



УКРАЇНА

(19) UA

(11) 81561

(13) C2

(51) МПК (2006)

A01N 37/52

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ
І НАУКИ УКРАЇНИДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІОПИС
ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД(54) ЗАСТОСУВАННЯ ПОХІДНОЇ N-АРИЛГІДРАЗИНУ ТА СПОСІБ БОРОТЬБИ З
НЕСІЛЬСЬКОГОСПОДАРСЬКИМИ ШКІДНИКАМИ

1

2

(21) а200607448

(22) 02.12.2004

(24) 10.01.2008

(86) РСТ/ЕР2004/013687, 02.12.2004

(31) 60/526,609

(32) 04.12.2003

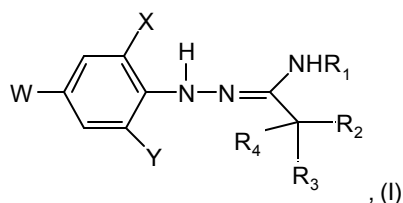
(33) US

(72) ФОН ДЕЙН ВОЛЬФГАНГ, ОЛОУМИ-САДЕГХИ
ХАССАН, КУН ДЕВІД ДЖ., АРМЕС НАЙДЖЕЛ,
КОРАДІН КРИСТОФЕР

(73) БАСФ АКЦІЕНГЕЗЕЛЬШАФТ

(56) ЕР 0604798 А, 06.07.1994
Furch J. A. et al.: "Amidrazones: a new class of
coleopteran insecticides Amidrazones: a new class of
coleopteran insecticides" ACS SYMPOSIUM
SERIES, 686, 1998, pages 178-184
Kuhn D. G. et al.: "Cycloalkyl-substituted
amidrazones: a novel class of insect control agents
Cycloalkyl-substituted amidrazones: a novel class of
insect control agents" ACS SYMPOSIUM SERIES,
686, 1998, pages 185-193

(57) 1. Застосування сполуки формули I



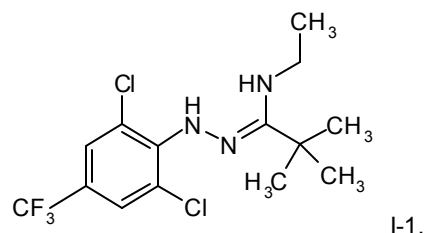
у якій

W означає хлор або трифторметил;

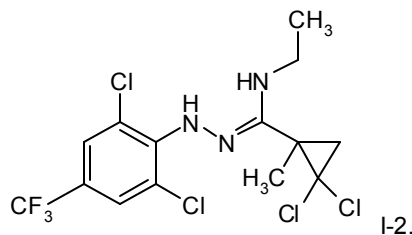
X та Y кожний незалежно означає хлор або бром;

R1 означає C1-C6-алкіл, C3-C6-алкеніл, C3-C6-
алкініл або C3-C6-циклоалкіл, який може бути
заміщений 1-3 атомами галогену, або C1-C4-алкіл,
який заміщений C1-C4-алкокси;R2 та R3 означають C1-C6-алкіл або, узяті разом,
можуть утворювати C3-C6-циклоалкіл, який може
бути незаміщеним або заміщеним 1-3 атомами
галогену;

R4 означає водень або C1-C6-алкіл,

або її енантіомеру, або її солі для боротьби з
несільськогосподарськими шкідниками, які вибрані
з групи, що складається із класів Chilopoda та
Diplopoda і рядів Isoptera, Diptera, Blattaria
(Blattodea), Demaptera, Hemiptera, Hymenoptera,Orthoptera, Ixodida, Siphonaptera, Thysanura,
Phthiraptera, Araneida, Parasitiformes та Acaridida.2. Застосування за п. 1, яке **відрізняється** тим, що
несільськогосподарські шкідники вибрані з групи,
що включає ряди Isoptera, Blattaria (Blattodea),
Diptera, Hymenoptera, Siphonaptera, Orthoptera та
Ixodida.3. Застосування за п. 1 або п. 2, яке **відрізняється**
тим, що сполукою формули I є сполука формули I-
1

I-1.

4. Застосування за п. 1 або п. 2, яке **відрізняється**
тим, що сполукою формули I є сполука формули I-
2

I-2.

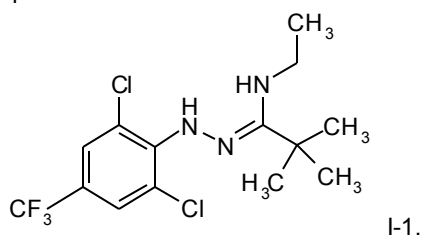
5. Застосування сполуки формули I, визначеної у
п. 1, для захисту неживих органічних матеріалів
від шкідників, вибраних із групи, що складається з
класів Chilopoda та Diplopoda і рядів Isoptera,
Diptera, Blattaria (Blattodea), Demaptera, Hemiptera,
Hymenoptera, Orthoptera, Siphonaptera, Thysanura,
Phthiraptera, Araneida, Parasitiformes та Acaridida.6. Застосування за п. 5, яке **відрізняється** тим, що
несільськогосподарські шкідники вибрані з групи,
що складається із класу Diplopoda та рядів
Isoptera, Diptera, Blattaria (Blattodea), Demaptera,
Hemiptera, Hymenoptera, Orthoptera та Thysanura.

(13) C2

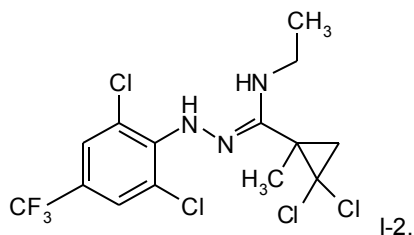
(11) 81561

(19) UA

7. Застосування за п. 5 або п. 6, яке **відрізняється** тим, що сполукою формули I є сполука формули I-1



8. Застосування за п. 5 або п. 6, яке **відрізняється** тим, що сполукою формули I є сполука формули I-2



9. Спосіб боротьби з несільськогосподарськими шкідниками, який **відрізняється** тим, що обробляють шкідників або їх їжу, місця перебування, місця розмноження або осередки пестицидно-ефективною кількістю сполуки формули I, визначеної у будь-якому з пп. 1, 3 або 4.

10. Спосіб за п. 9, який **відрізняється** тим, що несільськогосподарські шкідники вибрані із групи, що включає класи Chilopoda та Diplopoda і ряди Isoptera, Diptera, Blattaria (Blattodea), Demaptera, Hemiptera, Hymenoptera, Orthoptera, Siphonaptera, Thysanura, Phthiraptera, Araneida, Parasitiformes та Acaridida.

11. Спосіб за п. 9 або 10, який **відрізняється** тим, що несільськогосподарські шкідники вибрані із групи, що складається із рядів Isoptera, Blattaria (Blattodea), Diptera, Hymenoptera, Siphonaptera, Orthoptera та Ixodida.

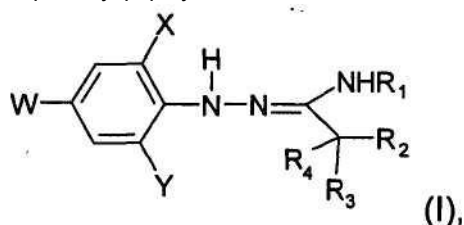
12. Спосіб захисту неживих органічних матеріалів від несільськогосподарських шкідників, вибраних із групи, що складається із класу Diplopoda і рядів Isoptera, Diptera, Blattaria (Blattodea), Demaptera, Hemiptera, Hymenoptera, Orthoptera та Thysanura, який **відрізняється** тим, що обробляють шкідників або їх їжу, місця перебування, місця розмноження, осередки або неживі органічні матеріали пестицидно-ефективною кількістю сполуки формули I, визначеної у будь-якому з пп. 1, 3 або 4.

13. Спосіб захисту тварин від несільськогосподарських шкідників, вибраних із групи, що складається із класу Chilopoda та рядів Araneida, Hemiptera, Diptera, Phthiraptera, Siphonaptera, Parasitiformes та Acaridida, який **відрізняється** тим, що обробляють шкідників у водоймах і/або в будовах або навколо них пестицидно-ефективною кількістю сполуки формули I, визначеної у будь-якому з пп. 1, 3 або 4.

14. Спосіб за п. 13, який **відрізняється** тим, що несільськогосподарські шкідники вибрані із групи, що складається із рядів Diptera, Phthiraptera, Siphonaptera та Parasitiformes.

15. Композиція для приманки, яка **відрізняється** тим, що містить пестицидно-ефективну кількість сполуки формули I, визначеної у будь-якому з пп. 1, 3 або 4, і аттрактант.

Даний винахід стосується застосування похідних гідразину формули I:



у якій

W означає хлор або трифторметил;

X та X кожний незалежно означає хлор або бром;

R¹ означає C₁-C₆-алкіл, C₃-C₆-алкеніл, C₃-C₆-алкініл або C₃-C₆-циклоалкіл, який може бути заміщений 1-3 атомами галогену або C₂-C₄-алкіл, який заміщений C₁-C₄-алкокси;

R² та R³ означають C₁-C₆-алкіл або, узяті разом, можуть утворювати C₃-C₆-циклоалкіл, який може бути незаміщеним або заміщеним 1-3 атомами галогену;

R⁴ означає водень або C₁-C₆-алкіл,

або їх енантіомерів або їх солей для боротьби з несільськогосподарськими шкідниками.

Винахід також стосується способу боротьби з несільськогосподарськими шкідниками, який включає обробку шкідників або їх їжі, місця перебування, місця розмноження або осередків пестицидно-ефективною кількістю сполуки формули I.

Винахід також стосується композицій, які містять сполуки формули I у пестицидно-ефективних кількостях для боротьби з несільськогосподарськими шкідниками.

Винахід, крім того, стосується застосування сполук формули I для захисту неживих органічних матеріалів від несільськогосподарських шкідників.

Типовими проблемами, що виникають при використанні доступних у цей час засобів для боротьби з несільськогосподарськими шкідниками, такими як піретроїди, є, наприклад, стійкість шкідників або несприятливі екологічні або токсикологічні властивості. Інша проблема, яка зустрічається, стосується необхідності мати доступні засоби для боротьби з несільськогосподарськими шкідниками, препарати для боротьби із шкідниками, які були б ефективні проти широкого спектра несільськогосподарських шкідників. Отже, існує необхідність у нових і поліпшених засобах для боротьби з несільськогосподарськими шкідниками, які вирішують ці проблеми.

Тому метою даного винаходу є розробка нових засобів для боротьби з несільськогосподарськими шкідниками, які переважно проявляють розширений спектр пестицидної дії.

Було встановлено, що дана ціль досягається застосуванням сполук формули I і композицій, що їх містять.

Несільськогосподарськими шкідниками є шкідники класів Chilopoda та Diplopoda і рядів Isoptera, Diptera, Blattaria (Blattodea), Dermaptera, Hemiptera, Hymenoptera, Orthoptera, Siphonaptera, Thysanura, Phthiraptera, Araneida, Parasitiformes та Acaridida.

Сполуки формули I особливо придатні для ефективної боротьби з наступними шкідниками:

сороканіжки (Chilopoda), наприклад, *Scutigera coleoptrata*,

багатоніжки (Diplopoda), наприклад, *Narceus* spp.,

павукоподібні (Araneida), наприклад, *Latrodectus mactans* та *Loxosceles reclusa*,

кліщі (Acaridida): наприклад, *Sarcoptes* sp.,

кліщі та кліщі паразитиформні (Parasitiformes): іксодові кліщі (Ixodida), наприклад, *Ixodes scapularis*, *Ixodes holocyclus*, *Ixodes pacificus*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Demacenter andersoni*, *Demacenter variabilis*, *Amblyomma americanum*, *Amblyomma maculatum*, *Ornithodoros hemsli*, *Ornithodoros turicata* та паразитиформні кліщі (Mesostigmata), наприклад, *Ornithonyssus bacoti* та *Demanyssus gallinae*,

терміти (Isoptera), наприклад, *Calotermes flavicollis*, *Leucotermes flavipes*, *Heterotermes aureus*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes virginicus*, *Reticulitermes lucifugus*, *Termes natalensis* та *Coptotermes formosanus*,

таргани (Blattaria-Blattodea), наприклад, *Blattella germanica*, *Blattella asahinae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta japonica*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Periplaneta australasiae* та *Blatta orientalis*,

двокрилі, комари (Diptera), наприклад, *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes vexans*, *Anastrepha ludens*, *Anopheles maculipennis*, *Anopheles crucians*, *Anopheles albimanus*, *Anopheles gambiae*, *Anopheles freeborni*, *Anopheles leucosphyrus*, *Anopheles minimus*, *Anopheles quadrimaculatus*, *Calliphora vicina*, *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Chrysops discalis*, *Chrysops silacea*, *Chrysops atlanticus*,

Cochliomyia hominivorax, *Cordylobia anthropophaga*, *Culicoides furens*, *Culex pipiens*, *Culex nigripalpus*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex tarsalis*, *Culiseta inornata*, *Culiseta melanura*, *Dematobia hominis*, *Fannia canicularis*, *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Glossina palpalis*, *Glossina fuscipes*, *Glossina tachinoides*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hippelates* spp., *Hypodema lineata*, *Leptoconops torrens*, *Lucilia Caprina*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*, *Lycoria pectoralis*, *Mansonia* spp., *Musca domestica*, *Muscina stabulans*, *Oestrus ovis*, *Phlebotomus argentipes*, *Psorophora columbiae*, *Psorophora discolor*, *Prosimulium mixtum*, *Sarcophaga haemorrhoidalis*, *Sarcophaga* sp., *Simulium vittatum*, *Stomoxys calcitrans*, *Tabanus bovinus*, *Tabanus atratus*, *Tabanus lineola* та *Tabanus similis*,

шкірястокрилі (Dermaptera), наприклад, *forficula auricularia*,

напівтвердокрилі (Hemiptera), наприклад, *Cimex lectularius*, *Cimex hemipterus*, *Reduvius senilis*, *Triatoma* spp., *Rhodnius prolixus* та *Arilus critatus*,

мурахи, бджоли, оси, пильщики (Hymenoptera), наприклад, *Crematogaster* spp., *Hoplocampa minuta*, *Hoplocampa testudinea*, *Monomorium pharaonis*, *Solenopsis geminata*, *Solenopsis invicta*, *Solenopsis richteri*, *Solenopsis xyloni*, *Pogonomyrmex barbatus*, *Pogonomyrmex californicus*, *Dasymutilla occidentalis*, *Bombus* spp., *Vespa squamosa*, *Paravespula vulgaris*, *Paravespula pennsylvanica*, *Paravespula germanica*, *Dolichovespula maculata*, *Vespa crabro*, *Polistes rubiginosa*, *Camponotus floridanus* та *Linepithema humile*,

цвіркуни, коникові, саранові (Orthoptera), наприклад, *Acheta domestica*, *Gryllotalpa gryllotalpa*, *Locusta migratoria*, *Melanoplus bivittatus*, *Melanoplus femurrubrum*, *Melanoplus mexicanus*, *Melanoplus sanguinipes*, *Melanoplus spretus*, *Nomadacris septemfasciata*, *Schistocerca americana*, *Schistocerca gregaria*, *Docostaurus maroccanus*, *Tachycines asynamorus*, *Oedaleus senegalensis*, *Zonozelus variegatus*, *Hieroglyphus daganensis*, *Kraussaria angulifera*, *Calliptamus italicus*, *Chortoicetes terminifera* та *Locustana pardalina*,

блохи (Siphonaptera), наприклад, *Ctenocephalides felis*, *Ctenocephalides canis*, *Xenopsylla cheopis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans* та *Nosopsyllus fasciatus*,

лускавиця звичайна, термобія домашня (Thysanura), наприклад, *Lepisma saccharina* та *Thermobia domestica*,

воші (Phthiraptera), наприклад, *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Phthirus pubis*, *Haematopinus eurytemus*, *Haematopinus suis*, *Linognathus vituli*, *Bovicola bovis*, *Menopon gallinae*, *Menacanthus stramineus* та *Solenopotes capillatus*.

Похідні гідразину формули I, які можуть бути використані відповідно до винаходу, відомі з EP-A 604 798 і можуть бути одержані відповідно до способів одержання, які описані або згадані в цьому документі. Цей документ відноситься до захисту рослин у сільському господарстві й описує

інсектицидну та акарицидну активність сполук формули I та інших сполук проти шкідників сільськогосподарських рослин рядів Coleoptera, Lepidoptera та Acarina.

У роботі J. A. Furch та ін., "Amidrazones: A New Class of Coleopteran Insecticides", ACS Symposium Series 686, Am. Chem. Soc, 1998, глава 18, стор. 178 і далі, ілюструється застосування певних амідразонів проти кукурудзяного жука діабротика, деякі із цих амідразонів є сполуками формули I. Повідомляється, що ці сполуки знищують зокрема певні види твердокрилих комах, будучи в той же час менш токсичними або нетоксичними до Lepidoptera та інших комах, таких як Acarina.

У роботі D. G. Kuhn та ін., "Cycloalkyl-substituted Amidrazones: A Novel Class of Insect Control Agents", ACS Symposium Series 686, Am. Chem. Soc, 1998, глава 19, стор. 185 і далі, повідомляється, що певні амідразони, деякі із яких є сполуками формули I, у якій R² та R³ узяті разом утворюють циклопропільне кільце, є активними проти певних рядів Coleopteran та Lepidoptera. Біологічні дослідження показують, що сполуки є цілком селективними, тільки деякі проявляють високу активність як проти Coleoptera, так і проти Lepidoptera.

Активність сполуки проти комах для захисту рослин у сільському господарстві, тобто, проти шкідників рослин, в цілому не припускає активності цієї сполуки проти несільськогосподарських шкідників. Боротьба із шкідниками рослин завжди є частиною захисту рослин. І навпаки, боротьба з несільськогосподарськими шкідниками, наприклад, стосується захисту неживих органічних матеріалів, або гігієни та профілактики захворювань (охорона здоров'я).

Розходження в необхідних засобах для боротьби із сільськогосподарськими/несільськогосподарськими шкідниками в цілому й переважно - крім можливих розходжень у біохімічних цілях - виникають із розходжень у їжі і/або місцях перебування шкідників.

Сільськогосподарські шкідники подібні ряду Homoptera паразитують на зелених частинах рослин, проколюючи їх і висмокчуючи рідину з рослин. Інші сільськогосподарські шкідники рядів Lepidoptera та Coleoptera паразитують на зелених частинах рослин, об'їдаючи їх. Навпроти, несільськогосподарські шкідники не живуть на рослинах і не харчуються зеленими частинами рослин або тільки в виключних випадках поїдають їх. Несільськогосподарські шкідники, наприклад, паразитують на неживих органічних матеріалах, таких як будинки, одяг та їжа і т.д., людей і тварин, а також на електричних проводах і т.д., вводючи, таким чином, патогенні мікроорганізми в оточуюче людей середовище та руйнуючи їх будинки та їжу. Прикладом є терміти (ряду Isoptera), які, головним чином, харчуються целюлозою, що є основним компонентом деревних виробів та паперової продукції. Іншим прикладом є комарі (ряду Diptera), личинки яких харчуються мікроорганізмами та органічними речовинами у воді і дорослі особи яких харчуються кров'ю.

Необхідно, щоб властивості пестицидів були адаптовані до їх конкретного використання. Системні пестициди, наприклад, які в силу їх розчинності у воді попадають у частини рослин, є придатними для боротьби з колючосисними шкідниками або шкідниками, що об'їдають (рослини). Однак слід очікувати, що вони не можуть проявляти таку ж активність проти несільськогосподарських шкідників, які не поїдають зелені частини рослин, але з якими борються по переважно за допомогою нерозчинних у воді пестицидів у системах пасток або шляхом безпосередньої обробки. У більшості випадків пестициди для боротьби із сільськогосподарськими шкідниками не придатні для боротьби несільськогосподарськими шкідниками та навпаки. Прикладами є наявні у продажу інсектициди піримікарб, ацефат, піримідивен та піридабен. Вони є активними проти сільськогосподарських комах, але проявляють низьку активність проти несільськогосподарських шкідників.

Підводячи підсумки, спеціаліст із попереднього рівня техніки може зробити висновок, що імідазони формули I і подібні структури проявляють селективну активність проти певних сільськогосподарських шкідників рядів Coleoptera або Lepidoptera і що незначні зміни в структурі сильно впливають на селективність.

Несподівано було встановлено, що певна група імідазонів, а саме сполуки формули I, проявляють широкий спектр дії проти несільськогосподарських шкідників.

Сполуки формули I та композиції, що їх містять, є особливо придатними для боротьби із шкідниками класів Chilopoda та Diplopoda.

Сполуки формули I та композиції, що їх містять, є особливо придатними для боротьби із шкідниками із рядів Isoptera, Blattaria (Blattodea), Diptera, Demaptera, Hemiptera, Hymenoptera, Orthoptera, Siphonaptera, Thysanura та Phthiraptera.

Крім того, сполуки формули I та композиції, що їх містять, є особливо придатними для боротьби із шкідниками із рядів Parasitiformes, Araneida та Acaridida.

Більш того, сполуки формули I та композиції, що їх містять, є особливо придатними для боротьби із шкідниками із рядів Isoptera, Blattaria (Blattodea), Diptera, Hymenoptera, Siphonaptera, Orthoptera та Ixodida.

Більш конкретно, сполуки формули I та композиції, що їх містять, є особливо придатними для боротьби із шкідниками із рядів Isoptera, Blattaria (Blattodea), Diptera, Hymenoptera та Siphonaptera.

Зокрема, сполуки формули I та композиції, що їх містять, є придатними для боротьби з Isoptera (Hodotermitidae, Kalotermitidae, Rhinotermitidae, Termitidae), Blattaria/Blattodea (Cryptocercidae, Blattidae, Polyphagidae, Blattellidae), Diptera (Culicidae, Simuliidae, Ceratopogonidae, Tabanidae, Muscidae, Calliphoridae, Oestridae, Sarcophagidae, Hippoboscidae), Hymenoptera (Xyelidae, Argidae, Cimbicidae, Tenthredinidae, Anaxelidae, Cephidae, Aphidiidae, Fomicidae, Vespidae, Sphecidae) та

Siphonaptera (Pulicidae, Rhopalopsyllidae, Ceratophyllidae).

Крім того, особливо кращим є застосування сполук формули I та композицій, що їх містять, до шкідників ряду Isoptera.

Застосування сполук формули I та композицій, що їх містять, до шкідників рядів Blattaria/Blattodea є іншим кращим втіленням даного винаходу.

Крім того, застосування сполук формули I та композицій, що їх містять, до шкідників ряду Hymenoptera, головним чином до мурах, є особливо кращим.

Застосування сполук формули I та композицій, що їх містять, до шкідників ряду Diptera, особливо, до мух і москітів, є іншим кращим втіленням даного винаходу.

Крім того, застосування сполук формули I та композицій, що їх містять, до шкідників ряду Orthoptera є особливо кращим.

Більше того, особливо кращим є застосування сполук формули I та композицій, що їх містять, до шкідників ряду Siphonaptera.

Застосування сполук формули I та композицій, що їх містять, до шкідників ряду Ixodida, особливо, до мух і москітів, є іншим кращим втіленням даного винаходу.

Крім того, застосування сполук формули I та композицій, що їх містять, до шкідників ряду Mesostigmata є подальшим кращим втіленням даного винаходу.

Крім того, застосування сполук формули I та композицій, що їх містять, до шкідників ряду Acaridida є ще одним кращим втіленням даного винаходу.

У кращому втіленні даного винаходу сполуки формули I та композиції, що їх містять, застосовують для захисту неживих органічних матеріалів, включаючи, але не обмежуючись ними: домашні продукти, такі як жири, масла, моно-, оліго- або поліорганосахариди, білки або свіжі або зів'ялі фрукти; матеріали, що містять целюлозу, наприклад, деревні матеріали, такі як житлові будинки, дерева, дощаті забори або шпалі, а також папір; а також конструкційні матеріали, меблі, шкіряні вироби, тваринні, рослинні та синтетичні волокна, вінілові вироби, електричні дроти та кабелі, а також стирольні піни.

Більш краще, сполуки формули I та композиції, що їх містять, застосовують для захисту неживих органічних матеріалів від несільськогосподарських шкідників, вибраних із групи, яка складається із класу Diplopoda і рядів Isoptera, Diptera, Blattaria (Blattodea), Demaptera, Hemiptera, Hymenoptera, Orthoptera та Thysanura.

Даний винахід також відноситься до способу захисту неживих органічних матеріалів від несільськогосподарських шкідників, бажано від несільськогосподарських шкідників, вибраних із групи, яка складається із класу Diplopoda і рядів Isoptera, Diptera, Blattaria (Blattodea), Demaptera, Hemiptera, Hymenoptera, Orthoptera та Thysanura, який включає обробку шкідників або їх їжі, місця перебування, місця розмноження, їх осередку (скупчення) або самих неживих органічних

матеріалів пестицидно ефективною кількістю сполуки формули I або композиції, що містить її.

Крім того, сполуки формули I або композиції, що їх містять, бажано використовувати для захисту неживих органічних матеріалів, які містять целюлозу.

Краще сполуки формули I або композиції, що їх містять, використовувати для захисту неживих органічних матеріалів, які містять целюлозу від несільськогосподарських шкідників, вибраних із рядів Isoptera, Diptera, Blattaria (Blattodea), Hymenoptera та Orthoptera, найбільш краще ряду Isoptera.

Даний винахід також передбачає спосіб захисту неживих органічних матеріалів, які містять целюлозу від несільськогосподарських шкідників, краще з рядів Isoptera, Diptera, Blattaria (Blattodea), Hymenoptera та Orthoptera, найбільш краще рядів Isoptera, який включає обробку шкідників або їх їжі, місця перебування, місця розмноження, їх осередку (скупчення) або самих неживих органічних матеріалів пестицидно ефективною кількістю сполуки формули I або композиції, що містить її.

В іншому кращому виконанні даного винаходу сполуки формули I або композиції, що їх містять, використовують для захисту моно-, оліго- або полісахаридів та білків.

Краще сполуки формули I або композиції, що їх містять, використовувати для захисту моно-, оліго- або полісахаридів і білків від несільськогосподарських шкідників, вибраних із рядів Demaptera, Diplopoda, Isoptera, Diptera, Blattaria (Blattodea), Hymenoptera, Orthoptera та Tysanura, найбільш краще, рядів Isoptera, Diptera, Blattaria (Blattodea) та Hymenoptera.

Даний винахід також передбачає спосіб захисту моно-, оліго- або полісахаридів і білків від несільськогосподарських шкідників, краще вибраних із рядів Demaptera, Diplopoda, Isoptera, Diptera, Blattaria (Blattodea), Hymenoptera, Orthoptera та Tysanura, найбільш краще, рядів Isoptera, Diptera, Blattaria (Blattodea) та Hymenoptera, який включає обробку шкідників або їх їжі, місця перебування, місця розмноження або їх осередку (скупчення) пестицидно ефективною кількістю сполуки формули I або композиції, що містить її.

Крім того, сполуки формули I краще використовувати для захисту тварин від несільськогосподарських шкідників класу Chilopoda і рядів Araneida, Hemiptera, Diptera, Phthiraptera, Siphonaptera, Parasitiformes та Acaridida шляхом обробки шкідників у водоймах і/або в будинках і навколо них, включаючи, але не обмежуючись ними: стіни, ґрунт, компостні купи, газонну траву, пасовища, каналізаційні мережі та матеріали, які використовуються в будівництві будинків, а також матраци та постільні принадлежності, пестицидно ефективною кількістю сполуки формули I або композиції, що містить її. Найбільш краще, сполуки формули I використовувати для захисту тварин від несільськогосподарських шкідників рядів Diptera, Phthiraptera, Siphonaptera та Parasitiformes.

Тварини включають теплокровних тварин, у тому числі людей та риб. Сполуки формули I краще використовувати для захисту теплокровних тварин, таких як велика рогата худоба, вівці, свині, верблюди, олені, коні, домашній птах, кролики, кози, собаки та коти.

У визначенні формули I, яка представлена вище, замісники мають наступні значення:

"Галоген" означає фтор, хлор, бром та йод.

Термін "алкіл" у даному контексті відноситься до розгалуженої або нерозгалуженої насиченої вуглеводневої групи, яка має від 1 до 5 або 6 атомів вуглецю, особливо C₁-C₆-алкіл, такий як метил, етил, пропіл, 1-метилетил, бутил, 1-метилпропіл, 2-метилпропіл, 1,1-диметилетил, пентил, 1-метилбутил, 2-метилбутил, 3-метилбутил, 2,2-диметилпропіл, 1-етилпропіл, гексил, 1,1-диметилпропіл, 1,2-диметилпропіл, 1-метилпентил, 2-метилпентил, 3-метилпентил, 4-метилпентил, 1,1-диметилбутил, 1,2-диметилбутил, 1,3-диметилбутил, 2,2-диметилбутил, 2,3-диметилбутил, 3,3-диметилбутил, 1-етилбутил, 2-етилбутил, 1,1,2-триметилпропіл, 1,2,2-триметилпропіл, 1-етил-1-метилпропіл та 1-етил-2-метилпропіл.

"Алкокси" відноситься до лінійної або розгалуженої алкільної групи, яка має від 1 до 4 атомів вуглецю (метил, етил, пропіл, 1-метилетил, бутил, 1-метилпропіл, 2-метилпропіл, 1,1-диметилетил) і зв'язаною через кисневий зв'язок з будь-яким зв'язком в алкільній групі. Приклади включають метокси, етокси, пропокси та ізопропокси.

"Циклоалкіл" відноситься до моноциклічного 3-6-членного насиченого вуглеводневого кільця, тобто циклопропілу, циклобутилу, циклопентилу та циклогексилу.

Що стосується використання сполук формули I за призначенням, то особлива перевага надається наступним значенням замісників, у кожному випадку їх власним значенням або в комбінації:

Перевага надається сполукам формули I, у якій W означає трифторметил.

Далі перевага надається сполукам формули I, у якій X та Y обидва означають хлор.

Крім того, кращими є сполуки формули I, у якій R¹ означає C₁-C₆-алкіл, особливо, етил.

Далі перевага надається сполукам формули I, у якій R² та R³ обидва означають метил.

Крім того, кращими є сполуки формули I, у якій R² та R³ утворюють циклопропільне кільце, яке є незаміщеним або заміщеним 1-3 атомами галогену, зокрема, хлором та бромом.

Крім того, особливо кращими є сполуки формули I, у якій R² та R³ утворюють циклопропільне кільце, яке є заміщеним 2 атомами галогену.

Крім того, особливо кращими є сполуки формули I, у якій R² та R³ утворюють циклопропільне кільце, яке є заміщеним 2 атомами хлору.

Особливо кращими є сполуки формули I, у якій R² та R³ утворюють 2,2-дихлорциклопропільне кільце.

Перевага надається сполукам формули I, у якій R⁴ означає C₁-C₆ алкіл, особливо, метил.

Особливо кращими є сполуки формули I, у якій R², R³ та R⁴ всі є метилом.

Крім того, особливо кращими є сполуки формули I, у якій R², R³ та R⁴ утворюють залишок 1-метил-2,2-дихлорциклопропіл.

Далі перевага надається сполукам формули I, у якій

W означає трифторметил;

X та Y кожний незалежно означає хлор або бром;

R¹ означає C₁-C₆-алкіл;

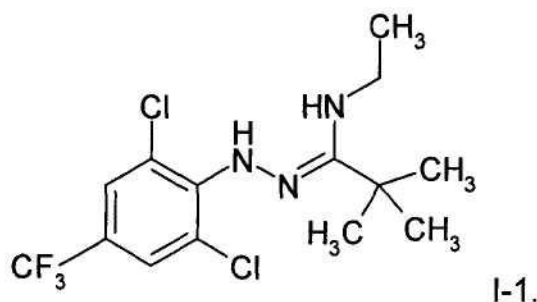
R² та R³ означають C₁-C₆-алкіл або можуть разом утворювати C₃-C₆-циклоалкіл, який заміщений 1-2 атомами галогену;

R⁴ означає C₁-C₆-алкіл;

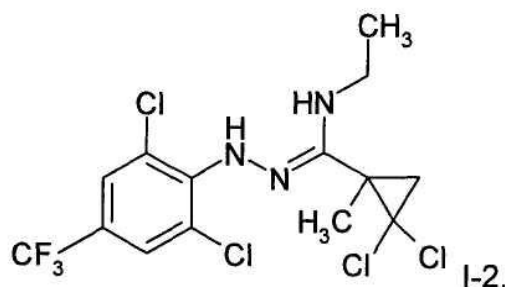
або їх енантіомерам або солям.

Особлива перевага надається N-етил-2,2-диметилпропіонамід-2-(2,6-дихлор- α,α,α -трифтор-*p*-толіл)гідрозону та N-етил-2,2-дихлор-1-метилциклопропанкарбоксамід-2'-(2,6-дихлор- α,α,α -трифтор-*p*-толіл)гідрозону.

Крім того, особлива перевага щодо використання даного винаходу надається сполуці формули 1-1 (N-етил-2,2-диметилпропіонамід-2-(2,6-дихлор- α,α,α -трифтор-*p*-толіл)гідрозону):



Крім того, особлива перевага щодо використання даного винаходу надається сполуці формули 1-2 (N-етил-2,2-дихлор-1-метилциклопропанкарбоксамід-2-(2,6-дихлор- α,α,α -трифтор-*p*-толіл)гідрозону):

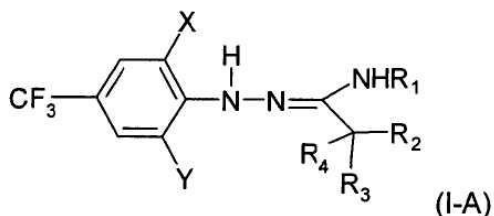


Що стосується їх використання, то особлива перевага надається сполукам 1-A, зведеним у таблицю нижче. Крім того, групи, згадані як замісники у таблицях, є самі по собі, незалежно від комбінації, у якій вони згадуються, особливо кращим втіленням розглянутого замісника.

Що стосується їх використання, то особлива перевага також надається аддуктам сполук із хлористоводневою кислотою, малеїноювою кислотою, дималеїноювою кислотою, фумаровою

кислотою, дифумаровою кислотою, метансульфеновою кислотою, метансульфоною кислотою та бурштиновою кислотою, які зазначені у таблицях нижче.

Деякі із сполук формули I є новими. Вони також являють предмет даного винаходу.



No.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	X	Y
A-1	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl	Cl
A-2	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl	Cl
A-3	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl	Cl
A-4	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl	Cl
A-5	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl	Cl
A-6	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Cl	Cl
A-7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Br	Br
A-8	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Br	Br
A-9	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Br	Br
A-10	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Br	Br
A-11	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Br	Br
A-12	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Br	Br
A-13	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	Br	Br
A-14	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	Br	Br
A-15	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	Br	Br
A-16	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	Br	Br
A-17	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	Br	Br
A-18	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	Br	Br
A-19	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	Br	Br
A-20	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	Br	Br
A-21	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	Br	Br
A-22	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	Br	Br
A-23	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	Br	Br
A-24	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	Br	Br
A-25	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	Br	Br
A-26	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	Br	Br
A-27	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	Br	Br
A-28	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	Br	Br
A-29	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	Br	Br
A-30	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	Br	Br
A-31	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	Br	Br
A-32	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	Br	Br
A-33	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	Br	Br
A-34	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	Br	Br
A-35	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	Br	Br
A-36	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	Br	Br
A-37	C ₃ H ₅	C ₃ H ₅	C ₃ H ₅	C ₃ H ₅	Br	Br
A-38	C ₃ H ₅	C ₃ H ₅	C ₃ H ₅	C ₃ H ₅	Br	Br
A-39	C ₃ H ₅	C ₃ H ₅	C ₃ H ₅	C ₃ H ₅	Br	Br
A-40	C ₃ H ₅	C ₃ H ₅	C ₃ H ₅	C ₃ H ₅	Br	Br
A-41	C ₃ H ₅	C ₃ H ₅	C ₃ H ₅	C ₃ H ₅	Br	Br
A-42	C ₃ H ₅	C ₃ H ₅	C ₃ H ₅	C ₃ H ₅	Br	Br
A-43	C ₃ H ₅	C ₃ H ₅	C ₃ H ₅	C ₃ H ₅	Br	Br
A-44	C ₃ H ₅	C ₃ H ₅	C ₃ H ₅	C ₃ H ₅	Br	Br

Придатними поверхнево-активними речовинами є солі лужних металів, лужноземельних металів та амонієві солі лігносульфонової кислоти, нафталінсульфонової кислоти, фенолсульфонової кислоти, дибутилнафталінсульфонової кислоти, алкіларилсульфонати, алкілсульфати, алкілсульфонати, сульфати жирних спиртів, жирні кислоти та гліколеві ефіри сульфатованих жирних кислот, крім того, конденсати сульфофанового нафталіну та нафталінових похідних з формальдегідом, конденсати нафталіну або нафталінсульфонової кислоти з фенолом, октилфенолом, нонілфенолом, алкілфенілполігліколеві ефіри, трибутилфенілполігліколеві ефіри, тристеарилфенілполігліколеві ефіри, алкіларилполієфірні спирти, конденсати спирту та спирту жирного ряду/етиленоксиду, етоксикована рицинова олія, поліоксіетиленалкілові ефіри, етоксикований поліоксипропілен, ацеталь полігліколевого ефіру лаурилового спирту, складні ефіри сорбіту, лігнінсульфітні відпрацьовані луѓи та метилцелюлоза та блокспівполімери етиленоксиду/пропіленоксиду.

Речовинами, придатними для одержання розчинів, емульсій, паст або масляних дисперсій, які розприскують безпосередньо, є фракції мінеральних масел із середньою-високою точкою кипіння, такі як гас або дизельне масло, крім того кам'яновугільні масла, а також масла (олії) рослинного або тваринного походження, аліфатичні, циклічні або ароматичні вуглеводні, наприклад, толуол, ксилол, парафін, тетрагідронафталін, алкіловані нафталіни або їх похідні, метанол, етанол, пропанол, бутанол, циклогексанол, циклогексанон, ізофорон, сильно полярні розчинники, наприклад, диметилсульфоксид, N-метилпіролідон або вода.

Порошки, матеріали для розсіювання та дуети можуть бути одержані шляхом змішування або спільного розмелу активних речовин із твердим носієм.

Гранули, наприклад, гранули з покриттям, імпрегновані гранули або гомогенні гранули, можуть бути одержані шляхом зв'язування активних інгредієнтів із твердими носіями. Прикладами твердих носіїв є мінеральні землі, такі як силікагелі, силікати, тальк, каолін, аттаклей, вапняк, вапно, крейда, болюс, лес, глина, доломіт, діатомова земля, сульфат кальцію, сульфат магнію, оксид магнію, подрібнені синтетичні матеріали, добрива, такі як, наприклад, сульфат амонію, фосфат амонію, нітрат амонію, сечовини та продукти рослинного походження, такі як зернове борошно, борошно з кори дерев, деревне борошно та борошно з горіхової шкарлупи, порошки із целюлози та інші тверді носії.

Загалом композиції містять від 0,01 до 95 мас.%, краще від 0,1 до 90 мас.% активного інгредієнта. Активні інгредієнти застосовують із чистотою від 90% до 100%, краще від 95% до 100% (згідно з даними спектра ЯМР).

Далі наведені приклади складів:

1. Продукти для розведення водою

A. Розчинні концентрати (SL)

10 мас. частин сполуки відповідно до винаходу розчиняють у воді або у водорозчинному розчиннику. Альтернативно додають змочувальні агенти або інші допоміжні речовини. Активний інгредієнт розчиняється при розведенні водою.

B. Дисперсійні концентрати (DC)

20 мас. частин сполуки відповідно до винаходу розчиняють у циклогексаноні з додаванням диспергатора, наприклад, полівінілпіролідону. Розведення водою дає дисперсію.

C. Емульгуювальні концентрати (EC)

15 мас. частин сполуки відповідно до винаходу розчиняють у ксилолі з додаванням додецилбензолсульфонату кальцію та етоксикованої рицинової олії (у кожному випадку 5% концентрації). При розведенні у воді утворюється емульсія.

D. Емульсії (EW, EO)

40 мас. частин сполуки відповідно до винаходу розчиняють у ксилолі з додаванням додецилбензолсульфонату кальцію та етоксикованої рицинової олії (у кожному випадку 5% концентрації). Цю суміш вводять у воду за допомогою емульгатора (Ultraturrax) і перетворюють у гомогенну емульсію. При розведенні у воді утворюється емульсія.

E. Суспензії (SC, OD)

У кульовому млині з мішалкою перемелювали 20 мас.ч. сполуки відповідно до винаходу з додаванням диспергатора, змочувального агента і води або органічного розчинника, одержуючи тонкодисперсну суспензію активного інгредієнта. Розведення водою приводить до стабільної суспензії активного інгредієнта.

F. Гранули, які диспергуються у воді, та розчинні у воді гранули (WG)

50 мас.ч. сполуки відповідно до винаходу тонко подрібнювали з додаванням диспергаторів і змочувальних агентів і перетворювали у гранули, які диспергуються у воді або розчинні у воді гранули за допомогою технічних засобів (наприклад, екструзією, в скрубєрі із розбризкувальним пристроєм, у псевдозрідженому шарі). Розведення водою дає стабільну дисперсію або розчин активного інгредієнта.

G. Порошки, що диспергуються у воді, та розчинні у воді порошки (WP, SP)

75 мас.ч. сполуки відповідно до винаходу подрібнювали в роторно-статорному млині при додаванні диспергатора, змочувальних агентів та силікагелю. Розведення водою приводить до стабільної дисперсії або розчину активного інгредієнта.

2. Продукти, що застосовуються нерозбавленими

H. Розпилювані порошки (DP)

5 мас.ч. сполуки відповідно до винаходу тонко подрібнювали та ретельно змішували з 95% тонко подрібненого каоліну. У результаті одержували розпилюваний продукт.

I. Гранули (GR, FG, GG, MG)

0,5 мас.ч. сполуки відповідно до винаходу тонко подрібнювали та вводили в контакт із 95,5% носіїв. Сучасними методами є екструзія, сушіння

розпилюванням або обробка у псевдозрідженому шарі. У результаті одержують гранули, які застосовують нерозбавленими.

Ж. Ультразвукооб'ємні розчини (UL)

10 мас.ч. сполуки відповідно до винаходу розчиняють в органічному розчиннику, наприклад, ксилолі. У результаті одержують продукт, який застосовують нерозбавленим.

Активні інгредієнти можуть бути використані як такі, у формі їх композицій або форм застосування, одержаних з них, наприклад, у формі призначених для безпосереднього обприскування розчинів, порошоків гелів, суспензій або дисперсій, емульсій, масляних дисперсій, паст, розпилюваних продуктів, матеріалів для розкидання, або гранул, мікрокапсул (CS), балабушок або таблеток, шляхом розбризкування, розпилення, опудрювання, розкидання або поливу. Форми застосування повністю залежать від намічених цілей; передбачається, що необхідно забезпечити в кожному випадку найбільш можливий тонкодисперсний розподіл активних інгредієнтів відповідно до винаходу.

Водні форми використання можуть бути приготувані з емульсійних концентратів, паст або змочувальних порошоків (порошки для розпилення, масляні дисперсії) шляхом додавання води. Для одержання емульсій, паст або масляних дисперсій речовини як такі або розчинені в маслі або розчиннику, можуть бути гомогенізовані у воді за допомогою змочувальних агентів, реагенту, що надає клейкості, диспергатора або емульгатора. Альтернативно, можна приготувати концентрати, які складаються з активної речовини, змочувального агента, реагенту, що надає клейкості, диспергатора або емульгатора та, при необхідності, розчинника або масла, причому такі концентрати придатні для розведення водою.

Концентрації активного інгредієнта в готових до використання продуктах можуть змінюватися у відносно широкому інтервалі. Загалом, вони перебувають у межах від 0,0001 до 10 %, краще від 0,01 до 1%.

Активні інгредієнти можуть також з успіхом застосовуватися в ультразвукооб'ємному способі (ULV), у якому можливо застосовувати склади, які містять понад 95 мас.% активного інгредієнта або навіть застосовувати активний інгредієнт без домішок.

Різні типи масел, змочувальних агентів, ад'ювантів, гербіцидів, фунгіцидів, інших пестицидів або бактерицидів можуть додаватися до активних інгредієнтів, при необхідності, безпосередньо перед застосуванням. Ці агенти звичайно змішують із агентами відповідно до винаходу у масовому співвідношенні від 1:10 до 10:1.

Сполуки формули I є ефективними при прямому і при опосередкованому впливі, при прийомі з їжею, а також при взаємній годівлі та перенесенні.

Кращі способи застосування полягають у внесенні у водойми, у ґрунт, щілини та тріщини, на пасовища, у компостні купи, каналізаційні мережі, у воду, на підлогу, стіни або шляхом

розбризкування за периметром, а також у приманках.

Відповідно до кращого втілення винаходу сполуки формули I застосовують шляхом внесення в ґрунт. Внесення в ґрунт є особливо придатним для використання проти мурах, термітів, ос, цвіркунів або тарганів.

Відповідно до іншого кращого втілення винаходу для застосування несільськогосподарських шкідників, таких як мурахи, терміти, оси, мухи, москіти, цвіркуні, сарана, таргани та лускавиця домашня, сполуки формули I застосовують у вигляді складів приманок.

Приманка може бути рідкою, твердою або напівтвердою композицією (наприклад, гелем). Тверді приманки можуть бути сформовані в різні виробі та форми, придатні для відповідного застосування, наприклад, гранули, блоки, бруски, диски. Рідкі приманки можуть бути налиті в різні пристрої для забезпечення належного застосування, наприклад, відкриті контейнери, обприскувачі, джерела крапель або джерела-випарники. Гелі можуть бути на основі водної або масляної матриць і можуть бути введені в склади для конкретного використання на основі їх липкості, вологозатримання або характеристик старіння. Приманкою, застосовуваною в композиції, є продукт, який є в достатньому ступені притягальним для збудження комах, таких як мурахи, терміти, оси, мухи, москіти, цвіркуні й т.п., або для спонукання тарганів до поїдання нього. Такий аттрактант може бути вибраний з харчових стимуляторів або пара- й/або статевих феромонів. Придатні харчові стимулятори вибирають, наприклад, із тваринних і/або рослинних білків (м'ясного, рибного або кров'яного кормового борошна, частин комах, порошку з цвіркунів, яєчного жовтка), з жирів і масел тваринного і/або рослинного походження, або моно-, оліго- або поліорганосахаридів, зокрема, із сахарози, лактози, фруктози, декстрози, глюкози, крохмалю, пектину або навіть меляси або меду, або із солей, таких як сульфат амонію, карбонат амонію або ацетат амонію. Свіжі або загниваючі частини фруктів, сільськогосподарських культур, рослин, тварин, комах або їх особливі частини також можуть бути харчовим стимулятором.

Феромони, як відомо, більше є спеціальним засобом для комах. Конкретні феромони описані в літературі та відомі спеціалісту в даній галузі.

Композиції сполук формули I у вигляді аерозолів (наприклад, в аерозольних балончиках), масляних спреїв або пульверизаторів у значній мірі придатні для непрофесійного користувача для боротьби із шкідниками, такими як мухи, блохи, кліщі, москіти, сарана або таргани. Аерозольні засоби переважно складаються з активної сполуки, розчинників, таких як нижчі спирти (наприклад, метанол, етанол, пропанол, бутанол), кетони (наприклад, ацетон, метил етил кетон), парафінові вуглеводні (наприклад, гас), які мають температурний інтервал кипіння від приблизно 50 до 250°C, диметилформамід, N-метилпіролідон, диметилсульфоксид, ароматичні вуглеводні, такі

як толуол, ксилол, вода, та, крім того, допоміжні речовини, такі як емульгатори, наприклад, моноолеат сорбіту, олеїлетоксилат, який має 3-7 моль етиленоксиду, етоксилат жирного спирту, парфумерні масла, такі як ефірні масла, ефіри середніх жирних кислот з нижчими спиртами, ароматичні карбонільні сполуки, якщо це доцільно, стабілізатори, такі як бензоат натрію, амфотерні поверхнево-активні речовини, нижчі епоксиди, триетилортоформіат та, у разі потреби, пропеленти, такі як пропан, бутан, азот, стиснене повітря, диметилловий ефір, діоксид вуглецю, оксид азоту або суміш цих газів.

Масляні композиції, що розприскуються, відрізняються від аерозольних сполук тим, що в них не використовуються пропеленти.

Сполуки формули I та їх відповідні композиції можуть також застосовуватися в москітних спіральках та обкурюваних спіральках, димових шашках, випарних пластинках, довгострокових випарниках або в інших незалежних від нагрівання випарних системах.

Способи боротьби з інфекційними захворюваннями, які передаються комахами (наприклад, малярією, тропічною пропасницею та жовтою пропасницею, лімфатичним філяріозом та лейшманіозом), за допомогою сполук формули I, а також їх відповідних композицій полягають в обробці поверхонь бараків і будинків, шляхом розбризкування стисненим повітрям і просочування занавісок, наметів, предметів обмундирування, ліжкових сіток, пасток для мух це-це і т.п. Інсектицидні композиції для застосування до ниток, тканин, трикотажних виробів, нетканих матеріалів, сітчастих матеріалів або фольги та брезентів бажано містять суміш, яка включає інсектицид, необов'язково, репелент та, щонайменше, одну сполучну речовину.

Просочування занавісок і ліжкових сіток головним чином здійснюють шляхом занурення текстильного матеріалу в емульсію або дисперсію інсектициду або шляхом розбризкування їх на полотна.

Наведений далі перелік пестицидів, разом з якими можуть використовуватися сполуки формули I, ілюструє можливі комбінації, але не носить обмежувачий характер:

Органофосфати: Ацефат, Азинфос-метил, Хлорпірифос, Хлорфенвінфос, Діазинон, Дихлорвос, Дикротофос, Диметоат, Дисульфотон, Етіон, Фенітротіон, Фентіон, Ізоксатіон, Малатіон, Метамідофос, Метидатіон, Метил-Паратіон, Метилпаратіон, Мевінфос, Монокротофос, Оксидеметон-метил, Параоксон, Паратіон, Пентоат, Фозалон, Фосмет, Фосфамідон, Форат, Фоксим, Піриміфос-метил, Профенофос, Протіофос, Сульпрофос, Тербуфос, Триазофос, Трихлорфон;

Карбамати: Аланікарб, Бенфурбакарб, Карбарил, Карбосульфат, Феноксикарб, Фуратіокарб, Індоксикарб, Метіокарб, Метоміл, Оксаміл, Піримікарб, Пропоксур, Тіодикарб, Триазамат;

Піретроїди: Біфентрин, Цифлутрин, Циперметрин, альфа-Циперметрин,

Дельтаметрин, Есфенвалерат, Етофенпрокс, Фенпропатрин, Фенвалерат, Цихалотрин, Лямбда-Цихалотрин, Перметрин, Силафлуофен, Тау-Флувалінат, Тефлутрин, Тралометрин, Зета-Циперметрин;

Регулятори росту членистоногих: а) інгібітори синтезу хітину: бензоїлсечовини: Хлорфлуазурон, Дифлубензурон, Флуциклоксурон, Флуфеноксурон, Гексафлумурон, Лufenурон, Новалурон, Тефлубензурон, Трифлумурон; Бупрофезин, Діофенолан, Гекситіазокс, Етоксазол, Клофентазин; б) антагоністи екдизону: Галофенозид, Метоксифенозид, Тебуфенозид; с) ювеніди: Пірипроксифен, Метопрен, Феноксикарб; d) інгібітори біосинтезу ліпідів: Спіродиклофен;

Неонікотиніди: Ацетаміпрід, Клотіанідин, Флонікамід, Імідаклопрід, Нітенпірам, Тіаклопрід, Тіаметоксам;

Різні: Абаментин, Ацехіноцил, Амітраз, Азатірактин, Біфеназат, *Bacillus thuringiensis*, *Bacillus subtilis*, Картап, Хлорфенаніп, Хлордиформ, Циромазин, Діафентіурон, Динетофурон, Діофенолан, Емаментин, Ендосульфат, Етіпрол, Феназахін, Фіпроніл, Форметанат, Форметанату гідрохлорид, Гідраметилнон, Індоксикарб, 4-((2Z)-2-((4-(трифторметокси)аніліно)карбоніл)гідрозоно)-2-[3-(трифторметил)-феніл]етил]бензонітріл, Піридабен, Піметрозин, Спіносад, Сірка, Тебуфенпірад, Тіаметоксам та Тіоциклам.

З комахами можна боротися шляхом обробки знищеного паразита/шкідника, його їжі, середовища перебування, середовища розмноження або його осередку пестицидно ефективною кількістю сполук або композицій формули I.

Під "осередком" розуміють середовище перебування, середовище розмноження, ґрунт, площу, матеріал або середовище, у якій шкідник або паразит росте або може рости.

Загалом, "пестицидно ефективна кількість" означає кількість активного інгредієнта, необхідна для досягнення помітного впливу на ріст, включаючи ефекти некрозу, смерті, затримки в розвитку, запобігання та усунення, знищення або іншого скорочення появи та активності знищуваних організмів. Пестицидно ефективна кількість може відрізнятися для різних сполук/композицій, використовуваних у даному винаході. Пестицидно ефективна кількість композицій також буде відрізнятися залежно від основних умов, таких як бажаний пестицидний ефект і тривалість, погодні умови, вид знищуваного шкідника, осередок, спосіб нанесення та подібні.

Сполуки формули I та їх композиції можуть використовуватися для захисту деревних матеріалів, таких як дерева, дощаті забори, шпалы, і т.д., а також будинків, таких як житлові будинки, надвірні будови, виробничі будови, а також будівельних матеріалів, меблів, шкіряних виробів, волокон, вінілових виробів, електричних дротів та кабелів і т.д. від мурах і/або термітів, а також для запобігання нанесення мурахами і

термітами шкоди сільськогосподарським культурам або людям (наприклад, коли шкідники вторгаються у вдома та суспільні будинки). Сполуки формули I наносяться не тільки на навколишню поверхню ґрунту або на ґрунт, який перебуває під підлогою, для захисту дерев'яних матеріалів, але також можуть наноситися на пиломатеріали, зокрема на бетонні поверхні під підлогою, на опори в нішах, бруси, багаточасову фанеру, меблі, і т.д., дерев'яні вироби, такі як дошки, півдюймові дошки, і т.д. та вінілові вироби, такі як ізолюваний електричний дріт, вінілові листи, теплоізоляційні матеріали, такі як стирольні піни, і т.д. У випадку застосування винаходу проти мурах, які наносять шкоду сільськогосподарським культурам або людям, композицію для боротьби із шкідниками відповідно до винаходу наносять безпосередньо на гніздо мурах або на місця поблизу такого гнізда, або ж використовують як приманку.

Сполуки або композиції відповідно до винаходу можуть наноситися як профілактика на місця, у яких очікується поява шкідників.

У випадку обробки ґрунту або у випадку нанесення на місце зосередження шкідників або їх гніздо, кількість активного інгредієнта становить від 0,0001 до 500г на 100м², краще від 0,001 до 20г на 100м². Особливо кращим варіантом даного винаходу є обробка ґрунту для боротьби з термітами (Isoptera).

Звичайні норми витрати для захисту матеріалів становлять, наприклад від 0,01г до 1000г активної сполуки на м² оброблюваного матеріалу, бажано від 0,1г до 50г на м².

Інсектицидні композиції для використання в просочуванні матеріалів звичайно містять від 0,001 до 95 мас.%, краще від 0,1 до 45 мас.%, та більш краще від 1 до 25 мас.% щонайменше одного репеленту і/або інсектициду.

При використанні композицій у приманках звичайний вміст активного інгредієнта становить від 0,0001 мас.% до 15 мас.%, бажано від 0,001 мас.% до 5 мас.% активної сполуки. Використовувана композиція також може містити інші домішки, такі як розчинник для активного матеріалу, смакова домішка, консервант, барвник або гірка домішка. Її привабливість може також бути підвищена за рахунок спеціально підібраних кольорів, форми або текстури.

При використанні композицій у спреях вміст активного інгредієнта становить від 0,001 до 80 мас.%, краще від 0,01 до 50 мас.%, та найбільш краще від 0,01 до 15 мас.%.

Приклади впливу на шкідників

Методика досліджень

1. Активність проти мурах аргентинських, мурах-женців, мурах-акробатів, мурах-деревоточців, вогненних мурах, мух кімнатних, жигалок звичайних, сірих м'ясних мух, амарильозних москітів, кулексів, малярійних комарів, рудих тарганів, котячих бліх і рудих іксодових собаків кліщів через контакт зі склом. Скляні пробірки (сцинтиляційні флакони об'ємом 20мл) обробляли за допомогою 0,5мл розчину активного інгредієнта в ацетоні. Кожну пробірку

провертали без накривання протягом близько 10 хвилин для того, щоб розчин повністю покрив її поверхню, а ацетон повністю висох. Комах або кліщів поміщали в кожну пробірку. Пробірки зберігали при температурі 22°C та спостерігали за ефектами такої обробки в різні проміжки часу. Результати представлені в Таблиці I.

2. Активність проти аргентинських мурах, мурах-акробатів, мурах-деревоточців, вогненних мурах і жовтоногих термітів через контакт із ґрунтом

Для мурах дослідження проводили в чашках Петрі. Чашки заповнювали тонким шаром 1% агару у воді, і поверх агару розподіляли піщаний ґрунт із Флориди (5г для маленьких чашок та 11г для більших чашок). Активний інгредієнт розчиняли в ацетоні та розподіляли по поверхні піску. Чашки продували, щоб випарувався ацетон, запускали в них мурах і накривали. У кожну чашку додавали 20%-й розчин меду у воді. Чашки зберігали при температурі 22°C та спостерігали за смертністю в різні проміжки часу.

Для термітів, чашки заповнювали тонким шаром 1% агару. Поверх агару розподіляли тонким шаром попередньо оброблений ґрунт. Для обробки ґрунту активний інгредієнт розбавляли ацетоном на основі масового співвідношення та додавали до 100г ґрунту. ґрунт поміщали в ємність і продували протягом 48 годин. Рівень вологості ґрунту був установлений на рівні польової вологоємності шляхом додавання 7мл води. У кожну чашку запускали термітів-робітників. Через 1 день у кожну чашку клали маленький шматочок фільтрувального паперу як джерело їжі, по необхідності додавали додаткову кількість води для підтримки вологості ґрунту. Використовувані в тесті чашки зберігали в темному інкубаторі при 25°C та відносній вологості приблизно 80%. За термітами спостерігали щодня для визначення смертності (мертві особини та нездатні стояти прямо, які проявляють тільки слабкі ознаки рухів). Результати представлені в Таблиці I.

3. Активність проти аргентинських мурах, мурах-акробатів, мурах-деревоточців, вогненних мурах, кімнатних мух, жовтоногих термітів, формозанських носатих термітів і рудих тарганів через пастку.

Для аргентинських мурах, мурах-акробатів і мурах-деревоточців досліди проводили в чашках Петрі. Мурахам забезпечували джерело води, і після цього позбавляли джерела їжі на 24 години. Пастки містили або 20% розчин меду у воді, або розмелений корм для кішок. У пастку додавали розчин активного інгредієнта в ацетоні. У кожну чашку додавали 0,2мл обробленого розчину меду у воді або 150мг обробленого котячого корму, поміщеного в ковпачок. Чашки накривали та зберігали при температурі 22°C. За смертністю мурах спостерігали щодня. Результати представлені в Таблиці I.

Для вогненних мурах як матриця для приманки використали кукурудзяну крупу. Пастку з кукурудзяною крупою одержували шляхом використання суміші знежиреної кукурудзяної крупи (80%), соєвого масла (19,9%), ацетону та

активного інгредієнта (0,1%). Чашки Петрі забезпечувалися джерелами води. У кожну чашку запускали дорослих особин вогнених мурах. Наступного дня в чашки ставили контейнери з пастками, які містять 250г приманної суміші. За смертністю мурах спостерігали щодня. Результати представлені в Таблиці I.

Для кімнатних мух дослідження проводили на дорослих мухах у віці 2-5 днів після вилуплення. До матриці пастки, що містить суміш сухого молока та цукру в співвідношенні 1:1 додавали розчин активного інгредієнта в ацетоні, і суміші давали просохнути. Аналізи проводили в ємностях, що містять 250мг приманки в тарілці, поміщеної на дно кожної такої ємності. Кімнатних мух запускали в ємності із приманками, і ємності закривали. Дослідні ємності зберігали при 22°C. За ємностями спостерігали через 4 години після обробки для визначення смертності (смертність плюс захворюваність (нездатність підтримувати вертикальне положення)). Результати представлені в Таблиці I.

У випадку з термітами розчин активного інгредієнта в ацетоні наносили на фільтрувальний папір. Процентний вміст активного інгредієнта розраховували, виходячи з маси фільтрувального паперу. Ацетон застосовували тільки до необроблених контрольних зразків. Оброблений папір продували для випарювання ацетону, зволожували мл води та поміщали в чашки Петрі, заповнені піском. При необхідності під час дослідження додавали воду. Біологічний аналіз проводили з використанням одного обробленого фільтра та приблизно 30 термітів-робітників на тестову чашку. Тестові чашки зберігали при 25°C та відносній вологості приблизно 85% і щодня спостерігали за смертністю (мертві або захворілі комахи) або інтоксикацією. Мертвих або захворілих комах видаляли щодня. Результати представлені в Таблиці I.

Для тарганів як дослідні ємності використали коробки для тарганів з вентиляційними кришками. Верхні 3-4см таких коробок обробляли вазеліном і мінеральним маслом, щоб запобігти можливості втечі. У міру необхідності додавали воду. Приманку готували, використовуючи розмелений котячий корм, і додавали розчин активного інгредієнта в ацетоні на основі масового співвідношення. Обробленому корму давали просохнути. Тарганів запускали в коробки та позбавляли джерела їжі на 24 години перед внесенням приманки. На терезах зважували по 0,03 грам приманки на коробку. Коробки зберігали при 22°C та за смертністю тарганів спостерігали щодня. Результати представлені в Таблиці I.

4. Активність проти амарильозних москітів, п'ятисмужкових комарів та личинок малярійних комарів через обробку води.

Як тестові ємності використовували планшети з комірками. Активний інгредієнт розчиняли в ацетоні та розбавляли водою для одержання необхідних концентрацій. Одержаний розчин, який містить приблизно 1% ацетону додавали в кожну комірку. У кожну комірку додавали 10 личинок комарів (4-а личинкова стадія) в 1мл води.

Личинок щодня підгодовували однією краплею печінкового порошку. Чашки накривали та зберігали при 22°C. Смертність аналізували щодня, а також видаляли мертвих личинок і живих або мертвих лялечок. Наприкінці тесту живих личинок, що залишилися, рахували та визначали відсоток смертності. Результати представлені в Таблиці I.

Кожний тест повторювали, щонайменше, тричі.

Результати

Тести, проведені зі сполуками формул 1-1 та I-2, показали наступні результати:

Активність проти різних рядів

Загальноприйнята назва шкідника	Латинська назва шкідника	Н
Активність через контакт зі склою		
аргентинська мураха	<i>Linepithema humile</i>	10
мураха-жнець	<i>Pogonomyrmex Californicus</i>	10
мураха-акробат	<i>Crematogaster spp.</i>	10
мураха-деревооточець	<i>Camponotus flohdanus</i>	10
вогненна мураха	<i>Solenopsis invicta</i>	10
муха кімнатна	<i>Musca domestica</i>	10
жигалка звичайна	<i>Stomoxys calcitrans</i>	10
сіра м'ясна муха	<i>Sarcophaga sp.</i>	10
амарильозний москіт	<i>Aedes aegypti</i>	10
кулекс	<i>Culex quinquefasciatus</i>	0,5
малярійний комар	<i>Anopheles albimanus</i>	1
рудий тарган	<i>Blattella germanica</i>	100
котяча блоха	<i>Ctenocephalides felis</i>	100
рудий іксодовий собачий кліщ	<i>Rhipicephalus sanguineus</i>	10
Активність через контакт із ґрунтом		
аргентинська мураха	<i>Linepithema humile</i>	0,1
мураха-акробат	<i>Crematogaster spp.</i>	0,0
мураха-деревооточець	<i>Camponotus floridanus</i>	0,0
вогненна мураха	<i>Solenopsis invicta</i>	0,0
жовтоногий терміт	<i>Reticulitermes flavipes</i>	0,00
Активність через приманку		
аргентинська мураха	<i>Linepithema humile</i>	1,0
мураха-акробат	<i>Crematogaster spp.</i>	1,5
мураха-деревооточець	<i>Camponotus floridanus</i>	2,0
вогненна мураха	<i>Solenopsis invicta</i>	0,7
муха кімнатна	<i>Musca domestica</i>	0,1
жовтоногий терміт	<i>Reticulitermes flavipes</i>	0,1
формозанський носатий терміт	<i>Coptotermes formosanus</i>	0,1
рудий тарган	<i>Blattella germanica</i>	0,3
Активність через обробку води		
амарильозний москіт	<i>Aedes aegypti</i>	1,0
кулекс	<i>Culex quinquefasciatus</i>	1,0
малярійний комар	<i>Anopheles albimanus</i>	1,0