta biologiškai aktyvi medžiaga sumaišoma su priedais. Taip gaunamas suspensijos koncentratas, iš kurio, praskiedžiant vandeniu, gali būti pagamintos bet kurios koncentracijos suspensijos.

Biologiniai pavyzdžiai (% = svorio procentai, jei nenurodyta kitaip)

B1 pavyzdys

Poveikis prieš *Anthonomus grandis*

Jauni medvilnės augalai apipurškiami vandeniniu apipurškimo emulsijos tirpalu, turinčiu 400 m.d. biologiškai aktyvios medžiagos. Nudžiūvus išpurkštam mišiniui, ant augalų apgyvendinama 10 suaugusių *Anthonomus grandis* individų ir augalai įdedami į plastmasinį indą. Po 3

dienų įvertinami rezultatai. Palyginant negyvų vabalų skaičių ir vabalų padarytą žalą apdorotuose ir neapdorotuose augaluose, nustatomas procentinis populiacijos sumažėjimas ir procentinis padarytos žalos sumažėjimas (poveikis %).

1 ir 2 lentelės junginiai šiame teste pasižymėjo geru veikimu. Ypač pasižymėjo junginiai Nr. 1.2, 1.3 ir 2.3, kurių poveikis viršijo 80 %.

B2 pavyzdys

Poveikis prieš *Aphis craccivora*

Žirnelių daigai infekuojami *Aphis craccivora*, po to apipurškiami apipurškimo tirpalu, turinčiu 400 m.d. biologiškai aktyvios medžiagos, ir po to inkubuojami 20° C temperatūroje. Po 3 ir 6 dienų buvo įvertinti rezultatai. Palyginant negyvų lapinių utėlių skaičių ant apdorotų ir neapdorotų augalų, nustatomas procentinis populiacijos sumažėjimas (veiksmingumo %).

1 ir 2 lentelės junginiai šiame teste pasižymėjo geru veikimu. Ypač pasižymėjo junginiai Nr. 1.2, 1.3, 1.15, 2.2 ir 2.3, kurių poveikis viršijo 80%.

B3 pavyzdys

Poveikis prieš *Bemisia tabaci*

Krūminės pupelės buvo sudėtos į narvelius iš marlinio tinklelio ir apgyvendintos suaugusiais *Bemisia tabaci* individais. Padėjus kiaušinėlius, visi suaugę individai buvo pašalinti. Po 10 dienų augalai su ant jų esančiomis nimfomis buvo apipurkšti vandeniniu apipurškimo emulsijos tirpalu, turinčiu 400 m.d. biologiškai aktyvios medžiagos. Dar po 14 dienų buvo įvertintas procentinis išsiritimas iš kiaušinėlių, lyginant su neapdorotais kontroliniais pavyzdžiais.

1 ir 2 lentelės junginiai šiame teste pasižymėjo geru veikimu. Ypač pasižymėjo junginiai Nr. 1.2 ir 1.3, kurių poveikis viršijo 80 %.

B4 pavyzdys

Poveikis prie *Ctenocephalides felis* (sisteminis)

Dvidešimt suaugusių *Ctenocephalides felis* rūšies blusų suaugusių individų patalpinama į plokščią, apvalų, iš abiejų pusių marle uždengtą narvelį. Ant narvelio pastatomas indas, kuris iš apačios uždengtas parafilmo membrana. Inde yra kraujas, turintis 5 m.d. biologiškai aktyvios medžiagos ir kuris laikomas pastoviai pašildytas iki 37° C temperatūros. Blusos paima kraują per membraną. Praėjus 24 ir 48 valandoms po patalpinimo, įvertinami rezultatai. Palyginant negyvų blusų skaičių apdoroto kraujo panaudojimo atveju su negyvų blusų skaičiumi neapdoroto kraujo atveju, nustatomas procentinis populiacijos sumažėjimas (veiksmingumo %). Praėjus 24 valandoms po apdorojimo, kraujas pakeičiamas nauju, taip pat apdorotu krauju.

1 ir 2 lentelės junginiai šiame teste pasižymėjo geru veikimu. Ypač pasižymėjo junginiai Nr. 1.2 ir 1.3, kurių poveikis viršijo 80 %.

B5 pavyzdys

Poveikis prieš *Diabrotica balteata*

Kukurūzų daigai apipurškiami vandeniniu apipurškimo emulsijos tirpalu, turinčiu 400 m.d. biologiškai aktyvios medžiagos. Nudžiūvus išpurkštam mišiniui, daigai apgyvendinami 10 antros stadijos *Diabrotica balteata* lervomis ir patalpinami į plastmasinį indą. Po 6 dienų įvertinami rezultatai. Palyginant negyvų lervų skaičių ant apdorotų ir neapdorotų augalų, nustatomas procentinis populiacijos sumažėjimas (veiksmingumo %).

1 ir 2 lentelės junginiai šiame teste pasižymėjo geru veikimu. Ypač pasižymėjo junginiai Nr. 1.2, 1.3, 1.5 ir 2.3, kurių poveikis viršijo 80 %.

B6 pavyzdys

Poveikis prieš *Heliothis virescens*

Jauni sojos augalai apipurškiami vandeniniu apipurškimo emulsijos tirpalu, turinčiu 400 m.d. biologiškai aktyvios medžiagos. Nudžiūvus išpurkštam mišiniui, augalai apgyvendinami 10 pirmos *stadijos Heliothis virescens* vikšrų ir patalpinami į plastmasinį indą. Po 6 dienų įvertinami rezultatai. Palyginant negyvų vikšrų skaičių ir vikšrų padarytą žalą apdorotuose ir neapdorotuose augaluose, nustatomas procentinis populiacijos sumažėjimas ir procentinis padarytos žalos sumažėjimas (veiksmingumo %).

1 ir 2 lentelės junginiai šiame teste pasižymėjo geru veikimu. Ypač pasižymėjo junginiai Nr. 1.2 ir 1.3, kurių poveikis viršijo 80%.

B7 pavyzdys

Poveikis prieš *Heliothis virescens* (ovi-/larvizid)

Ant medvilnės padėti *Heliothis virescens* kiaušinėliai apipurškiami vandeniniu apipurškimo emulsijos tirpalu, turinčiu 400 m.d. biologiškai aktyvios medžiagos. Po 8 dienų buvo įvertintas išsiritimas iš kiaušinėlių ir vikšrų išgyvenimo laipsnis, lyginant su neapdorotais kontroliniais pavyzdžiais (populiacijos sumažėjimo %).

1 ir 2 lentelės junginiai šiame teste pasižymėjo geru veikimu.

B8 pavyzdys

Poveikis prieš *Myzus persicae*

Žirnelių daigai buvo infekuoti *Myzus persicae*, vėliau apipurškšti apipurškimo tirpalu, turinčiu 400 m.d. biologiškai aktyvios medžiagos, ir po to inkubuoti 20° C temperatūroje. Po 3 ir 6 dienų buvo įvertinti rezultatai. Palyginant negyvų lapinių utėlių skaičių ant apdorotų ir neapdorotų augalų, buvo nustatytas procentinis populiacijos sumažėjimas (veiksmingumo %).

1 ir 2 lentelės junginiai šiame teste pasižymėjo geru veikimu. Ypač pasižymėjo junginiai Nr. 1.2 ir 1.3, kurių poveikis viršijo 80%.

B9 pavyzdys

Poveikis prieš *Myzus persicae* (sisteminis)

Žirnelių daigai buvo infekuoti *Myzus persicae*, vėliau su šaknimis įdėti į išpurškiamą tirpalą, turintį 400 m.d. biologiškai aktyvios medžiagos, ir po to inkubuoti 20° C temperatūroje. Po 3 ir 6 dienų buvo įvertinti rezultatai. Palyginant negyvų lapinių utėlių skaičių ant apdorotų ir neapdorotų augalų, buvo nustatytas procentinis populiacijos sumažėjimas (veiksmingumo %).

1 ir 2 lentelės junginiai šiame teste pasižymėjo geru veikimu. Ypač pasižymėjo junginiai Nr. 1.2, 1.3 ir 1.5, kurių poveikis viršijo 80 %.

B10 pavyzdys

Poveikis prieš *Nephotettix cincticeps*

Ryžių augalai apipurškiami vandeniniu apipurškimo emulsijos tirpalu, turinčiu 400 m.d. biologiškai aktyvios medžiagos. Nudžiūvus išpurkštam mišiniui, augalai apgyvendinamai 2. ir 3. stadijos lervomis. Po 21 dienos įvertinami rezultatai. Palyginant likusių gyvų cikadų skaičių ant apdorotų ir neapdorotų augalų, nustatomas procentinis populiacijos sumažėjimas (veiksmingumo %).

1 ir 2 lentelės junginiai šiame teste pasižymėjo geru veikimu. Ypač pasižymėjo junginiai Nr. 1.2, 1.3 ir 1.5, kurių poveikis viršijo 80 %.

B11 pavyzdys

Poveikis prieš *Nephotettix cincticeps* (sisteminis)

Puodai su ryžių augalais įdedami į vandeninį emulsijos tirpalą, turintį 400 m.d. biologiškai aktyvios medžiagos. Po to augalai apgyvendinami 2. ir 3. stadijos lervomis. Po 6 dienų įvertinami rezultatai. Palyginant cikadų skaičių ant apdorotų ir neapdorotų augalų, nustatomas procentinis populiacijos sumažėjimas (veiksmingumo %).

1 ir 2 lentelės junginiai šiame teste pasižymėjo geru veikimu. Ypač pasižymėjo junginiai Nr. 1.3, 1.5, 1.13 ir 1.15, kurių poveikis viršijo 80 %.

B12 pavyzdys

Poveikis prieš *Nilaparvata lugens*

Ryžių augalai apdorojant vandeniniu apipurškimo emulsijos tirpalu, turinčiu 400 m.d. biologiškai aktyvios medžiagos. Nudžiūvus išpurkštam mišiniui, ryžių augalai apgyvendinami 2. ir 3. stadijos cikadų lervomis. Po 21 dienos įvertinami rezultatai. Palyginant likusių gyvų cikadų skaičių ant apdorotų ir neapdorotų augalų, nustatomas procentinis populiacijos sumažėjimas (veiksmingumo %).

1 ir 2 lentelės junginiai šiame teste pasižymėjo geru veikimu. Ypač pasižymėjo junginiai Nr. 1.2, 1.3, 1.5, 1.8 ir 2.3, kurių poveikis viršijo 80 %.

B13 pavyzdys

Poveikis prieš *Nilaparvata lugens* (sisteminis)

Puodai su ryžių augalais įdedami į vandeninį emulsijos tirpalą, turintį 10 m.d. biologiškai aktyvios medžiagos. Po to augalai apgyvendinami 2. ir 3. stadijos lervomis. Po 6 dienų įvertinami rezultatai. Palyginant cikadų skaičių ant apdorotų ir neapdorotų augalų, nustatomas procentinis populiacijos sumažėjimas (veiksmingumo %).

B14 pavyzdys

Poveikis prieš *Blattella germanica*

Į Petri lėkštutę pridedama tiek acetoninio biologiškai aktyvios medžiagos tirpalo (0,1 %), kad jos kiekis atitiktų 1 g/m² panaudojimo kiekį. Kai tirpiklis išgaruoja, į lėkštutę įdedama 10 *Blattella germanica* nimfų (paskutinė nimfos stadijos) ir jos 2 valandas yra veikiamos bandomąja medžiaga. Po to nimfos narkotizuojamos CO₂, pernešamos į naują Petri lėkštutę ir laikomos tamsoje 25° C temperatūroje, esant 70 % oro drėgnumui. Po 48 valandų nustatomas insekticidinis poveikis, apskaičiuojant nužudymo laipsnį.

1 ir 2 lentelės junginiai šiame teste pasižymėjo geru veikimu. Ypač pasižymėjo junginys Nr. 1.3, kurio poveikis viršijo 80 %.

B15 pavyzdys

Poveikis prieš *Lucilia cuprina*

Po 30-50 šviežiai padėtų *Lucilia cuprina* kiaušinėlių įdedama į mėgintuvėlius, kuriuose 4 ml maitinamosios terpės yra sumaišyti su 1 ml bandomojo tirpalo, turinčio 16 m.d. biologiškai aktyvios medžiagos. Po kiaušinėlių įdėjimo į kultūrinę terpę, mėgintuvėliai su bandiniais užkemšami vatos kamščiais ir 4 dienas 30° C temperatūroje perimi inkubacinėje spintoje. Neapdorotoje terpėje iki to laiko išsivysto apie 1 cm ilgio lervos (3. stadija). Jei bandomoji medžiaga yra aktyvi, tai iki šio laiko

momento lervos žūva, arba yra aiškiai mažesnės. Po 96 valandų įvertinami rezultatai.

1 ir 2 lentelės junginiai šiame teste pasižymėjo geru veikimu. Ypač pasižymėjo junginys Nr. 1.3, kurio poveikis viršijo 80 %.

B16 pavyzdys

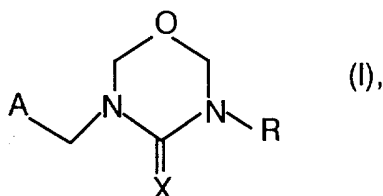
Poveikis prieš *Musca domestica*

Cukraus gabalėlis apdorojamas bandomosios medžiagos tirpalu taip, kad, išdžiovinus jį per naktį, bandomosios medžiagos koncentracija cukruje būtų 250 m.d. Taip apdorotas gabalėlis su drėgnu vatos tamponu ir 10 OP-atsparaus *Musca domestica* kamieno suaugusių individų padedamas į aliumininę lėkštutę. Ši uždengiama Becherio stikleliu ir inkubuojama 25 °C temperatūroje. Po 24 valandų nustatomas mirtingumo laipsnis.

1 ir 2 lentelės junginiai šiame teste pasižymėjo geru veikimu. Ypač pasižymėjo junginys Nr. 1.3, kurio poveikis viršijo 80 %.

IŠRADIMO APIBRĖŽTIS

1. Žemiau pateiktos formulės junginys



kurioje A žymi neturinčią pakaitų arba turinčią nuo vieno iki keturių pakaitų, aromatinę arba nearomatinę, monociklinę arba diciklinę, heterociklinę liekaną, ir nuo vieno iki dviejų A pakaitų gali būti pasirinkti iš grupės, susidedančios iš halogen- C_1 - C_3 -alkilo, ciklopropilo, halogenciklopropilo, C_2 - C_3 -alkenilo, C_2 - C_3 -alkinilo, halogen- C_2 - C_3 -alkenilo, halogen- C_2 - C_3 -alkinilo, halogen- C_1 - C_3 -alkoksi, C_1 - C_3 -alkiltio, halogen- C_1 - C_3 -alkiltio, aliloksi, propargiloksi, aliltio, propargiltio, halogenaliloksi, halogenaliltio, ciano ir nitro, ir nuo vieno iki keturių A pakaitų gali būti pasirinkti iš grupės, susidedančios iš C_1 - C_3 -alkilo, C_1 - C_3 -alkoksi ir halogeno;

R žymi vandenilį, C_1 - C_6 -alkilą, fenil- C_1 - C_4 -alkilą, C_3 - C_6 -cikloalkilą, C_2 - C_6 -alkenilą arba C_2 - C_6 -alkinilą; ir

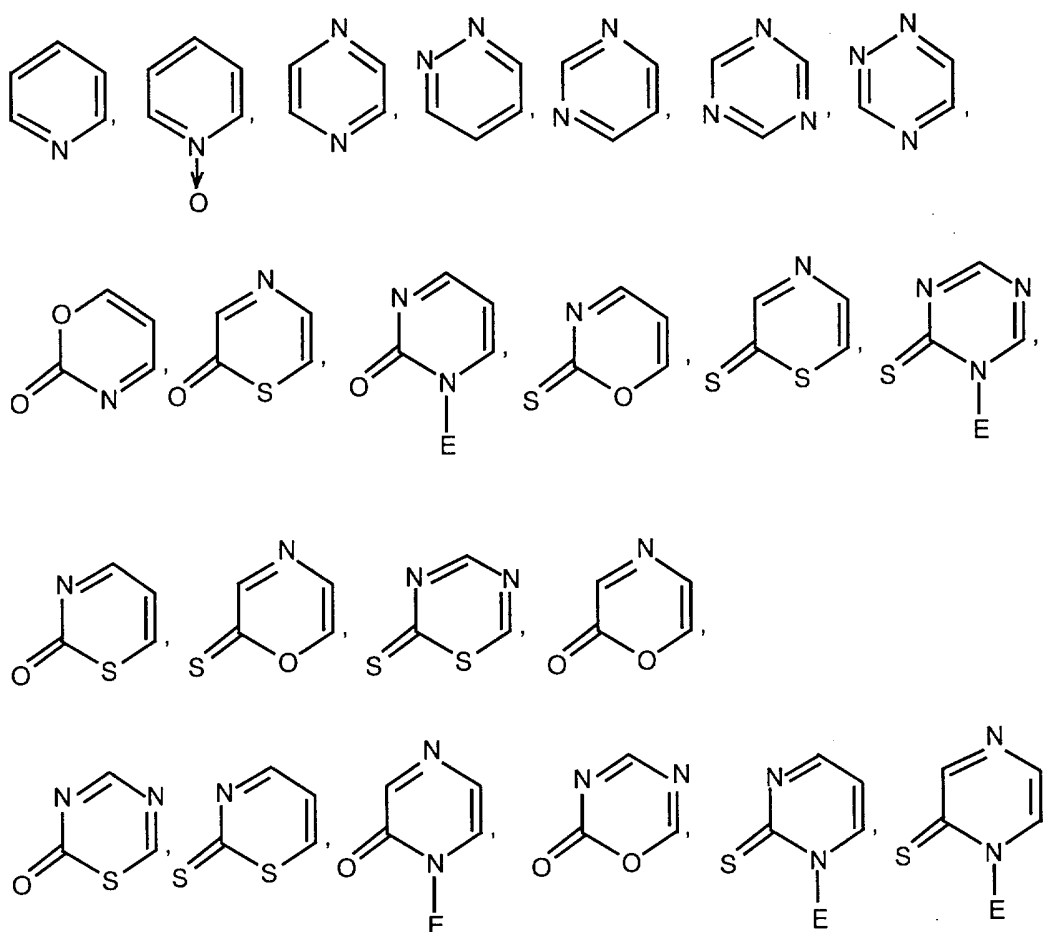
X žymi $N-NO_2$ arba $N-CN$, arba, reikalui esant, šio junginio tautomeras, laisvoje arba druskų formoje.

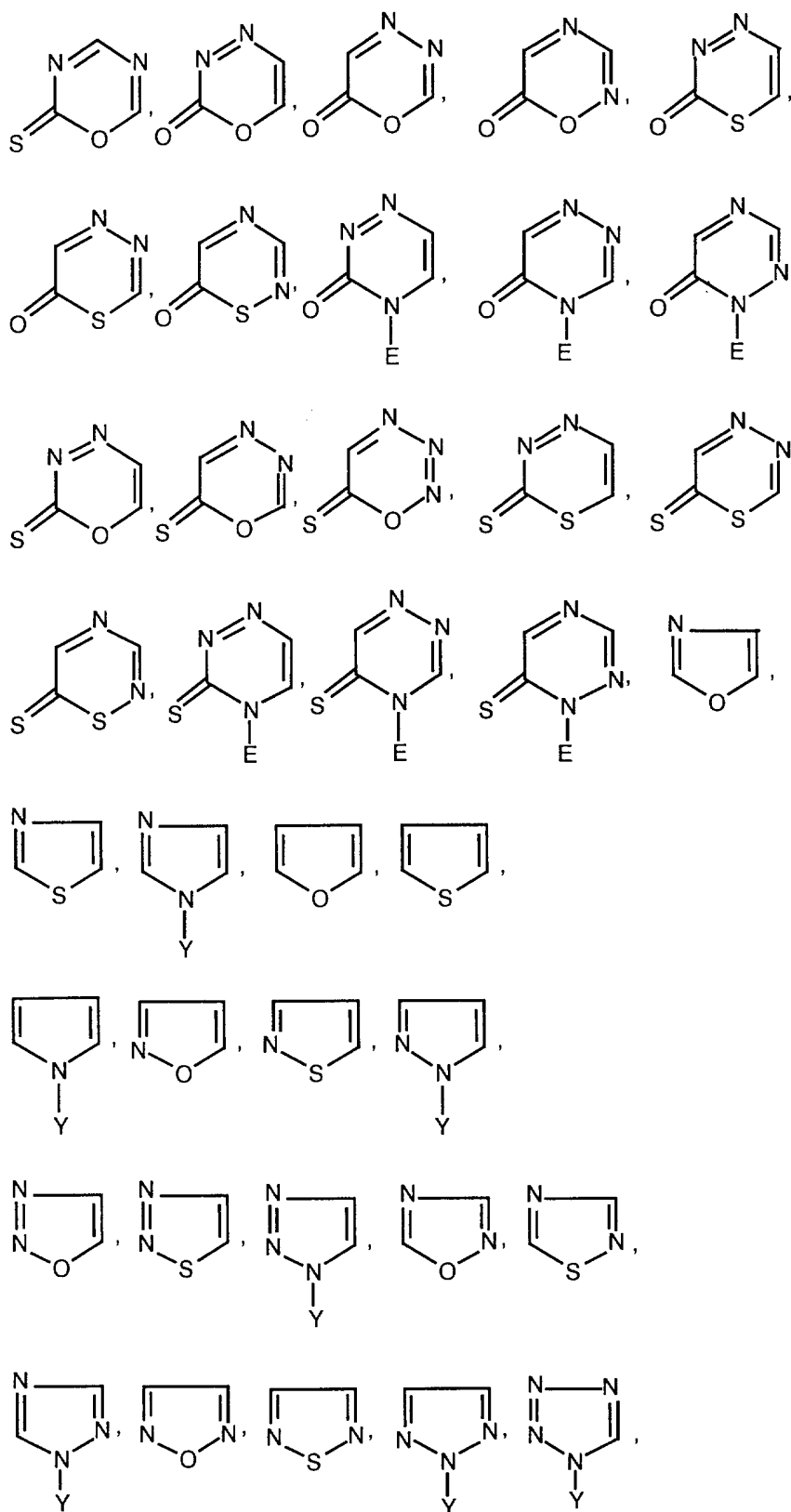
2. I formulės junginys pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad A yra žiedinis pagrindinis karkasas, sudarytas iš žiedo su 5 arba 6 nariais, prie kurio gali būti prisijungęs kitas žiedas su 5 arba 6 nariais, arba, reikalui esant, jo tautomeras.

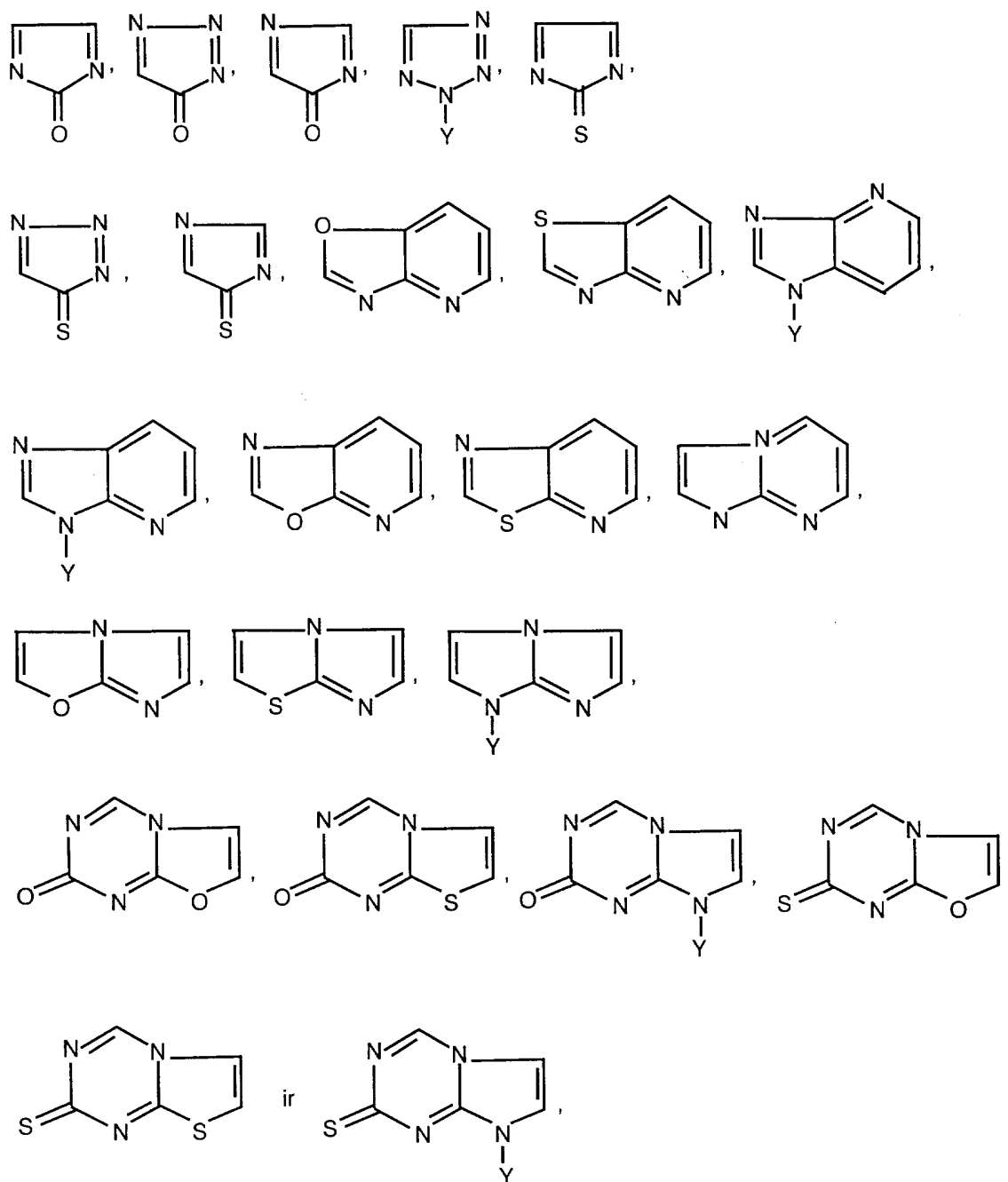
3. I formulės junginys pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad A yra žiedinis nesotus karkasas arba, reikalui esant, jo tautomeras.

4. I formulės junginys pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad A yra žiedinis pagrindinis karkasas, turintis 1-4 heteroatomus, arba, reikalui esant, jo tautomeras.

5. I formulės junginys pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad A yra žiedinis pagrindinis karkasas išrenkamas iš grupės, susidedančios iš žiedinių pagrindinių karkasų







kur E, atitinkamai, yra C_1 - C_3 -alkilas, Y, atitinkamai, yra vandenilis, C_1 - C_3 -alkilas arba ciklopropilas ir E arba Y, atitinkamai, nėra A pakaitai, o yra priskiriami A žiediniam pagrindiniam karkasui.

6. I formulės junginys pagal 5 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad A yra žiedinis pagrindinis karkasas, turintis 1, 2 arba 3 heteroatomus, išrinktus iš grupės, susidedančios iš deguonies, sieros ir azoto, ir iš žiediniame pagrindiniame karkase esančių heteroatomų daugiausiai vienas atomas yra deguonies atomas ir iš žiediniame pagrindiniame karkase esančių heteroatomų daugiausiai vienas atomas yra sieros atomas, ir, reikalui esant, jo tautomeras.

7. I formulės junginys pagal 6 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad A yra susijungęs su likusia I formulės junginio dalimi per savo žiedinio pagrindinio karkaso C atomą.

8. I formulės junginys pagal 7 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad A neturi pakaitų arba turi vieną arba du pakaitus, išrinktus iš grupės, susidedančios iš halogeno, C₁-C₃-alkilo, halogen-C₁-C₃-alkilo, C₁-C₃-alkoksi ir halogen-C₁-C₃-alkoksi, arba, reikalui esant, jo tautomeras.

9. I formulės junginys pagal 8 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad A žiedinis pagrindinis karkasas yra piridilo, 1-oksipiridinio arba tiazolilo grupė, arba, reikalui esant, jo tautomeras.

10. I formulės junginys pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad R yra C₁-C₆-alkilas, fenil-C₁-C₄-alkilas, C₃-C₆-cikloalkilas, C₃-C₄-alkenilas arba C₃-C₄-alkinilas, arba, reikalui esant, jo tautomeras.

11. I formulės junginys pagal 1 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad X yra N-NO₂ arba, reikalui esant, jo tautomeras.

12. I formulės junginys pagal 9 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad A yra per savo žiedinio pagrindinio karkaso C atomą su likusia I formulės junginio dalimi susijungusią, neturinčią pakaitų arba turinčią vieną arba du pakaitus, išrinktus iš grupės, susidedančios iš halogeno ir C₁-C₃-alkilo, piridilo, 1-oksipiridinio arba tiazolilo grupę, R žymi C₁-C₆-alkilą, fenil-C₁-C₄-alkilą, C₃-C₆-cikloalkilą, C₃-C₄-alkenilą arba C₃-C₄-alkinilą ir X žymi N-NO₂ arba N-CN, arba, reikalui esant, jo tautomeras.

13. I formulės junginys pagal 12 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad A yra 2-chlorpirid-5-il, 2-metilpirid-5-il, 1-oksido-3-piridinio, 2-chlor-1-oksido-5-piridinio, 2,3-dichlor-1-oksido-5-piridinio arba 2-chlortiazol-5-il grupę, R žymi C₁-C₄-alkilą ir X žymi N-NO₂.

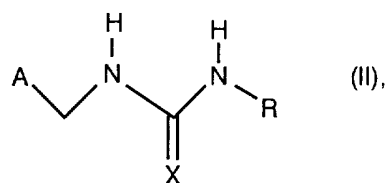
14. I formulės junginys pagal 13 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad A žymi 2-chlortiazol-5-il arba 2-chlorpirid-5-il grupę, R žymi C₁-C₄-alkilą ir X žymi N-NO₂.

15. I formulės junginys pagal 13 punktą, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad jis yra išrinktas iš grupės, susidedančios iš šių junginių:

- a) 5-(2-chlorpirid-5-ilmetil)-3-metil-4-nitroimino-perhidro-1,3,5-oksadiazino,
- b) 5-(2-chlortiazol-5-ilmetil)-3-metil-4-nitroimino-perhidro-1,3,5-oksadiazino,
- c) 3-metil-4-nitroimino-5-(1-oksido-3-piridiniometil)-perhidro-1,3,5-oksadiazino,
- d) 5-(2-chlor-1-oksido-5-peridiniometil)-3-metil-4-nitroimino-perhidro-1,3,5-oksadiazino ir
- e) 3-metil-5-(2-metilperid-5-ilmetil)-4-nitroimino-perhidro-1,3,5-oksadiazino.

16. I formulės junginio pagal 1 punktą arba, reikalui esant, jo tautomero, atitinkamai, laisvoje arba druskos formoje gavimo būdas, b e s i s k i - r i a n t i s tuo, kad

a) žemiau pateiktos formulės junginys



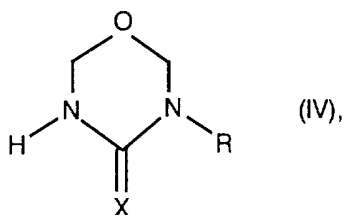
kuris yra žinomas arba gali būti gautas pagal analogiją su žinomais junginiais ir kur A, R ir X žymėjimai yra tokie patys, kaip I formulės atveju, arba jo tautomeras ir/arba jo druska, reaguoja, dažniausiai esant bazei arba dar rūgštiniam katalizatoriui, su formaldehidu arba paraformaldehidu arba

b) I formulės, kur R nėra vandenilis, junginio arba, reikalui esant, jo tautomero ir/arba druskos gavimui, pvz. pagal a) arba c) variantą, gaunamas I formulės, kur R yra vandenilis, junginys arba jo tautomeras ir/arba druska reaguoja, dažniausiai esant bazei, su žemiau pateiktos formulės junginiu

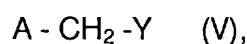


kuris yra žinomas arba gali būti gautas pagal analogiją su atitinkamais žinomais junginiais ir kur R žymėjimai yra tokie patys, išskyrus vandenilį, ir Y žymi galinę grupę, arba

c) žemiau pateiktos formulės junginys



kurioje R ir X žymėjimai yra tokie patys, kaip I formulės atveju, arba jo tautomeras ir/arba druska reaguoja, esant bazei, su žemiau pateiktos formulės junginiu



kuris yra žinomas arba gali būti gautas pagal analogiją su atitinkamais žinomais junginiais ir kur A žymėjimas yra toks pat, kaip I formulės atveju, ir Y žymi galinę grupę, arba, reikalui esant, su jo tautomeru ir/arba druska, ir/arba, jei norima, pagal gavimo būdą ar kitu būdu gautas I formulės junginys arba jo tautomeras, atsižvelgiant į aplinkybes, laisvoje arba druskos formoje yra pervedamas į kitą I formulės junginį arba jo tautomerą, pagal gavimo būdą gautas izomerų mišinys atskiriamas ir iš jo išskiriamas norimas izomeras ir/arba pagal gavimo būdą ar kitu būdu gautas laisvas I formulės junginys arba jo tautomeras pervedamas į druską, arba pagal gavimo būdą ar kitu būdu gauta I formulės junginio druska arba jo tautomeras pervedama į laisvą I formulės junginį arba jo tautomerą arba į kitą druską.

17. Kovos su kenkėjais priemonė, b e s i s k i r i a n t i tuo, kad joje yra bent vienas I formulės junginys pagal 1 punktą arba, reikalui esant, jo tautomeras, atsižvelgiant į aplinkybes, laisvoje arba agrochemiškai panaudojamos druskos formoje kaip biologiškai aktyvi medžiaga ir, reikalui esant, bent viena pagalbinė medžiaga.

18. Priemonės pagal 17 punktą panaudojimas vabzdžių naikinimui.

19. Priemonės pagal 17 punktą, turinčios bent vieną pagalbinę medžiagą, gavimo būdas, *b e s i s k i r i a n t i s* tuo, kad biologiškai aktyvi medžiaga sumaišoma ir/arba sumalama su pagalbine (pagalbinėmis) medžiaga (medžiagomis).

20. I formulės junginio pagal 1 punktą arba, reikalui esant, jo tautomero, atsižvelgiant į aplinkybes, laisvoje arba agrochemiškai panaudojamos druskos formoje panaudojimas priemonės pagal 17 punktą gavimui.

21. Priemonės pagal 17 punktą panaudojimas kovai su kenkėjais.

22. Panaudojimas pagal 21 punktą, *b e s i s k i r i a n t i s* tuo, kad kenkėjai yra vabzdžiai.

23. Panaudojimas pagal 21 punktą, *b e s i s k i r i a n t i s* tuo, kad priemonė pagal 17 punktą panaudojama augalinių sėklų apsaugai.

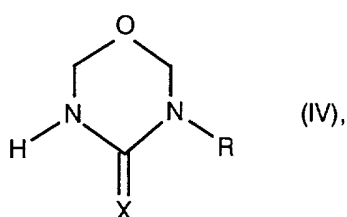
24. Kovos su kenkėjais būdas, *b e s i s k i r i a n t i s* tuo, kad priemonė pagal 17 punktą yra aplikuojama ant kenkėjų arba į jų gyvenamąją erdvę.

25. Būdo pagal 24 punktą panaudojimas vabzdžių naikinimui.

26. Būdas pagal 24 punktą augalinių sėklų apsaugai, *b e s i s k i r i a n t i s* tuo, kad yra apdorojamos sėklos arba sėjos vieta.

27. Augalinės sėklos, b e s i s k i r i a n č i o s tuo, kad jos apdorotos 26 punkte aprašytu būdu.

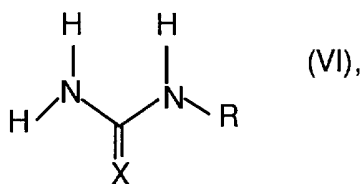
28. Žemiau pateiktos formulės junginys



kur R ir X žymėjimai yra tokie patys, kaip I formulės atveju, arba jo tautomeras, atsžvelgiant į aplinkybes, laisvoje arba druskos formoje.

29. IV formulės junginio pagal 28 punktą, reikalui esant, jo tautomero, atsižvelgiant į aplinkybes, laisvoje arba druskos formoje gavimo būdas, b e s i s k i r i a n t i s tuo, kad

d) žemiau pateiktos formulės junginys



kuris yra žinomas arba gali būti gautas pagal analogiją su žinomais atitinkamais junginiais ir kur R ir X žymėjimai yra tokie patys, kaip ir I formulės atveju, arba jo tautomeras ir/arba druska reaguoja su formaldehidu arba paraformaldehidu, pvz., analogišku būdu, kaip tai aprašyta a) variante atitinkamai II formulės junginio arba jo tautomero druskos reakcijai su formaldehidu arba paraformaldehidu, arba

e) IV formulės junginio, kur R nėra vandenilis, arba jo tautomero ir/arba druskos gavimui IV formulės junginys, kur R yra vandenilis, arba jo tautomeras ir/arba druska, gaunami pvz., pagal d) variantą, reaguoja su žemiau pateiktos formulės junginiu



kuris yra žinomas arba gali būti gautas pagal analogiją su žinomais junginiais ir kur R žymėjimai, išskyrus vandenilį, yra tokie patys, kaip ir I formulės atveju, ir Y yra galinė grupė, pvz., analogišku būdu kaip tai b) variante aprašyta atitinkamai I formulės junginio arba, reikalui esant, jo tautomero ir/arba druskos reakcijai su III formulės junginiu, ir/arba, jei pageidaujama, pagal gavimo būdą ar kitoku būdu gautas IV formulės junginys arba jo tautomeras, atsižvelgiant į aplinkybes, laisvoje arba druskos formoje, yra pervedamas į kitą IV formulės junginį arba jo tautomerą, pagal gavimo būdą gautas izomerų mišinys atskiriamas ir išskiriamas norimas izomeras ir/arba pagal gavimo būdą arba kitu būdu gautas IV formulės junginys arba jo tautomeras yra pervedamas į druską, arba pagal gavimo būdą ar kitu būdu gauta IV formulės junginio druska arba jo tautomero druska yra pervedama į laisvą IV formulės junginį arba jo tautomerą, arba į kitą druską.

30. IV formulės junginio pagal 28 punktą arba, reikalui esant, jo tautomero, atsižvelgiant į aplinkybes, laisvoje arba druskos formoje panaudojimas junginio pagal 1 punktą gavimui.