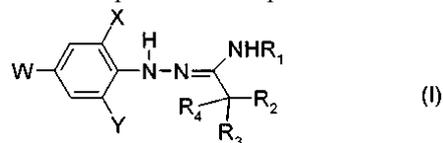


Настоящее изобретение относится к применению производных гидразина формулы (I)



в которой W означает хлор или трифторметил;

X и Y каждый независимо означают хлор или бром;

R<sup>1</sup> означает C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>алкенил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>алкинил или C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкил, который может быть замещен 1-3 атомами галогена или C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>алкил, который замещен C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкокси;

R<sub>2</sub> и R<sub>3</sub> означают C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкил или, взятые вместе, могут образовывать C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкил, который может быть незамещенным или замещенным 1-3 атомами галогена;

R<sub>4</sub> означает водород или C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкил,

или их энантиомеров, или их солей для борьбы с несельскохозяйственными вредителями.

Изобретение также относится к способу борьбы с несельскохозяйственными вредителями, включающему обработку вредителей или их пищи, мест обитания, мест размножения или очагов пестицидно эффективным количеством соединения формулы (I).

Изобретение также относится к композициям, содержащим соединения формулы (I) в пестицидно эффективных количествах для борьбы с несельскохозяйственными вредителями.

Изобретение, кроме того, относится к применению соединений формулы (I) для защиты неживых органических материалов от несельскохозяйственных вредителей.

Типичными проблемами, возникающими при использовании доступных в настоящее время средств для борьбы с несельскохозяйственными вредителями, такими как пиретроиды, являются, например, устойчивость вредителей или неблагоприятные экологические или токсикологические свойства. Другая встречающаяся проблема касается необходимости иметь доступные средства для борьбы с несельскохозяйственными вредителями, препараты для борьбы с вредителями, которые были бы эффективны против широкого спектра несельскохозяйственных вредителей. Следовательно, существует необходимость в новых и улучшенных средствах для борьбы с несельскохозяйственными вредителями, которые преодолевают эти проблемы.

Поэтому целью настоящего изобретения является разработка новых средств для борьбы с несельскохозяйственными вредителями, предпочтительно проявляющих расширенный спектр пестицидного действия.

Было обнаружено, что данные цели достигаются применением соединений формулы (I) и композиций, содержащих их.

Несельскохозяйственными вредителями являются вредители классов Chilopoda и Diplopoda и отрядов Isoptera, Diptera, Blattaria (Blattodea), Dermaptera, Hemiptera, Hymenoptera, Orthoptera, Siphonaptera, Thysanura, Phthiraptera, Araneida, Parasitiformes и Acaridida.

Соединения формулы (I) особенно пригодны для эффективной борьбы со следующими вредителями:

сороконожки (Chilopoda), например *Scutigera coleoptrata*;

многоножки (Diplopoda), например *Narceus* spp.;

паукообразные (Araneida), например *Latrodectus mactans* и *Loxosceles reclusi*;

клещи (Acaridida): например *sarcoptes* sp.;

клещи и клещи паразитиформные (Parasitiformes): иксодовые клещи (Ixodida), например *Ixodes scapularis*, *Ixodes holocyclus*, *Ixodes pacificus*, *Rhiphicephalus sanguineus*, *Dermacentor andersoni*, *Dermacentor variabilis*, *Amblyomma americanum*, *Amblyomma maculatum*, *Ornithodoros hermsi*, *Ornithodoros turicata* и паразитиформные клещи (Mesostigmata), например, *Ornithonyssus bacoti* и *Dermanyssus gallinae*;

термиты (Isoptera), например *Caloterms flavicollis*, *Leucotermes flavipes*, *Heterotermes aureus*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes virginicus*, *Reticulitermes lucifugus*, *Termes natalensis* и *Coptotermes formosanus*;

тараканы (Blattaria - Blattodea), например *Blattella germanica*, *Blattella asahinae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta japonica*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Periplaneta australasiae* и *Blatta orientalis*;

двукрылые, комары (Diptera), например *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*, *Dermatobia hominis*, *Fannia canicularis*, *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Glossina palpalis*, *Glossina fuscipes*, *Glossina tachinoides*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hippelates* spp., *Hypoderma 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* и *Tabanus similis*;

кожистокрылые (Dermaptera), например *forficula auricularia*;

полужесткокрылые (Hemiptera), например *Cimex lectularius*, *Cimex hemipterus*, *Reduvius senilis*, *Triatoma* spp., *Rhodnius prolixus* и *Arilus critatus*;

муравьи, пчелы, осы, пилильщики (Hymenoptera), например *CreMATogaster* spp., *Hoplocampa minuta*, *Hoplocampa testudinea*, *Monomorium pharaonis*, *Solenopsis geminata*, *Solenopsis invicta*, *Solenopsis richteri*, *Solenopsis xyloni*, *Pogonomyrmex barbatus*, *Pogonomyrmex californicus*, *Dasymutilla occidentalis*, *Bombus* spp. *Vespula squamosa*, *Paravespula vulgaris*, *Paravespula pennsylvanica*, *Paravespula germanica*, *Dolichovespula maculata*, *Vespa crabro*, *Polistes rubiginosa*, *Camponotus floridanus* и *Linepithema humile*;

сверчки, кузнечиковые, саранчовые (Orthoptera), например *Acheta domestica*, *Gryllotalpa gryllotalpa*, *Locusta migratoria*, *Melanoplus bivittatus*, *Melanoplus femurrubrum*, *Melanoplus mexicanus*, *Melanoplus sanguinipes*, *Melanoplus spretus*, *Nomadacris septemfasciata*, *Schistocerca americana*, *Schistocerca gregaria*, *Dociostaurus maroccanus*, *Tachycines asynamorus*, *Oedaleus senegalensis*, *Zonozerus variegatus*, *Hieroglyphus daganensis*, *Kraussaria angulifera*, *Calliptamus italicus*, *Chortoicetes terminifera* и *Locustana pardalina*;

блохи (Siphonaptera), например *Stenocephalides felis*, *Stenocephalides canis*, *Xenopsylla cheopis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans* и *Nosopsyllus fasciatus*;

чешуйница обыкновенная, термобия домашняя (*Thysanura*), например *Lepisma saccharina* и *Thermobia domestica*,

вши (Phthiraptera), например *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pthirus pubis*, *Haematopinus euryternus*, *Haematopinus suis*, *Linognathus vituli*, *Bovicola bovis*, *Menopon gallinae*, *Menacanthus stramineus* и *Solenopotes capillatus*.

Производные гидразина формулы (I), которые могут быть использованы согласно изобретению, известны из EP-A-604798 и могут быть получены в соответствии со способами получения, описанными или упомянутыми в этом документе. Этот документ относится к защите растений в сельском хозяйстве и описывает инсектицидную и акарицидную активность соединений формулы (I) и других соединений против вредителей сельскохозяйственных растений отрядов Coleoptera, Lepidoptera и Acarina.

В работе J.A. Furch и др., "Amidrazones: A New Class of Coleopteran Insecticides", ACS Symposium Series 686, Am. Chem. Soc., 1998, глава 18, с. 178 и далее иллюстрируется применение определенных амидразонов против кукурузного жука диабротика, некоторые из этих амидразонов являются соединениями формулы (I). Сообщается, что эти соединения уничтожают в особенности определенные виды жесткокрылых насекомых, будучи в то же время менее токсичными или нетоксичными к Lepidoptera и другим насекомым, таким как Acarina.

В работе D.G. Kuhn и др., "Cycloalkyl-substituted Amidrazones: A Novel Class of Insect Control Agents", ACS Symposium Series 686, Am. Chem. Soc., 1998, глава 19, с. 185 и далее сообщается, что определенные амидразоны, некоторые из этих амидразонов являются соединениями формулы (I), в которой R<sup>2</sup> и R<sup>3</sup> вместе образуют циклопропильное кольцо, являются активными против определенных отрядов Coleoptera и Lepidoptera. Биологические испытания показывают, что соединения являются вполне селективными, только некоторые проявляют высокую активность как против Coleoptera, так и против Lepidoptera.

Активность соединения против насекомых для защиты растений в сельском хозяйстве, т.е. против вредителей растений, в целом не предполагает активности этого растения против несельскохозяйственных вредителей. Борьба с вредителями растений всегда является частью защиты растений. Напротив, борьба с несельскохозяйственными вредителями, например, относится к защите неживых органических материалов, или гигиене и профилактике заболеваний (здравоохранение).

Различия в требуемых средствах для борьбы с сельскохозяйственными/несельскохозяйственными вредителями в целом и преимущественно - кроме возможных различий в биохимических целях - возникают из различий в пище и/или местах обитания вредителей.

Сельскохозяйственные вредители подобно отряду Homoptera паразитируют на зеленых частях растений, прокалывая их и высасывая жидкость из растений. Другие сельскохозяйственные вредители отрядов Lepidoptera и Coleoptera паразитируют на зеленых частях растений, объедая их. Напротив, несельскохозяйственные вредители не обитают на растениях и не питаются зелеными частями растений или только в редких случаях поедают их. Несельскохозяйственные вредители, например, паразитируют на неживых органических материалах, таких как дома, одежда и пища и т.д. людей и животных, а также на электрических проводах и т.д., вводя, таким образом, патогенные микроорганизмы в окружающую людей среду и разрушая их дома и пищу. Примером являются термиты (отряда Isoptera), которые, главным образом, питаются целлюлозой, которая является основным компонентом древесных изделий и бумажной продукции. Другим примером являются комары (отряда Diptera), чьи личинки питаются микроорганизмами и органическими веществами в воде и чьи взрослые особи питаются кровью.

Необходимо, чтобы свойства пестицидов были адаптированы к их конкретному использованию. Системные пестициды, например, которые в силу их растворимости в воде попадают в части растений, являются пригодными для борьбы с колюще-сосущими или объедающими (т.е. растения) вредителями. Однако следует ожидать, что они не могут проявлять такую же активность против несельскохозяйствен-

ных вредителей, которые не поедают зеленые части растений, но с которыми борются по большей части с помощью нерастворимых в воде пестицидов в системах ловушек или путем непосредственной обработки. В большинстве случаев пестициды для борьбы с сельскохозяйственными вредителями не пригодны для борьбы с несельскохозяйственными вредителями и наоборот. Примерами являются имеющиеся в продаже инсектициды пиримикарб, ацефат, пиримидивен и пиридабен. Они являются активными против сельскохозяйственных насекомых, но проявляют низкую активность против несельскохозяйственных вредителей.

Подводя итоги, специалист из предыдущего уровня техники может сделать вывод, что имидразоны формулы (I) и подобные структуры проявляют селективную активность против определенных сельскохозяйственных вредителей отрядов Coleoptera или Lepidoptera и что незначительные изменения в структуре оказывают очень сильное влияние на селективность.

Неожиданно было обнаружено, что определенная группа имидразонов, а именно соединения формулы (I), проявляют широкий спектр действия против несельскохозяйственных вредителей.

Соединения формулы (I) и композиции, содержащие их, являются особенно пригодными для борьбы с вредителями классов Chilopoda и Diplopoda.

Соединения формулы (I) и композиции, содержащие их, являются особенно пригодными для борьбы с вредителями из отрядов Isoptera, Blattaria (Blattodea), Diptera, Dermaptera, Hemiptera, Hymenoptera, Orthoptera, Siphonaptera, Thysanura и Phthiraptera.

Кроме того, соединения формулы (I) и композиции, содержащие их, являются особенно пригодными для борьбы с вредителями из отрядов Parasitiformes, Araneida и Acaridida.

Более того, соединения формулы (I) и композиции, содержащие их, являются особенно пригодными для борьбы с вредителями из отрядов Isoptera, Blattaria (Blattodea), Diptera, Hymenoptera, Siphonaptera, Orthoptera и Ixodida.

Более конкретно, соединения формулы (I) и композиции, содержащие их, являются особенно пригодными для борьбы с вредителями из отрядов Isoptera, Blattaria (Blattodea), Diptera, Hymenoptera и Siphonaptera.

В частности, соединения формулы (I) и композиции, содержащие их, являются пригодными для борьбы с 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, Anaxyelidae, Cephidae, Aphidiidae, Formicidae, Vespoidea, Sphecidae) и Siphonaptera (Pulicidae, Rhopalopsyllidae, Ceratophyllidae).

Кроме того, особенно предпочтительным является применение соединений формулы (I) и композиций, содержащих их, к вредителям отряда Isoptera.

Применение соединений формулы (I) и композиций, содержащих их, к вредителям отрядов Blattaria/Blattodea является другим предпочтительным воплощением настоящего изобретения.

Кроме того, применение соединений формулы (I) и композиций, содержащих их, к вредителям отряда Hymenoptera, главным образом к муравьям, является особенно предпочтительным.

Применение соединений формулы (I) и композиций, содержащих их, к вредителям отряда Diptera, в особенности, к мухам и мосkitам, является другим предпочтительным воплощением настоящего изобретения.

Кроме того, применение соединений формулы (I) и композиций, содержащих их, к вредителям отряда Orthoptera является особенно предпочтительным.

Более того, особенно предпочтительным является применение соединений формулы (I) и композиций, содержащих их, к вредителям отряда Siphonaptera.

Применение соединений формулы (I) и композиций, содержащих их, к вредителям отряда Ixodida, в особенности, к мухам и мосkitам, является другим предпочтительным воплощением настоящего изобретения.

Кроме того, применение соединений формулы (I) и композиций, содержащих их, к вредителям отряда Mesostigmata является дальнейшим предпочтительным воплощением настоящего изобретения.

Кроме того, применение соединений формулы (I) и композиций, содержащих их, к вредителям отряда Acaridida является еще одним предпочтительным воплощением настоящего изобретения.

В предпочтительном воплощении настоящего изобретения соединения формулы (I) и композиции, содержащие их, применяют для защиты неживых органических материалов, включая, но не ограничиваясь ими: домашние продукты, такие как жиры, масла, моно-, олиго- или полиорганосахариды, белки или свежие или увядшие фрукты; материалы, содержащие целлюлозу, например древесные материалы, такие как жилые дома, деревья, дощатые заборы или шпалы, а также бумага; а также конструкционные материалы, мебель, кожаные изделия, животные, растительные и синтетические волокна, виниловые изделия, электрические провода и кабели, а также стирольные пены.

Более предпочтительно, соединения формулы (I) и композиции, содержащие их, применяют для защиты неживых органических материалов от несельскохозяйственных вредителей, выбранных из группы, состоящей из класса Diplopoda и отрядов Isoptera, Diptera, Blattaria (Blattodea), Dermaptera, Hemiptera,

Hymenoptera, Orthoptera и Thysanura.

Настоящее изобретение также относится к способу защиты неживых органических материалов от несельскохозяйственных вредителей, предпочтительно от несельскохозяйственных вредителей, выбранных из группы, состоящей из класса Diplopoda и отрядов Isoptera, Diptera, Blattaria (Blattodea), Dermaptera, Hemiptera, Hymenoptera, Orthoptera и Thysanura, который включает обработку вредителей или их пищи, мест обитания, мест размножения, их очага (скопления) или самих неживых органических материалов пестицидно эффективным количеством соединения формулы (I) или композиции, содержащей его.

Кроме того, соединения формулы (I) или композиции, содержащие их, предпочтительно используют для защиты содержащих целлюлозу неживых органических материалов.

Предпочтительно соединения формулы (I) или композиции, содержащие их, используют для защиты содержащих целлюлозу неживых органических материалов от несельскохозяйственных вредителей, выбранных из отрядов Isoptera, Diptera, Blattaria (Blattodea), Hymenoptera и Orthoptera, наиболее предпочтительно отряда Isoptera.

Настоящее изобретение также предусматривает способ защиты содержащих целлюлозу неживых органических материалов от несельскохозяйственных вредителей, предпочтительно от отрядов Isoptera, Diptera, Blattaria (Blattodea), Hymenoptera и Orthoptera, наиболее предпочтительно отрядов Isoptera, который включает обработку вредителей или их пищи, мест обитания, мест размножения, их очага (скопления) или самих неживых органических материалов пестицидно эффективным количеством соединения формулы (I) или композиции, содержащей его.

В другом предпочтительном выполнении настоящего изобретения соединения формулы (I) или композиции, содержащие их, используют для защиты моно-, олиго- или полисахаридов и белков.

Предпочтительно соединения формулы (I) или композиции, содержащие их, используют для защиты моно-, олиго- или полисахаридов и белков от несельскохозяйственных вредителей, выбранных из отрядов Dermaptera, Diplopoda, Isoptera, Diptera, Blattaria (Blattodea), Hymenoptera, Orthoptera и Thysanura, наиболее предпочтительно, отрядов Isoptera, Diptera, Blattaria (Blattodea) и Hymenoptera.

Настоящее изобретение также предусматривает способ защиты моно-, олиго- или полисахаридов и белков от несельскохозяйственных вредителей, предпочтительно выбранных из отрядов Dermaptera, Diplopoda, Isoptera, Diptera, Blattaria (Blattodea), Hymenoptera, Orthoptera и Thysanura, наиболее предпочтительно, отрядов Isoptera, Diptera, Blattaria (Blattodea) и Hymenoptera, который включает обработку вредителей или их пищи, мест обитания, мест размножения или их очага (скопления) пестицидно эффективным количеством соединения формулы (I) или композиции, содержащей его.

Кроме того, соединения формулы (I) предпочтительно используют для защиты животных от несельскохозяйственных вредителей класса Chilopoda и отрядов

Araneida, Hemiptera, Diptera, Phthiraptera, Siphonaptera, Parasitiformes и Acaridida путем обработки вредителей в водоемах и/или в зданиях и вокруг них, включая, но не ограничиваясь ими: стены, почву, компостные кучи, газонную траву, пастбища, канализационные сети и материалы, используемые в строительстве зданий, а также матрасы и постельные принадлежности, пестицидно эффективным количеством соединения формулы (I) или композиции, содержащей его. Наиболее предпочтительно, соединения формулы (I) используют для защиты животных от несельскохозяйственных вредителей отрядов Diptera, Phthiraptera, Siphonaptera и Parasitiformes.

Животные включают теплокровных животных, в том числе людей и рыб. Соединения формулы (I) предпочтительно используются для защиты теплокровных животных, таких как крупный рогатый скот, овцы, свиньи, верблюды, олени, лошади, домашняя птица, кролики, козы, собаки и коты.

В определении формулы (I), представленной выше, заместители имеют следующие значения:

"Галоген" означает фтор, хлор, бром и йод.

Термин "алкил" в данном контексте относится к разветвленной или неразветвленной насыщенной углеводородной группе, имеющей от 1 до 4 или 6 атомов углерода, особенно C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкил, такой как метил, этил, пропил, 1-метилэтил, бутил, 1-метилпропил, 2-метилпропил, 1,1-диметилэтил, пентил, 1-метилбутил, 2-метилбутил, 3-метилбутил, 2,2-диметилпропил, 1-этилпропил, гексил, 1,1-диметилпропил, 1,2-диметилпропил, 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-этилбутил, 2-этилбутил, 1,1,2-триметилпропил, 1,2,2-триметилпропил, 1-этил-1-метилпропил и 1-этил-2-метилпропил.

"Алкокси" относится к линейной или разветвленной алкильной группе, имеющей от 1 до 4 атомов углерода (метил, этил, пропил, 1-метилэтил, бутил, 1-метилпропил, 2-метилпропил, 1,1-диметилэтил) и связанной через кислородную связь с любой связью в алкильной группе. Примеры включают метокси, этокси, пропокси и изопропокси.

"Циклоалкил" относится к моноциклическому 3-6-членному насыщенному углеводородному кольцу, т.е. циклопропилу, циклобутилу, циклопентилу и циклогексилу.

Что касается использования соединений формулы (I) по назначению, то особое предпочтение отдается следующим значениям заместителей, в каждом случае их собственным значениям или в комбинации.

Предпочтение отдается соединениям формулы (I), в которой W означает трифторметил.

Далее предпочтение отдается соединениям формулы (I), в которой X и Y оба означают хлор.

Кроме того, предпочтительными являются соединения формулы (I), в которой R<sup>1</sup> означает C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкил, особенно, этил.

Далее предпочтение отдается соединениям формулы (I), в которой R<sup>2</sup> и R<sup>3</sup> оба означают метил.

Кроме того, предпочтительными являются соединения формулы (I), в которой R<sup>2</sup> и R<sup>3</sup> образуют циклопропильное кольцо, которое является незамещенным или замещенным 1-3 атомами галогена, в особенности хлором и бромом.

Кроме того, особенно предпочтительными являются соединения формулы (I), в которой R<sup>2</sup> и R<sup>3</sup> образуют циклопропильное кольцо, которое является замещенным 2 атомами галогена.

Кроме того, особенно предпочтительными являются соединения формулы (I), в которой R<sup>2</sup> и R<sup>3</sup> образуют циклопропильное кольцо, которое является замещенным 2 атомами хлора.

Особенно предпочтительными являются соединения формулы (I), в которой R<sup>2</sup> и R<sup>3</sup> образуют 2,2-дихлорциклопропильное кольцо.

Предпочтение отдается соединениям формулы (I), в которой R<sup>4</sup> означает C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкил, в особенности метил.

Особенно предпочтительными являются соединения формулы (I), в которой R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> и R<sup>4</sup> все являются метилом.

Кроме того, особенно предпочтительными являются соединения формулы (I), в которой R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> и R<sup>4</sup> образуют остаток 1-метил-2,2-дихлорциклопропил.

Далее предпочтение отдается соединениям формулы (I), в которой

W означает трифторметил;

X и Y каждый независимо означают хлор или бром;

R<sup>1</sup> означает C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкил;

R<sup>2</sup> и R<sup>3</sup> означают C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкил или могут, взятые вместе, образовывать C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкил, который замещен 1-2 атомами галогена;

R<sup>4</sup> означает C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкил;

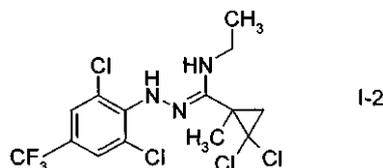
или их энантиомерам, или солям.

Особое предпочтение отдается N-этил-2,2-диметилпропионамид-2-(2,6-дихлор- $\alpha,\alpha,\alpha$ -трифтор-п-толил)гидразону и N-этил-2,2-дихлор-1-метилциклопропанкарбоксамид-2-(2,6-дихлор- $\alpha,\alpha,\alpha$ -трифтор-п-толил)гидразону.

Кроме того, особое предпочтение относительно использования настоящего изобретения отдается соединению формулы I-1 (N-этил-2,2-диметилпропионамид-2-(2,6-дихлор- $\alpha,\alpha,\alpha$ -трифтор-п-толил)гидразону)



Кроме того, особое предпочтение относительно использования настоящего изобретения отдается соединению формулы I-2 (N-этил-2,2-дихлор-1-метилциклопропанкарбоксамид-2-(2,6-дихлор- $\alpha,\alpha,\alpha$ -трифтор-п-толил)гидразону)



Что касается их использования, то особое предпочтение отдается соединениям I-A, сведенным в таблицу ниже. Кроме того, группы, упомянутые в качестве заместителей в таблицах, являются сами по себе, независимо от комбинации, в которой они упоминаются, особенно предпочтительным воплощением рассматриваемого заместителя.

Что касается их использования, то особое предпочтение также отдается аддуктам соединений с хлористоводородной кислотой, малеиновой кислотой, дималеиновой кислотой, фумаровой кислотой, дифумаровой кислотой, метан сульфеновой кислотой, метансульфоновой кислотой и янтарной кислотой, указанным в таблицах ниже.

Некоторые из соединений формулы (I) являются новыми. Они также представляют предмет данного изобретения.

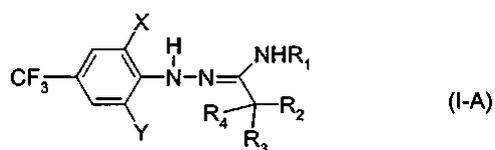


Таблица А

№	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	X	Y
A-1	CH <sub>3</sub>	2,2-дихлорциклопропил		H	Cl	Cl
A-2	CH <sub>3</sub>	2,2-дибромциклопропил		H	Cl	Cl
A-3	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Cl	Cl
A-4	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Cl	Cl
A-5	CH <sub>3</sub>	2,2-дихлорциклопропил		CH <sub>3</sub>	Cl	Cl
A-6	CH <sub>3</sub>	2,2-дибромциклопропил		CH <sub>3</sub>	Cl	Cl
A-7	CH <sub>3</sub>	2,2-дихлорциклопропил		H	Br	Br
A-8	CH <sub>3</sub>	2,2-дибромциклопропил		H	Br	Br
A-9	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Br	Br
A-10	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Br	Br
A-11	CH <sub>3</sub>	2,2-дихлорциклопропил		CH <sub>3</sub>	Br	Br
A-12	CH <sub>3</sub>	2,2-дибромциклопропил		CH <sub>3</sub>	Br	Br
A-13	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2,2-дихлорциклопропил		H	Cl	Cl
A-14	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2,2-дибромциклопропил		H	Cl	Cl
A-15	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Cl	Cl
A-16	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Cl	Cl
A-17	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2,2-дихлорциклопропил		CH <sub>3</sub>	Cl	Cl
A-18	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2,2-дибромциклопропил		CH <sub>3</sub>	Cl	Cl
A-19	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2,2-дихлорциклопропил		H	Br	Br
A-20	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2,2-дибромциклопропил		H	Br	Br
A-21	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Br	Br
A-22	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Br	Br
A-23	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2,2-дихлорциклопропил		CH <sub>3</sub>	Br	Br
A-24	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2,2-дибромциклопропил		CH <sub>3</sub>	Br	Br
A-25	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2,2-дихлорциклопропил		H	Cl	Cl
A-26	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2,2-дибромциклопропил		H	Cl	Cl
A-27	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Cl	Cl
A-28	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Cl	Cl
A-29	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2,2-дихлорциклопропил		CH <sub>3</sub>	Cl	Cl
A-30	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2,2-дибромциклопропил		CH <sub>3</sub>	Cl	Cl
A-31	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2,2-дихлорциклопропил		H	Br	Br
A-32	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2,2-дибромциклопропил		H	Br	Br
A-33	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Br	Br

A-34	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Br	Br
A-35	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2,2-дихлорциклопропил		CH <sub>3</sub>	Br	Br
A-36	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2,2-дибромциклопропил		CH <sub>3</sub>	Br	Br
A-37	C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	2,2-дихлорциклопропил		H	Cl	Cl
A-38	C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	2,2-дибромциклопропил		H	Cl	Cl
A-39	C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Cl	Cl
A-40	C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Cl	Cl
A-41	C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	2,2-дихлорциклопропил		CH <sub>3</sub>	Cl	Cl
A-42	C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	2,2-дибромциклопропил		CH <sub>3</sub>	Cl	Cl
A-43	C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	2,2-дихлорциклопропил		H	Br	Br
A-44	C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	2,2-дибромциклопропил		H	Br	Br
A-45	C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Br	Br
A-46	C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Br	Br
A-47	C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	2,2-дихлорциклопропил		CH <sub>3</sub>	Br	Br
A-48	C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	2,2-дибромциклопропил		CH <sub>3</sub>	Br	Br
A-49	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	2,2-дихлорциклопропил		H	Cl	Cl
A-50	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	2,2-дибромциклопропил		H	Cl	Cl
A-51	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Cl	Cl
A-52	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Cl	Cl
A-53	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	2,2-дихлорциклопропил		CH <sub>3</sub>	Cl	Cl
A-54	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	2,2-дибромциклопропил		CH <sub>3</sub>	Cl	Cl
A-55	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	2,2-дихлорциклопропил		H	Br	Br
A-56	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	2,2-дибромциклопропил		H	Br	Br
A-57	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Br	Br
A-58	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Br	Br
A-59	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	2,2-дихлорциклопропил		CH <sub>3</sub>	Br	Br
A-60	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	2,2-дибромциклопропил		CH <sub>3</sub>	Br	Br
A-61	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2,2-дихлорциклопропил		H	Cl	Cl
A-62	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2,2-дибромциклопропил		H	Cl	Cl
A-63	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Cl	Cl
A-64	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Cl	Cl
A-65	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2,2-дихлорциклопропил		CH <sub>3</sub>	Cl	Cl
A-66	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2,2-дибромциклопропил		CH <sub>3</sub>	Cl	Cl
A-67	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2,2-дихлорциклопропил		H	Br	Br
A-68	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2,2-дибромциклопропил		H	Br	Br
A-69	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Br	Br
A-70	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Br	Br
A-71	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2,2-дихлорциклопропил		CH <sub>3</sub>	Br	Br
A-72	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	2,2-дибромциклопропил		CH <sub>3</sub>	Br	Br

Для применения согласно настоящему изобретению соединения (I) могут быть превращены в обычные композиции, например растворы, эмульсии, суспензии, дусты, порошки, пасты и гранулы. Форма применения зависит от конкретного назначения; она предназначена обеспечить в каждом случае тонкодисперсное и равномерное распределение соединения согласно изобретению.

Композиции получают известным способом, например, добавляя к активному ингредиенту растворители и/или носители, при необходимости с использованием эмульгаторов и диспергаторов. Пригодными растворителями/вспомогательными веществами, по существу, являются

вода, ароматические растворители (например, Solvesso продукты, ксилол), парафины (например, фракции минеральных масел), спирты (например, метанол, бутанол, пентанол, бензиловый спирт), кетоны (например, циклогексанон, гамма-бутиролактон), пирролидоны (NMP, NOP), ацетаты (гликольдиацетат), гликоли, диметиламины жирных кислот, жирные кислоты и эфиры жирных кислот. В принципе, могут также использоваться смеси растворителей;

носители, такие как измельченные природные минералы (например, каолины, глины, тальк, мел) и измельченные синтетические минералы (например, высокодисперсный диоксид кремния, силикаты);

эмульгаторы, такие как неионные и анионные эмульгаторы (например, полиоксиэтиленовые эфиры жирных спиртов, алкилсульфонаты и арилсульфонаты), и

диспергирующие агенты, такие как лигнинсульфитные щелоки и метилцеллюлоза.

Пригодными поверхностно-активными веществами являются соли щелочных металлов,

щелочно-земельных металлов и аммониевые соли лигносульфоновой кислоты, нафталинсульфоновой кислоты, фенолсульфоновой кислоты, дибутилнафталинсульфоновой кислоты, алкиларилсульфонаты, алкилсульфаты, алкилсульфонаты, сульфаты жирных спиртов, жирные кислоты и гликолевые эфиры сульфатированных жирных кислот, кроме того, конденсаты сульфонируемого нафталина и нафталиновых производных с формальдегидом, конденсаты нафталина или нафталинсульфоновой кислоты с фенолом, октилфенолом, нонилфенолом, алкилфенилполигликолевые эфиры, трибутилфенилполигликолевые эфиры, тристеарилфенилполигликолевые эфиры, алкиларилполиэфирные спирты, конденсаты спирта и жирного спирта/этиленоксида, этоксилированное касторовое масло, полиоксиэтиленалкиловые эфиры, этоксилированный полиоксипропилен, ацеталь полигликолевого эфира лаурилового спирта, сложные эфиры сорбита, лигнинсульфитные щелоки и метилцеллюлоза и блоксополимеры этиленоксида/пропиленоксида.

Веществами, пригодными для получения непосредственно разбрызгиваемых растворов, эмульсий, паст или масляных дисперсий являются фракции минеральных масел с температурой кипения от средней до высокой, такие как керосин или дизельное топливо, кроме того, каменноугольные масла и масла растительного или животного происхождения, алифатические, циклические и ароматические углеводороды, например толуол, ксилол, парафин, тетрагидронафталин, алкилированные нафталины или их производные, метанол, этанол, пропанол, бутанол, циклогексанол, циклогексанон, изофорон, сильнополярные растворители, например диметилсульфоксид, N-метилпирролидон и вода.

Порошки, материалы для рассеивания и dustы могут быть получены путем смешивания или совместного помола активных веществ с твердым носителем.

Гранулы, например гранулы с покрытием, импрегнированные гранулы или гомогенные гранулы, могут быть получены путем связывания активных ингредиентов с твердыми носителями. Примерами твердых носителей являются минеральные земли, такие как силикагели, силикаты, тальк, каолин, аттаклей, известняк, известь, мел, болюс, лесс, глина, доломит, диатомовая земля, сульфат кальция, сульфат магния, оксид магния, измельченные синтетические материалы, удобрения, такие как, например, сульфат аммония, фосфат аммония, нитрат аммония, мочевины и продукты растительного происхождения, такие как зерновая мука, мука из коры деревьев, древесная мука и мука из ореховой скорлупы, порошки из целлюлозы и другие твердые носители.

В общем, композиции содержат от 0,01 до 95 вес.%, предпочтительно от 0,1 до 90 вес.% активного ингредиента. Активные ингредиенты применяют с чистотой от 90 до 100%, предпочтительно от 95 до 100% (согласно данным спектра ЯМР).

Далее приведены примеры составов.

1. Продукты для разбавления водой.

A. Растворимые концентраты (SL).

10 вес.ч. соединения согласно изобретению растворяют в воде или в водорастворимом растворителе. В качестве альтернативы добавляют смачиватели или другие вспомогательные вещества. Активный ингредиент растворяется при разбавлении водой.

B. Дисперсионные концентраты (DC).

20 вес.ч. соединения согласно изобретению растворяют в циклогексаноне с добавлением диспергатора, например поливинилпирролидона. Разбавление водой дает дисперсию.

C. Эмульгируемые концентраты (EC).

15 вес.ч. соединения согласно изобретению растворяют в ксилоле с добавлением додецилбензолсульфоната кальция и этоксилированного касторового масла (в каждом случае 5% концентрации). Разбавление водой дает эмульсию.

D. Эмульсии (EW, EO).

40 вес.ч. соединения согласно изобретению растворяют в ксилоле с добавлением додецилбензолсульфоната кальция и этоксилированного касторового масла (в каждом случае 5% концентрации). Эту смесь вводят в воду с помощью эмульгатора (Ultraturax) и превращают в гомогенную эмульсию. Разбавление водой дает эмульсию.

E. Суспензии (SC, OD).

В перемешиваемой шаровой мельнице перемалывали 20 вес.ч. соединения согласно изобретению с добавлением диспергатора, смачивателей и воды или органического растворителя, получая тонкодисперсную суспензию активного ингредиента. Разбавление водой дает стабильную суспензию активного ингредиента.

F. Вододиспергируемые гранулы и водорастворимые гранулы (WG).

50 вес.ч. соединения согласно изобретению тонко измельчали с добавлением диспергаторов и смачивателей и превращали в вододиспергируемые гранулы или водорастворимые гранулы с помощью технических средств (например, экструзией, в скруббере с разбрызгивающим устройством, в псевдооживленном слое). Разбавление водой дает стабильную дисперсию или раствор активного ингредиента.

G. Вододиспергируемые порошки и водорастворимые порошки (WP, SP).

75 вес.ч. соединения согласно изобретению измельчали в роторно-статорной мельнице с добавлением диспергатора, смачивателей и силикагеля. Разбавление водой дает стабильную дисперсию или рас-

твор активного ингредиента.

2. Продукты, применяемые неразбавленными.

H. Распыляемые порошки (DP).

5 вес.ч. соединения согласно изобретению тонко измельчали и тщательно смешивали с 95% тонко измельченного каолина. В результате получали распыляемый продукт.

I. Гранулы (GR, FG, GG, MG).

0,5 вес.ч. соединения согласно изобретению тонко измельчали и приводили в контакт с 95,5% носителей. Современными методами являются экструзия, сушка распылением или псевдоожиженный слой. В результате получают гранулы, которые применяют неразбавленными.

J. Ультразвукообъемные растворы (UL).

10 вес.ч. соединения согласно изобретению растворяют в органическом растворителе, например ксилоле. В результате получают продукт, который применяют неразбавленным.

Активные ингредиенты могут быть использованы как таковые, в форме их композиций или форм применения, полученных из них, например в форме непосредственно разбрызгиваемых растворов, порошков гелей, суспензий или дисперсий, эмульсий, масляных дисперсий, паст, распыляемых продуктов, материалов для разбрасывания, или гранул, микрокапсул (CS), катышков или таблеток, путем разбрызгивания, распыления, опудривания, разбрасывания или полива. Применяемые формы всецело зависят от намеченных целей; предполагается, что необходимо обеспечить в каждом случае наиболее возможно тонкодисперсное распределение активных ингредиентов согласно изобретению.

Водные формы использования могут быть приготовлены из эмульсионных концентратов, паст или смачиваемых порошков (разбрызгиваемые порошки, масляные дисперсии) путем добавления воды. Для получения эмульсий, паст или масляных дисперсий вещества как таковые или растворенные в масле или растворителе, могут быть гомогенизированы в воде с помощью смачивателя, реагента, придающего клейкость, диспергатора или эмульгатора. Альтернативно, можно готовить концентраты, состоящие из активного вещества, смачивателя, реагента, придающего клейкость, диспергатора или эмульгатора и, при необходимости, растворителя или масла, и такие концентраты пригодны для разбавления водой.

Концентрации активного ингредиента в готовых к использованию продуктах могут изменяться в относительно широком интервале. В общем, они находятся в пределах от 0,0001 до 10%, предпочтительно, от 0,01 до 1%.

Активные ингредиенты могут также с успехом применяться в ультразвукообъемном способе (ULV), в котором возможно применять составы, содержащие свыше 95 вес.% активного ингредиента или даже применять активный ингредиент без добавок.

Различные типы масел, смачивателей, адьювантов, гербицидов, фунгицидов, других пестицидов или бактерицидов могут добавляться к активным ингредиентам, при необходимости, непосредственно перед применением. Эти агенты обычно смешивают с агентами согласно изобретению в весовом соотношении от 1:10 до 10:1.

Соединения формулы (I) являются эффективными при воздействии как прямом, так и опосредованном, и при приеме с пищей, а также при взаимном кормлении и переносе.

Предпочтительные способы применения заключаются во внесении в водоемы, в почву, щели и трещины, на пастбища, в компостные кучи, канализационные сети, в воду, на пол, стены или путем разбрызгивания по периметру, а также в приманках.

Согласно предпочтительному воплощению изобретения соединения формулы (I) применяют путем внесения в почву. Внесение в почву является особенно пригодным для использования против муравьев, термитов, ос, сверчков или тараканов.

Согласно другому предпочтительному воплощению изобретения для применения несельскохозяйственных вредителей, таких как муравьи, термиты, осы, мухи, москиты, сверчки, саранча, тараканы и чешуйница домашняя, соединения формулы (I) применяют в виде составов приманок.

Приманка может быть жидкой, твердой или полутвердой композицией (например, гелем). Твердые приманки могут быть сформованы в различные изделия и формы, пригодные для соответствующего применения, например гранулы, блоки, бруски, диски. Жидкие приманки могут быть налиты в различные устройства для обеспечения надлежащего применения, например открытые контейнеры, опрыскиватели, источники капель или источники-испарители. Гели могут быть на основе водной или масляной матриц и могут быть введены в составы для конкретного использования на основе их липкости, влагоудержания или характеристик старения.

Приманкой, применяемой в композиции, является продукт, который является в достаточной степени притягательным для возбуждения насекомых, таких как муравьи, термиты, осы, мухи, москиты, сверчки и т.п., или для побуждения тараканов к поеданию его. Такой аттрактант может быть выбран из пищевых стимуляторов или пара- и/или половых феромонов. Пригодные пищевые стимуляторы выбирают, например, из животных и/или растительных белков (мясной, рыбной или кровяной кормовой муки, частей насекомых, сверчкового порошка, яичного желтка), из жиров и масел животного и/или растительного происхождения, или моно-, олиго- или полиорганосахаридов, в особенности из сахарозы, лактозы, фруктозы, декстрозы, глюкозы, крахмала, пектина или даже мелассы или меда, или из солей, таких как

сульфат аммония, карбонат аммония или ацетат аммония. Свежие или загнивающие части фруктов, сельскохозяйственных культур, растений, животных, насекомые или их особые части также могут служить в качестве пищевого стимулятора.

Феромоны, как известно, больше являются специальным средством для насекомых. Конкретные феромоны описаны в литературе и известны специалисту в данной области.

Композиции соединений формулы (I) в виде аэрозолей (например, в аэрозольных баллончиках), масляных спреев или пульверизаторов в значительной степени пригодны для непрофессионального пользователя для борьбы с вредителями, такими как мухи, блохи, клещи, москиты, саранча или тараканы. Аэрозольные средства предпочтительно состоят из активного соединения, растворителей, таких как низшие спирты (например, метанол, этанол, пропанол, бутанол), кетоны (например, ацетон, метилэтилкетон), парафиновые углеводороды (например, керосин), имеющие температурный интервал кипения от примерно 50 до 250°C, диметилформамид, N-метилпирролидон, диметилсульфоксид, ароматические углеводороды, такие как толуол, ксилол, вода, и, кроме того, вспомогательные вещества, такие как эмульгаторы, например моноолеат сорбита, олеилэтоксилат, имеющий 3-7 моль этиленоксида, этоксилат жирного спирта, парфюмерные масла, такие как эфирные масла, эфиры средних жирных кислот с низшими спиртами, ароматические карбонильные соединения, если это целесообразно, стабилизаторы, такие как бензоат натрия, амфотерные поверхностно-активные вещества, низшие эпоксиды, триэтилортоформат и, при необходимости, пропелленты, такие как пропан, бутан, азот, сжатый воздух, диметиловый эфир, диоксид углерода, оксид азота или смесь этих газов.

Масляные разбрызгивающиеся композиции отличаются от аэрозольных составов тем, что в них не используются пропелленты.

Соединения формулы (I) и их соответствующие композиции могут также применяться в москитных спиральках и окуривающих спиральках, дымовых шашках, испарительных пластинках, долговременных испарителях или в других независимых от нагревания испаряющих системах.

Способы борьбы с инфекционными заболеваниями, передаваемыми насекомыми (например, малярией, тропической лихорадкой и желтой лихорадкой, лимфатическим филяриозом и лейшманиозом), с помощью соединений формулы (I), а также их соответствующих композиций заключается в обработке поверхностей бараков и домов, путем разбрызгивания сжатым воздухом и пропитывания занавесей, палаток, предметов обмундирования, кроватных сеток, ловушек для мух цеце и т.п. Инсектицидные композиции для применения к нитям, тканям, трикотажным изделиям, нетканым материалам, сетчатым материалам или фольгам и брезентам предпочтительно содержат смесь, включающую инсектицид, необязательно, репеллент и по меньшей мере одно связующее вещество.

Пропитывание занавесей и кроватных сеток главным образом осуществляют путем погружения текстильного материала в эмульсии или дисперсии инсектицида или путем разбрызгивания их на полотно.

Приведенный далее перечень пестицидов, вместе с которыми могут использоваться соединения формулы (I), иллюстрирует возможные комбинации, но не носит ограничивающий характер.

Органофосфаты: ацефат, азинфос-метил, хлорпирифос, хлорфенвинфос, диазинон, дихлорвос, дикротофос, диметоат, дисульфотон, этион, фенитропион, фентион, изоксатион, малатион, метамидофос, метидаион, метилпаратион, мевинфос, монокротофос, оксидеметонметил, параоксон, паратион, пентоат, фозалон, фосмет, фосфамидон, форат, фоксим, пиримифосметил, профенофос, протиофос, сульпрофос, тербуфос, триазофос, трихлорфон;

Карбаматы: аланикарб, бенфурбакарб, карбарил, карбосульфат, феноксикарб, фуриатиокарб, индоксакарб, метиокарб, метомил, оксамил, пиримикарб, пропоксур, тиодикарб, триазамат;

Пиретроиды: бифентрин, цифлутрин, циперметрин, альфа-циперметрин, дельтаметрин, эсфенвалерат, этофенпрокс, фенпропатрин, фенвалерат, цихалотрин, лямбда-цихалотрин, перметрин, силафлуофен, тау-флувалинат, тефлутрин, тралометрин, зета-циперметрин;

Регуляторы роста членистоногих:

а) ингибиторы синтеза хитина: бензоилмочевинны: хлорфлуазурон, дифлубензулон, флуциклоксурон, флуфеноксурон, гексафлумурон, луфенурон, новалурон, тефлубензулон, трифлумурон; бупрофезин, диофенолан, гекситиазокс, этоксазол, клофентазин;

б) антагонисты экдизона: галофенозид, метоксифенозид, тебуфенозид;

с) ювеноиды: пирипроксифен, метопрен, феноксикарб; d) ингибиторы биосинтеза липидов: спиро-дикрофен;

Неоникотиноиды: ацетамиприд, клотианидин, флониамид, имидаклоприд, нитенпирам, тиаклоприд, тиаметоксам;

Разное: абамектин, ацехиноцил, амитраз, азадирактин, бифеназат, *Bacillus thuringiensis*, *Bacillus subtilis*, картап, хлорфенапир, хлордимеформ, циромазин, диафентиурон, динетофуран, диофенолан, эмектин, эндосульфат, этипрол, феназахин, фипронил, форметанат, форметаната гидрохлорид, гидраметиллон, индоксакарб, 4-{{(2Z)}-2-({[4-(трифторметокси)анилино]карбонил}гидразоно)-2-[3-(трифторметил)фенил]этил}бензонитрил, пиридабен, пиметрозин, спиносид, сера, тебуфенпирад, тиаметоксам и тиоциклам.

С насекомыми можно бороться путем обработки уничтожаемого паразита/вредителя, его пищи, среды обитания, среды размножения или его очага пестицидно эффективным количеством соединений или композиций формулы (I).

Под "очагом" понимают среду обитания, среду размножения, почву, площадь, материал или среду, в которой вредитель или паразит растет или может расти.

В общем, "пестицидно эффективное количество" означает количество активного ингредиента, необходимое для достижения заметного влияния на рост, включая эффекты некроза, смерти, задержки в развитии, предотвращения и устранения, уничтожения или другого сокращения появления и активности уничтожаемых организмов. Пестицидно эффективное количество может отличаться для разных соединений/композиций, используемых в данном изобретении. Пестицидно эффективное количество композиций также будет отличаться в зависимости от основных условий, таких как желаемый пестицидный эффект и длительность, погодные условия, вид уничтожаемого вредителя, очаг, способ нанесения и подобные.

Соединения формулы (I) и их композиции могут использоваться для защиты древесных материалов, таких как деревья, дощатые заборы, шпалы, и т.д., а также зданий, таких как жилые дома, надворные строения, производственные строения, а также строительных материалов, мебели, кожаных изделий, волокон, виниловых изделий, электрических проводов и кабелей и т.д. от муравьев и/или термитов, а также для предотвращения нанесения муравьями и термитами вреда сельскохозяйственным культурам или людям (например, когда вредители вторгаются в дома и общественные здания). Соединения формулы (I) наносятся не только на окружающую поверхность почвы или на почву, находящуюся под полом, для защиты деревянных материалов, но также могут наноситься на пиломатериалы, в частности на бетонные поверхности под полом, на опоры в нишах, брусья, многослойную фанеру, мебель, и т.д., деревянные изделия, такие как доски, полудюймовые доски, и т.д. и виниловые изделия, такие как изолированная электрическая проводка, виниловые листы, теплоизоляционные материалы, такие как стирольные пены, и т.д. В случае применения изобретения против муравьев, наносящих вред сельскохозяйственным культурам или людям, композицию для борьбы с вредителями согласно изобретению наносят непосредственно на гнездо муравьев или на места поблизости к такому гнезду, или же используют как приманку.

Соединения или композиции согласно изобретению могут наноситься в качестве профилактики на места, в которых ожидается появление вредителей.

В случае обработки почвы или в случае нанесения на место сосредоточения вредителей или их гнездо, количество активного ингредиента составляет от 0,0001 до 500 г на 100 м<sup>2</sup>, предпочтительно от 0,001 до 20 г на 100 м<sup>2</sup>. Особенно предпочтительным вариантом данного изобретения является обработка почвы для борьбы с термитами (Isoptera).

Обычные нормы расхода для защиты материалов составляют, например, от 0,01 г до 1000 г активного соединения на 1 м<sup>2</sup> обрабатываемого материала, желательно от 0,1 г до 50 г на 1 м<sup>2</sup>.

Инсектицидные композиции для использования в пропитывании материалов обычно содержат от 0,001 до 95 вес.%, предпочтительно от 0,1 до 45 вес.% и более предпочтительно от 1 до 25 вес.% по меньшей мере одного репеллента и/или инсектицида.

При использовании композиций в приманках обычное содержание активного ингредиента составляет от 0,0001 до 15 вес.%, желательно от 0,001 до 5 вес.% активного соединения. Используемая композиция также может содержать другие добавки, такие как растворитель для активного материала, вкусовая добавка, консервант, краситель или горькая добавка. Ее привлекательность может также быть повышена за счет специально подобранного цвета, формы или текстуры.

При использовании композиций в спреях содержание активного ингредиента составляет от 0,001 до 80 вес.%, предпочтительно от 0,01 до 50 вес.%, и наиболее предпочтительно от 0,01 до 15 вес.%.

Примеры воздействия на вредителей.

Методика испытаний.

1. Активность против муравьев аргентинских, муравьев-жнецов, муравьев-акробатов, муравьев-древоточцев, огненных муравьев, мух комнатных, жигалок обыкновенных, серых мясных мух, амариллезных москитов, кулексов, малярийных комаров, рыжих тараканов, кошачьих блох и рыжих иксодовых собачих клещей через контакт со стеклом.

Стекланные пробирки (сцинтилляционные флаконы объемом 20 мл) обрабатывали при помощи 0,5 мл раствора активного ингредиента в ацетоне. Каждую пробирку проворачивали без накрывания в течение около 10 мин с тем, чтобы раствор полностью покрыл ее поверхность, а ацетон полностью высох. Насекомых или клещей помещали в каждую пробирку. Пробирки хранили при температуре 22°C и наблюдали за эффектами такой обработки в разные промежутки времени. Результаты представлены в таблице.

2. Активность против аргентинских муравьев, муравьев-акробатов, муравьев-древоточцев, огненных муравьев и желтоногих термитов через контакт с почвой.

Для муравьев испытания проводили в чашках Петри. Чашки заполняли тонким шаром 1% агара в воде и поверх агара распределяли песчаную почву из Флориды (5 г для маленьких чашек и 11 г для более крупных чашек). Активный ингредиент растворяли в ацетоне и распределяли по поверхности песка. Чашки продували, чтобы испарился ацетон, запускали в них муравьев и накрывали. В каждую чашку

добавляли 20% раствор меда в воде. Чашки хранили при температуре 22°C и наблюдали за смертностью в разные промежутки времени.

Для термитов чашки заполняли тонким шаром 1% агара. Поверх агара распределяли тонким слоем предварительно обработанную почву. Для обработки почвы активный ингредиент разбавляли ацетоном на основе весового соотношения и добавляли к 100 г почвы. Почву помещали в емкость и продували в течение 48 ч. Уровень влажности почвы был установлен на уровне полевой влагоемкости путем добавления 7 мл воды. В каждую чашку запускали рабочих-термитов. Через 1 день в каждую чашу клали маленький кусочек фильтровальной бумаги в качестве источника пищи, по необходимости добавляли дополнительное количество воды для поддержания влажности почвы. Используемые в тесте чашки хранили в темном инкубаторе при 25°C и относительной влажности приблизительно 80%. За термитами наблюдали ежедневно для определения смертности (мертвые особи и неспособные стоять прямо, проявляющие только слабые признаки движений). Результаты представлены в таблице.

3. Активность против аргентинских муравьев, муравьев-акробатов, муравьев-древоточцев, огненных муравьев, комнатных мух, желтоногих термитов, формозанских носатых термитов и рыжих тараканов через ловушку.

Для аргентинских муравьев, муравьев-акробатов и муравьев-древоточцев опыты проводили в чашках Петри. Муравьям обеспечивали источник воды и после этого лишали источника пищи на 24 ч. Ловушки содержали либо 20% раствор меда в воде, либо размолотый корм для кошек. В ловушку добавляли раствор активного ингредиента в ацетоне. В каждую чашку добавляли 0,2 мл обработанного раствора меда в воде или 150 мг обработанного кошачьего корма, помещенного в колпачок. Чашки накрывали и хранили при температуре 22°C. За смертностью муравьев наблюдали ежедневно. Результаты представлены в таблице.

Для огненных муравьев в качестве матрицы для приманки использовали кукурузную крупу. Ловушку с кукурузной крупой получали путем использования смеси обезжиренной кукурузной крупы (80%), соевого масла (19,9%), ацетона и активного ингредиента (0,1%). Чашки Петри обеспечивались источниками воды. В каждую чашку запускали взрослых особей огненных муравьев. На следующий день в чашки ставили контейнеры с ловушками, содержащими 250 г приманочной смеси. За смертностью муравьев наблюдали ежедневно. Результаты представлены в таблице.

Для комнатных мух испытания проводили на взрослых мухах в возрасте 2-5 дней после вылупления. К матрице ловушки, содержащей смесь сухого молока и сахара в соотношении 1:1 добавляли раствор активного ингредиента в ацетоне и смеси давали просохнуть. Анализы проводили в емкостях, содержащих 250 мг приманки в тарелке, помещенной на дно каждой такой емкости. Комнатных мух запускали в емкости с приманками, и емкости закрывали. Опытные емкости хранили при 22°C. За емкостями наблюдали через 4 ч после обработки для определения смертности (смертность плюс заболеваемость (неспособность поддерживать вертикальное положение)). Результаты представлены в таблице.

В случае с термитами раствор активного ингредиента в ацетоне наносили на фильтровальную бумагу. Процентное содержание активного ингредиента рассчитывали, исходя из массы фильтровальной бумаги. Ацетон заменяли только к необработанным контрольным образцам. Обработанный бумагу продували для испарения ацетона, увлажняли мл воды и помещали в чашки Петри, заполненные песком. При необходимости в ходе испытания добавляли воду. Биологический анализ проводили с использованием одного обработанного фильтра и приблизительно 30 рабочих-термитов на тестовую чашку. Тестовые чашки хранили при 25°C и относительной влажности приблизительно 85% и ежедневно наблюдали за смертностью (мертвые или заболевшие насекомые) или интоксикацией. Мертвых или заболевших насекомых удаляли ежедневно. Результаты представлены в таблице.

Для тараканов в качестве опытных емкостей использовали коробки для тараканов с вентиляционными крышками. Верхние 3-4 см таких коробок обрабатывали вазелином и минеральным маслом, чтобы предотвратить возможность побега. По мере необходимости добавляли воду. Приманку готовили, используя размолотый кошачий корм, и добавляли раствор активного ингредиента в ацетоне на основании весового соотношения. Обработанному корму давали просохнуть. Тараканов запускали в коробки и лишали источника пищи на 24 ч перед внедрением приманки. На весах взвешивали по 0,03 г приманки на коробку. Коробки хранили при 22°C и за смертностью тараканов наблюдали ежедневно. Результаты представлены в таблице.

4. Активность против амариллезных москитов, пятиполосных комаров и личинок малярийных комаров через обработку воды.

В качестве тестовых емкостей использовали планшеты с ячейками. Активный ингредиент растворяли в ацетоне и разбавляли водой для получения необходимых концентраций. Полученный раствор, содержащий приблизительно 1% ацетона добавляли в каждую ячейку. В каждую ячейку добавляли 10 личинок комаров (4-я личиночная стадия) в 1 мл воды. Личинок каждый день подкармливали одной каплей печеночного порошка. Чашки накрывали и хранили при 22°C. Смертность анализировали ежедневно, а также удаляли мертвых личинок и живых или мертвых куколок. В конце теста оставшихся живых личинок считали и определяли процент смертности. Результаты представлены в таблице.

Каждый тест повторяли по меньшей мере трижды.

Результаты.

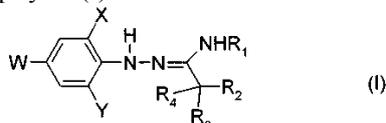
Тесты, проводимые с соединениями формул I-1 и I-2, показали следующие результаты.

Активность против различных отрядов

Общепринятое название вредителя	Латинское название вредителя	Норма	Дни или часы до достижения 100% смертности
<b>Активность через контакт со стеклом</b>			
аргентинский муравей	<i>Linepithema humile</i>	10 млн.ч.	1-2 дня
муравей-жнец	<i>Pogonomyrmex californicus</i>	10 млн.ч.	2-3 дня
муравей-акробат	<i>Crematogaster spp.</i>	10 млн.ч.	1-2 дня
муравей-древоточец	<i>Camponotus floridanus</i>	10 млн.ч.	1 день
огненный муравей	<i>Solenopsis invicta</i>	10 млн.ч.	4 часа
муха комнатная	<i>Musca domestica</i>	10 млн.ч.	4 часа
жигалка обыкновенная	<i>Stomoxys calcitrans</i>	10 млн.ч.	4 часа
серая мясная муха	<i>Sarcophaga sp.</i>	10 млн.ч.	4 часа
амариллезный москит	<i>Aedes aegypti</i>	10 млн.ч.	4 часа
кулекс	<i>Culex quinquefasciatus</i>	0,5 млн.ч.	4 часа
малярийный комар	<i>Anopheles albimanus</i>	1 млн.ч.	1 день
рыжий таракан	<i>Blattella germanica</i>	100 млн.ч.	5-24 часа
кошачья блоха	<i>Ctenocephalides felis</i>	100 млн.ч.	2 дня
рыжий иксодовый собачий клещ	<i>Rhipicephalus sanguineus</i>	10 млн.ч.	3-5 дней
<b>Активность через контакт с почвой</b>			
аргентинский муравей	<i>Linepithema humile</i>	0,1 вес.%	1-2 дня
муравей-акробат	<i>Crematogaster spp.</i>	0,01 вес.%	2 дня
муравей-древоточец	<i>Camponotus floridanus</i>	0,01 вес.%	1 день
огненный муравей	<i>Solenopsis invicta</i>	0,01 вес.%	1 день
желтоногий термит	<i>Reticulitermes flavipes</i>	0,005 вес.%	1-3 дня
<b>Активность через приманку</b>			
аргентинский муравей	<i>Linepithema humile</i>	1,0 вес.%	2-3 дня
муравей-акробат	<i>Crematogaster spp.</i>	1,5 вес.%	6-7 дней
муравей-древоточец	<i>Camponotus floridanus</i>	2,0 вес.%	1-3 дня
огненный муравей	<i>Solenopsis invicta</i>	0,7 вес.%	3 дня
муха комнатная	<i>Musca domestica</i>	0,1 вес.%	3 часа
желтоногий термит	<i>Reticulitermes flavipes</i>	0,1 вес.%	1-2 дня
формозанский носатый термит	<i>Coptotermes formosanus</i>	0,1 вес.%	5 дней
рыжий таракан	<i>Blattella germanica</i>	0,3 вес.%	1-2 дня
<b>Активность через обработку воды</b>			
амариллезный москит	<i>Aedes aegypti</i>	10 млн.ч.	2 дня
кулекс	<i>Culex quinquefasciatus</i>	10 млн.ч.	1 день
малярийный комар	<i>Anopheles albimanus</i>	1.0 млн.ч.	1 день

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Применение соединений формулы (I)



в которой W означает хлор или трифторметил;

X и Y каждый независимо означают хлор или бром;

R<sup>1</sup> означает C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>алкенил, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>алкинил или C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкил, который может быть

замещен 1-3 атомами галогена, или C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>алкил, который замещен C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкокси;

R<sup>2</sup> и R<sup>3</sup> означают C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкил или, взятые вместе, могут образовывать C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>циклоалкил, который может быть незамещенным или замещенным 1-3 атомами галогена;

R<sup>4</sup> означает водород или C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>алкил,

или их энантиомеров, или их солей для борьбы с несельскохозяйственными вредителями.

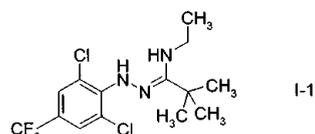
2. Применение по п.1, в котором несельскохозяйственные вредители выбраны из группы, состоящей из классов Chilopoda и Diplopoda и отрядов Isoptera, Diptera, Blattaria (Blattodea), Dermaptera, Hemiptera, Hymenoptera, Orthoptera, Siphonaptera, Thysanura, Phthiraptera, Araneida, Parasitiformes и Acaridida.

3. Применение по п.1 или 2, в котором несельскохозяйственные вредители выбраны из группы, включающей отряды Isoptera, Blattaria (Blattodea), Diptera, Hymenoptera, Siphonaptera, Orthoptera и Ixodida.

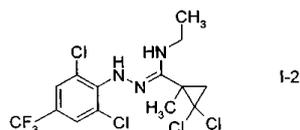
4. Применение соединений формулы (I), определенных в п.1, для защиты неживых органических материалов.

5. Применение по п.4 для защиты неживых органических материалов от несельскохозяйственных вредителей, выбранных из группы, состоящей из классов Diplopoda и отрядов Isoptera, Diptera, Blattaria (Blattodea), Dermaptera, Hemiptera, Hymenoptera, Orthoptera и Thysanura.

6. Применение по одному из пп.1-5, в котором соединением формулы (I) является соединение формулы I-1



7. Применение по одному из пп.1-5, в котором соединением формулы (I) является соединение формулы I-2



8. Способ борьбы с несельскохозяйственными вредителями, заключающийся в обработке вредителей или их пищи, мест обитания, мест размножения или очагов пестицидно эффективным количеством соединения формулы (I), определенного в пп.1, 6 или 7.

9. Способ по п.8, в котором несельскохозяйственные вредители выбраны из группы, включающей классы Chilopoda и Diplopoda и отряды Isoptera, Diptera, Blattaria (Blattodea), Dermaptera, Hemiptera, Hymenoptera, Orthoptera, Siphonaptera, Thysanura, Phthiraptera, Araneida, Parasitiformes и Acaridida.

10. Способ по п.8 или 9, в котором несельскохозяйственные вредители выбраны из группы, состоящей из отрядов Isoptera, Blattaria (Blattodea), Diptera, Hymenoptera, Siphonaptera, Orthoptera и Ixodida.

11. Способ защиты неживых органических материалов от несельскохозяйственных вредителей, выбранных из группы, состоящей из классов Diplopoda и отрядов Isoptera, Diptera, Blattaria (Blattodea), Dermaptera, Hemiptera, Hymenoptera, Orthoptera и Thysanura, заключающийся в обработке вредителей или их пищи, мест обитания, мест размножения, очагов или неживых органических материалов пестицидно-эффективным количеством соединения формулы (I), определенного в пп.1, 6 или 7.

12. Способ защиты животных от несельскохозяйственных вредителей, выбранных из группы, состоящей из классов Chilopoda и отрядов Araneida, Hemiptera, Diptera, Phthiraptera, Siphonaptera, Parasitiformes и Acaridida, заключающийся в обработке вредителей в водоемах и/или в строениях или вокруг них пестицидно эффективным количеством соединения формулы (I), определенного в пп.1, 6 или 7.

13. Способ по п.12, в котором несельскохозяйственные вредители выбраны из группы, состоящей из отрядов Diptera, Phthiraptera, Siphonaptera и Parasitiformes.

14. Композиция приманки для привлечения несельскохозяйственных вредителей, которая содержит пестицидно эффективное количество соединения формулы (I), определенного в пп.1, 6 или 7, и аттрактант.

