



УКРАЇНА

(19) **UA** (11) **127095** (13) **C2**
(51) МПК**C07D 401/04** (2006.01)
A01N 43/52 (2006.01)
A01P 7/02 (2006.01)
A01P 7/04 (2006.01)
A61K 31/4439 (2006.01)
A61P 33/14 (2006.01)НАЦІОНАЛЬНИЙ ОРГАН
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ ВЛАСНОСТІ
ДЕРЖАВНА ОРГАНІЗАЦІЯ
"УКРАЇНСЬКИЙ НАЦІОНАЛЬНИЙ
ОФІС ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ ТА ІННОВАЦІЙ"**(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВІНАХІД**

(21) Номер заявки: a 2020 08072	(72) Винахідник(и): Фудзіхара Хіроказу (JP), Абе Ютака (JP), Танака Ріосукє (JP), Футі Сунсукє (JP)
(22) Дата подання заявки: 22.05.2019	(73) Володілець (володільці): НІХОН НОХІЯКУ КО., ЛТД., 19-8, Kuobashi 1-Chome, Chuo-ku, Tokyo 1048386, Japan (JP)
(24) Дата, з якої є чинними права інтелектуальної власності: 13.04.2023	(74) Представник: Іванюк Наталія Борисівна, реєстр. №507
(31) Номер попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції: 2018-097629	(56) Перелік документів, взятих до уваги експертною: US 2017/210741 A1, 27.07.2017 WO 2009/051705 A1, 23.04.2009 WO 2008/128968 A1, 30.10.2008 SAVALL B M ET AL, "Synthesis of 2- arylbenzimidazoles via microwave Suzuki- Miyaura reaction of unprotected 2- chlorobenzimidazoles", TETRAHEDRON LETTERS, ELSEVIER, AMSTERDAM, NL, vol. 49, no. 47, 17 November 2008 (2008-11- 17), pages 6667 – 6669 DATABASE REGISTRY, CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 11 November 2005 (2005-11-11), Chemical Library, "5-(1H-Benzimidazol-2-yl)- N-(3,4- dimethylphenyl)-2-pyridinamine", Database accession no. 867299-25-0 DATABASE REGISTRY, CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 12 December 2005 (2005-12-12), Chemical Library, "5-(1H-Benzimidazol-2-yl)- N- (phenylmethyl)-2-pyridinamine", Database accession no. 869710-31-6 DATABASE REGISTRY, CHEMICAL ABSTRACTS SERVICE, COLUMBUS, OHIO, US; 18 February 2014 (2014-02-18), Chemical Catalog, "5,6-Dichloro-2-(2-methoxy-3- pyridinyl)- 1H-benzimidazole", Database accession no. 1547651-08-0 US 3 920 681 A, 18.11.1975 WO 2014/142292 A1, 18.09.2014 WO 2014/119679 A1, 07.08.2014
(32) Дата подання попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції: 22.05.2018	
(33) Код держави-учасниці Паризької конвенції, до якої подано попередню заявку: JP	
(41) Публікація відомостей про заявку: 27.01.2021, Бюл.№ 4	
(46) Публікація відомостей про державну реєстрацію: 12.04.2023, Бюл.№ 15	
(86) Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору РСТ: PCT/JP2019/020325, 22.05.2019	

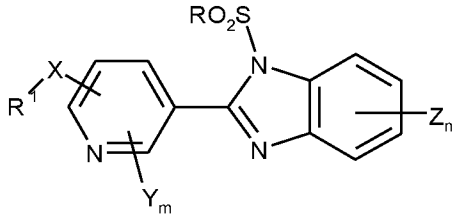
UA 127095 C2

(54) ПОХІДНЕ БЕНЗІМІДАЗОЛУ АБО ЙОГО СІЛЬ, СІЛЬСЬКОГОСПОДАРСЬКИЙ І САДІВНИЧИЙ ІНСЕКТИЦИДНИЙ І АКАРИЦИДНИЙ ЗАСІБ, ЯКИЙ МІСТИТЬ ВКАЗАНУ СПОЛУКУ, І СПОСІБ ЙОГО ЗАСТОСУВАННЯ

(57) Реферат:

Даний винахід стосується розробки і надання нового сільськогосподарського і садівничого інсектицидного і акарицидного засобу, що зумовлено такими чинниками, як серйозні пошкодження, викликані шкідниками і тому подібними, і ростом стійких до існуючих лікарських засобів шкідників в рослинництві, такому як сільське господарство і садівництво.

Даний винахід стосується сільськогосподарського і садівничого інсектицидного і акарицидного засобу, що містить як активний інгредієнт похідне бензімідазолу, представлене загальною формулою (1):



, Формула (1)

де R являє собою алкільну групу або т. ін., R¹ являє собою галогеналкільну групу або т. ін., X являє собою атом кисню або т. ін., m і n означають 0 або т. ін., або його сіль, і способу його застосування.

Галузь техніки

Даний винахід стосується сільськогосподарського і садівничого інсектицидного і акарицидного засобу, що містить похідне бензimidазолу або його сіль як активний інгредієнт і спосіб його застосування.

5 Галузь техніки

Дотепер документально підтверджено, що похідні бензimidазолу можуть використовуватися як інсектицидні засоби (наприклад, див. патентну літературу 1 і 2); однак в цих літературних джерелах не описується похідне бензimidазолу, що має конкретну N-сульфонільну групу, таку як N-алкілсульфонільна група, в положенні 1. В цих літературних джерелах описано похідне бензimidазолу, в якому піридинська група приєднана в положенні 2, але не приводиться опис сполуки, що має конкретну N-сульфонільну групу, таку як алкілсульфонільна група, в положенні 1, або його інсектицидна дія (наприклад, див. непатентну літературу 1 і 2).

Список цитованої літератури

Патентна література

15 Патентна література 1: Міжнародна публікація № WO2012/086848

Патентна література 2: Міжнародна публікація № WO2013/018928

Непатентна література

Непатентна література 1: Advanced Synthesis & Catalysis (2015), 357(7), 1416-1424

Непатентна література 2: Yinyong Huaxue (2007), 24(5), 507-511

20 Суть винаходу

Технічна задача

У рослинництві в галузі сільського господарства, садівництва і тому подібного є все ще серйозними пошкодження, які викликані шкідниками і тому подібним, і існує потреба в розробці сільськогосподарського і садівничого інсектицидного і акарицидного засобу, що має нову дію, менший вплив на природних ворогів корисних комах і наділений активністю проникнення і пересування речовин в рослинах, з точки зору появи шкідників, стійких до існуючих лікарських засобів, впливу на біологію навколишнього середовища і економії труда при експлуатації.

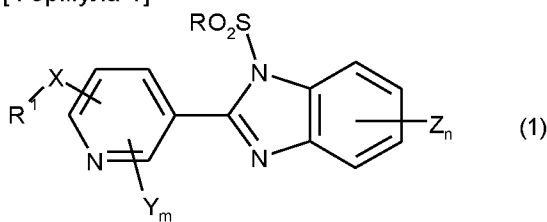
Розв'язання проблеми

Автори даного винаходу провели інтенсивні дослідження для розв'язання вищезгаданих проблем і встановили, що похідне бензimidазолу, представлене загальною формулою (1), де піридинська група приєднана в положенні 2 і конкретна N-сульфонільна група присутня в положенні 1, або його сіль демонструє не тільки хорошу дію в боротьбі з сільськогосподарськими і садівничими шкідливими комахами, але може вирішити вищезгадану проблему, таким чином створивши даний винахід.

35 Таким чином, даний винахід стосується

[1] Похідного бензimidазолу, представленого загальною формулою (1)

[Формула 1]



де R являє собою (a1) (C₁-C₈)алкільну групу; (a2) (C₃-C₈)циклоалкільну групу; (a3) (C₃-C₈)циклоалкіл(C₁-C₈)алкільну групу; (a4) галоген(C₁-C₈)алкільну групу; (a5) (C₂-C₈)алкенільну групу; (a6) (C₂-C₈)алкінільну групу; (a7) арильну групу або (a8) арильну групу, що має від 1 до 5 замісників, які можуть бути однаковими або різними і вибрані з (a) атома галогену, (b) (C₁-C₆)алкільної групи, (c) галоген(C₁-C₆)алкільної групи, (d) (C₁-C₆)алкокси групи, (e) галоген(C₁-C₆)алкокси групи, (f) (C₁-C₆)алкілтіо групи, (g) галоген(C₁-C₆)алкілтіо групи, (h) (C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (i) галоген(C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (j) (C₁-C₆)алкілсульфонільної групи, (k) галоген(C₁-C₆)алкілсульфонільної групи і (l) три(C₁-C₆)алкілсилільної групи, де алкільні групи можуть бути однаковими або різними;

R¹ являє собою (b1) (C₁-C₈)алкільну групу; (b2) галоген(C₁-C₈)алкільну групу; (b3) (C₃-C₈)циклоалкільну групу; (b4) галоген(C₃-C₈)циклоалкіл(C₁-C₈)алкільну групу; (b5) (C₃-C₈)циклоалкіл(C₁-C₈)алкільну групу; (b6) галоген(C₃-C₈)циклоалкіл(C₁-C₈)алкільну групу; (b7) (C₂-C₈)алкенільну групу; (b8) галоген(C₂-C₈)алкенільну групу; (b9) (C₂-C₈)алкінільну групу; (b10) галоген(C₂-C₈)алкінільну групу; (b11) арильну групу; (b12) арильну групу, що має від 1 до 5 замісників, які можуть бути однаковими або різними і вибрані з (a) атома галогену, (b) (C₁-C₆)алкільної групи, (c) галоген(C₁-C₆)алкільної групи, (d) (C₁-C₆)алкокси групи, (e) галоген(C₁-C₆)алкокси групи, (f)

(C₁-C₆)алкілтіо групи, (g) галоген(C₁-C₆)алкілтіо групи, (h) (C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (i) галоген(C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (j) (C₁-C₆)алкілсульфонільної групи, (k) галоген(C₁-C₆)алкілсульфонільної групи і (l) три(C₁-C₆)алкілсилільної групи, де алкільні групи можуть бути однаковими або різними; (b13) арил(C₁-C₈)алкільну групу; (b14) арил(C₁-C₆)алкільну групу, що має від 1 до 5 замісників, які можуть бути однаковими або різними і вибрані з (a) атома галогену, (b) (C₁-C₆)алкільної групи, (c) галоген(C₁-C₆)алкільної групи, (d) (C₁-C₆)алкокси групи, (e) галоген(C₁-C₆)алкокси групи, (f) (C₁-C₆)алкілтіо групи, (g) галоген(C₁-C₆)алкілтіо групи, (h) (C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (i) галоген(C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (j) (C₁-C₆)алкілсульфонільної групи, (k) галоген(C₁-C₆)алкілсульфонільної групи і (l) три(C₁-C₆)алкілсилільної групи, алкільна група може бути однією і тією ж або різною; (b15) ароматичну гетероциклічну групу; (b16) ароматичну гетероциклічну групу, що має від 1 до 3 замісників, які можуть бути однаковими або різними і вибрані з (a) атома галогену, (b) (C₁-C₆)алкільної групи, (c) галоген(C₁-C₆)алкільної групи, (d) (C₁-C₆)алкокси групи, (e) галоген(C₁-C₆)алкокси групи, (f) (C₁-C₆)алкілтіо групи, (g) галоген(C₁-C₆)алкілтіо групи, (h) (C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (i) галоген(C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (j) (C₁-C₆)алкілсульфонільної групи і (l) три(C₁-C₆)алкілсилільної групи, де алкільні групи можуть бути однаковими або різними; (b17) (C₁-C₈)алкокси(C₁-C₈)алкільну групу; (b18) (C₁-C₈)алкілтіо(C₁-C₈)алкільну групу; (b19) (C₁-C₈)алкілсульфініл(C₁-C₈)алкільну групу або (b20) (C₁-C₈)алкілсульфоніл(C₁-C₈)алкільну групу.

X являє собою O, S, SO, SO₂ або NR², де R² являє собою атом водню, (C₁-C₆)алкільну групу, (C₁-C₆)алкілкарбонільну групу, (C₁-C₆)алкоксикарбонільну групу, (C₁-C₆)алкілсульфонільну групу або галоген(C₁-C₆)алкілсульфонільну групу, або R² може бути приєднаний до R¹ з утворенням разом з атомом азоту, до якого приєднаний R², 5-8-членний насичений азотовмісний аліфатичний гетероцикл, що необов'язково має від 1 до 5 замісників, де замісник вибраний з (C₁-C₆)алкільної групи, (C₁-C₆)алкілкарбонільної групи, (C₁-C₆)алкоксикарбонільної групи, (C₁-C₆)алкілсульфонільної групи, галоген(C₁-C₆)алкілсульфонільної групи і (C₁-C₆)алкілендіокси групи, де дві окси групи в алкілендіокси групі можуть бути приєднані до одного і того ж атома вуглецю або до різних атомів вуглецю азотовмісного аліфатичного гетероциклу;

Y може бути однаковим або різним і являє собою (c1) атом галогену або (c2) (C₁-C₈)алкільну групу;

m являє собою 0, 1, 2 або 3;

Z може бути однаковим або різним і являє собою (d1) атом галогену; (d2) (C₁-C₈)алкільну групу; (d3) (C₃-C₈)циклоалкільну групу; (d4) (C₃-C₈)циклоалкіл(C₁-C₈)алкільну групу; (d5) галоген(C₃-C₈)циклоалкіл(C₁-C₈)алкільну групу; (d6) галоген(C₁-C₈)алкільну групу; (d7) галоген(C₁-C₈)алкокси групу; (d8) галоген(C₁-C₈)алкілтіо групу; (d9) галоген(C₁-C₈)алкілсульфінільну групу або (d10) галоген(C₁-C₈)алкілсульфонільну групу і n являє собою 0, 1, 2, 3 або 4, або його сіль;

[2] похідного бензimidазолу відповідно до [1], де R являє собою (a1) (C₁-C₈)алкільну групу; (a2) (C₃-C₈)циклоалкільну групу; (a3) (C₃-C₈)циклоалкіл(C₁-C₈)алкільну групу; (a4) галоген(C₁-C₈)алкільну групу; (a5) (C₂-C₈)алкенільну групу; (a6) (C₂-C₈)алкінільну групу; (a7) арильну групу або (a8) арильну групу, що має від 1 до 5 замісників, які можуть бути однаковими або різними і вибрані з (a) атома галогену, (b) (C₁-C₆)алкільної групи, (c) галоген(C₁-C₆)алкільної групи, (d) (C₁-C₆)алкокси групи, (e) галоген(C₁-C₆)алкокси групи, (f) (C₁-C₆)алкілтіо групи, (g) галоген(C₁-C₆)алкілтіо групи, (h) (C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (i) галоген(C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (j) (C₁-C₆)алкілсульфонільної групи і (k) галоген(C₁-C₆)алкілсульфонільної групи;

R¹ являє собою (b1) (C₁-C₈)алкільну групу; (b2) галоген(C₁-C₈)алкільну групу; (b3) (C₃-C₈)циклоалкільну групу; (b4) галоген(C₃-C₈)циклоалкільну групу; (b5) (C₃-C₈)циклоалкіл(C₁-C₈)алкільну групу; (b6) галоген(C₃-C₈)циклоалкіл(C₁-C₈)алкільну групу; (b7) (C₂-C₈)алкенільну групу; (b8) галоген(C₂-C₈)алкенільну групу; (b9) (C₂-C₈)алкінільну групу; (b10) галоген(C₂-C₈)алкінільну групу; (b11) арильну групу; (b12) арильну групу, що має від 1 до 5 замісників, які можуть бути однаковими або різними і вибрані з (a) атома галогену, (b) (C₁-C₆)алкільної групи, (c) галоген(C₁-C₆)алкільної групи, (d) (C₁-C₆)алкокси групи, (e) галоген(C₁-C₆)алкокси групи, (f) (C₁-C₆)алкілтіо групи, (g) галоген(C₁-C₆)алкілтіо групи, (h) (C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (i) галоген(C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (j) (C₁-C₆)алкілсульфонільної групи і (k) галоген(C₁-C₆)алкілсульфонільної групи; (b13) арил(C₁-C₈)алкільну групу; (b14) арил(C₁-C₆)алкільну групу, що має від 1 до 5 замісників, які можуть бути однаковими або різними і вибрані з (a) атома галогену, (b) (C₁-C₆)алкільної групи, (c) галоген(C₁-C₆)алкільної групи, (d) (C₁-C₆)алкокси групи, (e) галоген(C₁-C₆)алкокси групи, (f) (C₁-C₆)алкілтіо групи, (g) галоген(C₁-C₆)алкілтіо групи, (h) (C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (i) галоген(C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (j) (C₁-C₆)алкілсульфонільної групи і (k) галоген(C₁-C₆)алкілсульфонільної групи; (b15) ароматичну

гетероциклічну групу або (b16) ароматичну гетероциклічну групу, що має від 1 до 3 замісників, які можуть бути однаковими або різними і вибрані з (a) атома галогену, (b) (C₁-C₆)алкільної групи, (c) галоген(C₁-C₆)алкільної групи, (d) (C₁-C₆)алкокси групи, (e) галоген(C₁-C₆)алкокси групи, (f) (C₁-C₆)алкілтіо групи, (g) галоген(C₁-C₆)алкілтіо групи, (h) (C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (i) галоген(C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (j) (C₁-C₆)алкілсульфонільної групи і (k) галоген(C₁-C₆)алкілсульфонільної групи;

X являє собою O, S, SO, SO₂ або NR², де R² являє собою атом водню, (C₁-C₆)алкільну групу, (C₁-C₆)алкілкарбонільну групу, (C₁-C₆)алкоксикарбонільну групу, (C₁-C₆)алкілсульфонільну групу або галоген(C₁-C₆)алкілсульфонільну групу);

Y може бути однаковим або різним і являє собою (c1) атом галогену або (c2) (C₁-C₈)алкільну групу;

m являє собою 0, 1, 2 або 3;

Z може бути однаковим або різним і являє собою (d1) атом галогену; (d2) (C₁-C₈)алкільну групу; (d3) (C₃-C₈)циклоалкільну групу; (d4) (C₃-C₈)циклоалкіл(C₁-C₈)алкільну групу; (d5) галоген(C₃-C₈)циклоалкіл(C₁-C₈)алкільну групу; (d6) галоген(C₁-C₈)алкільну групу; (d7) галоген(C₁-C₈)алкокси групи; (d8) галоген(C₁-C₈)алкілтіо групи; (d9) галоген(C₁-C₈)алкілсульфінільну групу або (d10) галоген(C₁-C₈)алкілсульфонільну групу і

n являє собою 0, 1, 2, 3 або 4, або його сіль;

[3] похідного бензimidазолу відповідно до [1], де R являє собою (a1) (C₁-C₈)алкільну групу; (a2) (C₃-C₈)циклоалкільну групу; (a4) галоген(C₁-C₈)алкільну групу; (a7) арильну групу або (a8) арильну групу, що має від 1 до 5 замісників, які можуть бути однаковими або різними і вибрані з (a) атома галогену, (b) (C₁-C₆)алкільної групи, (c) галоген(C₁-C₆)алкільної групи, (d) (C₁-C₆)алкокси групи, (e) галоген(C₁-C₆)алкокси групи, (f) (C₁-C₆)алкілтіо групи, (g) галоген(C₁-C₆)алкілтіо групи, (h) (C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (i) галоген(C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (j) (C₁-C₆)алкілсульфонільної групи, (k) галоген(C₁-C₆)алкілсульфонільної групи і (l) три(C₁-C₆)алкілсилільної групи, де алкільні групи можуть бути однаковими або різними;

R¹ являє собою (b1) (C₁-C₈)алкільну групу; (b2) галоген(C₁-C₈)алкільну групу; (b3) (C₃-C₈)циклоалкільну групу; (b5) (C₃-C₈)циклоалкіл(C₁-C₈)алкільну групу; (b11) арильну групу; (b12) арильну групу, що має від 1 до 5 замісників, які можуть бути однаковими або різними і вибрані з (a) атома галогену, (b) (C₁-C₆)алкільної групи, (c) галоген(C₁-C₆)алкільної групи, (d) (C₁-C₆)алкокси групи, (e) галоген(C₁-C₆)алкокси групи, (f) (C₁-C₆)алкілтіо групи, (g) галоген(C₁-C₆)алкілтіо групи, (h) (C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (i) галоген(C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (j) (C₁-C₆)алкілсульфонільної групи, (k) галоген(C₁-C₆)алкілсульфонільної групи і (l) три(C₁-C₆)алкілсилільної групи, де алкільні групи можуть бути однаковими або різними; (b13) арил(C₁-C₈)алкільну групу; (b14) арил(C₁-C₆)алкільну групу, що має від 1 до 5 замісників, які можуть бути однаковими або різними і вибрані з (a) атома галогену, (b) (C₁-C₆)алкільної групи, (c) галоген(C₁-C₆)алкільної групи, (d) (C₁-C₆)алкокси групи, (e) галоген(C₁-C₆)алкокси групи, (f) (C₁-C₆)алкілтіо групи, (g) галоген(C₁-C₆)алкілтіо групи, (h) (C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (i) галоген(C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (j) (C₁-C₆)алкілсульфонільної групи, (k) галоген(C₁-C₆)алкілсульфонільної групи і (l) три(C₁-C₆)алкілсилільної групи, де алкільні групи можуть бути однаковими або різними; (b17) (C₁-C₈)алкоксі(C₁-C₈)алкільну групу; (b18) (C₁-C₈)алкілтіо(C₁-C₈)алкільну групу або (b20) (C₁-C₈)алкілсульфоніл(C₁-C₈)алкільну групу,

X являє собою O, S, SO, SO₂ або NR², де R² являє собою (C₁-C₆)алкільну групу, (C₁-C₆)алкілкарбонільну групу або (C₁-C₆)алкілсульфонільну групу, або R² може бути приєднаний до R¹ з утворенням разом з атомом азоту, до якого приєднаний R², 5-8-членний насичений азотовмісний аліфатичний гетероцикл, що необов'язково має від 1 до 5 замісників, де замісник вибраний з (C₁-C₆)алкільної групи, (C₁-C₆)алкілкарбонільної групи, (C₁-C₆)алкоксикарбонільної групи, (C₁-C₆)алкілсульфонільної групи, галоген(C₁-C₆)алкілсульфонільної групи і (C₁-C₆)алкілендіокси групи, де дві окси групи в алкілендіокси групі можуть бути приєднані до одного і того ж атома вуглецю або до різних атомів вуглецю азотовмісного аліфатичного гетероциклу;

Y може бути однаковим або різним і являє собою (c1) атом галогену;

m являє собою 0 або 1;

Z може бути однаковим або різним і являє собою (d1) атом галогену або (d2) (C₁-C₈)алкільну групу і

n являє собою 0, 1 або 2, або його сіль;

[4] похідного бензimidазолу відповідно до [1], де R являє собою (a1) (C₁-C₈)алкільну групу; R¹ являє собою (b1) галоген(C₁-C₈)алкільну групу; m являє собою 0, і n являє собою 0 або його сіль;

[5] сільськогосподарського і садівничого інсектицидного і акарицидного засобу, що містить похідне бензimidазолу або його сіль відповідно до будь-якого з [1]-[4] як активний інгредієнт;

[6] способу застосування сільськогосподарського і садівничого інсектицидного і акарицидного засобу, що включає нанесення на рослини або ґрунт ефективної кількості похідного бензimidазолу або його солі відповідно до будь-якого з [1]-[4];

5 [7] засобу боротьби з ектопаразитами у тварин, що містить ефективну кількість похідного бензimidазолу або його солі відповідно до будь-якого з [1]-[4] як активний інгредієнт;

[8] засобу боротьби з ендopаразитами у тварин, що містить ефективну кількість похідного бензimidазолу або його солі відповідно до будь-якого з [1]-[4] як активний інгредієнт.

Позитивний ефект винаходу

10 Похідне бензimidазолу за даним винаходом, де піридилна група приєднана в положенні 2 і конкретна N-сульфонільна група присутня в положенні 1, або його сіль має не тільки хороший ефект як сільськогосподарський і садівничий інсектицидний і акарицидний засіб, але також впливає на шкідників, що паразитують на тваринах-компаньйонах, таких як собаки і кішки, або на домашніх тваринах, таких як корови і вівці.

Опис варіантів здійснення винаходу

15 У визначенні загальної формули (1), що представляє похідне бензimidазолу, де піридилна група приєднана в положенні 2 і конкретна N-сульфонільна група присутня в положенні 1, за даним винаходом або його сіль, термін "галоген" означає "атом галогену" і стосується атома фтору, атома хлору, атома бромру або атома йоду.

20 Термін "(C₁-C₈)алкільна група" стосується прямих або розгалужених алкільних груп, що мають від 1 до 8 атомів вуглецю, таких як метильна група, етильна група, нормальна пропільна група, ізопропільна група, нормальна бутильна група, ізобутильна група, вторинна бутильна група, третинна бутильна група, нормальна пентильна група, ізопентильна група, третинна пентильна група, неопентильна група, 2,3-диметилпропільна група, 1-етилпропільна група, 1-метилбутильна група, 2-метилбутильна група, нормальна гексильна група, ізогексильна група, 25 2-гексильна група, 3-гексильна група, 2-метилпентильна група, 3-метилпентильна група, 1,1,2-триметилпропільна група, 3,3-диметилбутильна група, нормальна гептильна група, 2-гептильна група, 3-гептильна група, 2-метилгексильна група, 3-метилгексильна група, 4-метилгексильна група, ізогептильна група і нормальна октильна група, термін "(C₂-C₈)алкенільна група" стосується прямих або розгалужених алкенільних груп, що мають від 2 до 8 атомів вуглецю, 30 таких як вінільна група, алілільна група, ізопропенільна група, 1-бутенільна група, 2-бутенільна група, 2-метил-2-пропенільна група, 1-метил-2-пропенільна група, 2-метил-1-пропенільна група, пентенільна група, 1-гексенільна група, 3,3-диметил-1-бутенільна група, гептенільна група і октенільна група, і термін "(C₂-C₈)алкінільна група" стосується прямих або розгалужених алкінільних груп, які мають от 2 до 8 атомів вуглецю, таких як етинільна група, 1-пропінільна група, 2-пропінільна група, 1-бутинільна група, 2-бутинільна група, 3-бутинільна група, 3-метил-1-пропінільна група, 2-метил-3-пропінільна група, пентинільна група, 1-гексинільна група, 3-метил-1-бутинільна група, 3,3-диметил-1-бутинільна група, гептинільна група і октинільна група.

40 Термін "(C₁-C₆)алкільна група" стосується прямих або розгалужених алкільних груп, що мають від 1 до 6 атомів вуглецю, таких як метильна група, етильна група, нормальна пропільна група, ізопропільна група, нормальна бутильна група, ізобутильна група, вторинна бутильна група, третинна бутильна група, нормальна пентильна група, ізопентильна група, третинна пентильна група, неопентильна група, 2,3-диметилпропільна група, 1-етилпропільна група, 1-метилбутильна група, 2-метилбутильна група, нормальна гексильна група, ізогексильна група, 2-гексильна група, 3-гексильна група, 2-метилпентильна група, 3-метилпентильна група, 1,1,2-триметилпропільна група і 3,3-диметилбутильна група, термін "(C₂-C₆)алкенільна група" стосується прямих або розгалужених алкенільних груп, що мають від 2 до 6 атомів вуглецю, 45 таких як вінільна група, алілільна група, ізопропенільна група, 1-бутенільна група, 2-бутенільна група, 2-метил-2-пропенільна група, 1-метил-2-пропенільна група, 2-метил-1-пропенільна група, пентенільна група, 1-гексенільна група і 3,3-диметил-1-бутенільна група, і термін "(C₂-C₆)алкінільна група" стосується прямих або розгалужених алкінільних груп, що мають від 2 до 6 атомів вуглецю, таких як етинільна група, 1-пропінільна група, 2-пропінільна група, 1-бутинільна група, 2-бутинільна група, 3-бутинільна група, 3-метил-1-пропінільна група, 2-метил-3-пропінільна група, пентинільна група, 1-гексинільна група, 3-метил-1-бутинільна група і 3,3-диметил-1-бутинільна група.

55 Термін "(C₃-C₈)циклоалкільна група" стосується циклічних алкільних груп, що мають від 3 до 8 атомів вуглецю, таких як циклопропільна група, циклобутильна група, циклопентильна група, циклогексильна група, циклогептильна група і циклооктильна група, і термін "(C₁-C₈)алкокси група" стосується прямих або розгалужених алкокси груп, що мають від 1 до 8 атомів вуглецю, таких як метокси група, етокси група, нормальна пропокси група, ізопропокси група, нормальна 60 бутокси група, вторинна бутокси група, третинна бутокси група, нормальна пентилокси група,

гексилсульфонільна група, ізогексилсульфонільна група і 1,1,2-триметилпропілсульфонільна група.

Вищезгадані "(C₁-C₈)алкільна група", "(C₂-C₈)алкенільна група", "(C₂-C₈)алкінільна група", "(C₃-C₈)циклоалкільна група", "(C₁-C₈)алкокси група", "(C₁-C₈)алкілтіо група", "(C₁-C₈)алкілсульфінільна група" або "(C₁-C₈)алкілсульфонільна група" можуть бути заміщені одним або декількома атомами галогену в здатному до заміщення положенні, і коли кількість атомів галогену для використання при заміщенні становить два або більше, ці атоми галогену можуть бути однаковими або різними. Кожна група, заміщена одним або декількома галогенами, визначається як "галоген(C₁-C₈)алкільна група", "галоген(C₂-C₈)алкенільна група", "галоген(C₂-C₈)алкінільна група", "галоген(C₃-C₈)циклоалкільна група", "галоген(C₁-C₈)алкокси група", "галоген(C₁-C₈)алкілтіо група", "галоген(C₁-C₈)алкілсульфінільна група" або "галоген(C₁-C₈)алкілсульфонільна група".

Вищезгадані "(C₁-C₆)алкільна група", "(C₂-C₆)алкенільна група", "(C₂-C₆)алкінільна група", "(C₃-C₆)циклоалкільна група", "(C₁-C₆)алкокси група", "(C₁-C₆)алкілтіо група", "(C₁-C₆)алкілсульфінільна група" або "(C₁-C₆)алкілсульфонільна група" можуть бути заміщені одним або декількома атомами галогену в здатному до заміщення положенні, і коли кількість атомів галогену для використання при заміщенні становить два або більше, ці атоми галогену можуть бути однаковими або різними. Кожна група, заміщена одним або декількома галогенами, визначається як "галоген(C₁-C₆)алкільна група", "галоген(C₂-C₆)алкенільна група", "галоген(C₂-C₆)алкінільна група", "галоген(C₃-C₆)циклоалкільна група", "галоген(C₁-C₆)алкокси група", "галоген(C₁-C₆)алкілтіо група", "галоген(C₁-C₆)алкілсульфінільна група" або "галоген(C₁-C₆)алкілсульфонільна група".

Вираз "(C₁-C₆)", "(C₂-C₆)", "(C₃-C₆)", "(C₁-C₈)", "(C₂-C₈)", "(C₃-C₈)" і подібні стосуються діапазону чисел атомів вуглецю різних замісників. Вищезгадане визначення застосовне також до групи, до якої приєднаний вищезгаданий замісник, і, наприклад, "(C₃-C₈)циклоалкіл(C₁-C₈)алкільна група" стосується прямої або розгалуженої циклоалкільної групи, що має від 3 до 8 атомів вуглецю, зв'язаної з прямою або розгалуженою алкільною групою, що має від 1 до 8 атомів вуглецю.

Термін "арильна група" стосується ароматичних вуглеводневих груп, що мають від 6 до 10 атомів вуглецю, таких як фенільна група, 1-нафтильна група і 2-нафтильна група.

Термін "ароматична гетероциклічна група" стосується 5-6-членних моноциклічних ароматичних гетероциклічних груп, що мають від 1 до 5 гетероатомів, таких як атом кисню, атом азоту і атом сірки, таких як фурил, тієніл, піридин, піримідин, піридазин, піразин, піроліл, імідазол, піразол, тіазол, ізотіазол, оксазол, ізоксазол, оксадізол, тіадіазол, триазол, тетразол і триазин; і 9-18-членних ароматичних конденсованих гетероциклічних групам, що мають від 1 до 5 гетероатомів, таких як атом кисню, атом азоту і атом сірки, таких як хіноліл, ізохіноліл, хіназол, хіноксаліл, бензофураніл, бензотієніл, бензоксазоліл, бензоізоксазоліл, бензотіазоліл, бензімідазоліл, бензотриазоліл, індоліл, індазоліл, піролопіридиніл, імідазопіридиніл, імідазопіразиніл, піразолопіридиніл, піразолотієніл і піразолотриазиніл.

Термін "насичений азотовмісний аліфатичний гетероцикл" стосується 5-8-членних насичених азотовмісних аліфатичних гетероциклів, що мають щонайменше один (переважно, 1 або 2) атом азоту і, крім того, що необов'язково має від 1 до 2 гетероатомів, таких як атом кисню і атом сірки, таких як піролідин, піперидин, морфолін і піперазин.

Термін "(C₁-C₆)алкілкарбонільна група" стосується алкілкарбонільних груп, що складаються з прямої або розгалуженої алкільної групи, що має від 1 до 6 атомів вуглецю, і карбонільної групи, такої як ацетильна група, пропіонільна група, бутирильна група, ізобутирильна група, нормальна бутилкарбонільна група, ізобутилкарбонільна група, вторинна бутилкарбонільна група, третинна бутилкарбонільна група, нормальна пентилкарбонільна група, ізопентилкарбонільна група, третинна пентилкарбонільна група, неопентилкарбонільна група, 2,3-диметилпропілкарбонільна група, 1-етилпропілкарбонільна група, 1-метилбутилкарбонільна група, 2-метилбутилкарбонільна група, нормальна гексилкарбонільна група, ізогексилкарбонільна група, 2-гексилкарбонільна група, 3-гексилкарбонільна група, 2-метилпентилкарбонільна група, 3-метилпентилкарбонільна група, 1,1,2-триметилпропілкарбонільна група, 3,3-диметилбутилкарбонільна група.

Термін "(C₁-C₆)алкоксикарбонільна група" стосується алкоксикарбонільних груп, що складаються з прямої або розгалуженої алкокси групи, що має від 1 до 6 атомів вуглецю, і карбонільної групи, такої як метоксикарбонільна група, етоксикарбонільна група, нормальна пропоксикарбонільна група, ізопроксикарбонільна група, нормальна бутоксикарбонільна група, вторинна бутоксикарбонільна група, третинна бутоксикарбонільна група, нормальна пентилоксикарбонільна група, ізопентилоксикарбонільна група, третинна

пентилоксикарбонільна група, неопентилоксикарбонільна група, 2,3-диметилпропілоксикарбонільна група, 1-етилпропілоксикарбонільна група, 1-метилбутилоксикарбонільна група, нормальна гексилоксикарбонільна група, ізогексилоксикарбонільна група і 1,1,2-триметилпропілоксикарбонільна група.

5 Термін "три(C₁-C₆)алкілсилільні групи" стосується прямих або розгалужених триалкілсилільних груп, що мають від 1 до 6 атомів вуглецю, таких як триметилсилільна група, триетилсилільна група, третинна бутилдиметилсилільна група, етилдиметилсилільна група, ізопропїлдиметилсилільна група і н-пропїлдиметилсилільна група. У цьому випадку ці алкільні групи можуть бути однаковими або різними.

10 Приклади терміну "(C₁-C₆)алкілендіокси група" включають метилендіокси групу і етилендіокси групу. Дві окси групи в алкілендіокси групі можуть бути приєднані до одного і того ж атома вуглецю або до різних атомів вуглецю азотовмісного аліфатичного гетероциклу.

15 Приклади солі похідного бензimidазолу, представленого загальною формулою (1) за даним винаходом, включають солі неорганічних кислот, такі як гідрохлориди, сульфати, нітрат і фосфати, солі органічних кислот, такі як ацетати, фумарати, малеати, оксалати, метансульфонати, бензолсульфонати, і п-толуолсульфонати, і солі з неорганічною або органічною основою, такою як іон натрію, іон калію, іон кальцію і триметиламоній.

20 Похідне бензimidазолу, представлене загальною формулою (1) за даним винаходом, і його сіль можуть мати один асиметричний центр в структурній формулі, і даний винахід охоплює всі оптичні ізомери і суміші цих ізомерів в будь-якому співвідношенні.

У похідному бензimidазолу, представленому загальною формулою (1) за даним винаходом, або його солі, переважно

25 R являє собою (a1) (C₁-C₈)алкільну групу; (a2) (C₃-C₈)циклоалкільну групу; (a4) галоген(C₁-C₈)алкільну групу; (a7) арильну групу або (a8) арильну групу, що має від 1 до 5 замісників, які можуть бути однаковими або різними і вибрані з (a) атома галогену, (b) (C₁-C₆)алкільної групи, (c) галоген(C₁-C₆)алкільної групи, (d) (C₁-C₆)алкокси групи, (e) галоген(C₁-C₆)алкокси групи, (f) (C₁-C₆)алкілтію групи, (g) галоген(C₁-C₆)алкілтію групи, (h) (C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (i) галоген(C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (j) (C₁-C₆)алкілсульфонільної групи, (k) галоген(C₁-C₆)алкілсульфонільної групи і (l) три(C₁-C₆)алкілсилільної групи, де алкільні групи можуть бути однаковими або різними);

30 R¹ являє собою (b1) (C₁-C₈)алкільну групу; (b2) галоген(C₁-C₈)алкільну групу; (b3) (C₃-C₈)циклоалкільну групу; (b5) (C₃-C₈)циклоалкіл(C₁-C₈)алкільну групу; (b11) арильну групу; (b12) арильну групу, що має від 1 до 5 замісників, які можуть бути однаковими або різними і вибрані з (a) атома галогену, (b) (C₁-C₆)алкільної групи, (c) галоген(C₁-C₆)алкільної групи, (d) (C₁-C₆)алкокси групи, (e) галоген(C₁-C₆)алкокси групи, (f) (C₁-C₆)алкілтію групи, (g) галоген(C₁-C₆)алкілтію групи, (h) (C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (i) галоген(C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (j) (C₁-C₆)алкілсульфонільної групи, (k) галоген(C₁-C₆)алкілсульфонільної групи і (l) три(C₁-C₆)алкілсилільної групи, де алкільні групи можуть бути однаковими або різними); (b13) арил(C₁-C₈)алкільну групу; (b14) арил(C₁-C₆)алкільну групу, що має від 1 до 5 замісників, які можуть бути однаковими або різними і вибрані з (a) атома галогену, (b) (C₁-C₆)алкільної групи, (c) галоген(C₁-C₆)алкільної групи, (d) (C₁-C₆)алкокси групи, (e) галоген(C₁-C₆)алкокси групи, (f) (C₁-C₆)алкілтію групи, (g) галоген(C₁-C₆)алкілтію групи, (h) (C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (i) галоген(C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (j) (C₁-C₆)алкілсульфонільної групи, (k) галоген(C₁-C₆)алкілсульфонільної групи і (l) три(C₁-C₆)алкілсилільної групи, де алкільні групи можуть бути однаковими або різними); (b17) (C₁-C₈)алкоксі(C₁-C₈)алкільну групу; (b18) (C₁-C₈)алкілтію(C₁-C₈)алкільну групу або (b20) (C₁-C₈)алкілсульфоніл(C₁-C₈)алкільну групу,

45 X являє собою O, S, SO, SO₂ або NR², де R² являє собою (C₁-C₆)алкільну групу, (C₁-C₆)алкілкарбонільну групу або (C₁-C₆)алкілсульфонільну групу. Альтернативно, R² може бути приєднаний до R¹ з утворенням разом з атомом азоту, до якого приєднаний R², 5-8-членний насичений азотовмісний аліфатичний гетероцикл, що необов'язково має від 1 до 5 замісників, де замісник вибраний з (C₁-C₆)алкільної групи, (C₁-C₆)алкілкарбонільної групи, (C₁-C₆)алкоксикарбонільної групи, (C₁-C₆)алкілсульфонільної групи, галоген(C₁-C₆)алкілсульфонільної групи і (C₁-C₆)алкілендіокси групи, де дві окси групи в алкілендіокси групі можуть бути приєднані до одного і того ж атома вуглецю або до різних атомів вуглецю азотовмісного аліфатичного гетероциклу,

55 Y може бути однаковим або різним і являє собою (c1) атом галогену, m означає 0 або 1,

Z може бути однаковим або різним і являє собою (d1) атом галогену або (d2) (C₁-C₈)алкільну групу,

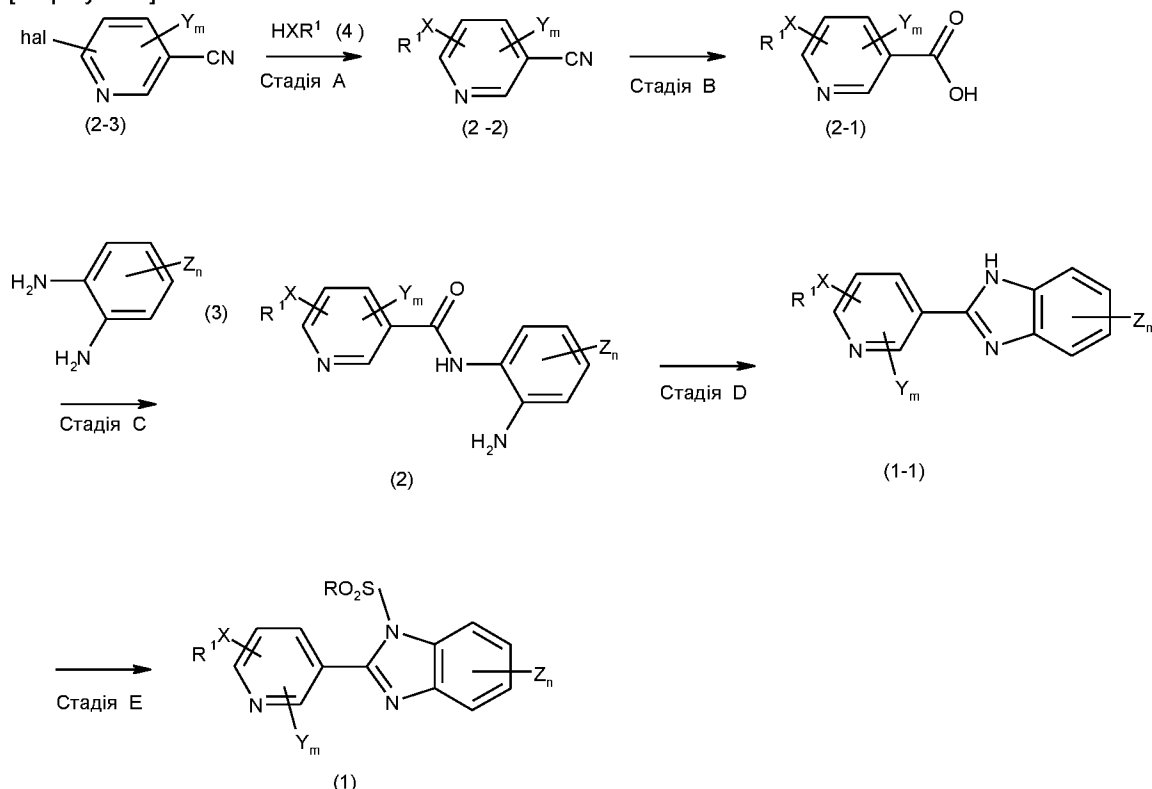
60 n означає 0, 1 або 2.

Крім того, переважно, R являє собою (a1) (C₁-C₆)алкільну групу, R¹ являє собою (b1) галоген(C₁-C₆)алкільну групу, і m і n означають 0.

5 Похідне бензimidазолу, представлене загальною формулою (1) за даним винаходом, або його сіль може бути отримане, наприклад, способом отримання, показаним нижче, але даний винахід цим не обмежується.

Спосіб отримання 1

[Формула 2]



де R, R¹, X, Y, Z, m і n є такими, як вказано вище, і hal являє собою атом галогену.

10 Спосіб отримання на стадії [A]

Сполука нітрилу, представлена загальною формулою (2-2), може бути отримана шляхом взаємодії сполуки, представленної загальною формулою (2-3), і сполуки, представленної загальною формулою (4), в присутності основи і інертного розчинника.

15 Приклади основи, що використовується в даній реакції, включають неорганічні основи, такі як гідроксид натрію, гідроксид калію, карбонат натрію, карбонат калію, гідрокарбонат натрію і гідрокарбонат калію, ацетати, такі як ацетат натрію і ацетат калію, алкоксиди лужних металів, такі як трет-бутоксид калію, метоксид натрію і етоксид натрію; третинні аміни, такі як триетиламін, діізопропілетиламін і 1,8-дізабіцикло[5,4,0]ундец-7-ен, азотовмісні ароматичні сполуки, такі як піридин і диметиламінопіридин, і ці основи використовуються в кількості, що становить звичайно діапазон від 1 до 10 кратних мольних кількості відносно сполуки, представленної загальною формулою (4).

20 Прикладом використуваного інертного розчинника в даній реакції, може бути будь-який розчинник, якщо він не перешкоджає протіканню даної реакції, і приклади можуть включати інертні розчинники, такі як ароматичні вуглеводні, наприклад, бензол, толуол і ксилол, галогеновані вуглеводні, такі як метиленхлорид, хлороформ і тетрахлорид вуглецю; галогеновані ароматичні вуглеводні, такі як хлорбензол і дихлорбензол, прямі або циклічні прості ефіри, такі як діетиловий ефір, метиловий трет-бутиловий ефір, діоксан і тетрагідрофуран, складні ефіри, такі як етилацетат, аміди, такі як диметилформамід і диметилацетамід, кетони, такі як ацетон і метилетилкетон, полярні розчинники, такі як диметилсульфоксид, 1,3-диметил-2-імідазолідинон і N-метилпіролідон (NMP), і один з цих інертних розчинників може бути використаний окремо, або два або більше з них можуть бути використані в суміші.

25 Дана реакція є еквімолярною реакцією, і тому кожний реагент використовується в однаковій кількості мольів, але будь-який з реагентів також може бути використаний в надлишку. 30 Температура реакції може знаходитися в діапазоні від кімнатної температури до точки кипіння 35

використовуваного інертного розчинника, а час реакції варіюється залежно від масштабу реакції і температури реакції, але може знаходитися в діапазоні від декількох хвилин до 48 годин.

Після завершення реакції бажану сполуку виділяють звичайним способом з реакційної системи, що містить бажану сполуку, і бажана сполука, якщо необхідно, може бути отримана шляхом очищення перекристалізацією або колонковою хроматографією. Альтернативно, наступна стадія може бути здійснена без виділення проміжного продукту з реакційної системи.

Стадія [B] способу отримання

Сполука карбонової кислоти, представлена загальною формулою (2-1), може бути отримана взаємодією нітрильної сполуки, представленої загальною формулою (2-2), в присутності основи і інертного розчинника.

Приклади основи, що використовується в даній реакції, включають неорганічні основи, такі як гідроксид натрію, гідроксид калію, карбонат натрію, карбонат калію, гідрокарбонат натрію і гідрокарбонат калію, ацетати, такі як ацетат натрію і ацетат калію, і ці основи використовуються в кількості звичайно в діапазоні від 1 до 10 кратного числа молів відносно сполуки, представленої загальною формулою (2-2).

Прикладами використовуюваного інертного розчинника в даній реакції, може бути будь-який розчинник, якщо він не перешкоджає протіканню даної реакції, і приклади можуть включати інертні розчинники, такі як ароматичні вуглеводні, наприклад, бензол, толуол і ксилол, галогеновані ароматичні вуглеводні, такі як хлорбензол і дихлорбензол, прямий або циклічні прості ефіри, такі як діетиловий ефір, метиловий трет-бутиловий ефір, діоксан і тетрагідрофуран, аміді, такі як диметилформамід і диметилацетамід, кетони, такі як ацетон і метилетилкетон, полярні розчинники, такі як диметилсульфоксид і 1,3-диметил-2-імідазолідинон, спирти, такі як метанол, етанол, пропанол, ізопропіловий спирт і вода, і один з цих інертних розчинників може бути використаний окремо, або два або більше з них можуть бути використані в суміші.

Після завершення реакції бажану сполуку виділяють звичайним способом з реакційної системи, що містить бажану сполуку, і бажана сполука може бути отримана шляхом очищення перекристалізацією або колонковою хроматографією, якщо необхідно.

Стадія [C] способу отримання

Сполука аміді, представлена загальною формулою (2), може бути отримана взаємодією сполуки карбонової кислоти, представленої загальною формулою (2-1), і діаміно сполуки, представленої загальною формулою (3), в присутності конденсуючого агента, основи і інертного розчинника.

Приклади конденсуючого агента, що використовується в даній реакції, можуть включати діетил фосфороціанідат (DEPC), карбонілдіімідазол (CDI), 1,3-дициклогексилкарбодіімід (DCC), 1-етил-3-(3-диметиламінопропіл)карбодіімід (EDC) або його гідрохлорид, складні ефіри хлоркарбонової кислоти і 2-хлор-1-метилпіридиний йодид, і ці агенти використовуються в кількості, прийнятній для нанесення, вибраній з діапазону від 1 до 1,5 кратного числа молів відносно сполуки, представленої загальною формулою (2-1).

Приклади основи, що використовується в даній реакції, включають неорганічні основи, такі як гідроксид натрію, гідроксид калію, карбонат натрію, карбонат калію, гідрокарбонат натрію і гідрокарбонат калію, ацетати, такі як ацетат натрію і ацетат калію, алкоксиди лужних металів, такий як трет-бутоксид калію, метоксид натрію і етоксид натрію; третинні аміни, такі як триетиламін, діізопропілетиламін і 1,8-дізабіцикло[5,4,0]ундец-7-ен, азотовмісні ароматичні сполуки, такі як піридин і диметиламінопіридин (DMAP), і ці основи використовуються в кількості, прийнятній для нанесення, звичайно в діапазоні від 0,1 до 10 кратного числа молів відносно сполуки, представленої загальною формулою (2-1).

Прикладом використовуюваного інертного розчинника в даній реакції, може бути будь-який розчинник, якщо він не перешкоджає протіканню даної реакції, і приклади можуть включати інертні розчинники, такі як ароматичні вуглеводні, наприклад, бензол, толуол і ксилол, галогеновані вуглеводні, такі як метиленхлорид, хлороформ і тетрахлорид вуглецю; галогеновані ароматичні вуглеводні, такі як хлорбензол і дихлорбензол, прямий або циклічні прості ефіри, такі як діетиловий ефір, метиловий трет-бутиловий ефір, діоксан і тетрагідрофуран, складні ефіри, такі як етилацетат, аміді, такі як диметилформамід і диметилацетамід, кетон, такі як ацетон і метилетилкетон, полярні розчинники, такі як диметилсульфоксид, 1,3-диметил-2-імідазолідинон, і азотовмісні ароматичні сполуки, такі як піридин, і один з цих інертних розчинників може бути використаний окремо, або два або більше з них можуть бути використані в суміші.

Дана реакція є еквімолярною реакцією, і тому кожний реагент використовується в однаковій кількості молів, але будь-який з реагентів також може бути використаний в надлишку.

Температура реакції може знаходитися в діапазоні від кімнатної температури до точки кипіння використуваного інертного розчинника, а час реакції варіюється залежно від масштабу реакції і температури реакції, але може знаходитися в діапазоні від декількох хвилин до 48 годин.

5 Після завершення реакції бажану сполуку виділяють звичайним способом з реакційної системи, що містить бажану сполуку, і бажана сполука, якщо необхідно, може бути отримана шляхом очищення перекристалізацією або колонковою хроматографією. Альтернативно, наступна стадія може бути здійснена без виділення проміжного продукту з реакційної системи.

Стадія способу отримання [D]

10 Похідне бензimidазолу, представлене загальною формулою (1-1), може бути отримане взаємодією amidної сполуки, представлені загальною формулою (2), в присутності кислоти і інертного розчинника.

15 Приклади кислоти, що використовується в реакції, можуть включати неорганічні кислоти, такі як хлористоводнева кислота, сірчана кислота, азотна кислота, органічні кислоти, така як мурашина кислота, оцтова кислота, пропіонова кислота, трифтороцтова кислота і бензойна кислота, сульфонові кислоти, такі як метансульфонова кислота, трифторметансульфонова кислота і пара-толуолсульфонова кислота, і фосфорні кислоти, і ці кислоти використовуються в прийнятній кількості, відповідним чином вибраний з діапазону від 0,01 до 10-кратної кількості молів відносно amidної сполуки, представлені загальною формулою (1-1).

20 Прикладом використуваного інертного розчинника в даній реакції, може бути будь-який розчинник, якщо він не перешкоджає протіканню даної реакції, і приклади можуть включати інертні розчинники, такі як ароматичні вуглеводні, наприклад, бензол, толуол і ксилол, галогеновані вуглеводні, такі як метиленхлорид, хлороформ і тетрахлорид вуглецю; галогеновані ароматичні вуглеводні, такі як хлорбензол і дихлорбензол, прямий або циклічні прості ефіри, такі як діетиловий ефір, метиловий трет-бутиловий ефір, діоксан і тетрагідрофуран, складні ефіри, такі як етилацетат, аміді, такі як диметилформамід і диметилацетамід, кетони, такі як ацетон і метилетилкетон, полярні розчинники, такі як диметилсульфоксид, 1,3-диметил-2-имідазолідинон і N-метилпіролідон (NMP), і один з цих інертних розчинників може бути використаний окремо, або два або більше з них можуть бути використані в суміші.

30 Після завершення реакції бажану сполуку виділяють звичайним способом з реакційної системи, що містить бажану сполуку, і бажана сполука, якщо необхідно, може бути отримана шляхом очищення перекристалізацією або колонковою хроматографією.

Стадія способу отримання [E]

35 Похідне бензimidазолу, представлене загальною формулою (1), може бути отримано взаємодією похідного бензimidазолу, представленого загальною формулою (1-1), і відповідним сульфонілхлориду в присутності інертного розчинника і основи.

40 Приклади основи, що використовується в даній реакції, включають неорганічні основи, такі як гідроксид натрію, гідроксид калію, карбонат натрію, карбонат калію, гідрокарбонат натрію, гідрокарбонат калію і гідрид натрію, ацетати, такі як ацетат натрію і ацетат калію, алкоксиди лужних металів, такий як трет-бутоксид калію, метоксид натрію і етоксид натрію; третинні аміні, такі як триетиламін, діізопропілетиламін і 1,8-діазабіцикло[5,4,0]ундец-7-ен, азотовмісні ароматичні сполуки, такі як піридин і диметиламінопіридин, і ці основи використовуються в кількості, прийнятній для нанесення, звичайно в діапазоні від 1 кратного до 10 кратного числа молів відносно сполуки, представлені загальною формулою (1-1).

45 Прикладом використуваного інертного розчинника в даній реакції, може бути будь-який розчинник, якщо він не перешкоджає протіканню даної реакції, і приклади можуть включати ароматичні вуглеводні, такі як бензол, толуол і ксилол, галогеновані вуглеводні, такі як метиленхлорид, хлороформ і тетрахлорид вуглецю; галогеновані ароматичні вуглеводні, такі як хлорбензол і дихлорбензол, прямий або циклічні прості ефіри, такі як діетиловий ефір, тетрагідрофуран (ТГФ) і діоксан, і один з цих інертних розчинників може бути використаний окремо, або два або більше з них можуть бути використані в суміші.

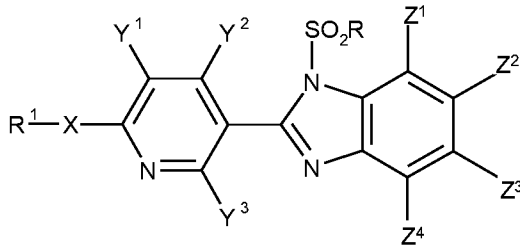
50 Сульфоніл хлорид, що використовується в даній реакції, спеціально не обмежується, якщо він є сульфонілхлоридом, представленим формулою: RSO_2Cl (R є таким, як описано вище). Дана реакція є еквімолярною реакцією, і тому кожний реагент використовується в однаковій кількості молів, але будь-який з реагентів також може бути використаний в надлишку.

55 Температура реакції в даній реакції може звичайно знаходитися в діапазоні від приблизно 0 °C до точки кипіння використуваного розчинника, і час реакції є змінним, при цьому змінюється залежно від масштабу реакції і температури реакції, але в той же час може бути відповідним чином вибраний з діапазону від декількох хвилин до 48 годин.

Після завершення реакції бажану сполуку виділяють звичайним способом, і бажану сполуку, якщо необхідно, отримують очищенням шляхом перекарystalізації, відгонки або колонкової хроматографії.

Далі в цьому документі нижче представлені конкретні приклади сполуки за даним винаходом. У таблиці нижче Me стосується метильної групи, Et стосується етильної групи, n-Pr стосується нормальної пропільної групи, ізо-Pr стосується ізопропільної групи, n-Bu стосується нормальної бутильної групи, трет-Бу стосується третинної бутильної групи, n-Pen стосується нормальної пентильної групи, n-Hex стосується нормальної гексильної групи, ц-Pr стосується циклопропільної групи, ц-Pen стосується циклопентильної групи, ц-Hex стосується циклогексильної групи, ц-Нер стосується циклогептильної групи, Ac стосується ацетильної групи, pTol стосується п-толільної групи, Ph стосується фенільної групи, Bn стосується бензильної групи і TMS стосується триметилсилільної групи. Фізична властивість покаже точки плавлення (°C) або ¹H-ЯМР. Дані ¹H-ЯМР показані в таблиці 8.

[Формула 3]



(1a)

[Таблиця 1]

Таблиця 1

Номер спол.	R ¹	X	Y ¹	Y ²	Y ³	Z ¹	Z ²	Z ³	Z ⁴	R	Фізична властивість
1-1	CF ₃ CH ₂	O	H	H	H	H	H	H	H	Et	99-101
1-2	CF ₃ CF ₂ CH ₂	O	H	H	H	H	H	H	H	Et	105-106
1-3	CF ₃ CF ₂ CH ₂	O	H	H	H	H	H	H	H	Me	170-172
1-4	CF ₃ CF ₂ CH ₂	O	H	H	H	H	H	H	H	n-Pr	89-90
1-5	CF ₃ CF ₂ CH ₂	O	H	H	H	H	H	H	H	n-Bu	86-87
1-6	CF ₃ CF ₂ CH ₂	O	H	H	H	H	H	H	H	ц-Pr	97-98
1-7	CF ₃ CF ₂ CH ₂	O	H	H	H	H	H	H	H	CF ₃	104-106
1-8	CF ₃ CF ₂ CH ₂	O	H	H	H	H	H	H	H	pTol	133-135
1-9	CF ₃ CF ₂ CH ₂	O	H	H	H	H	H	Br	H	Et	154-159
1-10	CF ₃ CF ₂ CH ₂	O	H	H	H	H	Br	H	H	Et	130-131
1-11	CF ₃ CF ₂ CH ₂	O	H	H	H	H	H	H	Br	Et	
1-12	CF ₃ CF ₂ CH ₂	O	H	H	H	H	H	Cl	H	Et	159-161
1-13	CF ₃ CF ₂ CH ₂	O	H	H	H	H	Cl	H	H	Et	119-120
1-14	CF ₃ CF ₂ CH ₂	O	H	H	H	H	Cl	Cl	H	Et	177-178
1-15	CF ₃ CF ₂ CH ₂	O	H	H	H	H	Br	Br	H	Et	184-186
1-16	CF ₃ CF ₂ CH ₂	O	H	H	H	H	Br	H	Br	Et	
1-17	CF ₃ CF ₂ CH ₂	O	H	H	H	H	Me	Me	H	Et	148-149
1-18	CF ₃ CF ₂ CH ₂	O	Cl	H	H	H	H	H	H	Et	88-90
1-19	CHF ₂ CF ₂ CH ₂	O	H	H	H	H	H	H	H	Et	77-78
1-20	CF ₃ CF ₂ CF ₂ CH ₂	O	H	H	H	H	H	H	H	Et	99-101
1-21	CF ₃ CF ₂ CF ₂ CH ₂	O	H	H	H	H	H	Br	H	Et	137-138
1-22	CF ₃ CF ₂ CF ₂ CH ₂	O	H	H	H	H	Br	H	H	Et	110-112
1-23	(CF ₃) ₂ CH	O	H	H	H	H	H	H	H	Et	102-104
1-24	CF ₃ CHF ₂ CF ₂ CH ₂	O	H	H	H	H	H	H	H	Et	93-94
1-25	CF ₃ CH ₂	NMe	H	H	H	H	H	H	H	Et	

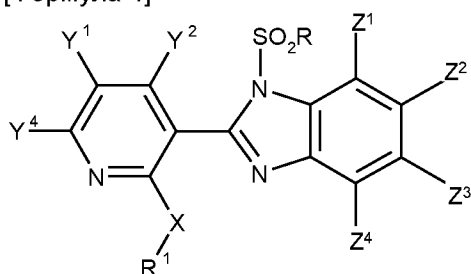
[Таблиця 2]

20

Таблиця 2

Номер спол.	R ¹	X	Y ¹	Y ²	Y ³	Z ¹	Z ²	Z ³	Z ⁴	R	Фізична властивість
1-26	CF ₃ CH ₂	NAc	H	H	H	H	H	H	H	Et	
1-27	CF ₃ CH ₂	NSO ₂ Et	H	H	H	H	H	H	H	Et	
1-28	CF ₃ CF ₂ CH ₂	NMe	H	H	H	H	H	H	H	Et	
1-29	CF ₃ CF ₂ CH ₂	NAc	H	H	H	H	H	H	H	Et	
1-30	CF ₃ CF ₂ CH ₂	NSO ₂ Et	H	H	H	H	H	H	H	Et	
1-31	CF ₃	S	H	H	H	H	H	H	H	Et	
1-32	CF ₃	SO	H	H	H	H	H	H	H	Et	
1-33	CF ₃	SO ₂	H	H	H	H	H	H	H	Et	
1-34	CF ₃ CH ₂	S	H	H	H	H	H	H	H	Et	
1-35	CF ₃ CH ₂	SO	H	H	H	H	H	H	H	Et	
1-36	CF ₃ CH ₂	SO ₂	H	H	H	H	H	H	H	Et	
1-37	CF ₃ CF ₂ CH ₂	S	H	H	H	H	H	H	H	Et	
1-38	CF ₃ CF ₂ CH ₂	SO	H	H	H	H	H	H	H	Et	
1-39	CF ₃ CF ₂ CH ₂	SO ₂	H	H	H	H	H	H	H	Et	
1-40	4-CF ₃ SPh	O	H	H	H	H	H	H	H	Et	135-136
1-41	4-CF ₃ SOPh	O	H	H	H	H	H	H	H	Et	120-121
1-42	4-CF ₃ SO ₂ Ph	O	H	H	H	H	H	H	H	Et	122-123
1-43	4-CF ₃ SBn	O	H	H	H	H	H	H	H	Et	118-119
1-44	4-CF ₃ SOBn	O	H	H	H	H	H	H	H	Et	110-111
1-45	CF ₃ CF ₂ CH ₂	O	H	H	H	H	H	H	H	CH ₂ Cl	113-115
1-46	4-CF ₃ OPh	O	H	H	H	H	H	H	H	Et	137-138
1-47	n-Bu	O	H	H	H	H	H	H	H	Et	84-85
1-48	n-Pen	O	H	H	H	H	H	H	H	Et	68-69
1-49	n-Hex	O	H	H	H	H	H	H	H	Et	67-68
1-50	ц-Pen	O	H	H	H	H	H	H	H	Et	81-82
1-51	ц-Нер	O	H	H	H	H	H	H	H	Et	103-104

[Формула 4]



(1b)

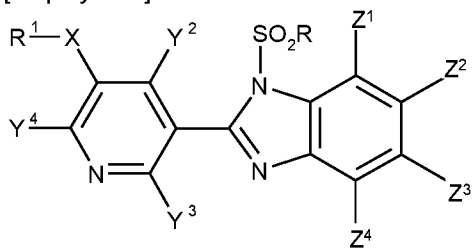
[Таблиця 3]

5

Таблиця 3

Номер сполуки	R ¹	X	Y ¹	Y ²	Y ⁴	Z ¹	Z ²	Z ³	Z ⁴	R	Фізична властивість
2-1	CF ₃ CF ₂ CH ₂	O	H	H	H	H	H	H	H	Et	ЯМР

[Формула 5]



(1c)

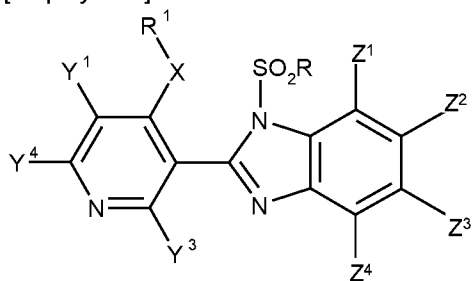
[Таблиця 4]

5

Таблиця 4

Номер сполуки	R ¹	X	Y ²	Y ³	Y ⁴	Z ¹	Z ²	Z ³	Z ⁴	R	Фізична властивість
3-1	CF ₃ CF ₂ CH ₂	O	H	H	H	H	H	H	H	Et	93-94

[Формула 6]



(1d)

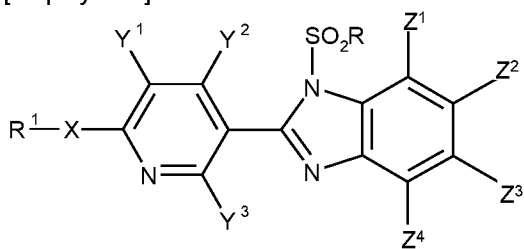
[Таблиця 5]

10

Таблиця 5

Номер сполуки	R ¹	X	Y ¹	Y ³	Y ⁴	Z ¹	Z ²	Z ³	Z ⁴	R	Фізична властивість
4-1	CF ₃ CF ₂ CH ₂	O	H	H	H	H	H	H	H	Et	

[Формула 7]



(1a)

[Таблиця 6]

15

Таблиця 6

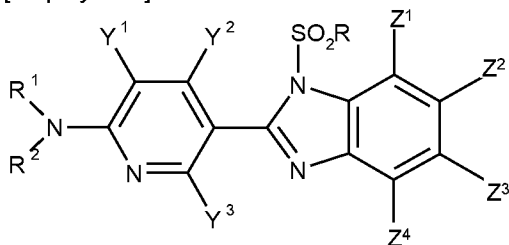
Номер сполуки	R ¹	X	Y ¹	Фізична властивість
5-1	n-Pr	O	H	90-91
5-2	ізо-Pr	O	H	105-106

Таблиця 6

Номер сполуки	R ¹	X	Y ¹	Фізична властивість
5-3	ц-Hex	O	H	124-125
5-4	трет-BuCH ₂ CH ₂	O	H	136-137
5-5	CH ₃ OCH ₂ CH ₂	O	H	111-112
5-6	CH ₃ SCH ₂ CH ₂	O	H	68-69
5-7	CH ₃ SO ₂ CH ₂ CH ₂	O	H	152-153
5-8	4-TMSPH	O	H	147-149
5-9	CF ₃ CH ₂	O	Cl	102-105
5-10	CHF ₂ CF ₂ CH ₂	O	Cl	98-99
5-11	CF ₃ CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₂ CH ₂ CH ₂	O	H	86-87
5-12	CHF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₂ CH ₂	O	H	77-78
5-13	Me	S	H	137-138
5-14	н-Pr	S	H	110-111
5-15	н-Pr	SO	H	118-119
5-16	н-Pr	SO ₂	H	134-135
5-17	н-Bu	S	H	99-100
5-18	ц-Pen	S	H	135-136
5-19	ц-Hex	S	H	158-159
5-20	ц-PrCH ₂	S	H	125-126
5-21	Bn	S	H	105-106
5-22	Bn	SO	H	ЯМР
5-23	Bn	SO ₂	H	ЯМР
5-24	н-Bu	N(н-Bu)	H	102-103
5-25	н-Bu	NMe	H	ЯМР

У формулі (1a) R являє собою етильну групу, Y², Y³, Z¹, Z², Z³ і Z⁴, кожний, являють собою атом водню.

[Формула 8]



5

[Таблиця 7]

Таблиця 7

Номер сполуки	N(R ¹)R ²	Y ¹	Фізична властивість
6-1		H	ЯМР
6-2		H	ЯМР
6-3		H	ЯМР

У формулі (1а-1) R являє собою етильну групу, Y², Y³, Z¹, Z², Z³ і Z⁴, кожний, являють собою атом водню.

[Таблиця 8]

Таблиця 8

Номер сполуки	Дані ¹ H-ЯМР (CDCl ₃)
2-1	8,33 (дд, 1H), 7,97-7,91 (м, 1H), 7,89-7,81 (м, 2H), 7,50-7,43 (м, 2H), 7,16 (дд, 1H), 4,89 (шир, 2H), 3,32 (кв, 2H), 1,21 (т, 3H)
5-22	9,02 (м, 1H), 8,13 (дд, 1H), 8,01 (м, 1H), 7,88 (м, 1H), 7,70 (дд, 1H), 7,52 (м, 2H), 7,25 (м, 3H), 4,43 (д, 1H), 4,17 (д, 1H), 3,17 (кв, 2H), 1,08 (т, 3H)
5-23	9,16 (м, 1H), 8,20 (дд, 1H), 8,01 (м, 1H), 7,91 (м, 2H), 7,53 (м, 2H), 7,28 (м, 3H), 7,23 (м, 2H), 4,69 (с, 2H), 3,22 (кв, 2H), 1,06 (т, 3H)
5-25	8,55 (д, 1H), 8,00 (м, 1H), 7,85 (дд, 1H), 7,80 (дд, 1H), 7,40 (м, 2H), 6,53 (д, 1H), 3,58 (т, 2H), 3,13 (м, 5H), 1,62 (м, 2H), 1,37 (м, 2H), 1,04 (т, 3H), 0,97 (т, 3H)
6-1	8,56 (д, 1H), 7,99 (дд, 1H), 7,85 (дд, 1H), 7,79 (дд, 1H), 7,40 (м, 2H), 6,68 (д, 1H), 3,66 (м, 4H), 3,11 (кв, 2H), 1,67 (м, 5H), 1,51 (т, 1H), 1,04 (т, 3H)
6-2	8,57 (м, 1H), 7,99 (м, 1H), 7,88 (дд, 1H), 7,80 (м, 1H), 7,41 (м, 2H), 6,72 (д, 1H), 4,02 (с, 4H), 3,82 (т, 4H), 3,12 (кв, 2H), 1,80 (т, 4H), 1,04 (т, 3H)
6-3	8,57 (д, 1H), 8,00 (м, 1H), 7,88 (дд, 1H), 7,80 (м, 1H), 7,42 (м, 2H), 6,70 (д, 1H), 4,36 (м, 2H), 4,16 (кв, 2H), 3,12 (м, 4H), 2,59 (м, 1H), 2,01 (м, 2H), 1,79 (м, 2H), 1,28 (т, 3H), 1,04 (т, 3H)

5

Сільськогосподарський і садівничий інсектицидний і акарицидний засіб, що містить похідне бензimidазолу, представлене загальною формулою (1) за даним винаходом, або його сіль як активний інгредієнт, підходить для боротьби з різними шкідниками, які можуть ушкоджувати рис-падді, фруктові дерева, овочі, інші культури і декоративні квіткові рослини. Цільовими шкідниками є, наприклад, шкідники сільськогосподарства і лісу, шкідники садових культур, шкідники зерна, що зберігається, шкідники, які погіршують санітарний стан рослинності, інші шкідники, такі як нематоди або кліщі і т. д.

Приклади вищезгаданих шкідників або нематод включають наступні.

Приклади видів роду Lepidoptera включають *Parasa consocia*, *Anomis mesogona*, *Papilio xuthus*, *Matsumuraeses azukivora*, *Ostrinia scapulalis*, *Spodoptera exempta*, *Hyphantria cunea*, *Ostrinia furnacalis*, *Pseudaletia separata*, *Tinea translucens*, *Bactra furfurana*, *Parnara guttata*, *Marasmia exigua*, *Parnara guttata*, *Sesamia inferens*, *Brachmia triannulella*, *Monema flavescens*, *trichoplusia ni*, *Pleuroptya ruralis*, *Cystidia couaggaria*, *Lampides boeticus*, *Cephonodes hylas*, *Helicoverpa armigera*, *Phalerodonta manleyi*, *Eumeta japonica*, *Pieris brassicae*, *Malacosoma neustria testacea*, *Stathmopoda masinissa*, *Cuphodes diospyrosella*, *Archips xylosteanus*, *Agrotis segetum*, *Tetramoera schistaceana*, *Papilio machaon hippocrates*, *Endoclyta sinensis*, *Lyonetia prunifoliella*, *Phyllonorycter ringoneella*, *Cydia kurokoi*, *Eucoenogenes aestuosa*, *Lobesia botrana*, *Latoia sinica*, *Euzophera batangensis*, *Phalonidia mesotypa*, *Spilosoma imparilis*, *Glyphodes pyloalis*, *Olethreutes mori*, *Tineola bisselliella*, *Endoclyta excrescens*, *Nemapogon granellus*, *Synanthedon hector*, *Cydia pomonella*, *Plutella xylostella*, *Cnaphalocrocis medinalis*, *Sesamia calamistis*, *Scirpophaga incertulas*, *Pediasia teterrellus*, *Phthorimaea operculella*, *Stauropus fagi persimilis*, *Etiella zinckenella*, *Spodoptera exigua*, *Palpifer sexnotata*, *Spodoptera mauritia*, *Scirpophaga innotata*, *Xestia c-nigrum*, *Spodoptera depravata*, *Ephestia kuehniella*, *Angerona prunaria*, *Clostera anastomosis*, *Pseudoplusia includens*, *Matsumuraeses falcana*, *Helicoverpa assulta*, *Autographa nigrisigna*, *Agrotis ipsilon*, *Euproctis pseudoconspersa*, *Adoxophyes orana*, *Caloptilia theivora*, *Homona magnanima*, *Ephestia elutella*, *Eumeta minuscula*, *Clostera anachoreta*, *Heliothis maritima*, *Sparganothis pilleriana*, *Busseola fusca*, *Euproctis subflava*, *Biston robustum*, *Heliothis zea*, *Aedia leucomelas*, *Narosoideus flavidorsalis*, *Viminia rumicis*, *Bucculatrix pyrivorella*, *Grapholita molesta*, *Spulerina astaurota*, *Ectomyeloides pyrivorella*, *Chilo suppressalis*, *Acrolepiopsis sapporensis*, *Plodia interpunctella*, *Hellula undalis*, *Sitotroga cerealella*, *Spodoptera litura*, види родини Tortricidae (*Eucosma aporema*), *Acleris comariana*, *Scopelodes contractus*, *Orgyia thyellina*, *Spodoptera frugiperda*, *Ostrinia zaguliaevi*, *Naranga aenescens*, *Andraca bipunctata*, *Paranthrene regalis*, *Acosmeryx castanea*, *Phyllocnistis toparcha*, *Endopiza viteana*, *Eupoecillia ambiguella*, *Anticarsia gemmatalis*, *Cnephasia cinereipalpana*, *Lymantria dispar*, *Dendrolimus spectabilis*, *Leguminivora glycinivorella*, *Maruca testulalis*, *Matsumuraeses phaseoli*, *Caloptilia soyella*, *Phyllocnistis citrella*, *Omiodes indicata*, *Archips fuscocupreanus*, *Acanthoplusia agnata*, *Bambalina sp.*, *Carposina niponensis*, *Conogethes punctiferalis*, *Synanthedon sp.*, *Lyonetia clerkella*, *Papilio helenus*, *Colias*

erate poliographus, *Phalera flavescens*, види родини Pieridae, такі як *Pieris rapae crucivora* і *Pieris rapae*, *Euproctis similis*, *Acrolepiopsis suzukiella*, *Ostrinia nubilalis*, *Mamestra brassicae*, *Ascotis selenaria*, *Phtheochroides clandestina*, *Hoshinoa adumbratana*, *Odonestis pruni japonensis*, *triaena intermedia*, *Adoxophyes orana fasciata*, *Grapholita inopinata*, *Spilonota ocellana*, *Spilonota lechriaspis*, *Illiberis pruni*, *Argyresthia conjugella*, *Caloptilia zachrysa*, *Archips breviplicanus*, *Anomis flava*, *Pectinophora gossypiella*, *Notarcha derogata*, *Diaphania indica*, *Heliothis virescens* і *Earias cupreoviridis*.

Приклади видів роду Hemiptera включають *Nezara antennata*, *Stenotus rubrovittatus*, *Graphosoma rubrolineatum*, *trigonotylus coelestialium*, *Aeschynteles maculatus*, *Creontiades pallidifer*, *Dysdercus cingulatus*, *Chrysomphalus ficus*, *Aonidiella aurantii*, *Graptopsaltria nigrofuscata*, *Blissus leucopterus*, *Icerya purchasi*, *Piezodorus hybneri*, *Lagynotomus elongatus*, *Thaia subrufa*, *Scotinophara lurida*, *Sitobion ibarae*, *Stariodes iwasaki*, *Aspidiotus destructor*, *Taylorilygus pallidulus*, *Myzus mumecola*, *Pseudaulacaspis prunicola*, *Acyrtosiphon pisum*, *Anacanthocoris striicornis*, *Ectometopterus micantulus*, *Eysarcoris lewisi*, *Molipteryx fuliginosa*, *Cicadella viridis*, *Rhopalosiphum rufiabdominalis*, *Saissetia oleae*, *trialeurodes vaporariorum*, *Aguriahana quercus*, *Lygus spp.*, *Euceraphis punctipennis*, *Andaspis kashicola*, *Coccus pseudomagnoliarum*, *Cavelerius saccharivorus*, *Galeatus spinifrons*, *Macrosiphoniella sanborni*, *Aonidiella citrina*, *Halyomorpha mista*, *Stephanitis fasciicarina*, *Trioza camphorae*, *Leptocorisa chinensis*, *Trioza quercicola*, *Uhlerites latius*, *Erythroneura comes*, *Paromius exiguus*, *Duplaspidotus claviger*, *Nephotettix nigropictus*, *Halticillus insularis*, *Perkinsiella saccharicida*, *Psylla malivorella*, *Anomomeura mori*, *Pseudococcus longispinis*, *Pseudaulacaspis pentagona*, *Pulvinaria kuwacola*, *Apolygus lucorum*, *Togo hemipterus*, *Toxoptera aurantii*, *Saccharicoccus sacchari*, *Geoica lucifuga*, *Numata muii*, *Comstockaspis perniciosa*, *Unaspis citri*, *Aulacorthum solani*, *Eysarcoris ventralis*, *Bemisia argentifolii*, *Cicadella spectra*, *Aspidiotus hederiae*, *Liorhyssus hyalinus*, *Calophya nigridorsalis*, *Sogatella furcifera*, *Megoura crassicauda*, *Brevicoryne brassicae*, *Aphis glycines*, *Leptocorisa oratorius*, *Nephotettix virescens*, *Uroeucon formosanum*, *Cyrtopeltis tenuis*, *Bemisia tabaci*, *Lecanium persicae*, *Parlatoria theae*, *Pseudaonidia paeoniae*, *Empoasca onukii*, *Plautia stali*, *Dysaphis tulipae*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Stephanitis pyrioides*, *Ceroplastes ceriferus*, *Parlatoria camelliae*, *Apolygus spinolai*, *Nephotettix cincticeps*, *Glaucias subpunctatus*, *Orthotylus flavosparsus*, *Rhopalosiphum maidis*, *Peregrinus maidis*, *Eysarcoris parvus*, *Cimex lectularius*, *Psylla abietis*, *Nilaparvata lugens*, *Psylla tobirae*, *Eurydema rugosum*, *Schizaphis piricola*, *Psylla pyricola*, *Parlatoreopsis pyri*, *Stephanitis nashi*, *Dysmicoccus wistariae*, *Lepholeucaspis japonica*, *Sappaphis piri*, *Lipaphis erysimi*, *Neotoxoptera formosana*, *Rhopalosiphum nymphaeae*, *Edwardsiana rosae*, *Pinnaspis aspidistrae*, *Psylla alni*, *Speusotettix subfuscus*, *Alnetoidia alneti*, *Sogatella panicicola*, *Adelphocoris lineolatus*, *Dysdercus poecilus*, *Parlatoria ziziphi*, *Uhlerites debile*, *Laodelphax striatellus*, *Eurydema pulchrum*, *Cletus trigonus*, *Clovia punctata*, *Empoasca sp.*, *Coccus hesperidum*, *Pachybrachius luridus*, *Planococcus kraunthiae*, *Stenotus binotatus*, *Arboridia apicalis*, *Macrosteles fascifrons*, *Dolycoris baccarum*, *Adelphocoris triannulatus*, *Viteus vitifolii*, *Acanthocoris sordidus*, *Leptocorisa acuta*, *Macropes obnubilus*, *Cletus punctiger*, *Riptortus clavatus*, *Paratrioza cockerelli*, *Aphrophora costalis*, *Lygus disponsi*, *Lygus saundersi*, *Crisicoccus pini*, *Empoasca abietis*, *Crisicoccus matsumotoi*, *Aphis craccivora*, *Megacopta punctatissimum*, *Eysarcoris guttiger*, *Lepidosaphes beckii*, *Diaphorina citri*, *Toxoptera citricidus*, *Planococcus citri*, *Dialeurodes citri*, *Aleurocanthus spiniferus*, *Pseudococcus citriculus*, *Zyginella citri*, *Pulvinaria citricola*, *Coccus discrepans*, *Pseudaonidia duplex*, *Pulvinaria aurantii*, *Lecanium corni*, *Nezara viridula*, *Stenodema calcaratum*, *Rhopalosiphum padi*, *Sitobion akebiae*, *Schizaphis graminum*, *Sorhoanus tritici*, *Brachycaudus helichrysi*, *Carpocoris purpureipennis*, *Myzus persicae*, *Hyalopterus pruni*, *Aphis farinose yanagicola*, *Metasalis populi*, *Unaspis yanonensis*, *Mesohomotoma camphorae*, *Aphis spiraeicola*, *Aphis pomi*, *Lepidosaphes ulmi*, *Psylla mali*, *Heterocordylus flavipes*, *Myzus malisuctus*, *Aphidonuguis mali*, *Orientus ishidae*, *Ovatus malicolens*, *Eriosoma lanigerum*, *Ceroplastes rubens* і *Aphis gossypii*.

Приклади видів роду Coleoptera включають *Xystrocera globosa*, *Paederus fuscipes*, *Eucetonia roelofsi*, *Callosobruchus chinensis*, *Cylas formicarius*, *Hypera postica*, *Echinocnemus squameus*, *Oulema oryzae*, *Donacia provosti*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Colasposoma dauricum*, *Euscepes postfasciatus*, *Epilachna varivestis*, *Acanthoscelides obtectus*, *Diabrotica virgifera virgifera*, *Involvulus cupreus*, *Aulacophora femoralis*, *Bruchus pisorum*, *Epilachna vigintioctomaculata*, *Carpophilus dimidiatus*, *Cassida nebulosa*, *Luperomorpha tenebrosa*, *Phyllotreta striolata*, *Psacotha hilaris*, *Aeolesthes chrysothrix*, *Curculio sikkimensis*, *Carpophilus hemipterus*, *Oxycetonia jucunda*, *Diabrotica spp.*, *Mimela splendens*, *Sitophilus zeamais*, *tribolium castaneum*, *Sitophilus oryzae*, *Palorus subdepressus*, *Melolontha japonica*, *Anoplophora malasiaca*, *Neatus picipes*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Diabrotica undecimpunctata howardi*, *Sphenophorus venatus*, *Crioceris quatuordecimpunctata*, *Conotrachelus nenuphar*, *Ceuthorhynchidius albosuturalis*, *Phaedon*

brassicae, *Lasioderma serricorne*, *Sitona japonicus*, *Adoretus tenuimaculatus*, *Tenebrio molitor*, *Basilepta balyi*, *Hypera nigrirostris*, *Chaetocnema concinna*, *Anomala cuprea*, *Heptophylla picea*, *Epilachna vigintioctopunctata*, *Diabrotica longicornis*, *Eucetonia pilifera*, *Agriotes* spp., *Attagenus unicolor japonicus*, *Pagria signata*, *Anomala rufocuprea*, *Palorus ratzeburgii*, *Alphitobius laevigatus*,
 5 *Anthrenus verbasci*, *Lyctus brunneus*, *tribolium confusum*, *Medythia nigrobilineata*, *Xylotrechus pyrrhoderus*, *Epitrix cucumeris*, *Tomicus piniperda*, *Monochamus alternatus*, *Popillia japonica*, *Epicauta gorhami*, *Sitophilus zeamais*, *Rhynchites heros*, *Listroderes costirostris*, *Callosobruchus maculatus*, *Phyllobius armatus*, *Anthonomus pomorum*, *Linaeidea aenea* i *Anthonomus grandis*.

Приклади видів роду *Diptera* включають *Culex pipiens pallens*, *Pegomya hyoscyami*, *Liriomyza huidobrensis*, *Musca domestica*, *Chlorops oryzae*, *Hydrellia sasakii*, *Agromyza oryzae*, *Hydrellia griseola*, *Hydrellia griseola*, *Ophiomyia phaseoli*, *Dacus cucurbitae*, *Drosophila suzukii*, *Rhacochlaena japonica*, *Muscina stabulans*, види родини *Phoridae*, такі як *Megaselia spiracularis*, *Clogmia albipunctata*, *Tipula aino*, *Phormia regina*, *Culex tritaeniorhynchus*, *Anopheles sinensis*, *Hylemya brassicae*, *Asphondylia* sp., *Delia platura*, *Delia antiqua*, *Rhagoletis cerasi*, *Culex pipiens molestus*
 10 *Forskal*, *Ceratitis capitata*, *Bradysia agrestis*, *Pegomya cunicularia*, *Liriomyza sativae*, *Liriomyza bryoniae*, *Chromatomyia horticola*, *Liriomyza chinensis*, *Culex quinquefasciatus*, *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Liriomyza trifolii*, *Liriomyza sativae*, *Dacus dorsalis*, *Dacus tsuneonis*, *Sitodiplosis mosellana*, *Meromuza nigriventris*, *Anastrepha ludens* i *Rhagoletis pomonella*.

Приклади видів роду *Hymenoptera* включають *Pristomyrmex pungens*, види родини *Bethylidae*, *Monomorium pharaonis*, *Pheidole noda*, *Athalia rosae*, *Dryocosmus kuriphilus*, *Formica fusca japonica*, види підродини *Vespininae*, *Athalia infumata infumata*, *Arge pagana*, *Athalia japonica*, *Acromyrmex* spp., *Solenopsis* spp., *Arge mali* i *Ochetellus glaber*.

Приклади видів роду *Orthoptera* включають *Homorocoryphus lineosus*, *Gryllotalpa* sp., *Oxya hyla intricata*, *Oxya yezoensis*, *Locusta migratoria*, *Oxya japonica*, *Homorocoryphus jezoensis* i *Teleogryllus emma*.
 20 25

Приклади видів роду *Thysanoptera* включають *Selenothrips rubrocinctus*, *Stenchaetothrips biformis*, *Haplothrips aculeatus*, *Ponticulothrips diospyrosi*, *Thrips flavus*, *Anaphothrips obscurus*, *Liothrips floridensis*, *Thrips simplex*, *Thrips nigropilosus*, *Heliothrips haemorrhoidalis*, *Pseudodendrothrips mori*, *Microcephalothrips abdominalis*, *Leeuwenia pasanii*, *Litotetothrips pasaniae*, *Scirtothrips citri*, *Haplothrips chinensis*, *Mycterothrips glycines*, *Thrips setosus*, *Scirtothrips dorsalis*, *Dendrothrips minowai*, *Haplothrips niger*, *Thrips tabaci*, *Thrips alliorum*, *Thrips hawaiiensis*, *Haplothrips kurdjumovi*, *Chirothrips manicatus*, *Frankliniella intonsa*, *Thrips coloratus*, *Frankliniella occidentalis*, *Thrips palmi*, *Frankliniella lilivora* i *Liothrips vaneeckei*.

Приклади видів роду *Acari* включають *Leptotrombidium akamushi*, *Tetranychus ludeni*, *Dermacentor variabilis*, *Tetranychus truncatus*, *Ornithonyssus bacoti*, *Demodex canis*, *Tetranychus viennensis*, *Tetranychus kanzawai*, види родини *Ixodidae*, такі як *Rhipicephalus sanguineus*, *Cheyletus malaccensis*, *Tyrophagus putrescentiae*, *Dermatophagoides farinae*, *Latrodectus hasseltii*, *Dermacentor taiwanensis*, *Acaphylla theavagrans*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Aculops lycopersici*, *Ornithonyssus sylvairum*, *Tetranychus urticae*, *Eriophyes chibaensis*, *Sarcoptes scabiei*,
 35 40 *Haemaphysalis longicornis*, *Ixodes scapularis*, *Tyrophagus similis*, *Cheyletus eruditus*, *Panonychus citri*, *Cheyletus moorei*, *Brevipalpus phoenicis*, *Octodectes cynotis*, *Dermatophagoides ptenyssnus*, *Haemaphysalis flava*, *Ixodes ovatus*, *Phyllocoptura citri*, *Aculus schlechtendali*, *Panonychus ulmi*, *Amblyomma americanum*, *Dermanyssus gallinae*, *Rhyzoglyphus robini* i *Sancassania* sp.

Приклади видів роду *Isoptera* включають *Reticulitermes miyatakei*, *Incisitermes minor*, *Coptotermes formosanus*, *Hodotermopsis japonica*, *Reticulitermes* sp., *Reticulitermes flaviceps amamianus*, *Glyptotermes kushimensis*, *Coptotermes quangzhoensis*, *Neotermes koshunensis*, *Glyptotermes kodamai*, *Glyptotermes satsumensis*, *Cryptotermes domesticus*, *Odontotermes formosanus*, *Glyptotermes nakajimai*, *Pericapritermes nitobei* i *Reticulitermes speratus*.
 45

Приклади видів роду *Blattodea* включають *Periplaneta fuliginosa*, *Blattella germanica*, *Blatta orientalis*, *Periplaneta brunnea*, *Blattella lituricollis*, *Periplaneta japonica* i *Periplaneta americana*.
 50

Приклади видів роду *Siphonaptera* включають *Pulex irritans*, *Ctenocephalides felis* i *Ceratophyllus gallinae*.

Приклади видів типу *Nematoda* включають *Nothotylenchus acris*, *Aphelenchoides besseyi*, *Pratylenchus penetrans*, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Globodera rostochiensis*,
 55 *Meloidogyne javanica*, *Heterodera glycines*, *Pratylenchus coffeae*, *Pratylenchus neglectus* i *Tylenchus semipenetrans*.

Приклади видів типу *Mollusca* включають, такі як *Pomacea canaliculata*, *Achatina fulica*, *Meghimatium bilineatum*, *Lehmannina valentiana*, *Limax flavus* i *Acusta despecta sieboldiana*.

рім того, сільськогосподарський і садівничий інсектицид за даним винаходом має так само сильну інсектицидну дію на *Tuta absoluta*.
 60

Крім того, кліщі і кліщі, що паразитують на тваринах, також включаються в число цільових шкідників.

Далі, кліщі і іксодові кліщі, що паразитують на тваринах, також включаються в число цільових шкідників, і приклади включають види родини Ixodidae, такі як *Boophilus microplus*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Haemaphysalis longicornis*, *Haemaphysalis flava*, *Haemaphysalis campanulata*, *Haemaphysalis concinna*, *Haemaphysalis japonica*, *Haemaphysalis kitaokai*, *Haemaphysalis ias*, *Ixodes ovatus*, *Ixodes nipponensis*, *Ixodes persulcatus*, *Amblyomma testudinarium*, *Haemaphysalis megaspinoza*, *Dermacentori Reticulatus* і *Dermacentor taiwanensis*; *Dermanyssus gallinae*; види роду *Ornithonyssus*, такі як *Ornithonyssus sylviarum* і *Ornithonyssus bursa*; види родини Trombiculidae, такі як *Eutrombicula wichmanni*, *Leptotrombidium akamushi*, *Leptotrombidium pallidum*, *Leptotrombidium fuji*, *Leptotrombidium tosa*, *Neotrombicula autumnalis*, *Eutrombicula alfreddugesi* і *Helenicula miyagawai*; види родини Cheyletidae, такі як *Cheyletiella yasguri*, *Cheyletiella parasitivorax* і *Cheyletiella blakei*; види суперроду *Sarcoptoidea*, такі як *Psoroptes cuniculi*, *Chorioptes bovis*, *Otodectes cynotis*, *Sarcoptes scabiei* і *Notoedres cati*; і види родини Demodicidae, такі як *Demodex canis*.

Інші цільові шкідники включають бліх, в тому числі ектопаразитарні безкрилі комахи, що стосуються роду *Siphonaptera*, більш конкретно, види, що стосуються сімейств *Pulicidae* і *Ceratophyllidae*. Приклади видів, що стосуються родини *Pulicidae*, включають *Stenocephalides canis*, *Stenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Echidnophaga gallinacea*, *Xenopsylla cheopis*, *Leptopsylla segnis*, *Nosopsyllus fasciatus* і *Monopsyllus anisus*.

Інші цільові шкідники включають ектопаразити, наприклад, види підряду *Anoplura*, такі як *Haematopinus eurysternus*, *Haematopinus asini*, *Dalmalinia ovis*, *Linognathus vituli*, *Haematopinus suis*, *Phthirus pubis* і *Pediculus capitis*; види підряду *Mallophaga*, такі як *Trichodectes canis*; і кровососучі двокрилі комахи-шкідники, такі як *Tabanus trigonus*, *Culicoides schultzei* і *Simulium ornatum*. Крім того, приклади ектопаразитів включають нематоди, такі як *lungworms*, волосоголовці, вузлуваті черв'яки, ендогастральні паразитарні черв'яки, аскариди і філяріатні черв'яки; цестоди, такі як *Spirometra erinacei*, *Diphyllobothrium latum*, *Dipylidium caninum*, *Multiceps multiceps*, *Echinococcus granulosus* і *Echinococcus multilocularis*; трематоди, такі як *Schistosoma japonicum* і *Fasciola hepatica*; і найпростіші, такі як кокцидії, *Plasmodium*, кишкові *Sarcocystis*, *Toxoplasma* і *Cryptosporidium*.

Більш детальні приклади ектопаразитів включають:

види роду *Enoplida*, такі як підрід *trichuris* (whipworms) (*Trichuris* spp.), підрід *Capillaria* (круглі черв'яки) (*Capillaria* spp.), підрід *Torikomosoidea* (*Trichomosoides* spp.) і підрід *trichinella* (під *Trichinella*) (*Trichinella* spp.);

види роду *Rhabditia*, такі як підрід *Micronema* (*Micronema* spp.) і підрід *Strongyloides* (*Strongyloides* spp.);

види роду *Strongylida*, наприклад, підрід *Strongylus* (*strongyles*) (*Strongylus* spp.), підрід *triodontophorus* (*Triodontophorus* spp.), підрід *Oesophagodontus* (*Oesophagodontus* spp.), підрід *trichonema* (*Trichonema* spp.), підрід *Gyalocephalus* (*Gyalocephalus* spp.), підрід *Cylindropharynx* (*Cylindropharynx* spp.), підрід *Poteriostomum* (*Poteriostomum* spp.), підрід *Cyclococercus* (*Cyclococercus* spp.), підрід *Cylicostephanus* (*Cylicostephanus* spp.), підрід *Oesophagostomum* (*Oesophagostomum* під) (*Oesophagostomum* spp.), підрід *Chabertia* (*Chabertia* spp.), підрід *Stephanurus* (*Stephanurus dentatus*) (*Stephanurus* spp.), підрід *Ancylostoma* (анкілостоми Старого Світа) (*Ancylostoma* spp.), підрід *Uncinaria* (*Uncinaria* spp.) і підрід *Bunostomum* (*Bunostomum* spp.); підрід *Globocephalus* (*Globocephalus* spp.), підрід *Syngamus* (*syngamus worms*) (*Syngamus* spp.), підрід *Cyathostoma* (*Cyathostoma* spp.), підрід *Metastrongylus* (*lungworms*) (*Metastrongylus* spp.), підрід *Dictyocaulus* (*Dictyocaulus* spp.), підрід *Muellerius* (*Muellerius* spp.), підрід *Protostrongylus* (*Protostrongylus* spp.) *Neostrongylus* (*Neostrongylus* spp.), підрід *Cystocaulus* (*Cystocaulus* spp.), підрід *Pneumostrongylus* (*Pneumostrongylus* spp.), підрід *Spicocaulus* (*Spicocaulus* spp.), підрід *Elaphostrongylus* (*Elaphostrongylus* spp.), підрід *Parelaphostrongylus* (*Parelaphostrongylus* spp.) *Crenosoma* (*Crenosoma* spp.), підрід *Paracrenosoma* (*Parelaphostrongylus* spp.), підрід *Angiostrongylus* (черв'яки *angiostrongylus*) (*Angiostrongylus* spp.), підрід *Aelurostrongylus* (*Aelurostrongylus* spp.), підрід *Filaroides* (*Filaroides* spp.), підрід *Parafilaroides* (*Parafilaroides* spp.), підрід *trichostrongylus* (водяний волос) (*Trichostrongylus* spp.), підрід *Haemonchus* (черв'як *haemonchus*) (*Haemonchus* spp.), підрід *Ostertagia* (*Ostertagia* spp.), підрід *Marshallagia* (*Marshallagia* spp.), підрід *Cooperia* (*Cooperia* spp.), підрід *Nematodirus* (нематоди) (*Nematodirus* spp.), підрід *Hyostromylus* (*Hyostromylus* spp.), підрід *Obeliscoides* (*Obeliscoides* spp.), підрід *Amidostomum* (*Amidostomum* spp.) і підрід *Ollulanus* (*Ollulanus* spp.);

види роду *Oxyurida*, такі як підвид *Oxyuris* (кінські гострики) (*Oxyuris* spp.), підвид *Enterobius* (гострики) (*Enterobius* spp.), підвид *Passalurus* (*Passalurus* spp.), підвид *Syphacia* (*Syphacia* spp.), підвид *Aspicularis* (*Aspicularis* spp.) і підвид *Heterakis* (*Heterakis* spp.);

5 види роду *Ascaridia*, такі як підвид *Ascaris* (круглі черв'яки) (*Ascaris* spp.), підвид *Toxascaris* (*Toxascaris* spp.), підвид *Toxocara* (аскаридоз собак) (*Toxocara* spp.), підвид *Parascaris* (*Parascaris* spp.), *Parascaris equorum* (*Parascaris* spp.), *Anisakis* підвид (*Anisakis* spp.) і підвид *Ascaridia* (круглі черв'яки) (*Ascaridia* spp.);

10 види роду *Spirurida* (*Spiruroids*), такі як підвид *Gnathostoma* (*Gnathostoma spinigerum*) (*Gnathostoma* spp.), підвид *Physaloptera* (*Physaloptera* spp.), підвид *Thelazia* (*Thelazia* spp.), підвид *Gongylonema* (*Gongylonema* spp.), підвид *Habronema* (*Habronema* spp.), підвид *Parabronema* (*Parabronema* spp.), підвид *Draschia* (*Draschia* spp.) і підвид *Dracunculus* (Гвінейські черв'яки) (*Dracunculus* spp.);

15 види роду *Filariida*, такі як підвид *Stephanofilaria* (*Stephanofilaria* spp.), *Parafilaria* (*Parafilaria* spp.), підвид *Setaria* (*Setaria* spp.), підвид *Loa* (*Loa* spp.), підвид *Dirofilaria* (серцеві черв'яки у собак) (*Dirofilaria* spp.), підвид *Litomosoides* (*Litomosoides* spp.), підвид *Brugia* (*Brugia* spp.), підвид *Wuchereria* (серцеві черв'яки) (*Wuchereria* spp.) і підвид *Onchocerca* (*Onchocerca* spp.), і

20 види роду *Gigantorhynchida*, такі як підвид *Filicollis* (*Filicollis* spp.), підвид *Moniliformis* (*Moniliformis* spp.), підвид *Macracanthorhynchus* (*Macracanthorhynchus* spp.) і підвид *Prosthenorchis* (*Prosthenorchis* spp.).

25 Засіб боротьби з ендopаразитами, що містить похідне бензimidазолу, представлене загальною формулою (1) за даним винаходом, або його сіль як активний інгредієнт, ефективний не тільки проти паразитів, які живуть в організмі проміжного або кінцевого хазяя, але також і для паразитів, які живуть в тілі резервуарного хазяя. Похідне бензimidазолу, представлене загальною формулою (1) за даним винаходом, або його сіль ефективні проти паразитів на кожній стадії їх розвитку. Наприклад, у разі найпростіших сполука ефективна проти їх кіст, передкістозних форм і трофозоїтів; шизонтів і амебоїдних форм на безстатевій стадії; гаметоцитів, гамет і зигот на сексуальній стадії; спорозоїтів і т. д. В випадку нематод сполука ефективна проти їх яєць, личинок і дорослих особнів. Сполука за даним винаходом здатна не тільки боротися з паразитами в живому організмі, але і навіть запобігати паразитарній інфекції шляхом внесення в довкілля як шлях зараження. Наприклад, можна запобігти інфекції, що передається через ґрунт, тобто інфекцію з ґрунту сільськогосподарських полів і парків; черезшкірну інфекцію через воду в ріках, озерах, болотах, рисових полях і оральну інфекцію від фекалій тварин, таких як собаки і кішки; оральну інфекцію від морської риби, прісноводної риби, ракоподібної, моллюсків, сирого м'яса домашніх тварин і зараження від комарів, оводів, мух, тарганів, кліщів і іксодних кліщів, бліх, вошей, клопів-вбивць, кліщів тромбікулідів і і тому подібне.

30 Коли сполуки за даним винаходом використовуються для боротьби з ендopаразитами у домашніх ссавців і птахів, сполуки за даним винаходом можна вводити в ефективній кількості разом з фармацевтично прийнятними добавками перорально, парентерально шляхом ін'єкції (внутрішньом'язово, підшкірно, внутрішньовенно або внутрішньочеревинно); підшкірно шляхом занурення, розпилення, купання, миття, обливання і нанесення плям і пилоподібного препарату або інтраназально. Сполуки за даним винаходом можна вводити через формовані вироби, такі як чипи, пластини, стрічки, коміри, вушні бирки, пов'язки на кінцівки і ідентифікаційні бирки. Сполуки за даним винаходом вводять в довільній лікарській формі, прийнятній для шляху введення.

40 Лікарська форма може являти собою твердий препарат, такий як пилоподібний препарат, гранули, змочуваний порошок, кормова гранула, таблетка, кулька, коржик і формований виріб, що містить активний інгредієнт, рідкий препарат, такий як рідина для ін'єкцій, рідина для перорального застосування, рідкий препарат, що наноситься на шкіру або в цілому, препарат для обливання, препарат для точкового нанесення, текучий, емульсивний і напівтвердий препарат, такий як мазь і гель.

45 Твердий препарат, як правило, можна використовувати для перорального введення, або для підшкірного введення, або для нанесення на навколишнє середовище після розбавлення водою і тому подібне Твердий препарат може бути отриманий шляхом змішування активного інгредієнта з відповідним носієм і, якщо необхідно, з ад'ювантом, і складання суміші в бажаній лікарській формі. Приклади носія включають неорганічний носій, такий як карбонат, гідрокарбонат, фосфат, оксид алюмінію, діоксид кремнію або глина, або органічний носій, такий як сахарид, целюлоза, зернове борошно або крохмаль.

60 Рідина для ін'єкцій може вводитися внутрішньовенно, внутрішньом'язово або підшкірно. Рідина для ін'єкцій може бути приготована шляхом розчинення активного інгредієнта у

відповідному розчиннику і, при необхідності, додавання добавок, таких як солюбілізатор, кислота, основа, буферна сіль, антиоксидант і захисний засіб. Приклади прийнятних розчинників включають воду, етанол, бутанол, бензиловий спирт, гліцерин, пропіленгліколь, поліетиленгліколь, N-метилпіролідон і їх суміші, фізіологічно прийнятні рослинні олії і синтетичні масла, прийнятні для ін'єкції. Приклади солюбілізаторів включають полівінілпіролідон, поліоксіетиловану рицинову олію, складний ефір поліоксіетилизованого сорбітану і тому подібне. Приклади захисних засобів включають бензиловий спирт, трихлорбутанол, складний ефір п-гідроксibenзойної кислоти, н-бутанол і тому подібне.

Рідина для перорального застосування може вводиться напряму або після розбавлення і може бути приготована таким же чином, як і рідина для ін'єкцій.

Текуча емульсія і тому подібне може вводиться напряму або після розбавлення черезшкірно або шляхом нанесення на навколишнє середовище.

Рідкий препарат, що наноситься на шкіру, вводиться шляхом крапання, намазання, розтирання, розпилення, розбризкування або занурення (замочення, купання або миття), і його можна приготувати таким же чином, як і рідину для ін'єкцій.

Препарати для обливання і засобу для точкового нанесення крапають або розпилюють на обмежену ділянку шкіри, так що вони проникають через шкіру і діють системно. Препарати для поливу і препарати для точкового нанесення можуть бути отримані шляхом розчинення, суспендування або емульгування активного інгредієнта у прийнятному сприятливому для шкіри розчиннику або суміші розчинників. При необхідності можуть бути додані такі добавки, як поверхнево-активна речовина, барвник, абсорбуючий засіб, антиоксидант, захист від УФ випромінювання і клей. Приклади прийнятних розчинників включають воду, спирт, гліколь, поліетиленгліколь, поліпропіленгліколь, гліцерин, бензиловий спирт, фенілетанол, феноксіетанол, етилацетат, бутилацетат, бензилбензоат, димонOMETИЛОВИЙ ефір пропіленгліколю, монобутиловий ефір діетиленгліколю, ацетон, метилетилкетон, ароматичні і/або аліфатичні вуглеводні, рослинні олії або синтетичні масла, ДМФ, рідкий парафін, легкий рідкий парафін, силікон, диметилацетамід, N-метилпіролідон або 2,2-диметил-4-окси-метилен-1,3-діоксолан. Приклади речовини, що посилює абсорбцію, включають ДМСО, ізопропіл міристат, дипропіленгліколь пеларгонової кислоти, силіконове масло, складні ефіри жирних кислот, тригліцериди і аліфатичні спирти. Приклади антиоксидантів включають сульфїти, метабісульфїти, аскорбінову кислоту, бутилгідрокситолуол, бутилгідроксіанізол і токоферол.

Емульсія може вводиться перорально, підшкірно або шляхом ін'єкції. Емульсія може бути приготована шляхом розчинення активного інгредієнта в гідрофобній фазі або гідрофільній фазі і гомогенізації отриманого розчину з іншою рідкою фазою разом з відповідним емульгатором, а також, якщо необхідно, з добавками, такими як барвник, абсорбуючий агент, захисний агент, антиоксидант, світлофільтр і загусник.

Приклади гідрофобних фаз (масел) включають парафінове масло, силіконове масло, кунжутну олію, мигдалеву олію, рицинову олію, синтетичні тригліцериди, етилстеарат, ди-н-бутириладипат, гексиллаурат, дипропіленгліколь пеларгонової кислоти, складні ефіри розгалужених коротколанцюжкових жирних кислот з C₁₆-C₁₈ насиченими жирними кислотами, ізопропілміристат, ізопропілпальмітат, складні ефіри C₁₂-C₁₈ насичених спиртів з каприловою/каприновою кислотою, ізопропілстеарат, олеїлолеат, децилолеат, етилолеат, етиллактат, віск складних ефірів жирних кислот, дибутилфталат, діізопропіладипат, ізотридециловий спирт, 2-октилдодеканол, цетилстеариловий спирт і олеїловий спирт.

Приклади гідрофільних фаз включають воду, пропіленгліколь, гліцерин і сорбіт.

Приклади емульгаторів неіонних поверхнево-активних речовин включають поліоксіетиловану рицинову олію, поліоксіетиловану сорбітанмоноолефінову кислоту, моностеарат сорбітану, моностеарат гліцерину, поліоксіетилстеарат і простий полігліколевий ефір алкілфенолу; амфотерні поверхнево-активні речовини, такі як динатрій N-лаурил-β-імінодипропіонат і лецитин; аніонні поверхнево-активні речовини, такі як лаурилсульфат натрію, сульфатний ефір аліфатичного спирту, моноетаноламінова сіль ортофосфату моно-/діалкілполігліколю; і катіонні поверхнево-активні речовини, такі як хлорид цетилтриметиламонію.

Приклади інших добавок включають карбоксиметилцелюлозу, метилцелюлозу, поліакрилат, альгінат, желатин, гуміарабік, полівінілпіролідон, полівініловий спирт, метилвініловий ефір, співполімери малеїнового ангїдриду, поліетиленгліколь, віск і колоїдний діоксид кремнію.

Напівтвердий препарат вводять шляхом нанесення або розподілу на шкірі або введення загалом. Гель може бути приготований шляхом додавання загусника до розчину, приготованого таким же чином, як і рідина для ін'єкцій, в достатній мірі, щоб отримати прозору в'язку речовину, подібну до мазі.

У випадку, коли засіб для боротьби з ендopаразитами за даним винаходом використовується як лікарський засіб для тварин, які не належать до людини видів ссавців або птахів, оптимальна кількість (ефективна кількість) активного інгредієнта варіюється залежно від мети (лікування або профілактика), виду інфекційного паразита, типу і серйозності інфекції, лікарської форми і т. д., але загалом добова доза для перорального застосування знаходиться в діапазоні від приблизно 0,0001 до 10000 мг/кг ваги тіла, і парентеральна добова доза знаходиться в діапазоні від приблизно 0,0001 до 10000 мг/кг ваги тіла. Така доза може бути дана як разова доза або розділена на декілька доз.

Концентрація активного інгредієнта в засобі для боротьби з ендopаразитами за даним винаходом звичайно становить від приблизно 0,001 до 100 % по масі, переважно, від приблизно 0,001 до 99 % по масі і, більш переважно, від приблизно 0,005 до 20 % по масі. Засіб для боротьби з ендopаразитами за даним винаходом може бути композицією, яку можна вводити напряму, або висококонцентрованою композицією, яку необхідно розбавити до прийнятної концентрації перед застосуванням.

Засіб для боротьби з ендopаразитами за даним винаходом може використовуватися в комбінації з будь-яким існуючим засобом для боротьби з ендopаразитами з метою посилення або доповнення його ефекту. При такому комбінованому застосуванні два або більше активних інгредієнтів можуть бути змішані і складені в один препарат перед введенням, або два або більше різних препаратів можуть бути введені окремо.

Сільськогосподарський і садівничий інсектицидний і акарицидний засіб, що містить похідне бензimidазолу, представлене загальною формулою (1) за даним винаходом, або його сіль як активний інгредієнт має помітний ефект боротьби з вищеописаними шкідниками, які ушкоджують низинні культури, польові культури, фруктові дерева, овочі, інші культури, декоративні квітучі рослини і т. д. Бажаний ефект може бути отриманий, коли сільськогосподарський і садівничий інсектицидний і акарицидний засіб застосовується в розплідниках для вирощування розсади, на рисових полях, полях, фруктових деревах, овочах, інших культурах, декоративних квітучих рослинах і т. д. і їх насінні, у воді для полів пади, на листі, в середовищі для вирощування, такому як ґрунт, і т. п. приблизно в очікуваний час зараження шкідниками, тобто до зараження або після підтвердження зараження. У особливо переважних варіантах здійснення при нанесенні сільськогосподарського і садівничого інсектицидного і акарицидного засобу використовується так зване проникнення і пересування речовин в рослинах. Тобто ґрунт розплідників, ґрунт в посадкових ямах, опору рослин, поливну воду, воду для вирощування в гідропоніці або тому подібне обробляють сільськогосподарським і садівничим інсектицидним і акарицидним засобом, щоб дати можливість культурам, декоративним квітучим рослинам і т. д. абсорбувати сполуки за даним винаходом корінням з ґрунту або іншим чином.

Приклади корисних рослин, до яких може застосовуватися сільськогосподарський і садівничий інсектицидний і акарицидний засіб за даним винаходом включають, але не обмежуються ними, злаки (наприклад, рис, ячмінь, пшениця, жито, овес, кукурудза і т. д.), бобові (наприклад, соєві боби, квасоля адзукі, боби, зелений горошок, квасоля, арахіс і т. д.), фруктові дерева і фрукти (наприклад, яблука, цитрусові, груші, виноград, персики, сливи, вишні, волоські горіхи, каштани, мигдаль, банани і т. д.), листові і фруктові овочі (наприклад, капуста, помідори, шпинат, брокколі, салат, цибуля, зелена цибуля (часник і цибуля по-уельски), зелений перець, баклажани, полуниці, посіви перця, окра, китайський часник і т. д.), зернові культури для обробки (наприклад, бавовна, коноплі, буряк, хміль, цукрова тростина, цукровий буряк, оливки, каучук, кава, тютюн, чай і т. д.), гарбузи (наприклад, японські гарбузи, огірки, кавуни, східні солодкі дині, дині і т. д.), пасовищна трава (наприклад, садова трава, сорго, тимофіївка, конюшина, люцерна і т. д.), газонна трава (наприклад, корейська газонна трава, мітлиця і т. д.), пряні і ароматичні культури і декоративні культури (наприклад, лаванда, розмарин, чебрець, петрушка, перець, імбир і т. д.), декоративні квітучі рослини (наприклад, хризантема, троянда, гвоздика, орхідея, тюльпан, лілія і т. д.), садові дерева (наприклад, дерева гінго, вишні, японська аукуба і т. д.) і лісові дерева (наприклад, *Abies sachalinensis*, *Picea jezoensis*, сосна, жовтий кедр, японський кедр, кипарис хінокі, евкаліпт і т. д.).

Вищезазначені "рослини" також включають рослини, які мають стійкість до гербіцидів, набути за допомогою класичної методики селекції або методики генної рекомбінації. Приклади такої стійкості до гербіцидів включають стійкість до інгібіторів HPPD, таких як ізоксафлутол; інгібіторів ALS, таких як імазетапір і тифенсульфуронметил; інгібіторів ВПС-синтази, таких як гліфосат; інгібіторів глутамінсинтетази, таких як глюфосинат; інгібіторів ацетил-CoA-карбоксілази, таких як сетоксидим; або інших гербіцидів, таких як бромоксиніл, дикамба і 2,4-D.

Приклади рослин, стійких до гербіцидів завдяки класичній методиці селекції, включають сорти рапсу, пшениці, соняшника і рису, стійкі до родини імідазолінонових гербіцидів, які інгібують БАС, таких як імазетапір, і такі рослини продаються під торговим найменуванням Clearfield (zareєстрована торговельна марка). Також включені сорти сої, які мають стійкість до родини сульфонілсечовини і гербіцидів, які інгібують ALS, таких як тифенсульфуронметил, завдяки класичній селекції, і вони продаються під торговельною назвою соя STS. Також включені рослини, які мають толерантність до інгібіторів ацетил-КоА-карбоксилази, таких як гербіциди тріонксиму і гербіциди арилоксифеноксипропіонової кислоти, завдяки класичній селекції, наприклад кукурудза SR і тому подібне.

Рослини зі стійкістю до інгібіторів ацетил-КоА-карбоксилази описані в Proc. Natl. Acad. Sci. USA, 87, 7175-7179 (1990), і тому подібне. Крім того, мутанти ацетил-КоА-карбоксилази, стійкі до інгібіторів ацетил-КоА-карбоксилази, описані в Weed Science, 53, 728-746 (2005), і тому подібне, і при введенні гена такого мутанта ацетил-КоА-карбоксилази в рослини за допомогою генної рекомбінації або введення мутації, що додає стійкості, в ацетил-КоА-карбоксилазу рослин, можна створити рослини, стійку до інгібіторів ацетил-КоА-карбоксилази. Альтернативно, шляхом введення в клітини рослин нуклеїнової кислоти, що викликає мутацію заміщення основ (типичним прикладом цього методу є метод химерапластики (Gura T. 1999. Repairing the Genome's Spelling Mistakes. Science 285: 316-318)) для забезпечення сайт-специфічної заміни можуть бути сконструйовані мутації в амінокислотах, карбоксилази, що кодуються геном ацетил-КоА, геном ALS і тому подібне, рослин, рослин, стійких до інгібіторів ацетил-КоА карбоксилази, інгібіторів ALS і тому подібне. Сільськогосподарський і садівничий інсектицидний і акарицидний засіб за даним винаходом також може застосовуватися до цих рослин.

Далі, типові токсини, які експресуються в генетично модифікованих рослинах, включають інсектицидні білки *Bacillus cereus* або *Bacillus popilliae*; *Bacillus thuringiensis* δ-ендотоксини, такі як Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1 і Cry9C, і інші інсектицидні білки, такі як VIP1, VIP2, VIP3 і VIP3A; інсектицидні білки нематод; токсини, що виробляються тваринами, такі як токсини скорпіона, токсини павуків, бджолині токсини і нейротоксини, специфічні для комах; токсини міцеліальних грибів; лектини рослин; аглютинін; інгібітори протеази, такі як інгібітори трипсину, інгібітори серинової протеази, інгібітори пататину, цистатину і папаїну; білки, які інактивують рибосоми (RIP), такі як рицин, RIP кукурудзи, абрин, люффін, сапорин і бріодин; ферменти, які метаболізують стероїди, такі як 3-гідроксистероїдоксидаза, екдистероїд-UDP-глюкозилтрансфераза і холестериноксидаза; інгібітори екдизону; HMG-КоА редуктаза; інгібітори іонних каналів, такі як інгібітори натрієвих каналів і інгібітори кальцієвих каналів; естеразу ювенільного гормону; рецептори діуретичних гормонів; стильбенсинтазу; бібензилсинтазу; хітиназу; і глюканазу.

Також включені гібридні токсини, частково дефіцитні токсини і модифіковані токсини, отримані з наступних: білків δ-ендотоксинів, таких як Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1F, Cry1Fa2, Cry2Ab, Cry3A, Cry3Bb1, Cry9C, Cry34Ab і Cry35Ab, а також інших інсектицидних білків, таких як VIP1, VIP2, VIP3 і VIP3A. Гібридний токсин може бути отриманий шляхом об'єднання деяких доменів цих білків інакше, ніж вихідна комбінація в природі, з використанням методу рекомбінації. Як токсин з частковим дефіцитом відомий токсин Cry1Ab, в якому видалена частина амінокислотної послідовності. У модифікованому токсині замінені одна або декілька амінокислот токсину природного походження.

Приклади вищезгаданих токсинів і генетично модифікованих рослин, здатних синтезувати ці токсини, описані в EP-A-0374753, WO 93/07278, WO 95/34656, EP-A-0427529, EP-A-451878, WO 03/052073 і т. д.

Завдяки токсинам, що містяться в таких генетично модифікованих рослинах, рослини виявляють стійкість до шкідників, зокрема, до жорсткокрилих комах-шкідників, напівжорсткокрилих комах-шкідників, двокрилих комах-шкідників, лускокрилих комах-шкідників і нематод. Вищеописані технології, а також інсектицидний і акарицидний засіб в сільському господарстві і садівництві за даним винаходом можна використовувати в комбінації або систематично.

Для боротьби з шкідниками-мішенями сільськогосподарський і садівничий інсектицидний і акарицидний засіб за даним винаходом з відповідним розбавленням або суспендуванням у воді або без цього застосовується до рослин, потенційно заражених цільовими комахами-шкідниками або нематодами, в кількості, ефективній для боротьби з комахами-шкідниками або нематодами. Наприклад, для боротьби з комахами-шкідниками і нематодами, які можуть пошкодити культурні рослини, такі як фруктові дерева, зернові і овочі, можна провести позакореневу підгодівлю і обробку насіння, таку як занурення, запилення і покриття пероксидом кальцію. Крім того, також може виконуватися обробка ґрунту і тому подібне, щоб дати

можливість рослинам поглинати агрохімікати своїм корінням. Приклади такої обробки включають загортання всього ґрунту, обробку посадкового ряду, загортання грядки, обробку паростків, обробку посадкових ям, обробку стебла рослин, підгодівлю, обробку ящиків для вирощування рису-сирця і внесення у воду. Крім того, також може бути виконано внесення в культуральні середовища в гідропоніці, обкурювання, ін'єкції в стовбур і тому подібне.

Крім того, сільськогосподарський і садівничий інсектицидний і акарицидний засіб за даним винаходом з відповідним розбавленням або суспендуванням у воді або без цього і т. д. можна наносити на ділянки, потенційно заражені шкідниками, в кількості, ефективній для боротьби з шкідниками. Наприклад, його можна безпосередньо наносити на шкідників зерна, що зберігається, домашніх шкідників, шкідників, які погіршують санітарний стан, лісових шкідників і т. д., а також використовувати для покриття будівельних матеріалів житлових будинків, для обробки обкурюванням або як рецептура приманки.

Приклади способів обробки насіння включають занурення насіння в розбавлену або нерозбавлену рідину рідкого або твердого складу для проникнення агрохімікатів в насіння; змішування або нанесення порошкового покриття на насіння твердим або рідким складом для прилипання складу до поверхні насіння; покриття насіння сумішшю агрохімікатів і адгезивного носія, такого як смоли і полімери; і нанесення твердого або рідкого препарату поблизу насіння одночасно з посівом.

Термін "насіння" у вищезазначеній обробці насіння стосується тіла рослини, яке знаходиться на ранніх стадіях культивування і використовується для розмноження рослин. Приклади включають, крім так званого насіння, тіло рослини для вегетативного розмноження, таке як цибулина, бульба, насіннева картопля, зубок, паросток, дископодібне стебло і стебло, що використовується для зрізання.

Термін "ґрунт" або "середовище для вирощування" в способі за даним винаходом для використання сільськогосподарських і садових інсектицидів стосується підтримувального середовища для вирощування сільськогосподарських культур, зокрема, підтримувального середовища, яке дозволяє культурним рослинам поширювати в ньому своє коріння, і матеріали особливо не обмежуються, якщо вони дають рослинам можливість рости. Приклади підтримувального середовища включають так звані ґрунти, мати для розсади і воду, і конкретні приклади матеріалів включають пісок, пемзу, вермикуліт, діатоміт, агар, гелеподібні речовини, високомолекулярні речовини, мінеральну вату, скловата, деревину, тріски і кору.

Приклади способів нанесення на листя сільськогосподарських культур або на шкідників зерна, що знаходиться на зберіганні, домашніх шкідників, шкідників, які погіршують санітарний стан, шкідників лісу і т. д. включають нанесення рідкого складу, такого як емульгований концентрат і текучий або твердий склад, такий як змочуваний порошок і дисперговані у воді гранули після відповідного розбавлення водою; застосування пилоподібного препарату; і обкурювання.

Приклади способів внесення в ґрунт включають нанесення розбавленого водою або нерозбавленого рідкого складу на стебла рослин, грядки для розсади і тому подібне, нанесення гранул на стебла рослин, грядки для розсади і тому подібне, нанесення пилоподібного препарату, змочуваного порошку, диспергованих у воді гранул, гранул і тому подібне на ґрунт і подальше внесення композиції у весь ґрунт перед посівом або пересадкою; і нанесення пилоподібного препарату, змочуваного порошку, диспергованих у воді гранул, гранул і тому подібне на посадкові ямки, посадкові ряди і тому подібне перед посівом або посадкою.

У ящики для вирощування рису-сирця можна наносити, наприклад, пилоподібний препарат, дисперговані у воді гранули, гранули і тому подібне, хоч відповідний склад може варіюватися залежно від часу нанесення, іншими словами, залежно від стадії вирощування, наприклад, як час посіву, період озеленення і час посадки. Склад, такий як пилоподібний препарат, дисперговані у воді гранули і гранули, можна змішувати з ґрунтом для розплідників. Наприклад, такий склад вводять в ґрунт грядки, що покриває ґрунт або у весь ґрунт. Простіше кажучи, ґрунт для розплідників і такий склад можна нашарувати навперемінно.

При нанесенні на рисові поля твердий склад, такий як джамбо, упаковка, гранули і дисперговані у воді гранули, або рідкий склад, такий як текучий і емульгований концентрат, звичайно наносять на затоплені рисові поля. У період посадки рису відповідний склад, як він є, або після змішування з добривом, може бути внесений на ґрунт або введений в ґрунт. Крім того, емульгований концентрат, текучий і тому подібний можна застосувати на джерелі водопостачання рисових полів, такому як водоприймач і іригаційний пристрій. У цьому випадку обробку можна провести з подачею води і, таким чином, економити труд.

У разі польових культур їх насіння, середовища для культивування поблизу їх рослин або тому подібне можна обробляти в період від посіву до посіву. У разі рослин, насіння яких

висівається безпосередньо в полі, в доповнення до прямої обробки насіння переважна обробка стебел рослин під час вирощування. Зокрема, обробка може здійснюватися, наприклад, шляхом нанесення гранул на ґрунт або замочування ґрунту складом в розбавленою водою або нерозбавленій рідкій формі. Іншим переважним способом обробки є введення гранул в

5 культуральне середовище перед посівом.

У разі культурних рослин, що пересаджуються переважні приклади обробки в період від посіву до посівної культури включають, крім прямої обробки насіння, просочення грядок для розсади складом в рідкій формі і внесення гранул на грядки для розсади. Також включається обробка посадкових ям гранулами і введення гранул в культуральне середовище поблизу точок

10 посадки під час фіксованої посадки.

Сільськогосподарський і садівничий інсектицидний і акарицидний засіб за даним винаходом звичайно використовується у вигляді композиції, зручної для застосування, яку готують звичайним способом отримання агрохімічних композицій.

Тобто похідне бензimidазолу, представлене загальною формулою (1) за даним винаходом, або його сіль і відповідний неактивний носій і, якщо необхідно, ад'ювант, змішують у відповідному співвідношенні і на стадії розчинення, розділення, суспендування, змішування, просочення, адсорбції і/або адгезії, складають форму, прийнятну для застосування, таку як суспензійний концентрат, емульгований концентрат, розчинний концентрат, змочуваний порошок, вододисперговані гранули, гранули, пилоподібний препарат, таблетки і упаковка.

20 Композиція (сільськогосподарський і садівничий інсектицидний і акарицидний засіб або агент для боротьби з паразитами тварин) за даним винаходом в доповнення до активного інгредієнта необов'язково може містити добавку, що звичайно використовується для агрохімічних складів або засобів для боротьби з паразитами тварин. Приклади добавки включають носії, такі як тверді або рідкі носії, поверхнево-активні речовини, диспергатори, змочувальні агенти, зв'язувальні, речовини, що підвищують клейкість, загусники, барвники, розподільники, агенти, які прилипають/розтікаються, антифризи, агенти, які перешкоджають злежуванню, розпушувачі і стабілізуючі агенти. При необхідності як добавку можна використовувати консерванти, фрагменти рослин і т. д. Одна з цих добавок може використовуватися окремо, а також дві або більше з них можуть використовуватися в комбінації.

30 Приклади твердих носіїв включають природні мінерали, такі як кварц, глина, каолінит, пірофіліт, серицит, тальк, бентоніт, кислу глину, атапульгіт, цеоліт і діатоміт; неорганічні солі, такі як карбонат кальцію, сульфат амонію, сульфат натрію і хлорид калію; органічні тверді носії, такі як синтетична кремнієва кислота, синтетичні силікати, крохмаль, целюлоза і порошки з рослин (наприклад, тирса, шкаралупа кокоса, качани кукурудзи, стебла тютюну і т. д.;

35 пластмасові носії, такі як поліетилен, поліпропілен і полівініліденхлорид; сечовину; порожнисті неорганічні матеріали; порожнисті пластмасові матеріали; і колоїдний діоксид кремнію (біла сажа). Один з цих твердих носіїв може використовуватися окремо, а також два або більше з них можуть використовуватися в комбінації.

40 Приклади рідких носіїв включають спирти, включаючи одноатомні спирти, такі як метанол, етанол, пропанол, ізопропанол і бутанол, і багатоатомні спирти, такі як етиленгліколь, діетиленгліколь, пропіленгліколь, гексиленгліколь, поліетиленгліколь, поліпропіленгліколь і гліцерин; сполуки поліолу, такі як простий ефір пропіленгліколю; кетони, такі як ацетон, метилетилкетон, метилізобутилкетон, діізобутилкетон і циклогексанон; прості ефіри, такі як етиловий ефір, діоксан, моноетиловий ефір етиленгліколю, простий дипропіловий ефір і

45 тетрагідрофуран; аліфатичні вуглеводні, такі як нормальний парафін, нафтен, ізопарафін, гас і мінеральне масло; ароматичні вуглеводні, такі як бензол, толуол, ксилол, нафта-розчинник і алкілнафталін; галогеновані аліфатичні вуглеводні, такі як дихлорметан, хлороформ і чотирехлористий вуглець; складні ефіри, такі як етилацетат, діізопропілфталат, дибутилфталат, діоктилфталат і диметиладипат; лактони, такі як γ -бутиролактон; аміди, такі як диметилформамід, діетилформамід, диметилацетамід і N-алкілпіролідіон; нітрили, такі як ацетонітрил; сполуки сірки, такі як диметилсульфоксид; рослинні олії, такі як соєва олія, ріпакова олія, олія насіння бавовни і рицинова олія; і воду. Один з цих рідких носіїв може використовуватися окремо, а також два або більше з них можуть використовуватися в комбінації.

55 Приклади поверхнево-активних речовин, що використовуються як диспергатор або змочувальний/розподіляючий агент, включають неіоногенні поверхнево-активні речовини, такі як складний ефір сорбітану і жирної кислоти, складний ефір поліоксіетиленсорбітану і жирної кислоти, ефір жирної кислоти і сахарози, поліоксіетиленовий ефір жирної кислоти, поліоксіетиленовий ефір смоляної кислоти, поліоксіетиленовий діефір жирної кислоти,

60 поліоксіетиленалкіловий ефір, поліоксіетиленалкілариловий ефір,

поліоксіетиленакліфеніловий ефір, поліоксіетилендіалкілфеніловий ефір, конденсати поліоксіетиленакліфенілового ефіру і формальдегіду, блок-співполімери поліоксіетилену і поліоксипропілену, блок-полімери полістиролу і поліоксіетилену, алкіловий ефір блок-співполімера поліоксіетилену і поліпропілену, поліоксіетиленакліамін, амід поліоксіетиленажирної кислоти, біс(феніловий ефір), поліалкіленбензилфеніловий ефір, поліоксіалкіленстирилфеніловий ефір, ацетилендіол, ацетилендіол з додаванням поліоксіалкілену, силікон складноефірного типу, фторовані ПАР, поліоксіетиленована рицинова олія і поліоксіетилена-гідрогенізована рицинова олія; аніонні поверхнево-активні речовини, такі як алкілсульфати, сульфати поліоксіетиленаклілового ефіру, сульфати поліоксіетиленакліфенілового ефіру, сульфати поліоксіетиленастирилфенілового ефіру, алкілбензолсульфонати, алкіларил сульфони, лигносульфонати, алкілсульфосукцинати, нафталінсульфонати, алкілнафталінсульфонати, солі конденсатів нафталінсульфонової кислоти і формальдегіду, солі конденсатів алкілнафталінсульфонової кислоти і формальдегіду, солі жирних кислот, солі полікарбонатових кислот, поліакрилати, саркозинати N-метилжирних кислот, резинати, фосфати поліоксіетиленаклілового ефіру і фосфати поліоксіетиленакліфенілового ефіру; катіонні поверхнево-активні речовини, включаючи солі алкіламінів, такі як гідрохлорид лауриламину, гідрохлорид стеариламину, гідрохлорид олеїламину, ацетат стеариламину, ацетат стеариламінопропіламину, хлорид алкілтриметиламонію і хлорид алкілдиметилбензалконію; і амфотерні поверхнево-активні речовини, такі як амфотерні поверхнево-активні речовини амінокислотного або бетаінового типу. Одну з цих поверхнево-активних речовин можна використовувати окремо, а також можна використовувати два або більше з них в комбінації.

Приклади зв'язувальних речовин або речовин, що підвищують клейкість, включають карбоксиметилцелюлозу або її солі, декстрин, розчинний крохмаль, ксантанову камедь, гуарову камедь, сахарозу, полівінілпіролідон, аравійську камедь, полівініловий спирт, полівінілацетат, поліакрилат натрію, поліетиленгліколі із середньою молекулярною масою від 6000 до 20000, поліетиленоксиди із середньою молекулярною масою від 100000 до 5000000, фосфоліпіди (наприклад, цефалін, лецитин і т. д.), порошок целюлози, декстрин, модифікований крохмаль, хелатуючі сполуки поліамінокарбонатової кислоти, зшитий полівінілпіролідон, співполімери малеїнової кислоти і стиролу, співполімери (мет)акрилової кислоти, напівефіри полімеру багатоатомного спирту і ангідриду дикарбонатової кислоти, водорозчинні сульфони полістиролу, парафін, терпен, поліамідні смоли, поліакрилати, поліоксіетилена, віск, полівінілалювий ефір, конденсати алкілфенолформальдегіду і емульсії синтетичних смол.

Приклади загусників включають водорозчинні полімери, такі як ксантанова камедь, гуарова камедь, діутанова камедь, карбоксиметилцелюлоза, полівінілпіролідон, карбоксивінілові полімери, акрилові полімери, сполуки крохмалю і полісахариди; і неорганічні тонкоподрібнені порошки, такі як високоякісний бентоніт і колоїдний діоксид кремнію (біла сажа).

Приклади барвників включають неорганічні пігменти, такі як оксид заліза, оксид титану і берлінську блакить; і органічні барвники, такі як алізаринові барвники, азобарвники і металофталоціанінові барвники.

Приклади антифризів включають багатоатомні спирти, такі як етиленгліколь, діетиленгліколь, пропіленгліколь і гліцерин.

Приклади ад'ювантів, які служать для запобігання злежуванню або полегшенню подрібнення, включають полісахариди (крохмаль, альгінова кислота, маноза, галактоза і т. д.), полівінілпіролідон, колоїдальний діоксид кремнію (біла сажа), складноефірну камедь, нафтову смолу, триполіфосфат натрію, гексаметафосфат натрію, стеарати металів, порошок целюлози, декстрин, співполімери метакрилату, полівінілпіролідон, хелатуючі сполуки поліамінокарбонатової кислоти, співполімери сульфонованого стиролу, ізобутилену і малеїнового ангідриду і прищеплені співполімери крохмалю і поліакрилонітрилу.

Приклади стабілізуючих агентів включають осушувачі, такі як цеоліт, негашене вапно і оксид магнію; антиоксиданти, такі як сполуки фенолу, аміносполуки, сполуки сірки і сполуки фосфорної кислоти; і поглиначі ультрафіолету, такі як сполуки саліцилової кислоти і сполуки бензофенону.

Приклади консервантів включають сорбат калію і 1,2-бензотіазолін-3-он. Крім того, при необхідності також можуть бути використані інші ад'юванти, включаючи функціональні агенти для розподілу, підсилювачі активності, такі як метаболічні інгібітори (піперонілбутоксид і т. д.), антифризи (пропіленгліколь і т. д.), антиоксиданти (ВНТ і т. д.) і поглиначі ультрафіолету.

Кількість активного інгредієнта в сільськогосподарському і садівничому інсектицидному і акарицидному засобі за даним винаходом може бути відрегульована по мірі необхідності, і в основному кількість активного інгредієнта відповідним чином вибирається з діапазону від 0,01

до 90 частин по масі в 100 частинах по масі сільськогосподарського і садового інсектициду. Наприклад, у випадку, коли сільськогосподарський і садівничий інсектицид являє собою пилоподібний препарат, гранули, емульгований концентрат або змочуваний порошок, підходить кількість активного інгредієнта від 0,01 до 50 частин по масі (від 0,01 до 50 % по масі по відношенню до загальної маси сільськогосподарського і садівничого інсектицидного і акарицидного засобу).

Норми застосування сільськогосподарських і садових інсектицидних і акарицидних засобів за даним винаходом можуть варіюватися залежно від різних чинників, наприклад, мети, цільового шкідника, умов вирощування сільськогосподарських культур, тенденції зараження шкідниками, погоди, умов навколишнього середовища, дозованої форми, способу застосування, місця застосування, часу застосування і т. д., але в основному витрату активного інгредієнта відповідно вибирають з діапазону від 0,001 г до 10 кг, переважно, від 0,01 г до 1 кг на 10 ар, залежно від мети.

Крім того, для розширення кола цільових шкідників і прийнятного часу для боротьби зі шкідниками або для зниження його дози сільськогосподарський і садівничий інсектицидний і акарицидний засіб за даним винаходом можна використовувати після змішування з іншим сільськогосподарським і садівничим інсектицидним і акарицидним засобом, акарицидами, нематодцидами, мікробіцидами, біопестицидами і/або тому подібне. Крім того, сільськогосподарський і садівничий інсектицидний і акарицидний засіб можна використовувати після змішування з гербіцидами, регуляторами росту рослин, добривами і/або подібними, залежно від ситуації.

Приклади таких додаткових сільськогосподарських і садівничих інсектицидів, акарицидів і нематодцидів, що використовуються для вищезазначених цілей, включають 3,5-ксилілметилкарбамат (ХМС), токсини кристалічного білка, які продукуються *Bacillus thuringiensis*, такими як *Bacillus thuringiensis aizawai*, *Bacillus thuringiensis israelensis*, *Bacillus thuringiensis japonensis*, *Bacillus thuringiensis kurstaki* і *Bacillus thuringiensis tenebrionis*, ВРМС, інсектицидні сполуки, отримані з токсину Bt, СРСBS (хлорфенсон), DCIP (дихлордіізопропіловий ефір), DD (1,3-дихлорпропен), DDT, NAC, О-4-диметилсульфамоїлфеніл О, О-діетилфосфоротіоат (DSP), О-етил О-4-нітрофенілфенілфосфонотіоат (EPNN), трипропілізоціанурат (ТПІС), акринатрин, азадирахтин, азинфос-метил, ацеквіноцил, ацетаміприд, ацетопрол, ацефат, абамектин, авермектин-В, амідофлумет, амітраз, аланікарб, альдикарб, альдоксикарб, альдрин, альфа-ендосульфат, альфа-цибетосперметрин, альфа-цибендазин ізоамідифос, ізоксатіон, ізофенфос, ізопрокарб (MIPC), івермектин, іміціафос, імідаклоприд, іміпротрин, индосакарб, есфенвалерат, етіофенкарб, етіон, етипрол, етоксазол, етофенпрокс, етопрофос, етримфос, емаектин, емаектин-бензоат, ендосульфат, емпентрин, оксаміл, оксидеметон-метил, оксидепрофос (ESP), оксibenдазол, оксфендазол, олеат калію, олеат натрію, кадусафос, картап, карбарил, карбосульфат, карбофуран, гамма-цигалотрин, ксилілкарб, хіналофос, кінопрен, хінометіонат, клоетокарб, клотіанідин, клофентезин, хромафенозид, хлорантраніліпрол, хлоретоксифос, хлордимеформ, хлордан, хлорпірифос, хлорпірифос-метил, хлорфенапір, хлорфенсон, хлорфенвінфос, хлорфлуазурон, хлорбензилат, хлорбензоат, кельтан (дикофол), салитіон, ціанофос (CYAP), діафентіурон, діамідафос, ціантраніліпрол, тета-циперметрин, діенохлор, цієнопірафен, діоксабензофос, діофенолан, сигма-циперметрин, дихлофентіон (ECP), циклопротрин, дихлофос (DDVP), дисульфотон, динотефуран, цигалотрин, цифенотрин, цифлутрин, дифлубензурон, цифлуметофен, дифловідазин, цигексатин, циперметрин, диметилвінфос, диметоат, димефлутрин, силафлуфен, циромазин, спінеторам, спіносад, спіродиклофен, спіротетрамат, спіромезифен, сульфлурамід, сульфпрофос, сульфоксафлор, зета-циперметинатин, діазинон, тау-флувалінат, дазомет, тіаклоприд, тіаметоксам, тіудикарб, тіоциклам, тіосультап, тіосультап-натрій, тіоназин, тіометон, деет, диеддрин, тетрахлорвінфос, тетрадифон, тетраметилфлутрин, тетраметрин, тебупіримфос, тебуфенозид, тебуфенпірад, тефлутрин, тефлубензурон, деметон-S-метил, трамекс, трафаметосфос, триазурон, трихлорамід, трихлорфон (DEP), трифлумурон, толфенпірад, налед (BRP), нітіазин, нітенпірам, новалурон, новіфлумурон, гідропрен, ваніліпрол, вандотіон, паратіон, паратіон-метил, халфенпрокс, галофенозид, бістрифлурун, бісультап, гідраметилнон, гідроксипропілкрохмаль, бінапакрил, біфеназат, біфентрин, піметрозин, піраклофос, пірафлупрол, піридафентіон, піридабен, піридаліл, пірифлухіназон, пірипрол, пірипроксифен, піримікарб, піримідифен, піриміфос-метил, піретрини, фіпроніл, феназахін, фенаміфос, бромпропілат, фенітротіон (MEP), феноксикарб, фенотіокарб, фенотрин, фенобукарб, фенсульфотіон, фентіон (MPP), фентоат (FAP), фенвалерат, фенпіроксимат, фенпропатрин, фенбендазол, фостіазат, форметанат, бутатіофос, бупрофезин, фураціокарб, паралетрин, флуакрипірим, флуазинам, флуазурон, флуенсульфон, флуциклоксурон, флуцитринат,

флувалінат, флупіразофос, флуфенерим, флуфеноксурон, флуфензин, флуфенпрокс,
 флупроксифен, флуброцитринат, флубендіамід, флуметрин, флууримфен, протіофос,
 протрифенбут, флонікамід, пропафос, пропаргіт (BPPS), профенофос, профлутрин, пропоксур
 5 (PHC), бромпропілат, бета-цифлутрин, гексафлумурон, гекситіазокс, гептенофос, перметрин,
 бенклотіаз, бендіокарб, бенсултап, бензоксимат, бенфуракарб, фоксим, фосфалон, фостіазат,
 фостіетан, фосфамідон, фосфокарб, фосмет (PMP), полінактини, форметанат, формотіон,
 форат, машинне масло, малатіон, мілбеміцин, мілбеміцин-А, мілбемектин, мекарбам,
 месульфенфос, метоміл, метальдегід, метафлумізон, метамідофос, метам-амоній, метам-
 натрій, метіокарб, метидатіон (DMTP), метилізотіоціанат, метилнеодеканамід, метилпаратіон,
 10 метоксадіазон, метоксихлор, метоксифенозид, метофлутрин, метопрен, метолкарб,
 меперфлутрин, мевінфос, монокротофос, моносультап, лямбда-цигалотрин, ріанодин,
 луфенурон, ресметрин, лепімектин, ротенон, левамізолу гідрохлорид, фенбутатин оксид,
 морантел тартарат, бромистий метил, гідроксид трициклогексилолова (цигексатин), ціанамід
 кальцію, полісульфід кальцію, сірка і нікотин-сульфат.
 15 Приклади сільськогосподарських і садівничих мікробіцидів, що використовуються для тих же
 цілей, що вказані вище, включають ауреофунгін, азаконазол, азитірам, аципетак, ацибензолар,
 ацибензолар-S-метил, азоксистробін, анілазин, амісульбром, ампропілфос, аметоктрадин,
 аліловий спирт, альдиморф, амобам, ізотіаніл, ізоваледіон, ізопіразам, ізопротіолан, іпконазол,
 іпродіон, іпровалікарб, іпробенфос, імазаліл, іміноктадин, іміноктадин-альбесилат, іміноктадин-
 20 триацетат, імібенконазол, уніконазол, уніконазол-P, ехломезол, едифенфос, етаконазол,
 етабоксам, етиримол, етем, етоксихин, етридіазол, енестробуурин, епоксиконазол, оксадиксил,
 оксикарбоксин, 8-хінолінолат міді, окситетрациклін, оксинат міді, окспоконазол, окспоконазол-
 фумарат, оксолінову кислоту, октхілінон, офурац, оризастробін, метам-натрій, касугаміцин,
 карбаморф, карпропамід, карбендазим, карбоксин, карвон, хіназамід, хінацетол, хіноксифен,
 25 хінометіонат, каптафол, каптан, киралаксил, хінконазол, квінтозен, гуазатин, куфранеб,
 купробам, гліудин, гризеофульвін, клімбазол, крезол, крезоксим-метил, хлзолінат,
 клотримазол, хлорбентіазон, хлораніформетан, хлораніл, хлорхінокс, хлорпікрин, хлорфеназол,
 хлординітронафталін, хлороталоніл, хлоронеб, зариламід, саліциланілід, ціазофамід,
 діетилпірокарбонат, діетофенкарб, циклафурамід, диклоцимет, дихлзолін, диклобутразол,
 30 дихлофлуанід, циклогексимід, дикломезин, диклоран, дихлорфен, дихлон, дисульфірам,
 диталімфос, дитіанон, диніконазол, диніконазол-M, цинеб, динокап, диноктон, диноссульфон,
 динотербон, динобутон, динопентон, дипіритіон, дифеніламін, дифеноконазол, цифлуфенамід,
 дифлуметорим, ципроконазол, ципродиніл, ципрофурам, ципендазол, симеконазол,
 35 диметиримол, диметоморф, цимоксаніл, димоксистробін, метилбромід, цирам, силтіофам,
 стрептоміцин, спіроксамін, сультропен, седаксан, зоксамід, дазомет, тіадіазин, тіадиніл,
 тіадифтор, тіабендазол, тіоксимід, тіохлорфенфим, тіофанат, тіофанат-метил, тиціофен,
 тіохінокс, хінометіонат, тифлузамід, тирам, декафентин, текназен, теклофталам, текорам,
 тетраконазол, дебакарб, дегідрооцтову кислоту, тебуконазол, тебуфлорин, додицин, додин,
 додецилбензолсульфонат, біс-етилендімін міді (II) (DBEDC), додеморф, дразоксолон,
 40 триадименол, триадимефон, триазбутил, триазоксид, триамифос, триаримол, трихпамід,
 трициклазол, тритіконазол, тридеморф, оксид трибутилолова, трифлумізол, трифлуксистробін,
 трифорин, толілфлуанід, толклофос-метил, натаміцин, набам, нітроталізопропіл, нітростирол,
 нуаримол, нонілфенол сульфонат міді, галакринат, валідаміцин, валифеналат, білок гарпін,
 біксафен, пікоксистробін, пікобензамід, бітіонол, бітертанол, гідроксіізоксазол, гідроксіізоксазол-
 45 калій, бінапакрил, біфеніл, піпералін, гімексазол, піраоксистробін, піракарболід, піраклостробін,
 піразофос, піраметостробін, піріофенон, піридинітрил, пірифенокс, пірибенкарб, піриметаніл,
 піроксихлор, піроксифур, піроквілон, вінклозолін, фамоксадон, фенапаніл, фенамідон,
 фенаміносульф, фенаримол, фенітропан, феноксаніл, феримзон, фербам, фентин,
 фенпіклоніл, фенпіразамін, фенбуконазол, фенфурам, фенпропідин, фенпропіморф,
 50 фенгексамід, фталід, бутіобат, бутиламін, бупіримат, фуберідазол, бластицидин-S,
 фураметпір, фуралаксил, флуакрипірим, флуазинам, флуоксастробін, флуотримазол,
 флуопіколід, флуопірам, фторимід, фуркарбаніл, флуксапіроксад, флухіконазол, фурконазол,
 фурконазол-цис, флудіоксоніл, флусилазол, флусульфамід, флутіаніл, флутоланіл,
 флутриафол, фурфурол, фурмециклокс, флуметовер, флуморф, проквіназид, прохлораз,
 55 процимідон, протіокарб, протіоконазол, пропамокарб, пропіконазол, пропінеб, фуурофанат,
 пробеназол, бромуконазол, гексахлорбутадиен, гексаконазол, гексилтіофос, бетоксазин,
 беналаксил, беналаксил-M, беноданіл, беноміл, пefуразоат, бенхінокс, пенконазол,
 бенцаморф, пенцикурон, бензогідроксамову кислоту, бенталурон, бентіазол, бентіавалікарб-
 ізопропіл, пентіопірад, пенфлуфен, боскалід, фосдифен, фосетил, фосетил-Al, поліоксини,
 60 поліоксорим, полікарбамат, фолпет, формальдегід, машинне масло, манеб, манкозеб,

мандипропамід, міклозолін, міклобутаніл, мілдіоміцин, мілнеб, мекарбінзид, метасульфокарб, метазоксолон, метам, метам-натрій, металаксил, металаксил-М, метирам, метилізотіоціанат, мептилдинокап, метконазол, метсульфовакс, метфуроксам, метоміностробін, метрафенон, меланіпірим, мефеноксам, мептилдинокап, мепроніл, мебеніл, йодметан, рабензазол, хлорид

5 бензалконію, основний хлорид міді, основний сульфат міді, неорганічні мікробіциди, такі як срібло, гіпохлорит натрію, гідроксид міді, змочувана сірка, полісульфід кальцію, гідрокарбонат калія, гідрокарбонат натрію, сірка, ангідрид сульфату міді, диметилдитіокарбамаат нікелю, сполуки міді, такі як 8-хінолінолат міді (оксин міді), сульфат цинку і пентагідрат сульфату міді.

10 Приклади гербіцидів, що використовуються для тих же цілей, що і вище, включають 1-нафтилацетамід, 2,4-РА, 2,3,6-ТВА, 2,4,5-Т, 2,4,5-ТВ, 2,4-Д, 2,4-ДВ, 2,4-ДЕВ, 2,4-ДЕР, 3,4-ДА, 3,4-ДВ, 3,4-ДР, 4-СРА, 4-СРВ, 4-СРР, МСР, МСРА, МСРА-тіоетил, МСРВ, йоксиніл, аклоніфен, азафенідин, ацифлуорфен, азипротрин, азимсульфурон, асулам, ацетохлор, атразин, атратон, анісурон, анілофос, авігліцин, абсцизову кислоту, амікарбазон, амідосульфурон, амітрол, аміноциклопірахлол, амінопіралід, амібозин, аміпрофос-метил, аметридіон, аметрин, алахлор,

15 алідохлор, алоксидим, алорак, ізоурон, ізокарбамід, ізоксахлолтол, ізоксапірифоп, ізоксафлутол, ізоксабен, ізоцил, ізонорурон, ізопротурон, ізопропалін, ізополінат, ізометіозин, інабенфід, іпазин, іпфенкарбазон, іпримідам, імазаквін, імазапик, імазапир, імазаметапир, імазаметабенз, імазаметабенз-метил, імазамокс, імазетапир, імазосульфурон, індазифлам, інданофан, індолмасляну кислоту, уніконазол-Р, егліназин, еспрокарб, етаметсульфурон,

20 етаметсульфурон-метил, еталфлуралін, етіолат, етихлосат-етил, етидимурон, етинофен, етифон, етоксисульфурон, етоксифен, етніпромід, етофумесат, етобензанід, епроназ, ербон, ендотал, оксадіазон, оксадіаргіл, оксазикломефон, оксасульфурон, оксапіразон, оксифлуорфен, оризалін, ортосульфамурон, орбенкарб, кафенстрол, камбендихлор, карбасулам, карфентразон, карфентразон-етил, карбутилат, карбетамід, карбоксазол, хізалофоп, хізалофоп-Р, хізалофоп-етил, ксилахлор, хінокламін, хінонамід, квінклолак, хінмерак, кумілурун, кліодинат, гліфосат, глюфосинат, глюфосинат-Р, кредазин, клетодим, клоксифонак, клодинафоп, клодинафоп-пропаргіл, хлортолурун, клопіралід, клопроксидим, клопроп, хлорбромурон, клофоп, кломазон, хлометоксиніл, хлорметоксифен, кломепроп, хлоразифоп, хлоразин, клорансулам, хлоранокрил, хлорамбен, клорансулам-метил, хлоридазон, хлоримурон,

30 хлоримурон-етил, хлорсульфурон, хлортал, хлортіамід, хлортолурун, хлорнітрофен, хлорфенак, хлорфенпроп, хлорбуфам, хлорфлуразол, хлорфлуренол, хлорпрокарб, хлорпрофам, хлормекват, хлоретурон, хлороксиніл, хлороксурон, хлоропон, сафлуфенацил, ціаназин, ціанатрин, ді-алат, діурон, діетамкват, дикамба, циклурун, циклоат, циклоксидим, диклосулам, циклосульфамурон, дихлорпроп, дихлорпроп-Р, дихлобеніл, диклофоп, диклофоп-метил, дихлормат, дихлорасечовина, дикват, цисанілід, дисул, сидурон, дитіопір, динітрамін, цинідон-етил, диносам, циносульфурон, диносеб, динотерб, динофенат, динопроп, цигалофоп-бутил, дифенамід, дифеноксурон, дифенопентен, дифензокват, цибутрин, ципразин, ципразол, дифлуфенікан, дифлуфензопір, дипропетрин, ципромід, циперкват, гіберелін, симазин, димексано, диметахлор, димідазон, диметаметрин, диметенамід, симетрин, симетон,

40 димепіперат, димефурон, цинметилін, свеп, сулглікапін, сульфотрион, сульфалат, сульфентразон, сульфосульфурон, сульфометурон, сульфометурон-метил, секбуметон, сетоксидим, себутилазин, тербацил, даймурун, дазомет, далапон, тіазафлурун, тіазопір, тіенкарбазон, тіенкарбазон-метил, тіокарбазил, тіоклорим, тіобенкарб, тидіазимін, тидіазурон, тифенсульфурон, тифенсульфурон-метил, десмедифам, десметрин, тетрафлурун, тенілхлор,

45 тебутам, тебутиурон, тербуметон, тепралоксидим, тефурилтрион, темботрион, делахлор, тербацил, тербукарб, тербухлор, тербутилазин, тербутрин, топрамезон, тралкоксидим, триазифлам, триасульфурон, три-алат, триетазин, трикамба, триклопир, тридифан, тритак, тритосульфурон, трифлусульфурон, трифлусульфурон-метил, трифлуралін, трифлуксисульфурон, трипропіндан, трибенурон-метил, трибенурон, трифоп, трифопсим, триметурон, напталам, напроанілід, напропамід, никосульфурон, нітралін, нітрофен, нітрофлуорфен, ніпіраклофен, небурон, норфлуразон, норурон, барбан, паклобутразол, паракват, парафлурун, галоксидин, галоксифоп, галоксифоп-Р, галоксифоп-метил, галосафен, галосульфурон, галосульфурон-метил, піклорам, піколінафен, біциклопирон, біспірибак, біспірибак-натрію, піданон, піноксаден, біфенокс, піперофос, гімексазол, піраклоніл, пірасульфотол, піразоксифен, піразосульфурон, піразосульфурон-етил, піразолат, біланафос, пірафлуфен-етил, піриклор, піридафол, піритіобак, піритіобак-натрій, піридат, пірифталід, пірибутикарб, пірибензоксим, піримісульфан, примісульфурон, піримінобак-метил, піроксасульфоп, піроксулам, фенасулам, фенізофам, фенурон, феноксасульфоп, феноксапроп, феноксапроп-Р, феноксапроп-етил, фенотіол, фенопроп, фенобензурун, фентіапроп,

60 фентеракол, фентразамід, фенмедифам, фенмедифам-етил, бутахлор, бутафенацил,

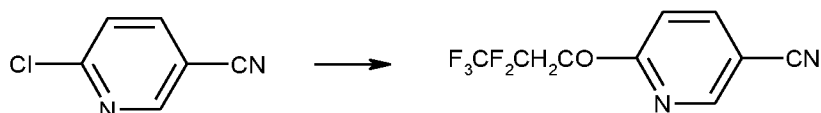
бутамифос, бутиурон, бутидазол, бутилат, бутурон, бутенахлор, бутроксидим, бутралін, флазасульфурон, флампроп, фурилоксифен, принахлор, примісульфурон-метил, флауазифоп, флауазифоп-Р, флауазифоп-бутил, флауазолат, флуороксіпір, флуотиурон, флуометурон, фторглікофен, флуорохлоридон, фтордифен, фторнітрофен, флуоромідин, флукарбазон, флукарбазон-натрій, флухлоралін, флуцетосульфурон, флутіацет, флутіацет-метил, флупірсульфурон, флуфенацет, флуфеникан, флуфенпір, флупропацил, флупропанат, флупоксам, флуміоксазин, флуміклорак, флуміклорак-пентил, флуміпропін, флумезин, флуометурон, флуметсулам, флуридон, флуртамон, флуороксіпір, претилахлор, проксан, прогліназин, проціазин, продимін, просульфалін, просульфурон, просульфокарб, пропаквізафоп, пропахлор, пропазин, пропаніл, пропізамід, пропізохлор, прогідрожасмон, пропірсульфурон, профам, профлуазол, профлуралін, прогексадіон-кальцій, пропоксикарбазон, пропоксикарбазон-натрій, профоксидим, бромацил, бромпіразон, прометрин, прометон, бромоксиніл, бромфеноксим, бромбутид, бромобоніл, флорасулам, гексахлорацетон, гексазинон, петоксамід, бензасолін, пеноксиулам, пебулат, бєфлутамід, вернолат, перфлуїдон, бенкарбазон, бензадокс, бензипрам, бензиламінопурин, бензтіазурон, бензфендизон, бенсулід, бенсульфурон-метил, бензоїлпроп, бензобіциклон, бензофенап, бензофтор, бентазон, пентанохлор, бентіокарб, пендиметалін, пентоксазон, бенфлуралін, бенфуресат, фозамін, фомесафен, форамсульфурон, форхлорфенурон, гідразид малеїнової кислоти, мекопроп, мекопроп-Р, мединотерб, мезосульфурон, мезосульфурон-метил, мезотрион, мезопразин, метопротрин, метазахлор, метазол, метазосульфурон, метабензтіазурон, метамітрон, метамифоп, метам, метальпропалін, метиурон, метіозолін, метіобенкарб, метилдимрон, метоксурон, метосулам, метсульфурон, метсульфурон-метил, метфлуразон, метобромурон, метобензурон, метометон, метолахлор, метрибузин, мепікват-хлорид, мефенацет, мефлуїдид, моналід, монісурон, монурон, монохлороцтову кислоту, монолінурон, молінат, морфамкват, йодосульфурон, йодосульфурон-метил-натрій, йодобоніл, йодметан, лактофен, линурон, римсульфурон, ленацил, родетаніл, пероксид кальцію і бромистий метил.

Приклади біопестицидів, що використовуються для тих же цілей, що і вище, включають вірусні препарати, такі як віруси ядерного поліедрозу (NPV), віруси гранульозу (GV), віруси цитоплазматичного поліедрозу (CPV) і віруси ентомопексії (EPV); мікробні пестициди, що використовуються як інсектицид або нематодцид, такі як *Monacrosporium rhynatophagum*, *Steinernema carpocapsae*, *Steinernema kushidai* і *Pasteuria penetrans*; мікробні пестициди, що використовуються як мікробіциди, такі як *Trichoderma lignorum*, *Agrobacterium radiobactor*, авірулентні *Erwinia carotovora* і *Bacillus subtilis*; і біопестициди, що використовуються як гербіцид, такі як *Xanthomonas campestris*. Можна чекати, що таке комбіноване використання інсектицидного і акарицидного засобу в сільському господарстві і садівництві за даним винаходом з вищезгаданим біопестицидом у вигляді суміші дасть той же ефект, що і вище.

Інші приклади біопестицидів включають природних хижаків, таких як *Encarsia formosa*, *Aphidius colemani*, *Aphidoletes aphidimyza*, *Diglyphus isaea*, *Dacnusa sibirica*, *Phytoseiulus persimilis*, *Amblyseius cucumeris* і *Orius sauteri*; мікробні пестициди, такі як *Beauveria brongniartii*; і феромони, такі як (Z)-10-тетрадеценілацетат, (E, Z)-4,10-тетрадекадієнілацетат, (Z)-8-додеценілацетат, (Z)-11-тетрадеценілацетат, (Z)-13-ікозен-10-он і 14-метил-1-октадецен.

Далі в цьому документі будуть більш детально описані приклади отримання типових сполук за даним винаходом і їх проміжних сполук, але даний винахід не обмежується тільки цими прикладами.

Приклад
Посилальний приклад 1
Приклад отримання проміжної сполуки (2-2)
Спосіб отримання 5-ціано-2-(2,2,3,3,3-пентафторпропілокси)піридину
[Формула 9]



2-Хлор-5-ціанопіридин (4,16 г, 30 ммоль) розчиняли в NMP (60 мл), додавали 2,2,3,3,3-пентафторпропанол (6,77 г, 1,5 еквіваленти) і карбонат калію (12,4 г, 3,0 еквіваленти) і потім розчин нагрівали при температурі 100 °С і піддавали взаємодії протягом 2 годин. Після охолодження реакційного розчину до кімнатної температури додавали воду і етилацетат для розділення розчину, і органічний шар промивали насиченим сольовим розчином і потім сушили над сульфатом натрію. Після відгонки розчинника здійснювали очищення шляхом колонкової хроматографії з отриманням бажаної сполуки (7,03 г, вихід 93 %).

Посилальний приклад 2

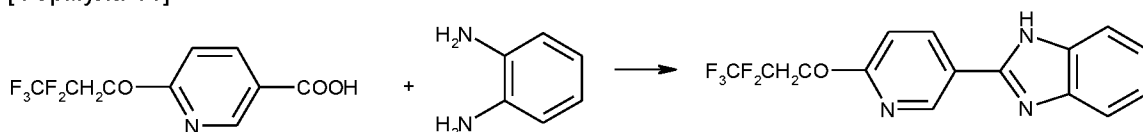
Спосіб отримання 6-(2,2,3,3,3-пентафторпропілокси)нікотинової кислоти
[Формула 10]



- 5 5-Ціано-2-(2,2,3,3,3-пентафторпропілокси)піридин (6,02 г, 24 ммоль), отриманий на вищезгаданій стадії, розчиняли в етанолі і воді (30 мл) і додавали гідроксид натрію (9,60 г, 10 еквівалентів) і розчин кип'ятили із зворотним холодильником протягом 2 годин. Після охолодження розчину до кімнатної температури для нейтралізації на крижаній бані додавали по краплях 10 %-ний розчин соляної кислоти і здійснювали екстракцію етилацетатом.
- 10 Органічний шар промивали насиченим сольовим розчином і потім сушили над сульфатом натрію. Розчинник відганяли з отриманням суміші, що містить головним чином бажану сполуку (6,40 г).

Посилальний приклад 3

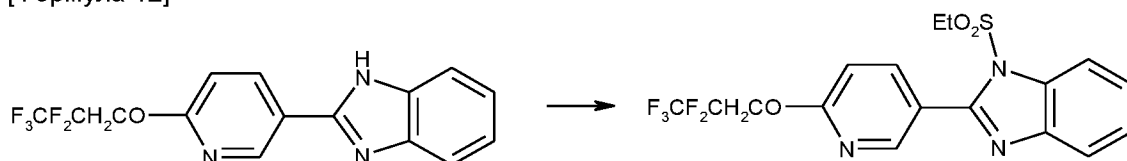
Спосіб отримання 2-(2-(2,2,3,3,3-пентафторпропілокси)піридин-5-іл)бензimidазолу
[Формула 11]



- 20 6-(2,2,3,3,3-Пентафторпропілокси)нікотинову кислоту (1,47 г, 5,4 ммоль) розчиняли в піридині (10 мл), додавали фенілендімін (0,70 г, 1,2 еквіваленти), DMAP (0,13 г, 0,2 еквіваленти) і EDC·HCl (1,54 г, 1,5 еквіваленти) і потім розчин піддавали взаємодії протягом 3 годин при кімнатній температурі. Для розділення розчину додавали воду і етилацетат і органічний шар промивали послідовно 10 %-ним розчином соляної кислоти, водним розчином карбонату калію і насиченим сольовим розчином і сушили над сульфатом натрію. Розчинник відганяли. Залишок розчиняли в NMP (10 мл), додавали моногідрат пара-толуолсульфонової кислоти (3,08 г, 3 еквіваленти) і потім розчин піддавали взаємодії протягом 1 години при температурі 140 °С.
- 25 Після охолодження розчину до кімнатної температури для розділення розчину додавали водний розчин карбонату калію і етилацетат. Органічний шар промивали насиченим сольовим розчином і сушили над сульфатом натрію. Після відгонки розчинника здійснювали очищення шляхом колонкової хроматографії з отриманням бажаної сполуки (0,67 г, вихід 36 % (з попередньої стадії)).

30 Приклад отримання 1

Спосіб отримання 2-(2-(2,2,3,3,3-пентафторпропілокси)піридин-5-іл)-1-етансульфоніл бензimidазолу (номер сполуки 1-2)
[Формула 12]



- 35 2-(2-(2,2,3,3,3-Пентафторпропілокси)піридин-5-іл)бензimidазол (610 мг, 1,8 ммоль), отриманий на вищезгаданій стадії, розчиняли в ТГФ (10 мл) і при кімнатній температурі при перемішуванні додавали 60 % гідроксид натрію (108 мг, 1,5 еквівалента). Після взаємодії протягом 10 хвилин додавали етансульфоніл хлорид (463 мг, 2,0 еквівалента) і піддавали взаємодії протягом 1 години. Послідовно додавали воду і етилацетат, органічний шар промивали послідовно водним розчином карбонату калію і насиченим сольовим розчином і сушили над сульфатом натрію. Після відгонки розчинника концентрований залишок очищали шляхом колонкової хроматографії з отриманням бажаної сполуки (695 мг, вихід 89 %).

Далі в цьому документі показані приклади складів, але даний винахід не обмежується ними. У прикладах складів "частина" означає частину по масі.

45 Приклад складу 1

Сполука за даним винаходом	10 частин
Ксилол	70 частин
N-метилпіролідон	10 частин

	Суміш поліоксіетиленнонілфенілового ефіру і алкілбензолсульфонату кальцію	10 частин
	Вищезгадані інгредієнти однорідно змішують для розчинення з отриманням складу емульгованого концентрату.	
	Приклад складу 2	
5	Сполука за даним винаходом	3 частини
	Порошок глини	82 частин
	Діатомітовий порошок	15 частин
	Вищезгадані інгредієнти однорідно змішують і потім подрібнюють з отриманням пилоподібного препарату.	
	Приклад складу 3	
10	Сполука за даним винаходом	5 частин
	Суміш бентонітового порошку і порошку глини	90 частин
	Лігносульфонат кальцію	5 частин
	Вищезгадані інгредієнти однорідно змішують. Після додавання відповідного об'єму води суміш замішують, гранують і сушать, отримуючи гранульований склад.	
	Приклад складу 4	
15	Сполука за даним винаходом	20 частин
	Каолін і синтетична вискодисперсна кремнієва кислота	75 частин
	Суміш поліоксіетиленнонілфенілового ефіру і алкілбензолсульфонату кальцію	5 частин
	Вищезгадані інгредієнти однорідно змішують і потім подрібнюють з отриманням складу змочуваного порошку.	
	Приклад отримання 5	
20	Сполука за даним винаходом	20 частин
	Поліоксіетиленлауриловий ефір	3 частини
	Натрію діоктилсульфосукцинат	3,5 частин
	Диметилсульфоксид	37 частин
	2-Пропанол	36,5 частин
	Вищезгадані інгредієнти однорідно змішують для розчинення з отриманням складу водорозчинного загусника.	
	Приклад отримання 6	
25	Сполука за даним винаходом	2 частини
	Диметилсульфоксид	10 частин
	2-Пропанол	35 частин
	Ацетон	53 частин
	Вищезгадані інгредієнти однорідно змішують для розчинення з отриманням препарату рідкого спрею.	
	Приклад отримання 7	
	Сполука за даним винаходом	5 частин
	Гексиленгліколь	50 частин
	Ізопропанол	45 частин
30	Вищезгадані інгредієнти однорідно змішують для розчинення з отриманням рідкого препарату для черезшкірного введення.	
	Приклад отримання 8	
	Сполука за даним винаходом	5 частин
	Монометилловий ефір пропіленгліколю	50 частин
	Дипропіленгліколь	45 частин

Вищезгадані інгредієнти однорідно змішують для розчинення з отриманням рідкого препарату для черезшкірного введення.

Приклад отримання 9

5

Сполука за даним винаходом	2 частини
Легкий рідкий парафін	98 частин

Вищезгадані інгредієнти однорідно змішують для розчинення з отриманням рідкого препарату для черезшкірного введення (полив).

Приклад отримання 10

10

Сполука за даним винаходом	2 частини
Легкий рідкий парафін	58 частин
Оливкова олія	30 частин
ODO-H	9 частин
ShinEtsu Silicone	1 частина

Вищезгадані інгредієнти однорідно змішують для розчинення з отриманням рідкого препарату для черезшкірного введення (полив).

Далі в цьому документі показані приклади випробувань в зв'язку з даним винаходом, але даний винахід не обмежується ними.

15

Приклад дослідження 1

Випробування на ефективність боротьби із зеленою персиковою попелицею (*Myzus persicae*)

20

Китайську капусту висаджували в пластикові горщики (діаметр: 8 см, висота: 8 см), на рослинах розмножували зелену персикову попелицю і підраховували кількість зелених персикових попелиць, що вижили, в кожному горщику. Похідні бензimidазолу, представлені загальною формулою (1) за даним винаходом, або їх солі окремо диспергували у воді і розбавляли до 500 ч/млн. Агрохімічні дисперсії наносили на листя горщикових рослин китайської капусти. Після сушіння рослин на повітрі горщики зберігали в теплиці. Через 6 днів після позакореневої підгодівлі підраховували кількість зелених персикових попелиць, що вижили, на китайській капусті в кожному горщику, розраховували норму контролю відповідно до наведеної нижче формули і оцінювали ефективність контролю відповідно до критеріїв, показаних нижче.

25

[Вираз 1]

30

Ступінь знищення= $100 - \{(T \times Ca) / (Ta \times C)\} \times 100$

Ta: кількість тих, які вижили перед позакореневим нанесенням на оброблюваній ділянці

T: кількість тих, що вижили після позакореневого нанесення на оброблюваній ділянці

Ca: кількість тих, що вижили перед позакореневим нанесенням на необроблюваній ділянці

C: кількість тих, що вижили після позакореневого нанесення на необроблюваній ділянці

35

Показники

A: ступінь знищення становить 100 %.

B: ступінь знищення становить від 90 до 99 %.

C: ступінь знищення становить від 80 до 89 %.

D: ступінь знищення становить від 50 до 79 %.

40

В результаті сполуки 1-3, 1-9, 1-10, 1-20, 1-24, 1-41, 1-42, 5-15, 5-17 і 5-24 за даним винаходом показали рівень активності, що оцінюється як A.

Приклад дослідження 2

Інсектицидний тест на маленькій коричневій цикадці (*Laodelphax striatellus*)

45

Похідне бензimidазолу, представлене загальною формулою (1) за даним винаходом, або його солі окремо диспергували у воді і розбавляли до 500 ч/млн. Саджанці рослин рису (сорт: Nihonbare) занурювали в агрохімічні дисперсії на 30 секунд. Після сушіння на повітрі кожен паросток вміщували в окрему скляну пробірку і інокулювали десятьма личинками 3-го віку маленької коричневої цикадки, а потім скляні пробірки закривали ватяними тампонами. Через 8 днів після інокуляції показники виживаності розраховували по кількості личинок, що вижили, і мертвих личинок, скоректований коефіцієнт смертності розраховували по формулі, показаній нижче, і інсектицидну ефективність оцінювали відповідно до критеріїв, показаних нижче.

50

[Вираз 2]

Скоректований коефіцієнт смертності (%)=(Коефіцієнт виживаності на ділянці без лікування-Рівень виживаності на оброблюваній ділянці)/(Коефіцієнт виживаності на ділянці без лікування)×100

Показники:

- 5 A: скоректований коефіцієнт смертності становить 100 %.
 B: скоректований коефіцієнт смертності становить від 90 до 99 %.
 C: скоректований коефіцієнт смертності становить від 80 до 89 %.
 D: скоректований коефіцієнт смертності становить від 50 до 79 %.
 В результаті 1-7, 1-10, 1-12, 1-13, і 5-15 за даним винаходом показали рівень активності, що оцінюється як А.

Приклад дослідження 3

Інсектицидний тест на молі ромбоподібній (*Plutella xylostella*)

- 15 Дорослих особин очеретяної молі випускали на паростки китайської капусти і дозволяли відкласти на них яйця. Через 2 дні після випускання імаго паростки китайської капусти з відкладеними яйцями занурювали приблизно на 30 секунд в агрохімічні дисперсії, розбавлені до 500 ч/млн, кожна з яких містила різне похідне бензimidазолу, представлене загальною формулою (1) за даним винаходом, або його сіль як активний інгредієнт. Після сушіння на повітрі паростки зберігали в термостатичній камері при 25 °С. Через 6 днів після обробки зануренням підраховували кількість личинок, що вилупилися на ділянці, розраховували скоректований рівень смертності відповідно до наведеної нижче формули і оцінювали інсектицидну ефективність відповідно до критеріїв випробувального прикладу 2. Це випробування проводили в трьох екземплярах, використовуючи 10 дорослих особин очеретяної молі на ділянку.

[Вираз 3]

- 25 Скоректований коефіцієнт смертності (%)=(Кількість личинок, що вилупилися, на необроблюваній ділянці-Кількість личинок, що вилупилися, на оброблюваній ділянці)/(Кількість личинок, що вилупилися, на необроблюваній ділянці)×100

- 30 В результаті 1-2, 1-3, 1-4, 1-6, 1-7, 1-9, 1-10, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-17, 1-18, 1-19, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-24, 1-40, 1-41, 1-42, 1-44, 1-45, 3-1, 5-2, 5-10, 5-12, 5-15, 5-18, 5-19 і 5-24 за даним винаходом показали рівень активності, що оцінюється як А.

Приклад дослідження 4

Акарицидна дія на павутинну двоплямистого кліщика (*Tetranychus urticae*)

- 35 Листовий диск діаметром 2 см готували з листя квасолі, і листовий диск вміщували на змочений фільтрувальний папір. Дорослих самиць павутинних двоплямистих кліщиків інокулювали на змоченому фільтрувальному папері, а потім на 50 мл агрохімічної дисперсії, приготованій шляхом розбавлення складу, що містить похідне бензimidазолу, представлене загальною формулою (1) даного винаходу, або його сіль у вигляді активного інгредієнта, щоб довести кожну з концентрацій до 500 ч/млн, рівномірно розпилювали на обертовий піднос. Після розпилення його залишали в термостатичній камері при 25 °С. Через два дні після обробки агрохімічної дисперсією підраховували кількість мертвих кліщів, скоректований рівень смертності розраховували відповідно до формули, показаної нижче, і акарицидну ефективність оцінювали відповідно до критеріїв тестового прикладу 2. Цей тест проводили два рази, використовуючи 10 дорослих самиць павутинних двоплямистих кліщиків на ділянці.

[Вираз 4]

- 45 Скоректована смертність (%)=(Кількість мертвих кліщів на необроблюваній ділянці-Кількість мертвих кліщів на оброблюваній ділянці)/(Кількість мертвих кліщів на необроблюваній ділянці)×100

- 50 В результаті 1-1, 1-2, 1-3, 1-4, 1-5, 1-10, 1-12, 1-13, 1-14, 1-15, 1-17, 1-18, 1-19, 1-20, 1-22, 1-23, 1-24, 1-40, 1-41, 1-42, 1-43, 1-44, 1-45, 1-46, 1-47, 1-48, 1-49, 1-50, 1-51, 3-1, 5-1, 5-2, 5-3, 5-4, 5-5, 5-6, 5-8, 5-9, 5-10, 5-11, 5-12, 5-14, 5-17, 5-18, 5-19, 5-20, 5-21, 5-24, 5-25 і 6-1 за даним винаходом показали рівень активності, що оцінюється як D або вище.

Приклад дослідження 5

Випробування на оцінку впливу на рухливість личинок нематоди *Haemonchus contortus*

- 55 Розбавлений в ДМСО розчин похідного бензimidазолу, представленого загальною формулою (1) за даним винаходом, або його солі вміщували в кожну ямку 96-ямкового планшета, що містить попередньо визначений приготований розчин, з отриманням кінцевої концентрації 50 ч/млн. Двадцять личинок нематоди *Haemonchus* на стадії L-1 випускали і залишали на 4 дні, а потім досліджували їх рухливість. Ступінь порушення рухливості на кожній

ділянці обробки коректувалася і розраховувалася на основі ефективності перешкоди одним розчином ДМСО і оцінювалася відповідно до критеріїв, показаних нижче.

Показники:

A: скоректована частота порушення моторики становить 100 %

5 B: скоректована частота порушення моторики становить від 99 % до 90 %

C: скоректована частота порушення моторики становить від 89 % до 80 %

D: скоректована частота порушення моторики становить від 79 % до 50 %

В результаті 1-9, 1-15, і 1-40 за даним винаходом показали рівень активності, що оцінюється як А.

10 Приклад дослідження 6

Випробування на оцінку впливу на рухливість личинок серцевого черв'яка собак (*Dirofilaria immitis*)

П'ятсот личинок собачого серцевого черв'яка на стадії L-1, розведених в попередньо визначеному приготованому розчині, інокулювали в кожну ямку 96-ямкового планшета, додавали розбавлений в ДМСО розчин похідного бензімідазолу, представленого загальною формулою (1) даного винаходу, або його сіль до кінцевої концентрації 50 ч/млн. Потім личинкам давали постояти 3 дні і досліджували їх рухливість. Ступінь порушення рухливості на кожній ділянці обробки коректувалася і розраховувалася на основі ефективності перешкоди одним розчином ДМСО, а ефективність впливу оцінювалася відповідно до критеріїв, показаних нижче.

20 Показники

A: скоректована частота порушення моторики становить 100 %

B: скоректована частота порушення моторики становить від 99 % до 90 %

C: скоректована частота порушення моторики становить від 89 % до 80 %

D: скоректована частота порушення моторики становить від 79 % до 50 %

25 В результаті 1-9, 1-15 і 1-40 за даним винаходом показали рівень активності, що оцінюється як А.

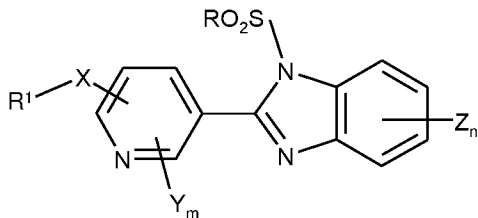
Промислова застосовність

Сполуки за даним винаходом є високоефективним для боротьби з широким спектром сільськогосподарських і садових шкідників і кліщів і, таким чином, є корисним.

30

ФОРМУЛА ВИНАХОДУ

1. Похідне бензімідазолу, представлене загальною формулою (1):



35

, формула (1)

де

R являє собою:

40 (a1) (C₁-C₈)алкільну групу;

(a2) (C₃-C₈)циклоалкільну групу;

(a3) (C₃-C₈)циклоалкіл(C₁-C₈)алкільну групу;

(a4) галоген(C₁-C₈)алкільну групу;

(a5) (C₂-C₈)алкенільну групу;

(a6) (C₂-C₈)алкінільну групу;

45 (a7) арильну групу або

(a8) арильну групу, що має від 1 до 5 замісників, які можуть бути однаковими або різними і вибрані з (a) атома галогену, (b) (C₁-C₆)алкільної групи, (c) галоген(C₁-C₆)алкільної групи, (d) (C₁-C₆)алкоксигрупи, (e) галоген(C₁-C₆)алкоксигрупи, (f) (C₁-C₆)алкілтіогрупи, (g) галоген(C₁-C₆)алкілтіогрупи, (h) (C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (i) галоген(C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (j) (C₁-C₆)алкілсульфонільної групи, (k) галоген(C₁-C₆)алкілсульфонільної групи і (l) три(C₁-C₆)алкілсилільної групи, де алкільні групи можуть бути однаковими або різними;

50

R' являє собою:

(b1) (C₁-C₈)алкільну групу;

(b2) галоген(C₁-C₈)алкільну групу;

- (b3) (C₃-C₈)циклоалкільну групу;
 (b4) галоген(C₃-C₈)циклоалкільну групу;
 (b5) (C₃-C₈)циклоалкіл(C₁-C₈)алкільну групу;
 (b6) галоген(C₃-C₈)циклоалкіл(C₁-C₈)алкільну групу;
 5 (b7) (C₂-C₈)алкенільну групу;
 (b8) галоген(C₂-C₈)алкенільну групу;
 (b9) (C₂-C₈)алкінільну групу;
 (b10) галоген(C₂-C₈)алкінільну групу;
 (b11) арильну групу;
 10 (b12) арильну групу, що має від 1 до 5 замісників, які можуть бути однаковими або різними і вибрані з (a) атома галогену, (b) (C₁-C₆)алкільної групи, (c) галоген(C₁-C₆)алкільної групи, (d) (C₁-C₆)алкоксигрупи, (e) галоген(C₁-C₆)алкоксигрупи, (f) (C₁-C₆)алкілтіогрупи, (g) галоген(C₁-C₆)алкілтіогрупи, (h) (C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (i) галоген(C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (j) (C₁-C₆)алкілсульфонільної групи, (k) галоген(C₁-C₆)алкілсульфонільної групи і (l) три(C₁-C₆)алкілсилільної групи, де алкільні групи можуть бути однаковими або різними;
 15 (b13) арил(C₁-C₈)алкільну групу;
 (b14) арил(C₁-C₈)алкільну групу, що має від 1 до 5 замісників, які можуть бути однаковими або різними і вибрані з (a) атома галогену, (b) (C₁-C₆)алкільної групи, (c) галоген(C₁-C₆)алкільної групи, (d) (C₁-C₆)алкоксигрупи, (e) галоген(C₁-C₆)алкоксигрупи, (f) (C₁-C₆)алкілтіогрупи, (g) галоген(C₁-C₆)алкілтіогрупи, (h) (C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (i) галоген(C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (j) (C₁-C₆)алкілсульфонільної групи, (k) галоген(C₁-C₆)алкілсульфонільної групи і (l) три(C₁-C₆)алкілсилільної групи, де алкільні групи можуть бути однаковими або різними;
 20 (b15) ароматичну гетероциклічну групу;
 25 (b16) ароматичну гетероциклічну групу, що має від 1 до 3 замісників, які можуть бути однаковими або різними і вибрані з (a) атома галогену, (b) (C₁-C₆)алкільної групи, (c) галоген(C₁-C₆)алкільної групи, (d) (C₁-C₆)алкоксигрупи, (e) галоген(C₁-C₆)алкоксигрупи, (f) (C₁-C₆)алкілтіогрупи, (g) галоген(C₁-C₆)алкілтіогрупи, (h) (C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (i) галоген(C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (j) (C₁-C₆)алкілсульфонільної групи, (k) галоген(C₁-C₆)алкілсульфонільної групи і (l) три(C₁-C₆)алкілсилільної групи, де алкільні групи можуть бути однаковими або різними;
 30 (b17) (C₁-C₈)алкоксі(C₁-C₈)алкільну групу;
 (b18) (C₁-C₈)алкілтіо(C₁-C₈)алкільну групу;
 (b19) (C₁-C₈)алкілсульфініл(C₁-C₈)алкільну групу або
 35 (b20) (C₁-C₈)алкілсульфоніл(C₁-C₈)алкільну групу;
 X являє собою O, S, SO, SO₂ або NR², де R² являє собою атом водню, (C₁-C₆)алкільну групу, (C₁-C₆)алкілкарбонільну групу, (C₁-C₆)алкоксикарбонільну групу, (C₁-C₆)алкілсульфонільну групу або галоген(C₁-C₆)алкілсульфонільну групу, або R² може бути приєднаний до R¹ з утворенням разом з атомом азоту, до якого приєднаний R², 5-8-членного насиченого азотовмісного аліфатичного гетероциклу, що необов'язково має від 1 до 5 замісників, де замісник вибраний з (C₁-C₆)алкільної групи, (C₁-C₆)алкілкарбонільної групи, (C₁-C₆)алкоксикарбонільної групи, (C₁-C₆)алкілсульфонільної групи, галоген(C₁-C₆)алкілсульфонільної групи і (C₁-C₆)алкілендіоксигрупи, де дві оксигрупи в алкілендіоксигрупі можуть бути приєднані до одного і того ж атома вуглецю або до різних атомів вуглецю азотовмісного аліфатичного гетероциклу;
 40 Y може бути однаковим або різним і являє собою:
 45 (c1) атом галогену або
 (c2) (C₁-C₈)алкільну групу;
 m являє собою 0, 1, 2 або 3;
 Z може бути однаковим або різним і являє собою:
 50 (d1) атом галогену;
 (d2) (C₁-C₈)алкільну групу;
 (d3) (C₃-C₈)циклоалкільну групу;
 (d4) (C₃-C₈)циклоалкіл(C₁-C₈)алкільну групу;
 (d5) галоген(C₃-C₈)циклоалкіл(C₁-C₈)алкільну групу;
 55 (d6) галоген(C₁-C₈)алкільну групу;
 (d7) галоген(C₁-C₈)алкоксигрупу;
 (d8) галоген(C₁-C₈)алкілтіогрупу;
 (d9) галоген(C₁-C₈)алкілсульфінільну групу або
 (d10) галоген(C₁-C₈)алкілсульфонільну групу, і
 60 n являє собою 0, 1, 2, 3 або 4;

або його сіль.

2. Похідне бензімідазолу за п. 1,
де

R являє собою:

- 5 (a1) (C₁-C₈)алкільну групу;
 (a2) (C₃-C₈)циклоалкільну групу;
 (a3) (C₃-C₈)циклоалкіл(C₁-C₈)алкільну групу;
 (a4) галоген(C₁-C₈)алкільну групу;
 (a5) (C₂-C₈)алкенільну групу;
 10 (a6) (C₂-C₈)алкінільну групу;
 (a7) арильну групу або
 (a8) арильну групу, що має від 1 до 5 замісників, які можуть бути однаковими або різними і
 вибрані з (a) атома галогену, (b) (C₁-C₆)алкільної групи, (c) галоген(C₁-C₆)алкільної групи, (d) (C₁-
 C₆)алкоксигрупи, (e) галоген(C₁-C₆)алкоксигрупи, (f) (C₁-C₆)алкілтіогрупи, (g) галоген(C₁-
 15 C₆)алкілтіогрупи, (h) (C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (i) галоген(C₁-C₆)алкілсульфінільної групи,
 (j) (C₁-C₆)алкілсульфонільної групи, (k) галоген(C₁-C₆)алкілсульфонільної групи і (l) три(C₁-
 C₆)алкілсилільної групи, де алкільні групи можуть бути однаковими або різними;

R¹ являє собою:

- (b1) (C₁-C₈)алкільну групу;
 20 (b2) галоген(C₁-C₈)алкільну групу;
 (b3) (C₃-C₈)циклоалкільну групу;
 (b4) галоген(C₃-C₈)циклоалкільну групу;
 (b5) (C₃-C₈)циклоалкіл(C₁-C₈)алкільну групу;
 (b6) галоген(C₃-C₈)циклоалкіл(C₁-C₈)алкільну групу;
 25 (b7) (C₂-C₈)алкенільну групу;
 (b8) галоген(C₂-C₈)алкенільну групу;
 (b9) (C₂-C₈)алкінільну групу;
 (b10) галоген(C₂-C₈)алкінільну групу;
 (b11) арильну групу;
 30 (b12) арильну групу, що має від 1 до 5 замісників, які можуть бути однаковими або різними і
 вибрані з (a) атома галогену, (b) (C₁-C₆)алкільної групи, (c) галоген(C₁-C₆)алкільної групи, (d) (C₁-
 C₆)алкоксигрупи, (e) галоген(C₁-C₆)алкоксигрупи, (f) (C₁-C₆)алкілтіогрупи, (g) галоген(C₁-
 C₆)алкілтіогрупи, (h) (C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (i) галоген(C₁-C₆)алкілсульфінільної групи,
 (j) (C₁-C₆)алкілсульфонільної групи, (k) галоген(C₁-C₆)алкілсульфонільної групи і (l) три(C₁-
 35 C₆)алкілсилільної групи, де алкільні групи можуть бути однаковими або різними;

- (b13) арил(C₁-C₈)алкільну групу;
 (b14) арил(C₁-C₈)алкільну групу, що має від 1 до 5 замісників, які можуть бути однаковими або
 різними і вибрані з (a) атома галогену, (b) (C₁-C₆)алкільної групи, (c) галоген(C₁-C₆)алкільної
 групи, (d) (C₁-C₆)алкоксигрупи, (e) галоген(C₁-C₆)алкоксигрупи, (f) (C₁-C₆)алкілтіогрупи, (g)
 40 галоген(C₁-C₆)алкілтіогрупи, (h) (C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (i) галоген(C₁-
 C₆)алкілсульфінільної групи, (j) (C₁-C₆)алкілсульфонільної групи, (k) галоген(C₁-
 C₆)алкілсульфонільної групи і (l) три(C₁-C₆)алкілсилільної групи, де алкільні групи можуть бути
 однаковими або різними;

- (b15) ароматичну гетероциклічну групу або
 45 (b16) ароматичну гетероциклічну групу, що має від 1 до 3 замісників, які можуть бути
 однаковими або різними і вибрані з (a) атома галогену, (b) (C₁-C₆)алкільної групи, (c) галоген(C₁-
 C₆)алкільної групи, (d) (C₁-C₆)алкоксигрупи, (e) галоген(C₁-C₆)алкоксигрупи, (f) (C₁-
 C₆)алкілтіогрупи, (g) галоген(C₁-C₆)алкілтіогрупи, (h) (C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (i)
 галоген(C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (j) (C₁-C₆)алкілсульфонільної групи, (k) галоген(C₁-
 50 C₆)алкілсульфонільної групи і (l) три(C₁-C₆)алкілсилільної групи, де алкільні групи можуть бути
 однаковими або різними;

X являє собою O, S, SO, SO₂ або NR², де R² являє собою атом водню, (C₁-C₆)алкільну групу,
 (C₁-C₆)алкілкарбонільну групу, (C₁-C₆)алкоксикарбонільну групу, (C₁-C₆)алкілсульфонільну групу
 або галоген(C₁-C₆)алкілсульфонільну групу;

55 Y може бути однаковим або різним і являє собою:

- (c1) атом галогену або
 (c2) (C₁-C₈)алкільну групу;
 m являє собою 0, 1, 2 або 3;

Z може бути однаковим або різним і являє собою:

- 60 (d1) атом галогену;

- (d2) (C₁-C₈)алкільну групу;
 (d3) (C₃-C₈)циклоалкільну групу;
 (d4) (C₃-C₈)циклоалкіл(C₁-C₈)алкільну групу;
 (d5) галоген(C₃-C₈)циклоалкіл(C₁-C₈)алкільну групу;
 5 (d6) галоген(C₁-C₈)алкільну групу;
 (d7) галоген(C₁-C₈)алкоксигрупу;
 (d8) галоген(C₁-C₈)алкілтіогрупу;
 (d9) галоген(C₁-C₈)алкілсульфінільну групу або
 (d10) галоген(C₁-C₈)алкілсульфонільну групу, і
 10 n являє собою 0, 1, 2, 3 або 4;
 або його сіль.
3. Похідне бензімідазолу за п. 1,
 де
 R являє собою:
- 15 (a1) (C₁-C₈)алкільну групу;
 (a2) (C₃-C₈)циклоалкільну групу;
 (a4) галоген(C₁-C₈)алкільну групу;
 (a7) арильну групу або
 (a8) арильну групу, що має від 1 до 5 замісників, які можуть бути однаковими або різними і
 20 вибрані з (a) атома галогену, (b) (C₁-C₆)алкільної групи, (c) галоген(C₁-C₆)алкільної групи, (d) (C₁-
 C₆)алкоксигрупи, (e) галоген(C₁-C₆)алкоксигрупи, (f) (C₁-C₆)алкілтіогрупи, (g) галоген(C₁-
 C₆)алкілтіогрупи, (h) (C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (i) галоген(C₁-C₆)алкілсульфінільної групи,
 (j) (C₁-C₆)алкілсульфонільної групи, (k) галоген(C₁-C₆)алкілсульфонільної групи і (l) три(C₁-
 C₆)алкілсилільної групи, де алкільні групи можуть бути однаковими або різними;
 25 R¹ являє собою:
 (b1) (C₁-C₈)алкільну групу;
 (b2) галоген(C₁-C₈)алкільну групу;
 (b3) (C₃-C₈)циклоалкільну групу;
 (b5) (C₃-C₈)циклоалкіл(C₁-C₈)алкільну групу;
 30 (b11) арильну групу;
 (b12) арильну групу, що має від 1 до 5 замісників, які можуть бути однаковими або різними і
 вибрані з (a) атома галогену, (b) (C₁-C₆)алкільної групи, (c) галоген(C₁-C₆)алкільної групи, (d) (C₁-
 C₆)алкоксигрупи, (e) галоген(C₁-C₆)алкоксигрупи, (f) (C₁-C₆)алкілтіогрупи, (g) галоген(C₁-
 C₆)алкілтіогрупи, (h) (C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (i) галоген(C₁-C₆)алкілсульфінільної групи,
 35 (j) (C₁-C₆)алкілсульфонільної групи, (k) галоген(C₁-C₆)алкілсульфонільної групи і (l) три(C₁-
 C₆)алкілсилільної групи, де алкільні групи можуть бути однаковими або різними;
 (b13) арил(C₁-C₈)алкільну групу;
 (b14) арил(C₁-C₈)алкільну групу, що має від 1 до 5 замісників, які можуть бути однаковими або
 різними і вибрані з (a) атома галогену, (b) (C₁-C₆)алкільної групи, (c) галоген(C₁-C₆)алкільної
 40 групи, (d) (C₁-C₆)алкоксигрупи, (e) галоген(C₁-C₆)алкоксигрупи, (f) (C₁-C₆)алкілтіогрупи, (g)
 галоген(C₁-C₆)алкілтіогрупи, (h) (C₁-C₆)алкілсульфінільної групи, (i) галоген(C₁-
 C₆)алкілсульфінільної групи, (j) (C₁-C₆)алкілсульфонільної групи, (k) галоген(C₁-
 C₆)алкілсульфонільної групи і (l) три(C₁-C₆)алкілсилільної групи, де алкільні групи можуть бути
 однаковими або різними;
 45 (b17) (C₁-C₈)алкоксі(C₁-C₈)алкільну групу;
 (b18) (C₁-C₈)алкілтіо(C₁-C₈)алкільну групу або
 (b20) (C₁-C₈)алкілсульфоніл(C₁-C₈)алкільну групу,
 X являє собою O, S, SO, SO₂ або NR², де R² являє собою (C₁-C₆)алкільну групу, (C₁-
 C₆)алкілкарбонільну групу або (C₁-C₆)алкілсульфонільну групу, або R² може бути приєднаний до
 50 R¹ з утворенням разом з атомом азоту, до якого приєднаний R², 5-8-членного насиченого
 азотовмісного аліфатичного гетероциклу, що необов'язково має від 1 до 5 замісників, де
 замісник вибраний з (C₁-C₆)алкільної групи, (C₁-C₆)алкілкарбонільної групи, (C₁-
 C₆)алкоксикарбонільної групи, (C₁-C₆)алкілсульфонільної групи, галоген(C₁-
 C₆)алкілсульфонільної групи і (C₁-C₆)алкілендіоксигрупи, де дві оксигрупи в алкілендіоксигрупі
 55 можуть бути приєднані до одного і того ж атома вуглецю або до різних атомів вуглецю
 азотовмісного аліфатичного гетероциклу,
 Y може бути однаковим або різним і являє собою:
 (c1) атом галогену,
 m являє собою 0 або 1,
 60 Z може бути однаковим або різним і являє собою:

- (d1) атом галогену або
 (d2) (C₁-C₈)алкільну групу, і
 n являє собою 0, 1 або 2;
 або його сіль.
- 5 4. Похідне бензімідазолу за п. 1,
 де
 R являє собою (a1) (C₁-C₈)алкільну групу;
 R¹ являє собою (b1) галоген(C₁-C₈)алкільну групу;
 m являє собою 0 і
- 10 n являє собою 0;
 або його сіль.
5. Сільськогосподарський і садівничий інсектицидний і акарицидний засіб, що містить похідне бензімідазолу або його сіль відповідно до одного з пп. 1-4 як активний інгредієнт.
- 15 6. Спосіб застосування сільськогосподарського і садівничого інсектицидного і акарицидного засобу, що включає нанесення на рослини або ґрунт ефективної кількості похідного бензімідазолу або його солі відповідно до одного з пп. 1-4.
7. Засіб боротьби з ектопаразитами у тварин, що містить ефективну кількість похідного бензімідазолу або його солі відповідно до одного з пп. 1-4 як активний інгредієнт.
- 20 8. Засіб боротьби з ектопаразитами у тварин, що містить ефективну кількість похідного бензімідазолу або його солі відповідно до одного з пп. 1-4 як активний інгредієнт.
9. Застосування похідного бензімідазолу або його солі відповідно до одного з пп. 1-4 при виготовленні засобу боротьби з ектопаразитами.
10. Застосування похідного бензімідазолу або його солі відповідно до одного з пп. 1-4 при виготовленні засобу боротьби з ектопаразитами.
- 25