

(19)



Евразийское
патентное
ведомство

(21) 202091471 (13) A1

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ

(43) Дата публикации заявки
2020.10.29

(51) Int. Cl. C07D 261/04 (2006.01)
A01N 43/80 (2006.01)

(22) Дата подачи заявки
2018.12.14

(54) ПОЛИМОРФЫ

(31) 1721235.8

(32) 2017.12.19

(33) GB

(86) PCT/EP2018/084957

(87) WO 2019/121394 2019.06.27

(71) Заявитель:
ЗИНГЕНТА ПАРТИСИПЕЙШНС АГ
(CH)

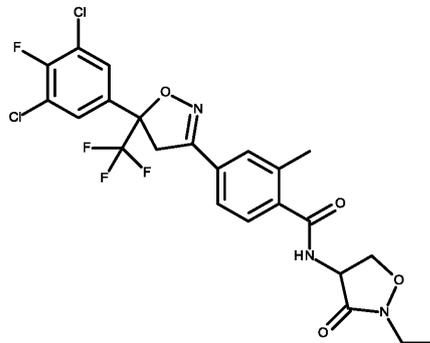
(72) Изобретатель:

Джордж Нил, Джонс Айан Кевин,
Хоун Джон (GB)

(74) Представитель:

Веселицкая И.А., Веселицкий М.Б.,
Кузенкова Н.В., Каксис Р.А., Белоусов
Ю.В., Куликов А.В., Кузнецова Е.В.,
Соколов Р.А., Кузнецова Т.В. (RU)

(57) Настоящее изобретение относится к твердым формам инсектицида формулы I



I,

композициям, содержащим твердые формы, и способам их применения в качестве инсектицидов.

A1

202091471

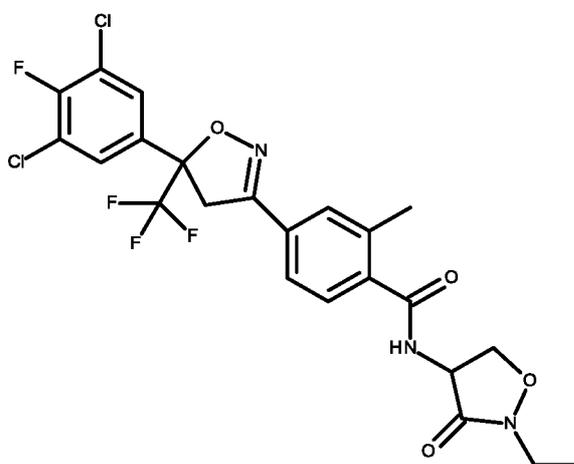
202091471

A1

ПОЛИМОРФЫ

5 Настоящее изобретение относится к твердым формам изоксазолинового производного, композициям, содержащим твердые формы, и способам их применения в качестве инсектицидов.

10 В WO 2011/067272 раскрыто, что некоторые изоксазолиновые производные характеризуются пестицидной активностью, в частности, инсектицидной, акарицидной, моллюскоцидной и нематоцидной активностью. В частности, раскрыто соединение формулы I,

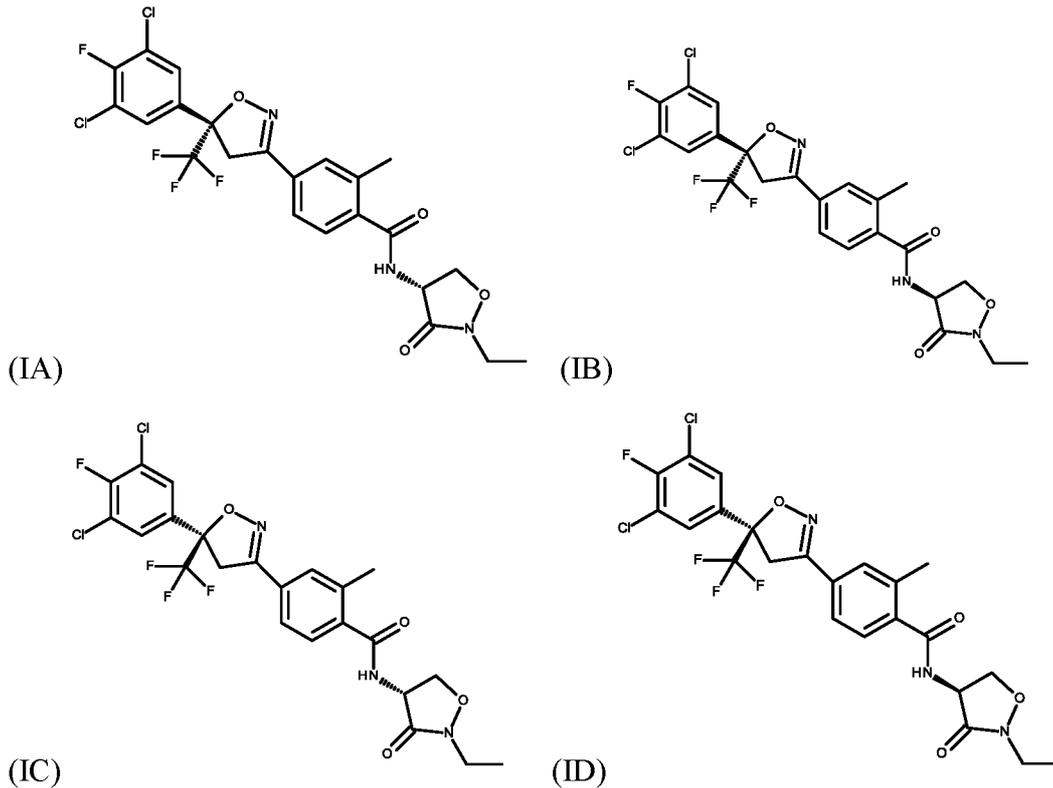


I.

15 Смеси данного соединения с другими инсектицидами раскрыты в WO 2012/163960, а с фунгицидами — в WO 2012/163945.

К настоящему времени раскрыты новые твердые формы данного соединения и его изомеров, композиции на их основе, а также способы их получения и применения.

20 Существует четыре изомера соединения формулы I: A, B, C и D, как показано ниже. Настоящее изобретение относится к полиморфным формам всех этих изомеров в комбинации или в выделенной форме.



Соответственно, настоящее изобретение относится к новым кристаллическим формам соединения формулы IA, обозначенным как форма A(a). Данный кристаллический полиморф, представляющий собой форму A(a), может быть охарактеризован с помощью параметров элементарной ячейки его монокристалла, показанных в таблице 1. Полиморф получали с применением способа, описанного в примере 1.

ТАБЛИЦА 1

Класс	Орторомбический
Пространственная группа	$P2_12_12_1$
Показатели длины ячейки (Å)	$a = 5,06, b = 18,92, c = 24,17$
Углы ячейки (°)	$\alpha = 90, \beta = 90, \gamma = 90$
Объем элементарной ячейки (Å ³)	2315
Z	4

10

В таблице a, b, c = длина ребер элементарной ячейки; α, β, γ = углы элементарной ячейки; и Z = число молекул на ячейку.

Таким образом, в одном варианте осуществления настоящего изобретения кристаллический полиморф, обозначенный как форма A(a), характеризуется

следующими параметрами решетки: $a=5,06 \text{ \AA} \pm 0,01 \text{ \AA}$, $b=18,92 \text{ \AA} \pm 0,01 \text{ \AA}$, $c=24,17 \text{ \AA} \pm 0,01 \text{ \AA}$, $\alpha = 90^\circ \pm 0,01^\circ$, $\beta = 90^\circ \pm 0,01^\circ$, $\gamma = 90^\circ \pm 0,01^\circ$ и объем = $2315 \text{ \AA}^3 \pm 1 \text{ \AA}^3$.

Кристаллический полиморф, обозначенный как форма А(а), может также быть охарактеризован с помощью порошковой дифракционной рентгенограммы, построенной на основе углов 2θ или межплоскостных расстояний d . Таким образом, в другом варианте осуществления настоящего изобретения кристаллический полиморф характеризуется порошковой дифракционной рентгенограммой, содержащей по меньшей мере три, по меньшей мере шесть или все значения угла 2θ , выбранные из группы, состоящей из $6,0 \pm 0,2$, $8,8 \pm 0,2$, $9,4 \pm 0,2$, $10,1 \pm 0,2$, $11,9 \pm 0,2$, $14,5 \pm 0,2$, $15,9 \pm 0,2$, $20,2 \pm 0,2$, $20,7 \pm 0,2$, $21,2 \pm 0,2$, $21,7 \pm 0,2$, $22,1 \pm 0,2$ и $22,7 \pm 0,2$. Данные значения пиков вместе с соответствующими значениями межплоскостного расстояния d показаны в таблице 2 ниже.

ТАБЛИЦА 2

2-Тета	D
6,0	14,6
8,8	10,1
9,4	9,4
10,1	8,8
11,9	7,4
14,5	6,1
15,9	5,6
20,2	4,4
20,7	4,3
21,2	4,2
21,7	4,1
22,1	4,0
22,7	3,9

Данные значения угла 2θ получены из порошковой дифракционной рентгенограммы полиморфа, полученного с применением способа из примера 1. Значения получены с применением средней длины волны $1,54056 \text{ \AA}$ с размером шага 2θ , составляющим $0,02^\circ$.

В другом варианте осуществления кристаллический полиморф, обозначенный как форма А(а), характеризуется температурой плавления, составляющей $141^{\circ}\text{C} \pm 2^{\circ}\text{C}$. Эту температуру плавления получают с применением дифференциальной сканирующей калориметрии (DSC) со скоростью нагревания $10^{\circ}\text{C}/\text{минута}$.

5 Кристаллический полиморф, обозначенный как форма А(а), может также быть охарактеризован с помощью рамановских спектров, построенных на основе рамановского смещения (cm^{-1}). Таким образом, в другом варианте осуществления настоящего изобретения кристаллический полиморф характеризуется рамановскими спектрами, содержащими по меньшей мере три, по меньшей мере шесть, по меньшей мере девять, по меньшей мере двенадцать, по меньшей мере пятнадцать или все значения рамановского сдвига, выбранные из группы, состоящей из 1698 ± 2 , 1640 ± 2 , 1603 ± 2 , 1564 ± 2 , 1458 ± 2 , 1364 ± 2 , 1293 ± 2 , 1272 ± 2 , 1201 ± 2 , 1178 ± 2 , 1092 ± 2 , 1069 ± 2 , 1011 ± 2 , 926 ± 2 , 906 ± 2 , 876 ± 2 , 833 ± 2 , 795 ± 2 , 752 ± 2 , 721 ± 2 , 691 ± 2 , 658 ± 2 и 631 ± 2 .

15 Настоящее изобретение также относится к дополнительной новой кристаллической форме соединения формулы IA, обозначенной как форма А(б), которая может быть охарактеризована с помощью порошковой дифракционной рентгенограммы, построенной на основе углов 2θ или межплоскостных расстояний d . Данный кристаллический полиморф характеризуется порошковой дифракционной рентгенограммой, содержащей по меньшей мере три значения угла 2θ , выбранные из группы, состоящей из $15,3 \pm 0,2$, $16,3 \pm 0,2$, $17,6 \pm 0,2$, $19,3 \pm 0,2$, $19,8 \pm 0,2$, $22,0 \pm 0,2$, $22,9 \pm 0,2$, $24,9 \pm 0,2$ и $25,3 \pm 0,2$. Данные значения пиков вместе с соответствующими значениями межплоскостного расстояния d показаны в таблице 3 ниже.

ТАБЛИЦА 3

2-Тета	D
15,3	5,8
16,3	5,4
17,6	5,0
19,3	4,6
19,8	4,5
22,0	4,0
22,9	3,9
24,9	3,6
25,3	3,5

25 Данные значения угла 2θ получены из порошковой дифракционной рентгенограммы полиморфа, полученного с применением способа из примера 1.

Значения получены с применением средней длины волны $1,54056 \text{ \AA}$ с размером шага 2θ , составляющим $0,02^\circ$.

Кристаллический полиморф, обозначенный как форма A(b), характеризуется температурой плавления, составляющей $152^\circ\text{C} \pm 2^\circ\text{C}$. Эту температуру плавления получают с применением дифференциальной сканирующей калориметрии (DSC) со скоростью нагревания $10^\circ\text{C}/\text{минута}$.

Настоящее изобретение также относится к дополнительной новой кристаллической форме соединения формулы IA, обозначенной как форма A(h), которая представляет собой гидрат. Данный кристаллический полиморф, представляющий собой форму A(h), может быть охарактеризован с помощью параметров элементарной ячейки его монокристалла, показанных в таблице 4. Полиморф получали с применением способа, описанного в примере 1.

ТАБЛИЦА 4

Класс	Моноклинный
Пространственная группа	$P2_1$
Показатели длины ячейки (\AA)	$a = 8,03, b = 16,10, c = 20,37$
Углы ячейки ($^\circ$)	$\alpha = 90, \beta = 97,02, \gamma = 90$
Объем элементарной ячейки (\AA^3)	2615
Z	2

В таблице a, b, c = длина ребер элементарной ячейки; α, β, γ = углы элементарной ячейки; и Z = число молекул на ячейку.

Таким образом, в одном варианте осуществления настоящего изобретения кристаллический полиморф, обозначенный как форма A(h), характеризуется следующими параметрами решетки: $a=8,03 \text{ \AA} \pm 0,01 \text{ \AA}$, $b=16,10 \text{ \AA} \pm 0,01 \text{ \AA}$, $c=20,37 \text{ \AA} \pm 0,01 \text{ \AA}$, $\alpha = 90^\circ \pm 0,01^\circ$, $\beta = 97,02^\circ \pm 0,01^\circ$, $\gamma = 90^\circ \pm 0,01^\circ$ и объем = $2615 \text{ \AA}^3 \pm 1 \text{ \AA}^3$.

Кристаллический полиморф, обозначенный как форма A(h), может также быть охарактеризован с помощью порошковой дифракционной рентгенограммы, построенной на основе углов 2θ или межплоскостных расстояний d. Таким образом, в другом варианте осуществления настоящего изобретения кристаллический полиморф характеризуется порошковой дифракционной рентгенограммой, содержащей по меньшей мере три, по меньшей мере шесть или все значения угла 2θ , выбранные из группы, состоящей из $4,4 \pm 0,2$, $7,0 \pm 0,2$, $8,7 \pm 0,2$, $10,3 \pm 0,2$, $11,0 \pm 0,2$, $12,4 \pm 0,2$, $12,7$

$\pm 0,2$, $13,3 \pm 0,2$, $14,1 \pm 0,2$, $15,9 \pm 0,2$, $17,1 \pm 0,2$, $18,6 \pm 0,2$, $19,0 \pm 0,2$ и $19,6 \pm 0,2$.
 Данные значения пиков вместе с соответствующими значениями межплоскостного расстояния d показаны в таблице 5 ниже.

ТАБЛИЦА 5

2-Тета	D
4,4	20,2
7,0	12,6
8,7	10,1
10,3	8,6
11,0	8,0
12,4	7,1
12,7	7,0
13,3	6,7
14,1	6,3
15,9	5,6
17,1	5,2
18,6	4,8
19,0	4,7
19,6	4,5

5

Данные значения угла 2θ получены из порошковой дифракционной рентгенограммы, рассчитанной с применением данных интенсивности для монокристалла полиморфа, полученного с применением способа из примера 1. Значения получены с применением средней длины волны $1,54056 \text{ \AA}$ с размером шага 2θ , составляющим $0,02^\circ$.

10

Также описана кристаллическая форма соединения формулы IA, обозначенная как форма A(c), которая может быть охарактеризована с помощью температуры плавления, составляющей $127^\circ\text{C} \pm 2^\circ\text{C}$. Эту температуру плавления получают с применением дифференциальной сканирующей калориметрии (DSC) со скоростью нагревания $10^\circ\text{C}/\text{минута}$. Следует отметить, что кристаллические формы соединения формулы ID будут иметь параметры, идентичные параметрам соединения формулы IA. Следовательно, настоящее изобретение также относится к новым кристаллическим

15

формам соединения формулы ID, которые имеют физические параметры, перечисленные выше для соединения формулы IA.

Настоящее изобретение также относится к новой кристаллической форме соединения формулы IB, которая может быть охарактеризована с помощью порошковой дифракционной рентгенограммы, построенной на основе углов 2θ или межплоскостных расстояний d . Данный кристаллический полиморф характеризуется порошковой дифракционной рентгенограммой, содержащей по меньшей мере три значения угла 2θ , выбранные из группы, состоящей из $4,1 \pm 0,2$, $8,3 \pm 0,2$, $10,2 \pm 0,2$, $12,4 \pm 0,2$, $15,5 \pm 0,2$, $16,5 \pm 0,2$, $18,2 \pm 0,2$, $18,4 \pm 0,2$, $18,7 \pm 0,2$, $19,0 \pm 0,2$, $20,5 \pm 0,2$, $21,0 \pm 0,2$ и $21,4 \pm 0,2$. Данные значения пиков вместе с соответствующими значениями межплоскостного расстояния d показаны в таблице 6 ниже.

ТАБЛИЦА 6

2-Тета	D
4,1	21,4
8,3	10,7
10,2	8,7
12,4	7,1
15,5	5,7
16,5	5,4
18,2	4,9
18,4	4,8
18,7	4,7
19,0	4,7
20,5	4,3
21,0	4,2
21,4	4,1

Данные значения угла 2θ получены из порошковой дифракционной рентгенограммы, рассчитанной с применением данных интенсивности для монокристалла полиморфа, полученного с применением способа из примера 1. Значения получены с применением средней длины волны $1,54056 \text{ \AA}$ с размером шага 2θ , составляющим $0,02^\circ$.

Кристаллический полиморф соединения формулы IV характеризуется температурой плавления, составляющей $206^{\circ}\text{C} \pm 2^{\circ}\text{C}$. Эту температуру плавления получают с применением дифференциальной сканирующей калориметрии (DSC) со скоростью нагревания $10^{\circ}\text{C}/\text{минута}$.

5 Настоящее изобретение также относится к новой кристаллической форме соединения формулы IC, которая может быть охарактеризована с помощью порошковой дифракционной рентгенограммы, построенной на основе углов 2θ или межплоскостных расстояний d . Данный кристаллический полиморф характеризуется порошковой дифракционной рентгенограммой, содержащей по меньшей мере три значения угла 2θ , выбранные из группы, состоящей из $4,1 \pm 0,2$, $8,3 \pm 0,2$, $10,2 \pm 0,2$, $12,4 \pm 0,2$, $15,5 \pm 0,2$, $16,5 \pm 0,2$, $18,2 \pm 0,2$, $18,4 \pm 0,2$, $18,7 \pm 0,2$, $19,0 \pm 0,2$, $20,5 \pm 0,2$, $21,0 \pm 0,2$ и $21,4 \pm 0,2$. Данные значения пиков вместе с соответствующими значениями межплоскостного расстояния d показаны в таблице 7 ниже. Следует отметить, что профиль порошковой рентгеновской дифракции соединения формулы IC идентичен
10
15 такому соединению формулы IV.

ТАБЛИЦА 7

2-Тета	D
4,1	21,4
8,3	10,7
10,2	8,7
12,4	7,1
15,5	5,7
16,5	5,4
18,2	4,9
18,4	4,8
18,7	4,7
19,0	4,7
20,5	4,3
21,0	4,2
21,4	4,1

Данные значения угла 2θ получены из порошковой дифракционной рентгенограммы, рассчитанной с применением данных интенсивности для

монокристалла полиморфа, полученного с применением способа из примера 1. Значения получены с применением средней длины волны $1,54056 \text{ \AA}$ с размером шага 2θ , составляющим $0,02^\circ$.

5 Кристаллический полиморф соединения формулы IC характеризуется температурой плавления, составляющей $206^\circ\text{C} \pm 2^\circ\text{C}$. Эту температуру плавления получают с применением дифференциальной сканирующей калориметрии (DSC) со скоростью нагревания $10^\circ\text{C}/\text{минута}$.

10 Настоящее изобретение также относится к дополнительной новой кристаллической форме рацемата соединений формулы IA и формулы ID, который может характеризоваться порошковой дифракционной рентгенограммой, построенной на основе углов 2θ или межплоскостных расстояний d . Данный кристаллический полиморф характеризуется порошковой дифракционной рентгенограммой, содержащей по меньшей мере три значения угла 2θ , выбранные из группы, состоящей из $4,0 \pm 0,2$, $8,1 \pm 0,2$, $9,7 \pm 0,2$, $11,1 \pm 0,2$, $12,7 \pm 0,2$, $15,3 \pm 0,2$, $15,9 \pm 0,2$, $16,2 \pm 0,2$, $16,7 \pm 0,2$, $18,4$
15 $\pm 0,2$, $19,5 \pm 0,2$, $19,8 \pm 0,2$, $20,3 \pm 0,2$, $21,8 \pm 0,2$ и $23,9 \pm 0,2$. Данные значения пиков вместе с соответствующими значениями межплоскостного расстояния d показаны в таблице 8 ниже.

ТАБЛИЦА 8

2-Тета	D
4,0	21,9
8,1	11,0
9,7	10,2
11,1	8,0
12,7	7,0
15,3	5,8
15,9	5,6
16,2	5,5
16,7	5,3
18,4	4,8
19,5	4,6
19,8	4,5
20,3	4,4
21,8	4,1
23,9	3,7

20 Данные значения угла 2θ получены из порошковой дифракционной рентгенограммы полиморфа, полученного с применением способа из примера 1. Значения получены с применением средней длины волны $1,54056 \text{ \AA}$ с размером шага 2θ , составляющим $0,02^\circ$.

Кристаллический полиморф рацемата соединений формулы IA и ID характеризуется температурой плавления, составляющей $173^{\circ}\text{C} \pm 2^{\circ}\text{C}$. Эту температуру плавления получают с применением дифференциальной сканирующей калориметрии (DSC) со скоростью нагревания $10^{\circ}\text{C}/\text{минута}$.

5 В контексте настоящего изобретения полиморф представляет собой конкретную кристаллическую форму химического соединения, которое в твердом состоянии может существовать в более чем одной кристаллической форме. Кристаллическая форма соединения содержит составляющие ее молекулы, образующие упорядоченные повторяющиеся структуры, простирающиеся во всех трех пространственных измерениях (напротив, в аморфной твердой форме отсутствует дальний порядок в расположении молекул). Разные полиморфы соединения характеризуются разными вариантами расположения атомов и/или молекул в своей кристаллической структуре. Если соединение является биологически активным соединением, таким как инсектицид, различие в кристаллических структурах может приводить к тому, что 10 разные полиморфы будут иметь различающиеся химические, физические и биологические свойства. Свойства, которые могут изменяться, включают форму кристалла, плотность, твердость, цвет, химическую стабильность, температуру плавления, гигроскопичность, способность суспендироваться, скорость растворения и биологическую доступность. В связи с этим определенный полиморф может обладать 20 свойствами, которые делают его более предпочтительным в конкретном применении по сравнению с другим полиморфом того же соединения: в частности, перечисленные выше физические, химические и биологические свойства могут оказывать значительное влияние на разработку способов получения и составов, показатель того, насколько просто соединение можно объединить в составе с другими активными ингредиентами и компонентами состава, а также качество и эффективность средств для обработки растений, таких как инсектициды. Следует отметить, что невозможно предугадать, может ли соединение в твердом состоянии быть представленным более чем одним полиморфом, и также невозможно предугадать свойства какой-либо из этих кристаллических форм.

30 В частности, применение определенного полиморфа может обеспечить применение новых составов по сравнению с существующими полиморфными/аморфными формами соединения. Это может быть целесообразным по ряду причин. Например, состав суспензионного концентрата (SC) может быть более предпочтительным, чем эмульсионный концентрат (EC), поскольку отсутствие

растворителя в SC зачастую означает, что состав, вероятно, будет являться менее фитотоксичным, чем эквивалентный состав ЕС, однако если существующая форма соединения не является стабильной в таких составах SC, может происходить полиморфное превращение, что приводит к нежелательному росту кристаллов. Такой
5 рост кристаллов является неблагоприятным, поскольку он приводит, например, к загустению и возможному отверждению состава, что может привести к закупориванию оборудования для применения составов, например, в распылительных соплах в сельскохозяйственной технике. Применение стабильной полиморфной формы решит данные проблемы.

10 Анализ твердой фазы на присутствие кристаллов можно провести при помощи традиционных способов, известных из уровня техники. Например, целесообразным и общепринятым является применение методик порошковой рентгеновской дифракции. Другие методики, которые можно применять, включают дифференциальную сканирующую калориметрию (DSC), термогравиметрический анализ (TGA) и
15 рамановскую или инфракрасную спектроскопию, ЯМР, газовую хроматографию или HPLC. Рентгеновская дифракция на монокристаллах является особенно пригодной в определении структур кристаллов.

Полиморфы по настоящему изобретению можно применять в неизменной форме, но более предпочтительным является введение их в агрохимические композиции с помощью традиционных способов. Соответственно, в дополнительном
20 аспекте настоящее изобретение предусматривает агрохимическую композицию, содержащую полиморф по настоящему изобретению, определенный выше, и по меньшей мере один приемлемый с точки зрения сельского хозяйства носитель или разбавитель.

25 Кроме того, композиции по настоящему изобретению могут содержать больше одного полиморфа по настоящему изобретению. В частности, соединение формулы IA является в большей степени биологически активным, чем соединения формул IB, IC и ID. В связи с этим, несмотря на то, что композиции по настоящему изобретению могут содержать смесь соединений IA, IB, IC и ID в полиморфных формах, раскрытых в
30 данном документе или иным образом, в любых количествах, они также могут быть обогащены соединением формулы IA или полиморфом соединения формулы IA. В частности, они могут быть обогащены полиморфом, обозначенным как форма A(a). "Обогащенный" означает, что молярная доля соединения или полиморфа формулы IA по сравнению с общим количеством соединений формулы IA, IB, IC и ID составляет

более 50%, например, по меньшей мере 55, 60, 65, 70, 75, 80, 85, 90, 95, 96, 97, 98 или по меньшей мере 99%.

Агрехимические композиции, содержащие полиморф или полиморфы по настоящему изобретению, представляют собой активные ингредиенты, которые имеют важное значение в сфере контроля вредителей для предупреждения и/или лечения даже при низких нормах применения, имеют удовлетворительный биоцидный спектр и хорошо переносятся теплокровными видами, рыбой и растениями. Композиции по настоящему изобретению могут действовать на всех или только на отдельных стадиях развития обычно чувствительных, а также устойчивых животных-вредителей, таких как насекомые или представители отряда Asarina. Инсектицидная или акарицидная активность композиций может проявляться непосредственно, т. е. в виде уничтожения вредителей, которое происходит либо сразу, либо по истечении некоторого времени, например во время линьки, или опосредованно, например, за счет уменьшения кладки яиц и/или выхода расплода, при этом надлежащая активность соответствует норме уничтожения (смертности), составляющей по меньшей мере 50-60%.

Таким образом, агрохимические композиции, содержащие полиморф или полиморфы по настоящему изобретению, можно применять для контроля патогенных для растений насекомых на нескольких видах растений. Соответственно, настоящее изобретение также предусматривает способ предупреждения или контроля инфекции, вызываемой насекомыми, на растениях или материале для размножения растений, включающий обработку растения или материала для размножения растений инсектицидно эффективным количеством композиции, предназначенной для использования в сельском хозяйстве, по настоящему изобретению.

Термин "инсектицид", используемый в данном документе, означает соединение или композицию, при помощи которых контролируют или модифицируют рост насекомых. Термин "инсектицидно эффективное количество" означает количество таких соединения или композиции или комбинации таких соединений или композиций, с помощью которого можно уничтожать, контролировать или заражать насекомых, замедляя рост или размножение насекомых, снижая численность популяции насекомых и/или уменьшая повреждения растений, обусловленные насекомыми.

Под "материалом для размножения растений" подразумевают посевные материалы всех типов (плоды, клубни, луковицы, зерна и т. д.), побеги, черенки и т. п.

Примерами вышеупомянутых животных-вредителей являются следующие:

из отряда *Acarina*, например, *Acalitus spp*, *Aculus spp*, *Acaricalus spp*, *Aceria spp*,
Acarus siro, *Amblyomma spp.*, *Argas spp.*, *Boophilus spp.*, *Brevipalpus spp.*, *Bryobia spp*,
Calipitrimerus spp., *Chorioptes spp.*, *Dermanyssus gallinae*, *Dermatophagoides spp*,
5 *Olygonychus spp*, *Ornithodoros spp.*, *Polyphagotarsonne latus*, *Panonychus spp.*,
Phyllocoptruta oleivora, *Phytonemus spp*, *Polyphagotarsonemus spp*, *Psoroptes spp.*,
Rhipicephalus spp., *Rhizoglyphus spp.*, *Sarcoptes spp.*, *Steneotarsonemus spp*, *Tarsonemus*
spp. и *Tetranychus spp.*;

из отряда *Anoplura*, например, *Haematopinus spp.*, *Linognathus spp.*, *Pediculus*
10 *spp.*, *Pemphigus spp.* и *Phylloxera spp.*;

из отряда *Coleoptera*, например, *Agriotes spp.*, *Amphimallon majale*, *Anomala*
orientalis, *Anthonomus spp.*, *Aphodius spp*, *Astylus atromaculatus*, *Ataenius spp*, *Atomaria*
linearis, *Chaetocnema tibialis*, *Cerotoma spp*, *Conoderus spp*, *Cosmopolites spp.*, *Cotinis*
nitida, *Curculio spp.*, *Cyclocephala spp*, *Dermestes spp.*, *Diabrotica spp.*, *Diloboderus*
15 *abderus*, *Epilachna spp.*, *Eremnus spp.*, *Heteronychus arator*, *Hypothenemus hampei*, *Lagria*
vilosa, *Leptinotarsa decemLineata*, *Lissorhoptrus spp.*, *Liogenys spp*, *Maecolaspis spp*,
Maladera castanea, *Megascelis spp*, *Melighetes aeneus*, *Melolontha spp.*, *Myochrous*
armatus, *Oryzaephilus spp.*, *Otiorhynchus spp.*, *Phyllophaga spp*, *Phlyctinus spp.*, *Popillia*
spp., *Psylliodes spp.*, *Rhyssomatus aubtilis*, *Rhizopertha spp.*, *Scarabeidae*, *Sitophilus spp.*,
20 *Sitotroga spp.*, *Somaticus spp*, *Sphenophorus spp*, *Sternechus subsignatus*, *Tenebrio spp.*,
Tribolium spp. и *Trogoderma spp.*;

из отряда *Diptera*, например, *Aedes spp.*, *Anopheles spp*, *Antherigona*
soccata, *Bactrocea oleae*, *Bibio hortulanus*, *Bradysia spp*, *Calliphora erythrocephala*,
Ceratitis spp., *Chrysomyia spp.*, *Culex spp.*, *Cuterebra spp.*, *Dacus spp.*, *Delia spp*,
25 *Drosophila melanogaster*, *Fannia spp.*, *Gastrophilus spp.*, *Geomyza tripunctata*, *Glossina*
spp., *Hypoderma spp.*, *Hyppobosca spp.*, *Liriomyza spp.*, *Lucilia spp.*, *Melanagromyza spp.*,
Musca spp., *Oestrus spp.*, *Orseolia spp.*, *Oscinella frit*, *Pegomyia hyoscyami*, *Phorbia spp.*,
Rhagoletis spp, *Rivelia quadrifasciata*, *Scatella spp*, *Sciara spp.*, *Stomoxys spp.*, *Tabanus*
spp., *Tannia spp.* и *Tipula spp.*;

из отряда *Hemiptera*, например, *Acanthocoris scabrator*, *Acrosternum spp*,
30 *Adelphocoris lineolatus*, *Amblypelta nitida*, *Bathycoelia thalassina*, *Blissus spp*, *Cimex spp.*,
Clavigralla tomentosicollis, *Creontiades spp*, *Distantiella theobroma*, *Dichelops furcatus*,
Dysdercus spp., *Edessa spp*, *Euchistus spp.*, *Eurydema pulchrum*, *Eurygaster spp.*,
Halyomorpha halys, *Horcias nobilellus*, *Leptocorisa spp.*, *Lygus spp*, *Margarodes spp*,

Murgantia histrionic, *Neomegalotomus* spp, *Nesidiocoris tenuis*, *Nezara* spp., *Nysius simulans*, *Oebalus insularis*, *Piesma* spp., *Piezodorus* spp, *Rhodnius* spp., *Sahlbergella singularis*, *Scaptocoris castanea*, *Scotinophara* spp. , *Thyanta* spp , *Triatoma* spp., и *Vatiga illudens*;

5 из отряда *Homoptera*, например, *Acyrtosium pisum*, *Adalges* spp, *Agalliana ensigera*, *Agonosцена targionii*, *Aleurodicus* spp, *Aleurocanthus* spp, *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrixus floccosus*, *Aleyrodes brassicae*, *Amarasca biguttula*, *Amritodus atkinsoni*, *Aonidiella* spp., *Aonidiella auranti*, *Aphididae*, *Aphis* spp., *Aspidiotus* spp., *Aulacorthum solani*, *Bactericera cockerelli*, *Bemisia* spp, *Brachycaudus* spp, *Brevicoryne*
10 *brassicae*, *Cacopsylla* spp, *Cavariella aegopodii Scop.*, *Ceroplaster* spp., *Chrysomphalus aonidium*, *Chrysomphalus dictyospermi*, *Cicadella* spp, *Cofana spectra*, *Cryptomyzus* spp, *Cicadulina* spp, *Coccus hesperidum*, *Dalbulus maidis*, *Dialeurodes* spp, *Diaphorina citri*, *Diuraphis noxia*, *Dysaphis* spp, *Empoasca* spp., *Eriosoma larigerum*, *Erythroneura* spp., *Gascardia* spp., *Glycaspis brimblecombei*, *Hyadaphis pseudobrassicae*, *Hyalopterus* spp,
15 *Hyperomyzus pallidus*, *Idioscopus clypealis*, *Jacobiasca lybica*, *Laodelphax* spp., *Lecanium corni*, *Lepidosaphes* spp., *Lopaphis erysimi*, *Lyogenys maidis*, *Macrosiphum* spp., *Mahanarva* spp, *Metcalfa pruinosa*, *Metopolophium dirhodum*, *Myndus crudus*, *Myzus* spp., *Neotoxoptera* sp, *Nephotettix* spp., *Nilaparvata* spp., *Nippolachmus piri Mats*, *Odonaspis ruthae*, *Oregma lanigera Zehnter*, *Parabemisia myricae*, *Paratrioza cockerelli*, *Parlatoria* spp., *Pemphigus*
20 spp., *Peregrinus maidis*, *Perkinsiella* spp, *Phorodon humuli*, *Phylloxera* spp, *Planococcus* spp., *Pseudaulacaspis* spp., *Pseudococcus* spp., *Pseudatomoscelis seriatus*, *Psylla* spp., *Pulvinaria aethiopica*, *Quadraspidotus* spp., *Quesada gigas*, *Recilia dorsalis*, *Rhopalosiphum* spp., *Saissetia* spp., *Scaphoideus* spp., *Schizaphis* spp., *Sitobion* spp., *Sogatella furcifera*, *Spissistilus festinus*, *Tarophagus Proserpina*, *Toxoptera* spp, *Trialeurodes*
25 spp, *Tridiscus sporoboli*, *Trionymus* spp, *Trioza erytreae* , *Unaspis citri*, *Zygina flammigera*, и *Zyginidia scutellaris*;

из отряда *Hymenoptera*, например, *Acromyrmex*, *Arge* spp, *Atta* spp., *Cephus* spp., *Diprion* spp., *Diprionidae*, *Gilpinia polytoma*, *Hoplocampa* spp., *Lasius* spp., *Monomorium pharaonis*, *Neodiprion* spp., *Pogonomyrmex* spp, *Slenopsis invicta*, *Solenopsis* spp. и *Vespa* spp.;

30 из отряда *Isoptera*, например, *Coptotermes* spp, *Cornitermes cumulans*, *Incisitermes* spp, *Macrotermes* spp, *Mastotermes* spp, *Microtermes* spp, *Reticulitermes* spp.; *Solenopsis geminate*;

- из отряда *Lepidoptera*, например, *Acleris* spp., *Adoxophyes* spp., *Aegeria* spp., *Agrotis* spp., *Alabama argillaceae*, *Amylois* spp., *Anticarsia gemmatalis*, *Archips* spp., *Argyresthia* spp., *Argyrotaenia* spp., *Autographa* spp., *Bucculatrix thurberiella*, *Busseola fusca*, *Cadra cautella*, *Carposina nipponensis*, *Chilo* spp., *Choristoneura* spp., *Chrysoteuchia topiaria*, *Clysia ambiguella*, *Cnaphalocrocis* spp., *Cnephasia* spp., *Cochylis* spp., *Coleophora* spp., *Colias lesbia*, *Cosmophila flava*, *Crambus* spp., *Crocidolomia binotalis*, *Cryptophlebia leucotreta*, *Cydalima perspectalis*, *Cydia* spp., *Diaphania perspectalis*, *Diatraea* spp., *Diparopsis castanea*, *Earias* spp., *Eldana saccharina*, *Ephestia* spp., *Epinotia* spp., *Estigmene acrea*, *Etiella zinckinella*, *Eucosma* spp., *Eupoecilia ambiguella*, *Euproctis* spp., *Euxoa* spp.,
- 10 *Feltia jaculiferia*, *Grapholita* spp., *Hedya nubiferana*, *Heliothis* spp., *Hellula undalis*, *Herpetogramma* spp., *Hyphantria cunea*, *Keiferia lycopersicella*, *Lasmopalpus lignosellus*, *Leucoptera scitella*, *Lithocollethis* spp., *Lobesia botrana*, *Loxostege bifidalis*, *Lymantria* spp., *Lyonetia* spp., *Malacosoma* spp., *Mamestra brassicae*, *Manduca sexta*, *Mythimna* spp., *Noctua* spp., *Operophtera* spp., *Orniodes indica*, *Ostrinia nubilalis*, *Pammene* spp., *Pandemis* spp.,
- 15 *Panolis flammea*, *Papaipema nebris*, *Pectinophora gossypiella*, *Perileucoptera coffeella*, *Pseudaletia unipuncta*, *Phthorimaea operculella*, *Pieris rapae*, *Pieris* spp., *Plutella xylostella*, *Prays* spp., *Pseudoplusia* spp., *Rachiplusia nu*, *Richia albicosta*, *Scirpophaga* spp., *Sesamia* spp., *Sparganothis* spp., *Spodoptera* spp., *Sylepta derogate*, *Synanthedon* spp., *Thaumetopoea* spp., *Tortrix* spp., *Trichoplusia ni*, *Tuta absoluta*, и *Yponomeuta* spp.;
- 20 из отряда *Mallophaga*, например, *Damalinea* spp. и *Trichodectes* spp.;
- из отряда *Orthoptera*, например, *Blatta* spp., *Blattella* spp., *Gryllotalpa* spp., *Leucophaea maderae*, *Locusta* spp., *Neocurtilla hexadactyla*, *Periplaneta* spp., *Scapteriscus* spp. и *Schistocerca* spp.;
- из отряда *Psocoptera*, например, *Liposcelis* spp.;
- 25 из отряда *Siphonaptera*, например, *Ceratophyllus* spp., *Ctenocephalides* spp. и *Xenopsylla cheopis*;
- из отряда *Thysanoptera*, например, *Calliothrips phaseoli*, *Frankliniella* spp., *Heliothrips* spp., *Hercinothrips* spp., *Parthenothrips* spp., *Scirtothrips aurantii*, *Sericothrips variabilis*, *Taeniothrips* spp., *Thrips* spp.; и/или
- 30 из отряда *Thysanura*, например, *Lepisma saccharina*.

Примерами обитающих в почве вредителей, которые могут повреждать сельскохозяйственную культуру на ранних стадиях развития растения, являются следующие:

из отряда *Lepidoptera*, например, *Acleris spp.*, *Aegeria spp.*, *Agrotis spp.*, *Alabama argillaceae*, *Amylois spp.*, *Autographa spp.*, *Busseola fusca*, *Cadra cautella*, *Chilo spp.*, *Crocidolomia binotalis*, *Diatraea spp.*, *Diparopsis castanea*, *Elasmopalpus spp.*, *Heliothis spp.*, *Mamestra brassicae*, *Phthorimaea operculella*, *Plutella xylostella*, *Scirpophaga spp.*,
5 *Sesamia spp.*, *Spodoptera spp.* и *Tortrix spp.*;

из отряда *Coleoptera*, например, *Agriotes spp.*, *Anthonomus spp.*, *Atomaria linearis*, *Chaetocnema tibialis*, *Conotrachelus spp.*, *Cosmopolites spp.*, *Curculio spp.*, *Dermestes spp.*, *Diabrotica spp.*, *Dilopoderus spp.*, *Epilachna spp.*, *Eremmus spp.*, *Heteronychus spp.*,
10 *Lissorhoptrus spp.*, *Melolontha spp.*, *Orycaephilus spp.*, *Otiorhynchus spp.*, *Phlyctinus spp.*, *Popillia spp.*, *Psylliodes spp.*, *Rhizopertha spp.*, *Scarabeidae*, *Sitotroga spp.*, *Somaticus spp.*, *Tanymecus spp.*, *Tenebrio spp.*, *Tribolium spp.*, *Trogoderma spp.* и *Zabrus spp.*;

из отряда *Orthoptera*, например, *Gryllotalpa spp.*;

из отряда *Isoptera*, например, *Reticulitermes spp.*;

из отряда *Psocoptera*, например, *Liposcelis spp.*;

15 из отряда *Anoplura*, например, *Haematopinus spp.*, *Linognathus spp.*, *Pediculus spp.*, *Pemphigus spp.* и *Phylloxera spp.*;

из отряда *Homoptera*, например, *Eriosoma larigerum*;

из отряда *Hymenoptera*, например, *Acromyrmex*, *Atta spp.*, *Cephus spp.*, *Lasius spp.*, *Monomorium pharaonis*, *Neodiprion spp.*, *Solenopsis spp.* и *Vespa spp.*;

20 из отряда *Diptera*, например, *Tipula spp.*;

блошка крестоцветная (*Phyllotreta spp.*), корневые личинки (*Delia spp.*), рапсовый семенной скрытохоботник (*Ceutorhynchus spp.*) и тли.

Композиции согласно настоящему изобретению также могут быть применимыми для контроля нематод. Таким образом, агрохимические композиции,
25 содержащие полиморф согласно настоящему изобретению, можно применять для контроля патогенных для растений нематод на нескольких видах растений. Соответственно, настоящее изобретение также предусматривает способ контроля повреждения растения и его частей паразитирующими на растениях нематодами (эндопаразитическими, полуэндопаразитическими и эктопаразитическими
30 нематодами), при этом способ включает обработку растения или материала для размножения растений нематоцидно эффективным количеством композиции, предназначенной для использования в сельском хозяйстве, по настоящему изобретению.

Термин "нематоцид", применяемый в данном документе, означает соединение или композицию, с помощью которых контролируют или модифицируют рост нематод. Термин "нематоцидно эффективное количество" означает количество таких соединения или композиции или комбинации таких соединений или композиций, с помощью которого можно уничтожить, контролировать или заражать нематод, замедляя рост или размножение нематод, снижая численность популяции нематод и/или уменьшая повреждения растений, обусловленные нематодами.

Примерами вышеуказанных паразитирующих на растениях нематод являются следующие:

10 клубеньковые нематоды, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne javanica*, *Meloidogyne arenaria* и другие виды *Meloidogyne*; цистообразующие нематоды, *Globodera rostochiensis* и другие виды *Globodera*; *Heterodera avenae*, *Heterodera glycines*, *Heterodera schachtii*, *Heterodera trifolii* и другие виды *Heterodera*; галловые нематоды семян, виды *Anguina*; стеблевые и листовые нематоды, виды *Aphelenchoides*;
 15 жалающие нематоды, *Eelionolaimus longicaudatus* и другие виды *Belonolaimus*; нематоды хвойных, *Bursaphelenchus xylophilus* и другие виды *Bursaphelenchus*; кольцевые нематоды, виды *Criconema*, виды *Criconemella*, виды *Criconemoides*, виды *Mesocriconema*; стеблевые и луковичные нематоды, *Ditylenchus destructor*, *Ditylenchus dipsaci* и другие виды *Ditylenchus*; шилоносые нематоды, виды *Dolichodorus*;
 20 спиральные нематоды, *Helicotylenchus multincinctus* и другие виды *Helicotylenchus*; оболочковые и оболочкоподобные нематоды, виды *Hemicycliophora* и виды *Hemicriconemoides*; виды *Hirshmanniella*; ланцетоподобные нематоды, виды *Hoploaimus*; нематоды ненастоящих корневых наростов, виды *Nacobbus*; игольчатые нематоды, *Longidorus elongatus* и другие виды *Longidorus*; короткотельные нематоды,
 25 виды *Pratylenchus*; ранящие нематоды, *Pratylenchus neglectus*, *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus curvatus*, *Pratylenchus goodeyi* и другие виды *Pratylenchus*; роющие нематоды, *Radopholus similis* и другие виды *Radopholus*; почковидные нематоды, *Rotylenchus robustus*, *Rotylenchus reniformis* и другие виды *Rotylenchus*; виды *Scutellonema*; нематоды, обуславливающие недоразвитость корнеплодов, *Trichodorus*
 30 *primitivus* и другие виды *Trichodorus*, виды *Paratrichodorus*; нематоды, обуславливающие карликовость, *Tylenchorhynchus claytoni*, *Tylenchorhynchus dubius* и другие виды *Tylenchorhynchus*; цитрусовые нематоды, виды *Tylenchulus*; кинжальные нематоды, виды *Xiphinema*; и другие виды паразитирующих на растениях нематод,

такие как *Subanguina spp.*, *Hypsoperine spp.*, *Macroposthonia spp.*, *Melinius spp.*, *Punctodera spp.* и *Quinisulcius spp.*

В частности, с помощью композиций согласно настоящему изобретению можно контролировать нематоды видов *Meloidogyne spp.*, *Heterodera spp.*, *Rotylenchus spp.* и *Pratylenchus spp.*

Композиции в соответствии с настоящим изобретением можно применять для контроля, т. е. сдерживания или уничтожения, вредителей вышеуказанного типа, которые встречаются, в частности, на растениях, особенно на полезных растениях и декоративных растениях в сельском хозяйстве, садоводстве и лесоводстве, или на органах таких растений, а именно плодах, цветках, листьях, стеблях, клубнях или корнях, и в некоторых случаях даже на органах растений, которые образуются в более поздние сроки, при этом остаются защищенными от данных вредителей.

Подходящими целевыми сельскохозяйственными культурами являются, в частности, зерновые культуры, такие как пшеница, ячмень, рожь, овес, рис, маис или сорго; свекла, такая как сахарная свекла или кормовая свекла; плодовые культуры, например, семечковые, косточковые или ягодные культуры, такие как сорта яблони, груши, сливы, персика, миндаля, вишни или ягод, например, сорта клубники, малины или ежевики; бобовые культуры, такие как сорта бобов, чечевицы, гороха или сои; масличные культуры, такие как масличный рапс, горчица, сорта мака, маслин, подсолнечника, кокосовая пальма, клещевина, какао-дерево или сорта арахиса; тыквенные культуры, такие как сорта тыквы, огурца или дыни; волокнистые растения, такие как хлопчатник, лен, конопля или джут; цитрусовые, такие как сорта апельсина, лимона, грейпфрута или мандарина; овощи, такие как шпинат, салат-латук, спаржа, сорта капусты, моркови, лука, томата, картофеля или болгарского перца; представители семейства Lauraceae, такие как авокадо, *Cinnamomum* или камфорное дерево; а также табак, разновидности орехов, кофейное дерево, сорта баклажана, сахарный тростник, чайный куст, перец, сорта культурного винограда, хмеля, подорожниковые и каучуконосные растения.

Композиции и/или способы по настоящему изобретению также можно применять по отношению к любым декоративным и/или овощным культурам, в том числе по отношению к цветам, кустарникам, широколиственным деревьям и вечнозеленым растениям.

Например, настоящее изобретение можно применять по отношению к любому из следующих видов декоративных растений: *Ageratum spp.*, *Alonsoa spp.*, *Anemone spp.*,

Anisodonteia capsensis, *Anthemis* spp., *Antirrhinum* spp., *Aster* spp., *Begonia* spp. (например *B. elatior*, *B. semperflorens*, *B. tubéaux*), *Bougainvillea* spp., *Brachycome* spp., *Brassica* spp. (декоративный вид), *Calceolaria* spp., *Capsicum annuum*, *Catharanthus roseus*, *Canna* spp., *Centaurea* spp., *Chrysanthemum* spp., *Cineraria* spp. (*C. maritime*), *Coreopsis* spp.,
 5 *Crassula coccinea*, *Cuphea ignea*, *Dahlia* spp., *Delphinium* spp., *Dicentra spectabilis*,
Dorotheantus spp., *Eustoma grandiflorum*, *Forsythia* spp., *Fuchsia* spp., *Geranium gnaphalium*, *Gerbera* spp., *Gomphrena globosa*, *Heliotropium* spp., *Helianthus* spp.,
Hibiscus spp., *Hortensia* spp., *Hydrangea* spp., *Hypoestes phyllostachya*, *Impatiens* spp. (*I. Walleriana*), *Iresines* spp., *Kalanchoe* spp., *Lantana camara*, *Lavatera trimestris*, *Leonotis*
 10 *leomurus*, *Lilium* spp., *Mesembryanthemum* spp., *Mimulus* spp., *Monarda* spp., *Nemesia* spp.,
Tagetes spp., *Dianthus* spp. (гвоздика), *Canna* spp., *Oxalis* spp., *Bellis* spp., *Pelargonium* spp. (*P. peltatum*, *P. Zonale*), *Viola* spp. (фиалка трехцветная), *Petunia* spp., *Phlox* spp.,
Plecthranthus spp., *Poinsettia* spp., *Parthenocissus* spp. (*P. quinquefolia*, *P. tricuspidata*),
Primula spp., *Ranunculus* spp., *Rhododendron* spp., *Rosa* spp. (роза), *Rudbeckia* spp.,
 15 *Saintpaulia* spp., *Salvia* spp., *Scaevola aemola*, *Schizanthus wisetonensis*, *Sedum* spp.,
Solanum spp., *Surfinia* spp., *Tagetes* spp., *Nicotinia* spp., *Verbena* spp., *Zinnia* spp. и другие растения для оформления цветника.

Например, настоящее изобретение можно применять по отношению к любому из следующих видов овощных культур: *Allium* spp. (*A. sativum*, *A. cepa*, *A. oschaninii*, *A.*
 20 *Porrum*, *A. ascalonicum*, *A. fistulosum*), *Anthriscus cerefolium*, *Apium graveolus*, *Asparagus officinalis*, *Beta vulgaris*, *Brassica* spp. (*B. Oleracea*, *B. Pekinensis*, *B. rapa*), *Capsicum annuum*, *Cicer arietinum*, *Cichorium endivia*, *Cichorium* spp. (*C. intybus*, *C. endivia*),
Citrillus lanatus, *Cucumis* spp. (*C. sativus*, *C. melo*), *Cucurbita* spp. (*C. pepo*, *C. maxima*),
Cyanara spp. (*C. scolymus*, *C. cardunculus*), *Daucus carota*, *Foeniculum vulgare*, *Hypericum*
 25 spp., *Lactuca sativa*, *Lycopersicon* spp. (*L. esculentum*, *L. lycopersicum*), *Mentha* spp.,
Ocimum basilicum, *Petroselinum crispum*, *Phaseolus* spp. (*P. vulgaris*, *P. coccineus*), *Pisum sativum*, *Raphanus sativus*, *Rheum rhaponticum*, *Rosemarinus* spp., *Salvia* spp., *Scorzonera hispanica*, *Solanum melongena*, *Spinacea oleracea*, *Valerianella* spp. (*V. locusta*, *V. eriocarpa*) и *Vicia faba*.

30 Предпочтительные виды декоративных растений включают африканскую фиалку, *Begonia*, *Dahlia*, *Gerbera*, *Hydrangea*, *Verbena*, *Rosa*, *Kalanchoe*, *Poinsettia*, *Aster*, *Centaurea*, *Coreopsis*, *Delphinium*, *Monarda*, *Phlox*, *Rudbeckia*, *Sedum*, *Petunia*, *Viola*, *Impatiens*, *Geranium*, *Chrysanthemum*, *Ranunculus*, *Fuchsia*, *Salvia*, *Hortensia*, розмарин, шалфей, зверобой, мяту, сладкий перец, томат и огурец.

Полиморфы в соответствии с настоящим изобретением являются особенно подходящими для контроля *Aphis craccivora*, *Diabrotica balteata*, *Heliothis virescens*, *Myzus persicae*, *Plutella xylostella* и *Spodoptera littoralis* на хлопчатнике, овощных, кукурузных, рисовых и соевых культурах. Полиморфы в соответствии с настоящим изобретением являются также особенно подходящими для контроля *Mamestra* (предпочтительно в овощных культурах), *Cydia pomonella* (предпочтительно в сортах яблони), *Empoasca* (предпочтительно в овощных культурах, виноградниках), *Leptinotarsa* (предпочтительно в сортах картофеля) и *Chilo suppressalis* (предпочтительно в рисе).

Под сельскохозяйственными культурами следует понимать такие культуры, которые встречаются в природе, получены традиционными способами селекции или получены при помощи генной инженерии. Они включают сельскохозяйственные культуры, которые характеризуются так называемыми привнесенными признаками продукта (например, улучшенной стойкостью при хранении, более высокой питательной ценностью и улучшенными вкусоароматическими свойствами).

Под сельскохозяйственными культурами также следует понимать такие сельскохозяйственные культуры, которым придали выносливость к гербицидам, подобным бромксинилу, или к классам гербицидов, таким как ALS-, EPSPS-, GS-, HPPD- и PPO-ингибиторы. Примером сельскохозяйственной культуры, которой придали выносливость к имидазолинонам, например имазамоксу, при помощи традиционных способов селекции, является сурепица Clearfield®. Примеры сельскохозяйственных культур, которым с помощью способов генной инженерии придали выносливость к гербицидам, включают, например, устойчивые к глифосату и глюфосинату сорта маиса, коммерчески доступные под торговыми названиями RoundupReady®, Herculex I® и LibertyLink®.

Под сельскохозяйственными культурами также следует понимать такие, которые по своей природе являются устойчивыми или которым придали устойчивость к причиняющим вред насекомым. Они включают растения, трансформированные с применением технологий рекомбинантной ДНК, например, таким образом, что они способны синтезировать один или несколько токсинов избирательного действия, таких как те, которые известны, например, у токсин-продуцирующих бактерий. Примеры токсинов, которые могут быть экспрессированы, включают δ-эндотоксины, вегетативные инсектицидные белки (Vip), инсектицидные белки бактерий,

колонизирующих нематод, и токсины, продуцируемые скорпионами, паукообразными, осами и грибами.

Примером сельскохозяйственной культуры, которая была модифицирована таким образом, чтобы экспрессировать токсин *Bacillus thuringiensis*, является Vt-маис KnockOut® (Syngenta Seeds). Примером сельскохозяйственной культуры, содержащей несколько генов, которые кодируют устойчивость к насекомым, и, таким образом, экспрессирующей несколько токсинов, является VipCot® (Syngenta Seeds). Сельскохозяйственные культуры или их семенной материал также могут быть устойчивыми к нескольким типам вредителей (так называемые трансгенные объекты с пакетированными генами, в случае если созданы путем генетической модификации). Например, растение может обладать способностью экспрессировать инсектицидный белок, являясь одновременно выносливым к гербицидам, например Herculex I® (Dow AgroSciences, Pioneer Hi-Bred International).

Дополнительными сферами применения композиций в соответствии с настоящим изобретением являются защита находящихся на хранении товаров и складских помещений и защита сырьевых материалов, таких как древесина, ткани, покрытия для пола или строительные материалы, а также применение в области санитарии, в частности, для защиты людей, домашних животных и продуктивного скота от вредителей упомянутого типа.

В настоящем изобретении также предусмотрен способ контроля вредителей (таких как комары и другие переносчики заболеваний; см. также http://www.who.int/malaria/vector_control/irs/en/). В одном варианте осуществления способ контроля вредителей включает применение композиций согласно настоящему изобретению по отношению к целевым вредителям, по отношению к их месторасположению или по отношению к поверхности или субстрату путем нанесения кистью, нанесения валиком, распыления, нанесения методом растекания или протравливания методом погружения. В качестве примера способ согласно настоящему изобретению предусматривает IRS-применение (распыление пестицидов остаточного действия внутри помещений) по отношению к поверхности, такой как поверхность стены, потолка или пола. В другом варианте осуществления предусматривается применение данных композиций по отношению к субстрату, такому как нетканый или тканый материал в виде (или который может применяться в изготовлении) сетки, одежды, постельных принадлежностей, занавесок и палаток. Следовательно, дополнительным объектом настоящего изобретения является субстрат, выбранный из

нетканого и тканого материала, содержащего композицию, которая содержит соединение формулы (I).

В одном варианте осуществления способ контроля таких вредителей включает применение пестицидно эффективного количества композиций согласно настоящему изобретению по отношению к целевым вредителям, по отношению к их месторасположению или по отношению к поверхности или субстрату так, чтобы обеспечить эффективный уровень активность пестицидов остаточного действия на поверхности или субстрате. Такое применение пестицидной композиции согласно настоящему изобретению можно осуществлять путем нанесения кистью, нанесения валиком, распыления, нанесения методом растекания или протравливания методом погружения. В качестве примера способ по настоящему изобретению предусматривает IRS-применение по отношению к поверхности, такой как поверхность стены, потолка или пола, для обеспечения таким образом эффективного уровня активности пестицидов остаточного действия на поверхности. В другом варианте осуществления предусматривается применение таких композиций для опосредованного остаточным действием контроля вредителей на субстрате, таком как тканый материал в виде (или который может применяться в изготовлении) сетки, одежды, постельных принадлежностей, занавесок и палаток.

Субстраты, включая подлежащие обработке нетканые материалы, тканые материалы или сетку, могут быть изготовлены из натуральных волокон, таких как хлопок, рафия, джут, лен, сизаль, мешковина или шерсть, или из синтетических волокон, таких как полиамид, сложный полиэфир, полипропилен, полиакрилонитрил или подобные. Сложные полиэфиры являются особенно подходящими. Способы обработки ткани известны, например, из WO 2008/151984, WO 2003/034823, US 5631072, WO 2005/64072, WO 2006/128870, EP 1724392, WO 2005113886 или WO 2007/090739.

Дополнительными областями применения композиций в соответствии с настоящим изобретением является сфера введения в дерево/обработки ствола касаясь всех декоративных деревьев, а также всех сортов плодовых и ореховых деревьев.

В сфере введения в дерево/обработки ствола полиморфы в соответствии с настоящим изобретением являются особенно подходящими против насекомых-древоточцев из отряда *Lepidoptera*, упоминаемых выше, и из отряда *Coleoptera*, особенно против древоточцев, перечисленных в следующих таблицах А и В.

Таблица А. Примеры завезенных древоточцев, имеющих экономическое значение

Семейство	Вид	Хозяин или заражаемая культура
Buprestidae	<i>Agilus planipennis</i>	Ясень
Cerambycidae	<i>Anoplura glabripennis</i>	Лиственные породы
Scolytidae	<i>Xylosandrus crassiusculus</i>	Лиственные породы
	<i>X. mutilatus</i>	Лиственные породы
	<i>Tomicus piniperda</i>	Хвойные породы

Таблица В. Примеры местных древоточцев, имеющих экономическое значение

Семейство	Вид	Хозяин или заражаемая культура
Buprestidae	<i>Agilus anxius</i>	Береза
	<i>Agilus politus</i>	Ива, клен
	<i>Agilus scyi</i>	Восковница, комптония
	<i>Agilus vittaticollis</i>	Яблоня, груша, клюква, ирга, боярышник
	<i>Chrysobothris femorata</i>	Яблоня, абрикос, бук, клен ясенелистный, вишня, каштан, смородина, вяз, боярышник, каркас, гикори, конский каштан, липа, клен, рябина, дуб, пекан, груша, персик, хурма, слива, тополь, айва, багряник, ирга, платан, грецкий орех, ива
	<i>Texania campestris</i>	Липа американская, бук, клен, дуб, платан, ива, тюльпанное дерево
Cerambycidae	<i>Goes pulverulentus</i>	Бук, вяз, тexasский красный дуб, ива, калифорнийский черный дуб, красный болотный дуб, дуб черный, платан
	<i>Goes tigrinus</i>	Дуб
	<i>Neoclytus acuminatus</i>	Ясень, гикори, дуб, грецкий орех, береза, бук, клен, хмелеграб виргинский, кизил, хурма, багряник, остролист, каркас, белая акация, гледичия, тюльпанное дерево, каштан, маклюра оранжевая, сассафрас, сирень, церкокарпус, груша, вишня, слива, персик, яблоня, вяз, липа американская, амбровое дерево
	<i>Neoptychodes trilineatus</i>	Инжир, ольха, шелковица, ива,

Семейство	Вид	Хозяин или заражаемая культура
		каркас сетчатый
	<i>Oberea ocellata</i>	Сумах, яблоня, персик, слива, груша, смородина, ежевика
	<i>Oberea tripunctata</i>	Кизил, калина, вяз, оксидендрум древовидный, голубика, рододендрон, азалия, лавр, тополь, ива, шелковица
	<i>Oncideres cingulata</i>	Гикори, пекан, хурма, вяз, оксидендрум древовидный, липа американская, гледичия, кизил, эвкалипт, дуб, каркас, клен, плодовые деревья
	<i>Saperda calcarata</i>	Тополь
	<i>Strophiona nitens</i>	Каштан, дуб, гикори, грецкий орех, бук, клен
Scolytidae	<i>Corthylus columbianus</i>	Клен, дуб, тюльпанное дерево, бук, клен ясенелистный, платан, береза, липа американская, каштан, вяз
	<i>Dendroctonus frontalis</i>	Сосна
	<i>Dryocoetes betulae</i>	Береза, амбровое дерево, дикая вишня, бук, груша
	<i>Monarthrum fasciatum</i>	Дуб, клен, береза, каштан, амбровое дерево, нисса лесная, тополь, гикори, мимоза, яблоня, персик, сосна
	<i>Phloeotribus liminaris</i>	Персик, вишня, слива, черемуха поздняя, вяз, шелковица, рябина
	<i>Pseudopityophthorus pruinosis</i>	Дуб, бук американский, черемуха поздняя, слива узколистная, каштан, клен, гикори, граб, хмелеграб
Sesiidae	<i>Paranthrene simulans</i>	Дуб, каштан американский
	<i>Sannina uroceriformis</i>	Хурма
	<i>Synanthedon exitiosa</i>	Персик, слива, нектарин, вишня, абрикос, миндаль, черемуха поздняя
	<i>Synanthedon pictipes</i>	Персик, слива, вишня, бук, черемуха поздняя
	<i>Synanthedon rubrofascia</i>	Тупело
	<i>Synanthedon scitula</i>	Кизил, пекан, гикори, дуб, каштан, бук, береза, черемуха поздняя, вяз, рябина, калина, ива, яблоня, мушмула японская, пузыреплодник, восковница
	<i>Vitacea polistiformis</i>	Виноград

Настоящее изобретение также можно применять для контроля любых насекомых-вредителей, которые могут присутствовать в газонной траве, в том числе, например, жуков, гусениц, огненных муравьев, червецов, двупарноногих многоножек, мокриц, клещей, медведок, щитовок, мучнистых червецов, иксодовых клещей, пенниц, южных земляных клопов и личинок хруща. Настоящее изобретение можно применять для контроля насекомых-вредителей на различных стадиях их жизненного цикла, в том числе на стадии яиц, личинок, нимф и взрослых особей.

В частности, настоящее изобретение можно применять для контроля насекомых-вредителей, которые питаются корнями газонной травы, в том числе личинок хруща (таких как *Cyclocephala spp.* (например, масковый хрущ, *C. lurida*), *Rhizotrogus spp.* (например, хрущ европейский, *R. majalis*), *Cotinus spp.* (например, хрущ блестящий зеленый, *C. nitida*), *Popillia spp.* (например, хрущик японский, *P. japonica*), *Phyllophaga spp.* (например, майский/июньский хрущ), *Ataenius spp.* (например, Black turfgrass ataenius, *A. spretulus*), *Maladera spp.* (например, хрущик азиатский садовый, *M. castanea*) и *Tomarus spp.*), червецов (*Margarodes spp.*), медведок (темно-желтых, южных и короткокрылых; *Scapteriscus spp.*, *Gryllotalpa africana*) и личинок комаров-долгоножек (долгоножка болотная, *Tipula spp.*).

Настоящее изобретение также можно применять для контроля насекомых-вредителей газонной травы, которые обитают в солоmine, в том числе "походных червей" (таких как совка травяная *Spodoptera frugiperda* и совка луговая *Pseudaletia unipuncta*), гусениц озимой совки, долгоносиков (*Sphenophorus spp.*, таких как *S. venatus* *verstitus* и *S. parvulus*) и огневок (таких как *Crambus spp.* и тропические огневки, *Herpetogramma phaeopteralis*).

Настоящее изобретение также можно применять для контроля насекомых-вредителей газонной травы, которые живут над землей и питаются листьями газонной травы, в том числе земляных клопов (таких как южные земляные клопы, *Blissus insularis*), клеща бермудской травы (*Eriophyes cynodoniensis*), червеца хлорис гвианской (*Antonina graminis*), пенницы двухполосой (*Prospapia bicincta*), цикадок, гусениц озимой совки (семейства *Noctuidae*) и тлей злаковых.

Настоящее изобретение также можно применять для контроля других вредителей газонной травы, таких как муравьи огненные импортные красные (*Solenopsis invicta*), которые создают муравейники на поверхности газона.

В области санитарии композиции в соответствии с настоящим изобретением активны против эктопаразитов, таких как твердые клещи, мягкие клещи, зудни чесоточные, краснотелки, мухи (жалящие и лижущие), личинки паразитических мух, вши, головные вши, пухоеды и блохи у птиц.

5 Примерами таких паразитов являются следующие.

Из отряда Anoplurida: *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp. и *Phtirus* spp., *Solenopotes* spp..

Из отряда Mallophagida: *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Damalina* spp., *Trichodectes* spp. и *Felicola* spp..

10 Из отряда Diptera и подотрядов Nematocera и Brachycera, например, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Simulium* spp., *Eusimulium* spp., *Phlebotomus* spp., *Lutzomyia* spp., *Culicoides* spp., *Chrysops* spp., *Hybomitra* spp., *Atylotus* spp., *Tabanus* spp., *Haematopota* spp., *Philipomyia* spp., *Braula* spp., *Musca* spp., *Hydrotaea* spp., *Stomoxys* spp., *Haematobia* spp., *Morellia* spp., *Fannia* spp., *Glossina* spp., *Calliphora* spp., *Lucilia* spp.,
15 *Chrysomyia* spp., *Wohlfahrtia* spp., *Sarcophaga* spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Gasterophilus* spp., *Hippobosca* spp., *Lipoptena* spp. и *Melophagus* spp..

Из отряда Siphonaptera, например, *Pulex* spp., *Ctenocephalides* spp., *Xenopsylla* spp., *Ceratophyllus* spp..

Из отряда Heteroptera, например, *Cimex* spp., *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp.,
20 *Panstrongylus* spp..

Из отряда Blattellidae, например, *Blattella germanica*, *Periplaneta americana*, *Blattella germanica* и *Supella* spp..

Из подкласса Acaria (Acarida) и отрядов Meta- и Mesostigmata, например, *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Otobius* spp., *Ixodes* spp., *Amblyomma* spp., *Boophilus* spp.,
25 *Dermacentor* spp., *Haemaphysalis* spp., *Hyalomma* spp., *Rhipicephalus* spp., *Dermanyssus* spp., *Raillietia* spp., *Pneumonyssus* spp., *Sternostoma* spp. и *Varroa* spp..

Из отрядов Actinotrichida (Prostigmata) и Acaridida (Astigmata), например, *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Ornithocheyletia* spp., *Myobia* spp., *Psorergates* spp., *Demodex* spp.,
30 *Trombicula* spp., *Listrophorus* spp., *Acarus* spp., *Tyrophagus* spp., *Caloglyphus* spp., *Hypodectes* spp., *Pterolichus* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Otodectes* spp., *Sarcoptes* spp., *Notoedres* spp., *Knemidocoptes* spp., *Cytodites* spp. и *Laminosioptes* spp..

Композиции в соответствии с настоящим изобретением также являются подходящими для защиты от заражения насекомыми в случае материалов, таких как

древесина, ткани, пластики, клейкие вещества, виды клея, краски, бумага и картон, кожа, покрытия для пола и строительные материалы.

Композиции в соответствии с настоящим изобретением можно применять, например, против следующих вредителей: жуков, таких как *Hylotrupes bajulus*,
5 *Chlorophorus pilosis*, *Anobium punctatum*, *Xestobium rufovillosum*, *Ptilinuspecticornis*,
Dendrobium pertinex, *Ernobius mollis*, *Priobium carpini*, *Lyctus brunneus*, *Lyctus africanus*,
Lyctus planicollis, *Lyctus linearis*, *Lyctus pubescens*, *Trogoxylon aequale*, *Minthesrugicollis*,
Xyleborus spec., *Tryptodendron spec.*, *Apate monachus*, *Bostrychus capucins*,
10 *Heterobostrychus brunneus*, *Sinoxylon spec.* и *Dinoderus minutus*, а также
перепончатокрылых насекомых, таких как *Sirex juvencus*, *Urocerus gigas*, *Urocerus gigas*
tagnus и *Urocerus augur*, и термитов, таких как *Kaloterme flavicollis*, *Cryptotermes*
brevis, *Heterotermes indicola*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes santonensis*,
Reticulitermes lucifugus, *Mastotermes darwiniensis*, *Zootermopsis nevadensis* и *Coptotermes*
formosanus, и щетинохвосток, таких как *Lepisma saccharina*.

15 Норма, в которой применяют агрохимические композиции по настоящему
изобретению, будет зависеть от конкретного типа насекомого, подлежащего контролю,
необходимой степени контроля, а также срока и способа применения, и может быть
легко установлена специалистом в данной области. В целом композиции по
настоящему изобретению можно применять при норме применения, составляющей от
20 0,005 килограмма/гектар (кг/га) до приблизительно 5,0 кг/га в пересчете на общее
количество активного ингредиента (где 'активный ингредиент' означает полиморф или
полиморфы по настоящему изобретению) в композиции. Предпочтительной является
норма применения от приблизительно 0,1 кг/га до приблизительно 1,5 кг/га, при этом
особенно предпочтительной является норма применения от приблизительно 0,3 кг/га до
25 0,8 кг/га.

На практике агрохимические композиции, содержащие полиморф или
полиморфы по настоящему изобретению, применяют в виде состава, содержащего
различные вспомогательные средства и носители, известные или применяемые в
отрасли.

30 Данные составы могут находиться в различных физических формах, например, в
форме порошков для опудривания, гелей, смачиваемых порошков, диспергируемых в
воде гранул, диспергируемых в воде таблеток, шипучих драже, эмульгируемых
концентратов, микроэмульгируемых концентратов, эмульсий типа "масло-в-воде",
масляных текучих составов, водных дисперсий, масляных дисперсий, суспензий,

капсульных суспензий, эмульгируемых гранул, растворимых жидкостей, водорастворимых концентратов (с водой или смешиваемым с водой органическим растворителем в качестве носителя), пропитанных полимерных пленок или в других формах, известных, например, из Manual on Development and Use of FAO and WHO Specifications for Pesticides, United Nations, First Edition, Second Revision (2010). Такие составы можно либо применять непосредственно, либо разбавлять перед применением. Разбавленные растворы можно получать, например, при помощи воды, жидких удобрений, питательных микроэлементов, биологических организмов, масла или растворителей.

10 Составы можно получать, например, путем смешивания полиморфа или полиморфов ('активного ингредиента') со вспомогательными средствами для составления с получением составов в форме тонкодисперсных твердых веществ, гранул, растворов, дисперсий или эмульсий. Активный ингредиент также можно составлять с другими вспомогательными средствами, такими как тонкодисперсные
15 твердые вещества, минеральные масла, масла растительного или животного происхождения, модифицированные масла растительного или животного происхождения, органические растворители, вода, поверхностно-активные вещества или их комбинации.

Активный ингредиент также может содержаться в очень мелких микрокапсулах. Микрокапсулы содержат активный ингредиент в пористом носителе. Это обеспечивает возможность высвобождения активного ингредиента в окружающую среду в регулируемых количествах (например, медленное высвобождение). Микрокапсулы обычно имеют диаметр от 0,1 до 500 микрон. Они содержат активный ингредиент в количестве от приблизительно 25 до 95% по весу от веса капсулы. Активный
20 ингредиент может находиться в форме монолитного твердого вещества, в форме мелких частиц в твердой или жидкой дисперсии или в форме подходящего раствора. Инкапсулирующие мембраны могут содержать, например, природные или синтетические каучуки, целлюлозу, сополимеры стирола и бутадиена, полиакрилонитрил, полиакрилат, сложные полиэфиры, полиамиды, полимочевины,
25 полиуретан или химически модифицированные полимеры и ксантогенаты крахмала или другие полимеры, известные специалисту в данной области. В качестве альтернативы могут быть образованы очень мелкие микрокапсулы, в которых активный ингредиент содержится в форме тонкодисперсных частиц в твердой матрице основного вещества, но микрокапсулы сами по себе не являются инкапсулированными.
30

Вспомогательные средства для составления, которые являются подходящими для получения составов в соответствии с настоящим изобретением, известны *per se*. В качестве жидких носителей можно использовать следующее: воду, толуол, ксилол, петролейный эфир, растительные масла, ацетон, метилэтилкетон, циклогексанон, ангидриды кислот, ацетонитрил, ацетофенон, амилацетат, 2-бутанон, бутиленкарбонат, хлорбензол, циклогексан, циклогексанол, сложные алкиловые эфиры уксусной кислоты, диацетоновый спирт, 1,2-дихлорпропан, диэтаноламин, п-диэтилбензол, диэтиленгликоль, диэтиленгликоля абиетат, простой бутиловый эфир диэтиленгликоля, простой этиловый эфир диэтиленгликоля, простой метиловый эфир диэтиленгликоля, *N,N*-диметилформамид, диметилсульфоксид, 1,4-диоксан, дипропиленгликоль, простой метиловый эфир дипропиленгликоля, дибензоат дипропиленгликоля, дипрокситол, алкилпирролидон, этилацетат, 2-этилгексанол, этиленкарбонат, 1,1,1-трихлорэтан, 2-гептанон, альфа-пинен, d-лимонен, этиллактат, этиленгликоль, простой бутиловый эфир этиленгликоля, простой метиловый эфир этиленгликоля, гамма-бутиролактон, глицерин, ацетат глицерина, диацетат глицерина, триацетат глицерина, гексадекан, гексиленгликоль, изоамилацетат, изоборнилацетат, изооктан, изофорон, изопропилбензол, изопропилмиридат, молочную кислоту, лауриламин, мезитилоксид, метоксипропанол, метилизоамилкетон, метилизобутилкетон, метиллаурат, метилоктаноат, метилолеат, метиленхлорид, м-ксилол, *n*-гексан, *n*-октиламин, октадекановую кислоту, октиламинацетат, олеиновую кислоту, олеиламин, о-ксилол, фенол, полиэтиленгликоль, пропионовую кислоту, пропиллактат, пропиленкарбонат, пропиленгликоль, простой метиловый эфир пропиленгликоля, п-ксилол, толуол, триэтилфосфат, триэтиленгликоль, ксилолсульфовую кислоту, парафин, минеральное масло, трихлорэтилен, перхлорэтилен, этилацетат, амилацетат, бутилацетат, простой метиловый эфир пропиленгликоля, простой метиловый эфир диэтиленгликоля, метанол, этанол, изопропанол и высокомолекулярные спирты, такие как амиловый спирт, тетрагидрофурфуриловый спирт, гексанол, октанол, этиленгликоль, пропиленгликоль, глицерин, *N*-метил-2-пирролидон и т. п.

Подходящими твердыми носителями являются, например, тальк, диоксид титана, пирофиллитовая глина, диоксид кремния, аттапульгитовая глина, кизельгур, известняк, карбонат кальция, бентонит, кальциевый монтмориллонит, шелуха семян хлопчатника, пшеничная мука, соевая мука, пемза, древесная мука, измельченная скорлупа грецких орехов, лигнин и подобные вещества.

Большое количество поверхностно-активных веществ можно успешно использовать как в твердых, так и в жидких составах, особенно в тех составах, которые можно разбавлять носителем перед применением. Поверхностно-активные вещества могут быть анионными, катионными, неионогенными или полимерными, и их можно использовать в качестве эмульгаторов, смачивающих средств или суспендирующих средств или для других целей. Типичные поверхностно-активные вещества включают, например, соли алкилсульфатов, такие как лаурилсульфат диэтаноламмония; соли алкиларилсульфонатов, такие как додецилбензолсульфонат кальция; продукты присоединения алкилфенола/алкиленоксида, такие как этилоксилат нонилфенола; продукты присоединения спирта/алкиленоксида, такие как этоксилат тридецилового спирта; мыла, такие как стеарат натрия; соли алкилнафталинсульфонатов, такие как дибутилнафталинсульфонат натрия; сложные диалкиловые эфиры сульфосукцинатных солей, такие как натрий-ди(2-этилгексил)сульфосукцинат; сложные эфиры сорбита, такие как сорбитолеат; четвертичные амины, такие как лаурилтриметиламмония хлорид, сложные полиэтиленгликолевые эфиры жирных кислот, такие как стеарат полиэтиленгликоля; блок-сополимеры этиленоксида и пропиленоксида и соли моно- и диалкилфосфатных сложных эфиров; а также дополнительные вещества, описанные, например, в McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual, MC Publishing Corp., Ridgewood New Jersey (1981).

Дополнительные вспомогательные средства, которые можно использовать в пестицидных составах, включают ингибиторы кристаллизации, модификаторы вязкости, суспендирующие средства, красители, антиоксиданты, вспенивающие вещества, поглотители света, вспомогательные вещества для смешивания, противовспенивающие вещества, комплексообразующие средства, нейтрализующие или модифицирующие pH вещества и буферы, ингибиторы коррозии, отдушки, смачивающие средства, усилители поглощения, питательные микроэлементы, пластификаторы, вещества, способствующие скольжению, смазывающие вещества, диспергирующие вещества, загустители, антифризы, микробициды, а также жидкие и твердые удобрения.

Составы в соответствии с настоящим изобретением могут включать добавку, предусматривающую масло растительного или животного происхождения, минеральное масло, сложные алкиловые эфиры таких масел или смеси таких масел и производных масел. Количество масляной добавки в составах в соответствии с настоящим изобретением обычно составляет от 0,01 до 10% в пересчете на количество

смеси, подлежащей применению. Например, масляную добавку можно добавлять в резервуар опрыскивателя в требуемой концентрации после приготовления смеси для распыления. Предпочтительные масляные добавки включают минеральные масла, или масло растительного происхождения, например, рапсовое масло, оливковое масло или подсолнечное масло, эмульгированное растительное масло, сложные алкиловые эфиры масел растительного происхождения, например метиловые производные, или масло животного происхождения, такое как рыбий жир или говяжье сало. Предпочтительные масляные добавки включают сложные алкиловые эфиры C₈-C₂₂-жирных кислот, особенно метиловые производные C₁₂-C₁₈-жирных кислот, например, сложные метиловые эфиры лауриновой кислоты, пальмитиновой кислоты и олеиновой кислоты (метиллаурат, метилпальмитат и метилолеат соответственно). Многие производные масел известны из Compendium of Herbicide Adjuvants, 10th Edition, Southern Illinois University, 2010.

Составы по настоящему изобретению содержат, как правило, от 0,1 до 99% по весу, в частности от 0,1 до 95% по весу, полиморфов по настоящему изобретению и от 1 до 99,9% по весу вспомогательного средства для составления, которое предпочтительно включает от 0 до 25% по весу поверхностно-активного вещества. Поскольку коммерческие продукты предпочтительно могут быть составлены в виде концентратов, то конечный потребитель обычно будет использовать разбавленные составы.

Нормы применения варьируются в широких пределах и зависят от свойств почвы, способа применения, культурного растения, вредителя, подлежащего контролю, преобладающих климатических условий и других факторов, определяемых способом применения, временем применения и целевой сельскохозяйственной культурой. В качестве общего руководства полиморфы по настоящему изобретению можно применять при норме от 1 до 2000 л/га, в частности от 10 до 1000 л/га.

Предпочтительные составы могут характеризоваться следующими композициями (вес. %).

Эмульгируемые концентраты:

активный ингредиент:	1-95%, предпочтительно 60-90%;
поверхностно-активное вещество:	1-30%, предпочтительно 5-20%;
жидкий носитель:	1-80%, предпочтительно 1-35%.

Пылевидные препараты:

активный ингредиент: 0,1-10%, предпочтительно 0,1-5%;
 твердый носитель: 99,9-90%, предпочтительно 99,9-99%.

Суспензионные концентраты:

активный ингредиент: 5-75%, предпочтительно 10-50%;
 вода: 94-24%, предпочтительно 88-30%;
 поверхностно-активное вещество: 1-40%, предпочтительно 2-30%.

Смачиваемые порошки:

активный ингредиент: 0,5-90%, предпочтительно 1-80%;
 поверхностно-активное вещество: 0,5-20%, предпочтительно 1-15%;
 твердый носитель: 5-95%, предпочтительно 15-90%.

Гранулы:

активный ингредиент: 0,1-30%, предпочтительно 0,1-15%;
 твердый носитель: 99,5-70%, предпочтительно 97-85%.

5 Следующие примеры дополнительно иллюстрируют настоящее изобретение, но не ограничивают его.

<u>Смачиваемые порошки</u>	a)	b)	c)
активный ингредиент	25 %	50 %	75 %
лигносульфонат натрия	5 %	5 %	-
лаурилсульфат натрия	3 %	-	5 %
дизобутилнафталинсульфонат натрия	-	6 %	10 %
простой феноловый эфир полиэтиленгликоля (7-8 моль этиленоксида)	-	2 %	-
высокодисперсная кремниевая кислота	5 %	10 %	10 %
каолин	62 %	27 %	-

10 Комбинацию тщательно перемешивают со вспомогательными средствами и смесь тщательно измельчают в подходящей мельнице с получением смачиваемых порошков, которые можно разбавлять водой с получением суспензий требуемой концентрации.

<u>Порошки для сухой обработки семян</u>	a)	b)	c)
активный ингредиент	25 %	50 %	75 %
легкое минеральное масло	5 %	5 %	5 %
высокодисперсная кремниевая кислота	5 %	5 %	-
каолин	65 %	40 %	-
тальк	-		20

Комбинацию тщательно перемешивают со вспомогательными средствами и смесь тщательно измельчают в подходящей мельнице с получением порошков, которые можно использовать непосредственно для обработки семян.

<u>Эмульгируемый концентрат</u>	
активный ингредиент	10 %
простой октилфеноловый эфир полиэтиленгликоля (4-5 моль этиленоксида)	3 %
додецилбензолсульфонат кальция	3 %
простой полигликолевый эфир касторового масла (35 моль этиленоксида)	4 %
циклогексанон	30 %
смесь ксилолов	50 %

5

Из этого концентрата путем разбавления водой можно получить эмульсии любой необходимой степени разведения, которые можно применять для защиты растений.

<u>Пылевидные препараты</u>	a)	b)	c)
активный ингредиент	5 %	6 %	4 %
тальк	95 %	-	-
каолин	-	94 %	-
минеральный наполнитель	-	-	96 %

10

Готовые к применению пылевидные препараты получают путем перемешивания комбинации с носителем и измельчения смеси в подходящей мельнице. Такие порошки также можно применять для сухого протравливания семян.

<u>Экструдированные гранулы</u>	
активный ингредиент	15 %
лигносульфонат натрия	2 %
карбоксиметилцеллюлоза	1 %
каолин	82 %

Комбинацию перемешивают и измельчают со вспомогательными средствами и смесь увлажняют водой. Смесь экструдуют и затем высушивают в потоке воздуха.

<u>Покрытые оболочкой гранулы</u>	
активный ингредиент	8 %
полиэтиленгликоль (молекулярная масса 200)	3 %
Каолин	89 %

- 5 Тонкоизмельченную комбинацию в перемешивающем устройстве равномерно наносят на увлажненный полиэтиленгликолем каолин. Таким образом получают непылевидные покрытые оболочкой гранулы.

Суспензионный концентрат

активный ингредиент	40 %
пропиленгликоль	10 %
простой полиэтиленгликолевый эфир нонилфенола (15 моль этиленоксида)	6 %
лигносульфонат натрия	10 %
карбоксиметилцеллюлоза	1 %
силиконовое масло (в форме 75% эмульсии в воде)	1 %
вода	32 %

- 10 Тонкоизмельченную комбинацию тщательно перемешивают со вспомогательными средствами с получением суспензионного концентрата, из которого можно получать суспензии любой требуемой степени разведения путем разбавления водой. Используя такие разбавленные растворы, можно обработать и защитить от заражения микроорганизмами живые растения, а также материал для размножения
- 15 растений путем опрыскивания, полива или погружения.

Текущий концентрат для обработки семян

активный ингредиент	40 %
пропиленгликоль	5 %
сополимер бутанола и РО/ЕО	2 %
тристиролфенол с 10-20 молями ЕО	2 %
1,2-бензизотиазолин-3-он (в форме 20% раствора в воде)	0,5 %
кальциевая соль моноазопигмента	5 %
силиконовое масло (в форме 75% эмульсии в воде)	0,2 %
вода	45,3 %

Тонкоизмельченную комбинацию тщательно перемешивают со вспомогательными средствами с получением суспензионного концентрата, из которого можно получать суспензии любой требуемой степени разведения путем разбавления водой. Используя такие разбавленные растворы, можно обработать и защитить от заражения микроорганизмами живые растения, а также материал для размножения растений путем опрыскивания, полива или погружения.

Капсульная суспензия медленного высвобождения

Смешивают 28 частей активного ингредиента с 2 частями ароматического растворителя и 7 частями смеси толуолдиизоцианат/полиметилениполифенилизоцианат (8:1). Данную смесь эмульгируют в смеси из 1,2 части поливинилового спирта, 0,05 части пеногасителя и 51,6 части воды до получения частиц требуемого размера. К данной эмульсии добавляют смесь 2,8 части 1,6-диаминогексана в 5,3 части воды. Смесь взбалтывают до завершения реакции полимеризации. Полученную капсульную суспензию стабилизируют путем добавления 0,25 части загустителя и 3 частей диспергирующего средства. В составе капсульной суспензии содержится 28% активного ингредиента. Средний диаметр капсул составляет 8-15 микрон. Полученный состав применяют в виде водной суспензии по отношению к семенам в устройстве, подходящем для этой цели.

Каждый из вышеприведенных составов можно получать в виде упаковки, содержащей полиморф или полиморфы по настоящему изобретению вместе с другими ингредиентами состава (разбавителями, эмульгаторами, поверхностно-активными веществами и т. д.). Составы также можно получать с помощью способа смешивания в

резервуаре, согласно которому ингредиенты получают отдельно и объединяют на участке, где производят выращивание растений.

Данные составы можно применять на участках, где требуется осуществление контроля, при помощи традиционных способов. Пылевидные и жидкие составы, например, можно применять при помощи моторных опылителей, веника и ручных опрыскивателей, а также комбинированных устройств для опрыскивания/опыливания. Составы также можно вносить из самолетов в виде пылевидного препарата или распыляемого препарата или с помощью вариантов применения с использованием веревочного фитиля. Как твердые, так и жидкие составы можно применять по отношению к почве в месте произрастания растения, подлежащего обработке, с обеспечением проникновения активного ингредиента в растение через корни.

Полиморфы по настоящему изобретению и композиции на их основе также являются подходящими для защиты материала для размножения растений, например, посадочных материалов, таких как плоды, клубни или зерна, или саженцев, от вредителей упомянутого выше типа. Материал для размножения можно обрабатывать с помощью полиморфа перед посадкой, например семена можно обрабатывать перед посевом. В качестве альтернативы полиморф можно применять по отношению к ядрам семян (нанесение покрытия) либо с помощью замачивания ядер в жидкой композиции, либо с помощью нанесения слоя твердой композиции. Композиции также можно применять при посадке материала для размножения по отношению к месту применения, например, вносить в борозду для семян во время рядового сева. Данные способы обработки материала для размножения растений и обработанный таким образом материал для размножения растений являются дополнительными объектами настоящего изобретения. Типичные нормы обработки будут зависеть от растения и вредителя/грибов, подлежащих контролю, и обычно они составляют от 1 до 200 грамм на 100 кг семян, предпочтительно от 5 до 150 грамм на 100 кг семян, например, от 10 до 100 грамм на 100 кг семян.

Термин "семя" охватывает семена и вегетативные части растений всех видов, в том числе без ограничения истинные семена, кусочки семян, корневые побеги, зерна злаковых, луковицы, плоды, клубни, зерна, корневища, черенки, нарезанные побеги и т. п., и в предпочтительном варианте осуществления означает истинные семена.

Настоящее изобретение также содержит семена, покрытые или обработанные полиморфом по настоящему изобретению или содержащие его. Термин "покрытое или обработанное и/или содержащее" обычно означает, что на большей части поверхности

семени находится активный ингредиент во время его применения, хотя большая или меньшая часть ингредиента может проникать в семенной материал в зависимости от способа применения. Если указанный семенной продукт высаживают (пересаживают), он может поглощать активный ингредиент. В одном варианте осуществления с помощью настоящего изобретения можно получать материал для размножения растений с адгезированным к нему соединением формулы (I). Кроме того, в настоящем документе представлен содержащий композицию материал для размножения растений, обработанный соединением формулы (I).

Обработка семян предусматривает все подходящие методики обработки семян, известные из уровня техники, такие как протравливание семян, нанесение покрытия на семена, опудривание семян, пропитывание семян и дражирование семян. Применение соединения формулы (I) при обработке семян может осуществляться с помощью любых известных способов, таких как распыление на семена или опыливание семян, перед посевом или во время посева/высаживания семян.

Соответственно, агрохимические композиции и составы по настоящему изобретению применяют до развития заболевания. Нормы и частота применения составов являются традиционно применяемыми в данной области и будут зависеть от риска заражения патогеном, представляющим собой насекомое.

Активность композиций, содержащих соединения и полиморфы в соответствии с настоящим изобретением, можно значительно расширить и адаптировать к преобладающим условиям путем включения других активных веществ. Активные вещества могут быть химического или биологического типа, и в случае биологического типа они могут быть дополнительно модифицированы из биологических видов природного происхождения. Активные вещества включают вещества, которые в целом обеспечивают контроль, отпугивают или привлекают вредителей, повреждающих полезные растения или наносящих им вред, а также вещества, которые улучшают рост полезного растения, такие как регуляторы роста растений, и вещества, которые улучшают эффективность активного вещества, такие как синергисты. Примерами являются инсектициды, акарициды, нематоциды, моллюскоциды, альгициды, вирусоциды, родентициды, бактерициды, фунгициды, хемотрисциды, антигельминтики. Примеры биологически активного вещества включают бакуловирус, растительный экстракт и бактерии.

Соответственно, настоящее изобретение предусматривает применение композиции в соответствии с настоящим изобретением вместе с одним или

несколькими пестицидами, питательными веществами для растений или удобрениями для растений. Комбинация может также охватывать конкретные признаки растения, которые включены в растение с использованием любых средств, например, традиционной селекции или генетической модификации.

5 Смеси полиморфов по настоящему изобретению с другими активными веществами могут также обладать дополнительными неожиданными преимуществами, которые также могут быть описаны в более широком смысле как синергетическая активность. К примеру, это лучшая переносимость растениями, уменьшенная степень фитотоксичности, возможность контроля насекомых на разных стадиях их развития
10 или лучшие показатели касаясь их получения, например, измельчения или смешивания, хранения или применения.

Отдельные активные вещества могут встречаться в более чем одной группе или в более чем одном классе, и в более чем одном месте в группе или классе: информацию об активных веществах, их спектр, источники и классификации можно найти в
15 Compendium of Pesticide Common Names (см. <http://www.alanwood.net/pesticides/index.html>) или в Pesticide Manual, созданном British Crop Production Council (см. <http://bcpcdata.com/pesticide-manual.html>).

Ниже приведены предпочтительные смеси, где полиморф или полиморфы по настоящему изобретению обозначены как "I".

20 Композиции, содержащие вспомогательное средство, включают I + соединения, выбранные из группы веществ, состоящей из нефтяных масел.

Композиции, содержащие акарицид, включают I + 1,1-бис(4-хлорфенил)-2-этоксиэтанол, I + 2,4-дихлорфенилбензолсульфонат, I + 2-фтор-N-метил-N-1-нафтилацетамид, I + 4-хлорфенилфенилсульфон, I + абамектин, I + ацеквиноцил, I +
25 ацетопрол, I + акринатрин, I + альдикарб, I + альдоксикарб, I + альфа-циперметрин, I + амидитион, I + амидофлумет, I + амидотиоат, I + амитон, I + амитона гидрооксалат, I + амитраз, I + арамит, I + оксид мышьяка, I + AVI 382, I + AZ 60541, I + азинфос-этил, I + азинфос-метил, I + азобензол, I + азоциклотин, I + азотоат, I + беномил, I + беноксафос, I + бензоксимат, I + бензилбензоат, I + бифеназат, I + бифентрин, I + бинапакрил, I +
30 бромфенвалерат, I + бромоциклен, I + бромофос, I + бромофос-этил, I + бромпропилат, I + бупрофезин, I + бутоксикарбоксим, I + бутоксикарбоксим, I + бутилпиридабен, I + полисульфид кальция, I + камфехлор, I + карбанолат, I + карбарил, I + карбофуран, I + карбофенотион, I + CGA 50'439, I + хинометионат, I + хлорбензид, I + хлордимеформ, I + хлордимеформа гидрохлорид, I + хлорфенапир, I + хлорфенетол, I + хлорфенсон, I +

хлорфенсульфид, I + хлорфенвинфос, I + хлоробензилат, I + хлоромебуформ, I +
 хлорометиурон, I + хлорпропилат, I + хлорпирифос, I + хлорпирифос-метил, I +
 хлортиофос, I + цинерин I, I + цинерин II, I + цинерины, I + клофентезин, I + клозантел,
 5 I + кумафос, I + кротамитон, I + кротоксифос, I + куфранеб, I + циантоат, I +
 цифлуметофен, I + цигалотрин, I + цигексатин, I + циперметрин, I + DCPM, I + DDT, I +
 демефион, I + демефион-O, I + демефион-S, I + деметон, I + деметон-метил, I +
 деметон-O, I + деметон-O-метил, I + деметон-S, I + деметон-S-метил, I + деметон-S-
 метилсульфон, I + диафентиурон, I + диалифос, I + диазинон, I + дихлорфлуанид, I +
 10 дихлорвос, I + диклифос, I + дикофол, I + дикротофос, I + диенохлор, I + димефокс, I +
 диметоат, I + динактин, I + динекс, I + динекс-диклексин, I + динобутон, I + динокап, I
 + динокап-4, I + динокап-6, I + диноктон, I + динопентон, I + диносульфен, I +
 динотербон, I + диоксатион, I + дифенилсульфон, I + дисульфирам, I + дисульфотон, I +
 DNOC, I + дофенапин, I + дорамектин, I + эндосульфен, I + эндотион, I + EPN, I +
 15 эприномектин, I + этион, I + этоат-метил, I + этоксазол, I + этримфос, I + феназафлор, I
 + феназаквин, I + фенбутатина оксид, I + фенотиокарб, I + фенпропатрин, I + фенпирад,
 I + фенпироксимат, I + фензон, I + фентрифанил, I + фенвалерат, I + фипронил, I +
 флуакрипирим, I + флуазурон, I + флубензимин, I + флуциклоксурон, I + флуцитринат,
 I + флуенетил, I + флуфеноксурон, I + флуметрин, I + флуорбензид, I + флювалинат, I +
 FMC 1137, I + форметанат, I + форметаната гидрохлорид, I + формотион, I +
 20 формпаранат, I + гамма-НСН, I + глиодин, I + галфенпрокс, I + гептенофос, I +
 гексадецилциклопропанкарбоксилат, I + гекситиазокс, I + йодметан, I + изокарбофос, I
 + изопропил-O-(метоксиаминотиофосфорил)салицилат, I + ивермектин, I + жасмолин I,
 I + жасмолин II, I + иодофенфос, I + линдан, I + люфенурон, I + малатион, I +
 маленобен, I + мекарбам, I + мефосфолан, I + месульфен, I + метакрифос, I +
 25 метамидофос, I + метидатион, I + метиокарб, I + метомил, I + метилбромид, I +
 метолкарб, I + мевинфос, I + мексакарбат, I + милбемектин, I + милбемицина оксим, I +
 мипафокс, I + монокротофос, I + морфотион, I + моксидектин, I + налед, I + NC-184, I +
 NC-512, I + нифлуридид, I + никкомицины, I + нитрилакарб, I + комплекс нитрилакарба
 и хлорида цинка 1:1, I + NNI-0101, I + NNI-0250, I + ометоат, I + оксамил, I +
 30 оксидепрофос, I + оксидисульфотон, I + pp'-DDT, I + паратион, I + перметрин, I +
 нефтяные масла, I + фенкаптон, I + фентоат, I + форат, I + фозалон, I + фосфолан, I +
 фосмет, I + фосфамидон, I + фоксим, I + пиримифос-метил, I + полихлортерпены, I +
 полинактины, I + проклонол, I + профенофос, I + промацил, I + пропаргит, I +
 пропетамфос, I + пропоксур, I + протидатион, I + протоат, I + пиретрин I, I + пиретрин

II, I + пиретрины, I + пиридабен, I + пиридафентион, I + пиримидифен, I + пиримитат, I + квиналфос, I + квинтиофос, I + R-1492, I + RA-17, I + ротенон, I + шрадан, I + себуфос, I + селамектин, I + SI-0009, I + софамид, I + спиродиклофен, I + спиромезифен, I + SSI-121, I + сульфирам, I + сульфлурамид, I + сульфотеп, I + сера, I + SZI-121, I + тау-флювалинат, I + тебуфенпирад, I + ТЕПП, I + тербам, I + тетрачлорвинфос, I + тетрадифон, I + тетранактин, I + тетрасул, I + тиафенокс, I + тиокарбоксим, I + тиофанокс, I + тиометон, I + тиоквинокс, I + турингиенсин, I + триамифос, I + триаратен, I + триазофос, I + триазурон, I + трихлорфон, I + трифенофос, I + тринактин, I + ванидотион, I + ванилипрол и I + YI-5302.

10 Композиции, содержащие антигельминтик, включают I + абамектин, I + круфомат, I + дорамектин, I + эмаектин, I + эмаектина бензоат, I + эприномектин, I + ивермектин, I + милбемицина оксим, I + моксидектин, I + пиперазин, I + селамектин, I + спиносад и I + тиофанат.

15 Композиции, содержащие авицид, включают I + хлоралоз, I + эндрин, I + фентион, I + пиридин-4-амин и I + стрихнин.

Композиции, содержащие средство биологического контроля, включают I + *Adoxophyes orana* GV, I + *Agrobacterium radiobacter*, I + *Amblyseius* spp., I + *Anagrapha falcifera* NPV, I + *Anagrus atomus*, I + *Aphelinus abdominalis*, I + *Aphidius colemani*, I + *Aphidoletes aphidimyza*, I + *Autographa californica* NPV, I + *Bacillus firmus*, I + *Bacillus sphaericus* Neide, I + *Bacillus thuringiensis* Berliner, I + *Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*, I + *Bacillus thuringiensis* subsp. *israelensis*, I + *Bacillus thuringiensis* subsp. *japonensis*, I + *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*, I + *Bacillus thuringiensis* subsp. *tenebrionis*, I + *Beauveria bassiana*, I + *Beauveria brongniartii*, I + *Chrysoperla carnea*, I + *Cryptolaemus montrouzieri*, I + *Cydia pomonella* GV, I + *Dacnusa sibirica*, I + *Diglyphus isaea*, I + *Encarsia formosa*, I + *Eretmocerus eremicus*, I + *Helicoverpa zea* NPV, I + *Heterorhabditis bacteriophora* и *H. megidis*, I + *Hippodamia convergens*, I + *Leptomastix dactylopii*, I + *Macrolophus caliginosus*, I + *Mamestra brassicae* NPV, I + *Metaphycus helvolus*, I + *Metarhizium anisopliae* var. *acridum*, I + *Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae*, I + *Neodiprion sertifer* NPV и *N. lecontei* NPV, I + *Orius* spp., I + *Paecilomyces fumosoroseus*, I + *Phytoseiulus persimilis*, I + *Spodoptera exigua* мультикапсидный вирус ядерного полиэдроза, I + *Steinernema bibionis*, I + *Steinernema carpocapsae*, I + *Steinernema feltiae*, I + *Steinernema glaseri*, I + *Steinernema riobrave*, I + *Steinernema riobravise*, I + *Steinernema scapterisci*, I + *Steinernema* spp., I + *Trichogramma* spp., I + *Typhlodromus occidentalis* и I + *Verticillium lecanii*.

Композиции, содержащие стерилизатор почвы, включают I + йодметан и метилбромид.

5 Композиции, содержащие хемотрисстерилизатор, включают I + афолат, I + бисазир, I + бусульфам, I + дифлурбензурон, I + диматиф, I + хемел, I + хемпу, I + метепу, I + метиотепу, I + метилафолат, I + морзид, I + пенфлурон, I + тепу, I + тиохемпу, I + тиотепу, I + третамина и I + уредепу.

10 Композиции, содержащие феромон насекомых, включают I + (E)-дец-5-ен-1-илацетат с (E)-дец-5-ен-1-олом, I + (E)-тридец-4-ен-1-илацетат, I + (E)-6-метилгепт-2-ен-4-ол, I + (E,Z)-тетрадека-4,10-диен-1-илацетат, I + (Z)-додец-7-ен-1-илацетат, I + (Z)-гексадец-11-еналь, I + (Z)-гексадец-11-ен-1-илацетат, I + (Z)-гексадец-13-ен-11-ин-1-илацетат, I + (Z)-икоз-13-ен-10-он, I + (Z)-тетрадец-7-ен-1-аль, I + (Z)-тетрадец-9-ен-1-ол, I + (Z)-тетрадец-9-ен-1-илацетат, I + (7E,9Z)-додека-7,9-диен-1-илацетат, I + (9Z,11E)-тетрадека-9,11-диен-1-илацетат, I + (9Z,12E)-тетрадека-9,12-диен-1-илацетат, I + 14-метилоктадец-1-ен, I + 4-метилнонан-5-ол с 4-метилнонан-5-оном, I + альфа-мултистриатин, I + бревикомин, I + кодлелур, I + кодлемон, I + куелур, I + диспарлур, I + додец-8-ен-1-илацетат, I + додец-9-ен-1-илацетат, I + додеку-8, I + 10-диен-1-илацетат, I + доминикалур, I + этил-4-метилоктаноат, I + эвгенол, I + фронталин, I + госсиплур, I + грандлур, I + грандлур I, I + грандлур II, I + грандлур III, I + грандлур IV, I + гексалур, I + ипсдиенол, I + ипсенол, I + японилур, I + линеатин, I + литлур, I + луплур, I + медлур, I + мегатомоевую кислоту, I + метилэвгенол, I + мускалур, I + октадека-2,13-диен-1-илацетат, I + октадека-3,13-диен-1-илацетат, I + орфралур, I + орикталур, I + остромон, I + сиглур, I + сордидин, I + сулкатол, I + тетрадец-11-ен-1-илацетат, I + тримедлур, I + тримедлур A, I + тримедлур B₁, I + тримедлур B₂, I + тримедлур C и I + транк-колу.

25 Композиции, содержащие средство для отпугивания насекомых, включают I + 2-(октилтио)этанол, I + бутопириноксил, I + бутокси(полипропиленгликоль), I + дибутиладипат, I + дибутилфталат, I + дибутилсукцинат, I + диэтилтолуамид, I + диметилкарбат, I + диметилфталат, I + этилгександиол, I + гексамид, I + метоквинбутил, I + метилнеодеканамид, I + оксамат и I + пикаридин.

30 Композиции, содержащие инсектицид, включают I + 1-дихлор-1-нитроэтан, I + 1,1-дихлор-2,2-бис(4-этилфенил)этан, I +, I + 1,2-дихлорпропан, I + 1,2-дихлорпропан с 1,3-дихлорпропеном, I + 1-бром-2-хлорэтан, I + 2,2,2-трихлор-1-(3,4-дихлорфенил)этилацетат, I + 2,2-дихлорвинил-2-этилсульфинилэтилметилфосфат, I + 2-(1,3-дителилан-2-ил)фенилдиметилкарбамат, I + 2-(2-бутоксиэтокси)этилтиоцианат, I +

2-(4,5-диметил-1,3-диоксолан-2-ил)фенилметилкарбамат, I + 2-(4-хлор-3,5-
 ксиллокси)этанол, I + 2-хлорвинилдиэтилфосфат, I + 2-имидазолон, I + 2-
 изовалерилндан-1,3-дион, I + 2-метил(проп-2-инил)аминофенилметилкарбамат, I + 2-
 тиоцианатоэтиллаурат, I + 3-бром-1-хлорпроп-1-ен, I + 3-метил-1-фенилпиразол-5-
 5 илдиметилкарбамат, I + 4-метил(проп-2-инил)амино-3,5-ксиллилметилкарбамат, I + 5,5-
 диметил-3-оксоциклогекс-1-енилдиметилкарбамат, I + абамектин, I + ацефат, I +
 ацетамиприд, I + ацетион, I + ацетопрол, I + акринатрин, I + акрилонитрил, I +
 аланикарб, I + альдикарб, I + альдоксикарб, I + альдрин, I + аллетрин, I + аллозамидин,
 I + алликсикарб, I + альфа-циперметрин, I + альфа-экдизон, I + фосфид алюминия, I +
 10 амидитион, I + амидотиоат, I + аминокарб, I + амитон, I + амитона гидрооксалат, I +
 амитраз, I + анабазин, I + атидатион, I + AVI 382, I + AZ 60541, I + азадирахтин, I +
 азаметифос, I + азинфос-этил, I + азинфос-метил, I + азотоат, I + дельта-эндотоксины
Bacillus thuringiensis, I + гексафторсиликат бария, I + полисульфид бария, I + бартрин, I
 + Bayer 22/190, I + Bayer 22408, I + бендиокарб, I + бенфуракарб, I + бенсултап, I +
 15 бета-цифлутрин, I + бета-циперметрин, I + бифентрин, I + биоаллетрин, I + изомер
 биоаллетрин-S-циклопентенила, I + биоэтанометрин, I + биоперметрин, I +
 биоресметрин, I + простой бис(2-хлорэтиловый)эфир, I + бистрифлурон, I + буру, I +
 брофенвалерат, I + бромфенвинфос, I + бромоциклен, I + бром-DDT, I + бромофос, I +
 бромофос-этил, I + буфенкарб, I + бупрофезин, I + бутаккарб, I + бутатиофос, I +
 20 бутоксикарбоксим, I + бутонат, I + бутоксикарбоксим, I + бутилпиридабен, I + кадусафос, I
 + арсенат кальция, I + цианид кальция, I + полисульфид кальция, I + камфехлор, I +
 карбанолат, I + карбарил, I + карбофуран, I + сероуглерод, I + четыреххлористый
 углерод, I + карбофенотион, I + карбосульфан, I + картап, I + картапа гидрохлорид, I +
 цевадин, I + хлорбициклен, I + хлордан, I + хлордекон, I + хлордимеформ, I +
 25 хлордимеформа гидрохлорид, I + хлорэтоксифос, I + хлорфенапир, I + хлорфенвинфос,
 I + хлорфлуазурон, I + хлормефос, I + хлороформ, I + хлорпикрин, I + хлорфоксим, I +
 хлорпразофос, I + хлорпирифос, I + хлорпирифос-метил, I + хлортиофос, I +
 хромафенозид, I + цинерин I, I + цинерин II, I + цинерины, I + цис-ресметрин, I +
 цисметрин, I + клоцитрин, I + клоэтокарб, I + клозантел, I + клотианидин, I +
 30 ацетоарсенит меди, I + арсенат меди, I + олеат меди, I + кумафос, I + кумитоат, I +
 кротамитон, I + кротоксифос, I + круфомат, I + криолит, I + CS 708, I + цианофенфос, I
 + цианофос, I + циантоат, I + циклетрин, I + циклопротрин, I + цифлутрин, I +
 цигалотрин, I + циперметрин, I + цифенотрин, I + циромазин, I + цитиоат, I + d-
 лимонен, I + d-тетраметрин, I + DAEP, I + дазомет, I + DDT, I + декарбофуран, I +

дельтаметрин, I + демефион, I + демефион-О, I + демефион-S, I + деметон, I + деметон-метил, I + деметон-О, I + деметон-О-метил, I + деметон-S, I + деметон-S-метил, I + деметон-S-метилсульфон, I + диафентиурон, I + диалифос, I + диамидафос, I + диазинон, I + дикаптон, I + дихлофентион, I + дихлорвос, I + диклифос, I + дикрезил, I + дикротофос, I + дицикланил, I + диелдрин, I + диэтил-5-метилпиразол-3-илфосфат, I + дифлубензурон, I + дилор, I + димефлутрин, I + димефокс, I + диметан, I + диметоат, I + диметрин, I + диметилвинфос, I + диметилан, I + динекс, I + динекс-диклексин, I + динопроп, I + диносам, I + диносеб, I + динотефуран, I + диофенолан, I + диоксабензофос, I + диоксакарб, I + диоксатион, I + дисульфотон, I + дитикрофос, I + DNOC, I + дорамектин, I + DSP, I + экдистерон, I + EI 1642, I + эмаектин, I + эмаектина бензоат, I + ЕМРС, I + эмпентрин, I + эндосульфан, I + эндотион, I + эндрин, I + ЕРВР, I + EPN, I + эпофенонан, I + эприномектин, I + эсфенвалерат, I + этафос, I + этиофенкарб, I + этион, I + этипрол, I + этоат-метил, I + этопрофос, I + этилформиат, I + этил-DDD, I + этилендибромид, I + этилендихлорид, I + оксид этилена, I + этофенпрокс, I + этримфос, I + EXD, I + фамфур, I + фенамифос, I + феназафлор, I + фенхлорфос, I + фенетакарб, I + фенфлутрин, I + фенитротрион, I + фенобукарб, I + феноксакрим, I + феноксикарб, I + фенпиритрин, I + фенпропатрин, I + фенпирад, I + фенсульфотион, I + фентион, I + фентион-этил, I + фенвалерат, I + фипронил, I + флоникамид, I + флубендиамид, I + флукофурун, I + флуциклоксурон, I + флуцитринат, I + флуенетил, I + флуфенерим, I + флуфеноксурон, I + флуфенпрокс, I + флуметрин, I + флювалинат, I + FMC 1137, I + фонофос, I + форметанат, I + форметаната гидрохлорид, I + формотион, I + формпаранат, I + фосметилан, I + фоспират, I + фостиазат, I + фостиэтан, I + фуратиокарб, I + фуретрин, I + гамма-цигалотрин, I + гамма-НСН, I + гуазатин, I + ацетаты гуазатина, I + GY-81, I + галфенпрокс, I + галофенозид, I + НСН, I + НЕОД, I + гептахлор, I + гептенофос, I + гетерофос, I + гексафлумурун, I + ННДН, I + гидраметилнон, I + цианистый водород, I + гидропреп, I + хиквинкарб, I + имидаклоприд, I + имипротрин, I + индоксакарб, I + йодметан, I + IPSP, I + исазофос, I + изобензан, I + изокарбофос, I + изодрин, I + изофенфос, I + изолан, I + изопрокарб, I + изопропил-О-(метоксиаминотиофосфорил)салицилат, I + изопротиолан, I + изотиоат, I + изоксатион, I + ивермектин, I + жасмолин I, I + жасмолин II, I + иодофенфос, I + ювенильный гормон I, I + ювенильный гормон II, I + ювенильный гормон III, I + келеван, I + кинопреп, I + лямбда-цигалотрин, I + арсенат свинца, I + лепимектин, I + лептофос, I + линдан, I + лиримфос, I + люфенурун, I + литидатион, I + м-куменилметилкарбамат, I +

фосфид магния, I + малатион, I + малонобен, I + мазидокс, I + мекарбам, I + мекарфон, I
 + меназон, I + мефосфолан, I + хлористая ртуть, I + месульфенфос, I + метафлумизон, I
 + метам, I + метам-калий, I + метам-натрий, I + метакрифос, I + метамидофос, I +
 5 метансульфонилфторид, I + метидатион, I + метиокарб, I + метокротофос, I + метомил,
 I + метопрен, I + метоквин-бутил, I + метотрин, I + метоксихлор, I + метоксифенозид, I
 + метилбромид, I + метилизотиоцианат, I + метилхлороформ, I + метиленхлорид, I +
 метофлутрин, I + метолкарб, I + метоксадиазон, I + мевинфос, I + мексакарбат, I +
 милбемектин, I + милбемицина оксим, I + мипафокс, I + мирекс, I + монокротофос, I +
 морфотион, I + моксидектин, I + нафталофос, I + налед, I + нафталин, I + NC-170, I +
 10 NC-184, I + никотин, I + сульфат никотина, I + нифлуридид, I + нитенпирам, I +
 нитиазин, I + нитрилакарб, I + комплекс нитрилакарба и хлорида цинка 1:1, I + NNI-
 0101, I + NNI-0250, I + норникотин, I + новалурон, I + новифлумурон, I + *O*-5-дихлор-4-
 йодфенил-*O*-этилэтилфосфонотиоат, I + *O,O*-диэтил-*O*-4-метил-2-оксо-2*H*-хромен-7-
 илфосфотиоат, I + *O,O*-диэтил-*O*-6-метил-2-пропилпиримидин-4-илфосфотиоат, I +
 15 *O,O,O',O'*-тетрапропилдитиопирофосфат, I + олеиновую кислоту, I + ометоат, I +
 оксамил, I + оксидеметон-метил, I + оксидепрофос, I + оксидисульфотон, I + pp'-DDT, I
 + пара-дихлорбензол, I + паратион, I + паратион-метил, I + пенфлурон, I +
 пентахлорфенол, I + пентахлорфениллаурат, I + перметрин, I + нефтяные масла, I + PH
 60-38, I + фенкаптон, I + фенотрин, I + фентоат, I + форат + ТХ, I + фозалон, I +
 20 фосфолан, I + фосмет, I + фоснихлор, I + фосфамидон, I + фосфин, I + фоксим, I +
 фоксим-метил, I + пириметафос, I + пиримикарб, I + пиримифос-этил, I + пиримифос-
 метил, I + полихлордициклопентадиеновые изомеры, I + полихлортерпены, I + арсенит
 калия, I + тиоцианат калия, I + праллетрин, I + прекоцен I, I + прекоцен II, I + прекоцен
 III, I + примидофос, I + профенофос, I + профлутрин, I + промацил, I + промекарб, I +
 25 пропафос, I + пропетамфос, I + пропоксур, I + протидатион, I + протиофос, I + протоат,
 I + протрифенбут, I + пиметрозин, I + пираклофос, I + пиразофос, I + пиресметрин, I +
 пиретрин I, I + пиретрин II, I + пиретрины, I + пиридабен, I + пиридалил, I +
 пиридафентион, I + пиримидифен, I + пиримитат, I + пирипроксифен, I + квассию, I +
 квиналфос, I + квиналфос-метил, I + квинотион, I + квинтиофос, I + R-1492, I +
 30 рафоксанид, I + ресметрин, I + ротенон, I + RU 15525, I + RU 25475, I + рианию, I +
 рианодин, I + сабадиллу, I + шрадан, I + себуфос, I + селамектин, I + SI-0009, I + SI-
 0205, I + SI-0404, I + SI-0405, I + силафлуофен, I + SN 72129, I + арсенит натрия, I +
 цианистый натрий, I + фторид натрия, I + гексафторсиликат натрия, I +
 пентахлорфеноксид натрия, I + селенат натрия, I + натрий роданистый, I + софамид, I +

спиносад, I + спиромезифен, I + спиротетрамат, I + сулкофулон, I + сулкофулон-натрий, I + сульфлурамид, I + сульфотеп, I + серный фторид, I + сульпрофос, I + дегтярные масла, I + тау-флювалинат, I + тазимкарб, I + TDE, I + тебуфенозид, I + тебуфенпирад, I + тебупиримфос, I + тефлубензурон, I + тефлутрин, I + темефос, I + ТЕРР, I + тераллетрин, I + тербам, I + тербуфос, I + тетрахлорэтан, I + тетрахлорвинфос, I + тетраметрин, I + тета-циперметрин, I + тиаклоприд, I + тиафенокс, I + тиаметоксам, I + тикрофос, I + тиокарбоксим, I + тиоциклам, I + тиоциклама гидрооксалат, I + тиодикарб, I + тиофанокс, I + тиометон, I + тионазин, I + тиосултап, I + тиосултап-натрий, I + турингиенсин, I + толфенпирад, I + тралометрин, I + трансфлутрин, I + трансперметрин, I + триамифос, I + триазамат, I + триазофос, I + триазурон, I + трихлорфон, I + трихлорметафос-3, I + трихлоронат, I + трифенофос, I + трифлумурон, I + триметакарб, I + трипреп, I + ванидотион, I + ванилипрол, I + вератридин, I + вератрин, I + ХМС, I + ксиллкарб, I + YI-5302, I + зета-циперметрин, I + зетаметрин, I + фосфид цинка, I + золапрофос и ZXI 8901, I + циантранилипрол, I + хлорантранилипрол, I + циенопирафен, I + цифлуметофен, I + пирифлуквиназон, I + спинеторам, I + спиротетрамат, I + сульфоксафлор, I + флуфипрол, I + меперфлутрин, I + тетраметилфлутрин, I + трифлумезопирим.

Композиции, содержащие моллюскоцид, включают I + бис(трибутилолова) оксид, I + бромацетамид, I + арсенат кальция, I + клоэтокарб, I + ацетоарсенит меди, I + сульфат меди, I + фентин, I + фосфат железа, I + метальдегид, I + метиокарб, I + никлосамид, I + никлосамид-оламин, I + пентахлорфенол, I + пентахлорфеноксид натрия, I + тазимкарб, I + тиодикарб, I + трибутилолова оксид, I + трифенморф, I + триметакарб, I + ацетат трифенилолова и гидроксид трифенилолова, I + пирипрол.

Композиции, содержащие нематоцид, включают I + АКД-3088, I + 1,2-дибром-3-хлорпропан, I + 1,2-дихлорпропан, I + 1,2-дихлорпропан с 1,3-дихлорпропеном, I + 1,3-дихлорпропен, I + 3,4-дихлортетрагидротиофен-1,1-диоксид, I + 3-(4-хлорфенил)-5-метилроданин, I + 5-метил-6-тиоксо-1,3,5-тиадиазинан-3-илуксусную кислоту, I + 6-изопентениламинопурин, I + абамектин, I + ацетопрол, I + аланикарб, I + альдикарб, I + альдоксикарб, I + AZ 60541, I + бенклотиаз, I + беномил, I + бутилпиридабен, I + кадусафос, I + карбофуран, I + сероуглерод, I + карбосульфат, I + хлорпикрин, I + хлорпирифос, I + клоэтокарб, I + цитокинины, I + дазомет, I + ДВСР, I + ДСР, I + диамидафос, I + дихлофентион, I + диклифос, I + диметоат, I + дорамектин, I + эмаектин, I + эмаектина бензоат, I + эприномектин, I + этопрофос, I + этилендибромид, I + фенамифос, I + фенпирад, I + фенсульфотион, I + фостиазат, I +

фостизтан, I + фурфурол, I + GY-81, I + гетерофос, I + йодметан, I + изамидофос, I + исазофос, I + ивермектин, I + кинетин, I + мекарфон, I + метам, I + метам-калий, I + метам-натрий, I + метилбромид, I + метилизотиоцианат, I + милбемицина оксим, I + оксамил, I + фонат, I + фосфамидон, I + фосфокарб, I + себуфос, I + селамектин, I + спиносид, I + тербам, I + тербуфос, I + тетрахлортиофен, I + тиафенокс, I + тионазин, I + триазофос, I + триазурон, I + ксиленолы, I + YI-5302 и зеатин, I + флуенсульфон.

Композиции, содержащие синергист, включают I + 2-(2-бутоксизтокси)этилпиперонилат, I + 5-(1,3-бензодиоксол-5-ил)-3-гексилциклогекс-2-енон, I + фарнезол с неролидом, I + MB-599, I + MGK 264, I + пиперонилбутоксид, I + пипротал, I + изомер пропила, I + S421, I + сезамекс, I + сезасмолин и I + сульфоксид.

Композиции, содержащие средство для отпугивания животных, включают I + антрахинон, I + хлоралозу, I + нафтенат меди, I + оксихлорид меди, I + диазинон, I + дициклопентадиен, I + гуазатин, I + ацетаты гуазатина, I + метиокарб, I + пиридин-4-амин, I + тирам, I + триметакарб, I + нафтенат цинка и I + цирам.

Дополнительные композиции включают I + брофлутринат, I + циклоксаприд, I + дифловидазин, I + флометоквин, I + флугексафон, I + гуадипир, I + вирус гранулеза *Plutella xylostella*, I + вирус гранулеза *Cydia pomonella*, I + харпин, I + имициафос, I + вирус ядерного полиэдрога *Heliothis virescens*, I + вирус ядерного полиэдрога *Heliothis punctigera*, I + вирус ядерного полиэдрога *Helicoverpa armigera*, I + вирус ядерного полиэдрога *Helicoverpa zea*, I + вирус ядерного полиэдрога *Spodoptera frugiperda*, I + вирус ядерного полиэдрога *Plutella xylostella*, I + *Pasteuria nishizawae*, I + п-цимол, I + пифлубумид, I + пирафлупрол, I + пиретрум, I + QRD 420, I + QRD 452, I + QRD 460, I + смеси терпеноидов, I + терпеноиды, I + тетранилипрол и I + α -терпинен.

Композиция также включает смеси полиморфа или полиморфов по настоящему изобретению и активного вещества, указанного с помощью кода, такие как I + код AE 1887196 (BSC-BX60309), I + код NNI-0745 GR, I + код IKI-3106, I + код JT-L001, I + код ZNQ-08056, I + код IPPA152201, I + код HNPC-A9908 (CAS: [660411-21-2]), I + код HNPC-A2005 (CAS: [860028-12-2]), I + код JS118, I + код ZJ0967, I + код ZJ2242, I + код JS7119 (CAS: [929545-74-4]), I + код SN-1172, I + код HNPC-A9835, I + код HNPC-A9955, I + код HNPC-A3061, I + код Chuanhua 89-1, I + код IPP-10, I + код ZJ3265, I + код JS9117, I + код SYP-9080, I + код ZJ3757, I + код ZJ4042, I + код ZJ4014, I + код ITM-121, I + код DPX-RAB55 (DKI-2301), I + код Me5382, I + код NC-515, I + код NA-

89, I + код MIE-1209, I + код MCI-8007, I + код BCS-CL73507, I + код S-1871, I + код DPX-RDS63 и I + код AKD-1193.

5 Хотя композиции, содержащие полиморф или полиморфы по настоящему изобретению и другой инсектицид и т. д., в явной форме раскрыты выше, специалист поймет, что настоящее изобретение распространяется на трехкомпонентную смесь, а также на множество комбинаций, содержащих вышеуказанные двухкомпонентные смеси.

10 Весовое соотношение полиморфа или полиморфов по настоящему изобретению и другого инсектицида, как правило, составляет от 1000:1 до 1:100, более предпочтительно от 500:1 до 1:100, например, от 250:1 до 1:66, от 125:1 до 1:33, от 100:1 до 1:25, от 66:1 до 1:10, от 33:1 до 1:5 и от 8:1 до 1:3.

15 Полиморфы по настоящему изобретению также применимы в сфере ветеринарии, например, их можно применять против вредителей, представляющих собой паразитических беспозвоночных, более предпочтительно против вредителей, представляющих собой паразитических беспозвоночных, в организме животного или на нем. Примеры вредителей включают нематод, трематод, цестод, мух, клещей, иксодовых клещей, вшей, блох, клопов и личинок. Животное может представлять собой животное, отличное от человека, например, животное, связанное с сельским хозяйством, например, корову, свинью, овцу, козу, лошадь или осла, или домашнее животное, например собаку, или кошку.

20 В дополнительном аспекте настоящее изобретение предусматривает полиморф по настоящему изобретению для применения в способе терапевтического лечения.

25 В дополнительном аспекте настоящее изобретение относится к способу контроля вредителей, представляющих собой паразитических беспозвоночных, в организме животного или на нем, включающему введение пестицидно эффективного количества полиморфа по настоящему изобретению. Введение может представлять собой, например, пероральное введение, парентеральное введение или наружное введение, например, нанесение на поверхность тела животного. В дополнительном аспекте настоящее изобретение относится к полиморфу по настоящему изобретению для контроля вредителей, представляющих собой паразитических беспозвоночных, в организме животного или на нем. В дополнительном аспекте настоящее изобретение относится к применению полиморфа по настоящему изобретению в изготовлении лекарственного препарата, предназначенного для контроля вредителей,

представляющих собой паразитических беспозвоночных, в организме животного или на нем.

В дополнительном аспекте настоящее изобретение относится к способу контроля вредителей, представляющих собой паразитических беспозвоночных, включающему введение пестицидно эффективного количества полиморфа по настоящему изобретению в окружающую среду, в которой животное обитает.

В дополнительном аспекте настоящее изобретение относится к способу защиты животного от вредителя, представляющего собой паразитическое беспозвоночное, включающему введение животному пестицидно эффективного количества полиморфа по настоящему изобретению. В дополнительном аспекте настоящее изобретение относится к полиморфу по настоящему изобретению, предназначенному для применения в защите животного от вредителя, представляющего собой паразитическое беспозвоночное. В дополнительном аспекте настоящее изобретение относится к применению полиморфа по настоящему изобретению в изготовлении лекарственного препарата для защиты животного от вредителя, представляющего собой паразитическое беспозвоночное.

В дополнительном аспекте настоящее изобретение предусматривает способ лечения животного, страдающего от вредителя, представляющего собой паразитическое беспозвоночное, включающий введение животному пестицидно эффективного количества полиморфа по настоящему изобретению. В дополнительном аспекте настоящее изобретение относится к полиморфу по настоящему изобретению, предназначенному для применения в лечении животного, страдающего от вредителя, представляющего собой паразитическое беспозвоночное. В дополнительном аспекте настоящее изобретение относится к применению полиморфа по настоящему изобретению в изготовлении лекарственного препарата, предназначенного для лечения животного, страдающего от вредителя, представляющего собой паразитическое беспозвоночное.

В дополнительном аспекте настоящее изобретение предусматривает фармацевтическую композицию, содержащую полиморф по настоящему изобретению и фармацевтически приемлемое вспомогательное вещество.

Полиморф по настоящему изобретению можно применять отдельно или в комбинации с одним или несколькими другими биологически активными ингредиентами.

В одном аспекте настоящее изобретение предусматривает комбинированный продукт, содержащий пестицидно эффективное количество компонента А и пестицидно эффективное количество компонента В, где компонент А представляет собой полиморф по настоящему изобретению, а компонент В представляет собой соединение, описанное ниже.

Полиморф по настоящему изобретению можно применять в комбинации с антигельминтными средствами. Такие антигельминтные средства включают соединения, выбранные из класса соединений макроциклических лактонов, таких как производные ивермектина, авермектина, абамектина, эмамектинина, эприномектина, дорамектина, селамектина, моксидектина, немадектина и милбемицина, описанные в EP-357460, EP-444964 и EP-594291. Дополнительные антигельминтные средства включают полусинтетические и биосинтетические производные авермектина/милбемицина, такие как описаны в US-5015630, WO-9415944 и WO-9522552. Дополнительные антигельминтные средства включают бензимидазолы, такие как албендазол, камбендазол, фенбендазол, флубендазол, мебендазол, оксфендазол, оксibenдазол, парбендазол и другие представители класса. Дополнительные антигельминтные средства включают имидазотиазолы и тетрагидропиримидины, такие как тетраметизол, левамизол, пирантела памоат, оксантел или морантел. Дополнительные антигельминтные средства включают флукициды, такие как триклабендазол и клорсулон, а также цестоциды, такие как празиквантел и эспипрантел.

Полиморфы по настоящему изобретению можно применять в комбинации с производными и аналогами класса антигельминтных средств на основе парагерквотида/маркфортина, а также с противопаразитарными оксазолинами, такими как раскрыты в US-5478855, US- 4639771 и DE-19520936.

Полиморфы по настоящему изобретению можно применять в комбинации с производными и аналогами общего класса диоксоморфолиновых противопаразитарных средств, описанными в WO-9615121, а также с антигельминтными активными циклическими депсипептидами, такими как описаны в WO-9611945, WO-9319053, WO-9325543, EP-626375, EP-382173, WO-9419334, EP-382173 и EP-503538.

Полиморфы по настоящему изобретению можно применять в комбинации с другими эктопаразитамицидами; например, фипронилом; пиретроидами; фосфорорганическими соединениями; регуляторами роста насекомых, такими как люфенурон; агонистами экдизона, такими как тебуфенозид и т. п.; неоникотиноидами, такими как имидаклоприд и т. п.

Полиморфы по настоящему изобретению можно применять в комбинации с терпеновыми алкалоидами, например, описанными в публикациях международных заявок на патент №№ WO 95/19363 или WO 04/72086, в частности, соединениями, раскрытыми в данных документах.

5 Другие примеры таких биологически активных соединений, в комбинации с которыми можно применять полиморфы по настоящему изобретению, включают без ограничения следующие.

Фосфорорганические соединения: ацефат, азаметифос, азинфос-этил, азинфос-метил, бромфос, бромфос-этил, кадусафос, хлорэтоксифос, хлорпирифос, 10 хлорфенвинфос, хлормефос, деметон, деметон-S-метил, деметон-S-метилсульфон, диалифос, диазион, дихлорвос, дикротофос, диметоат, дисульфотон, этион, этопрофос, этримфос, фамфур, фенамифос, фенитротиион, фенсульфотион, фентион, флупиразофос, фонофос, формотион, фостиазат, гептенофос, исазофос, изотиоат, изоксатион, малатион, метакрифос, метамидофос, метидатион, метил-паратион, 15 мевинфос, монокротофос, налед, ометоат, оксидеметон-метил, параоксон, паратион, паратион-метил, фентоат, фозалон, фосфолан, фосфокарб, фосмет, фосфамидон, фортат, фоксим, пиримифос, пиримифос-метил, профенофос, пропафос, проэтамфос, протиофос, пираклофос, пиридапентион, квиналфос, сульпрофос, темефос, тербуфос, тебупиримфос, тетрахлорвинфос, тиметон, тиазофос, трихлорфон, ванидотион.

20 Карбаматы: аланикарб, альдикарб, 2-втор-бутилфенилметилкарбамат, бенфуракарб, карбарил, карбофуран, карбосульфан, клоетокарб, этиофенкарб, феноксикарб, фентиокарб, фуратиокарб, HCN-801, изопрокарб, индоксакарб, метиокарб, метомил, 5-метил-м-куменилбутирил(метил)карбамат, оксамил, пиримикарб, пропоксур, тиодикарб, тиофанокс, триазамат, UC-51717.

25 Пиретроиды: акринатрин, аллетрин, альфаметрин, 5-бензил-3-фурилметил (E)-(1R)-цис-2,2-диметил-3-(2-оксотиолан-3-илиденметил)циклопропанкарбоксилат, бифентрин, бета-цифлутрин, цифлутрин, альфа-циперметрин, бета-циперметрин, биоаллетрин, биоаллетрин ((S)-циклопентилизомер), биоресметрин, бифентрин, NCI-85193, циклопротрин, цигалотрин, цититрин, цифенотрин, дельтаметрин, эмпентрин, 30 эсфенвалерат, этофенпрокс, фенфлутрин, фенпропатрин, фенвалерат, флуцитринат, флуметрин, флювалинат (D-изомер), имипротрин, цигалотрин, лямбда-цигалотрин, перметрин, фенотрин, праллетрин, пиретрины (натуральные продукты), ресметрин, тетраметрин, трансфлутрин, тета-циперметрин, силафлуофен, тау-флювалинат, тефлутрин, тралометрин, зета-циперметрин.

Регуляторы роста членистоногих: а) ингибиторы синтеза хитина: соединения бензоилмочевины: хлорфлуазурон, дифлубензурон, флуазурон, флуциклоксурон, флуфеноксурон, гексафлумурон, люфенурон, новалурон, тефлубензурон, трифлумурон, бупрофезин, диофенолан, гекситиазокс, этоксазол, хлорфентазин; б) антагонисты экдизона: галофенозид, метоксифенозид, тебуфенозид; с) ювеноиды: пирипроксифен, метопрен (включая S-метопрен), феноксикарб; d) ингибиторы биосинтеза липидов: спироциклофен.

Другие противопаразитарные средства: ацеквиноцил, амитраз, АКD-1022, ANS-118, азадирахтин, *Bacillus thuringiensis*, бенсултап, бифеназат, бинапакрил, бромпропилат, BTG-504, BTG-505, камфехлор, картап, хлорбензилат, хлордимеформ, хлорфенапир, хромафенозид, клотианидин, циромазин, диаклоден, диафентиурон, DBI-3204, динактин, дигидроксиметилдигидроксипирролидин, динобутон, динокап, эндосульфан, этипрол, этофенпрокс, феназаквин, флумит, МТИ-800, фенпироксимат, флуакрипирим, флубензимин, флуброцитринат, флуфензин, флуфенпрокс, флупроксифен, галофенпрокс, гидраметилнон, ИКИ-220, канемит, NC-196, ним гард, нидинортерфуран, нитенпирам, SD-35651, WL-108477, пиридарил, пропаргит, протрифенбут, пиметрозин, пиридабен, пиримидифен, NC-1111, R-195, RH-0345, RH-2485, RYI-210, S-1283, S-1833, SI-8601, силафлуофен, силомадин, спиносад, тебуфенпирад, тетрадифон, тетранактин, тиаклоприд, тиоциклам, тиаметоксам, толфенпирад, триазамат, триэтоксиспиносин, тринактин, вербутин, верталек, YI-5301.

Фунгициды: ацибензолар, алдиморф, ампропилфос, андоприм, азаконазол, азоксистробин, беналаксил, беномил, биалафос, бластицидин-S, бордосская смесь, бромуконазол, бупиримат, карпропамид, каптафол, каптан, карбендазим, хлорфеназол, хлоронеб, хлорпикрин, хлороталонил, хлзолинат, оксихлорид меди, соли меди, цифлуфенамид, цимоксанил, ципроконазол, ципродинил, ципрофурам, RH-7281, диклоцимет, диклобутразол, дикломезин, диклоран, дифенокконазол, RP-407213, диметоморф, домоксистробин, диниконазол, диниконазол-M, додин, эдифенфос, эпоксиконазол, фамоксадон, фенамидон, фенаримол, фенбуконазол, фенкарамид, фенпиклонил, фенпропидин, фенпропиморф, фентина ацетат, флуазинам, флудиоксонил, флуметовер, флуморф/флуморлин, фентина гидроксид, флуоксастробин, флуквинконазол, флузилазол, флутоланил, флуотриафол, фолпет, фосетил-алюминий, фуралаксил, фураметапир, гексаконазол, ипконазол, ипробенфос, ипродион, изопротиолан, касугамицин, крезоксим-метил, манкозеп, манеб, мефеноксам, мепронил, металаксил, метконазол, метоминостробин/феноминостробин,

метрафенон, миклобутанил, нео-асозин, никобифен, орисастробин, оксадиксил, пенконазол, пенцикурон, пробеназол, прохлораз, пропамокарб, пропиоконазол, проквиназид, протиоконазол, пирифенокс, пиракlostробин, пириметанил, пироквилон, квиноксифен, спироксамин, сера, тебуконазол, тетраконазол, тиабендазол, тифлузамид, тиюфанат-метил, тирам, тиадинил, триадимефон, триадименол, трициклазол, трифлорксистробин, тритиконазол, валидамицин, винклозин.

Биологические средства: *Bacillus thuringiensis* ssp. *aizawai*, *kurstaki*, дельта-эндотоксин *Bacillus thuringiensis*, бакуловирус, энтомопатогенные бактерии, вирусы и грибы.

10 Бактерициды: хлортетрациклин, окситетрациклин, стрептомицин.

Другие биологические средства: энрофлоксацин, фебантел, пенетамат, молоксикам, цефалексин, канамицин, пимобендан, кленбутерол, омепразол, тиамулин, беназеприл, пирипрол, цефквином, флорфеникол, бусерелин, цефовецин, тулатромицин, цефтиофур, карпрофен, метафлумизон, празиквантел, триклабендазол.

15 При применении в комбинации с другими активными ингредиентами полиморфы по настоящему изобретению предпочтительно применяют в комбинации с имидаклопридом, энрофлоксацином, празиквантелом, пирантела эмбонатом, фебантелом, пенетаматом, молоксикамом, цефалексином, канамицином, пимобенданом, кленбутеролом, фипронилом, ивермектином, омепразолом, тиамулином, беназеприлом, милбемицином, циромазином, тиаметоксамом, пирипролом, дельтаметрином, цефквиномом, флорфениколом, бусерелином, цефовецином, тулатромицином, цефтиофуrom, селамектином, карпрофеном, метафлумизоном, моксидектином, метопреном (включая S-метопрен), клорсулоном, пирантелом, амитразом, триклабендазолом, авермектином, абамектином, эмамектином, эприномектином, дорамектином, селамектином, немадектином, албендазолом, камбендазолом, фенбендазолом, флубендазолом, мебендазолом, оксфендазолом, оксбендазолом, парбендазолом, тетрализолом, левамизолом, пирантела памоатом, оксантелом, морантелом, триклабендазолом, эспипрантелом, фипронилом, люфенуроном, экдизоном или тебуфенозидом; более предпочтительно с
20 энрофлоксацином, празиквантелом, пирантела эмбонатом, фебантелом, пенетаматом, молоксикамом, цефалексином, канамицином, пимобенданом, кленбутеролом, омепразолом, тиамулином, беназеприлом, пирипролом, цефквиномом, флорфениколом, бусерелином, цефовецином, тулатромицином, цефтиофуrom, селамектином, карпрофеном, моксидектином, клорсулоном, пирантелом, эприномектином,
25
30

дорамектином, селамектином, немадектином, албендазолом, камбендазолом, фенбендазолом, флубендазолом, мебендазолом, оксфендазолом, оксibenдазолом, парбендазолом, тетрализолом, левамизолом, пирантела памоатом, оксантелом, морантелом, триклабендазолом, эспипрантелом, люфенуроном или экдизоном; еще
5 более предпочтительно с энрофлоксацином, празиквантелом, пирантела эмбонатом, фебантелом, пенетаматом, молоксикамом, цефалексином, канамицином, пимобенданом, кленбутеролом, омепразолом, тиамулином, беназеприлом, пирипролом, цефквиномом, флорфениколом, бусерелином, цефовецином, тулатромицином, цефтиофуrom, селамектином, карпрофеном, моксидектином, клорсулоном или
10 пирантелом.

Особенно следует отметить комбинацию, в которой дополнительный активный ингредиент характеризуется участком действия, отличающимся от такового у полиморфа по настоящему изобретению. В определенных случаях комбинация с по меньшей мере одним другим активным ингредиентом для контроля вредителя,
15 представляющего собой паразитическое беспозвоночное, характеризующимся подобным спектром контроля, но другим участком действия, будет особенно предпочтительной для управления устойчивостью. Таким образом, комбинированный продукт по настоящему изобретению может содержать пестицидно эффективное количество полиморфа по настоящему изобретению и пестицидно эффективное
20 количество по меньшей мере одного дополнительного активного ингредиента для контроля вредителя, представляющего собой паразитическое беспозвоночное, характеризующегося подобным спектром контроля, но другим участком действия.

Специалисту в данной области понятно, что поскольку в окружающей среде и при физиологических условиях соли химических соединений находятся в равновесии с
25 соответствующими им несолевыми формами, соли обладают той же биологической применимостью, что и несолевые формы.

Таким образом, для контроля беспозвоночных вредителей и паразитов животных могут быть пригодны разнообразные соли полиморфов по настоящему изобретению (и активные ингредиенты, применяемые в комбинации с активными
30 ингредиентами по настоящему изобретению). Соли включают соли присоединения кислоты с неорганическими или органическими кислотами, такими как бромистоводородная, хлористоводородная, азотная, фосфорная, серная, уксусная, масляная, фумаровая, молочная, малеиновая, малоновая, щавелевая, пропионовая, салициловая, винная, 4-толуолсульфоновая или валериановая кислоты. Полиморфы по

настоящему изобретению также включают N-оксиды. Соответственно, настоящее изобретение предусматривает комбинации полиморфов по настоящему изобретению, в том числе их N-оксидов и солей, и дополнительного активного ингредиента, в том числе его N-оксидов и солей.

5 Композиции для применения в ветеринарии также могут содержать вспомогательные вещества и добавки состава, известные специалистам в данной области как вспомогательные средства состава (некоторые из которых могут рассматриваться как также функционирующие в качестве твердых разбавителей, жидких разбавителей или поверхностно-активных веществ). С помощью таких
10 вспомогательных веществ и добавок состава можно регулировать pH (буферы), пенообразование во время обработки (противовспениватели, подобные полиорганосилоксанам), осаждение активных ингредиентов (суспандирующие средства), вязкость (тиксотропные загустители), развитие микроорганизмов в таре (противомикробные средства), замораживание продуктов (антифризы), цвет (дисперсии
15 красителей/пигментов), смывание (пленкообразователи или клейкие вещества), испарение (замедлители испарения) и другие свойства состава. Пленкообразователи включают, например, поливинилацетаты, сополимеры на основе поливинилацетата, сополимер поливинилпирролидона и винулацетата, поливиниловые спирты, сополимеры поливинилового спирта и восков. Примеры вспомогательных веществ и
20 добавок состава включают перечисленные в McCutcheon's, том 2: Functional Materials, ежегодном международном и северо-американском изданиях, публикуемых McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; и в публикации заявки согласно PCT WO 03/024222.

 Полиморфы по настоящему изобретению можно применять без других
25 вспомогательных средств, но чаще всего будет предусматриваться применение состава, содержащего один или несколько активных ингредиентов с подходящими носителями, разбавителями и поверхностно-активными веществами, и, возможно, в комбинации с питательными веществами в зависимости от предполагаемого конечного
30 использования. Один способ применения предусматривает распыление водной дисперсии или раствора на основе рафинированного масла в виде комбинированных продуктов. Композиции с распыляемыми маслами, распыляемыми масляными концентратами, распределителями-прилипателями, вспомогательными средствами, другими растворителями и синергистами, такими как пиперонилбутоксид, часто усиливают эффективность соединения. Такие спреи можно применять из контейнеров

для распыления, таких как баллон, бутылка или другой контейнер, либо с помощью насоса, либо путем высвобождения его из контейнера под давлением, например, баллона под давлением для распыления аэрозоля. Такие композиции для распыления могут принимать различные формы, например, спреев, легких туманов, пен, паров или тумана. Поэтому в зависимости от конкретного случая такие композиции для распыления могут дополнительно содержать газы-вытеснители, вспенивающие вещества и т. п. Следует отметить композицию для распыления, содержащую пестицидно эффективное количество соединения по настоящему изобретению и носитель. Согласно одному варианту осуществления такая композиция для распыления содержит пестицидно эффективное количество соединения по настоящему изобретению и газ-вытеснитель. Характерные газы-вытеснители включают без ограничений метан, этан, пропан, бутан, изобутан, бутен, пентан, изопентан, неопентан, пентен, гидрофторуглероды, хлорфторуглероды, диметиловый эфир и смеси вышеперечисленных. Следует отметить композицию для распыления (и способ применения такой композиции для распыления, распределяемой из контейнера для распыления), используемую для контроля по меньшей мере одного вредителя, представляющего собой паразитическое беспозвоночное, выбранного из группы, состоящей из комаров, мошек, настоящих мух, слепней, оводов, ос, настоящих ос, шершней, иксодовых клещей, пауков, муравьев, гнусов и т. п., в том числе отдельно или в комбинациях.

Контроль паразитов животных включает контроль наружных паразитов, которые паразитируют на поверхности тела животного-хозяина (например, на плечах, в подмышечных впадинах, на животе, внутренней части бедер), и внутренних паразитов, которые паразитируют внутри организма животного-хозяина (например, в желудке, кишечнике, легком, венах, под кожей, в лимфатической ткани). Наружные паразиты или вредители, передающие заболевания, включают, например, клещей-тромбикулидов, иксодовых клещей, вшей, комаров, мух, клещей и блох. Внутренние паразиты включают сердечных гельминтов, нематод и гельминтов. Полиморфы по настоящему изобретению могут быть особенно подходящими для борьбы с вредителями, представляющими собой наружные паразиты. Полиморфы по настоящему изобретению могут быть подходящими для системного и/или несистемного контроля заражения или инфицирования паразитами у животных.

Полиморфы по настоящему изобретению могут быть подходящими для борьбы с вредителями, представляющими собой паразитических беспозвоночных, которые

заражают субъектов-животных, включая таковых в дикой природе, домашний скот и сельскохозяйственных рабочих животных. "Домашний скот" является термином, который применяют для обозначения (в единственном числе или во множественном числе) одомашненного животного, намеренно разводимого в сельском хозяйстве для
5 получения продукции, такой как пищевой продукт или волокно, или для выполнения им работы; примеры домашнего скота включают крупный рогатый скот, овец, коз, лошадей, свиней, ослов, верблюдов, буйволов, кроликов, кур, индюков, уток и гусей (например, выращиваемых ради мяса, молока, масла, яиц, пуха, кожи, перьев и/или шерсти). За счет борьбы с паразитами сокращаются показатели смертности и снижения
10 продуктивности (в отношении мяса, молока, шерсти, шкуры, яиц и т. д.), так что применение полиморфов по настоящему изобретению позволяет осуществлять более экономичное и простое разведение животных.

Полиморфы по настоящему изобретению могут быть подходящими для борьбы с вредителями, представляющими собой паразитических беспозвоночных, которые
15 заражают домашних животных и питомцев (например, собак, кошек, комнатных птиц и аквариумных рыбок), подопытных и экспериментальных животных (например, хомяков, морских свинок, крыс и мышей), а также животных, разводимых для зоопарков, местообитаний в дикой природе и/или цирков или непосредственно в них.

В варианте осуществления настоящего изобретения животное предпочтительно
20 представляет собой позвоночное животное и более предпочтительно — млекопитающее, птицу или рыбу. В конкретном варианте осуществления субъектом-животным является млекопитающее (в том числе высшие приматы, такие как люди). Другие субъекты-млекопитающие включают приматов (например, обезьян), жвачных животных (например, крупный рогатый скот или молочных коров), свинообразных
25 (например, кабанов или свиней), овечьих (например, коз или овец), лошадиных (например, лошадей), псовых (например, собак), кошачьих (например, домашних кошек), верблюдов, оленей, ослов, буйволов, антилоп, кроликов и грызунов (например, морских свинок, белок, крыс, мышей, песчанок и хомяков). Пернатые включают Anatidae (лебедей, уток и гусей), Columbidae (например, горлиц и голубей), Phasianidae
30 (например, куропаток, тетеревов и индюков), Thesienidae (например, домашних кур), попугаеобразных (например, длиннохвостых попугаев, ара и попугаев), пернатую дичь и бескилевых (например, страусов).

Птицы, обработанные или защищенные полиморфами по настоящему изобретению, могут быть связаны либо с коммерческим, либо некоммерческим

птицеводством. Они включают Anatidae, такие как лебеди, гуси и утки, Columbidae, такие как горлицы и домашние голуби, Phasianidae, такие как куропатки, тетерева и индюки, Thesienidae, такие как домашние куры, и Psittacines, такие как длиннохвостые попугаи, ара и попугаи, разводимые для продажи в качестве питомцев или объектов коллекционирования, среди прочего.

Для целей настоящего изобретения термин "рыба" следует понимать как включающий без ограничения рыбу, которая относится к группе Teleostei, т. е. костистые рыбы. К группе Teleostei принадлежат и рыбы порядка Salmoniformes (который включает семейство Salmonidae), и рыбы порядка Perciformes (который включает семейство Centrarchidae). Примеры потенциальных рыб-реципиентов включают Salmonidae, Serranidae, Sparidae, Cichlidae и Centrarchidae, среди прочего.

Предполагается, что от способов по настоящему изобретению пользу получают также и другие животные, в том числе сумчатые (такие как кенгуру), рептилии (такие как выращиваемые на фермах черепахи) и других экономически важных домашних животных, для которых способы по настоящему изобретению являются безопасными и эффективными при лечении или предотвращении паразитарных инфекции или заражения.

Примеры вредителей, представляющих собой паразитических беспозвоночных, контролируемых введением пестицидно эффективного количества полиморфов по настоящему изобретению животному, подлежащему защите, включают эктопаразитов (членистоногих, клещей и т. д.) и эндопаразитов (гельминтов, например, нематод, трематод, цестод, скребней и т. д.).

Заболевание или группа заболеваний, в целом описанных как гельминтоз, обуславливается инфицированием животного-хозяина паразитическими червями, известными как гельминты. Подразумевается, что термин 'гельминты' включает нематод, трематод, цестод и скребней. Гельминтоз является распространенной и серьезной экономической проблемой, касающейся одомашненных животных, таких как свиньи, овцы, лошади, крупный рогатый скот, козы, собаки, кошки и птицы.

Среди гельминтов группа червей, описанных как нематоды, вызывает распространенную и порой серьезную инфекцию у различных видов животных.

Нематоды, от которых предполагается лечение с помощью полиморфов по настоящему изобретению, включают без ограничения следующие роды: *Acanthocheilonema*, *Aelurostrongylus*, *Ancylostoma*, *Angiostrongylus*, *Ascaridia*, *Ascaris*, *Brugia*, *Bunostomum*, *Capillaria*, *Chabertia*, *Cooperia*, *Crenosoma*, *Dictyocaulus*,

Diocotophyme, Dipetalonema, Diphyllbothrium, Dirofilaria, Dracunculus, Enterobius, Filaroides, Haemonchus, Heterakis, Lagochilascaris, Loa, Mansonella, Muellerius, Necator, Nematodirus, Oesophagostomum, Ostertagia, Oxyuris, Parafilaria, Parascaris, Physaloptera, Protostrongylus, Setaria, Spirocerca, Stephanofilaria, Strongyloides, Strongylus, Thelazia, Toxascaris, Toxocara, Trichinella, Trichonema, Trichostrongylus, Trichuris, Uncinaria и *Wuchereria*.

Из приведенных выше наиболее распространенными родами нематод, инфицирующих упомянутых выше животных, являются *Haemonchus, Trichostrongylus, Ostertagia, Nematodirus, Cooperia, Ascaris, Bunostomum, Oesophagostomum, Chabertia, Trichuris, Strongylus, Trichonema, Dictyocaulus, Capillaria, Heterakis, Toxocara, Ascaridia, Oxyuris, Ancylostoma, Uncinaria, Toxascaris* и *Parascaris*. Некоторые из них, такие как *Nematodirus, Cooperia* и *Oesophagostomum*, поражают прежде всего кишечный тракт, тогда как другие, такие как *Haemonchus* и *Ostertagia*, больше преобладают в желудке, а иные, такие как *Dictyocaulus*, обнаруживаются в легких. Кроме того, другие паразиты могут находиться в других тканях, таких как сердце и кровеносные сосуды, под кожей, в лимфатической ткани и т. п.

Трематоды, от которых предполагается лечение с помощью настоящего изобретения и способов по настоящему изобретению, включают без ограничения следующие роды: *Alaria, Fasciola, Nanophyetus, Opisthorchis, Paragonimus* и *Schistosoma*.

Цестоды, от которых предполагается лечение с помощью настоящего изобретения и способов по настоящему изобретению, включают без ограничения следующие роды: *Diphyllbothrium, Diplydium, Spirometra* и *Taenia*.

Наиболее распространенными родами паразитов желудочно-кишечного тракта людей являются *Ancylostoma, Necator, Ascaris, Strongyloides, Trichinella, Capillaria, Trichuris* и *Enterobius*. К другим важным с медицинской точки зрения родам паразитов, которые обнаруживаются в крови или в других тканях и органах вне желудочно-кишечного тракта, относятся черви филярии, такие как *Wuchereria, Brugia, Onchocerca* и *Loa*, а также *Dracunculus* и кишечные черви *Strongyloides* и *Trichinella* на внекишечных стадиях развития.

В данной области известны многие другие роды и виды гельминтов, от которых также предполагается лечение с помощью полиморфов по настоящему изобретению. Они подробно перечислены в Textbook of Veterinary Clinical Parasitology, Volume 1, Helminths, E. J. L. Soulsby, F. A. Davis Co., Philadelphia, Pa.; Helminths, Arthropods and

Protozoa, (6th Edition of Monnig's Veterinary Helminthology and Entomology), E. J. L. Soulsby, Williams and Wilkins Co., Baltimore, Md.

Полиморфы по настоящему изобретению могут быть эффективными против ряда эктопаразитов животных (например, членистоногих-эктопаразитов у млекопитающих и птиц).

Вредители, представляющие собой насекомых и клещей, включают, например, жалящих насекомых, таких как мухи и комары, клещи, иксодовые клещи, вши, блохи, клопы, паразитические личинки и т.п.

Взрослые мухи включают, например, жигалку коровью малую или *Haematobia irritans*, слепня или *Tabanus* spp., жигалку осеннюю или *Stomoxys calcitrans*, мошку или *Simulium* spp., оленьего слепня или *Chrysops* spp., кровососку или *Melophagus ovinus*, и муху цеце или *Glossina* spp. Паразитические личинки мух включают, например, личинки носоглоточного овода (*Oestrus ovis* и *Cuterebra* spp.), мухи мясной синей или *Phaenicia* spp., личинки мясной мухи или *Cochliomyia hominivorax*, овода бычьего или *Hypoderma* spp., червя овечьей шерсти и *Gastrophilus* лошадей. Комары включают, например, *Culex* spp., *Anopheles* spp. и *Aedes* spp.

Клещи включают *Mesostigmalphatalpha* spp., например, *Mesostigmatids*, таких как куриный клещ, *Dermalphanyssus galphallinalphae*; чесоточных клещей или конских клещей, таких как *Sarcoptidae* spp., например, *Salpharcoptes scalphabiei*; чесоточных зудней, таких как *Psoroptidae* spp., в том числе *Chorioptes bovis* и *Psoroptes ovis*; клещей-тромбикулидов, например, *Trombiculidae* spp., например, североамериканского клеща-тромбикулида, *Trombiculalpha alphalfreddugesi*.

Иксодовые клещи включают, например, мягкотелых иксодовых клещей, в том числе *Argasidae* spp., например, *Argalphas* spp. и *Ornithodoros* spp.; твердотелых иксодовых клещей, в том числе *Ixodidae* spp., например, *Rhipicephalalphalus sanguineus*, *Dermacentor variabilis*, *Dermacentor andersoni*, *Amblyomma americanum*, *Ixodes scapularis*, и других *Rhipicephalus* spp. (в том числе представителей бывшего рода *Boophilus*).

Вши включают, например, сосущих вшей, например, *Menopon* spp. и *Bovicola* spp.; пухоедов, например, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp. и *Solenopotes* spp.

Блохи включают, например, *Ctenocephalides* spp., такие как блоха собачья (*Ctenocephalides canis*) и блоха кошачья (*Ctenocephalides felis*); *Xenopsylla* spp., такие как блоха крысиная южная (*Xenopsylla cheopis*); и *Pulex* spp., такие как блоха человеческая (*Pulex irritans*).

Клопы включают, например, *Cimicidae* или, например, распространенного постельного клопа (*Cimex lectularius*); *Triatominae* spp., в том числе триатомовых клопов, также известных как поцелуйные клопы; например, *Rhodnius prolixus* и *Triatoma* spp.

5 Как правило, мухи, блохи, вши, комары, гнусы, клещи, иксодовые клещи и гельминты приводят к огромным потерям в отраслях, касающихся домашнего скота и домашних животных. Членистоногие паразиты также досаждают людям и могут переносить вызывающие заболевания организмы у людей и животных.

10 В данной области известно много других вредителей, представляющих собой паразитических беспозвоночных, от которых также предполагается лечение с помощью полиморфов по настоящему изобретению. Они подробно перечислены в *Medical and Veterinary Entomology*, D. S. Kettle, John Wiley AND Sons, New York and Toronto; *Control of Arthropod Pests of Livestock: A Review of Technology*, R. O. Drummand, J. E. George, and S. E. Kunz, CRC Press, Boca Raton, Fla.

15 Полиморфы по настоящему изобретению также могут быть эффективными против эктопаразитов, в том числе мух, таких как *Haematobia (Lyperosia) irritans* (жигалка коровья малая), *Simulium* spp. (мошка), *Glossina* spp. (муха цеце), *Hydrotaea irritans* (зубоножка), *Musca autumnalis* (муха обыкновенная полевая), *Musca domestica* (муха комнатная), *Morellia simplex* (потовая муха), *Tabanus* spp. (слепень), *Hypoderma bovis*, *Hypoderma lineatum*, *Lucilia sericata*, *Lucilia cuprina* (падальница зеленая),
20 *Calliphora* spp. (мясная муха), *Protophormia* spp., *Oestrus ovis* (носоглоточный овод), *Culicoides* spp. (мокрецы), *Hippobosca equine*, *Gastrophilus intestinalis*, *Gastrophilus haemorrhoidalis* и *Gastrophilus nasalis*; вшей, таких как *Bovicola (Damalinia) bovis*, *Bovicola equi*, *Haematopinus asini*, *Felicola subrostratus*, *Heterodoxus spiniger*, *Lignonathus setosus* и *Trichodectes canis*; рунцов, таких как *Melophagus ovinus*; и клещей, таких как
25 *Psoroptes* spp., *Sarcoptes scabiei*, *Chorioptes bovis*, *Demodex equi*, *Cheyletiella* spp., *Notoedres cati*, *Trombicula* spp. и *Otodectes cyanotis* (ушные клещи).

Обработки согласно настоящему изобретению осуществляются традиционными способами, например, путем энтерального введения в форме, например, таблеток,
30 капсул, напитков, препаратов для вливания через ротовую полость, гранул, паст, болюсов, с помощью процедур введения с кормом или введения суппозиторий; или путем парентерального введения, такого как, например, путем инъекции (включая внутримышечную, подкожную, внутривенную, интраперитонеальную) или введения имплантатов; или путем назального введения.

Если полиморфы по настоящему изобретению применяют в комбинации с дополнительным биологически активным ингредиентом, их можно вводить по отдельности, например, в виде отдельных композиций. В таком случае биологически активные ингредиенты можно вводить одновременно или последовательно. В качестве альтернативы биологически активные ингредиенты могут быть компонентами одной композиции.

Полиморфы по настоящему изобретению можно вводить в форме с контролируемым высвобождением, например, в составах с медленным высвобождением, вводимых подкожно или перорально.

Как правило, паразитицидная композиция в соответствии с настоящим изобретением содержит полиморф по настоящему изобретению, необязательно в комбинации с дополнительным биологически активным ингредиентом или его N-оксидами или солями, с одним или несколькими фармацевтически приемлемыми или приемлемыми в ветеринарии носителями, которые включают наполнители и вспомогательные вещества, выбранные с учетом предполагаемого пути введения (например, пероральное или парентеральное введение, такое как инъекция) и в соответствии со стандартной практикой. Кроме того, подходящий носитель выбирают на основании совместимости с одним или несколькими активными ингредиентами в композиции, включая такие факторы, как стабильность относительно pH и влагосодержание. Поэтому следует отметить полиморф по настоящему изобретению для защиты животного от вредителя, представляющего собой паразитическое беспозвоночное, что предусматривает паразитицидно эффективное количество полиморфа по настоящему изобретению, необязательно в комбинации с дополнительным биологически активным ингредиентом и по меньшей мере одним носителем.

Для парентерального введения, в том числе внутривенной, внутримышечной и подкожной инъекции, полиморфы по настоящему изобретению могут быть составлены в суспензию, раствор или эмульсию в масляных или водных средах-носителях и могут содержать дополнительные вещества, такие как суспендирующие, стабилизирующие и/или диспергирующие средства.

Полиморфы по настоящему изобретению можно также составлять для болюсной инъекции или непрерывной инфузии. Фармацевтические композиции для инъекции включают водные растворы водорастворимых форм активных ингредиентов (например, соль активного соединения), предпочтительно в физиологически совместимых

буферах, содержащих другие наполнители или вспомогательные вещества, которые известны из области техники, касающейся фармацевтического состава. Кроме того, суспензии активных соединений можно получать в липофильной среде-носителе. Подходящие липофильные среды-носители включают жирные масла, такие как кунжутное масло, сложные эфиры синтетических жирных кислот, такие как этилолеат и триглицериды, или такие материалы, как липосомы.

Иньекционные суспензии на водной основе могут содержать вещества, которые повышают вязкость суспензии, такие как карбоксиметилцеллюлоза натрия, сорбит или декстран. Составы для инъекции могут присутствовать в стандартной лекарственной форме, например, в ампулах или в контейнерах для многократного дозирования. В качестве альтернативы активный ингредиент может быть представлен в порошковой форме для восстановления с помощью подходящей среды-носителя, например, стерильной, апиrogenной воды, перед применением.

В дополнение к составам, описанным ранее, полиморфы по настоящему изобретению могут также быть составлены в виде депо-препарата. Такие составы пролонгированного действия можно вводить путем имплантации (например, подкожно или внутримышечно) или путем внутримышечной или подкожной инъекции.

Полиморфы по настоящему изобретению могут быть составлены для этого пути введения с подходящими полимерными или гидрофобными материалами (например, в эмульсии с фармакологически приемлемым маслом), с ионообменными смолами или как умеренно растворимое производное, такое как, без ограничения, умеренно растворимая соль.

Для введения путем ингаляции полиморфы по настоящему изобретению можно доставлять в форме распыляемого аэрозоля с использованием упаковки под давлением или небулайзера и подходящего газа-вытеснителя, например, без ограничения, дихлордифторметана, трихлорфторметана, дихлортetraфторэтана или диоксида углерода. В случае аэрозоля, находящегося под давлением, единицу дозирования можно контролировать путем обеспечения клапана для доставки отмеренного количества.

Капсулы и картриджи, например из желатина, для применения в ингаляторе или инсуффляторе могут быть составлены таким образом, чтобы они содержали порошкообразную смесь соединения и подходящей порошкообразной основы, такой как лактоза или крахмал.

Полиморфы по настоящему изобретению могут обладать удовлетворительными фармакокинетическими и фармакодинамическими свойствами, обеспечивающими системную доступность при пероральном введении и проглатывании. Следовательно, после проглатывания животным, подлежащим защите, паразитицидно эффективные концентрации полиморфа по настоящему изобретению в кровотоке могут защитить животное, подвергаемое обработке, от кровососущих вредителей, таких как блохи, иксодовые клещи и вши. Следовательно, следует отметить композицию для защиты животного от вредителя, представляющего собой паразитическое беспозвоночное, в форме для перорального введения (т. е. содержащей, в дополнение к паразитицидно эффективному количеству полиморфа по настоящему изобретению, один или несколько носителей, выбранных из связующих и наполнителей, подходящих для перорального введения, и носителей кормовых концентратов).

Для перорального введения в форме растворов (наиболее легкодоступная форма для абсорбции), эмульсий, суспензий, паст, гелей, капсул, таблеток, болусов, порошков, гранул, средств, задерживающихся в рубце, и брикетов корм/вода/лизунец полиморфы по настоящему изобретению можно составлять со связующими/заполнителями, известными из уровня техники как подходящие для композиций для перорального введения, такими как сахара и производные сахаров (например, лактоза, сахароза, маннит, сорбит), крахмал (например, маисовый крахмал, пшеничный крахмал, рисовый крахмал, картофельный крахмал), целлюлоза и ее производные (например, метилцеллюлоза, карбоксиметилцеллюлоза, этилгидроксигидроксицеллюлоза), белковые производные (например, зеин, желатин) и синтетические полимеры (например, поливиниловый спирт, поливинилпирролидон). При необходимости могут быть добавлены смазывающие вещества (например, стеарат магния), средства для улучшения распадаемости (например, сшитый поливинилпирролидинон, агар, альгиновая кислота) и красители или пигменты. Пасты и гели часто также содержат клейкие вещества (например, гуммиарабик, альгиновую кислоту, бентонит, целлюлозу, ксантановую камедь, коллоидный алюмосиликат магния) для способствования удерживанию композиции в контакте с ротовой полостью и чтобы ее было нелегко выбросить.

В одном варианте осуществления композиция по настоящему изобретению составлена в жевательный и/или съедобный продукт (например, жевательное средство для обработки или съедобную таблетку). Такой продукт в идеальном варианте должен иметь вкус, текстуру и/или аромат, предпочитаемые животным, подлежащим защите,

что облегчает таким образом пероральное введение соединений по настоящему изобретению.

Если паразитицидные композиции представлены в форме кормовых концентратов, то носитель типично выбирают из высокоэффективного корма, кормовых злаков или белковых концентратов. Такие композиции, содержащие кормовой концентрат, в дополнение к паразитицидным активным ингредиентам могут содержать добавки, способствующие улучшению состояния здоровья или стимулирующие рост животного, улучшающие качество мяса от животных для забоя или иным образом пригодные для животноводства. Эти добавки могут включать, например, витамины, антибиотики, химиотерапевтические средства, бактериостатические средства, фунгистатические средства, кокцидиостатические средства и гормоны.

Полиморф по настоящему изобретению можно составить в виде композиций для ректального применения, таких как суппозитории или удерживающие клизмы, с применением, например, традиционных основ для суппозиториев, таких как масло какао или другие глицериды.

Составы для способа по настоящему изобретению могут включать антиоксидант, такой как ВНТ (бутилированный гидрокситолуол). Антиоксидант, как правило, присутствует в количествах 0,1-5 процентов (вес/объем). Некоторые из составов нуждаются в солюбилизаторе, таком как олеиновая кислота, для растворения активного средства, особенно если включен спиносод. Распространенные средства, улучшающие распределение, используемые в таких растекающихся составах, включают изопропилмирикат, изопропилпальмитат, сложные эфиры каприловой/каприновой кислоты и насыщенных C₁₂-C₁₈-жирных спиртов, олеиновую кислоту, олеиловый сложный эфир, этилолеат, триглицериды, силиконовые масла и метиловый эфир дипропиленгликоля. Растекающиеся составы для способа по настоящему изобретению получают согласно известным методикам. Если растекающийся состав представляет собой раствор, то паразитицид/инсектицид смешивают с носителем или средой-носителем, применяя при необходимости нагревание и перемешивание. Вспомогательные или дополнительные ингредиенты можно добавлять к смеси активного средства и носителя или их можно смешивать с активным средством перед добавлением носителя. Растекающиеся составы в форме эмульсий или суспензий получают аналогично, применяя известные методики.

Для сравнительно гидрофобных фармацевтических соединений можно использовать другие системы доставки. Липосомы и эмульсии являются хорошо известными примерами сред-носителей или носителей для доставки гидрофобных лекарственных средств. Кроме того, при необходимости можно использовать органические растворители, такие как диметилсульфоксид.

Норма применения, необходимая для эффективного контроля вредителей, представляющих собой паразитических беспозвоночных (например, "пестицидно эффективное количество"), будет зависеть от таких факторов, как вид вредителя, представляющего собой паразитическое беспозвоночное, подлежащего контролю, жизненный цикл вредителя, стадия жизни, его размер, местоположение, время года, культура-хозяин или животное-хозяин, пищевое поведение, брачное поведение, влажность окружающей среды, температура и подобное. Специалист в данной области может легко определить пестицидно эффективное количество, необходимое для требуемого уровня контроля вредителей, представляющих собой паразитических беспозвоночных.

Как правило, для применения в ветеринарии полиморфы по настоящему изобретению вводят в пестицидно эффективном количестве животному, особенно гомеотермическому животному, которое подлежит защите от вредителей, представляющих собой паразитических беспозвоночных.

Пестицидно эффективное количество представляет собой количество активного ингредиента, необходимое для достижения заметного эффекта в виде уменьшения степени встречаемости или активности целевого вредителя, представляющего собой паразитическое беспозвоночное. Специалисту в данной области будет понятно, что пестицидно эффективная доза может варьироваться для различных соединений и композиций, пригодных для способа по настоящему изобретению, требуемого пестицидного эффекта и его длительности, вида целевого вредителя, представляющего собой паразитическое беспозвоночное, животного, подлежащего защите, способа применения и подобного, и при этом количество, необходимое для достижения конкретного результата, можно определить посредством проведения простого эксперимента.

Для перорального или парентерального введения животным доза композиций по настоящему изобретению, вводимая с подходящими интервалами, как правило, находится в диапазоне от приблизительно 0,01 мг/кг до приблизительно 100 мг/кг и

предпочтительно от приблизительно 0,01 мг/кг до приблизительно 30 мг/кг массы тела животного.

5 Подходящие интервалы, с которыми вводят композиции по настоящему изобретению животным, находятся в диапазоне от приблизительно одного дня до приблизительно одного года. Следует отметить интервалы, с которыми осуществляют введение, находящиеся в диапазоне от приблизительно еженедельных до приблизительно одного раза в 6 месяцев. Следует особо отметить помесичные интервалы введения (то есть введение соединений животному один раз в месяц).

10 Теперь настоящее изобретение будет описано с помощью следующих неограничивающих примеров и фигур, на которых представлено следующее.

На фиг. 1 представлена порошковая дифракционная рентгенограмма на основе измеренных значений для полиморфа, обозначенного как форма A(a).

На фиг. 2 представлена порошковая дифракционная рентгенограмма на основе расчетных значений для полиморфа, обозначенного как форма A(a).

15 На фиг. 3 представлена DSC-кривая для полиморфа, обозначенного как форма A(a).

На фиг. 4 представлена порошковая дифракционная рентгенограмма на основе измеренных значений для полиморфа, обозначенного как форма A(b).

20 На фиг. 5 представлена DSC-кривая для полиморфа, обозначенного как форма A(b).

На фиг. 6 представлена порошковая дифракционная рентгенограмма на основе измеренных значений для гидрата соединения формулы IA.

На фиг. 7 представлена порошковая дифракционная рентгенограмма на основе расчетных значений для гидрата соединения формулы IA.

25 На фиг. 8 представлена порошковая дифракционная рентгенограмма на основе измеренных значений для полиморфа соединения формулы IB.

На фиг. 9 представлена DSC-кривая для полиморфа соединения формулы IB.

На фиг. 10 представлена порошковая дифракционная рентгенограмма на основе расчетных значений для полиморфа соединения формулы IB.

30 На фиг. 11 представлена порошковая дифракционная рентгенограмма на основе измеренных значений для полиморфа рацемата соединений формул IA и ID.

На фиг. 12 представлена DSC-кривая для полиморфа рацемата соединений формул IA и ID.

На фиг. 13 представлены рамановские спектры для полиморфа, обозначенного как форма A(a).

На фиг. 14 представлена DSC-кривая для полиморфа, обозначенного как форма A(c).

5

ПРИМЕРЫ

1. Получение полиморфов

Соединение формулы I получали с помощью способов, описанных в WO 2011/067272. Данный полученный твердый осадок и жидкий фильтрат анализировали с помощью HPLC, как указано в WO 2011/067272. Соединение формулы IA присутствовало в фильтрате, а соединение формулы IC — в твердом осадке. После кристаллизации из фильтрата полиморф, представляющий собой форму A(c), идентифицировали с помощью DSC (см. фиг. 14).

10

1a. Получение формы A(a)

Очищенный образец соединения формулы IA суспендировали в диметилкарбонате в течение 2 недель при 25°C, после чего выделяли кристаллы и определяли их характеристики с помощью DSC, порошковой рентгеновской дифракции и рентгеновской дифракции монокристаллов. Порошковая дифракционная рентгенограмма на основе измеренных значений для полиморфа соединения формулы IA (обозначенного как форма A(a)) представлена на фиг. 1. Рентгенограмма, полученная на основе измеренных данных интенсивности для монокристалла, представлена на фиг. 2. DSC-кривая формы A(a) представлена на фиг. 3.

15

20

1b. Получение формы A(b)

Дополнительный образец соединения формулы IA подвергали медленному выпариванию при комнатной температуре из ряда растворителей. Образец, выделенный после выпаривания из 20% смеси вода/метанол, анализировали с помощью DSC и порошковой рентгеновской дифракции. Порошковая дифракционная рентгенограмма на основе измеренных значений для полиморфа соединения формулы IA (обозначенного как форма A(b)) представлена на фиг. 4. DSC-кривая для формы A(b) представлена на фиг. 5.

25

30

1c. Получение формы A(h)

Дополнительный образец соединения формулы IA подвергали медленному выпариванию из смеси вода/этанол. Анализ кристаллов показал, что вода была включена в структуру — две молекулы воды и две молекулы соединения формулы IA в асимметричной единице. Данный гидрат (обозначенный как форма A(h)) подвергали

анализу с помощью DSC и TGA, а также порошковой рентгеновской дифракции и рентгеновской дифракции монокристаллов. Порошковая дифракционная рентгенограмма на основе измеренных значений для гидрата представлена на фиг. 6. Рентгенограмма, полученная на основе расчетных значений, исходя из данных интенсивности для монокристалла, представлена на фиг. 7.

1d. Получение формы B(a) и формы C(a)

Образцы соединений формул IB и IC готовили путем растворения образцов в ацетоне, фильтрования ацетона через 0,2 мкм шприцевой фильтр в чистый флакон, и флакон оставляли в вытяжном шкафу с обеспечением выпаривания ацетона. Полученные образцы твердого вещества анализировали с помощью порошковой рентгеновской дифракции и DSC. Порошковые дифракционные рентгенограммы для IB и IC были идентичны. Рентгенограмма для соединения формулы IB представлена на фиг. 8. Данные DSC для данного соединения представлены на фиг. 9.

Кристаллы, подходящие для анализа с помощью рентгеновской дифракции монокристаллов, выращивали в смеси изопропанол/вода (80/20). Рентгенограмма, полученная на основе расчетных значений, исходя из данных интенсивности для монокристалла, представлена на фиг. 10.

1e. Получение рацемической смеси соединений формул IA и ID

Равные количества соединений формул IA и ID растворяли в ацетоне и затем оставляли при комнатной температуре до выпаривания растворителя. Определяли характеристики полученного кристаллического твердого вещества с помощью порошковой рентгеновской дифракции и DSC. Порошковая дифракционная рентгенограмма на основе измеренных значений для полиморфа рацемата соединений формул IA и ID представлена на фиг. 11. DSC-кривая для данного полиморфа представлена на фиг. 12.

2. Анализ полиморфов

После получения образцов их подвергали анализу с помощью порошковой рентгеновской дифракции, и/или рентгеновской дифракции монокристаллов, и/или дифференциальной сканирующей калориметрии (DSC), и/или термическому гравиметрическому анализу (TGA), как подробно описано выше. Способы, применяемые для таких методов анализа, подробно описаны ниже.

Анализ с помощью порошковой рентгеновской дифракции твердого материала проводили с использованием порошкового дифрактометра Bruker D8 при комнатной температуре и относительной влажности выше 40%. Образцы закрепляли в фиксаторах

образцов Perspex и образцы выпрямляли. Фиксатор образцов вращали и рентгеновские лучи улавливали от 4° до 34° 2-тета, при этом время сканирования составляло от 25 до 30 минут в зависимости от интенсивности картины.

5 Данные интенсивности для монокристалла собирали на дифрактометре Oxford Xcalibur PX Ultra с применением излучения $\text{CuK}\alpha$ ($\lambda=1,5418 \text{ \AA}$) и графитового монохроматора. Кристалл помещали в масло Paratone N при 100K для сбора данных. Данные расшифровывали с использованием пакета программного обеспечения CRYSTALS.

10 DSC проводили с использованием Mettler Toledo DSC1. Загружали приблизительно 5 мг образца и нагревали его от 25°C до 160°C со скоростью $10^\circ\text{C}/\text{минута}$. В крышке тигля DSC имелись отверстия для обеспечения возможности выхода любого газа, образовавшегося в ходе нагревания образца.

15 Рамановскую спектроскопию проводили с применением рамановского микроскопа Thermo Scientific DXR: рамановский лазер, 780 нМ, направляли на образец на кварцевом предметном стекле.

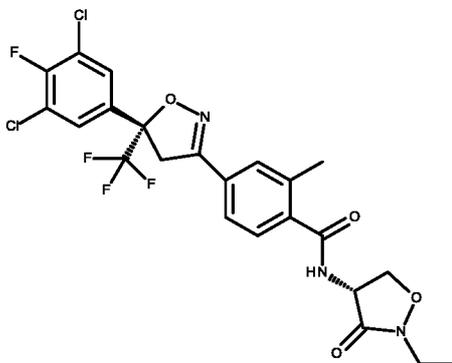
3. Стабильность полиморфов

20 Образец полиморфа, обозначенного как форма A(c), перемешивали в 5 мл диметилкарбоната в течение двух дней. Кристаллы выделяли, высушивали на воздухе и определяли их характеристики с помощью DSC и pXRD. DSC-кривая показала четкую одиночную эндотерму плавления с пиком плавления при 141°C , и рентгенограмма pXRD соответствовала таковой для формы A(a), что указывает на то, что весь объем формы A(c) был преобразован в форму (A)a.

25 Несмотря на то, что настоящее изобретение было описано со ссылкой на предпочтительные варианты осуществления и их примеры, объем настоящего изобретения не ограничивается только такими описанными вариантами осуществления. Для специалистов в данной области будет очевидно, что можно осуществлять модификации и адаптации применительно к вышеописанному изобретению без отступления от сущности и объема настоящего изобретения, которые определены и ограничены прилагаемой формулой изобретения. Все цитируемые в данном документе
30 публикации включены в данный документ при помощи ссылки во всей их полноте для всех целей в той же степени, как если бы каждая отдельная публикация была специально и отдельно указана, как таким образом включенная при помощи ссылки.

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Кристаллический полиморф соединения формулы IA,



5

IA,

который характеризуется порошковой дифракционной рентгенограммой, содержащей по меньшей мере три значения угла 2θ , выбранные из группы, состоящей из $6,0 \pm 0,2$, $8,8 \pm 0,2$, $9,4 \pm 0,2$, $10,1 \pm 0,2$, $11,9 \pm 0,2$, $14,5 \pm 0,2$, $15,9 \pm 0,2$, $20,2 \pm 0,2$, $20,7 \pm 0,2$, $21,2 \pm 0,2$, $21,7 \pm 0,2$, $22,1 \pm 0,2$ и $22,7 \pm 0,2$.

10

2. Кристаллический полиморф по п. 1, который характеризуется следующими параметрами решетки: $a = 5,06 \text{ \AA} \pm 0,01 \text{ \AA}$, $b = 18,92 \text{ \AA} \pm 0,01 \text{ \AA}$, $c = 24,17 \text{ \AA} \pm 0,01 \text{ \AA}$, $\alpha = 90^\circ \pm 0,01^\circ$, $\beta = 90^\circ \pm 0,01^\circ$, $\gamma = 90^\circ \pm 0,01^\circ$ и объем = $2315 \text{ \AA}^3 \pm 1 \text{ \AA}^3$.

15

3. Кристаллический полиморф по п. 1 или п. 2, который характеризуется точкой плавления, составляющей $141^\circ\text{C} \pm 2^\circ\text{C}$.

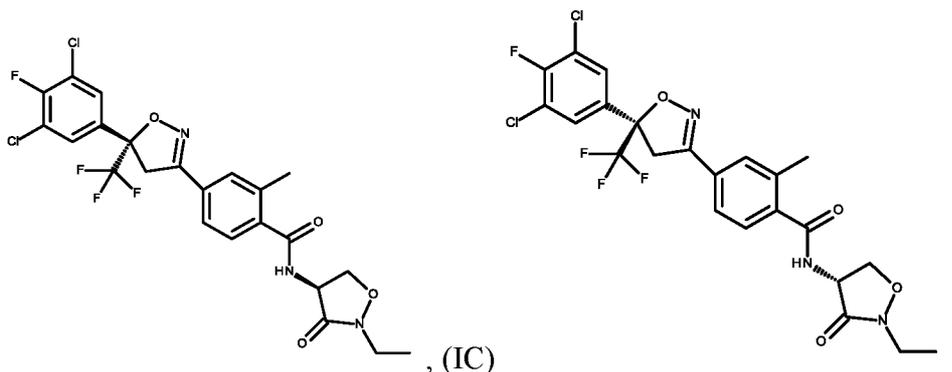
4. Кристаллический полиморф соединения формулы IA, который представляет собой гидрат и который характеризуется порошковой дифракционной рентгенограммой, содержащей по меньшей мере три значения угла 2θ , выбранные из группы, состоящей из $4,4 \pm 0,2$, $7,0 \pm 0,2$, $8,7 \pm 0,2$, $10,3 \pm 0,2$, $11,0 \pm 0,2$, $12,4 \pm 0,2$, $12,7 \pm 0,2$, $13,3 \pm 0,2$, $14,1 \pm 0,2$, $15,9 \pm 0,2$, $17,1 \pm 0,2$, $18,6 \pm 0,2$, $19,0 \pm 0,2$ и $19,6 \pm 0,2$.

20

5. Кристаллический полиморф по п. 4, который характеризуется следующими параметрами решетки: $a = 8,03 \text{ \AA} \pm 0,01 \text{ \AA}$, $b = 16,10 \text{ \AA} \pm 0,01 \text{ \AA}$, $c = 20,37 \text{ \AA} \pm 0,01 \text{ \AA}$, $\alpha = 90^\circ \pm 0,01^\circ$, $\beta = 97,02^\circ \pm 0,01^\circ$, $\gamma = 90^\circ \pm 0,01^\circ$ и объем = $2615 \text{ \AA}^3 \pm 1 \text{ \AA}^3$.

25

6. Кристаллический полиморф соединения формулы IB или IC,

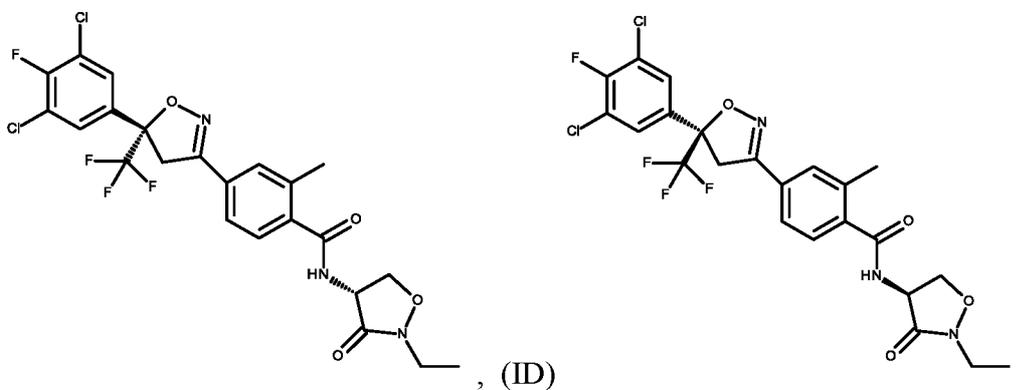


5 который характеризуется порошковой дифракционной рентгенограммой, содержащей по меньшей мере три значения угла 2θ , выбранные из группы, состоящей из $4,1 \pm 0,2$, $8,3 \pm 0,2$, $10,2 \pm 0,2$, $12,4 \pm 0,2$, $15,5 \pm 0,2$, $16,5 \pm 0,2$, $18,2 \pm 0,2$, $18,4 \pm 0,2$, $18,7 \pm 0,2$, $19,0 \pm 0,2$, $20,5 \pm 0,2$, $21,0 \pm 0,2$ и $21,4 \pm 0,2$.

7. Кристаллический полиморф по п. 6, который характеризуется точкой плавления, составляющей $206^\circ\text{C} \pm 2^\circ\text{C}$.

10

8. Кристаллический полиморф рацемата соединений формул IA и ID,



15 который характеризуется порошковой дифракционной рентгенограммой, содержащей по меньшей мере три значения угла 2θ , выбранные из группы, состоящей из $4,0 \pm 0,2$, $8,1 \pm 0,2$, $9,7 \pm 0,2$, $11,1 \pm 0,2$, $12,7 \pm 0,2$, $15,3 \pm 0,2$, $15,9 \pm 0,2$, $16,2 \pm 0,2$, $16,7 \pm 0,2$, $18,4 \pm 0,2$, $19,5 \pm 0,2$, $19,8 \pm 0,2$, $20,3 \pm 0,2$, $21,8 \pm 0,2$ и $23,9 \pm 0,2$.

9. Кристаллический полиморф по п. 8, который характеризуется точкой плавления, составляющей $173^\circ\text{C} \pm 2^\circ\text{C}$.

20

10. Композиция, предназначенная для использования в сельском хозяйстве, содержащая полиморф по любому из пп. 1-9 и по меньшей мере один приемлемый с точки зрения сельского хозяйства носитель или разбавитель.

5 11. Композиция по п. 10, которая содержит более чем один полиморф из полиморфов по любому из пп. 1-9.

12. Композиция по п. 10, которая обогащена полиморфом соединения формулы IA.

10

13. Композиция по п. 12, которая обогащена полиморфом по любому из пп. 1-3.

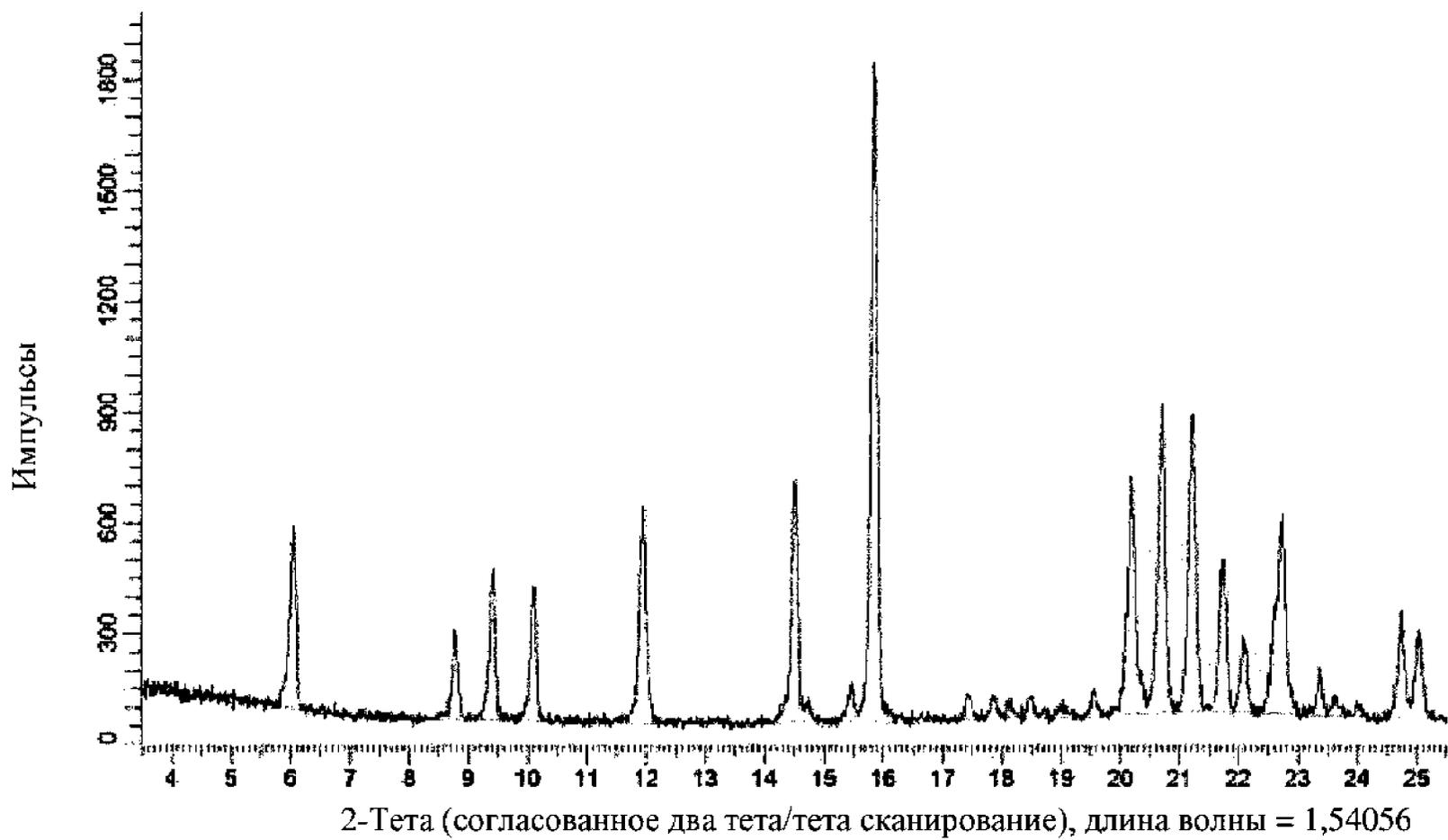
15

14. Композиция по любому из пп. 10-13, которая содержит по меньшей мере один дополнительный инсектицид или нематоцид.

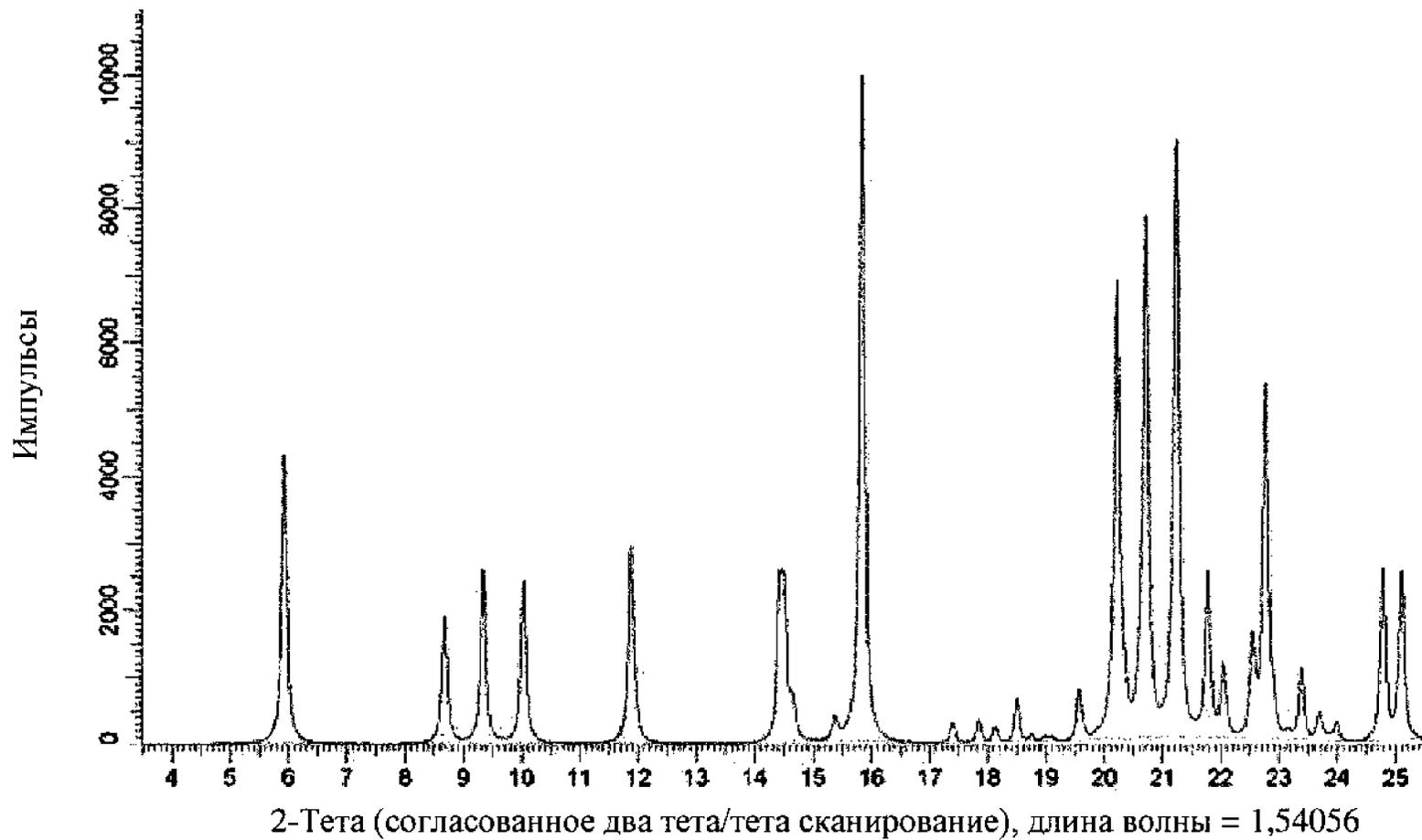
20

15. Способ предупреждения или контроля инфекции, вызываемой насекомыми, на растениях или материале для размножения растений, включающий обработку растения или материала для размножения растений инсектицидно эффективным количеством композиции, предназначенной для использования в сельском хозяйстве, по любому из пп. 10-14.

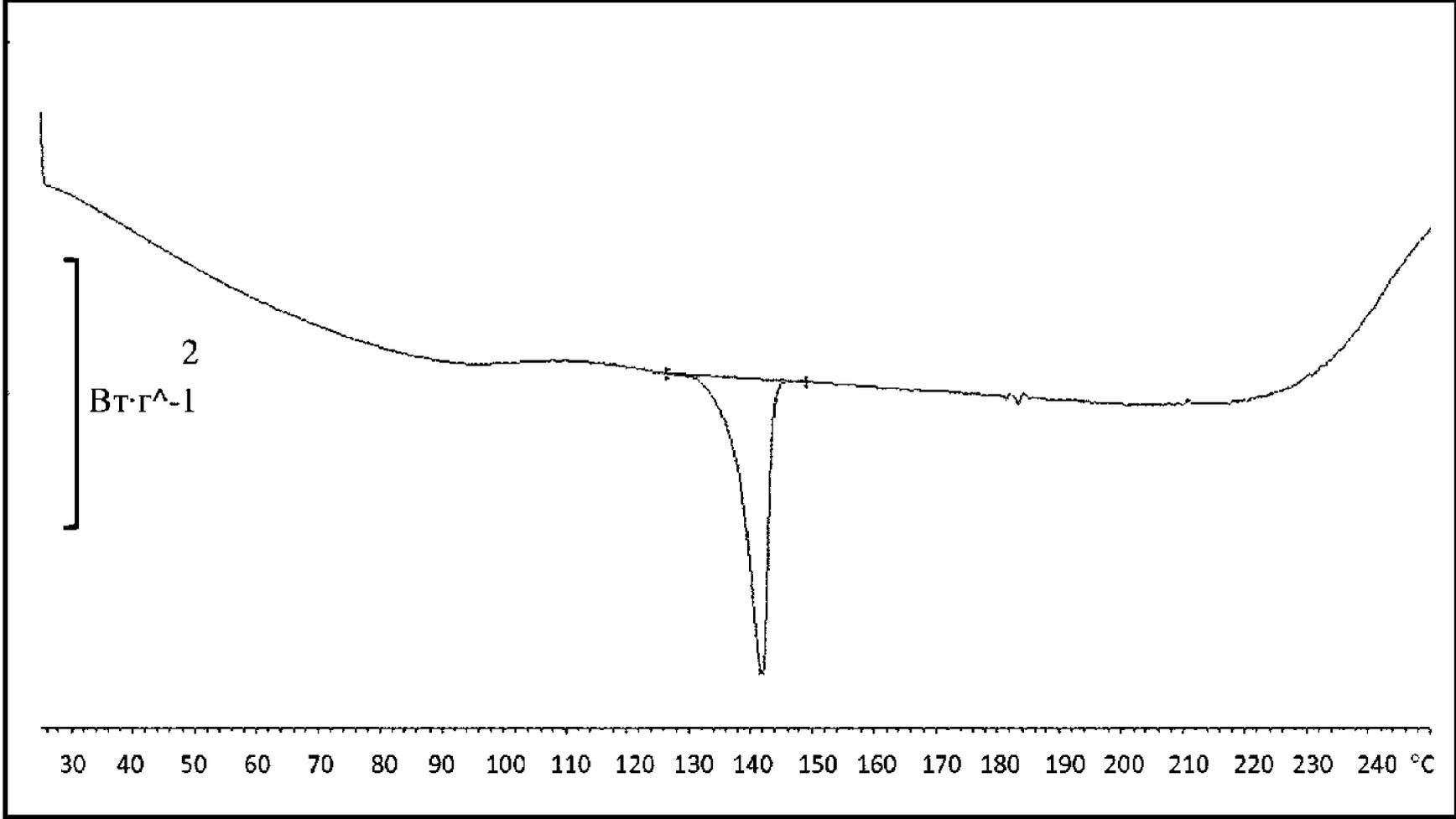
Фиг. 1



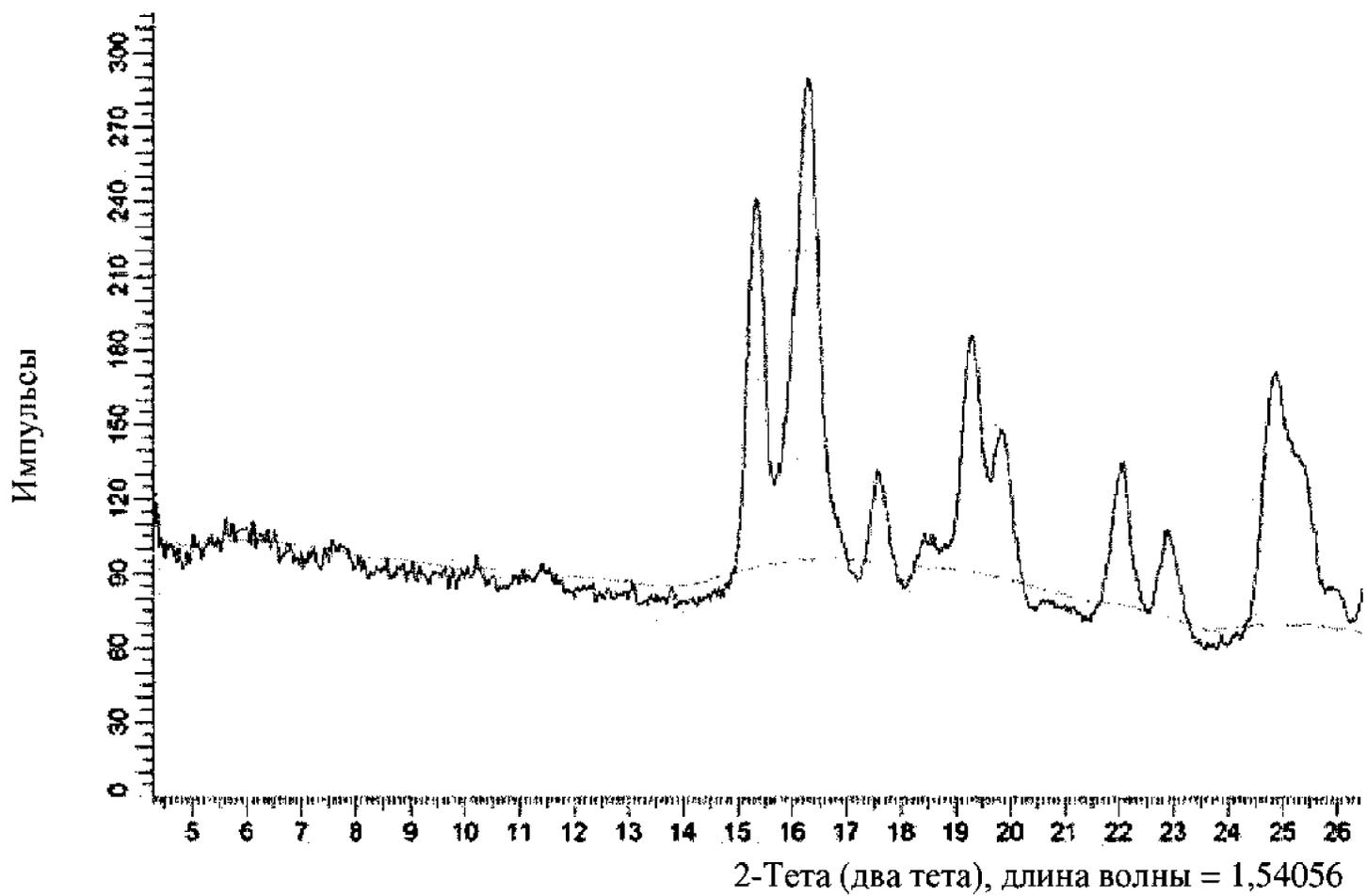
Фиг. 2



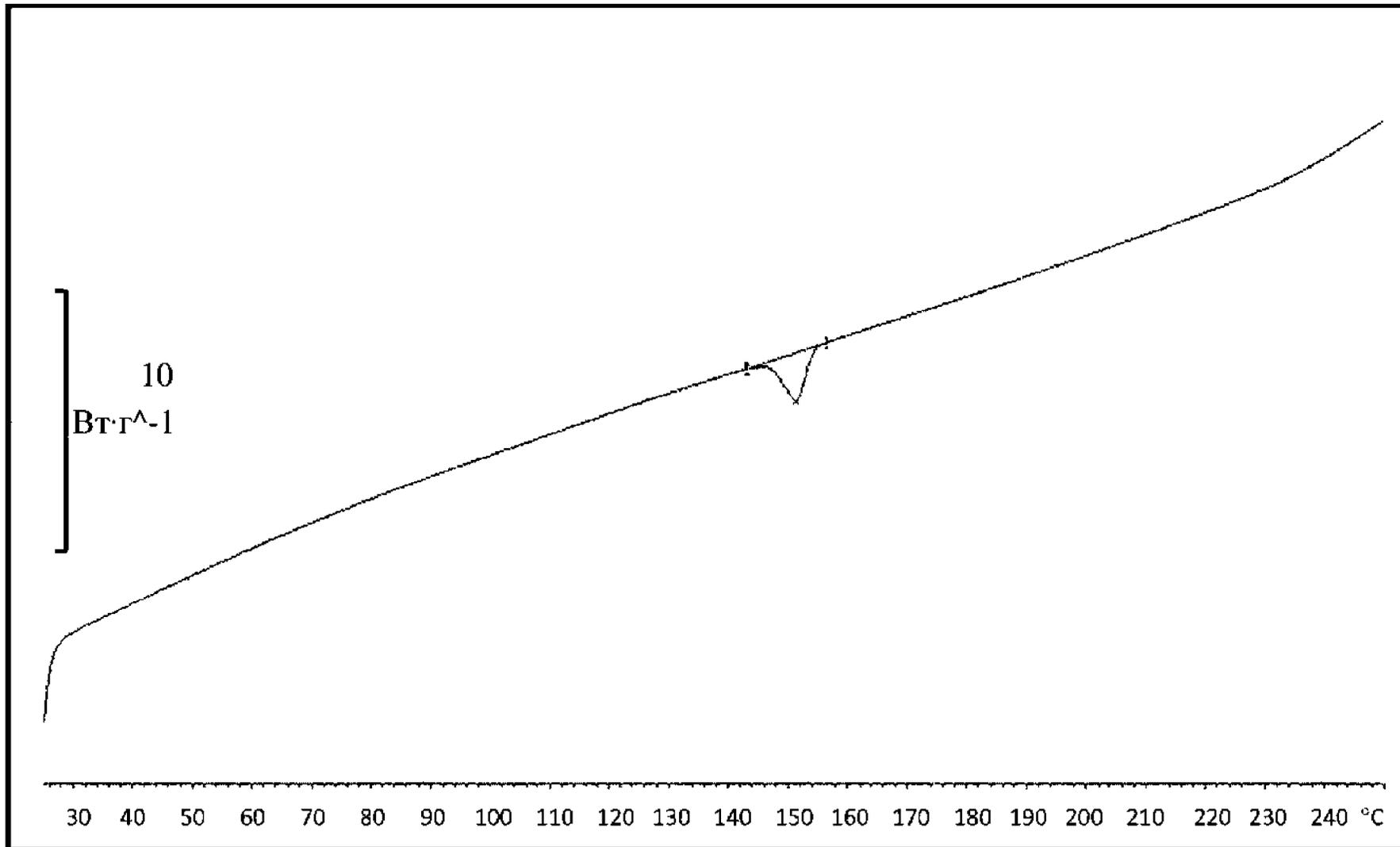
Фиг. 3



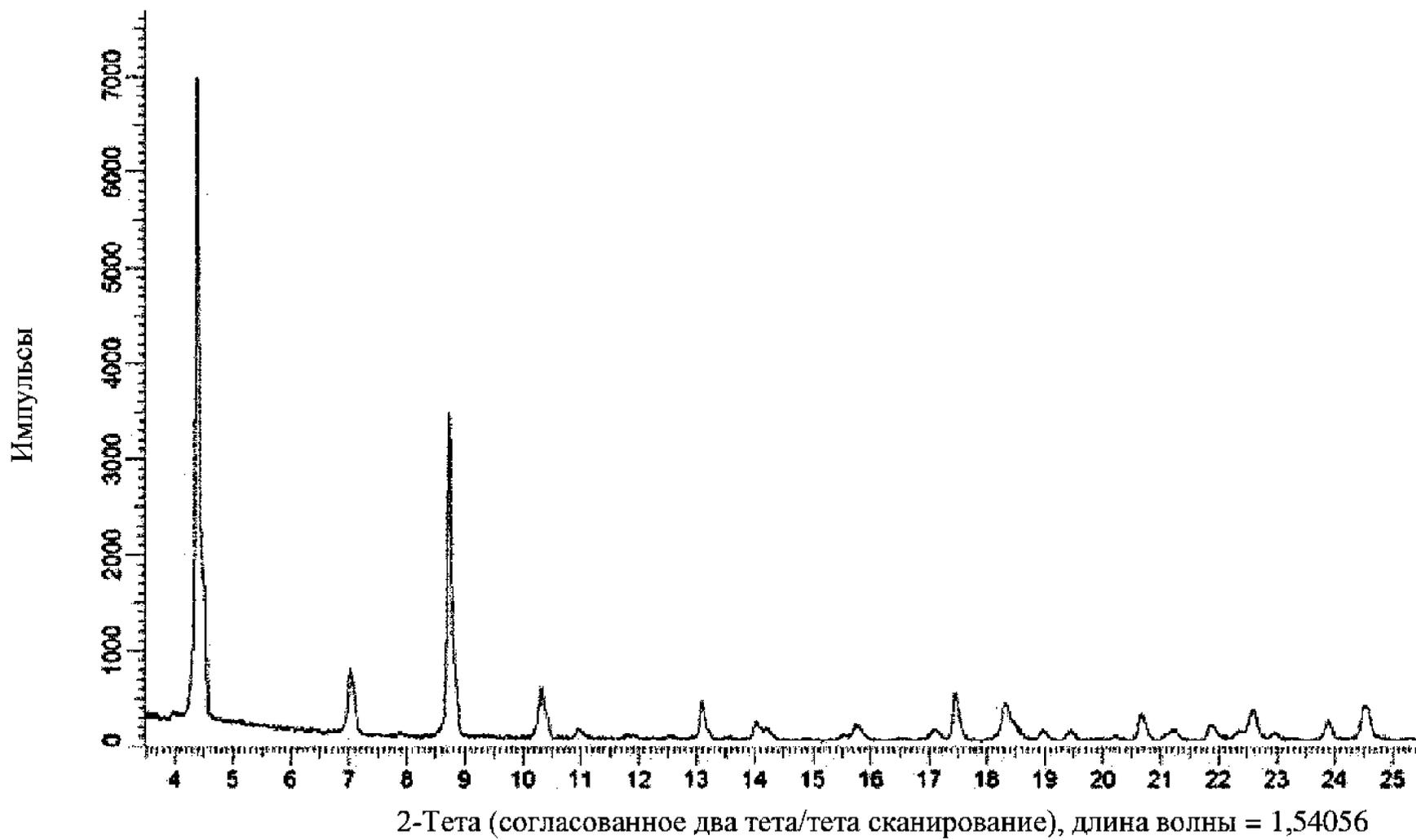
Фиг. 4



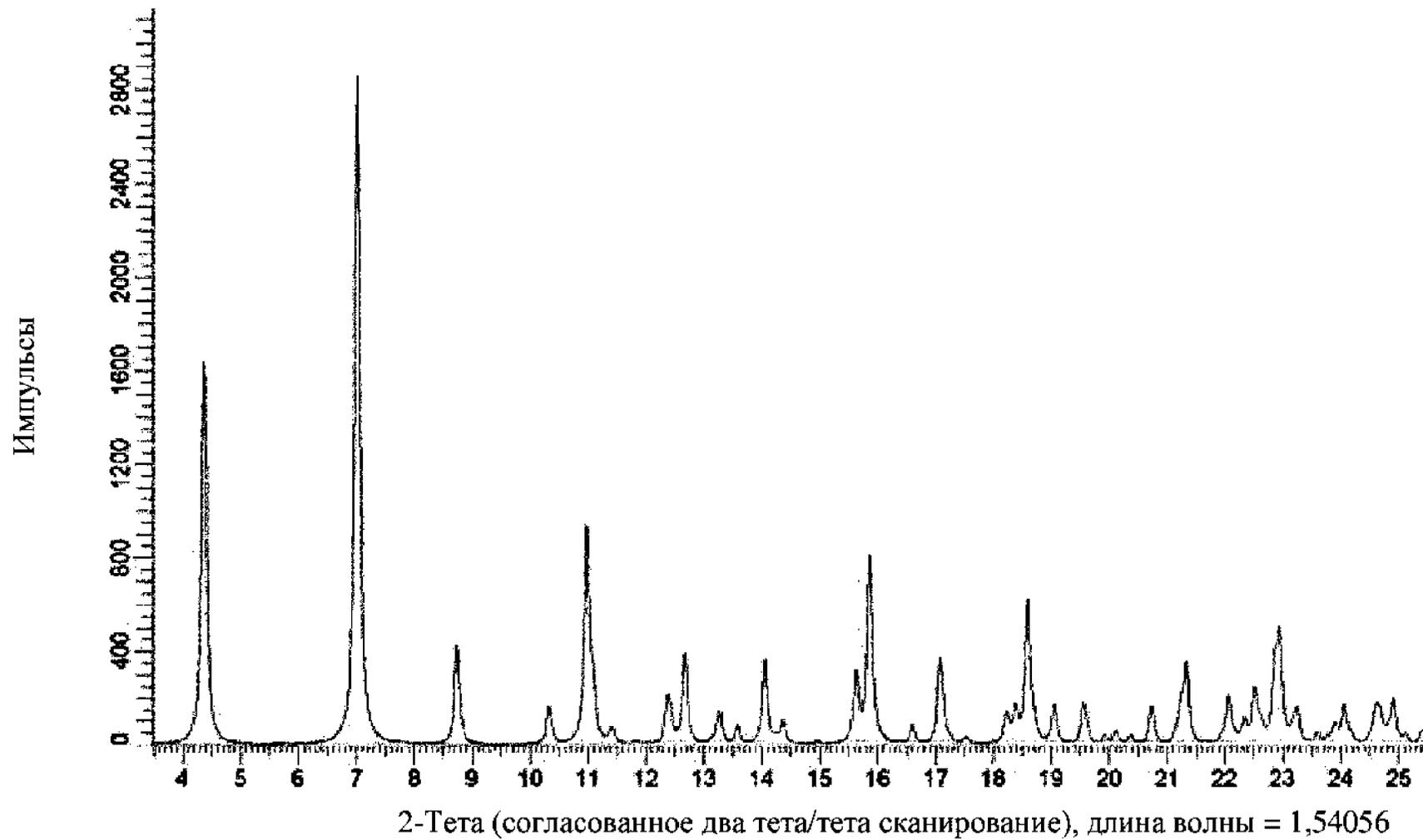
Фиг. 5



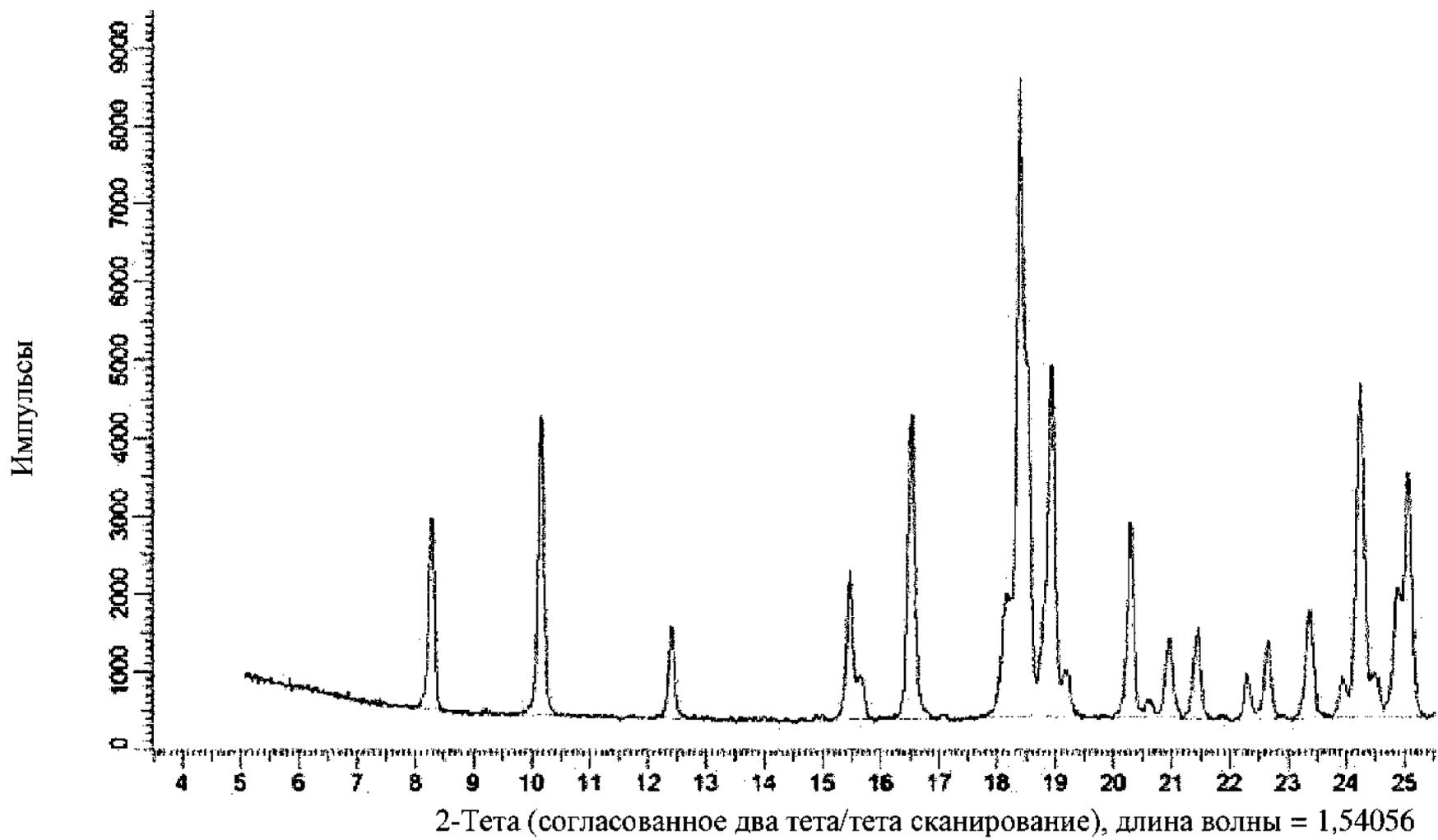
Фиг. 6



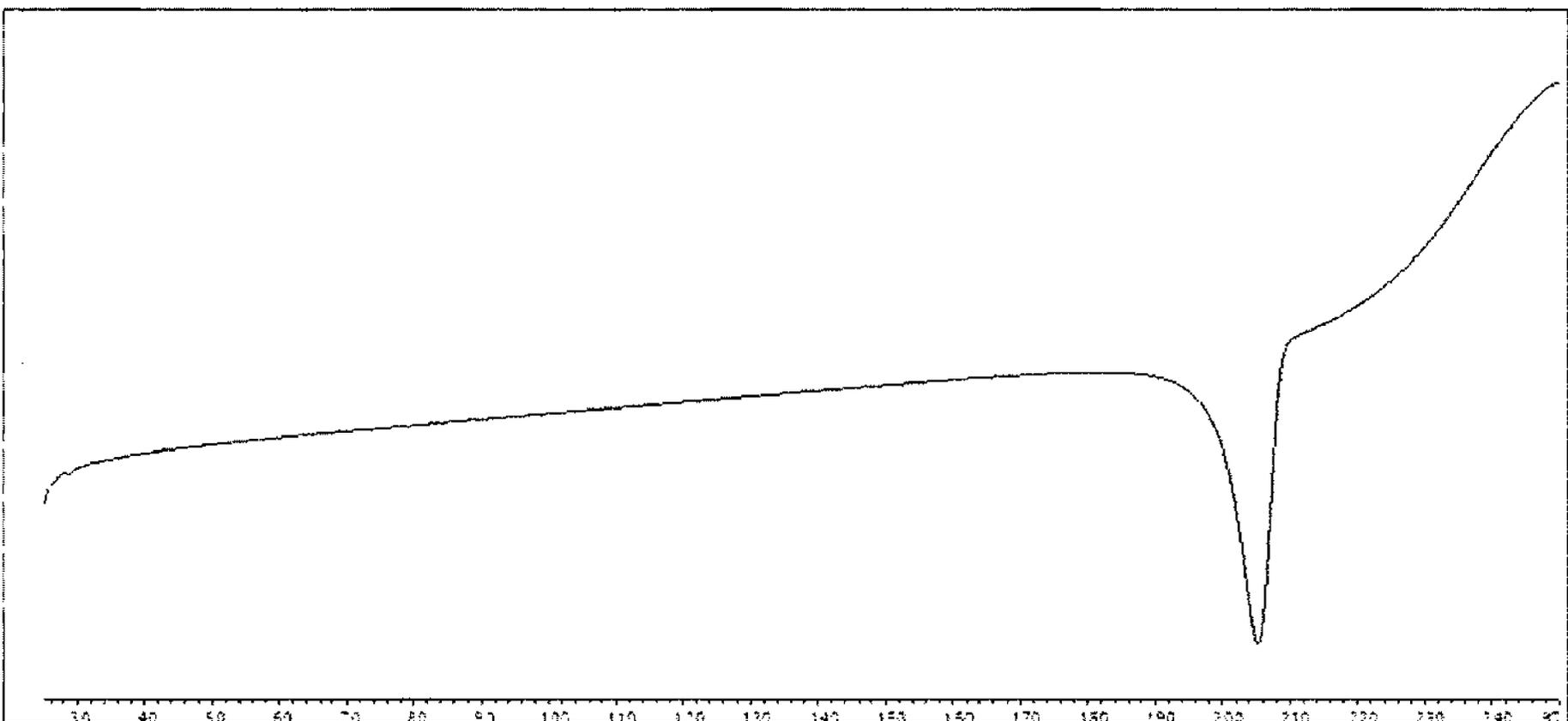
Фиг. 7



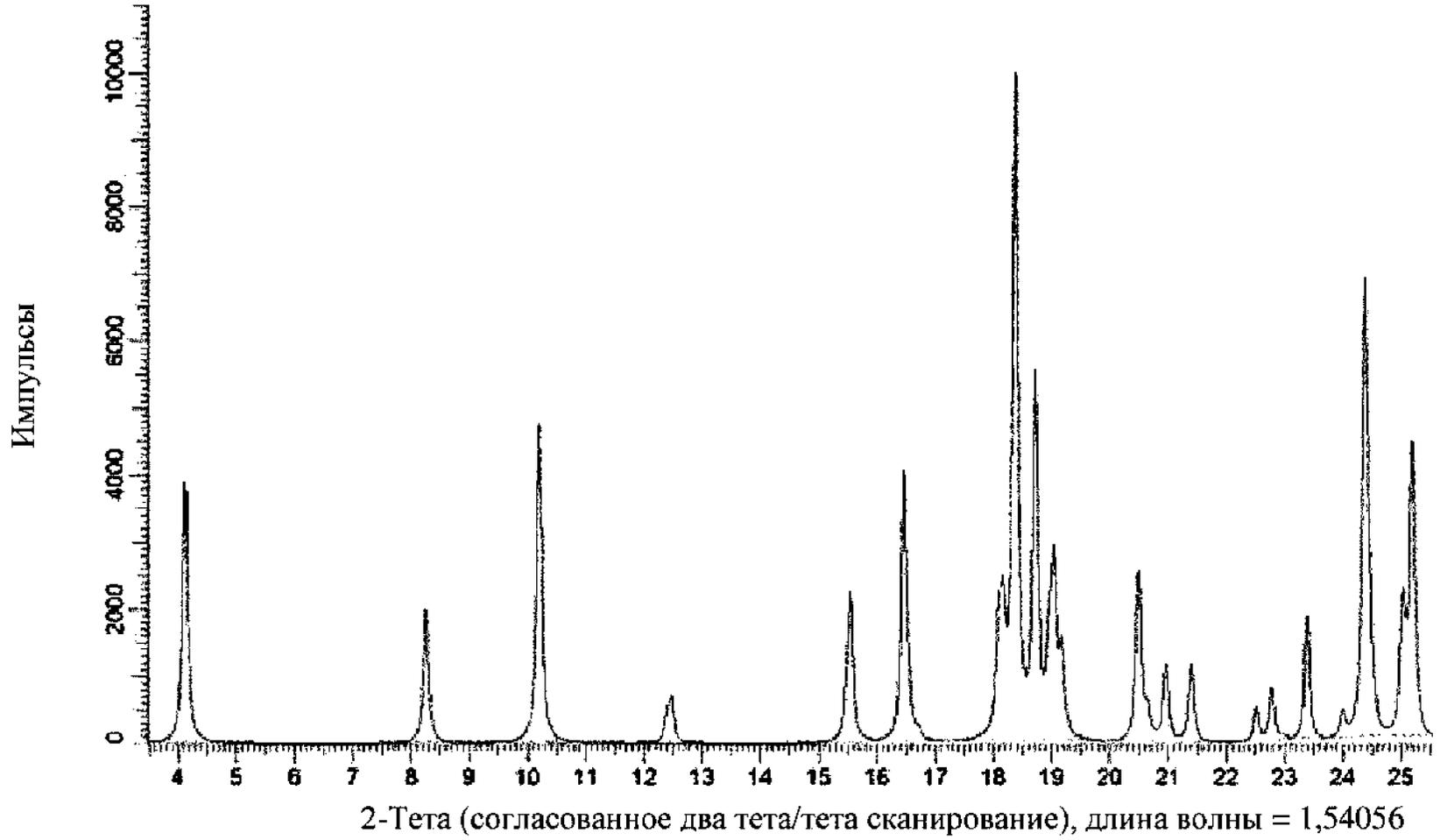
Фиг. 8



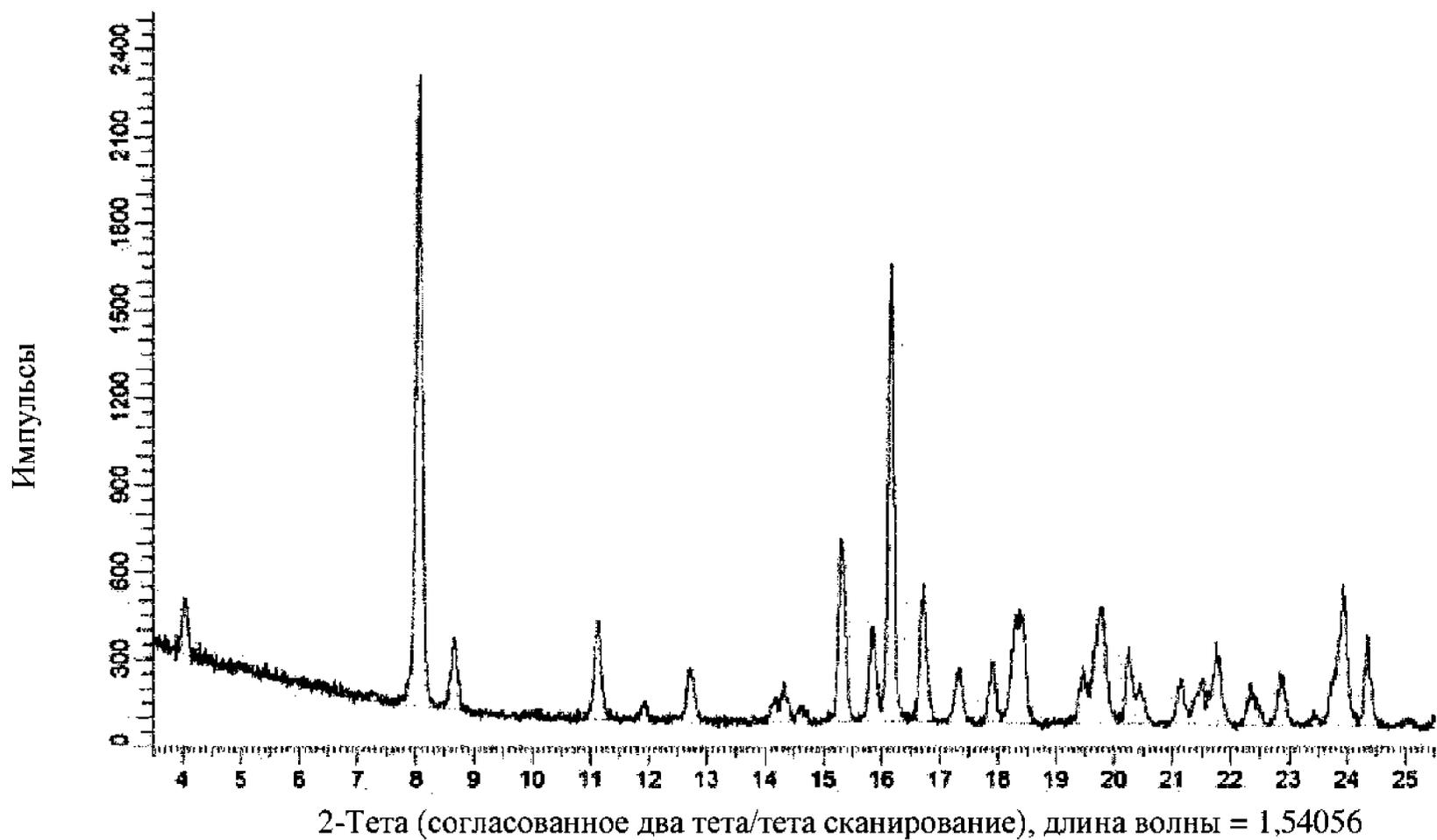
Фиг. 9



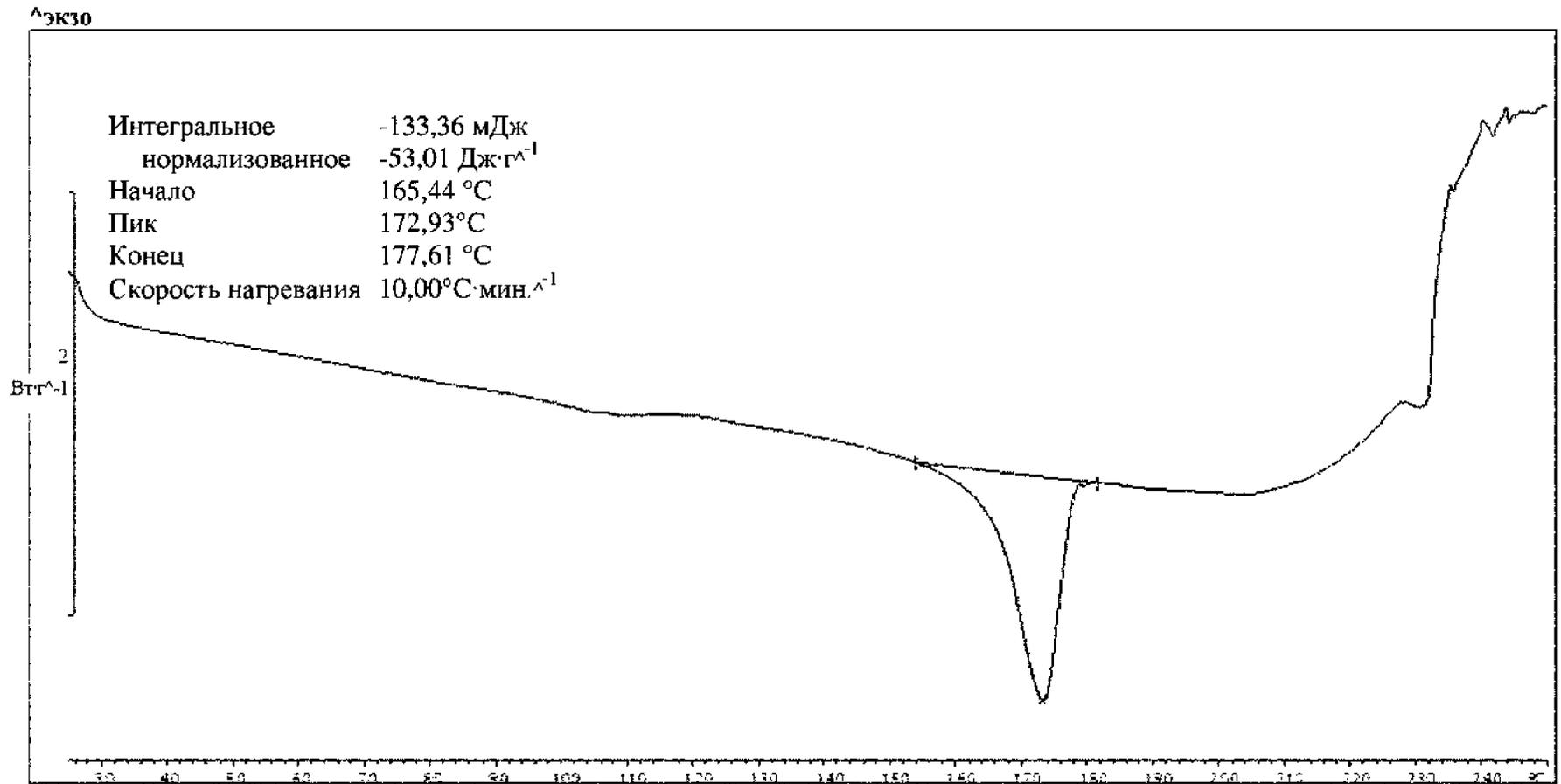
Фиг. 10



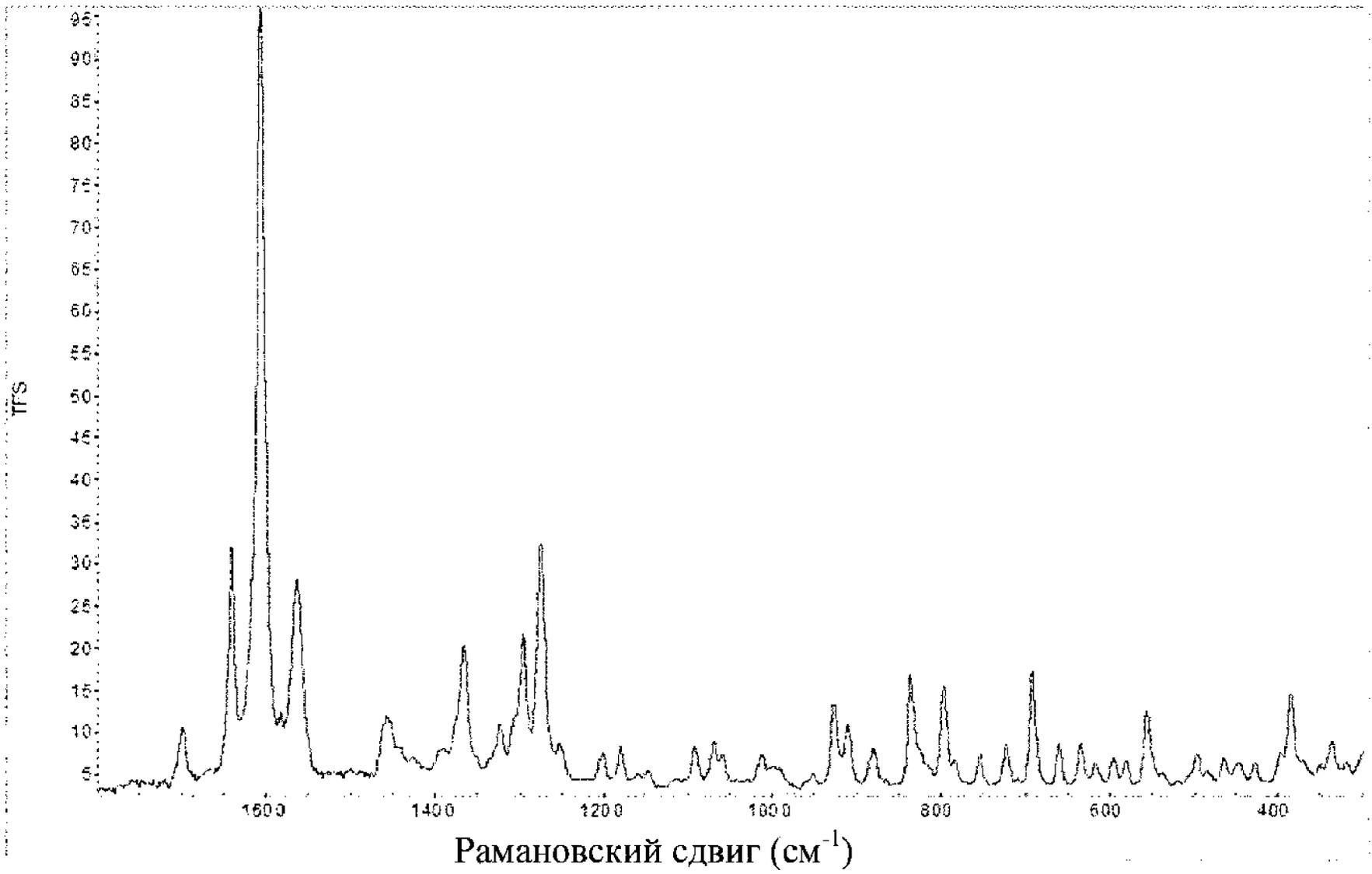
Фиг. 11



Фиг. 12



Фиг. 13



Фиг. 14

