

Даний винахід відноситься до нових похідних 1-арилпіразолів, що мають ряд цінних властивостей в якості пестицидів або в якості проміжних сполук для одержання інших пестицидів. Далі даний винахід відноситься до композицій, що містять зазначені сполуки, і до способів, що використовують зазначені сполуки або в якості проміжних сполук для одержання інших пестицидів або для боротьби з членистоногими шкідниками, зокрема, до використання зазначених сполук або композицій у сільському господарстві для захисту тварин, особливо в якості пестицидів.

У Міжнародній патентній публікації №WO 87/03781 і в Європейських патентних публікаціях №0295117, 0154115 і 0201852 описані інсектицидні 1-(заміщений феніл)піразоли. У тексті цих патентних заяв або виданих за ними патентів зазначені також інші джерела відомого рівня техніки. У Міжнародних патентних публікаціях №WO 93/06089 і WO 94/21606 також розкриті інсектицидні 1-(4-SF₅-заміщений феніл)гетероцикли, що можуть бути піролами, а також імідазолами або піразолами. Вміст цих патентів істотно не відрізняється від Міжнародної патентної публікації №WO 87/03781 або від Європейської патентної публікації №0295117 у тій частині, що стосується піразолів.

Різні пестицидні піразоли були описані в різних патентах або патентних заявках: Європейських - 0418016, 0403309, 0352944; США - 5104994, 5079370, 5047550, 52321940, 4810720, 4804675, 5306694, 4614533, 5187185, 5223525 WO 93/06089, 94/21606 та WO 97/28126.

Оскільки існує множина шкідників і культурних рослин і умів зараження цих рослин шкідниками, існує потреба в нових пестицидних сполуках.

Ціллю даного винаходу є створення нових пестицидних сполук сімейства 1-арилпіразолу разом із способами їх одержання.

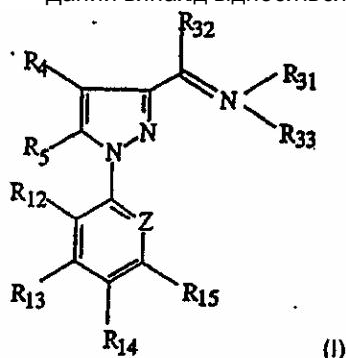
Ще одною ціллю даного винаходу є пестицидні композиції, і особливо проти комах, особливо для сільськогосподарських і садових культур, лісів, ветеринарії або скотарства, або для охорони здоров'я, а також способів використання пестицидних піразольних сполук проти членистоногих.

Третьою ціллю даного винаходу є створення дуже активних сполук із широким спектром пестицидної активності, а також сполук, що мають особливу селективну активність, наприклад, афіцидну, мітицидну, інсектицидну на листі, ґрунтову інсектицидну, системну активність, активність від поїдання корму або пестицидну активність при обробці насіння.

Ці й інші цілі, що вирішуються цілком або частково даним винаходом, стануть легко зрозумілими з наступного опису винаходу.

Даний винахід охоплює нові хімічні сполуки, що мають інсектицидну, мітицидну або нематоцидну активність, або активність проти гельмінтів.

Даний винахід відноситься до сполук загальної формули (I):



де R₃₁ може представляти:

H; CN; NO₂; SH; C₁-C₆алкілїогрупу; NH₂; P(O)(OR₈)(OR₉); або R₃₈, або моно(C₁-C₆алкіл)аміногрупу; ди(C₁-C₆алкіл)аміногрупу; форміл; (C₁-C₆алкіл); C₁-C₂₀алкіл; C₃-C₆циклоалкіл; або C₄-C₈(циклоалкіл)алкіл; причому кожний з алкілу і циклоалкілу заміщений, як варіант, одним або більше R₃₅; або

нафтил або феніл, кожний із котрих заміщений, як варіант, одним або більше R₃₆ або R₃₇; або

NH-CO-NH-N=CR₈R₉; NH-CS-NH-N=CR₈R₉; NH-CO-NR₈R₉;

NH-CS-NR₈R₉; NH-CO-OR₈; NH-CS-OR₈; або NH-CO-NH-NH₂;

R₃₂ може представляти алкіл (C₁-C₆), циклоалкіл (C₃-C₇), циклоалкілалкіл (C₄-C₈), причому кожний алкіл може бути заміщений одним або більше R₃₅; феніл, заміщений, як варіант, одним або більше R₃₆ або R₃₇; або R₃₈;

R₃₃ представляє вільну пару електронів, або атом оксигену, або атом сульфору (коли R₃₃ представляє атом оксигену або атом сульфору, він може бути пов'язаний з атомом нітрогену ковалентним зв'язком або зв'язком, що може бути частково ковалентним і частково йонним), або алкіл(C₁-C₆)групу, причому атом нітрогену, із яким пов'язаний R₃₃, знаходиться тоді в катіонній формі N⁺ (коли R₃₃ представляє алкільну групу, зв'язок між атомом нітрогену і R₃₃ є простим зв'язком; і сполука формули (I) тоді представляє сіль імінію); або R₃₁ і R₃₃ разом утворюють C₂-C₆алкілен, де один або два з атомів карбону замінені кожний, як варіант, гетероатомом, обраним із групи, що складається з O, S і N (причому конкретний N і зв'язок меду N і R₃₃ такі ж, що зазначені для випадку, коли R₃₃ - алкіл);

R₃₅ представляє галоген, аміногрупу, C₁-C₆алкіламіногрупу, ди(C₁-C₆алкіл)аміногрупу, NO₂, CN, C₁-C₆алкоксил, (C₁-C₆алкокси)карбоніл, гідроксикарбоніл, (C₁-C₆алкіл)карбоніл, метилен, метилідин, C₁-C₆алкініл, алкілалкініл(C₁-C₆алкіл; C₁-C₆алкініл); або R₃₅ може представляти заміщений, як варіант, феніл одним або більше R₃₆, або R₃₅ може представляти гетероциклічне кільце, що містить усього від 3 до 7 атомів, із яких від 1 до 4 є гетероатомами, причому зазначені гетероатоми є однаковими або різними, і обрані з групи, що складається з O, S і N, зазначене гетероциклічне кільце є насиченим або ненасиченим і заміщене, як варіант,

одним або більше R_{36} , або R_{35} може представляти OH , SH , C_1-C_6 алкілтіогрупу, C_1-C_6 алкілсульфініл, C_1-C_6 алкілсульфоніл, амінокарбоніл, $(C_1-C_6$ алкіл) амінокарбоніл, $ди(C_1-C_6$ алкіл)амінокарбоніл, $(C_1-C_6$ алкокси)карбоніл або $P(O)(OR_8)(OR_9)$;

R_{36} може представляти SF_5 , галоген, C_1-C_6 алкіл, C_1-C_6 гідроксіалкіл, NO_2 , CN , аміногрупу, C_1-C_6 алкіламіногрупу, $ди(C_1-C_6$ алкл)аміногрупу, $ди(C_1-C_6$ алкіл)амінокарбоніламіногрупу, $(C_1-C_6$ алкіл)амінокарбоніламіногрупу, амінокарбоніламіногрупу, $(C_1-C_6$ алкіл)карбоніл, $(C_1-C_6$ алкокси)карбоніл, $(C_1-C_6$ алкіл)карбоніламіногрупу, $(C_1-C_6$ алкокси)карбоніламіногрупу, амінокарбоніл, $ди(C_1-C_6$ алкіл)амінокарбоніл, $(C_1-C_6$ алкіл)амінокарбоніл, гідроксикарбоніл, амінокарбонілоксил $(C_1-C_6$ алкіл)амінокарбонілоксил, $ди(C_1-C_6$ алкіл)амінокарбонілоксил, гідроксил, C_1-C_6 алкоксил, C_1-C_6 галогеналкіл, C_1-C_6 галогеналкоксил, C_1-C_6 алкілтіогрупу, C_1-C_6 алкіл-сульфініл, C_1-C_6 алкілсульфоніл, C_1-C_6 галогеналкілтіогрупу, C_1-C_6 галогеналкілсульфініл, C_1-C_6 галогеналкілсульфоніл, $P(O)(OR_8)(OR_9)$, $(C_1-C_6$ алкіл)[$(C_1-C_6$ алкіл)карбоніл]аміногрупу або феніламіно(C_1-C_6 алкіл);

R_{37} може представляти R_{36} або заміщений, як варіант, одним або більше R_{36} феніл, заміщений, як варіант, одним або більше R_{36} феноксил, або заміщений, як варіант, одним або більше R_{36} бензил;

R_{38} представляє гетероциклічний радикал, отриманий з одного гетероциклічного кільця або з гетероциклічної системи двох сконденсованих кілець, у якій, принаймні одна кілець є гетероциклічним, причому кожне з кілець містить від 3 до 7 атомів у кільці, кожне гетероциклічне кільце містить від 1 до 4 кільцевих гетероатомів, причому зазначені гетероатоми кільця однакові або різні, і обрані з групи, що складається з O , S і N , кожне кільце може бути насиченим або ненасиченим; такими гетероциклічними радикалами можуть бути, наприклад, радикали, похідні з таких сполук: піридину, піримідину, оксазолу, оксадіазолу, оксатріазолу, ізоксазолу, тіазолу, ізотіазолу, імідазолу, пірану, пірону, піразолу, піролу, тетразолу, фуросану, тетрагідрофуранілу, фурану, азіну, піридазину, бензімідазолу, хіноліну, ізохіноліну, тріазину, тіофену, фуropірану, фуropірону, тіатріазину, тіадіазолу, причому усі з цих гетероциклічних радикалів можуть бути приєднані до нітрогену групи $R_{32}-C=N-R_{31}$ у будь-якому можливому положенні гетероциклічного кільця, і всі кільця можуть бути заміщені, як варіант, одним або більше R_{36} або фенілом, заміщеним, як варіант, одним або більше R_{36} ;

R_8 або R_9 незалежно обрані з H і C_1-C_6 алкілу, що, як варіант, містить один або більше замісників, що обрані з групи, яка складається з галогену, NO_2 , CN , CHO , OH , C_1-C_6 алкоксилу, C_1-C_6 алкілтіогрупи, C_1-C_6 алкілсульфінілу, C_1-C_6 алкілсульфонілу, $(C_1-C_6$ алкіл)карбонілу, гідроксикарбонілу і карбамоїлу;

R_4 представляє R_{11} або $S(O)_nR_{11}$;

R_{11} представляє C_1-C_6 алкіл, C_3-C_8 циклоалкіл або C_4-C_8 (циклоалкіл)алкіл, кожний із котрих заміщений, як варіант, одним або більше атомами галогену;

n дорівнює 0, 1 або 2;

R_5 представляє H , галоген, CN , $S(O)_nR_8$, OR_8 , NR_8R_9 , $N(R_8)CON(R_8)(R_9)$, азидогрупу, або $-N=C(R_{10})(OR_9)$;

R_{10} може мати ті ж значення, що і R_8 , і також може представляти бензил або феніл, що заміщено, як варіант, одним або більше R_{36} ;

Z представляє N або $C-R_{16}$; і

Кожний $R_{12}-R_{16}$ може представляти H , галоген, R_8 , OR_8 , SF_5 , $S(O)_nR_8$, CN , NO_2 , CHO , $C(O)R_8$, або $COO(R_8)$; а також їх пестицидно прийнятних солей.

Всі стереоізомери, геометричні ізомери (E та Z форми для імінів), оптичні ізомери і діастереомери загальної формули (I), а також їх таутомери (якщо вони існують) і їх суміші усі включено в рамки даного винаходу.

Солі зазначених сполук також включені в рамки винаходу, особливо солі натрію, калію або амонію чи імінію. Солі лужних або лужноземельних металів або солі амонію звичайно одержують зі сполук формули (I), де R_{33} представляє електронну пару, а R_{31} представляє гідроген. Солі імінію звичайно одержують із сполук формули (I), у яких R_{33} представляє електронну пару, а R_{31} має значення, зазначені раніше для формули (I).

Якщо немає інших вказівок, алкільні радикали й алкільні фрагменти інших радикалів містять від 1 до 20, переважно від 1 до 10, краще від 1 до 6 атомів карбону, і можуть бути з прямим або розгалуженим ланцюгом. Аналогічно, якщо немає інших вказівок, алкоксирадикали та алкоксифрагменти інших радикалів містять від 1 до 6 атомів карбону і можуть бути з прямим або розгалуженим ланцюгом.

Алкільні фрагменти діалкіламініорадикалів і інших радикалів, які містять діалкіламінофрагменти, можуть бути однаковими або різними, наприклад N,N -диметиламіногрупою, N,N -діетиламіногрупою, (N -етил- N -метил)аміногрупою.

Термін "галоген", використовуваний тут перед назвою радикалу, означає, що радикал заміщений одним або більше атомами галогену, що можуть бути однаковими або різними. Так, термін "галогеналкіл", використовуваний тут, означає алкіл, що містить в якості замісників один або більше атомів галогену, що можуть бути однаковими або різними, і у такий спосіб включає моногалогеналкіл і полігалогеналкіли (тобто, що містять більше одного атома галогену в якості замісників), останній термін, у свою чергу, включає пергалогеналкіл (тобто цілком заміщений атомами галогену).

Термін "галогеналкоксил" аналогічно включає моногалогеналкоксил і полігалогеналкоксил, причому останній, у свою чергу, включає пергалогеналкоксил.

Термін "галоген" включає F , Cl , Br і I . Коли в якості замісників присутні більше одного атома галогену, як наприклад, на фенільному кільці, вони можуть бути однаковими або різними.

Даний винахід відноситься далі до композицій зазначених сполук і до способів, в яких використовують зазначені сполуки для боротьби з членистоногими, нематодами, гельмінтами або найпростішими шкідниками. Зокрема, він стосується застосування сполук або їхніх композицій, що їх містять, у сільському господарстві, особливо в якості пестицидів.

У даному описі термін іміні використовується в назвах сполук, що містять групу $C=NR$.

У однім аспекті згідно з винаходом запропоновані сполуки для використання в боротьбі з членистоногими,

нематодами, гельмінтами або найпростішими шкідниками, причому зазначені сполуки мають загальну формулу (I). У іншому аспекті згідно з винаходом запропоновано пестицидну композицію (тобто композицію проти членистоногих, нематод, гельмінтів або найпростіших), що включає пестицидно ефективну кількість (тобто кількість, ефективну для знищення членистоногих, нематод, гельмінтів або найпростіших) сполуки формули (I) і прийнятний у сільському господарстві інертний носій для неї. Вираз «сполука формули (I)» тут і далі у всьому описі включає різні стереоізомерні форми сполук формули (I).

У ще однім аспекті згідно з винаходом запропонований спосіб боротьби з членистоногими, нематодами, гельмінтами або найпростішими в локусі або місцях їх поширення, причому зазначений спосіб включає застосування до зазначеного локусу пестицидно ефективної кількості (тобто кількості, що ефективна для знищення членистоногих, нематод, гельмінтів або найпростіших) сполуки формули (I), або визначеної вище пестицидної композиції.

Кращі сполуки згідно з винаходом відрізняються однією або більше із таких характеристик:

Z представляє C-R₁₆;

R₁₂ представляє хлор або бром;

R₁₃ і R₁₅ представляють H;

R₁₄ представляє пергалогеналкіл, пергалогеналкоксил або SF₅, переважно CF₃, OCF₃ або SF₅;

R₁₆ представляє хлор або бром;

R₃₁ представляє аміногрупу; алкіл, заміщений, як варіант, одним або більше R₃₅; феніл, заміщений, як варіант, R₃₆ або R₃₇; R₃₈; NH-CO-NH-N=CR₈R₉; NH-CS-NH-N=CR₈R₉; NH-CO-NR₈R₉; NH-CS-NR₈R₉; NH-CO-OR₈ або NH-CS-OR₈;

R₃₂ представляє C₁-C₆алкіл, переважно метил;

R₃₃ представляє вільну пару електронів або оксиген, переважно вільну пару електронів;

R₄ представляє S(O)_nR₁₁;

R₁₁ представляє метил або етил;

n дорівнює 0 або 1, переважно 1; або

R₅ представляє NR₈R₉; переважно NH₂ або NHR₉.

Кращі сполуки згідно з винаходом включають одну або більше із відмінних рис, представлених далі в зв'язку з такими класами кращих сполук:

Перший клас кращих сполук включає сполуки, в яких:

R₃₂ представляє C₁-C₆алкіл; Z представляє C-R₁₆; R₄ представляє S(O)_nR₁₁;

R₁₃ і R₁₅ представляють H; а R₁₄ представляє пергалогеналкіл, пергалогеналкоксил або SF₅.

Другий клас кращих сполук включає сполуки, в яких:

R₃₂ представляє CH₃; R₄ представляє S(O)_nR₁₁; а R₁₁ представляє метил або етил.

Третій клас кращих сполук включає сполуки, у яких:

R₁₄ представляє CF₃, OCF₃ або SF₅; а R₁₂ і R₁₆ представляють хлор або бром.

Четвертий клас кращих сполук включає сполуки, у яких:

R₅ представляє аміногрупу або алкіламіногрупу, де алкіл заміщений, як варіант, CN, CO-NH₂, алкоксикарбоніл, алкоксил, алкілтіогрупу, алкілсульфініл або алкілсульфоніл.

П'ятий клас кращих сполук включає сполуки, у яких:

R₃₃ представляє вільну пару електронів або оксиген;

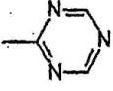
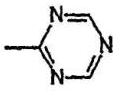
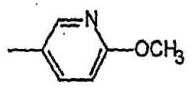
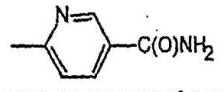
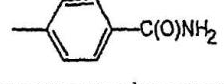
R₃₁ представляє аміногрупу; алкіл, заміщений, як варіант, одним або більше R₃₅, феніл, заміщений, як варіант, R₃₆ або R₃₇; R₃₈; NH-CO-NH-N=CR₈R₉; NH-CS-NH-N=CR₈R₉; NH-CO-NR₈R₉; NH-CS-NR₈R₉; NH-CO-OR₈; або NH-CS-OR₈;

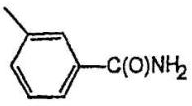
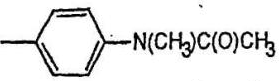
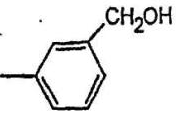


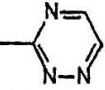
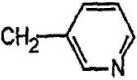
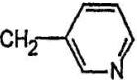
Сполуки, що представляють особливу цінність згідно з винаходом, є сполуками, у котрих R₁₂=R₁₆=Cl; R₁₃=R₁₅=H; R₁₄=CF₁₃; R₅=NH₂; R₃₂=CH₃; R₃₃ представляє вільну пару електронів, а R₄ і R₃₃ мають значення відповідно такій таблиці:

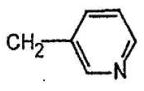
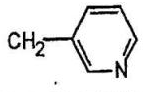
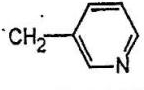
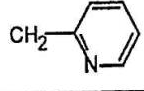
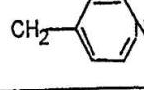
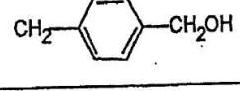
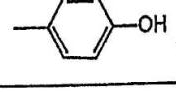
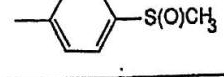
R ₄	R ₃₁
SOCH ₃	CH ₃
SOCH ₃	Et
SOCH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃
SOCH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
SOCH ₃	CH ₂ CH=CH ₂
SOCH ₃	CH ₂ CH ₂ Ph
SOCH ₃	CH ₂ CH ₂ CN
SOCH ₃	CH ₂ CH ₂ C(O)NH ₂
SOCH ₃	CH ₂ C(O)CH ₃
SOCH ₃	CH ₂ C(O)OCH ₃
SOCH ₃	CH ₂ CH ₂ COOCH ₃
SOCH ₃	CH ₂ CH ₂ COOH
SOCH ₃	CH ₂ C(O)OC ₂ H ₅
SOCH ₃	CH ₂ OCH ₃
SOCH ₃	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃
SOCH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃
SOCH ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ CH ₃
SOCH ₃	CH ₂ CH ₂ NH ₂
SOCH ₃	CH ₂ CH ₂ NO ₂
SOCH ₃	CH ₂ CH ₂ COOC ₂ H ₅

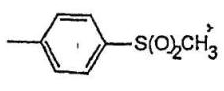
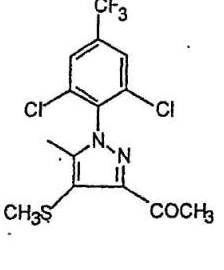
SOCH ₃	CH(CH ₃)CH ₂ COOH
SOCH ₃	CH ₂ COOH
SCH ₃	CH ₂ COOH
S(O)Et	CH ₃ COOH
S(O) ₂ Et	CH ₂ COOH
SEt	CH ₂ COOH
SOCH ₃	CH(CH ₃)COOCH ₃
SOCH ₃	CH(COOCH ₃)CH ₂ CONH ₂
SOCH ₃	CH(COOCH ₃)CH ₂ COOH
SOCH ₃	CH(COOCH ₃)CH ₂ SCH ₃
SOCH ₃	CH(COOH)CH ₂ CH ₂ CH ₂ COOCH ₃
SOCH ₃	CH(COOH)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CONH ₂
SOCH ₃	CH ₂ CH ₂ -4-імідазол
SOCH ₃	CH(COOCH ₃)-4-імідазол
SOCH ₃	CH(COOC ₂ H ₅)CH(CH ₃)CH ₂ C ₂ H ₅
SOCH ₃	CH(COOC ₂ H ₅)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
SOCH ₃	(CH ₂) ₄ CH(NH ₂)COOH
SOCH ₃	CH(COOH)CH ₂ CH ₂ SCH ₃
SOCH ₃	CH(COOH)(CH ₂) ₃ CH ₃
SOCH ₃	CH(COOCH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
S(O) ₂ CH ₃	CH(COOCH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃
SOCH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₄ CH(NH ₂)COOCH ₃

SOCH ₃	CH ₂ (CH ₂) ₃ CH(NH ₂)COOCH ₃
SOCH ₃	C(COOCH ₃)(SH)CH(CH ₃) ₂
SOCH ₃	CH(COOH)CH ₂ C ₆ H ₅
SOCH ₃	CH(COOCH ₃)CH ₂ OH
SOCH ₃	CH(COOCH ₃)(OH)CHCH ₃
SOCH ₃	CH(COOC ₂ H ₅)CH ₂ C ₆ H ₄ (4-OH)
SOCH ₃	CH(COOCH ₃)CH(CH ₃) ₂
SOCH ₃	(CH ₂) ₄ COOH
SOCH ₃	(CH ₂) ₅ COOH
SOCH ₃	N(CH ₃) ₂
SOCH ₃	P(O)(CH ₃) ₂
SOCH ₃	CH ₂ CH ₂ S(O) ₂ CH ₃
SOCH ₃	NO ₂
SOCH ₃	NHCH ₂ C ₆ H ₅
SOCH ₃	NHCH ₂ CH=CH ₂
SOCH ₃	NHCH ₂ C≡CH ₂
SOCH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃
SOCH ₃	циклогексиламін
SOCH ₃	CH ₂ CH(OH)CH ₃
SOCH ₃	2- піридил
SCH ₃	2- піридил
S(O)Et	2- піридил

$3(\text{O})_2\text{Et}$	2-піридил
SEt	2-піридил
SOCH_3	3-піридил
SOCH_3	4-піридил
SO_2CH_3	2-піридил
SOCH_3	
SO_2CH_3	
SOCH_3	
SOCH_3	
SOCH_3	

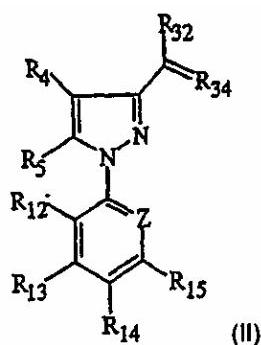
SOCH ₃	
SOCH ₃	
SOCH ₃	
SOCH ₃	
SOCH ₃	
SOCH ₃	
SOCH ₃	
SCH ₃	

S(O)Et	
S(O) ₂ Et	
SEt	
SOCH ₃	
SOCH ₃	
SOCH ₃	
SOCH ₃	
SOCH ₃	

SOCH ₃	
SCH ₃	

У наступному описі символи, що конкретно не визначені, варто розглядати як символи, «що мають визначені раніше значення».

Сполуки загальної формули (I) можуть бути отримані за допомогою взаємодії сполук загальної формули (II)



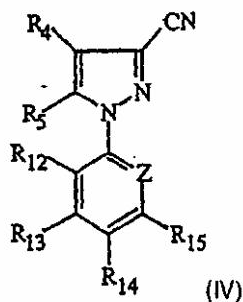
де R_4 - атом оксигену, із відповідним аміном загальної формули (III): $R_{31}-NH_2$. У такий спосіб одержують сполуки формули (I), у яких R_{33} є вільною парою електронів.

Ця трансформація (перетворення) є, по суті, дегідратацією, що переважно може проходити у присутності розчинника. Температура реакції для досягнення трансформації може бути в інтервалі від приблизно $-78^\circ C$ до приблизно $200^\circ C$, переважно від приблизно $-20^\circ C$ до приблизно $120^\circ C$. Можуть допомогти такі каталізатори, як дегідрувальні агенти. Серед можливих дегідрувальних агентів можна згадати основи, або кислоти, або молекулярні сита.

Реакцію можна вести в різних розчинниках, включаючи (але не обмежуючись ними) такі органічні ароматичні розчинники, як бензол, толуол, ксилол; такі спирти, як метанол, етанол, ізопропанол, етиленгліколь, пропіленгліколь; такі етери, як тетрагідрофуран, етиловий етер, диметоксіетан, диглім, діоксан, краун-етери; такі галогеновані вуглеводні, як метиленхлорид, хлороформ; такі амідні, як диметилформамід; такі кетони, як ацетон. Реакцію можна також провести в змішаному розчиннику. При можливості часто може допомогти азеотропне видалення води.

Приклади каталізаторів, що можна використовувати у вищевказаній трансформації, включають гідроксиди лужних металів і триалкіламіни, а також неорганічні й органічні кислотні каталізатори. Прикладами останніх двох каталізаторів є гідрохлоридна кислота і пара-толуолсульфонова кислота.

Сполуку формули (II) у котрій R_{34} - оксиген, можна одержати зі сполук формули (IV)



за допомогою реакції з реактивом Грин'єра, що включає магнійорганічну сполуку формули $R_{31}-Mg-X$, де X представляє атом галогену, переважно хлор, бром або йод. Найкращий хлор. Реакцію ведуть у рідкому розчиннику (такому, як етер, галоген, ароматичний розчинник, амід або їх суміш) при температурі в інтервалі від приблизно $-70^\circ C$ до приблизно $150^\circ C$, у залежності від конкретного реагенту і розчиннику.

Реагенти формули (IV) можна одержати у відповідності з описаними в цитованих вище відомих роботах способами.

Сполуки формули (I), у яких R_{33} представляє атом оксигену або сульфору, можна одержати зі сполук формули (II), реакцією з аміном формули $R_{31}-NHOH$ або $R_{11}NHSH$, що дає безпосередньо відповідні сполуки формули (I), у котрих R_{33} представляє оксиген або сульфур. Реакцію можна провести в рідкому органічному розчиннику при температурі в інтервалі від приблизно $-30^\circ C$ до приблизно $150^\circ C$.

Сполуки формули $R_{31}-NHOH$ або $R_{11}-NHSH$ відомі, або можуть бути отримані спеціалістами в даній області техніки.

Утворення солей імінію у випадку, коли R_{33} представляє алкіл, або R_{33} і R_{31} разом утворюють двовалентну групу, можна досягти взаємодією кетону або тіокетону з вторинним аміном в умовах, аналогічних описаним вище для загального способу.

У багатьох описаних вище перетвореннях очевидно, що обрані замісники можуть іноді заважати здійсненню реакцій. Таких небажаних ефектів можна уникнути, використовуючи для запобігання небажаних побічних реакцій відповідні захисні групи. Можна також використовувати реагенти, що не впливають на функціональні групи, інші за ті, що бажано змінити. Конкретний вибір відповідних захисних груп і реагентів легко зрозумілий спеціалісту. У якості джерела знань спеціалістів розглядається і пропонується, використання Chemical Abstracts і всіх доступних комп'ютеризованих банків для вибору відповідного з різних описаних у даному описі способів.

Для подальшої ілюстрації даного винаходу і його переваг, нижче приводяться такі конкретні приклади, але варто розуміти, що ці приклади наведені лише для ілюстрації, і вони ніяк не обмежують рамок винаходу.

Приклад 1

Одержання N-феніл-5-аміно-1-[2,6-дихлор-4-(трифлуорметил)феніл]-4-метилсульфініл-1H-піразол-3-іл)етаніміну (Сполука №6):

Суміш 3-ацетил-5-аміно-1-[2,6-дихлор-4-(трифлуорметил)феніл]-4-метилсульфініл-1H-піразолу (1,0г,

2,5ммоль), п-толуолсульфонової кислоти (47,5мг, 0,25ммоль), аніліну (232,5мг, 2,5ммоль) і бензолу (20мл) нагрівають при перемішуванні протягом 15 годин до дефлегмації з видаленням води. Суміш випарюють, потім хроматографують, одержуючи 360мг сполука №6 (Т.пл. приблизно 179°C).

Приклад 2

Одержання N-(2,4-дихлорфеніл)-[5-аміно-1-[2,6-дихлор-4-(трифлуорметил)феніл]-4-метилсульфініл-1Н-піразол-3-іл]етаніміну (Сполука №41):

Суміш 3-ацетил-5-аміно-1-[2,6-дихлор-4-(трифлуорметил)феніл]-4-метилсульфініл-1Н-піразолу (100мг, 0,25ммоль), тетраклориду титану (0,25мл, 0,25ммоль), 2,4-дихлораніліну (202мг, 1,25ммоль), тріетиламіну (0,104мл, 0,75ммоль) і метиленхлориду (2мл) перемішують протягом 12 годин при 20°C. Отриману суміш піддають хроматографії, одержуючи 80мг сполуки №41 (Т.пл. 83°C).

Приклад 3

Одержання N-(метоксикарбоніламіно)-[5-аміно-1-[2,6-дихлор-4-(трифлуорметил)-феніл]-4-метилсульфініл-1Н-піразол-3-іл]етаніміну (Сполука №2):

Суміш 3-ацетил-5-аміно-1-[2,6-дихлор-4-(трифлуорметил)феніл]-4-метилсульфініл-1Н-піразолу (1г, 2,5ммоль), метоксикарбонілгідрозину (0,236г, 2,625ммоль) і метанолу (10мл) перемішують 2 доби при 20°C. Суміш випарюють, потім хроматографують, одержуючи 536мг сполуки №2 у вигляді білого порошку (Т.пл. приблизно 121°C).

Приклад 4

Одержання N-оксиду N-метил-[5-аміно-1-[2,6-дихлор-4-(трифлуорметил)феніл]-4-метилсульфініл-1Н-піразол-3-іл]етаніміну (Сполука №4):

Суміш 2,0г, (0,005моль) 3-ацетил-5-аміно-1-[2,6-дихлор-4-(трифлуорметил)феніл]-4-метилсульфініл-1Н-піразолу, 0,83г (0,01моль) гідрохлориду N-метилгідроксиламіну, 1,21мл (0,015моль) піридину і 150мл метанолу перемішують 68 годин при 20°C. Суміш послідовно випарюють, промивають метиленхлоридом і водою; фільтрують, промивають гарячим ацетонітрилом, ацетоном, гарячим метанолом і сушать, одержуючи 0,79г сполуки №4 (Т.пл. приблизно 228°C).

Приклад 5

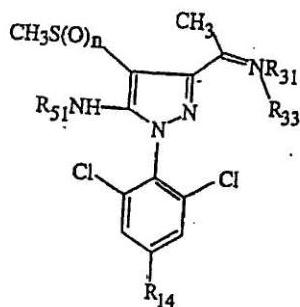
Одержання N-[[[1-[5-аміно-1-[2,6-дихлор-4-(трифлуорметил)-феніл]-4-(метилтіо)-1Н-піразол-3-іл]етиліден]]-4-(метилтіо)-3-[1-(феніламіно)етил]-1Н-піразол-5-аміну (Сполука №22):

Суміш продукту прикладу 1 (2,5г, 5,5ммоль) і метанолу (25мл) перемішують з борогідридом натрію (0,41г, 11ммоль) при кімнатній температурі. Метанол видаляють при зниженому тиску, а залишок розподіляють між метиленхлоридом і водою. Отриману органічну фазу сушать над сульфатом натрію, фільтрують, концентрують і очищають за допомогою колоночної хроматографії, одержуючи 77мг сполуки №22 (Т. плавлення приблизно 189°C).

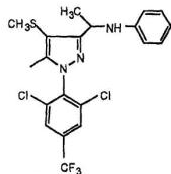
Сполуки, що наведені в Таблиці 1 далі, можна одержати, адаптуючи способи попередніх прикладів, і модифікуючи їх, як це зрозуміло спеціалістам. У тих випадках, коли не наведена Т.пл., сполуки охарактеризовані за допомогою Мас-спектрометрії.

Таблиця 1

Сполуки Таблиці (I) мають загальну формулу (Е представляє вільну пару електронів):







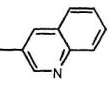

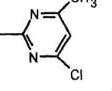


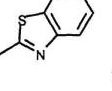
Сполука	R ₅₁	R ₃₁	n	R ₃₁	R ₁₄	°C Т.пл.
1	NH ₂	E	1	H	CF ₃	212
2	NHC(O)OCH ₃	E	1	H	CF ₃	121
3	H	E	1	H	CF ₃	180
4	CH ₃	O	1	H	CF ₃	228
5	NHC(O)NH ₂	E	1	H	CF ₃	114
6	Феніл	E	1	H	CF ₃	179
7	CH ₂ CH ₂ OH	E	1	H	CF ₃	93
8		E	0	H	CF ₃	oil







9	CH ₃	O	0	H	CF ₃	196
10	CH ₃	O	2	H	CF ₃	240
11	CH ₃	O	1	CH ₃	CF ₃	155
12	4-(OCH ₃)C ₆ H ₄	E	1	H	CF ₃	oil
13	CH ₃	O	1	H	SF ₅	oil
14	NHC(O)NHN=C(CH ₃) ₂	E	1	H	CF ₃	209
15	NHC(O)NHNH ₂	E	1	H	CF ₃	197
16	3-(OCH ₃)C ₆ H ₄	E	1	H	CF ₃	95
17	4-ClC ₆ H ₄	E	1	H	CF ₃	165
18	3-BrC ₆ H ₄	E	1	H	CF ₃	176
19	3-NO ₂ C ₆ H ₄	E	1	H	CF ₃	170
20	3-OH-4-OCH ₃ -C ₆ H ₄	E	1	H	CF ₃	120
21	NHC(S)NHN=C(CH ₃) ₂	E	1	H	CF ₃	200
22		E	0	H	CF ₃	189
23	(3-OCH ₃)(5-OCH ₃)C ₆ H ₃	E	1	H	CF ₃	70
24	4-NO ₂ C ₆ H ₄	E	1	H	CF ₃	oil
25	3-CNC ₆ H ₄	E	1	H	CF ₃	95
26	4-CNC ₆ H ₄	E	1	H	CF ₃	131
27	3-SCH ₃ C ₆ H ₃	E	1	H	CF ₃	107
28	3,4-Cl ₂ C ₆ H ₃	E	1	H	CF ₃	172
29	3,5-Cl ₂ C ₆ H ₃	E	1	H	CF ₃	172
30	4-F-C ₆ H ₄	E	1	H	CF ₃	191
31	CH ₂ COOCH ₃	E	1	H	CF ₃	oil
32	3-ClC ₆ H ₄	E	1	H	CF ₃	162
33	2-FC ₆ H ₄	E	1	H	CF ₃	163
34	4-CF ₃ C ₆ H ₄	E	1	H	CF ₃	156
35	CH ₂ Ph	E	1	H	CF ₃	188
36	3-FC ₆ H ₄	E	1	H	CF ₃	175
37	4-CH ₃ C ₆ H ₄	E	1	H	CF ₃	85

41	(2,4-Cl ₂)C ₆ H ₃	E	1	H	CF ₃	183
42	3-CH ₃ C ₆ H ₄	E	1	H	CF ₃	166
43	(2,4-F ₂)C ₆ H ₃	E	1	H	CF ₃	179
44	(3,4-F ₂)C ₆ H ₃	E	1	H	CF ₃	186
45	(2-CH ₃ -4-F)C ₆ H ₄	E	1	H	CF ₃	oil
46	CH ₂ -(2-тетрагідрофуран)	E	1	H	CF ₃	90
47	CH ₂ -(2-фуран)	E	1	H	CF ₃	88
48	CH ₂ CH=CH ₂	E	1	H	CF ₃	134
49	2-CH ₃ C ₆ H ₄	E	1	H	CF ₃	72
50	C ₆ H ₅	E	2	H	CF ₃	186
51	(2-Cl-4-S(O) ₂ CH ₃)C ₆ H ₃	E	2	H	CF ₃	
52	(2-Cl-4-Br)C ₆ H ₃	E	1	H	CF ₃	175
53	(2-F-4-Br)C ₆ H ₃	E	1	H	CF ₃	174
54	(2-Br-4-F)C ₆ H ₃	E	1	H	CF ₃	187
55	(2-Cl-5-CF ₃)C ₆ H ₃	E	1	H	CF ₃	182
56	(2-F-4-Cl)C ₆ H ₃	E	1	H	CF ₃	183
57	(2-Cl-4-F)C ₆ H ₃	E	1	H	CF ₃	184
58	(2-CF ₃ -4-Cl)C ₆ H ₃	E	1	H	CF ₃	193
59	(2,4,6-F ₃)C ₆ H ₂	E	1	H	CF ₃	186
60	(4-CF ₃)C ₆ H ₄	E	1	H	CF ₃	75
61	(2,4-F ₂ -6-Br)C ₆ H ₂	E	1	H	CF ₃	164
62	(3,5-F ₂)C ₆ H ₃	E	1	H	CF ₃	198
63	(2,3-диCF ₃ -4-Cl)C ₆ H ₂	E	1	H	CF ₃	178
65	(3-CF ₃ -5-OCH ₃)C ₆ H ₃	E	1	H	CF ₃	96
66	(3-F-4-OCH ₃)C ₆ H ₃	E	1	H	CF ₃	98
67	(2-Br-4-Cl)C ₆ H ₃	E	1	H	CF ₃	174
68	(3-Cl-4-Br)C ₆ H ₃	E	1	H	CF ₃	132
69	(2,6-Cl-4-Br)C ₆ H ₂	E	1	H	CF ₃	213
70	(3,5-Cl ₂ -4-Br)C ₆ H ₂	E	1	H	CF ₃	137
71	CH ₂ -(4-Cl-C ₆ H ₄)	E	1	H	CF ₃	
73	CH ₂ -(2,4-Cl ₂ -C ₆ H ₄)	E	1	H	CF ₃	
74	CH ₂ -(2-OC ₂ H ₅ -C ₆ H ₄)	E	1	H	CF ₃	
75	CH ₂ -(2-F-C ₆ H ₄)	E	1	H	CF ₃	
76	CH ₂ -(3-F-C ₆ H ₄)	E	1	H	CF ₃	
77	CH ₂ -(4-F-C ₆ H ₄)	E	1	H	CF ₃	
78	CH ₂ -(4-OCH ₃ -C ₆ H ₄)	E	1	H	CF ₃	

79	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{-C}_6\text{H}_5$	E	1	H	CF_3	
80	$\text{CH}_2\text{-(2-CH}_3\text{-C}_6\text{H}_4\text{)}$	E	1	H	CF_3	
81	$\text{CH}_2\text{-(3-CH}_3\text{-C}_6\text{H}_4\text{)}$	E	1	H	CF_3	
82	$\text{CH}_2\text{-(4-CH}_3\text{-C}_6\text{H}_4\text{)}$	E	1	H	CF_3	
83	$\text{CH}_2\text{-(2-CF}_3\text{-C}_6\text{H}_4\text{)}$	E	1	H	CF_3	
84	$\text{CH}_2\text{-(4-CF}_3\text{-C}_6\text{H}_4\text{)}$	E	1	H	CF_3	
85	$\text{CH}_2\text{-(3-CF}_3\text{-C}_6\text{H}_4\text{)}$	E	1	H	CF_3	
86	$(4\text{-Br})\text{C}_6\text{H}_4$	E	1	H	CF_3	
87	$(2,4\text{-динітро-6-Br})\text{C}_6\text{H}_2$	E	1	H	CF_3	
88	$(4\text{-NHC(O)CH}_3)\text{C}_6\text{H}_4$	E	1	H	CF_3	
89	$(2\text{-Cl-4-S(O)}_2\text{CH}_3)\text{C}_6\text{H}_3$	E	1	H	CF_3	155
90	$(2\text{-NO}_2\text{-4-OCH}_3)\text{C}_6\text{H}_3$	E	1	H	CF_3	131
91	$(2\text{-OCH}_3\text{-4-Cl})\text{C}_6\text{H}_3$	E	1	H	CF_3	189
92	Циклопропіл	E	1	H	CF_3	207
93	$(2,5\text{-Cl}_2)\text{C}_6\text{H}_3$	E	1	H	CF_3	172

94	$(2,4\text{-CH}_3\text{-6-NO}_2)\text{C}_6\text{H}_2$	E	1	H	CF_3	185
95	$(3\text{-Cl-4-CN})\text{C}_6\text{H}_3$	E	1	H	CF_3	
96	$(4\text{-OCH}_3)\text{C}_6\text{H}_4$	E	2	H	CF_3	80
97	$(3\text{-OH-4-OCH}_3)\text{C}_6\text{H}_3$	E	2	H	CF_3	102
98	$(2\text{-SCH}_3)\text{C}_6\text{H}_4$	E	1	H	CF_3	191
99	$(3\text{-NO}_2)\text{C}_6\text{H}_4$	E	2	H	CF_3	195
100	$(2\text{-Br-4-CF}_3\text{-6-NO}_2)\text{C}_6\text{H}_2$	E	1	H	CF_3	115
101	$(2\text{-NO}_2\text{-4-CH}_3)\text{C}_6\text{H}_3$	E	1	H	CF_3	145
102	$(4\text{-Cl})\text{C}_6\text{H}_4$	E	2	H	CF_3	191
103	$(3\text{-CF}_3\text{-5-OCH}_3)\text{C}_6\text{H}_3$	E	1	H	CF_3	
104	$(3,4\text{-Cl}_2)\text{C}_6\text{H}_3$	E	2	H	CF_3	188
105		E	1	H	CF_3	
106		E	1	H	CF_3	
107		E	1	H	CF_3	
108		E	1	H	CF_3	

109	 6	E	1	H	CF_3	
110		E	1	H	CF_3	
111	 8	E	1	H	CF_3	
112	 9	E	1	H	CF_3	
113	 10	E	1	H	CF_3	
115	 11	E	1	H	CF_3	

116		E	1	H	CF3	
117	3-OCH3-5-CF3-C6H3	E	1	H	CF3	
118	3-Cl-5-Cl-C6H3	E	1	H	CF3	188
119	4-C6H5O-C6H5	E	2	H	CF3	196
120	4-C6H4NHC6H4	E	2	H	CF3	85
121	3-C(O)NH2-C6H4	E	1	H	CF3	
122		E	1	H	CF3	
123		E	1	H	CF3	
124		E	1	H	CF3	
125		E	1	H	CF3	
126		E	1	H	CF3	
127	CH2CH2C(O)OCH3	E	1	H	CF3	69
128	CH2C=CH	E	1	H	CF3	127
129	C(CH2)5CH3	E	1	H	CF3	114
130	C(CH2)4CH3	E	1	H	CF3	132
131	C(CH2)3CH3	E	1	H	CF3	131
132	CH(CH3)2	E	1	H	CF3	194
133	CH2CH2CH3	E	1	H	CF3	129
134	(CH2)6CH3	E	1	H	CF3	108
135	(CH2)7CH3	E	1	H	CF3	124
136	(CH2)8CH3	E	1	H	CF3	125

137	(CH2)9CH3	E	1	H	CF3	83
138	(CH2)10CH3	E	1	H	CF3	
139	(CH2)11CH3	E	1	H	CF3	64
140	(CH2)11CH3	E	1	H	CF3	
141	(CH2)13CH3	E	1	H	CF3	
142	(CH2)10CH3	E	1	H	CF3	
143	CH2CH(CH3)2	E	1	H	CF3	
144	CH2CH2CH(CH3)2	E	1	H	CF3	138
145	CH2CH(CH3)CH2CH3	E	1	H	CF3	150
146	CH(CH3)-O-CH(CH3)2	E	1	H	CF3	178
147	(CH2)12CH3	E	1	H	CF3	
148	(CH2)13CH3	E	1	H	CF3	56

Нижченаведені приклади не лімітують, а тільки ілюструють використання сполук згідно з винаходом для боротьби зі шкідниками.

Досліджували такі види:

Рід, вид	Звичайна назва
<i>Aphis gossypii</i>	попелиця бавовняна
<i>Musca domestica</i>	муха кімнатна
<i>Diabrotica virgifera</i>	блошка довговуса
<i>Periplaneta americana</i>	тарган американський
<i>Spodoptera eridania</i>	південний похідний хробак
<i>Shizaphis graminum</i>	попелиця злакова
<i>Ctenocephalides felis</i>	блоха котяча
<i>Rhipicephalus sanguineas</i>	кліщ собачий
	коричневий

Тест із дренуванням ґрунту (системна активність) Рослини бавовни і сорго вирощують у горщиках. За день до обробки рослини в горщиках інфікують приблизно 25 особами попелиці змішаної популяції. Рослини бавовни інфікують попелицею, а рослини сорго інфікують попелицею злаковою. Обрані сполуки формули (I) наносять на поверхню ґрунту при розведенні, яке забезпечує еквівалент 10,0 част. на млн. ґрунтової концентрації за масою. Кількість попелиці підраховують через 5 днів після обробки. Кількість попелиці на оброблених рослинах порівнюють із кількістю на необроблених контрольних рослинах. Цей тест демонструє системну активність (міграцію активного інгредієнту).

Тест на контакт кімнатної мухи з принадою

Приблизно 25 4-6-добових дорослих кімнатних мух анестезують і поміщають у камеру з принадою - розчином цукру у воді, що містить сполуку. Концентрація обраної сполуки формули (I) у розчині принади складає 50 част. на млн. Через 24 години мух, що залишаються нерухомими після стимуляції, вважають заггиблими.

Застосування стосовно листя з попелицею (контактний тест)

Рослини бавовни, інфіковані попелицею, поміщають на обертовий столик і обприскують до стікання композицією з концентрацією 100 част. на млн. обраних сполук формули (I). Оброблені, інфіковані *A. gossypii*

рослини витримують протягом трьох днів після обробки, після чого підраховують кількість загиблої попелиці.

Отримано такі результати (у цій таблиці 'X' означає високу активність; '+' означає помірну активність; '-' означає низьку активність; і 'NT' означає відсутність активності):

Таблиця

Сполука №	Системна активність на попелиці	Системна активність на попелиці злаковій	Активність на мусі кімнатній при контакті	Активність на попелиці на листі
1	+	X	X	X
2	-	-	X	-
3	X	X	NT	NT
4	X	X	X	X
5	-	-	X	X
6	X	X	NT	X
7	+	X	X	X
8	-	-	X	-
9	+	X	X	-
10	-	X	X	-
11	-	X	X	-
12	X	X	X	X
13	-	X	X	-
14	-	X	X	-
15	-	X	4-	-
16	X	X	X	+
17	X	X	X	X
18	+	X	X	X
19	X	X	X	-
20	X	X	X	X
21	+	+	X	"
22	-	-	+	X
23	X	X	X	X
24	X	X	NT	NT
25	X	X	X	X
26	+	X	X	X
27	+	X	X	X
28	+	X	X	-
29	+	X	X	-
30	+	X	X	-
31	+	X	X	X
32	X	X	X	-
33	+	X	X	X
34	+	X	X	X
35	X	X	X	X
36	X	X	X	
37	+	X	X	X
41	-	-	X	+
42.	+	X	X	X
43	+	X	X	-
44	X	X	X	-
45	+	X	X	+
46	X	X	X	X
47	X	X	X	X
48	+	X	X	X
49	X	X	X	X
50	+	X	X	X
51	X	X	X	-
52	+	X	X	X
53	+	X	X	X
54	+	X	X	-
55	-	X	X	-
56	+	X	X	X
57	-	X	X	X
58	-	X	X	-
59	+	X	X	-
60	X	X	X	X
61	-	X	X	-
62	-	X	X	X
63	X	X	"	X
65	X	X	X'	X
66	X	X	X,	X
67	+	X	X	"
68	X	X	X	X

69	-	X	-	-
70	X	X	X	X
71	+	X	X	X
74	+	X	X	X
75	X	X	X	X
76	+	X	X	X
77	X	X	X	X
78	X	X	X	X
79	X	X	X	X
80	X	X	X	X
81	X	X	X	X
82	+	X	X	X
83	+	X	X	X
84	X	X	X	X
85	X	X	X	X
86		+		X
87	NT	NT		
88	NT	NT	X	X
89	NT	NT	X	+
90	+	+	X	
91	+	X	X	-
92	+	X	X	X
93	NT	NT	-	-
94	NT	NT	X	-
95	-	X	NT	NT
96	+	X	X	NT
97	+	X	X	NT
98	+	X	X	-
99	+	+	X	+
100	NT	NT	X	-
101	-	+	X	-
102	+	X	X	X
103	NT	NT	-	X
104	X	X	X	NT
105	+	X	X	-
106	NT	NT	X	X
107	NT	NT	X	-
108	NT	NT	X	X
109	NT	NT	X	NT
110	+	X	X	X
111	-	+	+	-
112	NT	NT	X	+
113	-	X	1	-
115	+	X	X	X
116	-	X	X	X
117		-	-	
118	X	X	X	
119	X	X	X	X
120	+	X	X	-
121	X	X	X	+
122	X		X	X
123	X	X	X	-
124	X		X	-
125	X		X	X
126	X	X	X	-
127	X			
128	X	X	X	-
129	X	X	-	
130	X	X	-	
131	X	X	-	
132	X	X	-	
133	X	X	-	
134	-	X	X	-
135	X	-	X	-
136	X	X	X	-
137	X	X	X	-
138	X	X	X	-
139	4-	X	X	-
140	X	X	X	-
141	X	X	X	
142	X	X	-	
143	X	X	-	
144	X	X	-	-
145	X	X	X	+
146	+	X	X	X

147	X	X	-	-
147	X	X	+	-

«-»w = низька активність

Згідно з винаходом запропоновано спосіб боротьби зі шкідниками в локусі, причому зазначений спосіб включає застосування до локусу пестицидно-ефективної кількості сполуки формули (I), або її пестицидно прийнятної солі, або композиції, що містить активний інгредієнт. Спосіб переважно корисний для системної боротьби з членистоногими в локусі, особливо з деякими комахами або кліщами, що харчуються на наземній частині рослин. Боротьба з такими шкідниками листя може бути забезпечена шляхом безпосереднього застосування до листя, або застосування, наприклад, спрею чи гранул на ґрунті, до коренів рослин, або до насіння рослин із наступним системним переміщенням на розташовані над ґрунтом рослин. Така системна активність включає боротьбу з комахами, що має місце не тільки в точці застосування, але і на віддалених частинах рослини, за рахунок переміщення з однієї сторони листа на іншу, або з обробленого листа на необроблений лист. Приклади класів комах-шкідників, із котрими можна системно боротися за допомогою сполук згідно з винаходом, включають ряд Homoptera (які ссуть проколюючи), ряд Hemiptera (які ссуть поглинаючи) і ряд Thysanoptera. Даний винахід особливо підходить для боротьби з попелицею і трипсами.

Як очевидно з попереднього пестицидного використання, що винахід пропонує пестицидно активні сполуки і способи використання зазначених сполук для боротьби з рядом видів шкідників, що включають: членистоногих, особливо комах або кліщів; рослинних нематод; або гельмінтів; або найпростіших шкідників. Сполуки формули (I) або їх пестицидно прийнятні солі переважно використовують на практиці, наприклад, у сільському господарстві або садівництві, у лісівництві, ветеринарії або скотарстві або для лікування населення. Починаючи з даного моменту і далі, коли використовують термін «сполуки формули (I)», цей термін охоплює сполуки формули (I) і їх пестицидно прийнятні солі. Термін «сполука формули (I)» охоплює сполуку формули (I) і її пестицидно прийнятну сіль.

Даний винахід надає спосіб боротьби з комахами в локусі, що включає обробку локусу (ділянки) (наприклад, шляхом застосування або введення) ефективної кількості сполуки формули (I) або її пестицидно прийнятної солі, де замісні групи мають зазначені вище значення. Ділянка включає, наприклад, самих шкідників або місце (рослина, тваринна, поле, будівля, будинок, ліс, оранжерею, водойма, ґрунт, продукти рослинного або тваринного походження або т.п.), де знаходяться шкідники, або де вони харчуються.

Сполуки згідно з винаходом можна, крім того, використовувати для боротьби з такими шкідниками, що живуть у ґрунті, як личинки, що ушкоджують корені кукурудзи (corn rootworm), терміти (особливо для захисту будівель), кореневі личинки, проволочники, кореневі довгоносики, совки, комах, що прогризають стебла, коренева попелиця або хробаковидні личинки. Їх можна також використовувати для забезпечення активності проти таких рослинних патогенних нематод, як вузликові, цистові, кинжалоподібні, виразкові, або стеблові чи цибулинні нематоди, або проти кліщів. Для боротьби з ґрунтовими шкідниками, наприклад, совкою довговусою, сполуки переважно застосовують до ґрунту або вводять в ефективній кількості в ґрунт, де посаджені культурні рослини, або де вони будуть посаджені, або застосовуються до насіння або до коренів рослин, що ростуть.

У області охорони здоров'я сполуки особливо корисні для боротьби з багатьма комахами, особливо з гнотіовими мухами або іншими шкідниками ряду двокрилих, такими як муха кімнатна, жигалка осіння, львинки, жигалка коров'яча мала, лосина муха, жигалка коняча, комарі, мокреці, скатопсиди або москити.

Для захисту продуктів, що зберігаються, наприклад, злаків, включаючи зерно або мuku, земляні горіхи, продукти тваринництва, лісоматеріали або домашній посуд, наприклад килими і текстиль, сполуки згідно з винаходом корисні проти нападу членистоногих, більше конкретно, жуків, включаючи міль або кліщів, наприклад *Ephestia* spp. (вогнівка мірошницька), *Anthrenus* spp. (шкіроїди), *Tribolium* spp (хрущик борошняний), *Sitophilus* spp. (каландрини) *Acarus* spp. (кліщі).

Вони корисні для боротьби з тарганами, мурашками або термітами чи аналогічними членистоногими шкідниками в заражених домашніх або промислових помешканнях або для боротьби з личинками москитів у водоймах, криницях, резервуарах або інших проточних або стоячих водах.

Для обробки фундаментів, будівель або ґрунту для запобігання нападу на будинки термітів, наприклад, *Reticulitermes* spp., *Heisrotemes* spp., *Coptotemes* spp.

У сільському господарстві проти дорослих осіб, личинок і яєчок ряду чешуйчатокрилих (метелики і молі), наприклад, *Heliothis* spp., таких як *Heliothis virescens* (тютюнова совка), *Heliothis amigera* і *Heliothis zea*. Проти дорослих осіб і личинок ряду Coleoptera. (жуки), наприклад, *Anthonomus* spp., наприклад, *grandis* (довгоносик бавовняний), *Leptinotarsa decemlineata* (колорадський картопляний жук), *Diabrotica* spp. (блешка довговуса). Проти ряду Heteroptera (Hemiptera і Homoptera), наприклад, *Psilla* spp., *Bemisia* spp., *Trialeurodes* spp., *Aphis* spp., *Myzus* spp., *Megoura viciae*, *Phloxera* spp., *Nephotettix* spp. (цикадка рисова), *Nilaparvata* spp.

Проти ряду Двокрилих, наприклад, *Musca* spp. Проти ряду Thysanoptera, таких як *Thrips tabaci*. Проти ряду Orthoptera, таких як *Locusta* і *Schistocerca* (сарана і цвіркуни), наприклад, *Gryllus* spp. і *Acheta* spp., наприклад, *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blatella germanica*, *Locusta migratoria migratoroides* і *Schistocerca gregaria*. Проти ряду Collembola, наприклад *Periplaneta* spp. і *Blatella* spp. (таргани). Проти ряду Isoptera, наприклад *Coptoterines* spp. (терміти).

Проти членистоногих, що мають значення в сільському господарстві, таких як *Acari* (кліщі), наприклад *Tetranychus* spp. і *Paponychus* spp.

Проти нематод, що ушкоджують рослини або дерева, що важливі для сільського господарства, лісництва або садівництва, або безпосередньо, або шляхом поширення бактеріальних, вірусних, мікоплазмових або грибових захворювань рослин. Наприклад, проти вузликових нематод, таких як *Meloidogyne* spp.

В області ветеринарії і тваринництва або охорони здоров'я у боротьбі проти членистоногих, гельмінтів або

найпростіших, що паразитують усередині або поза організмом хребцевих, особливо теплокровних хребцевих, наприклад, домашніх тварин, наприклад, великої рогатої худоби, овець, свиней, кіз, коней, птиць, собак або кішок, наприклад, *Ascaris*, включаючи кліщів, наприклад *Ixodes* spp., *Boophilus* spp., наприклад *Boophilus microplus* *Rhipicephalus* spp., наприклад *Rhipicephalus appendiculatus*, *Ornithodoros* spp. (наприклад, *Ornithodoros moubata*) і кліщів (наприклад *Damalinia* spp.); Diptera (наприклад *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Musca* spp., *Hypodema* spp.); Hemiptera, Dictyoptera (наприклад *Periplaneta* spp., *Blattella* spp.); Hymenoptera; наприклад проти інфекцій шлунково-кишкового тракту, що викликаються паразитичними нематодами, наприклад членами сімейства Trichostrongylidae; для боротьби з хворобами і для лікування хвороб, що викликаються найпростішими, наприклад, *Eimeria* spp., наприклад *Trypanosoma cruzi*, *Leishmania* spp., *Plasmodium* spp., *Babesia* spp., *Trichomonadidae* spp., *Toxoplasma* spp. і *Theileria* spp.

При практичному використанні для боротьби з членистоногими, особливо комахами або кліщами, або нематодами - шкідниками рослин, спосіб, наприклад, включає застосування до рослин або до середовища, у якому вони ростуть, ефективної кількості сполуки згідно з винаходом. При такому способі активну сполуку звичайно застосовують до ділянки, де необхідна боротьба з членистоногими або нематодами, в ефективній кількості в інтервалі від приблизно 5г до приблизно 1 кг активної сполуки на гектар оброблюваної ділянки. У ідеальних умовах, у залежності від шкідника, із котрим необхідно боротися, адекватний захист можуть забезпечити нижчі дози. З іншого боку, несприятливі погодні умови, стійкість шкідника або інших чинників можуть зажадати застосування активного інгредієнту у великих кількостях. Оптимальна кількість залежить звичайно від ряду чинників, наприклад, від типу шкідника, із котрим необхідно боротися, від типу або стадії розвитку інфікованої рослини, від відстані між рядами, а також від способу застосування. Краще використовувати ефективну кількість активної сполуки в інтервалі значень від приблизно 50г/га до приблизно 400г/га.

Коли шкідники зароджуються в ґрунті, активну сполуку, звичайно приготовлену у вигляді композиції, рівномірно розподіляють по поверхні, що підлягає обробці (тобто, наприклад, розсіюють врозкид або обробляють рядами) будь-яким зручним способом, і застосовують у кількості від приблизно 5г до приблизно 1кг активного інгредієнту на га, переважно приблизно від 50 до 250г а.і./га. При обробці в якості розчину або суспензії для занурення кореневої системи сіянців або при краплинному зрошенні цей розчин або суспензія містить від приблизно 0,075 до приблизно 1000мг активної речовини/л, переважно від приблизно,25 до приблизно 200мг а.і./л. Нанесення може здійснювати за бажанням по всій поверхні поля, або на площі, на якій ростуть культурні рослини, або в безпосередній близькості до насіння або рослин, що необхідно охоронити від нападу шкідників. Активний компонент можна змивати в ґрунт, обприскуючи водою ділянку, або можна лишити до природної дії дощу. Під час або після застосування, перетворену в готову форму сполуку можна при бажанні розподіляти в ґрунті механічно, наприклад, за допомогою плуга, дискуванням, або з використанням драгових ланцюгів. Застосування можна здійснювати до посадки, під час посадки, після посадки, але до того, як з'являться паростки, або після того, як з'являться паростки.

Сполуки згідно з винаходом і способи боротьби зі шкідниками мають особливу цінність для захисту полів, фуражу, плантацій, теплиць, оранжерей або виноградників, або посадок декоративних рослин, або лісопосадок, наприклад: злакових (таких як пшениця або рис), бавовни, овочів (таких як перці), польових культур (таких як цукровий буряк, соя або олійний рапс), лугових або фуражних культур (таких як кукурудза або сорго), фруктових садів або гаїв (таких як кісточкові фруктові культури або цитрусові), декоративних рослин, квітів або овочів або чагарників у теплицях або в садах і парках, або лісових дерев (як листопадних так і вічнозелених) у лісах, на плантаціях або в розплідниках.

Вони представляють також цінність для захисту деревини (лісів на корені, повалених дерев, обробленої деревини, складованої деревини або деревини в будівлях) від нападу, наприклад, піляльщика, або жуків або термітів.

Вони знаходять застосування для захисту таких продуктів, що зберігаються, як зерно, фрукти, горіхи, прянощі або тютюн, незалежно від того, знаходяться вони в цілому або здрібненому вигляді, або приготовлені у вигляді продуктів, від нападу моли, жуків, кліщів або зернового довгоносика. Захищають вони також такі продукти тваринництва, що зберігаються, як шкіру, вовну, волосся або пір'я в природній або обробленій формі (наприклад, килими і текстиль) від нападу молі або жуків, а також м'яса, що зберігається, риби або зерна від нападу жуків, кліщів або мух.

Крім того, сполуки згідно з винаходом і способи їх використання представляють особливу цінність для боротьби з членистоногими, гельмінтами або найпростішими, що уражають домашніх тварин, або поширюють їх захворювання, або є переносниками захворювань, наприклад, тих, що були згадані раніше, а більше конкретно, для боротьби з тиксодовими кліщами, кліщиками, вошами, мухами, дрібними двокрилими комахами, докучливими або гнійовими мухами, або мухами, що кусають. Сполуки згідно з винаходом особливо корисні для боротьби з членистоногими, гельмінтами або найпростішими, що знаходяться усередині організму домашніх тварин, або які харчуються в шкірі або на ній, або ссуть кров тварин, причому для цієї цілі їх можна вводити перорально, парентерально, підшкірно або застосовувати топічно або за місцем.

Крім того, сполуки згідно з винаходом можна використовувати для боротьби з кокцидіозом, хворобою, що викликається інфікуванням найпростішими паразитами роду *Eimeria*. Кокцидіоз є важливою потенційною причиною економічних втрат при вирощуванні домашніх тварин і птиці, особливо якщо їх вирощують або тримають в інтенсивних умовах. Так наприклад, уражатися захворюванням може велика рогата худоба, вівці, свині або кролики, але особливо важливу роль він грає для птиць, особливо курчат. Введення невеличких кількостей сполуки згідно з винаходом, переважно в сполученні з кормом, ефективно запобігає або істотно знижує випадки виникнення кокцидіозу. Ці сполуки ефективні як проти кишкової форми, так і проти форми кокцидіозу в сліпій кишці. Крім того, сполуки згідно з винаходом можуть інгібувати дію на ооцити, значно знижуючи їхню кількість і споруючість. Захворювання домашньої птиці звичайно поширюються птицями, що скльовують організми, що інфікують, які утримуються в поносі і знаходяться в або на смітті, землі, кормі або в питній воді. Захворювання виявляється кровотечею, накопиченням крові в сліпій кишці, улученням крові в

понос, у слабості і порушенні травлення. Це захворювання часто закінчується загибеллю тварин, а птиця, що пережила важку інфекцію, у значній мірі втрачає свою ринкову вартість.

Композиції, що описані далі, для застосування на культури, що ростуть, або на ділянки з культурними рослинами, що ростуть, або для протравлення насіння, можна в альтернативному варіанті використовувати для тепличного застосування на тваринах або для захисту продуктів, що зберігаються, домашнього посуду, земельної власності, або ділянок навколишнього середовища. Підходжі способи для застосування сполук згідно з винаходом включають:

до сільськогосподарських культур, що ростуть - у вигляді спреїв для листя, дуетів, гранул, туманів або пін, або також у вигляді суспензій тонко здрібнених або інкапсульованих композицій для ґрунтової або кореневої обробки шляхом змочування рідиною, обробки дуетами, гранулами, окуренням або обробкою пінами; до насіння рослин - шляхом застосування протравлянням рідкими суспензіями або дуетами;

до тварини, інфікованої або схильної до зараження членистоногими, гельмінтами або найпростішими - шляхом парентерального введення або місцевого застосування композицій, у яких активний інгредієнт демонструє негайну і/або пролонговану дію протягом деякого проміжку години, проти членистоногих, гельмінтів і найпростіших, наприклад, шляхом введення в корм або в підходящі перорально засвоювані фармацевтичні композиції, їстівні принади, солі для лизання, дієтичні добавки, готові поливні форми композицій, спреї, ванну, душі, струминні композиції, дуети, мазі, шампуні, креми, липкі воски або системи для самообробки домашньої худоби;

до навколишнього середовища взагалі або до конкретної ділянки, де шкідники можуть ховатися, включаючи продукти, що зберігаються, лісоматеріали, домашній посуд або домашні або промислові помешкання, у вигляді спреїв, туманів, дуетів, липких восків, лаків, гранул або принад, або в протоки до водних шляхів, у криниці, резервуари або інші проточні або стоячі води;

для домашніх тварин у кормі для боротьби з личинками мух, що харчуються їх фекаліями.

На практиці сполуки згідно з винаходом частіше усього складають частину композицій. Ці композиції можна використовувати для боротьби з членистоногими, особливо з комахами або кліщами; нематодами; або гельмінтами або найпростішими шкідниками. Ці композиції можуть бути будь-якого відомого спеціалістам типу, придатного для застосування до потрібних шкідників у будь-якому помешканні, усередині або на площі поза помешканнями, або шляхом внутрішнього або зовнішнього введення хребцевим. Ці композиції містять, щонайменше, таку одну сполуку формули (I), або її пестицидно прийнятну сіль, як описані вище, у якості активного інгредієнту в сполученні або в зв'язку з одним або більше із сумісних компонентів, що є, наприклад, твердими або рідкими носіями або розріджувачами, ад'ювантами, поверхнево активними або тому подібними агентами, що підходять для гаданого використання, і який є прийнятним в медицині і сільському господарстві. Ці композиції, що можна одержати будь-яким відомим спеціалістам способом, також складають частину даного винаходу.

Ці композиції можуть також містити такі інші типи інгредієнтів, як захисні колоїди, адгезиви, загущуючі та тиксотропні агенти, агенти, що сприяють проникності, олії для спреїв (особливо для акарицидного застосування), стабілізатори, консерванти (особливо попереджуючі появу цвілі), секвеструючі агенти або т.п., а інші відомі активні інгредієнти, що мають пестицидні властивості (особливо інсектицидні, мітицидні, нематодцидні або фунгіцидні), або маючі властивості регуляторів росту рослин. В більш загальному плані, сполуки, використовувані у винаході, можна комбінувати з будь-якими твердими або рідкими добавками, що відповідають звичайним прийомом готування готових форм.

Композиції, придатні для застосування в сільському господарстві, садівництві або т.п. включають готові препаративні форми, що підходять для використання в якості, наприклад, спреїв, дуетів, гранул, туманів, пін, емульсій і т.п.

Ефективні використовувані дози сполук, застосовувані в даному винаході, можуть змінюватися в широких межах, зокрема, в залежності від природи шкідника, із котрим необхідно боротися, або ступеню зараження, наприклад, сільськогосподарських культур, цими шкідниками. Звичайно композиції згідно з винаходом містять від приблизно 0,05 до приблизно 95% за масою одного або більше з активних інгредієнтів згідно з винаходом, від приблизно 1 до приблизно 95% одного або більше із твердих або рідких носіїв, і, як варіант, від приблизно 0,1 до приблизно 50% одного або більше інших сумісних компонентів, таких як поверхнево активні агенти, або т.п.

У рамках даного винаходу термін "носій" позначає органічний або неорганічний інгредієнт, природний або синтетичний, із яких комбінують активний інгредієнт для полегшення його застосування, наприклад, до рослин, насіння або ґрунту. Такий носій, отже, звичайно є інертним, і повинний бути прийнятним (наприклад, агрономічно прийнятним, особливо для обробки рослин).

Носієм можуть бути тверді речовини, наприклад, глини, природні або синтетичні силікати, діоксид силіцію, смоли, воски, тверді добрива (наприклад, солі амонію), такі здрібнені природні мінерали, як каоліни, глини, тальк, крейда, кварц, атапульгіт, монтморилоніт, бентоніт або діатомова земля, або такі здрібнені синтетичні мінерали, як оксид алюмінію або силікати, особливо силікати алюмінію або магнію. У якості твердих носіїв для гранул підходжими є такі:

роздрібнені або здрібнені природні гірські породи, такі як кальцит, мармур, пемза, сепіоліт і доломіт; синтетичні гранули неорганічної або органічної муки; гранули таких органічних матеріалів, як тирса, кокосова шкаралупа, кукурудзяні початки, кукурудзяне лушпиння, або стебла тютюну; кізельгур, трикальційфосфат, здрібнена в порошок шкірка, або адсорбентна сажа; водорозчинні полімери, смоли, воски; або тверді добрива. Такі тверді композиції можуть за бажанням містити один або більше сумісних змочувальних, диспергувальних, емульгуючих або забарвлюючих агентів, що, у тому випадку, коли вони тверді, можуть також слугувати розріджувачем.

Носії можуть бути також рідкими,^А наприклад, вода, спирти, зокрема бутанол або гліколь, а також їх етери або естери, зокрема метилгліколяцетат; кетони, особливо ацетон, циклогексанон, метилетилкетон, метилізобутилкетон або ізофорон;

такі нафтові фракції, як парафінові або ароматичні вуглеводні, особливо ксилоли або алкілнафталіни; мінеральні або рослинні олії; аліфатичні хлоровані вуглеводні, особливо такі, як трихлоретан або метилхлорид; ароматичні хлоровані вуглеводні, особливо хлорбензоли; такі водорозчинні або сильно полярні розчинники, як диметилформамід, диметилсульфоксид, або N-метилпіролідон; скраплені гази; і т.п. або їх суміші.

Поверхнево-активний агент може бути емульгуючим агентом, що диспергує або змочує, іоногенного або неіоногенного типу, або сумішшю таких поверхнево-активних агентів. Серед них, наприклад, можна зазначити солі поліакрилових кислот, солі лігносульфонових кислот, солі фенолсульфонових або нафталінсульфонових кислот, поліконденсати етиленоксиду і жирних спиртів або жирних кислот, або жирних естерів, або жирних амінів, заміщені феноли (особливо алкілфеноли або арилфеноли), солі естерів сульфоянтарної кислоти, похідні таурину (особливо алкілтаурати), фосфорні естери спиртів або поліконденсатів етиленоксиду з фенолами, естери жирних кислот з поліолами, або сульфатні, сульфонатні або фосфатні функціональні похідні вищевказаних сполук. Присутність, принаймні, одного поверхнево-активного агента звичайно важлива, коли активний інгредієнт і/або інертний носій лише слабо розчинні у воді, або не розчинні у воді, а носієм у композиції для нанесення є вода.

Композиції згідно з винаходом можуть далі містити такі інші добавки, як адгезиви або барвні речовини. У композиціях можна використовувати такі адгезиви, як карбоксиметилцелюлоза або природні або такі синтетичні полімери у формі порошків, гранул або штахетів, як гуміарабік, полівініловий спирт або полівінілацетат, такі природні фосфоліпіди, як цефаліни, або лецитини, або синтетичні фосфоліпіди. Можна використовувати такі барвні речовини, як неорганічні пігменти, наприклад:

оксиди феруму, оксиди титану або прусський синій; такі органічні барвники, як алізаринові барвники, азобарвники або металофталоціанінові барвники; або сліди таких живильних речовин, як солі феруму, магнію, бора, міді, кобальту, молібдену або цинку.

Композиції, що містять сполуки формули (I), або їх пестицидно прийнятні солі, що можна застосовувати для боротьби з членистоногими, рослинними нематодами, гельмінтами або найпростішими шкідниками, можуть також містити синергісти (наприклад, піперонілбутоксид або сезамекс), стабілізатори, інші інсектициди, акарициди, рослинні нематоциди, агенти для боротьби з гельмінтами або кокцидіозом, фунгіциди (сільськогосподарські або ветеринарні, наприклад, беноміл і іпродіон), бактерициди, аттрактанти для членистоногих або хребцевих, або репеленти чи феромони, дезодоранти, смакові агенти, барвники або допоміжні терапевтичні агенти, наприклад, слідові елементи. Вони можуть бути призначені для посилення ефективності, стійкості, безпеки, споживання, коли це бажано, для розширення спектра шкідників, із якими необхідно боротися, або для забезпечення можливості здійснення композиціями інших корисних функцій у відношенні тих же тварин або оброблюваних ділянок.

Приклади інших пестицидно-активних сполук, що можуть бути включені в композиції, або використані в сполученні з композиціями згідно з винаходом, включають: ацефат, хлоропірифос, деметон-5-метил, дисульфотон, етопрофос, фенітроіон, фенаміфос, фонофос, ісазофос, ізофенфос, мелатіон, монокротофос, паратіон, форат, фозалон, піриміфос-метил, тербуфос, тріазофос, цифлутрин, циперметрин, дельтаметрин, фенпропатрин, фенвалерат, перметрин, тифлутрин, альдикарб, карбосульфат, метоміл, оксаміл, піримікарб, бендіокарб, тифлубензурон, дікофол, ендосульфат, ліндан, бензоксимат, картап, цигексатин, тетрадифон, авермектини, івермектини, мілбеміцини, тіофанат, трихлорофон, дихлорвос, діаверидин або диметріадазол.

Тому для застосування в сільському господарстві сполуки формули (I), або їх пестицидно прийнятні солі звичайно знаходяться у формі композицій, що можуть бути в різних твердих або рідких формах.

Твердими формами композицій, що можна використовувати, є пилоподібні порошки (дуети) (з вмістом сполуки формули (I) або її пестицидно прийнятої солі в інтервалі аж до 80%), порошки, що змочуються, або гранули (включаючи диспергуємі у воді гранули), особливо гранули, що одержують екструзією, пресуванням, просочуванням гранул носія, або гранулюванням, виходячи з порошку (утримання сполуки формули (I) або її пестицидно прийнятої солі в цих порошках, що змочуються, або гранулах складає від приблизно 0,5 до приблизно 80%). Тверді гомогенні або гетерогенні композиції, що містять одну або більше із сполук формули (I), або їх пестицидно прийнятих солей, наприклад гранули, таблетки, брикети або капсули, можна використовувати для обробки стоячої або проточної води протягом деякого проміжку часу. Аналогічного ефекту можна досягти, використовуючи струминну або періодичну подачу диспергуємих у воді концентратів, як описано тут.

Рідкі композиції, наприклад, включають водні або неводні розчини або суспензії (такі як емульгувальні концентрати, емульсії, текучі склади, дисперсії або розчини) або аерозолі. Рідкі композиції включають також, зокрема, емульгувальні концентрати, дисперсії, емульсії, текучі склади, аерозолі, порошки, що змочуються, (або порошки для розпилення), сухі текучі або сипучі склади або пасти, у вигляді форм композицій, що є рідкими, або призначені для одержання рідких композицій при застосуванні, наприклад, у вигляді водних спреїв (включаючи малі й ультра-малі об'єми) або у формі туманів або аерозолів.

Рідкі композиції, наприклад, у формі емульгувальних або розчинних концентратів частіше усього включають від приблизно 5 до приблизно 80% за масою активного інгредієнту, хоча емульсії або розчини, що уже готові для застосування, містять у цьому випадку від приблизно 0,01 до приблизно 20% активного інгредієнту. Крім розчинника емульгувальні або розчинні концентрати можуть містити при необхідності від приблизно 2 до приблизно 50% таких підходящих добавок, як стабілізатори, поверхнево-активні агенти, агенти, сприяння проникності, інгібітори корозії, барвники або адгезиви. Емульсії будь-якої необхідної концентрації, що особливо придатні для застосування, наприклад, до рослин, можна одержати з цих концентратів при розведенні їх водою. Ці композиції включені в об'єм композицій, які можна використовувати згідно з винаходом. Емульсії можуть бути типу вода-в-маслі або масло-у-воді, і вони можуть мати густу консистенцію.

Рідкі композиції згідно з винаходом можуть крім звичайного застосування в сільському господарстві бути використані, наприклад, для обробки субстратів або ділянок інфікованих або схильних до інфікування членистоногими (або іншими шкідниками, із якими борються за допомогою сполук згідно з винаходом),

включаючи помешкання, сховища поза помешканнями або усередині помешкань, або виробничі площі, контейнери чи устаткування або стоячу чи проточну воду.

Всі ці водні дисперсії або емульсії або суміші для розбризкування можна застосовувати, наприклад, до культурних рослин будь-якими зручними способами, головним чином, розбризкуванням або обприскуванням, у кількості, що звичайно складає від приблизно 100 до приблизно 1200 л суміші, що розприскується, на гектар, але воно може бути більше або менше (наприклад малий або ультрамалий об'єм) у залежності від необхідності або використовуваної техніки. Сполуки або композиції згідно з винаходом звичайно застосовують до вегетаційних частин рослин і, зокрема, до коренів або листя, на яких знаходяться шкідники, що підлягають знищенню, інший спосіб застосування сполук або композицій згідно з винаходом являє собою "хімічне зрошення", тобто додавання композиції, що містить активний інгредієнт, у воду для зрошення. Таке зрошення може здійснюватися обприскувачем для листяних пестицидів, або може бути зрошенням по поверхні землі або підземного зрошення для ґрунтових або системних пестицидів.

Концентровані суспензії, що можуть застосовуватися обприскуванням, виготовляють таким чином, щоб одержати стабільний рідкий продукт, що не осідає (тонке здрібнювання), і звичайно містить від приблизно 10 до приблизно 75% за масою активного інгредієнту, від приблизно 0,5 до приблизно 30% поверхнево-активних агентів, від приблизно 0,1 до приблизно 10% тиксотропних агентів, від приблизно 0 до приблизно 30% підходящих добавок, таких як протисліплюючі агенти, інгібітори корозії, стабілізатори, агенти, що сприяють проникності, адгезивні, а у якості носія воду або органічну рідину, у котрій активний інгредієнт погано розчинний або нерозчинний. Деякі органічні тверді речовини або неорганічні солі можуть розчинятися в носії, щоб сприяти запобіганню осадження, або в якості антифризів для води.

Порошки, що змочуються, (або порошки для розпилення) звичайно виготовляють таким чином, щоб вони містили від приблизно 10 до приблизно 80% за масою активного інгредієнту, від приблизно 20 до приблизно 90% твердого носія, від приблизно 0 до приблизно 5% агента, що змочує, від приблизно 3 до приблизно 10% агента, що диспергує, і, при необхідності, від приблизно 0 до приблизно 80% одного або більше стабілізаторів і/або таких інших добавок, як агенти, що сприяють проникності, адгезивні, агенти, що перешкоджають спіканню, барвники або т.п. Для одержання таких порошоків, що змочуються, активний інгредієнт (інгредієнти) старанно змішують у підходящому змішувачі з додатковими речовинами, якими може бути просочений пористий наповнювач, і подрібнюють, використовуючи млин або інший підходящий подрібнювач. Це дає порошки, змочуваність і суспендуємість яких є сприятливими. Їх можна суспендувати у воді, одержуючи будь-які бажані концентрації, і ці суспензії можна з великим успіхом використовувати, зокрема, для нанесення на листя рослин.

Диспергуємі у воді гранули (гранули, що легко диспергувати у воді) мають склад, що дуже близький до складу порошоків, що змочуються, їх можна одержати в результаті гранулювання готових форм, описаних для порошоків, що змочуються, або вологим способом (здійснюючи контакт тонко, здрібненого активного інгредієнту з інертним наповнювачем і невеличкою кількістю води, наприклад, від приблизно 1 до приблизно 20% за масою, або з водним розчином агента, що диспергує, або сполучного, із наступним сушінням і просіюванням).

Кількості і концентрації композицій, що готуються, можуть змінюватися в залежності від способу застосування, характеру композиції або способу її використання. Звичайно композиції для боротьби з членистоногими, рослинними нематодами, гельмінтами або найпростішими шкідниками містять від приблизно 0,00001 до приблизно 95%, переважніше від приблизно 0,0005 до приблизно 50% за масою одної або більше сполук формули (I), або їх пестицидно прийнятних солей, або складаються цілком з активних інгредієнтів (тобто сполук формули (I), або їх пестицидно прийнятних солей, разом із: іншими речовинами, токсичними для членистоногих або рослинних нематод, антигельмінтними або антикокцидіозними сполуками, синергістами, мікроелементами або стабілізаторами). Фактично використовувані композиції і дози їх нанесення вибирають для досягнення потрібного ефекту (ефектів) фермером, тваринником, практикуючим лікарем або ветеринаром, оператором по боротьбі зі шкідниками або іншими спеціалістами в цій області.

Тверді і рідкі композиції для топічного застосування до тварин, лісоматеріалів, що зберігаються, продуктів або домашнього посуду звичайно містять від приблизно 0,00005% до приблизно 90% або більше, конкретніше від приблизно 0,001% до приблизно 10% за масою одної або більше сполук формули (I) або їх пестицидно прийнятних солей. Для уведення тварині перорально або парентерально, включаючи введення через шкіру, тверді або рідкі композиції звичайно містять від приблизно 0,1% до приблизно 90% за масою одної або більше із сполук формули (I) або їх пестицидно прийнятних солей. Лікарські харчові добавки звичайно містять від приблизно 0,001% до приблизно 3% за масою одної або більше сполук формули (I), або їх пестицидно прийнятних солей. Концентрати або добавки для змішування з кормом звичайно містять від приблизно 5% до приблизно 90%, переважно від приблизно 5% до приблизно 50% за масою одної або більше сполук формули (I), або їх пестицидно прийнятних солей. Мінеральної солі для лизання звичайно містять від приблизно 0,1% до приблизно 10% за масою одної або більше сполук формули (I), або їх пестицидно прийнятних солей.

Дуети або рідкі композиції для нанесення (застосування) на домашніх тварин, товари або помешкання, або ділянки поза помешканнями можуть містити від приблизно 0,0001% до приблизно 15%, переважніше від приблизно 0,005% до приблизно 2,0% за масою одної або більше із сполук формули (I) або їх пестицидно прийнятних солей. Підхожі концентрації в оброблюваній воді складають від приблизно 0,0001 частин на млн до приблизно 20 частин на млн., особливо від приблизно 0,001 частин на млн. до приблизно 5,0 частин на млн. одної або більше сполук формули (I) або їх пестицидно прийнятних солей, і можуть використовуватися терапевтично в рибних господарствах при відповідних періодах експонування. Істивні принади можуть містити від приблизно 0,01% до приблизно 5%, переважно від приблизно 0,01% до приблизно 1,0 % за масою одної або більше сполук формули (I) або їх пестицидно прийнятних солей.

При введенні хребцевим парентерально, перорально, або через шкіру, або іншими способами, дози сполук формули (I) або їх пестицидно прийнятних солей, залежать від виду, віку або стану здоров'я хребцевого, і від характеру і ступеню його реального або потенційного зараження членистоногими, гельмінтами або найпростішими шкідниками. Звичайно при пероральному або парентеральному уведенні

підходить одинична доза від приблизно 0,1 до приблизно 100мг, переважно від приблизно 2,0 до приблизно 20,0мг на кг маси тіла тварини, або дози від приблизно 0,01 до приблизно 20,0мг, переважно від приблизно 0,1 до приблизно 5,0мг на кг ваги тіла тварини в день для уповільненого введення. Використовуючи композиції або пристосування для уповільненого звільнення активного агента, денні дози, необхідні для тривалого періоду (протягом місяців), можна об'єднати і вводити тварині одноразово.

Нижченаведені приклади композицій 2А-2М ілюструють композиції для використання проти членистоногих, особливо кліщів або комарів, рослинних нематод, або гельмінтів або найпростіших шкідників, що включають, у якості активного інгредієнту сполуки формули (I), або їх пестицидно прийнятні солі, такі як описані в препаративних прикладах. Кожну з композицій, описаних у прикладах 2А-2М, можна розбавити, щоб одержати розпилювальні композиції в концентраціях, придатних для використання в полі. Загальний хімічний опис інгредієнтів (для яких усі з таких відсотків зазначені у масових відсотках), використаних у композиціях прикладів 2А-2М, є такими:

Торгова марка	Хімічний опис
Етилан	
BCP	Конденсат.нонілфенолетиленоксида
Сопрофор	Конденсат
BSU	тристирилфенолетиленоксида
Арилан	70% розчин (маса/об'єм)
СА	додецилбензолсульфонат кальцію
Сольвессо 150	Легкий C ₁₀ ароматичний розчинник
Арилан S	Додецилбензолсульфонат натрію
Дарван №2	Лігносульфонат натрію
Целіт PF	Синтетичний носій - силікат магнію
Сопропон	
T36	Натрієві солі полікарбонових кислот
Родигель	
23	Полісахаридна ксантанова смола
Бентон 38	Органічне похідне магніймонтморилоніту
Аеросил	Дуже тонко здрібнений діоксид кремнію

Приклад 2А

Виготовляють розчинний у воді концентрат такого складу:

Активний інгредієнт	7%
Етилан BCP	10%
N-метилпіролідон	83%

До розчину Етилан BCP у частині N-метилпіролідону при нагріванні і перемішуванні до розчинення додають активний інгредієнт. Отриманий розчин доводять до потрібного об'єму, додаючи інший розчинник.

Приклад 2В

Виготовляють емульгуючий концентрат (ЕК) такого складу:

Активний інгредієнт	25% (макс)
Сопрофор BSU	10%
Арилан СА	5%
N-метилпіролідон	50%
Сольвессо 150	10%

Перші три компоненти розчиняють у N-метилпіролідоні, і до розчину додають Сольвессо 150 до кінцевого об'єму.

Приклад 2С

Виготовляють порошок, що змочується, (ПЗ) такого складу:

Активний інгредієнт	40%
Арилан S	2%
Дарван №2	5%
Целіт PF	53%

Всі інгредієнти змішують, і подрібнюють у молотковому млині до одержання порошку з розмірами часток менше 50 мікрон.

Приклад 2D

Виготовляють водну текучу композицію такого складу:

Активний інгредієнт	40,00%
Етилан BCP	1,00%
Сопропон T360	0,20%
Етиленгліколь	5,00%
Родигель 230	0,15%
Вода	53,65%

Всі інгредієнти старанно перемішують і подрібнюють у кульовому млині до одержання середнього розміру часток менше 3 мікрон.

Приклад 2Е

Одержують концентрат емульгуючої суспензії такого складу:

Активний інгредієнт	30,00%
Етилан BCP	10,00%
Бентон 38	0,5%
Сольвессо 150	59,5%

Інгредієнти старанно перемішують і подрібнюють у кульовому млині до одержання часток із розміром менше 3 мікрон.

Приклад 2F

Виготовляють диспергуємі у воді гранули такого складу:

Активний інгредієнт	30%
Дарван №2	15%
Арилан S	8%
Целіт PF	47%

Інгредієнти змішують, подрібнюють у гідродинамічній дробарці, а потім гранулюють в обертовому грануляторі, обприскуючи водою (аж до 10%). Отримані гранули сушать у сушарці з псевдозрідженим прошарком для видалення надлишку води.

Приклад 2G

Виготовляють порошок, що порошить, (дуст) такого складу:

Активний інгредієнт	1-10%
Дуже здрібнений порошок тальку (superfine)	99-90%

Інгредієнти старанно змішують і додатково подрібнюють при необхідності до одержання тонкого порошку. Цей порошок можна застосовувати до зараженого членистоногими локусу, наприклад, на смітниках, зберігаємих продуктах або домашньому посуді, або на тваринах, заражених чи схильних до зараження членистоногими, для боротьби з членистоногими, або його можна вводити перорально. Підходжі способи для розподілу порошку, що порошить, на ділянці, зараженій членистоногими, включають механічні повітродувки, ручні розпорошувачі і пристосування для самообробки домашньої худоби.

Приклад 2H

Виготовляють їстівну принаду такого складу:

Активний інгредієнт	0,1-1,0%
Пшенична мука	80%
Меласса	19,9-19%

Інгредієнти старанно перемішують і перетворюють у форму принади. Їстівну принаду можна розподіляти на ділянці, наприклад, у домашніх або промислових помешканнях, наприклад у кухнях, лікарнях або сховищах, на ділянках поза домом, заражених членистоногими, наприклад, мурашками, сараною, тарганами або мухами для боротьби з членистоногими за допомогою перорального введення.

Приклад 2I

Виготовляють композицію розчину такого складу:

Активний інгредієнт	15%
Диметилсульфоксид	85%

Активний інгредієнт розчиняють у диметилсульфоксиді при перемішуванні і/або нагріванні при необхідності. Даний розчин можна застосовувати через шкіру шляхом поливу домашніх тварин, заражених членистоногими, або після стерилізації за допомогою фільтрування через політетрафлуоретиленову мембрану (розмір 0,22мкм), шляхом парентеральної ін'єкції в кількості для застосування від 1,2 до 12мл розчину на 100кг маси тіла тварини.

Приклад 2J

Виготовляють порошок, що змочується, такого складу:

Активний інгредієнт	50%
Етилан BCP	5%
Аеросил	5%
Целіт PF	40%

Етилан абсорбують на Аеросил, потім змішують з іншими інгредієнтами і подрібнюють у молотковому млині, одержуючи порошок, що змочується, що можна розбавляти водою до концентрації від 0,001% до 2% за масою активної сполуки, і застосовувати до локусу, зараженого членистоногими, наприклад, личинками двокрилих або рослинними нематодами, шляхом обприскування, або до домашніх тварин, заражених, або схильних до зараження членистоногими, гельмінтами або найпростішими, розпиляючи або занурюючи, або шляхом перорального введення в питній воді, для боротьби з членистоногими, гельмінтами або найпростішими.

Приклад 2K

Композицію у вигляді кульок (болюсів) з уповільненим вивільненням одержують із гранул, що містять такі компоненти в різних процентних співвідношеннях (аналогічно тим, що описані для зазначених вище композицій), у залежності від необхідності:

- Активний інгредієнт
- Агент, що забезпечує щільність
- Агент, що забезпечує уповільнене виділення
- Сполучне

Старанно перемішані інгредієнти формують у гранули, що пресують у кульки з питомою густиною 2 або більше. Їх можна вводити перорально жуйним домашнім тваринам для того, щоб вони затрималися в ретикуло-рубці для забезпечення безупинного повільного виділення активної сполуки протягом тривалого проміжку часу для боротьби з зараженням жуйних домашніх тварин членистоногими, гельмінтами або найпростішими.

приклад 2L

Композицію такого складу з уповільненим виділенням виготовляють у формі гранул, таблеток, брикетів або т.п.:

Активний інгредієнт	0,5-25%
Полівінілхлорид	75-99,5%

Діоктилфталат (пластифікатор)

Компоненти змішують, а потім формують у підходящу форму екструзією у розплаві або формуванням. Ці композиції корисні, наприклад, для додавання в стоячу воду, або виготовлення комірців або бирок на вуха для прикріплення до домашніх тварин для боротьби зі шкідниками за допомогою уповільненого виділення.

Приклад 2M

Виготовляють диспергуємі у воді гранули такого складу:

Активний інгредієнт	85% (макс)
Полівінілпіролідон	5%
Атапульгітна глина	6%
Лаурилсульфат натрію	2%
Гліцерин	2%

Інгредієнти змішують у вигляді 45% суспензії у воді, і подрібнюють у вологому стані до розміру часток 4мкм, потім сушать розпиленням для видалення води.

Хоча даний винахід був описаний з огляду кращих варіантів, спеціалістам повинно бути ясно, що різні модифікації, заміщення, пропускання і зміни можна здійснити, не виходячи за рамки його суті. Відповідно, мається на увазі, що об'єм даного винаходу обмежений тільки об'ємом такої формули винаходу, включаючи його еквіваленти.