



(19) **RU** ⁽¹¹⁾ **2 160 535** ⁽¹³⁾ **C2**

(51) МПК⁷ **A 01 N 47/02, 43/56**

РОССИЙСКОЕ АГЕНТСТВО
ПО ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ПАТЕНТУ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

(21), (22) Заявка: 97110663/13, 27.09.1996
(24) Дата начала действия патента: 27.09.1996
(30) Приоритет: 29.09.1995 FR 9511685
11.09.1996 FR 9611278
(46) Дата публикации: 20.12.2000
(56) Ссылки: EP 0295117 A, 14.12.1988. EP 0412849
A, 13.02.1991. EP 0500209 A, 26.08.1992. EP
0659745 A, 28.06.1995. WO 9306089 A,
01.04.1993.
(85) Дата перевода заявки PCT на национальную
фазу: 30.06.1997
(86) Заявка PCT:
FR 96/01521 (27.09.1996)
(87) Публикация PCT:
WO 97/12521 (10.04.1997)
(98) Адрес для переписки:
129010, Москва, ул. Большая Спасская 25,
стр.3, ООО "Городисский и Партнеры",
Лебедевой Н.Г.

(71) Заявитель:
МЕРИАЛЬ (FR)
(72) Изобретатель: Жан-Пьер ЭТШЕГАРАЙ (FR)
(73) Патентообладатель:
МЕРИАЛЬ (FR)

(54) АНТИПАРАЗИТАРНЫЙ СОСТАВ ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ И ЗАЩИТЫ ЖИВОТНЫХ-СПУТНИКОВ ЧЕЛОВЕКА

(57)
Состав, используемый особенно для
лечения и защиты домашних животных,
зараженных, или которые могут быть
заражены, паразитами, содержит в форме
раствора, готового к применению: а)
действующее инсектицидное начало
формулы (1), б) ингибитор кристаллизации, в)
органический растворитель, имеющий
диэлектрическую проницаемость в интервале

10 - 35, предпочтительно 20 - 30, г)
дополнительный органический растворитель,
имеющий температуру кипения меньше
100 °С, предпочтительно меньше 80°С, и
диэлектрическую проницаемость в интервале
10 - 40, предпочтительно 20 - 30. Состав
обладает высокой эффективностью удобен
при применении, так как не требует
обрызгивания всего тела животного. 20
з.п.ф-лы, 1 табл.

RU 2 1 6 0 5 3 5 C 2

RU 2 1 6 0 5 3 5 C 2



(19) **RU** ⁽¹¹⁾ **2 160 535** ⁽¹³⁾ **C2**
(51) Int. Cl.⁷ **A 01 N 47/02, 43/56**

RUSSIAN AGENCY
FOR PATENTS AND TRADEMARKS

(12) **ABSTRACT OF INVENTION**

(21), (22) Application: 97110663/13, 27.09.1996
(24) Effective date for property rights: 27.09.1996
(30) Priority: 29.09.1995 FR 9511685
11.09.1996 FR 9611278
(46) Date of publication: 20.12.2000
(85) Commencement of national phase: 30.06.1997
(86) PCT application:
FR 96/01521 (27.09.1996)
(87) PCT publication:
WO 97/12521 (10.04.1997)
(98) Mail address:
129010, Moskva, ul. Bol'shaja Spasskaja 25,
str.3, OOO "Gorodisskij i Partnery", Lebedevoj N.G.

(71) Applicant:
MERIAL' (FR)
(72) Inventor: Zhan-P'er EhTShEGARAJ (FR)
(73) Proprietor:
MERIAL' (FR)

(54) **ANTI-PARASITIC COMPOSITION FOR TREATMENT AND PROTECTION OF DOMESTIC ANIMALS**

(57) Abstract:
FIELD: veterinary. SUBSTANCE:
ready-to-use composition contains: active
insecticide substance having formula 1
(given in description); crystallization
inhibitor; organic solvent with dielectric

permittivity 10- 35, preferably 20-30;
auxiliary organic solvent having boiling
temperature below 100 C, preferably below 80
C, and dielectric permittivity 10-40,
preferably 20-30. EFFECT: increased
anti-parasitic efficiency. 21 cl, 1 tbl, 24 ex

RU
2 1 6 0 5 3 5
C 2

RU
2 1 6 0 5 3 5
C 2

Изобретение касается состава для лечения и защиты животных, зараженных, или которые могут быть заражены, паразитами.

В частности, целью изобретения является борьба с паразитами и удаление паразитов, заражающих животных-спутников человека, особенно кошек и собак.

Животные-спутники человека часто заражаются одним или несколькими из следующих паразитов:

- кошачьи и собачьи блохи (*Ctenocephalides felis*, *Ctenocephalides* sp. и другие),

- клещи (*Rhipicephalus* sp., *Ixodes* sp., *Dermacentor* sp., *Amblyomma* sp. и другие),

- галлы (*Demodex* sp., *Sarcoptes* sp., *Octodectes* sp. и другие).

Блохи вызывают у животного сильный стресс и наносят вред его здоровью. Кроме того, блохи являются также переносчиками патогенных факторов, таких как собачий солитер (*Dipylidium canis*), и могут также нападать на человека.

Таким же образом, клещи также могут вызывать стресс у животного и наносить вред его здоровью. Они также могут нанести вред человеку. Но самая серьезная проблема заключается в том, что они являются переносчиками патогенных факторов, способных затрагивать как животное, так и человека. Среди основных заболеваний, которых необходимо избежать, можно назвать боррелиозы (болезнь Лима, вызываемая *Borellia burgdorferi*) и бабезиеллезы (или пироплазмозы, вызываемые *Babesia* sp.), рекетсиозы (называемые английским названием "пятнистая лихорадка скалистых гор"). Клещи могут также выделять токсины с парализующими и воспалительными свойствами и иногда могут вызвать смертельный исход.)

Наконец, с галлами особенно трудно бороться, так как существует очень мало активных веществ, действующих на этих паразитов, и они требуют частых обработок.

Существует много более или менее активных и более или менее дорогих инсектицидов. Но явление резистентности часто зависит от их использования, как, например, в случае карбаматов, фосфорорганических соединений и пиретроидов.

Международная заявка на патент 8703781 и европейская заявка на патент 0295117 описывают большое семейство N-фенил-пиразолов, имеющих очень широкий спектр действия, включая антипаразитарные действия.

Целью изобретения является создание новых антипаразитарных составов для лечения и защиты животных, обладающих высокой эффективностью и удобных при применении.

Другой целью изобретения является создание таких легко используемых составов для всех видов домашних животных, какими бы ни были их размер и характер волосяного покрова.

Еще одной целью изобретения является создание эффективных антипаразитарных составов, не требующих обрызгивания всего тела животного.

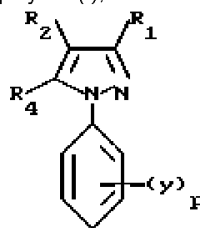
Еще одной другой целью изобретения является создание таких составов, которые, будучи нанесены локально, будут затем

распространяться по всему телу животного, затем высыхать, в максимальной степени избегая любого явления кристаллизации.

Еще одной целью изобретения является создание таких составов, которые после сушки не влияют на внешний вид волосяного покрова и, особенно, не оставляют кристаллов и не придают волосяному покрову белесый оттенок.

Эти цели достигаются изобретением, а именно антипаразитарными составами, используемыми, в частности, для лечения и защиты домашних животных, зараженных, или которые могут быть заражены, паразитами, содержащие в форме раствора, готового к применению

а) действующее инсектицидное начало формулы (I),



(I)

где R₁ обозначает атом галогена, CN или метил;

R₂ обозначает S(O)_nR₃ или 4,5-дицианоимидазол 2-ил или галогеналкил;

R₃ обозначает алкил или галогеналкил, например низший галогеналкил;

R₄ обозначает атом водорода или галогена; или радикал NR₅R₆, C(O)_mR₇, C(O)R₇, или C(O)OR₇, алкил, галогеналкил, или OR₈, или радикал -N=C(R₉) (R₁₀);

R₅ и R₆ независимо друг от друга обозначают атом водорода или радикал алкил, галогеналкил, C(O)алкил, S(O)_rCF₃, ацил или алкоксикарбонил; или R₅ и R₆ вместе могут образовывать двухвалентный алкиленовый радикал, который может быть прерван одним или двумя двухвалентными гетероатомами, такими как кислород или сера;

R₇ обозначает алкильный радикал или галогеналкильный радикал;

R₈ обозначает алкильный радикал, галогеналкильный радикал или атом водорода;

R₉ обозначает алкильный радикал или атом водорода;

R₁₀ обозначает фенил или гетероарил, возможно замещенный одним или несколькими атомами галогена или такими группами, как OH, -O-алкил, -S-алкил, циано, или алкил;

Y обозначает атом галогена, галогеналкильный радикал или галогеналкоксильный радикал, например, низший галогеналкоксильный радикал, SF₅ с возможностью того, что

Y может быть CN или NO₂ в положениях 2 и 6 (по отношению к углероду, связанному с пиразольным циклом и обозначенному 1);

что углерод в положении 2 может быть замещен на N;

что Y может быть S(O)_qCF₃ в положении 4, но предпочтительно галогеналкил, галогеналкоксигруппа или SF₅;

m, n, q, r обозначают, независимо один от другого, целое число, равное 0, 1 или 2;

p является целым числом, равным 1, 2, 3, 4 или 5, предпочтительно равным 1, 2 или 3, особенно 3;

при условии, что, когда R₁ обозначает метил, тогда или R₃ обозначает галогеналкил, R₄ обозначает NH₂, p равно 2, Y в положении 6 обозначает C1, Y в положении 4 обозначает CF₃, и углерод в положении 2 фенила замещен на N; или R₂ обозначает 4,5-дицианоимдазол 2-ил, R₄ обозначает C1, p равно 3, Y в положении 6 обозначает C1, Y в положении 4 обозначает CF₃ и углерод в положении 2 фенила замещен на =C-C1,

в количестве 1-20%, предпочтительно, 5-15% (процентное содержание масса/объем) от общего состава;

б) ингибитор кристаллизации в количестве 1-20% (масса/объем), предпочтительно 5-15%, который отвечает тесту, согласно которому:

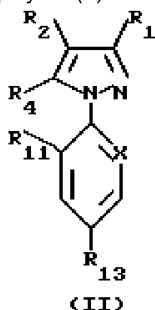
0,3 мл раствора а), содержащего 10% (масса/объем), соединения формулы (I) в растворителе, определенном в пункте с), следующем ниже, а также 10% этого ингибитора наносят на стеклянную пластинку при 20°C на 24 часа, после чего невооруженным глазом на стеклянной пластинке не наблюдают кристаллов или наблюдают немного кристаллов, в частности меньше 10 кристаллов, предпочтительно отсутствие кристаллов,

в) органический растворитель, имеющий диэлектрическую проницаемость, в интервале 10-35, предпочтительно 20-30, в количестве, предпочтительно дополняющим состав до 100%,

г) дополнительный органический растворитель, имеющий температуру кипения меньше 100°C, предпочтительно меньше 80°C и диэлектрическую проницаемость 10-40, предпочтительно 20-30;

причем этот дополнительный растворитель, присутствует в составе в массовом отношении г/в), в интервале 1/15-1/2. Растворитель является летучим, чтобы служить, в частности, промотором сушки, и смешивается с водой и/или растворителем в).

Предпочтительно, действующее инсектицидное начало является соединением формулы (II)



в которой R₁ обозначает атом галогена, CN или метил;

R₂ обозначает S(O)_nR₃ или 4,5-дицианоимдазол 2-ил или галогеналкил;

R₃ обозначает алкил или галогеналкил;

R₄ обозначает атом водорода или галогена; или радикал NR₅R₆, C(O)_mR₇,

C(O)R₇, или C(O)OR₇, алкил, галогеналкил, или OR₈, или радикал -N=C(R₉) (R₁₀);

R₅ и R₆ независимо друг от друга обозначают атом водорода или радикал алкил, галогеналкил, C(O)алкил, S(O)_rCF₃, или алкоксикарбонил; или R₅ и R₆ вместе могут образовывать двухвалентный алкиленовый радикал, который может быть прерван одним или двумя двухвалентными гетероатомами, такими как кислород или сера;

R₇ обозначает алкильный радикал или галогеналкильный радикал;

R₈ обозначает алкильный радикал, галогеналкильный радикал или атом водорода;

R₉ обозначает алкильный радикал или атом водорода;

R₁₀ обозначает фенил или гетероарил, возможно, замещенный одним или несколькими атомами галогена или такими группами, как OH, -O-алкил, -S-алкил, циано, или алкил;

R₁₁ и R₁₂ обозначают, независимо один от другого, атом водорода или галогена и, возможно, CN или NO₂, но H или галоген предпочтительнее;

R₁₃ обозначает атом галогена или галогеналкильную группу, галогеналкоксильную группу, S(O)_qCF₃ или SF₅;

m, n, q, r обозначают, независимо один от другого, целое число, равное 0, 1 или 2;

X обозначает трехвалентный атом азота или радикал C-R₁₂, три другие валентности атома углерода составляют часть ароматического цикла;

при условии, что когда R₁ обозначает метил, тогда или R₃ обозначает галогеналкил, R₄ обозначает NH₂, R₁₁ обозначает C1, R₁₃ обозначает CF₃ и X обозначает N; или R₂ обозначает 4,5-дицианоимдазол 2-ил, R₄ обозначает C1, R₁₁ обозначает C1, R₁₃ обозначает CF₃ и X обозначает =C-C1.

Алкильные радикалы, упоминавшиеся при определении соединений формул (I) и (II), обычно содержат от 1 до 6 атомов углерода. Цикл, образованный двухвалентным алкиленовым радикалом, представляющим собой R₅ и R₆, а также атомом азота, к которому присоединены R₅ и R₆, обычно является 5-, 6- или 7-членным циклом.

Кроме того, предпочтительно, когда R₁ обозначает CN, R₃ обозначает галогеналкил, R₄ обозначает NH₂, R₁₁ и R₁₂ независимо один от другого являются атомами галогена, R₁₃ обозначает галогеналкил.

Предпочтительно также, когда X является радикалом C-R₁₂.

Соединением а) формулы (I), особенно предпочтительным в изобретении, является 1-[2,6-Cl₂ 4-CF₂ фенил]3-CN 4-[SO-CF₃]₅-NH₂ пиразол, простым названием которого является фипронил.

Получение соединений формулы (I) может быть осуществлено согласно одному или другому способам, описанным в международных заявках на патенты 87/3781, 93/6089, 94/21606 или европейской заявке 295117, или любым другим способом в

зависимости от компетентности специалиста в области химического синтеза. Для химического получения продуктов согласно изобретению специалист рассматривается как имеющий в своем распоряжении, помимо прочего, все содержимое "Chemical Abstracts" и документы, цитированные там.

Хотя это не является предпочтительным, состав может при необходимости содержать воду, особенно из расчета 0-30 об.%, предпочтительно 0-5 об.%.
5

Состав может также содержать антиоксидант, предназначенный для замедления окисления на воздухе, который, в частности, присутствует в соотношении от 0,005 до 1% (масса/объем), предпочтительно от 0,01 до 0,05%.
10

Составы согласно изобретению, предназначенные для животных-спутников человека, особенно собак и кошек, обычно применяют, путем нанесения на кожу (по-английски "покрывают пятнами" или "льют на"); речь идет обычно о локализованном нанесении на участок поверхности площадью меньше 10 см², особенно в интервале 5-10 см², в частности в двух точках, предпочтительно расположенных между лопатками животного. После нанесения состав распространяется, в частности, по всему телу животного, затем высыхает без кристаллизации, не изменяя внешний вид (в частности, отсутствие какого-либо белесого налета или запыленного внешнего вида) и не затрагивая волосяного покрова.
15

Составы согласно изобретению особенно интересны благодаря их эффективности, скорости действия, а также приятному внешнему виду шерсти животных после их нанесения и сушки.
20

В качестве органического растворителя в), который может быть использован в изобретении, можно назвать, в частности: ацетон, ацетонитрил, бензиловый спирт, бутилдигликоль, диметилацетамид, диметилформамид, н-бутиловый эфир дипропиленгликоля, этанол, изопропанол, метанол, моноэтиловый эфир, этиленгликоля, монометиловый эфир этиленгликоля, монометилацетамид, монометиловый эфир дипропиленгликоля, жидкие полиоксиэтиленгликоли, пропиленгликоль, 2-пирролидон, особенно N-метилпирролидон, моноэтиловый эфир диэтиленгликоля, этиленгликоля, диэтилфталат или смесь по меньшей мере двух из них.
25

Предпочтительными растворителями в) являются простые гликолевые эфиры, особенно простой моноэтиловый эфир диэтиленгликоля и простой монометиловый эфир дипропиленгликоля.
30

В качестве ингибитора кристаллизации б), который может быть использован в изобретении, можно назвать, в частности:
35

-поливинилпирролидон, поливиниловые спирты, сополимеры винилацетата и винилпирролидона, полиэтиленгликоли, бензиловый спирт, маннит, глицерин, сорбит, полиоксиэтиленированные сложные эфиры сорбитана; лецитин, Na-карбоксиметилцеллюлозу; акриловые производные, такие как метакрилаты, и другие,
40

-анионные поверхностно-активные соединения, такие как стеараты щелочных металлов, особенно натрия, калия или
45

аммония; стеарат кальция, стеарат триэтаноламина; абиетат натрия; алкилсульфаты, особенно лаурилсульфат натрия и цетилсульфат натрия; додецилбензолсульфонат натрия, диоктилсульфосукцинат натрия; жирные кислоты, особенно те, которые получают на основе кокосового масла,
50

-катионные поверхностно-активные соединения, такие как водорастворимые соли четвертичного аммония формулы N⁺R'R''R'''R''''', Y, в которой радикалы R обозначают углеводородные радикалы, возможно гидроксильированные, и Y обозначает анион сильной кислоты, такой как галогенид, сульфат и сульфонат; цетилтриметиламмонийбромид входит в используемые катионные
55

поверхностно-активные соединения,
- соли амина формулы N⁺R'R''R''', в которой радикалы R являются углеводородными радикалами, возможно, гидроксильированными; хлоргидрат октадециламина входит в используемые катионные поверхностно-активные
60

соединения,
- неионные поверхностно-активные соединения, такие как сложные эфиры сорбитана, возможно полиоксиэтиленированные, в частности Полисорбат 80, полиоксиэтиленированные простые алкиловые эфиры; стеарат полиэтиленгликоля,
65

полиоксиэтиленированные производные касторового масла, сложные полиглицериновые эфиры, полиоксиэтиленированные жирные спирты, полиоксиэтиленированные жирные кислоты, сополимеры этиленоксида и пропиленоксида,
70

- амфотерные поверхностно-активные вещества, такие как лаурилзамещенные производные бетаина или, предпочтительно смесь по меньшей мере двух из них. Особенно предпочтительно, используют два ингибитора кристаллизации, а именно комбинацию пленкообразующего агента полимерного типа и поверхностно-активного агента. Эти агенты выбирают, особенно среди соединений, называвшихся в качестве ингибитора кристаллизации б).
75

Среди особенно интересных пленкообразующих агентов полимерного типа можно назвать:
80

- поливинилпирролидоны с различной степенью полимеризации;
- поливиниловые спирты, и
- сополимеры винилацетата и винилпирролидона.
85

В том, что касается поверхностно-активных агентов, называют, в особенности, неионные поверхностно-активные вещества, предпочтительно сложные полиоксиэтиленированные эфиры сорбитана и, особенно, различные сорта Полисорбата, например Полисорбат 80.
90

Пленкообразующий агент и поверхностно-активный агент могут быть введены, особенно, в близких или одинаковых количествах в пределах общих количеств ингибитора кристаллизации, упоминавшихся в другом месте.
95

Составленная таким образом пара обеспечивает отсутствие кристаллизации на шерсти и поддержания косметического
100

внешнего вида волосяного покрова, то есть без тенденции к склеиванию или запыленному внешнему виду, несмотря на высокую концентрацию действующего начала.

В качестве дополнительного растворителя г) можно назвать, в частности, абсолютированный этанол, изопропанол (пропанол-2), метанол.

В качестве антиоксиданта используют, особенно, классические агенты, такие как бутилгидроксианизол, бутилгидрокситолуол, аскорбиновую кислоту, метабисульфит натрия, пропилгаллат, тиосульфат натрия, смесь по меньшей мере двух из них.

Составы согласно изобретению получают, обычно, простым смешиванием компонентов, таких, которые были точно описаны перед этим; предпочтительно начинают со смешивания действующего начала с основным растворителем и затем добавляют другие компоненты или добавки.

Предметом настоящего изобретения является также способ лечения и/или защиты (предотвращения заражения) животных от паразитов, согласно которому эффективный объем состава согласно изобретению наносят на ограниченный участок тела животного, как это описано выше. Благоприятно, нанесение осуществляют в двух точках и/или на спину между лопатками животного.

Цель способа может быть нетерапевтической, касаясь очистки шерсти и кожи животных путем удаления присутствующих паразитов, а также их остатков и испражнений. Животное имеет, таким образом, волосяной покров, приятный на глаз и на ощупь. Это позволяет также избежать появления блох в доме.

Цель может также быть терапевтической, когда речь идет о лечении паразитоза, имеющего патогенные последствия.

Наносимый объем может быть порядка 0,3-1 мл, предпочтительно порядка 0,5 мл для кошки и порядка 0,33-3 мл для собаки, в зависимости от массы животного.

Наносимый объем состава, предпочтительно, соответствует дозе соединения формулы (I) в интервале 0,3-60 мг/кг, особенно между 5 и 15 мг/кг.

Следующие примеры, приводимые в качестве не ограничивающих объема охраны патента, иллюстрируют изобретение и показывают, как оно может быть использовано.

Примеры 1-12

Составы примеров 1-12 даны в таблице.

В качестве примера, для рецепта примера 1 достаточное количество простого моноэтилового эфира диэтиленгликоля составляет приблизительно 75 см³.

Перемешивая, смешивают:

- 10 г действующего начала 1-[4-CF₃ 2,6-Cl₂ фенил]3-циано 4-[CF₃-SO]5-NH₂ пиразола,

- все количество этанола,

- 60 см³ простого моноэтилового эфира диэтиленгликоля или простого монометилового эфира дипропиленгликоля (растворители),

- все количество поливинилпирролидона (Kollidon^R 17PF фирмы БАСФ, Германия),

- все количество Полисорбата 80 (Tween^R 80 фирмы ИСИ),

- все количество бутилгидроксианизола

(если присутствует),

- все количество бутилгидрокситолуола (если присутствует).

Добавляют до 100 см³ простой моноэтиловый эфир диэтиленгликоля или простой монометиловый эфир дипропиленгликоля (для примера 1 это соответствует остаточному объему около 15 см³).

Каждая смесь представляет собой концентрированный раствор S.

Трех собак, массой 7, 14 и 28 кг соответственно, заражают 100 блохами каждую. Через два дня их обрабатывают, путем локального нанесения на участок кожи площадью около 5 см², расположенный между лопатками на уровне загривка, раствора S из расчета 0,1 мл/кг. По прошествии 24 часов, времени, необходимого для полного высыхания, внешний вид волосяного покрова собак в области нанесения состава на кожу и в других местах идентичен первоначальному внешнему виду. Особенно при ручном контакте волосяной покров животного не ощущается ни клейким, ни запыленным, и он не содержит стоящих торчком прядей.

Через 24 часа после обработки собак расчесывают, чтобы извлечь и, в случае необходимости, сосчитать присутствующих блох. Затем с еженедельными интервалами после обработки животных вновь заражают таким же образом, что и перед этим. Через 24 часа после каждого повторного экспериментального заражения вновь осуществляют расчесывание для извлечения и подсчета блох, возможно еще присутствующих. В течение тринадцатинедельного периода наблюдения констатируют, что процент уменьшения популяции блох удерживается выше 95% по отношению к контрольной группе, не получившей обработку согласно изобретению.

Примеры 12-24:

Для примеров 12-24 достаточно заменить в таблице примеры 1-12 на 12-24 соответственно с 12,5 г действующего начала.

Количества других компонентов не изменяются, не считая количества растворителя, необходимого для дополнения до 100 см³.

При простом перемешивании осуществляют смешивание следующих компонентов:

- 12,5 г соединения примера 1,

- все количество этанола,

- 60 см³ простого моноэтилового эфира диэтиленгликоля или простого монометилового эфира дипропиленгликоля,

- все количество поливинилпирролидона,

- все количество Полисорбата 80,

- все количество бутилгидроксианизола (если присутствует),

- все количество бутилгидрокситолуола (если присутствует).

Добавляют до 100 см³ простой моноэтиловый эфир диэтиленгликоля или простой монометиловый эфир дипропиленгликоля.

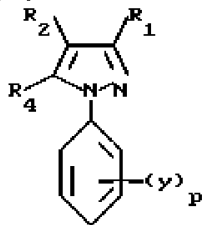
При использовании в условиях, описанных в примере 1, эти смеси приводят к сравнимым результатам. По сравнению с контрольной группой констатируют уменьшение популяции

блоч, больше чем на 95%, за время, меньше 24 часов.

Формула изобретения:

1. Состав, используемый для лечения и защиты домашних животных, зараженных, или которые могут быть заражены, паразитами, отличающийся тем, что он содержит в форме раствора, готового к применению:

а) действующее инсектицидное начало формулы I



где R₁ обозначает атом галогена, CN или метил;

R₂ обозначает S(O)_nR₃ или 4,5-дицианоимидазол 2-ил или галогеналкил;

R₃ обозначает алкил или галогеналкил;

R₄ обозначает атом водорода или галогена; или радикал NR₅R₆, S(O)_mR₇, C(O)R₇, или C(O)OR₇, алкил, галогеналкил, или OR₈ или радикал - N= C(R₉)(R₁₀);

R₅ и R₆ независимо друг от друга обозначают атом водорода или радикал алкил, галогеналкил, C(O)алкил, S(O)_rCF₃, ацил или алкоксикарбонил; или R₅ и R₆ вместе могут образовывать двухвалентный алкиленовый радикал, который может быть прерван одним или двумя двухвалентными гетероатомами, такими как кислород или сера;

R₇ обозначает алкильный радикал или галогеналкильный радикал;

R₈ обозначает алкильный радикал, галогеналкильный радикал или атом водорода;

R₉ обозначает алкильный радикал или атом водорода;

R₁₀ обозначает фенил или гетероарил, возможно замещенный одним или несколькими атомами галогена или такими группами, как OH, -O-алкил, -S-алкил, циано или алкил;

Y обозначает атом галогена, галогеналкильный радикал или галогеналкоксильный радикал, например, низший галогеналкоксильный радикал, SF₅, с возможностью того, что Y может быть CN или NO₂ в положениях 2 и 6; что углерод в положении 2 может быть замещен на N; что Y может быть S(O)_qCF₃ в положении 4, но предпочтительно галогеналкил, галогеналкоксигруппу или SF₅;

m, n, q, r обозначают, независимо один от другого, целое число, равное 0, 1 или 2;

p является целым числом, равным 1, 2, 3, 4 или 5, предпочтительно равным 1, 2 или 3, особенно 3;

при условии, что когда R₁ обозначает метил, тогда или R₃ обозначает галогеналкил, R₄ обозначает NH₂, p = 2, Y в положении 6 обозначает C1, Y в положении 4 обозначает CF₃, и углерод в положении 2 фенила замещен на N; или R₂ обозначает

4,5-дицианоимидазол 2-ил, R₄ обозначает C1, p = 3, Y в положении 6 обозначает C1, Y в положении 4 обозначает CF₃, и углерод в положении 2 фенила замещен на =C - C1;

б) ингибитор кристаллизации, который отвечает тесту, согласно которому: 0,3 мл раствора а), содержащего 10 об.% соединения формулы I в растворителе, определенном в п. с), следующем ниже, а также 10% этого ингибитора, наносят на

стеклянную пластинку при 20 °C на 24 ч, после чего невооруженным глазом на стеклянной пластинке наблюдают меньше 10 кристаллов, предпочтительно отсутствие кристаллов; в) органический растворитель, имеющий диэлектрическую проницаемость в

интервале 10 - 35, предпочтительно 20 - 30, г) дополнительный органический растворитель, имеющий температуру кипения меньше 100 °C, предпочтительно меньше 80 °C, и диэлектрическую проницаемость 10 - 40, предпочтительно 20 - 30.

2. Состав по п.1, отличающийся тем, что соединение формулы I присутствует в составе в количестве 1 - 20% (мас./об.), предпочтительно 5 - 15%.

3. Состав по п.1 или 2, отличающийся тем, что ингибитор кристаллизации присутствует в составе в количестве 1 - 20% (мас./об.), предпочтительно 5 - 15%.

4. Состав по любому из пп.1 - 3, отличающийся тем, что органический растворитель присутствует в количестве, дополняющем состав до 100%.

5. Состав по любому из пп.1 - 4, отличающийся тем, что дополнительный органический растворитель присутствует в составе в таком количестве, что массовое отношение дополнительный растворитель г) растворитель в) находится в интервале 1/15 и 1/2.

6. Состав по любому из пп.1 - 5, отличающийся тем, что вода присутствует в составе в количестве 0 - 30 об.%, предпочтительно 0 - 5 об. %.

7. Состав по любому из пп.1 - 6, отличающийся тем, что содержит антиоксидант.

8. Состав по п.7, отличающийся тем, что в нем присутствует антиоксидант в количестве 0,005 - 1% (мас./об.), предпочтительно 0,01 - 0,05%.

9. Состав по любому из пп.1 - 8, отличающийся тем, что растворитель в) выбирают в группе, состоящей из ацетона, ацетонитрила, бензилового спирта, бутилдигликоля, диметилацетамида, диметилформамида, н-бутилового эфира дипропиленгликоля, этанола, изопропанола, метанола, моноэтилового эфира этиленгликоля, монометилового эфира этиленгликоля, монометилацетамида, монометилового эфира дипропиленгликоля, жидких полиоксипропиленгликолей, пропиленгликоля, 2-пирролидона, особенно N-метилпирролидона, моноэтилового эфира диэтиленгликоля, этиленгликоля, диэтилфталата и смеси, по меньшей мере, двух из них.

10. Состав по любому из пп.1 - 9, отличающийся тем, что ингибитор кристаллизации выбирают в группе, состоящей из: поливинилпирролидона, поливиниловых спиртов, сополимеров винилацетата и винилпирролидона,

-7-

полиэтиленгликолей, бензилового спирта, маннита, глицерина, сорбита, полиоксиэтиленированных сложных эфиров сорбитана, лецитина, Na-карбоксиметилцеллюлозы, акриловых производных, таких как метакрилаты и другие; анионных поверхностно-активных соединений, таких как стеараты щелочных металлов, особенно натрия, калия или аммония, стеарат кальция, стеарат триэтаноламина; абиетат натрия, алкилсульфаты, особенно лаурилсульфат натрия и цетилсульфат натрия, додецилбензолсульфонат натрия, диоктилсульфосукцинат натрия, жирные кислоты, особенно те, которые получают на основе кокосового масла; катионных поверхностно-активных соединений, таких как водорастворимые соли четвертичного аммония формулы $N^+R_1R_2R_3R_4$, в которой радикалы R обозначают углеводородные радикалы, возможно гидроксильные, и Y^- обозначает анион сильной кислоты, такой как галогенид, сульфат и сульфонат, цетилтриметиламмонийбромид; солей амина формулы $N^+R_1R_2R_3$, в которой радикалы R являются углеводородными радикалами, возможно гидроксильными, хлоргидрата октадециламина; неионных поверхностно-активных соединений, таких как сложные эфиры сорбитана, возможно полиоксиэтиленированные, в особенности Полисорбат 80, полиоксиэтиленированные простые алкиловые эфиры, стеарат полиэтиленгликоля, полиоксиэтиленированные производные касторового масла, сложные полиглицериновые эфиры, полиоксиэтиленированные жирные спирты, полиоксиэтиленированные жирные кислоты, сополимеры этиленоксида и пропиленоксида; амфотерных поверхностно-активных веществ, таких как лаурилзамещенные производные бетаина, и, предпочтительно смесей, по меньшей мере, двух из них.

11. Состав по любому из пп.1 - 10, отличающийся тем, что в качестве ингибитора кристаллизации он содержит спаренный ингибитор кристаллизации, включающий пленкообразующий полимерный агент и поверхностно-активный агент.

12. Состав по п.11, отличающийся тем, что пленкообразующий полимерный агент выбирают в группе, состоящей из поливинилпирролидонов с различной степенью полимеризации, поливиниловых спиртов и сополимеров винилацетата и винилпирролидона.

13. Состав по п.11 или 12, отличающийся тем, что поверхностно-активное соединение является неионным поверхностно-активным соединением.

14. Состав по п.13, отличающийся тем, что поверхностно-активное соединение является полиоксиэтиленированным сложным эфиром сорбитана, таким как Полисорбат.

15. Состав по п.14, отличающийся тем, что ингибитор кристаллизации является смесью поливинилпирролидона и Полисорбата, предпочтительно Полисорбата 80.

16. Состав по любому из пп.1 - 15, отличающийся тем, что растворитель в) является простым эфиром гликоля.

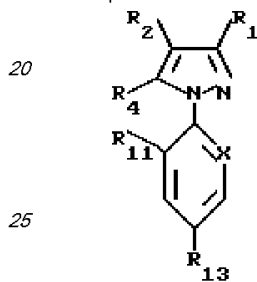
17. Состав по п. 16, отличающийся тем,

что растворитель в) выбирают в группе, состоящей из моноэтилового эфира диэтиленгликоля и монометилового эфира дипропиленгликоля.

18. Состав по любому из пп.1 - 17, отличающийся тем, что дополнительный растворитель г) выбирают в группе, состоящей из абсолютированного этанола, изопропанола и метанола.

19. Состав по любому из пп.1 - 18, отличающийся тем, что он содержит антиоксидант, выбираемый в группе, состоящей из бутилгидроксианизола, бутилгидрокситолуола, аскорбиновой кислоты, метабисульфита натрия, пропилгаллата, тиосульфата натрия и смеси, самое большее, двух из них.

20. Состав по любому из пп.1 - 19, отличающийся тем, что инсектицидное вещество отвечает формуле II



где R₁ обозначает атом галогена, CN или метил;

R₂ обозначает S(O)_nR₃ или 4,5-дицианоимидазол 2-ил или галогеналкил; R₃ обозначает алкил или галогеналкил;

R₄ обозначает атом водорода или галогена; или радикал NR₅R₆, S(O)_mR₇, C(O)R₇, или C(O)OR₇, алкил, галогеналкил, или OR₈ или радикал - N= C(R₉)(R₁₀);

R₅ и R₆ независимо друг от друга обозначают атом водорода или радикал алкил, галогеналкил, C(O)алкил, S(O)_rCF₃, ацил или алкоксикарбонил; или R₅ и R₆ вместе могут образовывать двухвалентный алкиленовый радикал, который может быть прерван одним или двумя двухвалентными гетероатомами, такими как кислород или сера;

R₇ обозначает алкильный радикал или галогеналкильный радикал;

R₈ обозначает алкильный радикал, галогеналкильный радикал или атом водорода;

R₉ обозначает алкильный радикал или атом водорода;

R₁₀ обозначает фенил или гетероарил, возможно замещенный одним или несколькими атомами галогена или такими группами, как OH, -O-алкил, -S-алкил, циано или алкил;

R₁₁ и R₁₂ обозначают, независимо один от другого, атом водорода или галогена и, возможно CN или NO₂, но H или галоген предпочтительнее;

R₁₃ обозначает атом галогена или галогеналкильную группу, галогеналкоксильную группу, S(O)_q CF или SF₅;

m, n, q, r обозначают, независимо один от другого, целое число, равное 0, 1 или 2;

X обозначает трехвалентный атом азота

или радикал С - R₁₂, три другие валентности атома углерода составляют часть ароматического цикла,

при условии, что когда R₁ обозначает метил, тогда R₃ обозначает галогеналкил, R₄ обозначает NH₂, R₁₁ обозначает Cl, R₁₃ обозначает CF₃ и X обозначает N; или R₂ обозначает 4,5-дицианоимидазол 2-ил, R₄ обозначает Cl, R₁₁ обозначает Cl,

R₁₃ обозначает CF₃ и X обозначает = С - Cl.

21. Состав по любому из пп.1 - 20, отличающийся тем, что соединение формулы I или II представляет собой 1-[4-CF₃ 2,6 - Cl₂ фенил]3-циано 4-[CF₃ - SO]5 - NH₂ пиразол.

Приоритет по пунктам:
29.09.95 по пп.1 - 10, 13 - 20, 21;
11.09.96 по пп.1 - 20.

5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

55

60

-9-

RU 2 1 6 0 5 3 5 C 2

RU ? 1 6 0 5 3 5 C 2

Пример №	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12
Действующее начало (г)	10	10	10	10	10	10	10	10	10	10	10	10
Этанол см ³ (г)	10	7,5	15	10	10	10	10	7,5	15	10	10	10
Поливинилпирролидон (г)	5	5	5	5	5	7,5	5	5	5	5	5	7,5
Полисорбат 80 (г)	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
Бутилгидроксанизол (г)	0,02	0,02	0,02	0	0,02	0	0,02	0,02	0,02	0	0,02	0
Бутилгидрокситолуол (г)	0,01	0,01	0,01	0,01	0,01	0	0,01	0,01	0,01	0,01	0,01	0
Простой моноэтиловый эфир диэтиленгликоля (см ³)	Достаточное количество до 100 см ³	0										
Простой монометиловый эфир дипропиленгликоля (см ³)	Достаточное количество до 100 см ³	0										

Продолжение таблицы

Пример №	1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12
Действующее начало (г)	10	10	10	10	10	10	10	10	10	10	10	10
Этанол см ³ (г)	10	7,5	15	10	10	10	10	7,5	15	10	10	10
Поливинилпирролидон (г)	5	5	5	5	5	7,5	5	5	5	5	5	7,5
Полисорбат 80 (г)	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5	5
Бутилгидроксизонизол (г)	0,02	0,02	0,02	0	0,02	0	0,02	0,02	0,02	0	0,02	0
Бутилгидрокситолуол (г)	0,01	0,01	0,01	0,01	0,01	0	0,01	0,01	0,01	0,01	0,01	0
Простой моноэтиловый эфир диэтиленгликоля (см ³)	Достаточное количество до 100 см ³	Достаточное количество до 100 см ³	0	100 см ³	0	0	0	0	0	0	0	0
Простой монометиловый эфир дипропиленгликоля (см ³)	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0
									Достаточное количество до	100 см ³		