



Ausschliessungspatent

Erteilt gemäß § 5 Absatz 1 des Änderungsgesetzes
zum Patentgesetz

ISSN 0433-6461

(11)

208 908

Int.Cl.³

3(51) A 01 N 47/06

AMT FÜR ERFINDUNGS- UND PATENTWESEN

In der vom Anmelder eingereichten Fassung veröffentlicht

21) AP A 01 N/ 2470 013
31) 337039

(22) 04.01.83
(32) 04.01.82

(44) 18.04.84
(33) US

71) siehe (73)
72) WONG, RAYMAN Y.; US;
73) STAUFFER CHEMICAL COMPANY, RICHMOND, US
74) IPB (INTERNATIONALES PATENTBUERO BERLIN) 61845/11/37/36 1020 BERLIN WALLSTRASSE
23/24

4) INSEKTENVERDRAENGENDE ZUSAMMENSETZUNG

57) Die Erfindung betrifft eine insektenverdrängende Zusammensetzung für die Anwendung beispielsweise in Cremes, Lotionen, Puder, Hautbräunungsölen, Insektiziden. Ziel der Erfindung ist die Bereitstellung neuer Zusammensetzungen mit verbesserter insektenverdrängender Wirkung. Erfindungsgemäß enthalten die neuen Zusammensetzungen (a) eine zur Verdrängung von Insekten wirksame Menge einer Verbindung mit der Formel, worin R ein Alkyl, Cycloalkyl, Alkyl, Chlorphenyl oder Chlorobenzyl ist, R₁ Wasserstoff oder ein niederes Alkyl, und n eins, zwei oder drei ist und (b) ein inaktives Verdünnungsmittel oder eine zur Insektenverdrängung geeignete Trägersubstanz. Formel

247 001 3 -1-

Berlin, den 23.6.1983

AP C 08 G/247 001/3

61 845/11

Insektenverdrängende Zusammensetzung

Anwendungsgebiet der Erfindung

Die Erfindung betrifft eine insektenverdrängende Zusammensetzung für die Anwendung beispielsweise in Cremes, Lotionen, Puder, Hautbräunungsölen, Insektiziden.

Charakteristik der bekannten technischen Lösungen

Insektenabwehrmittel sind bekannt. Beispielsweise besitzt N,N-Diethyl-m-toluamid, das industriell hergestellt und unter dem Namen "Deet" gehandelt wird, insektenabwehrende Wirkung.

Ziel der Erfindung

Ziel der Erfindung ist die Bereitstellung von neuen Zusammensetzungen mit verbesserter insektenverdrängender Wirkung.

Darlegung des Wesens der Erfindung

Der Erfindung liegt die Aufgabe zugrunde, neue Verbindungen mit den gewünschten Eigenschaften aufzufinden, die als Wirkstoff in insektenverdrängenden Zusammensetzungen geeignet sind.

Erfindungsgemäß werden in den neuen insektenverdrängenden Zusammensetzungen neuartige Verbindungen der Formel

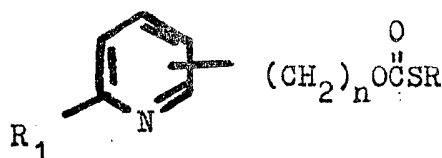
-4. JUL 1983*101041

247001 3 -2-

23.6.1983

AP C 08 G/247 001/3

61 845/11



verwendet,

in welcher R einem Alkyl, Cycloalkyl, Aralkyl, Chlorphenyl oder Chlorbenzyl entspricht, R₁ für Wasserstoff oder ein niederes Alkyl steht und n für 1, 2 oder 3 steht. Handelt es sich bei R um Wasserstoff, dann kann die Seitenkette in der 2-, 3- oder 4-Stellung an den Pyridin-Ring substituiert werden; handelt es sich bei R um ein niederes Alkyl, dann kann die Seitenkette an der 2-Position angelagert werden.

Der Begriff "Alkyl" bezieht sich auf gerad- oder verzweigte gesättigte Hydrocarbyl-Komponenten mit 1 bis 20, vorzugsweise aber 1 bis 12 Kohlenstoffatomen. Der Begriff "niederes Alkyl" bezieht sich auf Komponenten mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen. Der Begriff "Cycloalkyl" bezieht sich auf cyclische gesättigte Hydrocarbyl-Komponenten mit 3 bis 7 Kohlenstoffatomen wie beispielsweise Cyclohexyl. Der Begriff "Aralkyl" bezieht sich auf aromatische Komponenten, welche an eine aliphatische (gerad- oder verzweigte) Komponente gebunden sind, wobei die aromatische Komponente vorzugsweise 1 bis 3, besser noch 1 oder 2, Kohlenstoffatome aufweist und beispielsweise als Benzyl oder Phenethyl vorliegt.

Die Verbindungen sind als Insektenabwehrstoffe einsetzbar, insbesondere zur Abwehr fliegender Insekten

247001 3 -2a-

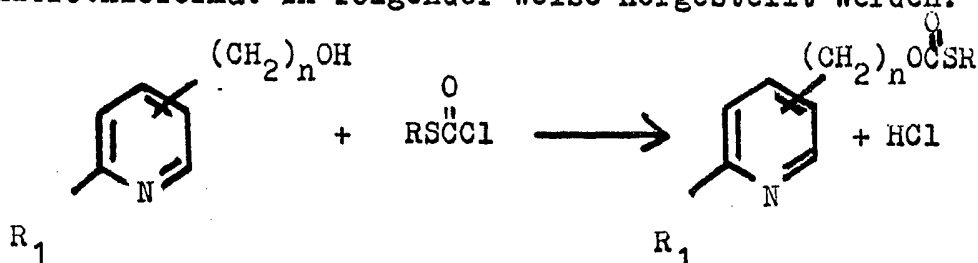
23.6.1983

AP C 08 G/247 001/3

61 845/11

in bezug auf das Sich-Niederlassen und/oder Fressen.

Die Verbindungen des genannten Typs können durch Reaktion eines passenden Pyridyl-Alkanols mit einem geeigneten Chlorothioformat in folgender Weise hergestellt werden:



Die Pyridyl-Alkanole, in denen R einem niederen Alkyl entspricht, können, sofern sie nicht im Handel erhältlich sind, beispielsweise unter Anwendung des von Umezawa et al. in der Japanischen Patentbeschreibung 74/13180 beschriebenen Verfahrens synthetisiert werden.

Die Reaktion wird im allgemeinen bei Temperaturen von etwa 0 °C bis etwa 25 °C in Anwesenheit eines Lösungsmittels wie etwa Methylenchlorid wie auch in Anwesenheit eines Hydrogenchlorid-Akzeptors wie etwa Natriumbicarbonat, Triethylamin oder Pyridin durchgeführt. Das Produkt wird durch konventionelles Extrahieren, Waschen, Filtrieren sowie - erforderlichenfalls - weitere Reinigungsschritte dargestellt. Wahlweise kann der Hydrogenchlorid-Akzeptor zugesetzt werden, nachdem die Reaktion der Vollendung entgegengegangen ist.

Ausführungsbeispiel

Die Erfindung wird nachstehend an einigen Beispielen näher erläutert.

247001 3 -2b-

23.6.1983

AP C 08 G/247 001/3

61 845/11

Die Herstellung derartiger Verbindungen wird durch das nachstehende Ausführungsbeispiel veranschaulicht.

Herstellung von S-Methyl,0/3-(3-pyridyl)-1-propyl7thio-
carbonat

(im folgenden Verbindung 1)

In einen Kolben wurden 5,0 g (0,0364 Mol) 3-(3-Pyridyl)-1-propanol sowie 50 ml Methylenchlorid eingebracht. Der Kolben wurde auf 0 °C heruntergehühlt. Sodann wurden unter Verrühren

247001 3

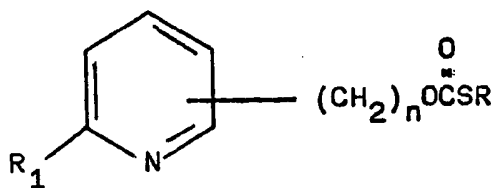
-3-

4,4 g (0,04 Mol) Methyl-chlorothioformat in einer solchen Rate zugesetzt, daß die Temperatur auf einem Höchstwert von 15°C gehalten wurde. Nach Vollendung des Zusetzens wurde das Gemisch 1 Stunde lang bei Zimmertemperatur verrührt.

Das Produkt wurde mit gesättigtem Natriumbicarbonat neutralisiert, sodann mit Wasser ~~gewaschen~~ und gesättigtem Natriumchlorid gewaschen sowie über Natriumsulfat getrocknet. Die getrocknete Lösung wurde gefiltert, und das Lösungsmittel wurde in vacuo abgeführt. Gewonnen wurden auf diese Weise 6,2 g (82 % der theoretischen Ausbeute) des gewünschten Produktes in Gestalt eines klaren gelben Öls, n_D^{30} 1,5335. Die Struktur des Produktes wurde vermittels Infrarotspektroskopie, magnetische Kernresonanzspektroskopie und Massenspektroskopie bestätigt.

Die folgende Tabelle I enthält eine Liste repräsentativer erfindungsgemäßer Verbindungen.

TABELLE I



Verb.- Nr.	R_1	R	Ring- Position	n	n_D^{30}
1	H	Methyl	3-	3	1,5335
2	H	Ethyl	3-	3	1,5420
3	H	Isopropyl	3-	3	1,5110
4	H	n-Propyl	3-	3	1,5165
5	H	n-Butyl	3-	3	1,5115
6	H	sek.-Butyl	3-	3	1,5145

247001 3

-4-

TABELLE I (Fortsetzung)

Verb.- Nr.	R ₁	R	Ring- Position	n	n _D ³⁰
7	H	Isobutyl	3-	3	1,5146
8	H	tert.-Butyl	3-	3	1,5122
9	H	3-Methylbutyl	3-	3	1,5120
10	H	n-Hexyl	3-	3	1,5077
11	H	Cyclohexyl	3-	3	1,5720
12	H	C(CH ₃) ₂ C ₂ H ₅	3-	3	1,5127
13	H	p-Chlorphenyl	3-	3	1,5838
14	H	n-Dodecyl	3-	3	1,4964
15	H	Benzyl	3-	3	1,5615
16	H	2-Methylbutyl	3-	3	1,5030
17	H	Ethyl	4-	3	1,5380
18	Methyl	Ethyl	2-	3	1,5145
19	H	Methyl	2-	3	1,5610
20	Methyl	Methyl	2-	3	1,5191
21	H	n-Propyl	4-	3	1,5126
22	Methyl	n-Propyl	2-	3	1,5100
23	H	Isopropyl	4-	3	1,5431
24	Methyl	Isopropyl	2-	3	1,5047
25	H	n-Butyl	4-	3	1,5286
26	Methyl	n-Butyl	2-	3	1,5029
27	Methyl	sek.-Butyl	2-	3	1,5041
28	H	sek.-Butyl	4-	3	1,5016
29	Methyl	Isobutyl	2-	3	1,5021
31	Methyl	tert.-Butyl	2-	3	1,5027
32	H	tert.-Butyl	4-	3	1,5177
33	H	Methyl	2-	3	1,5230
34	H	Ethyl	2-	3	1,5167
35	H	Isopropyl	2-	3	1,5102
36	H	n-Butyl	2-	3	1,5070
37	H	sek.-Butyl	2-	3	1,5073
38	H	Isobutyl	2-	3	1,5087
39	H	n-Propyl	2-	3	1,5141

247001 3

-5-

TABELLE I (Fortsetzung)

Verb.- Nr.	R ₁	R	Ring- Position	n	³⁰ n _D
40	H	tert.-Butyl	2-	3	1,5067
41	H	Benzyl	4-	3	1,5750
42	H	Benzyl	2-	3	1,5664
43	Methyl	Benzyl	2-	3	1,5602
44	H	Phenethyl	2-	3	1,5581
45	H	Phenethyl	4-	3	1,5572
46	H	Phenethyl	3-	3	1,5560
47	Methyl	Phenethyl	2-	3	1,5535
48	H	p-Chlorphenyl	4-	3	1,5766
49	H	p-Chlorphenyl	2-	3	1,5756
50	Methyl	p-Chlorphenyl	2-	3	1,5742
51	H	n-Octyl	4-	3	1,5018
52	H	n-Octyl	3-	3	1,5023
53	H	n-Octyl	2-	3	1,5015
54	Methyl	n-Octyl	2-	3	1,5000
55	H	tert.-Butyl	3-	1	1,5228
56	H	tert.-Butyl	2-	2	1,5011
57	H	Isopropyl	3-	1	1,5191
58	H	Isopropyl	2-	2	1,5125
59	H	p-Chlorbenzyl	3-	3	1,5603

Die Strukturen der Verbindungen in der vorstehenden Tabelle I wurden vermittle Infrarotspektroskopie, magnetische Kernresonanzspektroskopie und/oder Massespektroskopie bestätigt.

Insektenabwehrmittel-Tests

Die in der obigen Tabelle I beschriebenen Verbindungen wurden hinsichtlich ihrer Insekten-Abwehrwirkung vermittle der nachstehenden Verfahren geprüft:

Moskitos

Ein mit Puppen des Moskitos Culex pipiens quinquefasciatus (Say)

247001 3

-6-

gefüllter Pappbacher wurde in einen Gazekäfig eingebracht, wobei den Puppen Gelegenheit gegeben wurde, sich zu fertigen Insekten weiterzuentwickeln. Sodann wurden Würfelzuckerstücke mit 1,0 ml einer 0,1 Masseprozent Testverbindung enthaltenden Acetonlösung getränkt; als Kontrollvariante wurde die gleiche Acetonmenge ohne Prüfverbindung appliziert. Nach dem Trocknen der Würfelzuckerstücke wurden diese in ~~die~~ den Gazekäfig eingebracht. Die Abwehrwirkung wurde durch die Anzahl der fertig entwickelten Moskitos bestimmt, welche sich auf den Zuckerstücken niederließen und fraßen; die Beobachtungen erfolgten über die der Behandlung folgenden fünf Tage hinweg. Aufgezeichnet wurde die Anzahl der Tage, an denen eine vollständige Abwehrwirkung der Zuckerstücke auf die Moskitos beobachtet wurde.

In ähnlicher Weise wurden Vergleichprüfungen unter Einsatz der Verbindung N,N-Diethyl-m-toluamid vorgenommen, bei der sich um ein ~~das~~ industriell hergestelltes und im allgemeinen unter dem generischen Namen "Deet" bekanntes Insektenabwehrmittel handelte. Die in der mit Deet durchgeführten Prüfung erzielten Ergebnisse wie auch die in den mit den Verbindungen der Tabelle I durchgeführten Prüfungen erzielten Ergebnisse sind in der nachstehenden Tabelle II aufgeführt. Die in jeder Säule angegebenen Zahlen entsprechen den Tagen vollständiger Abwehrwirkung, wie sie bei Anwendung der angegebenen Konzentration beobachtet wurde.

TABELLE II (Southern House Moskito)

<u>Verbindung</u>	<u>Abwehrtage, 0,1 Masseprozent</u>
1	11
2	11
3	>5
4	>5
5	>5
6	>5
7	>5
8	>5
9	3,5
10	3
11	3
12	4,5
13	3

247001 3

-7-

TABELLE II (Fortsetzung)

<u>Verbindung</u>	<u>Abwehrtage, 0,1 Masseprozent</u>
14	2
17	1
18	3
19	1
Deet	1
Kontrolle	0

Stubenfliegen: In diesem Test wurde die Stubenfliege, Musca domestica (L.), verwendet. Einhundert Stubenfliegen beiderlei Geschlechts wurden in Prüfkäfige eingesetzt. In jeden Käfig wurde ein Zuckerwürfel eingebracht, welcher mit 1,0 ml Aceton getränkt worden war; das 1 Masseprozent der Prüfverbindung enthielt. Vor dem Einbringen in den Käfig war der Zuckerwürfel getrocknet und gewogen worden. Zur Bereitstellung von Feuchtigkeit enthielt jeder Käfig darüber hinaus einen wassergesättigten Baumwollstopfen. Die Prüfkäfige wurden auf eine Drehscheibe gesetzt und mit 1,5 U/min bewegt, um eine zufällige Verteilung der Fliegen innerhalb des Käfigs zu erhalten. Nach 48 h wurden die Fliegen in jedem Käfig mit Kohlendioxid anästhesiert. Die Würfelzuckerstücke wurden entnommen und erneut gewogen, wobei der prozentuale Masseverlust (auf Grund des Verbrauchs durch die Fliegen) ermittelt wurde. Durch Dividieren des prozentualen Masseverlustes des behandelten Zuckerwürfels durch den Masseverlust eines lediglich mit Aceton behandelten Kontroll-Zuckerwürfels wurde ein Abwehrwirkungsverhältnis berechnet. Je niedriger das Abwehrwirkungsverhältnis, desto größer die Abwehrwirkung der Prüfverbindung. Die Abwehrwirkungsverhältnisse der Prüfverbindungen sind in der folgenden Tabelle III aufgeführt. Die dort abgegebenen Werte repräsentieren den Durchschnitt von einer bis drei Wiederholungen pro Verbindung.

247001 3

-8-

TABELLE III (Stubenfliege)

Verbindung	Abwehrwirkungsver- hältnis; Konzen- tration, 1 Masse-%	Verbindung	Abwehrwirkungsver- hältnis; Konzen- tration, 1 Masse-%
1	0,48	31	0,35
2	0,37	32	0,27
3	0,38	33	0,61
4	0,38	34	0,37
5	0,39	35	0,28
6	0,33	36	0,37
7	0,38	37	0,18
8	0,37	38	0,32
9	0,25	39	0,43
10	0,29	40	0,31
11	0,40	41	0,43
12	0,18	42	0,51
13	0,57	43	0,64
14	0,66	44	0,52
17	0,18	45	0,68
18	0,36	46	0,37
19	0,42	47	0,64
20	0,46	49	0,50
21	0,24	50	0,55
22	0,36	51	0,32
23	0,54	52	0,37
24	0,34	53	0,54
25	0,38	54	0,58
26	0,36	55	0,26
27	0,31	56	0,37
28	0,19	57	0,32
29	0,52	58	0,37
30	0,37	59	0,35
31	0,35	Deet	0,60
32	0,27		
33	0,61		
34	0,37		
35	0,28		

Mithin wehrte eine Konzentration der Prüfverbindungen von 1 Masseprozent die Insekten in einem Maße ab, daß der Masseverlust der mit diesen Verbindungen behandelten Zuckerwürfel generell unter 50 % jenes Masseverlustes lag, der bei den (unbehandelten) Kontrollwürfeln festgestellt wurde.

247001 3

-9-

Stallfliege; Gelbfiebermoskito

Bei den in diesen Prüfungen verwendeten Insekten handelte es sich um die Stallfliege, Stomoxys calcitrans und den Gelbfiebermoskito Aedes aegypti.

Puppen dieser Insekten wurden in separate Standard-Fliegenkäfige eingebracht und bis zur Umwandlung in fertige Insekten gehalten. Die Moskitos wurden mit einer Zuckerwasserlösung versorgt; die Stallfliegen wurden mit Wasser, Zuckerwürfeln und Kasein versorgt. Die Tests an den Moskitos wurden mindestens über drei Tage nach dem Schlüpfen der fertigen Insekten hinweg durchgeführt; die Tests an den Stallfliegen wurden über einen Tag nach dem Schlüpfen hinweg durchgeführt, dies auf Grund der kurzen Lebensdauer (4...5 Tage) dieser Fliegen bei Vorenthaltung einer Blutmahlzeit.

Die Prüfverbindungen wurden gewogen und in Aceton aufgelöst. Ein Milliliter (ml) der Prüfverbindung wurde mittels Pipette auf ein 9 x 9 cm großes Stück Baumwollvorlage aufgebracht. Diese Stücke wurden dann über 1 h hinweg getrocknet.

In einer oberen Ecke einer Seite jedes der Fliegenkäfige wurde eine quadratische Öffnung von 6 x 6 cm angebracht. Über die Öffnung wurde eine große, feste Pappscheibe dergestalt platziert, daß sie beim Drehen die Öffnung entweder verdeckte oder freigab. Eine Hälfte der Scheibe wurde unversehrt gelassen, in die andere Hälfte wurden mehrere 6 x 6 cm große quadratische Öffnungen geschnitten. Wurde die intakte Hälfte der Scheibe über die Öffnung im Fliegenkäfig geschoben, so bewirkte dies eine wirk-same Abdeckung.

Die Stücke der behandelten Baumwollvorlage wurden über die in die Scheibe geschnittenen quadratischen Öffnungen gelegt und mittels Metallrahmen und Magnetstreifen an Ort und Stelle gehalten.

Bei Prüfbeginn wurde die Scheibe dergestalt gedreht, daß eine

behandelte Vorlage über die Käfigöffnung zu liegen kam. Die innere Handfläche des den Test Ausführenden wurde nunmehr über einen 1 cm starken und einen Durchmesser von 8 cm aufweisenden Pappring gelegt. Der Ring wirkte als Abstandhalter und schützte die Hand vor Bissen, welche anderenfalls durch die Insekten zugefügt worden wären. Desweiteren wurde durch einen Schlauch ein Luftstrom in die Öffnung ~~geblasen~~ ^{geblasen}, so daß die Insekten durch die warme, feuchte Luft und die Hand des Prüfenden zur Vorlage gelockt wurden. Während einer jeweils einminütigen Exposition wurde die Anzahl der auf der Vorlage landenden Insekten wie auch die Anzahl der die Vorlage sondierenden Insekten ermittelt. Vom Vorliegen einer Abwehrwirkung wurde ausgegangen, wenn 5 oder weniger Insekten die Vorlage während der Expositionszeit von einer Minute sondierten.

Die Verbindungen wurden in Aufwandmengen von $0,1 \text{ mg/cm}^2$ Vorlage und darunter geprüft. Die Ergebnisse dieser Prüfungen bei Stallfliegen (SF) und Gelbfiebermoskitos (GFM) sind in Tabelle IV dargestellt.

TABELLE IV (Stallfliege, Gelbfiebermoskito)

Abwehrstoffkonz., mg/cm^2			Abwehrstoffkonz., mg/cm^2		
Verb.- Nr.	SF	GFM	Verb.- Nr.	SF	GFM
1	0,03	0,1	36	> 0,1	> 0,1
2	0,03	0,1	37	> 0,1	0,03
15	> 0,1	> 0,1	38	> 0,1	0,03
16	> 0,1	> 0,1	39	> 0,1	0,03
20	> 0,1	> 0,1	40	> 0,1	0,1
21	0,1	> 0,1	41	> 0,1	> 0,1
22	> 0,1	> 0,1	42	> 0,1	> 0,1
23	> 0,1	> 0,1	43	> 0,1	> 0,1
24	> 0,1	> 0,1	44	> 0,1	> 0,1
25	> 0,1	> 0,1	45	> 0,1	> 0,1
26	> 0,1	> 0,1	46	> 0,1	> 0,1
27	> 0,1	> 0,1	47	> 0,1	> 0,1
28	> 0,1	> 0,1	48	> 0,1	> 0,1
29	> 0,1	> 0,1	49	> 0,1	> 0,1
30	> 0,1	> 0,1	50	> 0,1	> 0,1
31	> 0,1	0,1	51	> 0,1	> 0,1
32	> 0,1	> 0,1	52	> 0,1	> 0,1
33	> 0,1	> 0,1	53	> 0,1	> 0,1
34	> 0,1	0,03	54	> 0,1	> 0,1
35	> 0,1	0,03	59	> 0,1	--

Phormia regina; Haematobia irritans

Die Verbindungen 1 und 2 wurden hinsichtlich ihrer Abwehrwirkung gegenüber Phormia regina und Haematobia irritans geprüft. Die Tests mit Phormia regina wurden in ähnlicher Weise wie die Stubenfliegen-Tests durchgeführt; die Tests mit Haematobia irritans wurden in ähnlicher Weise wie die Stallfliegen-Tests durchgeführt. Die Ergebnisse sind in der folgenden Tabelle V aufgeführt.

TABELLE V

Verb.- Nr.	<u>Phormia regina,</u> Abwehrwirkungsver- hältnis, 0,1 Masse-%	<u>Haematobia irritans</u> Abwehrstoffkonzentra- tion, mg/cm ²
1	0,42	0,1
2	0,54	0,03

Die neuartigen Verbindungen der vorliegenden Erfindung können sowohl verdünnt als auch in unverdünnter Form als Insektenabwehrmittel eingesetzt werden. Bei Einsatz in einer verdünnten Form können die Verbindungen in Zusammensetzungen eingebettet werden, welche verhältnismäßig niedrige oder auch verhältnismäßig hohe Konzentrationen der aktiven Verbindungen enthalten. Beispielsweise kann der Wirkstoff in relativ hochkonzentrierte Zusammensetzungen wie etwa in Naßspritzmittel oder auch in Lösungen in Alkohol oder andere geeignete Lösungsmittel eingebaut werden. Derartige Zusammensetzungen können zusätzlich zum Wirkstoff Hilfsstoffe wie etwa Emulgierungshilfsmittel, oberflächenaktive Substanzen, Antioxidantien und Treibmittel enthalten, wie sie normalerweise in Insektenabwehrstoff-Zubereitungen vorgefunden werden können. Die Wirkstoffe der vorliegenden Erfindung können als alleinige aktive Komponente derartiger Zusammensetzungen eingesetzt werden, sie können aber auch als Beimischung zu anderen Verbindungen mit ähnlicher oder unterschiedlicher Nutzbarkeit verwendet werden. So können die Ver-

bindungen beispielsweise in Cremes, Lotionen, Puder, Hautbräunungsöle; Insektizide sowie weitere pestizid oder anderweitig nutzbare Stoffe enthaltende Präparationen einbezogen werden; sie können aber auch in verschiedenartige Zusammensetzungen einbezogen werden, wie sie zur Behandlung von Geweben oder Kleidungsstücken angewendet werden, um dieselben insektenabweisend zu machen. Im allgemeinen können die Zusammensetzungen für den Einsatz als Insektenabwehrmittel die neuartigen Verbindungen in einem Anteil von 0,5...80 Masseprozent - vorzugsweise von 2 bis etwa 40 Masseprozent - enthalten. Hochkonzentrierte Formulierungen mit einem Gehalt von bis zu 95 % Wirkstoff könnten darüber hinaus für niedrigvolumige Spritzungen aus der Luft verwendet werden.

Typische Formulierungen, in denen erfindungsgemäße Verbindungen genutzt werden, sind beispielsweise:

Beispiel 1: Emulgierbares Konzentrat

<u>Komponente</u>	<u>Masseprozent</u>
Verbindung 1	53,6
Aromatisches Kohlenwasserstoff-Lösungsmittel	36,4
Emulgator	10,0
Gesamt	100,0

Beispiel 2: Lotion

<u>Komponente</u>	<u>Masseprozent</u>
Verbindung 37	10,7
Lanolin	4,8
Mineralöl	8,0
Trihydroxyethylamin-stearat	1,8
Glycosterin	0,8
Glycerol	4,6
Natriumbenzoat	1,0
Wasser	68,3
Gesamt	100,0

247001 3

-13-

Beispiel 3: Alkohollösung

<u>Komponente</u>	<u>Masseprozent</u>
Verbindung 38	53,6
Isopropanol	46,4
Gesamt	100,0

Beispiel 4: Alkohollösung

<u>Komponente</u>	<u>Masseprozent</u>
Verbindung 39	80,0
Ethanol	20,0
Gesamt	100,0

Beispiel 5: Suspensionsspritzmittel

<u>Komponente</u>	<u>Masseprozent</u>
Verbindung 2	26,9
Hydriertes Calciumsilikat	62,1
Natriumlignosulfonat	5,0
Orzan A. (gemisch aus Ammoniumlignosulfonat und Holzzuckern)	5,0
Netzmittel	1,0
Gesamt	100,0

Beispiel 6: Schwach konzentrierte Lösung

<u>Komponente</u>	<u>Masseprozent</u>
Verbindung 34	0,1
Kerosen	99,9
Gesamt	100,0

Beispiel 7: Alkohollösung

<u>Komponente</u>	<u>Masseprozent</u>
Verbindung 2	90,0
Ethanol	10,0
Gesamt	100,0

247001 3

-14-

Beispiel 8: Granulat

<u>Komponente</u>	<u>Masseprozent</u>
Verbindung 1	1,0
Ethanol	10,0
Attapulgit-Granulat	89,0
Gesamt	100,0

Beispiel 9: Suspensionsspritzmittel

<u>Komponente</u>	<u>Masseprozent</u>
Verbindung 35	80,0
Hydriertes Calciumsilikat	9,0
Natriumlignosulfonat	5,0
Orzan A	5,0
Netzmittel	1,0
Gesamt	100,0

247 001 3 -15-

23.6.1983

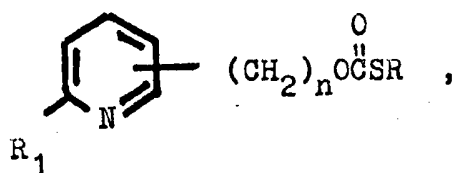
AP C 08 G/247 001/3

61 845/11

Erfindungsanspruch

1. Insektenverdrängende Zusammensetzung, gekennzeichnet dadurch, daß sie enthält:

(a) eine zur Verdrängung von Insekten wirksame Menge einer Verbindung mit der Formel



worin R ein Alkyl, Cycloalkyl, Aralkyl, Chlorphenyl oder Chlorbenzyl ist, R₁ Wasserstoff oder ein niederes Alkyl, und n eins, zwei oder drei ist und

(b) ein inaktives Verdünnungsmittel oder eine zur Insektenverdrängung geeignete Trägersubstanz.

2. Zusammensetzung nach Punkt 1, gekennzeichnet dadurch, daß die Seitenkette des Pyridinringes auf der 2-Position substituiert wird.
3. Zusammensetzung nach Punkt 1, gekennzeichnet dadurch, daß die Seitenkette des Pyridinringes auf der 3-Position substituiert wird.

247001 3 -16-

23.6.1983

AP C 08 G/247 001/3

61 845/11

4. Zusammensetzung nach den Punkten 1 bis 3, gekennzeichnet dadurch, daß R_1 Wasserstoff ist und R ein Alkyl.
5. Zusammensetzung nach den Punkten 1 bis 4, gekennzeichnet dadurch, daß R ein $C_1 - C_{12}$ Alkyl ist.
6. Zusammensetzung nach Punkt 1, gekennzeichnet dadurch, daß R_1 Wasserstoff ist, R Methyl ist, n gleich 3 ist und die Seitenkette des Pyridinringes auf der 3-Position substituiert wird.
7. Zusammensetzung nach Punkt 1, gekennzeichnet dadurch, daß R_1 Wasserstoff ist, R Ethyl ist und die Seitenkette des Pyridinringes auf der 3-Position substituiert wird.
8. Zusammensetzung nach Punkt 1, gekennzeichnet dadurch, daß R_1 Wasserstoff ist, R Ethyl ist, n gleich 3 ist und die Seitenkette des Pyridylringes auf der 2-Position substituiert wird.
9. Zusammensetzung nach Punkt 1, gekennzeichnet dadurch, daß R_1 Wasserstoff ist, R Isopropyl ist, n gleich 3 ist und die Seitenkette des Pyridinringes auf der 2-Position substituiert wird.
10. Zusammensetzung nach Punkt 1, gekennzeichnet dadurch, daß R_1 Wasserstoff ist, R sek.-Butyl ist, n gleich 3 ist und die Seitenkette des Pyridinringes auf der 2-Position substituiert wird.

247001 3 -17-

23.6.1983

AP C 08 G/247 001/3

61 845/11

11. Zusammensetzung nach Punkt 1, gekennzeichnet dadurch,
daß R₁ Wasserstoff ist, R Isobutyl ist, n gleich 3 ist
und die Seitenkette des Pyridinringes auf der 2-Position
substituiert wird.
12. Zusammensetzung nach Punkt 1, gekennzeichnet dadurch,
daß R₁ Wasserstoff ist, R n-Propyl ist, n gleich 3 ist
und die Seitenkette des Pyridinringes auf der 2-Position
substituiert wird.