

(19)



SUOMI - FINLAND

(FI)

PATENTTI- JA REKISTERIHALLITUS
PATENT- OCH REGISTERSTYRELSEN
FINNISH PATENT AND REGISTRATION OFFICE

(10) **FI 903036 A7**

(12) **JULKISEKSI TULLUT PATENTTIHAKEMUS
PATENTANSÖKAN SOM BLIVIT OFFENTLIG
PATENT APPLICATION MADE AVAILABLE TO THE
PUBLIC**

(21) Patentihakemus - Patentansökan - Patent application 903036

(51) Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassifikation -
International patent classification
C07D231/28
A01N 43/56

(22) Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date 15.06.1990

(23) Saapumispäivä - Ankomstdag - Reception date 15.06.1990

(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig - Available to the public 17.12.1990

(43) Julkaisupäivä - Publiceringsdag - Publication date 13.06.2019

(32) (33) (31) Etuokeus - Prioritet - Priority

16.06.1989 GB 8913866

(71) Hakija - Sökande - Applicant

1 •Rhône- Poulenc Agriculture Limited, Fyfield Road, Ongar, Essex CM5 OHW, ISO-BRITANNIA, (GB)

(72) Keksijä - Uppfinnare - Inventor

1 •Roberts, David Alan, United Kingdom, ISO-BRITANNIA, (GB)

2 •Hawkins, David William, United Kingdom, ISO-BRITANNIA, (GB)

3 •Buntain, Ian George, United Kingdom, ISO-BRITANNIA, (GB)

4 •McGuire, Ross, United Kingdom, ISO-BRITANNIA, (GB)

(74) Asiamies - Ombud - Agent

Berggren Oy Ab, Antinkatu 3 C, 00100 Helsinki

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention

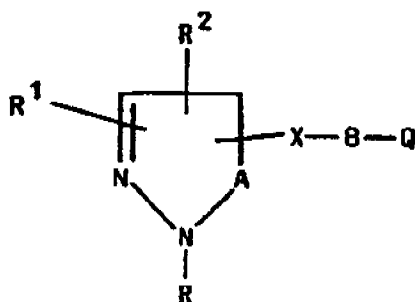
N-fenyylipyratsolijohdannaisia

N-fenylpyrazolderivat

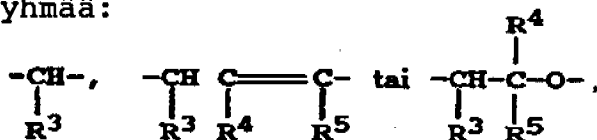
N-Fenyylipyratsolijohdannaiset

Tämä keksintö liittyy N-fenyylipyratsolijohdannaisiin, niitä sisältäviin koostumuksiin ja N-fenyylipyratsolijohdannaisten käyttöön niveljalkaisiin, kasvien sukkulamatoihin, loismatoihin ja alkueläimiin kuuluvien tuhoeläinten torjunnassa.

Japanilainen patenttijulkaisu 213280, julkaistu 3.3.1989, kuvaa pyratsolijohdannaisia, jotka ovat kaavan:



mukaisia, jossa A edustaa ryhmiä -CO- tai $\text{-}\overset{\text{I}}{\text{C}}\text{-}$, edellyttäen, että pyratsolirenkaan 4- ja 5-asemien välille muodostuu kaksoissidos, X edustaa O:ta tai S:ää, Q edustaa fenyyli ryhmää, joka on vaihtoehtoisesti substituoitu, tai heterosyklistä ryhmää, joka on vaihtoehtoisesti substituoitu, B edustaa ryhmää:



jossa R^3 , R^4 , ja R^5 edustavat vetyä tai 1-4-hiiliatomista alkyyliryhmää, R^1 ja R^2 edustavat vetyä, halogeenia, (mutta molemmat eivät voi samanaikaisesti olla halogeeneja), syaani-, nitro-, OH- tai $\text{-C=N(R}^6\text{)-OR}^7\text{-}$ ryhmää, 1-4-hiiliatomista alkyyliryh-

mää, joka on vaihtoehtoisesti substituoitu, 1—4—hiiliato-
 mista tioalkyyliiryhmää, joka on vaihtoehtoisesti substi-
 tuoitu, tiofenyyliiryhmää, joka on vaihtoehtoisesti substi-
 tuoitu, fenyyliiryhmää, joka on vaihtoehtoisesti substi-
 5 tuoitu, heterosyklistä ryhmää, joka on vaihtoehtoisesti
 substituoitu, tai -COOR^8 -ryhmää,
 R^6 ja R^7 edustavat vetyä tai 1—4—hiilistä alkyyliryhmää,
 joka on vaihtoehtoisesti substituoitu,
 R^8 edustaa 2—8—hiilistä alkenyyliiryhmää, 2—8—hiilistä al-
 10 kynyyliiryhmää tai 1—4—hiilistä alkyyliryhmää, joka on
 vaihtoehtoisesti substituoitu,
 R edustaa 1—16—hiilistä alkyyliryhmää, joka on vaihtoeh-
 toisesti substituoitu, 2—16—hiilistä alkenyyliiryhmää, joka
 on vaihtoehtoisesti substituoitu, 2—16—hiilistä alkynyy-
 15 liiryhmää, joka on vaihtoehtoisesti substituoitu, 3—8—hiilistä
 sykloalkyyliiryhmää, joka on vaihtoehtoisesti substi-
 tuoitu, 5—8—hiilistä oksasykloalkyyliiryhmää, 5—8—hiilistä
 tiosykloalkyyliiryhmää, joka on vaihtoehtoisesti substi-
 tuoitu, fenyyliiryhmää, joka on vaihtoehtoisesti substi-
 20 tuoitu, tai heterosyklistä ryhmää, joka on vaihtoehtoisesti
 substituoitu. Pyratsolijohdannaisten todetaan olevan
 käyttökelpoisia hyönteismyrkkyinä ja akaricideinä. Rapor-
 toitiin, että käytettäessä kaavan (I) mukaisia yhdisteitä
 hyönteismyrkkinä, niillä oli 100-%:inen tehokkuus
 25 Epilachna vigintioctomaculatan toukkia ja 100-%:inen tehok-
 kuus Tetranychus kanzawan toukkia vastaan.

Havaittiin, että ryhmällä yhdisteitä, joista osa kuuluu
 edellä kuvatun yleisen kaavan piiriin, on odottamattoman
 30 edullisia ominaisuuksia. Näillä uusilla yhdisteillä on
 aktiivisuutta niveljalkaisiin, kasvien sukkulamatoihin,
 loismatoihin ja alkueläimiin kuuluvia tuhoeläimiä vastaan.
 Jäljempänä kuvattavissa aktiivisuustesteissä testatut tä-
 män keksinnön mukaiset yhdisteet aiheuttivat 100-%:isen ja
 35 88-%:isen elinkyvyttömyyden, tässä järjestyksessä, 20 mil-

joonasosan annoksena *Spodoptera littoralis* toukkia vastaan ja 100-%:isen elinkyvyttömyyden 0,5 tai 1 miljoonasosan annoksena *Diabrotica undecimpunctata* toukkia vastaan. Näitä uusia yhdisteitä kuvaa kaava (I) eikä yhtäkään yleisen kaavan (I) piiriin kuuluvaa yhdistettä ole kuvattu julkaistussa japanilaisessa patenttijulkaisussa.

Tämä keksintö tarjoaa käyttöön yleisen kaavan (I) mukaiset N-fenyyli-pyratsolijohdannaiset, jossa:

10 R^1 edustaa korkeintaan neljä hiiliatomia käsittävää suoraa tai haaroittunutta alkyyliryhmää, joka voi olla substituimaton tai substituoitu yhdellä tai useammalla halogeeniatomilla,
 R^2 edustaa aryyli- (esim. fenyyli-) tai aralkyyli- (esim. bentsyyli-) ryhmää, joka on vaihtoehtoisesti substituoitu,
 15 R^3 edustaa fenyyli-ryhmää, joka on substituoitu 2-asemassa halogeeniatomilla, joka on substituoitu 4-asemassa 1-4-hiiliatomia sisältävällä suora- tai haaraketjuisella alkyyli- tai alkoksiryhmällä, joka voi olla substituoitu
 20 yhdellä tai useammalla halogeeniatomilla, ja m ja n ovat toisistaan riippumatta 0, 1 tai 2, ja joilla on arvokasta aktiivisuutta niveljalkaisiin, kasvien sukkulamatoihin, loismatoihin ja alkueläimiin kuuluvia tuhoeläimiä vastaan, erityisemmin siten, että yleisen kaavan (I) mukaiset yhdisteet joutuvat niveljalkaisten elimistöön ravinnonoton välityksellä.

Ryhmä R^2 voi olla vaihtoehtoisesti substituoitu aromaattisesta renkaasta yhdellä tai useammalla halogeeniatomilla,
 30 alkyyli-, alkoksi-, alkyylitio-, alkyylisulfinyyli- tai alkyylisulfonyyliryhmillä, jotka kukin sisältävät korkeintaan 4 hiiliatomia ja niiden ketju on joko suora tai haaroittunut ja ne voivat vaihtoehtoisesti olla halogenoituja, tai nitro-, syaani- tai asyyli-ryhmillä. Lisäksi kun R^2

edustaa aralkyyliiryhmää, se voi olla myös substituoitu α -asemassa korkeintaan 4 hiiliatomia sisältävällä suoralla tai haaraketjuisella alkyyliryhmällä.

- 5 Tämän keksintö koostuu yleisen kaavan (I) mukaisista yhdisteistä, niiden valmistusmenetelmistä, niitä sisältäviä koostumuksista ja näiden käyttömenetelmistä.

10 On selvää, että halogeeniatomit ovat fluori, kloori, bromi tai jodi, fenyyliiryhmässä R^3 olevat halogeeniatomit voivat olla saman- tai erilaisia ja että kun ryhmät R^1 ja R^2 ovat substituoituja useammalla kuin yhdellä halogeeniatomilla, nämä atomit voivat myös olla saman- tai erilaisia.

- 15 Edulliset kaavan (I) mukaiset yhdisteet ovat niitä, joissa R^1 edustaa trihalogeenimetyyliiryhmää, ja edullisemmin trifluorimetyyliiryhmää.

20 Yleisen kaavan (I) mukaiset yhdisteet, joissa R^3 :n edustaman fenyyliiryhmän 4-asema on substituoitu trifluorimetyyliiryhmällä tai trifluorimetoksiryhmällä, ovat edullisia.

25 Edullisia yleisen kaavan (I) mukaisia yhdisteitä ovat ne, joissa R^3 :ssa esiintyy substituoiva ryhmä, joka on: 2,6-dikloori-4-trifluorimetoksi-, 2-kloori-4-trifluorimetyyli-, 2-bromi-6-kloori-4-trifluorimetyyli-, 2,6-dibromi-4-trifluorimetyyli- tai 2-bromi-4-trifluorimetyyli-ryhmä.

30 Erityisen edullisia ovat yleisen kaavan (I) mukaiset yhdisteet, joissa fenyyliiryhmä (R^3) on substituoitu 2,6-dikloori-4-trifluorimetyyli- tai 2,6-dikloori-4-trifluorimetoksiryhmällä.

35 Erityistä mielenkiintoa on yleisen kaavan (I) mukaisilla

yhdisteillä, jotka ovat:

1. 3-syaani-1-(2,6-dikloori-4-trifluorimetyyylifenyyli)-5-fenyyilitio-4-trifluorimetyyliopyratsoli
2. 5-bentsyyilitio-3-syaani-1-(2,6-dikloori-4-trifluorimetyyylifenyyli)-4-trifluorimetyylisulfonylipyratsoli.

Näitä yhdisteitä merkitään numeroilla 1 ja 2, joilla ne jäljempänä tunnistetaan ja joita käytetään niihin viitattaessa.

10

Yhtenä tähän keksintöön kuuluvana osana tarjotaan käyttöön niveljalkaisiin, kasvien sukkulamatoihin, loismatoihin ja alkueläimiin kuuluvien, kohteessaan esiintyvien tuhoeläinten torjuntamenetelmä, joka käsittää kohteen käsittelyn (esim. käytön tai annostelun) tehokkaalla määrällä yleisen kaavan (I) mukaista yhdistettä, jossa eri merkinnät ovat edellä annettujen määritysten mukaiset. Yleisen kaavan (I) mukaisia yhdisteitä voidaan käyttää erityisesti eläinlääketieteessä ja karjanhoidossa ja kansanterveyden ylläpitämisessä niveljalkaisiin, loismatoihin ja alkueläimiin kuuluvia tuhoeläimiä vastaan, jotka ovat sisä- tai ulkoloisia selkärankaisissa, erityisesti tasalämpöisissä selkärankaisissa, esimerkiksi ihmisissä ja kotieläimissä, esim. nautakarjassa, lampaissa, vuohissa, hevosissa, sioissa, siipikarjassa, koirissa, kissoissa ja kaloissa, esimerkiksi Acarina, mukaan luettuna punkit (esim. Ixodes-lajit, Boophilus-lajit, esim. Boophilus microplus, Amblyomma-lajit, Hyalomma-lajit, Rhipicephalus-lajit, esim. Rhipicephalus appendiculatus, Haemaphysalis-lajit, Dermacentor-lajit, Ornithodoros-lajit (esim. Ornithodoros moubata) ja punkit (esim. Damalinia-lajit, Dermahyssus gallinae, Sarcoptes-lajit, esim. Sarcoptes scabiei, Psoroptes-lajit, Chorioptes-lajit, Demodex-lajit, Eutrombicula-lajit), Diptera (esim. Aedes-lajit, Anopheles-lajit, Musca-lajit, Hypoderma-lajit,

Gasterophilus-lajit, Simulium-lajit), Hemiptera (esim. Triatoma-lajit), Phthiraptera (esim. Damalinia-lajit, Linognathus-lajit), Siphonaptera (esim. Ctenocephalides-lajit), Dictyoptera (esim. Periplaneta-lajit, Blatella-lajit), Hymenoptera (esim. Monomorium pharaonis), niitä voidaan käyttää esimerkiksi ruoansulatuskanavan infektiota vastaan, joita aiheuttavat loisivat sukkulamadot, esimerkiksi Trichostrongylidae-lahkon jäsenet, Nippostrongylus brasiliensis, Trichinella spiralis, Hemonchus contortus, Trichostrongylus colubriformis, Nematodirus battus, Ostertagia circumcincta, Trichostrongylus axei, Cooperia-lajit ja Hymenolepis nana, torjuttaessa ja hoidettaessa sairauksia, joita aiheuttavat alkueläimet, kuten esimerkiksi Eimeria-lajit, esim. Eimeria tenella, Eimeria acervulina, Eimeria brunetti, Eimeria maxima ja Eimeria necatrix, Trypanosoma cruzi, Leishmania-lajit, Plasmodium-lajit, Babesia-lajit, Trichomonadidae-lajit, Histomonas-lajit, Giardia-lajit, Toxoplasma-lajit, Entamoeba histolytica ja Theileria-lajit; niitä voidaan käyttää suojaamaan varastoituja tuotteita, kuten viljaa, mukaan lukien jyvät ja jauhot, maapähkinöitä, eläinten rehuja, puutavaraa, ja kotitaloustarvikkeita, kuten mattoja ja tekstiilejä, niveljalkaisia vastaan, tarkemmin sanottuna kovakuoriaisia vastaan, mukaan lukien kärsäkkäät, koit ja punkit, esimerkiksi Ephestia-lajit (jauhokoit), Anthrenus-lajit (mattokuoriaiset), Tribolium-lajit (jauhokuoriaiset), Sitophilus-lajit (viljakärsäkkäät) ja Acarus-lajit (punkit), torakoiden, muurahaisten ja termiittien torjuntaan tuhoeläinvahingoista kärsivissä kotitalous- ja teollisuustiloissa ja moskiittojen toukkien torjuntaan vesiväylissä, kaivoissa, altaissa tai muussa juoksevassa tai seisovassa vedessä; perustusten, rakenteiden ja maaperän käsittelyyn suojaamaan rakennuksia termiiteiltä, kuten Reticulitermes-lajit, Heterotermes-lajit ja Coptotermes-lajit; maanviljelyksessä Lepidoptera -ryhmään (perhoset ja koit) kuuluvien

lajien aikuisia, toukkia ja munia vastaan, esim. *Heliothis virescens* (vaellusyökkösiin kuuluva tupakatuholainen), *Heliothis armigera* ja *Heliothis zea*, *Spodoptera*-lajit, kuten *S. exempta*, *S. littoralis* (krysanteemiyökkönen) ja
5 *S. eridania* -laji, *Mamestra configurata* (tarhayökkösiin kuuluva laji), *Earias*-lajit, esim. *E. insulana*, *Pectinophora*-lajit, esim. *Pectinophora gossypiella* (puuvillakoi), *Ostrinia*-lajit, kuten *O. nubilalis* (maissikoisa), *Trichoplusia ni* (tupsumetalliyökkönen), *Pieris*-
10 lajit (kaaliperhoset), *Laphygma*-lajit (yökkösiin kuuluvia lajeja), *Agrotis*- ja *Amathes*-lajit (yökköset), *Wiseana*-lajit, *Chilo*-lajit, *Tryporyza*-lajit ja *Diatraea*-lajit (sokeriruo'on ja riisin tuholaisia), *Sparganothis pilleriana*, *Cydia pomonella* (omenakääriäinen), *Archips*-lajit (ruostekääriäisiä), *Plutella xylostella* (kaalikoi), *Coleoptera*-
15 ryhmän (kovakuoriaiset) lajien aikuisia ja toukkia vastaan, kuten *Hypothenemus hampei* (kahvin tuholainen), *Hylesinus*-lajit (kaarnakuoriaiset), *Anthonomus grandis* (puuvillakärsäkäs), *Acalymma*-lajit (kurkun tuholaisia),
20 *Lema*-lajit, *Psylliodes*-lajit, *Leptinotarsa decemlineata* (koloradokuoriainen), *Diabrotica*-lajit (maissin juuren tuholainen), *Gonocephalum*-lajit, *Agriotes*-lajit (viljasepät), *Dermolepida*- ja *Heteronychus*-lajit, *Phaedon cochleariae*, *Lissorhoptrus oryzophilus* (riisituholaisena
25 tunnettu kärsäkäs), *Melighetes*-lajit (rapsikuoriaisia), *Ceutorhynchus*-lajit, *Rhynchoporus*- ja *Cosmopolites*-lajit (juuria tuhoavat kärsäkkäät), *Hemiptera*-ryhmän lajeja vastaan, kuten *Psylla*-lajit, *Bemisia*-lajit, *Trialeurodes*-
lajit, *Aphis*-lajit, *Myzus*-lajit, *Megoura viciae*, *Phylloxera*-
30 lajit, *Adelges*-lajit, *Phorodon humuli* (kirvalaji), *Aeneolamia*-lajit, *Nephotettix*-lajit (riisituholaisena tunnettuja kaskaita), *Empoasca*-lajit, *Nilaparvata*-lajit, *Perkinsiella*-lajit, *Pyrilla*-lajit, *Aonidiella*-lajit (punaisesta kuorestaan tunnettuja tuholaisia), *Coccus*-lajit,
35 *Pseucoccus*-lajit, *Helopeltis*-lajit, *Lygus*-lajit, *Dysder-*

cus-lajit, Oxycarenus-lajit ja Nezara-lajit, Hymenoptera-ryhmän lajeja vastaan, kuten Athalia-lajit ja Cephus-lajit (korsipistiäisiä), Atta-lajit (lehdenleikkaajamuurahaiset), Diptera-ryhmän lajeja vastaan, kuten Hylemyia-lajit (juurikärpäsiä), Atherigona-lajit ja Chlorops-lajit (kahukärpäset), Phytomyza-lajit (miinaajakärpäset), Ceratitis-lajit (hedelmäkärpäset), Thysanoptera-ryhmän lajeja vastaan, kuten Thrips tabaci, Orthoptera-ryhmän lajeja vastaan, kuten Locusta- ja Schistocerca-lajit (heinäsirkkoja) ja kotisirkat, esim. Gryllus-lajit ja Acheta-lajit, Collembola-ryhmän lajeja vastaan, esim. Sminthurus-lajit ja Onychiurus-lajit (hyppyhäntäisiä), Isoptera-ryhmän lajeja vastaan, kuten Odontotermes-lajit (termiittejä), Dermaptera-ryhmän lajeja vastaan, esim. Forficula-lajit (pihtihäntäiset) sekä myös muita sellaisia niveljalkaisia vastaan, joilla merkitystä maanviljelyksessä, kuten punkit, esim. Tetranychus-lajit, Panonychus-lajit ja Bryophia-lajit (hämähäkipunkit), Eriophyes-lajit (äkämäpunkkeja), Polyphagotarsonemus-lajit, Blaniulus-lajit (tuhatjalkaiset), Scutigera-lajit (kääpiötuhatjalkaisia), Oniscus-lajit (maasiiroja) ja Triops-lajit (äyriäisiä), sellaisia sukkulamatoja vastaan, jotka tuhoavat maanviljelyksessä ja metsän- ja puutarhanhoidossa tärkeitä kasveja ja puita joko suoraan tai levittämällä bakteereista, viruksista, mykoplasmoista tai sienistä johtuvia kasvitauteja, ja joihin kuuluvat äkämäankeroiset, kuten Meloidogyne-lajit (esim. M. incognita), kysta-ankeroiset, kuten Globodera-lajit (esim. G. rostochiensis), Heterodera-lajit (esim. H. avenae), Radopholus-lajit, esim. R. similis), vauriokoh-tien sukkulamadot, kuten Pratylenchus-lajit (esim. P. pratensis), Belonolaimus-lajit (esim. B. gracilis), Tylenchulus-lajit (esim. T. semipenetrans), Rotylenchulus-lajit, (esim. R. reniformis), Rotylenchus-lajit, (esim. R. robustus), Helicothylenchus-lajit, (esim. H. multicinctus), Hemicycliophora-lajit, (esim. H. gracilis),

Criconemoides-lajit, (esim. *C. similis*), Trichodorus-lajit, (esim. *T. primitivus*), tikarin muotoiset sukkulamadot, kuten Xiphinema-lajit, (esim. *X. diversicaudatum*), Longidorus-lajit, (esim. *L. elongatus*), Hoplolaimus-lajit, (esim. *H. coronatus*), Aphelenchoides-lajit, (esim. *A. ritzema-bosi*, *A. besseyi*), (varsiankeroiset), kuten Ditylenchus-lajit, (esim. *D. dipsaci*).

Tämä keksintö tarjoaa myös käyttöön niveljalkaisiin tai sukkulamatoihin kuuluvien kasvien tuhoeläinten torjuntamenetelmän, joka käsittää sen, että kasveja tai kasvien kasvatukseen käytettävää väliainetta käsitellään tehoavalla määrällä yleisen kaavan (I) mukaista yhdistettä.

Torjuttaessa niveljalkaisia ja sukkulamatoja käytetään aktiivista yhdistettä kohteeseen, jossa esiintyvät niveljalkaiset tai sukkulamadot aiotaan torjua, määrä, joka on noin 0,1–25 kg aktiivista yhdistettä käsiteltävän kohteen hehtaaria kohti. Ihanteellisissa olosuhteissa voidaan pienemmällä määrällä saavuttaa riittävä suojaus torjuttavasta tuhoeläimestä riippuen. Huonot sääolosuhteet, tuhoeläimen vastustuskyky ja muut tekijät voivat toisaalta vaatia sen, että aktiivista ainesosaa on käytettävä korkeammassa suhteissa. Levitettäessä lehvistöön voidaan käyttää määrää, joka on 1–1000 g/ha.

Kun tuhoeläin esiintyy maaperässä, aktiivista yhdistettä sisältävä formulaatio levitetään tasaisesti käsiteltävälle alueelle millä tahansa sopivalla tavalla. Käsittely voidaan tehdä haluttaessa pellolle tai satoa tuottavalle alueelle yleensä tai tuholaisia vastaan suojattavan siemenen tai kasvin läheisyyteen. Aktiivinen komponentti voidaan huuhtoa maaperään ruiskuttamalla alueelle vettä tai tämä voidaan jättää sateen luonnollisen toiminnan varaan. Formulaatio voidaan levittää mekaanisesti käsittelyn aikana

tai sen jälkeen esimerkiksi kyntämällä tai levypyörillä. Käsittely voi olla ennen kylvämistä, kylvön aikana, kylvön jälkeen, mutta ennen itämistä tai itämisen jälkeen.

- 5 Yleisen kaavan (I) mukaisia yhdisteitä voidaan käyttää kiinteinä tai nestemäisinä koostumuksina maaperään pääasiassa siinä esiintyvien sukkulamatojen torjumiseksi, mutta myöskin lehvistöön niiden sukkulamatojen torjumiseksi, jotka käyvät kasvien ilmassa olevien osien kimppuun
10 (esim. annetussa luettelossa olleet *Aphelenchoides*-lajit ja *Ditylenchus*-lajit).

- Yleisen kaavan (I) mukaisilla yhdisteillä on arvoa torjuttaessa tuhoeläimiä, jotka käyttävät käyttöpisteestä kaukana olevia kasvin osia ravinnokseen, esim. asianomainen
15 juurille annettu yhdiste tappaa lehtiä syövät hyönteiset.

- Nämä yhdisteet voivat vähentää kasviin kohdistuvia hyök-
käyksiä ravinnonottoa vähentävillä tai karkottavilla vai-
20 kutuksilla.

- Yleisen kaavan (I) mukaisilla yhdisteillä on erityistä arvoa suojattaessa satoa pelloilla, rehupelloilla, viljelmillä, kasvihuoneissa, ja hedelmä- ja viinitarhoissa,
25 koristekasveja ja viljelmillä ja metsissä olevia puita, esimerkiksi viljakasveja (kuten maissia, vehnää, riisiä ja durraa), puuvillaa, tupakkaa, vihanneksia ja salaatteja (kuten papuja, kaalisatoja, kurpitsoja, lehtisalaattia, sipuleita, tomaatteja ja pippureita), satoja pelloilta
30 (kuten perunaa, sokerijuurikasta, maapähkinöitä, soijapapua ja rapsia), sokeriruokoa, ruohikkoa, ja rehukasveja (kuten maissia, durraa ja sinimailasta), viljelmiä (kuten tee-, kahvi-, kaakao, banaani-, öljypalmu-, kookospähkinä, kumi- ja maustekasviviljelmiä), hedelmätarhoja ja metsi-
35 köitä (kuten luumarjoja ja siemenhedelmiä, sitrushedelmiä,

5 kivi hedelmiä, avokadoa, mangoa, oliiveja ja saksanpähkinöitä tuottavia puita), viinitarhoja, koristekasveja, latsinalaisviljelmillä ja puutarhoissa ja puistoissa olevia kukkia ja pensaita, metsäpuita (sekä vuosittain varisevia että ikivihreitä) metsissä, viljelmillä ja taimikoissa.

10 Niillä on myös arvoa puutavaran (puuston, kaadetun puun, sahatavaran, käyttöpuun tai rakennuspuun) suojauksessa lehtipistiäisten (esim. Urocerus) tai kovakuoriaisten (esim. kaarnakuoriaiset, lieriökuoriaiset, tomukuoriaiset, huppukuoriaiset, sarvijäärät ja puunkaivajat) tai termiittien, esimerkiksi Reticulitermes-lajien, Heterotermes-lajien ja Coptotermes-lajien, taholta tulevia hyökkäyksiä vastaan.

15 Niillä on sovellutuksia varastoitujen tuotteiden suojauksessa, kuten viljan, hedelmien, pähkinöiden, mausteiden ja tupakan suojauksessa kokonaisena, jauhettuna tai tuotteisiin yhdistettynä, koita, kovakuoriaisia ja punkkeja vastaan. 20 Niillä suojattavia ovat varastoidut eläinperäiset tuotteet, kuten nahat, hiukset, villa ja sulat luonnollisessa tai jalostetussa muodossaan (esim. mattoina tai tekstiileinä) koita ja kovakuoriaisia vastaan, myöskin säilytettävä liha ja kala kovakuoriaisia, punkkeja ja kärpäsiä vastaan. 25

30 Yleisen kaavan (I) mukaisilla yhdisteillä on erityistä arvoa torjuttaessa niveljalkaisia, loismatoja tai alkueläimiä, jotka vahingoittavat ihmisiä ja kotieläimiä tai levittävät niihin sairauksia tai toimivat näiden välittäjinä, esimerkiksi ne, jotka on mainittu edellä, ja erityisemmin torjuttaessa punkkeja, luteita, kirppuja, surviais-sääskiä ja purevia, häiritseviä ja toukkatautia aiheuttavia kärpäsiä.

35

Yleisen kaavan (I) mukaiset yhdisteet ovat erityisen käyttökelpoisia torjuttaessa niveljalkaisia, loismatoja tai alkueläimiä, jotka esiintyvät isäntäeläiminä olevien kotieläinten ruumiissa tai jotka ottavat ravintonsa ollen eläimen ihon sisässä tai sen pinnalla tai imevät tämän verta, johon tarkoitukseen niitä voi annostella suun kautta, ruoansulatuskanavan kautta, ihon kautta tai paikallisesti.

10 Kokkidioosi, Eimeria-sukuun kuuluvien alkueläininfektioiden aiheuttama tauti, on tärkeä potentiaalinen taloudellisten tappioiden aiheuttaja kotieläimissä ja linnuissa, erityisesti eläimissä, joita kasvatetaan tai pidetään tehotuotanto-olosuhteissa. Tämä tauti voi vahingoittaa esimerkiksi nautakarjaa, lampaista, sikoja ja kaneja, mutta se on erityisen tärkeä siipikarjalla, erityisesti kananpojissa.

20 Kanojen tauti leviää yleensä lintujen välityksellä, jotka saavat infektoivia organismeja kanalapehkuissa olevasta kananlannasta tai maasta tai ravinnon tai juomaveden välityksellä. Sairaus ilmenee verenvuotona, veren keräytymisenä umpisuoleen, veren siirtymisenä lantaan, heikkoutena ja ruoansulatushäiriöinä. Tauti päättyy usein eläimen kuolemaan, mutta vaikeista infektiosta eloon jääneiden lintujen käypä arvo pienenee huomattavasti infektion seurauksena.

30 Pienen määrän antaminen yleisen kaavan (I) mukaista yhdistettä, edullisesti yhdessä kananrehun kanssa on tehokasta estämään kokkidioosia tai vähentämään sen esiintymistiheyttä. Nämä yhdisteet ovat tehokkaita sekä taudin umpisuolimuotoa (E. tenellan aiheuttama) että suolistomuo-
toja (jotka ovat pääasiassa E. acervulinan, E. brunettin,
35 E. maximan ja E. necatrixin aiheuttamia) vastaan.

Yleisen kaavan (I) mukaiset yhdisteet vaikuttavat myös estävästi ookysteihin vähentämällä suuresti niiden lukumäärää ja/tai tuotettujen ookystien sporulaatiota.

5

Jäljempänä kuvattavia koostumuksia, jotka on tarkoitettu paikalliseen käsittelyyn ihmisillä ja eläimillä sekä tuotevarastojen, kotitalouden tarvikkeiden, omaisuuden tai yleensä ympäristössä olevien alueiden suojaukseen, voidaan yleensä vaihtoehtoisesti käyttää kasvavan viljan ja satojen kasvatukseen käytettävien alueiden käsittelemiseen ja siementen peittaukseen.

10

Sopiviin yleisen kaavan (I) mukaisten yhdisteiden käsittelykeinoihin kuuluvat:

15

kun käsittely on tarkoitettu ihmisille tai eläimille, joiden elimistössä esiintyy niveljalkaisia, loismatoja tai alkueläimiä tai jotka ovat näille alttiina, käytetään ruoansulatuskanavan ulkopuolitse, suun kautta tai paikallisesti tapahtuvaa käsittelyä koostumuksilla, joissa aktiivinen ainesosa vaikuttaa välittömästi ja/tai pidemmän ajanjakson aikana niveljalkaisia, loismatoja tai alkueläimiä vastaan, esimerkiksi siten, että ne yhdistetään rehuihin tai suun kautta otettaviin farmaseuttisiin formulaatioihin, syötäviin syötteihin, suolanuolukiviin, ravinnon mukana annettaviin aineisiin, levitettäviin formulaatioihin, suihkeisiin, rasvoihin, sampoisiin, voiteisiin, vahavoiteisiin ja karjan itsetoimiviin käsittelysysteemeihin, tai viedään yleensä ympäristöön tai tiettyihin paikkoihin, joissa tuhoeläimet viihtyvät, mukaan lukien tuotevarastot, puutavara, kotitalouden tarvikkeet ja yksityistalouksien ja teollisuuden tilat, ruiskutteina, sumutteina, pölytteinä, savutteina, vaha-

20

25

30

35

levitteinä, lakkoina, rakeina tai syötteinä, ja vesiväyliin johtaviin puroihin, kaivoihin, säiliöihin ja muuhun juoksevaan tai seisovaan veteen, tai annetaan kotieläimille rehun mukana näiden lannasta ravintonsa saavien karpästoukkien torjumiseksi, tai annetaan kasvavalle viljalle lehtien kautta vaikuttavina ruiskutteina, pölytteinä, rakeina, sumutteina ja vaahdokkeina ja myöskin hienoksi jauhetujen ja kapseloitujen yleisen kaavan (I) mukaisen yhdisteiden suspensioina, tai annetaan maaperän tai juurien käsittelemiseksi nestemäisillä kasteluaineilla, pölytteillä, rakeilla, savutteilla tai vaahdoilla, ja siementen peittaukseen nestemäisillä vetelillä massoilla ja pölytteillä.

Yleisen kaavan (I) mukaisia yhdisteitä voidaan käyttää niveljalkaisten, loismatojen tai alkueläinten torjuntaan mitä tahansa tyyppiä olevina sinänsä tunnettuina koostumuksina, jotka soveltuvat selkärankaisille käytettävään sisäiseen tai ulkoiseen annosteluun tai käytettäväksi niveljalkaisten torjumiseksi missä tahansa sisä- tai ulkotiloissa ja jotka sisältävät ainakin yhtä yleisen kaavan (I) mukaista yhdistettä yhdessä yhden tai useamman tämän kanssa yhteen sopivan liuottimen tai lisäaineen kanssa, joka on aiotun käytön mukainen. Kaikki nämä koostumukset voidaan valmistaa millä tahansa sinänsä tunnetulla tavalla.

Selkärankaisille tai ihmiselle käytettävään annosteluun sopiviin koostumuksiin kuuluvat valmisteet, jotka soveltuvat suun kautta, ruoansulatuskanavan ulkopuolitse, ihon kautta, esim. ihovoide, tai paikallisesti tapahtuvaan annosteluun.

Suun kautta tapahtuvaan annosteluun tarkoitettut koostumuk-

set käsittävät yhden tai useamman yleisen kaavan (I) mukaisen yhdisteen yhdessä farmaseuttisesti hyväksyttävien kantaja-aineiden tai päällysteiden kanssa ja niihin kuuluvat esimerkiksi tabletit, pillerit, kapselit, voiteet, geelit, pakkosyöttöaineet, lääkerehut, lääkkeitä sisältävä juomavesi, lääkkeitä sisältävät ravinnon lisäaineet, aineita hitaasti vapauttavat annostelukapselit tai muut hitaasti annostelevat välineet, jotka on tarkoitettu pysymään ruoansulatuskanavassa. Mitkä tahansa näistä voivat sisältää aktiivisen aineen, joka on mikrokapseleissa tai joka on päällystetty hapolla hajoavalla, emäksellä hajoavalla tai muilla farmaseuttisesti hyväksyttävillä suolisto-
 päällysteillä. Voidaan myös käyttää tämän keksinnön mukaisia yhdisteitä sisältäviä valmiita sekoitteita ja tiivistettä, joita käytetään lääkettä sisältävän ravinnon valmistukseen tai juomaveden tai eläinten muiden ravinto-
 aineiden käsittelyyn.

Ruoansulatuskanavan ulkopuoliseen annosteluun tarkoitettuihin koostumuksiin kuuluvat liuokset, emulsiot tai suspensiot missä tahansa farmaseuttisesti hyväksyttävässä kantaja-aineessa ja kiinteissä tai puolikiinteissä ihon-
 alaissiirteissä tai pillereissä, jotka on suunniteltu vapauttamaan aktiivista ainesosaa pitkän ajanjakson kuluessa, ja nämä voidaan valmistaa ja steriloida millä tahansa sopivalla sinänsä tunnetulla tavalla.

Ihon kautta ja paikallisesti tapahtuvaan annosteluun tarkoitettuihin koostumuksiin kuuluvat suihkeet, pölytteet, kylvyt, kastoliuokset, ruiskutteen, suihkutteen, rasvat, sampoot, voiteet, vahavoiteet tai levitettävät valmisteet tai laitteet (esim. korvakiinnikkeet), jotka on kiinnitetty eläimiin ulkoisesti siten, että niveljalkaisten torjunta niiden avulla voi tapahtua paikallisesti tai koko elimistön kattavasti.

Niveljalkaisten torjuntaan sopivat kiinteät tai nestemäiset syötit käsittävät yhden tai useamman yleisen kaavan (I) mukaisen yhdisteen ja kantaja-aineen tai laimentimen, joka voi sisältää syömisherätteen niveljalkaiselle antavan ravintoaineen tai jonkin muun aineen.

Yhtä tai useampia yleisen kaavan (I) mukaisia yhdisteitä sisältäviin nestemäisiin koostumuksiin kuuluvat vesisekoitteiset tiivisteet, emulgoituvat tiivisteet, juoksevat suspensiot ja kosteutettavat tai liukenevat jauheet, joita voidaan käyttää sellaisten alustojen tai kohteiden käsittelyyn, joissa esiintyy niveljalkaisia tai jotka ovat näille alttiina, mukaan lukien tilat, ulko- tai sisävarastoalueet tai käsittelyalueet, säiliöt tai laitteet ja seisova ja juokseva vesi.

Yhtä tai useampaa yleisen kaavan (I) mukaista yhdistettä sisältäviä kiinteitä homogeenisia tai heterogeenisia koostumuksia, esimerkiksi rakeita, helmiä, brikettejä tai kapsелеita, voidaan käyttää seisovan tai juoksevan veden käsittelyyn tietyn ajanjakson kuluessa. Samanlainen vaikutus voidaan saada aikaan käyttäen tässä veteen dispergoituvien tiivisteiden hidasta tai ajoittaista juoksutusta.

Voidaan myös käyttää aerosolien ja vesipitoisten ja vettä sisältämättömien liuosten tai dispersioiden muodossa olevia koostumuksia, jotka soveltuvat ruiskutukseen, sumutukseen ja pientä tai hyvin pientä tilavuutta vaativaan ruiskutukseen.

Sopiviin kiinteisiin laimentimiin, joita voidaan käyttää yleisen kaavan (I) mukaisilla yhdisteillä tapahtuvaan käsittelyyn sopivien koostumusten valmistukseen, kuuluvat aluminiumsiliikaatti, piimaa, akanat, trikalsiumfosfaatti,

korkkijauhe, aktiivihiiili, magnesiumsilikaatti, savi, kuten kaoliini, bentoniitti tai attapulgiitti ja vesiliu-
koisiet polymeerit ja tällaiset kiinteät koostumukset voi-
vat haluttaessa sisältää yhtä tai useampaa niiden kanssa
5 yhteen sopivaa kosteutinta, dispergointi-, emulsifiointi-
tai värjäysainetta, jotka kiinteinä ollessaan voivat toi-
mia myös laimentimina.

Sellaiset kiinteät koostumukset, jotka voivat olla pölyt-
10 teiden, rakeiden tai kosteutettavien jauheiden muodossa,
valmistetaan tavallisesti kyllästämällä kiinteät laimentii-
met yleisen kaavan (I) mukaisen yhdisteen liuoksilla haih-
tuvissa liuottimissa, haihduttamalla liuottimet ja, jos
tarpeen, jauhamalla tuotteet ja haluttaessa rakeistamalla
15 tai kiinteyttämällä nämä tuotteet, jotta niistä saadaan
rakeita, helmiä tai brikettejä, tai kapseloimalla hienoja-
koinen aktiivinen ainesosa luonnon- tai synteettiseen po-
lymeeriin, esim. gelatiiniin, synteettisiin hartseihin ja
polyamideihin.

20 Läsnnä mahdollisesti olevat kosteuttimet, dispergoivat ai-
neet ja ioniset tai ionittomat emulgoivat aineet, tai näi-
den seokset, esimerkiksi edellä kuvatun tyyppiset aineet.
Haluttaessa voidaan yleisen kaavan (I) mukaisia yhdisteitä
25 sisältäviä emulsioita käyttää itse-emulgoituvina tiivis-
teinä, jotka sisältävät aktiivisen aineen kanssa yhteen
sopiviin emulgoiviin aineisiin tai aktiivisen aineen kans-
sa yhteen sopivia emulgointiaineita sisältäviin liuotti-
miin liuotetun aktiivisen aineen, jolloin yksinkertainen
30 veden lisäys tällaisiin tiivistisiin tuottaa käyttöval-
miita koostumuksia.

Yleisen kaavan (I) mukaisia yhdisteitä sisältäviä koostu-
muksia, joita voidaan käyttää niveljalkaisiin, kasvien
35 sukkulamatoihin, loismatoihin tai alkueläimiin kuuluvien

5 tuhoeläinten torjuntaan, voivat myös sisältää synergisti-
 sestä vaikuttavia aineita (esim. piperonyylibutoksidia tai
 sesameksia), stabilointiaineita, muita insektisidejä, aka-
 risidejä, kasvinematosidejä, loismatomyrkkijä tai kokkidi-
 10 myrkkijä, fungisidejä (käyttökohteen mukaisia maataloude-
 sa tai eläinlääkinnässä käytettäviä, esim. benomyyli ja
 iprodioni), bakterisidejä, niveljalkaisten tai selkärän-
 kaisten houkutusaineita tai karkotusaineita tai feromone-
 ja, deodorantteja, makua ja hajua antavia aineita, väri-
 15 aineita ja hoitavia lisäaineita, esim. hivenaineita. Nämä
 voidaan ottaa koostumusta suunniteltaessa huomioon paran-
 tamaan tämän tehokkuutta, vaikutuksen säilyvyyttä, turval-
 lisuutta, pidättymistä sinne, mihin sen halutaan menevän,
 laajentamaan torjuttavaksi aiottujen tuholaislajien jouk-
 20 koa tai antamaan koostumukselle kyvyn huolehtia muista
 käyttökelpoisista toiminnoista samassa eläimessä tai käsi-
 teltävällä alalla.

20 Esimerkkejä muista tuhoeläinten torjunta-aktiivisuutta
 osoittavista yhdisteistä, joita voidaan liittää tämän kek-
 sinnön mukaisiin koostumuksiin tai joita voidaan käyttää
 niiden yhteydessä, ovat:

asefaatti, klorpyrifos, demetoni-S-metyyli, disulfotoni,
 etoprofossi, fenitrotioni, malationi, monokrotofossi, pa-
 25 rationi, fosaloni, pirimifossi-metyyli, triatsofossi, syf-
 lutriini, sypermetriini, deltametriini, fenopropatriini,
 fenvaleraatti, permetriini, aldikarbi, karbosulfaani, me-
 tomyyli, oksamyli, pirimikarbi, bendiokarbi, teflubent-
 suroni, dikofolli, endosulfaani, lindaani, bentsoksimaat-
 30 ti, kartappi, syheksatiini, tetradifoni, avermektiinit,
 ivermektiini, milbemysiinit, tiofanaatti, triklorfoni,
 diklorvossi, diaveridiini, ja dimetridatsoli.

35 Niveljalkaisiin, kasvien sukkulamatoihin, loismatoihin tai
 alkueläimiin kuuluvien tuhoeläinten torjuntaan käytettä-

vät koostumukset sisältävät tavallisesti 0,000 01—95 paino-%, tarkemmin sanottuna 0,000 05—50 paino-% yhtä tai useampaa kaavan (I) mukaista yhdistettä tai tämänsuuruisen aktiivisten ainesosien yhteisösuuden (tämä tarkoittaa yleisen kaavan (I) mukaista (-ia) yhdistettä (-eitä) yhdessä muiden niveljalkaisille tai kasvien sukkulamadoille toksisten aineiden, loismatolääkkeiden, kokkidimyrkkyjen, synergististen aineiden, hivenaineiden tai stabilointiaineiden kanssa). Varsinaiset käytetyt koostumukset ja niiden annostelutahdin halutun (-tujen) vaikutuksen (-sten) saavuttamiseksi valitsee maanviljelijä, karjantuottaja, lääkärin- tai eläinlääkärin tointa harjoittava, tuhoeläinten torjuntaa suorittava henkilö tai jokin muu alan ammattimies. Kiinteät ja nestemäiset koostumukset paikallista käyttöä varten eläimille, puutavaraan, varastoituihin tuotteisiin tai kotitaloustarvikkeisiin sisältävät tavallisesti 0,000 05—90 paino-%, tarkemmin sanottuna 0,001—10 paino-% yhtä tai useampaa kaavan (I) mukaista yhdistettä. Eläimille suun kautta tai ruoansulatuskanavan ulkopuolitse, mukaan lukien ihon kautta tapahtuvaa annostelua varten tarkoitetut kiinteät ja nestemäiset koostumukset sisältävät tavallisesti 0,1—90 paino-% yhtä tai useampaa kaavan (I) mukaista yhdistettä. Lääkettä sisältävät rehut sisältävät tavallisesti 0,001—3 paino-% yhtä tai useampaa kaavan (I) mukaista yhdistettä. Tiivistet ja rehuihin sekoitettavat lisäaineet sisältävät tavallisesti 5—90 paino-% ja edullisesti 5—50 paino-% yhtä tai useampaa kaavan (I) mukaista yhdistettä. Mineraalisuolaa sisältävät nuolukivet sisältävät tavallisesti 0,1—10 paino-% yhtä tai useampaa kaavan (I) mukaista yhdistettä.

Pölytteet ja nestemäiset koostumukset, jotka on tarkoitettu käytettäväksi karjaan, ihmisiin, hyödykkeisiin tai ulkoalueisiin, voivat sisältää 0,000 1—15 paino-% ja tarkemmin sanottuna 0,005—2 paino-% yhtä tai useampaa kaavan (I)

- mukaista yhdistettä. Sopivat pitoisuudet käsiteltävissä vesissä ovat 0,000 1—20 miljoonasosaa ja tarkemmin sanotuna 0,001—5 miljoonasosaa yhtä tai useampaa kaavan (I) mukaista yhdistettä ja näitä voidaan käyttää terapeuttisesti kalankasvatuksessa käyttäen sopivanmittaisia altistusaikoja. Syötäväksi tarkoitettut syötit voivat sisältää 0,01—5 paino-% ja edullisemmin 0,01—1 paino-% yhtä tai useampaa kaavan (I) mukaista yhdistettä.
- 10 Annosteltuna selkärankaisiin ruoansulatuskanavan ulkopuolitse, suun tai ihon kautta tai muilla tavoin, kaavan (I) mukaisten yhdisteiden annos riippuu lajista, iästä ja selkärankaisten terveydestä ja niveljalkaisiin, loismatoihin tai alkueläimiin kuuluvan tuhoeläimen luonteesta ja näiden
- 15 esiintymisen asteesta tai siitä asteesta, jossa ne tulevat esiintymään. Yksittäinen 0,1—100 mg:n, edullisesti 2,0—20 mg:n, annos eläimen ruumiinpainokiloa kohti tai kooltaan 0,01—20 mg, edullisesti 0,1—5 mg, oleva annos eläimen ruumiinpainokiloa kohti päivässä jatkuvan lääkityksen aikana,
- 20 ovat yleensä sopivia suun kautta tai ruoansulatuskanavan ulkopuolitse annettaessa. Käyttämällä jatkuvasti vapauttavia koostumuksia tai laitteita voidaan tarvittavat kuu-kausien mittaiset päivittäiset annokset yhdistää ja annostella eläimille yhdellä kertaa.
- 25 Edustavilla yhdisteillä suoritetuissa aktiivisuuskokeissa niveljalkaisia vastaan saatiin seuraavat tulokset (tässä ppm tarkoittaa yhdisteen pitoisuutta miljoonasosina käytettävässä testiliuoksessa):
- 30 Kokeen kohteena oleva laji: *Spodoptera littoralis*
Lehtikiekkoja eräästä papulajikkeesta asetettiin petrimaljoilla olevaan agariin ja ne infektoitiin 5 toukalla (2. muodonvaihdos). Kutakin käsittelyä kohti varattiin neljä
- 35 rinnakaismaljaa ja ne ruiskutettiin Potter-kuvun alla

asianomaisella testattavalla laimennoksella. Kahden päivän jälkeen elävät toukat siirrettiin samanlaisille maljoille, jotka sisälsivät agariin asetettuja käsittelimättömiä lehtiä. Kaksi tai kolme päivää myöhemmin maljat
 5 poistettiin vakiolämpötilassa olevasta (25 °C) huoneesta, jossa niitä oli pidetty ja toukkien kuolleisuusprosenttien keskiarvot määritettiin. Nämä koetulokset korjattiin kontrolleina käytetyiltä, 50-%:sella asetonilla käsiteltyiltä maljoilta saatujen kuolleisuusarvojen suhteen.

10

Tämän menetelmän mukaisesti olivat käsittelyt yhdisteillä 1 ja 2 tehokkaita Spodoptera littoraliksen toukkia vastaan ja ne aiheuttivat tässä järjestyksessä mainittuna 100-%:sen ja 88-%:sen kuolleisuuden, kun pitoisuus oli 20
 15 miljoonasosaa.

Kokeen kohteena oleva laji: Diabrotica undecimpunctata Savimaata käsiteltiin sopivan pitoisuuden omaavilla testattavilla liuoksilla ja sekoitettiin perusteellisesti.
 20 Käsitelty maa-aines siirrettiin sitten pieniin ruukkuihin ja ne infektoitiin viidellä toukalla (seitsemän päivän ikäisiä) ruukkua kohti. Käytettiin neljää rinnakkaista ruukkua yhtä kokeiltavaa pitoisuutta kohti. Seitsemän päivän jälkeen 26 °C:n lämpötilassa laskettiin kuolleiden
 25 ja elävien toukkien lukumäärä ja määritettiin kuolleisuusprosentti. Nämä koetulokset korjattiin kontrolleina käytetyistä, pelkästään asetonilla käsitellyistä ruukuista havaituilla kuolleisuusarvoilla.

30 Tämän menetelmän mukaisesti olivat käsittelyt yhdisteillä 1 ja 2 tehokkaita Diabrotica undecimpunctatan toukkia vastaan ja ne aiheuttivat tässä järjestyksessä mainittuna 100-%:sen kuolleisuuden, kun pitoisuus oli 1 tai 0,5 miljoonasosaa (savimaan uunikuivauspaino).

35

Seuraavat koostumusesimerkit kuvaavat koostumuksia, jotka on tarkoitettu käytettäväksi niveljalkaisiin, kasvien sukkulamatoihin, loismatoihin tai alkueläimiin kuuluvia tuhoeläimiä vastaan ja jotka käsittävät aktiivisina ainesosinaan yleisen kaavan (I) mukaisia yhdisteitä. Kukin koostumusesimerkeissä 1-6 kuvattu koostumus voidaan laimentaa veteen avomailla käytettävän ruiskutettavan koostumuksen aikaansaamiseksi.

10 Koostumusesimerkki 1

Valmistettiin vesiliukoinen tiiviste aineista 3-syaani-1-(2,6-dikloori-4-trifluorimetyylifenyyli)-5-fenyyilitio-4-trifluorimetyylitiopyratsoli 7 tilavuus-%

Etylaani BCP 10 tilavuus-%

15 ja N-metyylipyrrolidoni täytetään 100 tilavuus-%:ksi liuottamalla Etylaani BCP osaan N-metyylipyrrolidonia ja lisäämällä aktiivinen ainesosa lämmittäen ja sekoittaen, kunnes tämä liukenee. Tulokseksi saatu liuos täytettiin haluttuun tilavuuteen lisäämällä loput liuottimesta.

20

Koostumusesimerkki 2

Emulgoitava tiiviste valmistettiin aineista:

3-syaani-1-(2,6-dikloori-4-trifluorimetyylifenyyli)-5-fenyyilitio-4-trifluorimetyylitiopyratsoli 7 tilavuus-%

25 Soprophor BSU 4 tilavuus-%

Arylan CA 4 tilavuus-%

N-metyylipyrrolidoni 50 tilavuus-%

ja Solvesso 150 täytetään 100 tilavuus-%:ksi liuottamalla Soprophor BSU, Arylan CA, ja aktiivinen ainesosa N-metyylipyrrolidoniin ja lisäämällä Solvesso 150:ä halutun tilavuuden aikaansaamiseksi.

30

Koostumusesimerkki 3

Kosteutettava jauhe valmistettiin aineista:

35 3-syaani-1-(2,6-dikloori-4-trifluorimetyylifenyyli)-5-fenyyilitio-4-trifluorimetyylitiopyratsoli 40 paino-%

Arylan S 2 paino-%
 Darvan no 2 5 paino-%
 Celite PF täytetään 100 paino-%:ksi
 sekoittamalla ainesosat ja jauhamalla seos vasaramyllyssä
 5 hiukkaskokoon, joka on pienempi kuin 50 mikrometriä.

Koostumusesimerkki 4

Vesipitoinen juokseva formulaatio valmistettiin aineista
 3-syaani-1-(2,6-dikloori-4-trifluorimetyylifenyyli)-5-fe-
 10 nyyllitio-4-trifluorimetyyllitiopyratsoli 30 tilavuus-%
 Ethylan BCP 1 tilavuus-%
 Sopropon T36 0,2 tilavuus-%
 Etyleeniglykoli 5 tilavuus-%
 Rhodigel 23 0,15 tilavuus-%
 15 ja vettä täytetään 100 tilavuus-%:ksi
 sekoittamalla ainesosat toisiinsa ja jauhamalla kuulamyl-
 lyssä, kunnes hiukkasten mediaanikoko oli pienempi kuin 3
 mikrometriä.

Koostumusesimerkki 5

Valmistettiin emulgoitava suspensiotiiviste aineista
 3-syaani-1-(2,6-dikloori-4-trifluorimetyylifenyyli)-5-fe-
 nyyllitio-4-trifluorimetyyllitiopyratsoli 30 tilavuus-%
 Ethylan BCP 10 tilavuus-%
 25 Bentone 38 0,5 tilavuus-%
 ja Solvesso 150 täytetään 100 tilavuus-%:ksi
 sekoittamalla ainesosat toisiinsa ja jauhamalla kuulamyl-
 lyssä, kunnes hiukkasten mediaanikoko oli pienempi kuin 3
 mikrometriä.

30

Koostumusesimerkki 6

Valmistettiin veteen dispergoituvia rakeita aineista
 3-syaani-1-(2,6-dikloori-4-trifluorimetyylifenyyli)-5-fe-
 nyyllitio-4-trifluorimetyyllitiopyratsoli 30 paino-%
 35 Darvan no 2 15 paino-%
 Arylan S 8 paino-%

- ja Celite PF täytetään 100 paino-%:ksi sekoittamalla ainesosat, hienontamalla neste-energialla toimivassa myllyssä, ja rakeistamalla sitten pyörivässä pelleteimislaitteessa ruiskuttamalla riittävällä vesimäärällä (enintään 10 paino-%). Saadut rakeet kuivattiin leijukerroskuivauslaitteessa vesiylimäärän poistamiseksi. Näissä koostumusesimerkeissä käytetyt kaupalliset ainesosat ovat:
- | | | | |
|----|---------------|--|----|
| 10 | Ethylan BCP | nonyylifenoli-etyleesioksidikondensaatti | |
| | Soprophor BSU | tristyryylifenolin ja etyleenioksidin kondensaatti | |
| | Arylan CA | kalsiumdodekylibentseenisulfonaatin | 70 |
| | | tilavuus-%:inen liuos | |
| | Solvesso 150 | Kevyt C ₁₀ -aromaattinen liuos | |
| 15 | Arylan S | natriumdodekylibentseenisulfonaatti | |
| | Darvan | natriumlignosulfonaatti | |
| | Celite PF | synteettinen magnesiumsilikaattikantaja-aine | |
| | Sopropon T36 | polykarboksyylihapon natriumsuola | |
| 20 | Rhodigel 23 | polysakkaridiksantaanikumi | |
| | Bentone 38 | magnesiummontmorilloniitin orgaaninen johdannainen | |

Koostumusesimerkki 7

- 25 Pölyte jauhe voidaan valmistaa sekoittamalla toisiinsa aineita 3-syaani-1-(2,6-dikloori-4-trifluorimetyylifenyyli)-5-fenyyli-4-trifluorimetyyli-pyratsoli
- 1—10 paino-%
- Erittäin hienoa talkkia täytetään 100 paino-%:ksi

30

- Tällä pölytteellä voidaan kohde, jossa esiintyy niveljalkaisia, esimerkiksi jätteiden kaatopaikat tai jätekasat, varastoidut tuotteet tai kotitalouksineet tai eläimet, joissa esiintyy niveljalkaisia tai joita nämä uhkaavat,
- 35 käsitellä niveljalkaisten torjumiseksi siten, että ainetta

joutuu tuhoeläinten elimistöön suun kautta. Sopiviin pölytteen levittämiskeinoihin kohteeseen, jossa esiintyy niveljalkaisia, kuuluvat mekaaniset puhaltajat, käsisirottimet tai karjan itsetoimivat käsittelylaitteet.

5

Koostumusesimerkki 8

Syötäväksi tarkoitettu syötti voidaan valmistaa sekoittamalla toisiinsa aineita:

3-syaani-1-(2,6-dikloori-4-trifluorimetyylifenyyli)-5-fenyyli-4-trifluorimetyyli-pyratsoli

0,1—1,0 paino-%

vehnäjauhoja

80 paino-%

melasseja

täytetään 100 paino-%:ksi

Tätä syötäväksi tarkoitettua syöttiä voidaan levittää kohteeseen, esimerkiksi kotitalous- ja teollisuustiloihin, esim. keittiöihin, sairaaloihin, tai varastoihin, tai rakennusten ulkopuolisille alueille, joissa esiintyy niveljalkaisia, esimerkiksi muurahaisia, heinäsiirkkoja, torakoita ja kärpäsiä, niveljalkaisten torjumiseksi siten, että ainetta joutuu näiden tuhoeläinten elimistöön suun kautta.

Koostumusesimerkki 9

Voidaan valmistaa liuos, joka sisältää:

3-syaani-1-(2,6-dikloori-4-trifluorimetyylifenyyli)-5-fenyyli-4-trifluorimetyyli-pyratsoli 15 tilavuus-%

dimetyylisulfoksidi lisätään 100 tilavuus-%:ksi

liuottamalla pyratsolijohdannainen osaan dimetyylisulfoksidia ja lisäämällä sitten dimetyylisulfoksidia halutun tilavuuden saavuttamiseksi. Tällä liuoksella voidaan käsitellä kotieläimiä, joissa esiintyy niveljalkaisia, ihon kautta päältäpäin levitettävänä käsittelynä tai polytetrafluorietyleenikalvon (0,22 mikrometrin huokoskoko) läpi tehdyllä suodatuksella suoritettun steriloinnin jälkeen ruoansulatuselimistön ulkopuolitse tehtävänä ruiskeena,

käsittelymäärän ollessa 1,2—12 ml liuosta 100 kg:a eläimen ruumiinpainoa kohti.

Koostumusesimerkki 10

- 5 Voidaan muodostaa kosteutettava jauhe aineista
3-syaani-1-(2,6-dikloori-4-trifluorimetyylifenyyli)-5-fenyyllitio-4-trifluorimetyyllitiopyratsoli 50 paino-%
Ethylan BCP (nonyylifenoli/etyleenioksidikondensaatti, joka sisältää 9 moolia etyleenioksidia fenolimoolia kohti) 5 paino-%
10 Aerosil (piidioksidi, joka on hiukkaskooltaan mikrohienoa) 5 paino-%
Celite PF (synteettinen magnesiumsilikaattikantaja-aine) 40 paino-%
15 imeyttämällä Ethylan BCP Aerosiliin, sekoittamalla nämä muihin ainesosiin ja jauhamalla seos vasaramyllyssä kosteutettavan jauheen saamiseksi, joka voidaan laimentaa vedellä pitoisuuteen, joka on 0,001—2 tilavuus-% pyratso-
20 liyhdistettä ja tätä ruiskuttamalla voidaan käsitellä kohde, jossa esiintyy niveljalkaisia, esimerkiksi kärpäs-
toukkia tai kasvien sukkulamatoja, tai tätä ruiskuttamalla, siihen kastamalla tai sitä juomavetenä suun kautta
25 antamalla voidaan kotieläimet, joiden elimistössä esiintyy niveljalkaisia, loismatoja tai alkueläimiä tai jotka ovat
vaarassa saada näitä elimistöönsä, käsitellä niveljalkaisten, loismatojen tai alkueläinten torjumiseksi.

Koostumusesimerkki 11

- Lääkeainetta hitaasti vapauttava suuri annos voidaan muodostaa rakeista, jotka sisältävät tiheyttä lisäävän aineen, sidosaineen, hitaaseen vapautumiseen tarvittavan aineen ja yhdistettä 3-syaani-1-(2,6-dikloori-4-trifluorimetyylifenyyli)-5-fenyyllitio-4-trifluorimetyyllitiopyratsoli eri prosenttiosuuksia sisältävinä koostumuksina.
35 Tästä seoksesta voidaan puristamalla muodostaa ominaispai-

noltaan 2 tai tätä korkeampi oleva suuri tabletti, joka voidaan antaa suun kautta märehdiville kotieläimille, jolloin sen jäämisestä pötsi-verkkomaha-alueelle seuraa pyratsolihdisteen jatkuva hidas vapautuminen pidemmän ajanjakson kuluessa, jotta voitaisiin torjua niveljalkais-, loismato- tai alkueläinvahingot märehdivissä kotieläimissä.

Koostumusesimerkki 12

- 10 Voidaan valmistaa hitaasti vapauttava koostumus aineista 3-syaani-1-(2,6-dikloori-4-trifluorimetyylifenyyli)-5-fenyyli-4-trifluorimetyyli-4-trifluorimetyyli-pyratsoli 30 paino-% polyvinyylikloridiperusaine täytetään 100 tilavuus-%:ksi
- 15 sekoittamalla polyvinyylikloridiperusaine pyratsolihdisteen ja sopivan pehmittimen, esim. dioktyyliftalaatin, kanssa ja muokkaamalla se sulatusekstruusiolla tai kuuma-
valulla sopiviin muotoihin, esim. rakeiksi, helmiksi, bri-
keteiksi tai nauhoiksi, jotka soveltuvat esimerkiksi li-
sättäväksi seisovaan veteen tai nauhojen kyseessäollessa
20 valmistettaviksi kotieläimiin kiinnitettäväksi kaulapan-
noiksi tai korvakiinnikkeiksi tuhohyönteisten torjumiseksi
pyratsolihdisteen hitaan vapautumisen ansiosta.
- 25 Samanlaisia koostumuksia voidaan valmistaa korvaamalla koostumusesimerkeissä ollut 3-syaani-1-(2,6-dikloori-4-trifluorimetyylifenyyli)-5-fenyyli-4-trifluorimetyyli-
tiopyratsoli sopivalla määrällä mitä tahansa yleisen kaa-
van (I) mukaista yhdistettä.
- 30 Yleisen kaavan (I) mukaiset yhdisteet voidaan valmistaa käyttämällä tai soveltamalla tunnettuja menetelmiä (ts. kemiallisessa kirjallisuudessa aiemmin käytettyjä tai kuvattuja menetelmiä), muodostamalla tavallisesti pyratso-
lirengas ja tämän jälkeen tarvittaessa vaihtamalla substi-

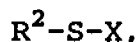
tuentit.

Kun seuraavassa kuvauksessa kaavoissa esiintyy merkkejä, joita ei erikseen määritellä, pidetään selvänä sitä, että ne ovat "aiemmin määriteltyjä" sen mukaisesti kuin kukin merkki on ensiksi määritelty tässä patenttijulkaisussa.

Yhden tämän keksinnön osan mukaisesti tarjotaan käyttöön menetelmä yleisen kaavan (I) mukaisen yhdisteen valmistamiseksi, joka käsittää sen, että:

(i) kun $m = 0$: annetaan kaavan (II), jossa Hal edustaa klooria, bromia tai jodia:

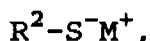
(a) kun Hal on bromi tai jodi, reagoida orgaanisen litiumreagenssin, esim. n-butyylilitiumin, kanssa inertissä liuottimessa, esim. tetrahydrofuraanissa, -30 — -90 °C:ssa, ja tämän jälkeen suoritetaan reaktio yhdisteen kanssa, jolla on kaava:



jossa X on halogeeni, edullisesti kloori, tai syaaniryhmä, tai jolla on kaava:

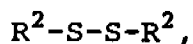


(b) kun Hal = kloori tai bromi, suoritetaan reaktio yhdisteen kanssa, jolla on kaava:



jossa M on alkalimetalli, edullisesti natrium tai kalium, inertissä liuottimessa, esim. N,N-dimetyyliformamidissa lämpötilassa, joka on huoneenlämmöstä 100 °C:een tai

(ii) diatsotoimalla kaavan (III) mukainen yhdiste yhdisteen kanssa, jolla on kaava:

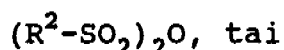


ja diatsotointi suoritetaan edullisesti alkyylinitriittiä, esim. t-butyylinitriittiä, käyttämällä inertissä liuottimessa, esim. kloroformissa tai asetonitriilissä ja lämpötilassa, joka on huoneenlämmöstä palautusjäähdytyslämpö-

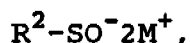
tilaan (J. Het. Chem. 25, 955, 1988), tai

(iii) kun $m = 2$, antamalla yhdisteen, jolla on kaava (II) reagoida:

(a) kun Hal = bromi tai jodi, orgaanisen litiumreagenssin, esim. n-butyylilitiumin, kanssa inertissä liuotuksessa, esim. tetrahydrofuraanissa, -30 — -90 °C:ssa, ja tämän jälkeen suoritetaan reaktio yhdisteen kanssa, jolla on kaava:



(b) kun Hal = kloori, bromi tai jodi, reagoida reaktiolla yhdisteen kanssa, jolla on kaava:



inertissä liuotuksessa, esim. N,N-dimetyyliformamidissa lämpötilassa, joka on huoneenlämmöstä 100 °C:een, ja vaihtoehtoisesti tätä seuraa yleisen kaavan (I) mukaisen yhdisteen, jossa m ja/tai n on (a) 0 tai (b) 1 hapetus yhdisteeksi, jossa m ja/tai n on (a) 1 tai 2 tai (b) 2 , tavallisesti käyttäen joko

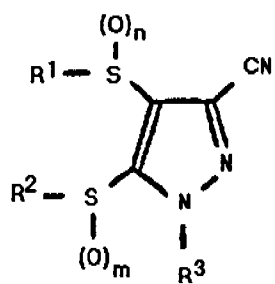
(i) reagensseja, joilla on yleinen kaava:

R-OOH,

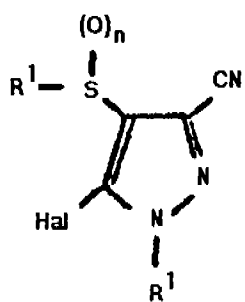
jossa R on vety, trifluoroasetyyli tai edullisesti 3-klooribentsoyyli, liuotuksessa, esim. dikloorimetaanissa, kloroformissa tai trifluorietikkahapossa 0 — 60 °C:ssa, tai

(ii) peroksisuolaa, kuten kaliumvetypersulfaattia tai Caron hapon kaliumsuolaa liuotuksessa, esim metanolissa ja vedessä, -30 — 50 °C:n lämpötilassa.

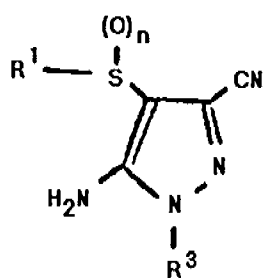
Yhdisteet (II) ja (III) voidaan saada menetelmillä, jotka on annettu eurooppalaisessa patenttihakemuksessa no 295117.



(I)



(II)



(III)

Seuraavat esimerkit ja viite-esimerkit kuvaavat yleisen kaavan (I) mukaisten yhdisteiden tämän keksinnön mukaisen valmistuksen: (Kromatografia suoritettiin silikapylväässä [May & Baker Ltd 40/60 salamakromatografiasilika] 6,8 N m⁻².)

Esimerkki 1

Difenyylidisulfidia (8,72 g) sisältävässä kloroformissa (60 ml) olevaa 5-amino-3-syaani-1-(2,6-dikloori-4-trifluorimetyylifenyyli)-4-trifluorimetyylitiopyratsolia (8,4 g) käsiteltiin t-butyylinitriitillä (4,12 g) 5 minuutin pituisen ajan huoneenlämmössä. Liuosta kuumennettiin 50 °C:ssa 2 tuntia, jäähdytettiin huoneenlämpötilaan ja pestiin vedellä (2 x 50 ml). Vedettömän magnesiumsulfaatin päällä suoritettua kuivauksen jälkeen liuos haihdutettiin tyhjiössä, jotta saatiin oranssinvärinen neste. Tämä puhdistettiin kromatografialla, eluoimalla dikloorimetani/heksaani -seoksella (1:3), jonka jälkeen suoritettiin uudelleenkititys heksaanista, jotta saatiin 3-syaani-1-(2,6-dikloori-4-trifluorimetyylifenyyli)-5-fenyyli-4-trifluorimetyylitiopyratsoli (1,8 g) valkeana kiinteänä aineena, sp. 84–86 °C.

Esimerkki 2

Typen alla -78 °C:ssa sekoitettua, kuivassa tetrahydrofuraanissa (32 ml) olevaa 5-amino-3-syaani-1-(2,6-dikloori-4-trifluorimetyylifenyyli)-4-trifluorimetyylitiopyratsolin (8,4 g) liuosta käsiteltiin heksaaniin tehdyllä n-butyylilitiumpuliuoksella (2,8 ml 2,5-molaarista liuosta) 5 minuutin pituisen ajan. Kun käsittelyyn -78 °C:ssa oli kulunut 1 tunti, lisättiin tetrahydrofuraanissa (2 ml) olevaa bentsyyli-tyrosyyniä (0,95 g) liuosta. Sekoitettua liuoksen annettiin lämmetä hitaasti huoneenlämpöön 16 tunnin aikana, sitten se kaadettiin jää/vesiseokseen (50 ml) ja uutettiin eetterillä (3 x 50 ml). Yhdistetyt uutteen kui-

vattiin vedettömän magnesiumsulfaatin päällä, haihdutettiin tyhjiössä ja puhdistettiin kromatografisesti eluomalla etyyliasetaatti/heksaani (2:98) -seoksella. Tuote trituroitiin heksaanin kanssa, jotta saatiin 5-bentsyyli-

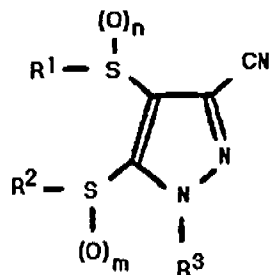
5 tio-3-syaani-1-(2,6-dikloori-4-trifluorimetyylifenyyli)-4-trifluorimetyylisulfonyylipyratsolia (0,25 g) valkeana kiinteänä aineena, sp. 117—119 °C.

Patenttivaatimukset

1. N-fenyylipyratsolijohdannainen, jolla on yleinen kaava:

5

10



jossa R^1 edustaa korkeintaan neljä hiiliatomia käsittävää suoraa tai haaroittunutta alkyyliryhmää, joka voi olla substituomaton tai substituoitu yhdellä tai useammalla halogeeniatomilla,

R^2 edustaa aryyli- tai aralkyyli-ryhmää, joka on vaihtoehtoisesti substituoitu,

R^3 edustaa fenyyli-ryhmää, joka on substituoitu 2-asemassa halogeeniatomilla, joka on substituoitu 4-asemassa 1-4-hiiliatomia sisältävällä suora- tai haaraketjuisella alkyli- tai alkoksiryhmällä, joka voi olla substituoitu yhdellä tai useammalla halogeeniatomilla, ja vaihtoehtoisesti 6-asemassa halogeeniatomilla, ja m ja n ovat toisistaan riippumatta 0, 1 tai 2.

2. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, t u n n e t - t u siitä, että R^2 edustaa fenyyli- tai bentsyyli-ryhmää, joka on vaihtoehtoisesti aromaattisesta renkaasta substituoitu yhdellä tai useammalla halogeeniatomilla, vaihtoehtoisesti alkyli-, alkoksi-, alkyylitio-, alkyylisulfinyyli- tai alkyylisulfonyyliryhmillä, jotka kukin sisältävät korkeintaan 4 hiiliatomia ja niiden ketju on joko suora tai haaroittunut ja ne ovat vaihtoehtoisesti halogenoituja, tai nitro-, syaani- tai asyyli-ryhmillä, ja kun R^2 edustaa bentsyyli-ryhmää, tämä voi olla vaihtoehtoisesti subs-

tituoitu α -asemassa korkeintaan 4 hiiliatomia sisältävällä suoralla tai haaraketjuisella alkyyliryhmällä.

3. Patenttivaatimusten 1 tai 2 mukainen yhdiste, t u n n e t t u siitä, että R^1 edustaa trihalogeenimetyyliryhmää.

4. Patenttivaatimusten 1, 2 tai 3 mukainen yhdiste, t u n n e t t u siitä, että R^1 edustaa trifluorimetyyli-ryhmää.

5. Minkä tahansa edellisen patenttivaatimuksen mukainen yhdiste, t u n n e t t u siitä, että R^3 :n edustaman fenyyli-ryhmä on 4-asemastaan substituoitu trifluorimetyyli- tai trifluorimetoksiryhmällä.

6. Minkä tahansa edellisistä patenttivaatimuksista 1–4 mukainen yhdiste, t u n n e t t u siitä, että R^3 edustaa fenyyli-ryhmää, joka on substituoitu 2,6-dikloori-4-difluorimetoksi-, 2-kloori-4-trifluorimetyyli-, 2-bromi-6-kloori-4-trifluorimetyyli-, 2,6-dibromi-4-trifluorimetyyli-, 2,6-dibromi-4-trifluorimetyyli- tai 2-bromi-4-trifluorimetyylisubstituentilla.

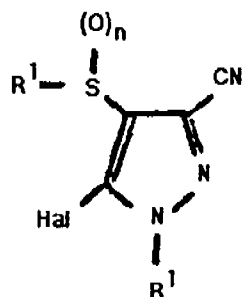
7. Minkä tahansa edellisistä patenttivaatimuksista 1–5 mukainen yhdiste, t u n n e t t u siitä, että R^3 on substituoitu 2,6-dikloori-4-trifluorimetyyli- tai 2,6-dikloori-4-trifluorimetoksisubstituentilla.

8. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, t u n n e t t u siitä, että se on 3-syaani-1-(2,6-dikloori-4-trifluorimetyylifenyyli)-5-fenyyli-4-trifluorimetyylitio-pyratsoli tai 5-bentsyyli-3-syaani-1-(2,6-dikloori-4-trifluorimetyylifenyyli)-4-trifluorimetyylisulfonyli-pyratsoli.

9. Menetelmä patenttivaatimuksen 1 mukaisen yhdisteen valmistamiseksi, t u n n e t t u siitä, että se käsittää sen, että

(i) kun $m = 0$:

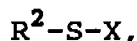
annetaan yhdisteen, jolla on kaava (II)



(II),

jossa Hal edustaa klooria, bromia tai jodia ja muut merkinnät ovat patenttivaatimuksessa 1 annetun määrittelyn mukaisia:

(a) kun Hal on bromi tai jodi, reagoida orgaanisen litiumreagenssin, esim. n-butyylilitiumin, kanssa inertissä liuotuksessa, -30—90 °C:ssa, ja tämän jälkeen suoritetaan reaktio yhdisteen kanssa, jolla on yleinen kaava:

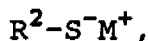


jossa X on halogeeni, edullisesti kloori, tai syaaniryhmä, tai jolla on yleinen kaava:



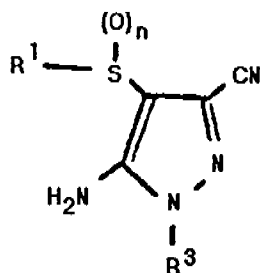
jossa R² on patenttivaatimuksessa 1 annetun määrittelyn mukainen tai

(b) kun Hal edustaa klooria tai bromia, suoritetaan reaktio yhdisteen kanssa, jolla on yleinen kaava:



jossa M edustaa alkalimetalliatomia ja R² on patenttivaatimuksessa 1 annetun määrittelyn mukainen, inertissä liuotuksessa, lämpötilassa, joka on huoneenlämmöstä 100 °C:een tai

(ii) diatsotoimalla yhdiste, jolla on yleinen kaava:



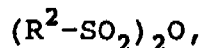
(III),

jossa eri merkinnät ovat patenttivaatimuksessa 1 annetun määrityksen mukaiset, yleisen kaavan mukaisen yhdisteen $R^2-S-S-R^2$, jossa R^2 on patenttivaatimuksessa 1 annetun määrityksen mukainen, läsnäollessa tai

(iii) kun $m = 2$,

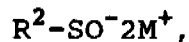
antamalla yhdisteen, jolla on yleinen kaava (II) reagoida:

(a) kun Hal = bromi tai jodi, orgaanisen litium-reagenssin, esim. n-butyylilitiumin, kanssa inertissä liuottimessa, esim. tetrahydrofuraanissa, $-30-90\text{ }^{\circ}\text{C}$:ssa, ja tämän jälkeen suoritetaan reaktio yhdisteen kanssa, jolla on yleinen kaava:



jossa R^2 on patenttivaatimuksessa 1 annetun määrityksen mukainen tai

(b) kun Hal = kloori, bromi tai jodi, reagoida reaktiolla yhdisteen kanssa, jolla on yleinen kaava:



jossa M on edellä annetun määrityksen mukainen ja R^2 on patenttivaatimuksessa 1 annetun määrityksen mukainen, inertissä liuottimessa lämpötilassa, joka on huoneenlämmöstä $100\text{ }^{\circ}\text{C}$:een, ja vaihtoehtoisesti tätä seuraa yleisen kaavan (I) mukaisen yhdisteen, jossa m ja/tai n on (a) 0 tai (b) 1, hapetus yhdisteeksi, jossa m ja/tai n on (a) 1 tai 2 tai (b) 2.

10. Tuhoeläinten torjunta-ainekoostumus, t u n n e t t u siitä, että se käsittää patenttivaatimuksessa 1 määritellyn yleisen kaavan I mukaisen N-fenyylipyratsolijohdannaisen hyväksyttävän kantaja-aineen tai päällysteen yhteydessä.

11. Menetelmä niveljalkaisiin, kasvien sukkulamatoihin, loismatoihin tai alkueläimiin kuuluvien tuhoeläinten torjumiseksi tietyssä kohteessa, t u n n e t t u siitä, että tämä kohde käsitellään patenttivaatimuksessa 1 määritellyn yleisen kaavan I mukaisella N-fenyylipyratsolijohdannaisella.