



УКРАЇНА

(19) UA (11) 34466 (13) C2

(51) 7 A01N43/50, 43/78, 43/40,  
47/44, 57/24, 43/54, 43/66

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ  
І НАУКИ УКРАЇНИ

ДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ  
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ  
ВЛАСНОСТІ

## ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД

### (54) ЗАСІБ ДЛЯ НЕСИСТЕМНОЇ БОРОТЬБИ З ПАРАЗИТУЮЧИМИ КОМАХАМИ

(21) 95058436

(22) 18.05.1995

(24) 15.03.2001

(31) P 4417742.9

(32) 20.05.1994

(33) DE

(46) 15.03.2001, Бюл. № 2, 2001 р.

(72) Дорн Хуберт (DE), Хопкінс Теренс (AU)

(73) БАЙЕР АГ (DE)

(56) EP, 0268915, 01.06.1988.

EP, 0413610, 20.02.1991.

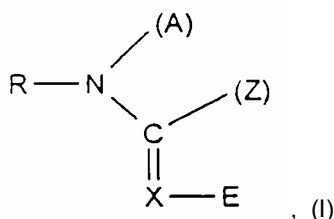
EP, 0483052, 29.04.1992.

WO, 9324002, 09.12.1993.

US, 4171355, 16.10.1979.

(57) 1. Средство для несистемной борьбы с паразитирующими насекомыми, содержащее по меньшей мере одно активное вещество и по меньшей мере один носитель, **отличающееся** тем, что в качестве активного вещества оно содержит агонист или антагонист никотинэргических ацетилхолиновых рецепторов насекомых в эффективном количестве.

2. Средство по п.1, **отличающееся** тем, что в качестве активного вещества оно содержит соединение общей формулы (I)



где R означает водород, незамещенные или замещенные остатки группы: ацил, алкил, арил, аралкил, гетероарил или гетероарилалкил, A означает монофункциональную группу из ряда: водород, ацил, алкил, арил или бифункциональную группу, которая связана с остатком Z, E означает электроноакцепторный остаток, X означает остатки -CH= или -N=, причем остаток -CH= вместо атома водорода может быть связан с остатком Z, Z означает монофункциональную группу из ряда

алкил, -O-R, -S-R,  $-\text{N} \begin{array}{l} \nearrow \text{R} \\ \searrow \text{R} \end{array}$

или бифункциональную группу, которая соединена с остатком A или остатком X.

3. Средство по п.1, **отличающееся** тем, что в качестве активного вещества оно содержит соединение общей формулы (I) по п.2, в которой остатки имеют следующее значение:

R означает незамещенный или замещенный гетероарилметил, гетероарилэтил, содержащие до 6 атомов в кольце и азот, кислород, серу в качестве гетероатома,

A означает водород, а также незамещенный или замещенный алкил, или алкилен с 1-4 атомами углерода и причем алкиленовые группы могут быть прерваны гетероатомами из ряда азот, кислород, сера,

A и Z вместе с атомами, с которыми они связаны, могут образовывать насыщенное или ненасыщенное гетероциклическое кольцо, которое может содержать дополнительно 1 или 2 одинаковых или различных гетероатомов и/или гетерогрупп,

E означает группу NO<sub>2</sub>, CN, галогеналкилкарбонил,

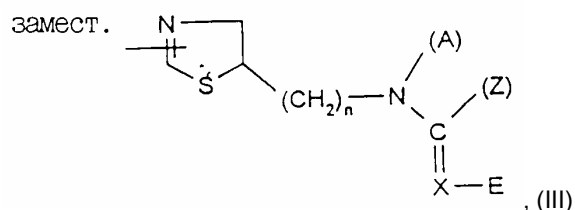
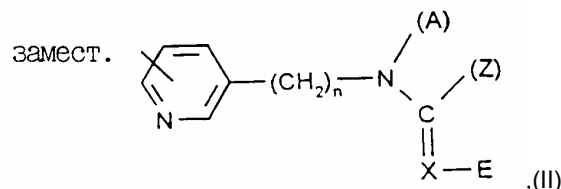
X означает -CH= или -N=,

Z означает возможно замещенные остатки алкил, -OR, -SR, -NRR, причем R и заместители предпочтительно имеют указанное выше значение,

Z может, кроме вышеназванного кольца, образовывать вместе с атомом, с которым он связан, и

остатком =C- вместо X, насыщенное или ненасыщенное гетероциклическое кольцо.

4. Средство по п.1, **отличающееся** тем, что оно содержит в качестве активного вещества соединения общих формул (II) и (III),



C2 (13)

34466 (11)

UA (19)

в которых  
n означает 1 или 2,  
заместителем является галоген,  
A, Z, X и E имеют указанные в пп. 2 и 3 значения.

5. Средство по п.1, **отличающееся** тем, что оно содержит в качестве активного вещества 1 - [ (6-хлор-3-пиридинил)метил]-N-нитро-2-имидазолдиний.

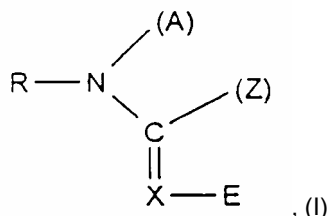
Настоящее изобретение относится к области борьбы с паразитами, в частности, к средству для несистемной борьбы с паразитирующими насекомыми.

Известно применение определенных азотосодержащих соединений в качестве агонистов или антагонистов никотинэргических ацетилхолиновых рецепторов насекомых (см., например, европейские выложенные заявки N 464 830, 428 941, 425 978, 386 565, 383 091, 375 907, 364 844, 315 826, 259 738, 254 859, 235 725, 212 600, 192 060, 163 855, 154 178, 136 636, 303 570, 302 833, 306 696, 189 972, 455 000, 135 956, 471 372, 302 389; немецкие выложенные заявки N 3 639 877, 3 712 307; японские выложенные заявки N 03 220 176, 02 207 083, 63 307 857, 63 287 764, 03 246 283, 04 9371, 03 279 359, 03 255 072; патенты США N 5 034 524, 4 948 798, 4 918 086, 5 039 686, 5 034 404; PCT-заявки N WO 91/17 659, 91/4965; французская заявка N 2 611 114; бразильская заявка N 88 03 621).

Неожиданно было найдено, что именно агонисты или антагонисты никотинэргических ацетилхолиновых рецепторов насекомых особенно пригодны для несистемной борьбы с насекомыми, такими как блохи, вши или мухи, паразитирующими на людях и животных.

Поэтому объектом изобретения является средство для несистемной борьбы с паразитирующими насекомыми, которое наряду с по меньшей мере одним носителем содержит в качестве активного вещества по меньшей мере один агонист или антагонист никотинэргических ацетилхолиновых рецепторов насекомых в эффективном количестве.

Средство согласно изобретению содержит предпочтительно активные вещества общей формулы (I)



где R означает водород, незамещенные или замещенные остатки группы: ацил, алкил, арил, аралкил, гетероарил или гетероарилалкил,

А означает монофункциональную группу из ряда: водород, ацил, алкил, арил или бифункциональную группу, которая связана с остатком Z,

Е означает электроноакцепторный остаток,

X означает остатки  $-CH=$  или  $=N-$ , причем остаток  $-CH=$  вместо атома водорода может быть связан с остатком Z.

Z означает монофункциональную группу из  
ряда алкил, -O-R, -S-R,  $-N \begin{smallmatrix} \nearrow R \\ \searrow R \end{smallmatrix}$

или бифункциональную группу, которая соединена с остатком А или остатком Х.

Особенно предпочтительны соединения формулы (I), в которой остатки имеют следующие значения:

R означает водород, а также незамещенные или замещенные остатки из ряда: ацил, алкил, арил, аралкил, гетероарил, гетероарилалкил.

В качестве ацильных остатков следует называть формил, алкилкарбонил, арилкарбонил, алкилсульфонил, арилсульфонил, (алкил-)-(арил-)-фосфорил, которые, в свою очередь, могут быть замещены.

В качестве алкильных остатков следует называть алкил с 1-10 атомами углерода, в частности, алкил с 1-4 атомами углерода, более конкретно, метил, этил, изо-пропил, втор.- или трет.-бутил, которые, в свою очередь, могут быть замещены.

В качестве арила следует назвать фенил, нафтил, в частности, фенил. В качестве аралкила следует назвать фенилметил, фенилэтил.

В качестве гетероарила следует назвать гетероарил, содержащий до 10 атомов в кольце и в качестве гетероатома азот, кислород и серу, в частности, азот. Конкретно следует назвать тие- нил, фурил, тиазолил, имидазолил, пиридил, бенз- тиазолил.

В качестве гетероарилалкила следует называть гетероарилметил, гетероарилэтил, содержащие до 6 атомов в кольце и в качестве гетероатома азот, кислород, серу, в частности азот.

Заместителями, которые можно привести в качестве примера и которые являются предпочтительными, являются следующие:

алкил с предпочтительно 1-4, в частности, 1-2 атомами углерода, такие как метил, этил, н- и изо-пропил и н-, изо- и трет.-бутил;

алкокси с предпочтительно 1-4, в частности, 1 или 2 атомами углерода, такие как метокси, этокси, н- и изо-пропилокси и н-, изо- и трет.-бутилокси;

алкилтио с предпочтительно 1-4, в частности, 1 или 2 атомами углерода, такие как метилтио, этилтио, *n*- и изо-пропилтио и *n*-, изо- и трет.-бутилтио;

галоидалкил с предпочтительно 1-4, в частности, 1 или 2 атомами углерода и предпочтительно с 1-5, в частности, 1-3 атомами галоида.

причем галоиды являются одинаковыми или различными и означают предпочтительно фтор, хлор или бром, в частности фтор, например, трифторметил;

ГИДРОКСИ:

галогид, предпочтительно фтор, хлор, бром и иод, в частности фтор, хлор и бром;

циано;

нитро;

амино;

моноалкил и диалкиламино с предпочтительно 1-4, в частности, 1 или 2 атомами углерода в каждой алкильной группе, например, метиламино, метилэтиламино, н- и изо-пропиламино и метил-н-бутиламино;

карбоксил;

карбалкокси с предпочтительно 2-4, в частности, 2 или 3 атомами углерода, например, карбометокси и карбоэтокси;

сульфо (-SO<sub>3</sub>H);

алкилсульфонил с предпочтительно 1-4, в частности, 1 или 2 атомами углерода, например, метилсульфонил и этилсульфонил;

арилсульфонил с предпочтительно 6 или 10 арильными атомами углерода, например, фенилсульфонил, а также гетероариламино и гетероарилалкиламино, такие как хлорпиридиламино и хлорпиридилметиламино.

A является особенно предпочтительно водородом, а также незамещенным или замещенным остатком из ряда ацил, алкил, арил, которые предпочтительно имеют значения, указанные для R. Далее A означает бифункциональную группу. Следует назвать незамещенный или замещенный алкилен с 1-4, в частности, с 1-2 атомами углерода, причем в качестве заместителей нужно назвать вышеперечисленные заместители и причем алкиленовые группы могут быть прерваны гетероатомами из ряда азот, кислород, сера.

A и Z вместе с атомами, с которыми они связаны, могут образовывать насыщенное или ненасыщенное гетероциклическое кольцо. Гетероциклическое кольцо может содержать дополнительно 1 или 2 одинаковых или различных гетероатомов и/или гетерогрупп. Гетероатомами предпочтительно являются кислород, сера или азот и гетерогруппами N-алкил, причем алкил N-алкильной группы содержит предпочтительно 1-4, в частности, 1 или 2 атома углерода. В качестве алкила следует назвать метил, этил, н-, изо- и трет.-бутил. Гетероциклическое кольцо содержит 5-7, предпочтительно 5 или 6 членов кольца.

В качестве примеров гетероциклического кольца следует назвать пирролидин, пиперидин, пиперазин, гексаметиленмин, гексагидро-1,3,5-триазин, морфолин, которые могут быть замещены предпочтительно метилом.

E означает электроноакцепторный остаток, в частности, следует назвать NO<sub>2</sub>, CN, галоидалкилкарбонил, такой как 1,5-галоид-C<sub>1-4</sub>-карбонил, в частности, COCF<sub>3</sub>.

X означает -CH= или -N=.

Z означает возможно замещенные остатки алкил, -OR, -SR, -NRR, причем R и заместители предпочтительно имеют указанное выше значение.

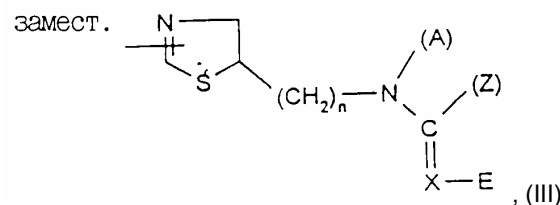
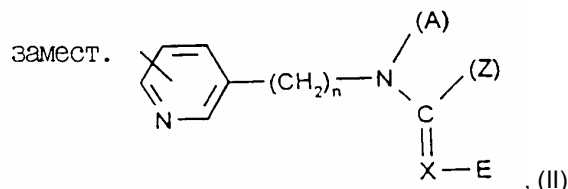
Z может кроме вышеназванного кольца образовывать вместе с атомом, с которым он связан,

и остатком =C- вместо X, насыщенное или ненасыщенное гетероциклическое кольцо. Гетероциклическое кольцо может иметь другие 1 или 2 одинаковые или различные гетероатома и/или гетерогруппы. Гетероатомами предпочтительно являются кислород, сера или азот и гетерогруппами

N-алкил, причем алкил или N-алкильная группа предпочтительно имеют 1-4, в частности, 1 или 2 углеродных атома. В качестве алкила следует назвать метил, этил, н- и изо-пропил и н-, изо- и трет.-бутил. Гетероциклическое кольцо содержит 5-7, предпочтительно 5 или 6 членов кольца.

В качестве примеров гетероциклического кольца можно назвать пирролидин, пиперидин, пиперазин, гексаметиленмин, морфолин и N-метилпиперазин.

Особенно предпочтительные активные вещества имеют общие формулы (II) и (III)



в которых

n означает 1 или 2,

заместитель означает один из вышеприведенных заместителей, в частности, галоид, особенно хлор,

A, Z, X и E имеют вышеуказанные значения.

Средство по изобретению может быть в любой жидкой или твердой форме, которые известны для средств для борьбы с вредителями.

Пригодными формами являются: растворы или концентраты для употребления после разбавления, растворы для нанесения на кожу, составы для полива, гели; эмульсии и суспензии для дермального применения, а также полутвердые составы; композиции, в которых активное вещество введено в основу мази или в основу эмульсии масло-в-воде или вода-в-масле, твердые композиции, такие как порошки, содержащие активное вещество формованные изделия, как, например, полосы, пластины, повязки, ошейники, ушные метки, бандажи для конечностей, маркирующие устройства.

Растворы для кожного применения накапливают, намазывают, втирают, набрызгивают, напыляют или наносят путем погружения, с помощью ванн или мойкой.

Растворы получают тем, что растворяют активное вещество в подходящем растворителе и добавляют возможные добавки, такие как вещество, способствующее растворению, кислоты, основания, буферные соли, антиоксиданты, консервирующие средства.

В качестве растворителей следует назвать физиологически переносимые растворители, такие как вода, спирты, например, этанол, бутанол, бензиловый спирт, глицерин, углеводороды, пропиленгликоль, полиэтиленгликоли, N-метилпирролидон, а также их смеси.

Активные вещества растворяют при желании также в физиологически переносимых растительных или синтетических маслах.

В качестве веществ, способствующих растворению, следует назвать растворители, которые способствуют растворению активного вещества в основном растворителе или препятствуют его осаждению.

Примерами являются поливинилпирролидон, полиоксиэтилированное касторовое масло, полиоксиэтилированный сложный сорбитановый эфир.

Консервирующими средствами являются бензиловый спирт, трихлорбутанол, сложный эфир п-гидроксibenзойной кислоты, н-бутанол.

Может быть предпочтительным прибавлять при получении растворов загустители. Загустителями являются неорганические загустители, такие как бентониты, коллоидальная кремниевая кислота, алюминиймоностеарат; органические загустители, такие как производные целлюлозы, поливиниловые спирты и их сополимеры, акрилаты и метакрилаты. Гели, которые наносятся или намазываются на кожу, получают тем, что растворы, полученные как описано выше, смешивают с таким количеством загустителя, чтобы получилась прозрачная масса мазеподобной консистенции. В качестве загустителей применяют вышеописанные вещества. Композиции для полива выливают или набрызгивают на ограниченный участок кожи, причем активное вещество распределяется на поверхности тела. Композиции для полива получают тем, что активное вещество растворяют в подходящих, переносимых кожей растворителях или смесях растворителей, суспендируют или эмульгируют. При необходимости добавляют вспомогательные вещества, такие как красители, антиоксиданты, светозащитные средства, связующие.

В качестве растворителей следует назвать воду, алифатические спирты, гликоли, полиэтиленгликоли, полипропиленгликоли, глицерин, ароматические спирты, такие как бензиловый спирт, фенилэтанол, феноксиэтанол, сложные эфиры, такие как сложный эфир уксусной кислоты, бутилацетат, бензилбензоат, простые эфиры, такие как алкиловый эфир алкиленгликоля, например, моноэтиловый эфир дипропиленгликоля, монобутиловый эфир диэтиленгликоля, кетоны, например, ацетон, метилэтилкетон, ароматические и/или алифатические углеводороды, растительные или: синтетические масла, диметилформамид, диметилацетамид, N-метилпирролидон, 2-диметил-4-окси-метил-1,3-диоксолан. Красителями являются все разрешенные к применению на животных красители, которые могут быть растворены или суспендированы. Вспомогательными веществами являются также растекающиеся масла, такие как изопропилмиристат, дипропиленгликольпеларгонат, силиконовые масла, сложные эфиры жирных кислот, триглицериды, жирные спирты. Антиоксидантами являются сульфиты или метабисульфиты, например, метабисульфит калия, аскорбиновая кислота, бутилгидрокситолуол, бутилгидроксианизол, токоферол.

Светозащитными веществами являются, например, вещества из класса бензофенонов или новантизоловая кислота.

Связующими являются, например, производные целлюлозы, производные крахмала, полиакрилаты, природные полимеры, такие как альгинаты, желатины. Эмульсии существуют двух типов: вода в масле или масло в воде. Их получают тем, что растворяют активное вещество либо в гидрофобной, либо в гидрофильной фазе и ее с добавлением подходящих эмульгаторов и при необходимости других вспомогательных веществ, таких как красители, способствующие ресорбции вещества, консервирующие вещества, антиоксиданты, светозащитные вещества, повышающие вязкость вещества, гомогенизируют с растворителем другой фазы.

В качестве гидрофобной фазы (масла) следует назвать парафиновые масла, силиконовые масла, натуральные растительные масла, такие как кунжутное масло, миндальное масло, касторовое масло, синтетические триглицериды, такие как биглицерид каприл/каприновой кислоты, смесь триглицеридов с растительными жирными кислотами с длиной цепи 8-12 атомов углерода и другими специально выбранными природными жирными кислотами, смесь частичных глицеридов насыщенных или ненасыщенных, возможно также содержащих гидроксильные группы жирных кислот, моно- и диглицериды C<sub>8</sub>-C<sub>10</sub>-жирных кислот;

сложные эфиры жирных кислот, такие как этилстеарат, ди-н-бутирил-адипат, сложный гексиловый эфир лауриновой кислоты, дипропиленгликольпеларгонат, сложные эфиры разветвленной жирной кислоты со средней длиной цепи с насыщенными жирными спиртами с длиной цепи C<sub>16</sub>-C<sub>18</sub>, изопропилмиристат, изопропилпальмитат, сложные эфиры каприл/каприновой кислоты с насыщенными жирными спиртами с длиной цепи C<sub>12</sub>-C<sub>18</sub>, изопропилстеарат, сложный этиловый эфир олеиновой кислоты, сложный дециловый эфир олеиновой кислоты, этилолеат, этиловый эфир молочной кислоты, воскоподобные сложные эфиры жирных кислот, такие как дибutilфталат, сложный диизопропиловый эфир адипиновой кислоты, родственные последнему смеси сложных эфиров с жирными спиртами, такими как изотридециловый спирт, 2-октилдодеканоил, цетилстеариловый спирт, олеиловый спирт; жирные кислоты, например, олеиновая кислота и ее смеси.

В качестве гидрофильной фазы следует назвать воду, спирты, такие как, например, пропиленгликоль, глицерин, сорбитол и их смеси.

Эмульгаторами являются неионогенные поверхностно-активные вещества, например, полиоксиэтилированное касторовое масло, полиоксиэтилированный сорбитанмоноолеат, сорбитанмоностеарат, глицеринмоностеарат, полиоксиэтилстеарат, полигликолевый эфир алкилфенола;

амфотерные поверхностно-активные вещества, такие как динарий-N-лаурил-β-иминодипропионат или лецитин;

анионные поверхностно-активные вещества, такие как лаурилсульфат натрия, сульфаты простых эфиров жирных спиртов, моноэтаноламиновая соль сложного эфира ортофосфорной кислоты и простого моно/диалкилполигликолевого эфира;

катионные поверхностно-активные вещества, такие как цетилтриметиламмонийхлорид.

В качестве других вспомогательных веществ следует назвать повышающие вязкость и стабилизирующие эмульсию вещества, такие как карбоксиметилцеллюлоза, метилцеллюлоза и другие производные целлюлозы и крахмала, полиакрилаты, альгинаты, желатина, гуммиарабик, поливинилпирролидон, поливиниловый спирт, сополимеры метилвинилового эфира и малеинового ангидрида, полиэтиленгликоли, воска, коллоидальная кремниевая кислота или смеси указанных веществ.

Суспензии получают суспендированием активного вещества в жидкости-носителе, при необходимости с добавлением других вспомогательных веществ, таких как смачиватели, красители, способствующие ресорбции вещества, консерванты, антиоксиданты и светозащитные средства.

В качестве жидких наполнителей следует назвать все гомогенные растворители и смеси растворителей.

В качестве смачивателя (диспергатора) следует назвать вышеназванные поверхностно-активные вещества.

В качестве других вспомогательных веществ могут быть использованы другие вышеназванные вещества.

Полутвердые композиции для кожного применения отличаются от вышеописанных суспензий и эмульсий лишь более высокой вязкостью. Для получения твердых композиций смешивают активное вещество с подходящими носителями, при необходимости с добавкой вспомогательных веществ, и переводят в желаемую форму.

В качестве носителей могут быть названы все физиологически переносимые твердые инертные вещества. Таковыми являются все неорганические или органические вещества. Неорганическими веществами являются, например, поваренная соль, карбонаты, например, карбонат кальция, кислые карбонаты, окислы алюминия, кремниевые кислоты, глинозем, осажденная или коллоидальная окись кремния, фосфаты.

Вспомогательными веществами являются уже приведенные выше консерванты, антиоксиданты, красители.

Другими подходящими вспомогательными веществами являются смазочные вещества, вещества, придающие скользкость, например, стеарат магния, стеариновая кислота, тальк, бентониты.

Рабочие формы композиций содержат активное вещество в концентрации от 1 ч/мл до 20 вес.%, предпочтительно 0,01-10 вес.%. Композиции, которые перед применением разбавляются, содержат активное вещество, как правило, в концентрации от 0,5 до 90 вес.%, предпочтительно от 1 до 50 вес.%.

Обычно является предпочтительным для достижения эффективного результата применять от 0,5 до 50 мг, предпочтительно от 1 до 20 мг активного вещества на кг веса в день.

Особенно предпочтительным является применение в виде формованных изделий. Формованными изделиями являются среди прочих ошейники, подвески для ошейников (медальоны), ушные метки, бандаж для укрепления конечностей или частей тела, клейкие полосы и пленки, снимающиеся пленки. Особенно предпочтительны

ошейники и медальоны. Для изготовления формованных изделий применяют термопластичные и эластичные термоотверждаемые полимеры, а также эластомеры и термопластичные эластомеры. Как таковые следует назвать поливиниловые смолы, полиуретаны, полиакрилаты, эпоксидные смолы, целлюлозы, производные целлюлозы, полиамиды и полиэфиры, которые совместимы с вышеназванным активным веществом. Полимеры должны обладать достаточной прочностью и гибкостью, чтобы при формировании не трескаться и не ломаться.

Они должны быть достаточно прочными на нормальный износ. Кроме того, полимеры должны обеспечивать достаточное перемещение активного вещества к поверхности формованного изделия.

В формованных изделиях могут содержать еще другие компоненты, такие как стабилизаторы, смазочные средства, средства для придания текучести, средства для извлечения из формы, наполнители и красители, не изменяя при этом основных свойств композиции.

Подходящими стабилизаторами являются антиоксиданты и средства, которые защищают бандаж от ультрафиолетового облучения и нежелательного разрушения во время обработки, например, прессования. Некоторые стабилизаторы, такие как эпоксидированные масла соевых бобов, служат, кроме того, в качестве вторичных смягчителей. В качестве смазочного средства могут применяться, например, стеараты, стеариновая кислота и полиэтилен с низким молекулярным весом. Эти компоненты могут применяться в концентрации до 5 вес.% от всей композиции.

Формованные изделия содержат активное вещество, как правило, в концентрации от 1 до 20 вес.%, предпочтительно от 5 до 20 вес.%, особенно предпочтительно около 10 вес.%.

Для ошейников концентрация активного вещества составляет предпочтительно 1-15%, для медальонов, подвесок и ушных меток предпочтительно 5-20%, для пленок, клеящихся полос предпочтительно от 0,1 до 5%. Активные вещества находятся в композициях и формованных изделиях в смеси с синергистами или другими активными веществами. К активным веществам относятся инсектициды, такие как фосфорсодержащие соединения, т.е. сложные эфиры фосфорной или фосфоновой кислот, природные или синтетические пиретроиды, карбоматы, амидины, ювенальные гормоны и ювеноидные синтетические активные вещества.

Нижеследующие примеры демонстрируют возможные формы средства согласно изобретению, содержащего в качестве активного вещества 1-[(6-хлор-3-пиридинил)метил]-N-нитро-2-имидазолидин (торговый продукт Имидаклоприд).

#### Пример 1

##### Суспензионный концентрат

Имидаклоприд	368 г
блоксополимер на основе этилен-оксида и пропиленоксида	35 г
конденсат сульфоната простого дитолилового эфира и формальдегида (эмульгатор)	12 г

водорастворимый поливиниловый спирт	3,5 г
NH <sub>4</sub> Cl	58,0 г
мочевина	116,0 г
37%-ная водная соляная кислота	1,2 г
Ксантан-гум	4,6 г
дистиллированная вода	560,5 г

**Пример 2****Диспергируемый порошок**

Имидаклоприд	25,0 г
диизобутил-нафталин-сульфонат натрия	1,0 г
н-додецилсульфокислый кальций	10,0 г
алкиларилполиглицоловый эфир, содержащий высокодисперсную кремниевую кислоту	12,0 г
конденсат сульфоната простого дитиолового эфира и формальдегида (эмульгатор)	3,0 г
®Байсилон-Е (кремнийсодержащий вспениватель фирмы Байер)	2,0 г
тонкодисперсная двуокись кремния	2,0 г
каолин	45,0 г

**Пример 3****Водорастворимый концентрат**

Имидаклоприд	18,3 г
нейтральный эмульгатор на основе алкиларилполиглицолового эфира	2,5 г
Na-соль сложного диизооктилового эфира сульфоянтарной кислоты	3,5 г
диметилсульфоксид	38,4 г
2-пропанол	37,5 г

**Пример 4****Водорастворимый концентрат**

Имидаклоприд	18,5 г
Na-соль сложного диизооктилового эфира сульфоянтарной кислоты	5,0 г
диметилсульфоксид	76,5 г
примешивают к 100 г шампуня, состоящего из:	
Марлон АТ 50 (триэтаноламина соль алкилбензолсульфокислот фирмы Хюльс АГ)	44,4 вес. %
Марлон А 350 (натриевая соль алкилбензолсульфокислот фирмы Хюльс АГ)	11,1 вес. %
продукт конденсации олеиновых кислот и диэтаноламина фирмы Хюльс АГ	3,0 вес. %
полиэтиленгликоль	41,5 вес. %

**Пример 5****Препарат для разбрызгивания**

Имидаклоприд	2,0 г
диметилсульфоксид	10,0 г
2-пропанол	35,0 г
ацетон	53,0 г

**Пример 6****Препарат для полива**

Имидаклоприд	20,3 г
--------------	--------

поливиниловый спирт	1,8 г
блоксополимер на основе этиленоксида и пропиленоксида	1,8 г
Ксантан-гум	0,26 г
глицерин	9,0 г
дистиллированная вода	59,2 г

**Пример 7****Композиция:**

Имидаклоприд	10,00 г
ди-н-бутиладипат	21,10 г
диэтилгексилфталат	9,10 г
эпоксидированное соевое масло	2,30 г
стеариновая кислота	0,80 г
поливинилхлорид	56,70 г

Получение: Гомогенную смесь из Имидаклоприда и поливинилхлорида смачивают в смесителе смесью из ди-н-бутиладипата, диэтилгексилфталата и эпоксидированного соевого масла. Перемешивают до гомогенности смеси. При этом нагревание, например, путем повышения числа оборотов мешалки, способствует введению смеси пластификаторов в поливинилхлорид. После заключительного гомогенного распределения стеариновой кислоты из смеси формируют собачьи ошейники.

**Пример 8****Композиция:**

Имидаклоприд	10,00 г
эпоксидированное соевое масло	2,30 г
стеариновая кислота	0,80 г
ацетилтрибутилцитрат	30,20 г
поливинилхлорид	56,70 г

Получение: Смесь из ацетилтрибутилцитрата и эпоксидированного соевого масла наносят в смесителе на гомогенную смесь из Имидаклоприда и поливинилхлорида. Нагревание при перемешивании способствует введению смеси пластификатора в поливинилхлорид; перемешивают до тех пор, пока смесь не станет гомогенной. Из смеси экструдированием обычным способом изготавливают собачьи ошейники.

**Пример 9****Композиция:**

Имидаклоприд	20,00 г
эпоксидированное соевое масло	2,30 г
стеариновая кислота	0,80 г
ацетилтрибутилцитрат	30,20 г
поливинилхлорид	56,70 г

Получение: как описано в примере 8.

**Пример 10****Композиция:**

Имидаклоприд	7,50 г
эпоксидированное соевое масло	10,00 г
стеариновая кислота	0,80 г
ацетилтрибутилцитрат	15,00 г
поливинилхлорид	66,70 г

Получение: как описано в примере 8.

**Пример 11****Композиция:**

Имидаклоприд	10,00 г
эпоксидированное соевое масло	2,30 г
стеариновая кислота	0,80 г
триацетин	15,00 г
поливинилхлорид	71,90 г

Получение: Смесь из триацетина и эпоксидированного соевого масла наносят в смесителе на гомогенную смесь из поливинилхлорида и Имидаклоприда.

лоприда. При этом нагревание, например, повышением числа оборотов мешалки, способствует введению пластификатора в поливинилхлорид. После перемешивания до однородного состояния смесь экструдировать в пластины, из которых штампуют медальоны (подвески к ошейникам).

#### Пример 12

##### Композиция:

Имидаклоприд 5,00 г  
 блоксополиэфирамид (Пебакс®) 94,50 г

Получение: Активное вещество в интенсивном смесителе наносят на носитель и из смеси формуют литьем под давлением собаки ошейники.

#### Пример 13

##### Композиция:

Имидаклоприд 10,00 г  
 триглицериды со средней  
 длиной цепи 15,00 г  
 высокодисперсная двуокись  
 кремния 0,50 г  
 блоксополиэфирамид (Пебакс®) 74,50 г

Получение: Триглицериды со средней длиной цепи наносят в смесителе на Имидаклоприд и блоксополиэфирамид. При этом нагревание способствует введению триглицеридов со средней длиной цепи в блоксополиэфирамид. Для улучшения текучести перед экструзией смеси гомогенно вмешивают высокодисперсную двуокись кремния. Экструдировать пластины, из которых штампуют медальоны (подвески к собачьим ошейникам).

#### Пример 14

##### Композиция:

Имидаклоприд 10,00 г  
 блоксополимер стирол-бутилен  
 (Термопласт® К) 90,00 г

Получение: Активное вещество наносят в интенсивном смесителе на носитель и из смеси литьем под давлением формуют ошейники.

#### Пример 15

##### Композиция:

Имидаклоприд 5,00 г  
 сложный сополиэфир (Хютрел®) 95,00 г

Получение: Из смеси обычным способом экструдировать собаки ошейники.

#### Пример 16

##### Композиция:

Имидаклоприд 10,00 г  
 блоксополиэфирамид (Пебакс®) 90,00 г

Получение: Гомогенную смесь экструдировать в экструдере пластины, из которых штампуют медальоны (подвески для собачьих ошейников).

#### Пример 17

##### Композиция:

Имидаклоприд 10,00 г  
 триглицериды со средней  
 длиной цепи 30,00 г  
 высокодисперсная двуокись  
 кремния 0,50 г  
 блоксополиэфирамид (Пебакс®) 59,50 г

Получение: как описано в примере 13.

Нижеприведенные примеры подтверждают биологическую активность средства согласно изобретению.

#### Пример 18

1 мл описанного в примере 1 препарата в виде раствора наносят на плечо собаки, зараженной 200 блохами. Подопытное животное сразу же освобождалось от взрослых блох. Обработка согласно изобретению приводит к 100%-ной смертности блох.

#### Пример 19

1 мл описанного в примере 1 препарата разводят в 1 л воды и этим раствором смачивают собак, зараженных блохами. Получают следующие результаты:

Период времени, день	Число блох на собаку		% активности
	необработанные	обработанные	
- 1 заражение 100 блохами			
0 обработка и подсчет	30	0	100
5,8 заражение 100 блохами			
9 подсчет	56	0	100
15 заражение 100 блохами			
16 подсчет	76	0	100
19 заражение 100 блохами (необработанные животные) 250 блохами (обработанные животные)			
20 подсчет	39	0	100
26 заражение 100 блохами			
27 подсчет	43	0	100

#### Пример 20

1 мл раствора по примеру 1 наносят на плечо собаки. Животное заражают 200 блохами на второй и шестой день после обработки. На

третий и соответственно седьмой день после обработки подсчитывают оставшихся на собаке блох. Не было обнаружено ни одной живой блохи. Активность составляла 100%.

---

Тираж 50 екз.

Відкрите акціонерне товариство «Патент»  
Україна, 88000, м. Ужгород, вул. Гагаріна, 101  
(03122) 3 – 72 – 89 (03122) 2 – 57 – 03

---