

Винахід відноситься до нового пестицидного способу боротьби з довгоносиками, наприклад, *Otiorynchus sulcatus*, і до нової композиції.

В даний час відомо, що довгоносики, такі як *Otiorynchus sulcatus* (відомий також як довгоносик баштаний), є руйнівними шкідниками в сільському господарстві і садівництві. Дані комахи можуть заселяти горщечні рослини, що є на ринках комерційної садової продукції. Проблемою, яку потрібно подолати в боротьбі з цими комахами на ринках садової продукції, фактично є виявлення присутності личинок цих комах. Якщо дорослі особні можна легко виявити обстеженням ушкоджень на листях через поїдання, то ушкодження личинками дуже приховане і їх важко виявити, оскільки личинки ушкоджують рослини шляхом руйнації коренів. Таким чином, коли ушкодження виявляється, рослини вже не можуть мати шансу або можливості повернутися до норми після обробки.

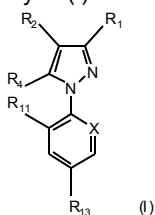
Метою винаходу є боротьба з довгоносиками, такими як *Otiorynchus sulcatus* і інші, зазначені нижче.

Ще однією метою винаходу є запобігання ушкодження рослин, наприклад, декоративних рослин, довгоносиками, такими як *Otiorynchus sulcatus*.

Другою метою винаходу є створення нової композиції для боротьби з довгоносиками, такими як *Otiorynchus sulcatus*, і іншими, зазначеними нижче.

Даний винахід вирішує цілком або частково поставлені задачі.

Винахід пропонує спосіб захисту рослин, наприклад, декоративних рослин, рослин із м'яким плодом (наприклад, суниці або малини) або сосни, від довгоносиків; даний спосіб включає застосування до середовища для вирощування, у якому рослина росте або повинно рости, інсектицидне ефективною кількості 1-арилпіразолу формули (I):



в якій

R₁ є CN або метил, або атом галогену;

R₂ є S(O)_nR₃ або 4,5-диціанімідазол-2-іл, або галогеналкіл;

R₃ є алкіл або галогеналкіл;

R₄ вибраний із групи, що складається з водню, галогену, -NR₅R₆, -C(O)OR₇, -S(O)_mR₇, алкіла, галогеналкіла, -OR₈, -N=C(R₉) (R₁₀) і -C (O) алкіла;

R₅ і R₆, незалежно, вибраний з атома водню, алкіла, галогеналкіла, -C (O) алкіла, -C (O) OR₇, -S(O)_rCF₃; або R₅ і R₆ разом утворюють двовалентний алкіленовий радикал, що може бути перерваний одним або декількома гетероатомами, переважно, вибраними з кисню, азоту і сірки;

R₇ вибраний з алкіла і галогеналкіла;

R₈ вибраний з алкіла, галогеналкіла і водню;

R₉ вибраний з водню і алкіла;

R₁₀ вибраний із фенола і гетероарила, кожний із яких не заміщений або заміщений одним або декількома гідрокси, галогенами, групами -O-алкіл, -S-алкіл, ціано або алкілами або їхніми сполученнями;

X вибраний з азоту і -C-R₁₂;

R₁₁ і R₁₂, незалежно, вибрані з галогену, водню, CN і NO₂,

R₁₃ вибраний з галогену, галогеналкілу, галогеналкокси, -S(O)_qCF₃ і -SF₅,

m, n, q, r, незалежно, вибрані з 0, 1 або 2;

за умови, що, коли R₁ є метил, R₃ є галогеналкіл, R₄ де NH₂, R₁₁ є Cl, R₁₃ є CF₃ і X є N, і за умови, що, коли R₂ є 4,5-диціанімідазол-2-іл, R₄ є Cl, R₁₁ є Cl, R₁₃ є CF₃ і X є =C-Cl.

Алкільні і алкоксигрупи і їхні фрагменти формули (I), переважно, є нижчі алкільні й алкоксигрупи, тобто групи, що мають від одного до шести атомів вуглецю. Галогеналкільні і галогеналкоксигрупи аналогічним чином, переважно, мають від одного до чотирьох атомів вуглецю. Галогеналкільні і галогеналкоксигрупи можуть мати один або декілька атомів галогену; переважні групи цього типу включають -CF₃ і -OCF₃. Повинно бути зрозуміло, що кільце, утворене двовалентним алкіленовим радикалом, поданим R₅ і R₆, і яке включає атом азоту, до якого приєднані R₅ і R₆, звичайно являє собою 5-, 6- або 7-членне кільце. Коли R₁₀ є, гетероарилом, він, переважно, є піридилом, найбільше переважно, 2-піридилом. Очевидно зрозуміло, що 1-арилпіразолі формули (I) включають їхній енантіомери і/або діастереомери і їх суміші.

Переважна група 1-арилпіразолів для використання в даному винаході є 1-арилпіразолами формули (I) з однією або декількома такими особливостями, в якій R₁ є CN;

R₄ є -NR₅R₆;

R₅ і R₆ незалежно, вибрані з атома водню, алкіла, галогеналкіла, C (O) алкілу, C(O)OR₇;

X є C-R₁₂; і

R₁₃ вибраний з атома галогену, галогеналкіла, галогеналкокси і -SF₅.

Ще одна переважна група 1-арилпіразолів формули (I) для використання в даному винаході є 1-арилпіразолами, у котрих

R₁ є CN;

R₃ є галогеналкільний радикал;

R₄ є NH₂;

X є C-R₁₂;

R₁₁ і R₁₂ є, незалежно один від одного, атом галогену; і

R₁₃ є галогеналкільний радикал.

Найбільше переважним з'єднанням є 5-аміно-1-(2,6-дихлор-4-трифторметилфеніл)-4-трифторметилсульфініл-3-ціанопіразол, яке далі позначається як з'єднання (A).

З'єднання формули (I) можна одержати відомими засобами, наприклад, як описано в Міжнародній патентній публікації WO 87/3781, 93/6089 і 94/21606, а також у заявках на Європейські патенти 295117, 403300, 385809 або

679650, Публікації патенту Німеччини 19511269 і в патентах Сполучених Штатів 5232940 і 5236938, або іншим способом у відповідності зі знаннями фахівця в області хімічного синтезу, які, як рахується, включають Кемікал Абстракте і літературу, що згадується там. Композиції, що включають з'єднання формули (I), можна також одержати відповідно до інформації того ж відомого рівня техніки або з аналогічних публікацій.

Довгоносики можуть бути із сімейства *Otiorynchus* або *Hylobius*, наприклад, довгоносики *Otiorynchus sulcatus*, *Otiorynchus ovatus* (суниця лісової), *Otiorynchus singularis*, що нападають на рослини з м'якими плодами (наприклад, суницю і малину) і *Hylobius abietis* (слоник великий сосновий).

Термін «середовище для вирощування» означає субстанцію, у якій, наприклад, рослина або насіння, із яких воно виростає, може проростати і розвиватися, або в котру його можна перенести. Середовище для вирощування рослин звичайно включає компост, торф або ґрунт для горщечної культури. Щоб полегшити рівномірний розподіл 1-арилпіразолу в середовищі для вирощування рослин, його можна застосовувати стосовно одному або більш компонентів, наприклад, піску, перліту або утримуючим воду гранулам середовища для вирощування рослин до того, як цей компонент буде введений у середовище для вирощування рослин. Утримання 1-арилпіразолу в обробленому компоненті можна регулювати, щоб забезпечити бажану кінцеву концентрацію після змішування всіх компонентів середовища для вирощування. Такі оброблені компоненти також складають одну з ознак винаходу.

1-Арилпіразол можна використовувати в сполученні з іншими активними інгредієнтами, наприклад, харчуванням для рослин або регулятором росту рослин. Композиції, що включають харчування для рослин або регулятор росту рослин, 1-арилпіразол загальної формули (I) і, необов'язково, носій і/або поверхнево-активна речовина, також складають відмінну ознаку винаходу.

Винахід відноситься до середовища для вирощування рослин, що включає кількість 1-арилпіразолу формули (I), що є ефективним для захисту рослини або насіння, із яких воно виростає, від нападу довгоносика.

Переважає середовище для вирощування рослин, в якому 1-арилпіразол розподілений по суті рівно або рівномірно на всьому протязі. 1-Арилпіразол, переважно, є присутнім на гранулах, які по суті рівно або рівномірно розподілені на всьому протязі середовища для вирощування рослин. Винахід пропонує також середовище для вирощування рослин, що включає 1-арилпіразол, описаний в описі, і упаковану, наприклад, у пластикові мішки, в якості компосту для насіння, компосту для горщечних культур або компосту для загальної цілі.

Компост може бути, наприклад, на основі ґрунту або торфу. Пластикові мішки можуть містити просто компост, кількості якого можна використовувати по потребі, або вони можуть бути у формі «контейнера для вирощування рослин», у якому можна вирощувати рослини.

Звичайно кількість 1-арилпіразолу складає від 0,01 г/м³ до 20 г/м³, наприклад, від 0,01 до 10 г/м³ 1-арилпіразолу на об'єм середовища для вирощування, переважно від 0,2 до 5 г/м³, більш переважно від 0,25 до 1 г/м³.

Спосіб винаходу, переважно, застосовують для рослин, що вирощують в контейнерах, наприклад, горщиках, сітках або в іншому гнучкому матеріалі, що містить середовище для вирощування.

Застосування 1-арилпіразолу звичайно здійснюють придатними засобами, відомими спеціалістам у даній області. Звичайно переважно застосовувати 1-арилпіразол по відношенню до середовища для вирощування рослин у вигляді твердої композиції, що складається з часток, або рідкої композиції. Більш переважно застосовувати 1-арилпіразол у вигляді твердої композиції, що складається з часток, щоб зменшити до мінімуму ефективну кількість і більш рівномірно розподілити активний інгредієнт у середовищі для вирощування.

1-Арилпіразол вводять, переважно, у середовище для вирощування у вигляді гранул. Гранули звичайно містять від 0,02% до 2% по масі 1-арилпіразолу, переважно від 0,05 до 0,5%, найбільше переважно, біля 0,1% арилпіразолу. 1-Арилпіразол використовують, переважно, у формі гранул, що містять 0,1% по масі 1-арилпіразолу, із використанням від 0,5 до 2,5 кг, переважно, від 1 до 2 кг, найбільше переважно 1 кг гранул на кубічний метр середовища для вирощування. Винахід, відповідно, стосується середовища для вирощування, яке включає гранули, що звичайно містять від 0,02% до 2% по масі 1-арилпіразолу. Гранули звичайно по суті рівномірно розподіляють по всьому середовищу для вирощування рослин.

Розмір часток у гранулах звичайно складає 100-1000 мкм, переважно, 200-900 мкм.

Насипна щільність звичайно складає 30-60 фунт/фут³ (480-960 кг/м³), переважно, 40-50 фунт/фут³ (640-800 кг/м³), найбільше переважно, 42-45 фунт/фут³ (670-720 кг/м³). Гранули можуть бути, наприклад, комерційним продуктом Chiro Choice 0,IG, виготовленим із насипною щільністю 42-45 фунт/фут³ (670-720 кг/м³). Переважний діапазон розміру часток складає від 150 до 1000 мкм, переважно, коли >95% гранул мають розмір від 355 до 856 мкм, більш переважно з 65% гранул розміром >500 мкм.

Гранули можуть містити маркер, наприклад, що офарблює агент, для полегшення контролювання їхнього розподілу в середовищі для вирощування під час змішування.

1-Арилпіразол можна також вводити в середовище для вирощування, наприклад, розпиленням водяної дисперсії 1-арилпіразолу на середовище для вирощування під час його виготовлення або обробки.

Взагалі спосіб за даним винаходом використовують профілактично: тобто застосування 1-арилпіразолу використовують для запобігання або зниження нападу довгоносиків, таких як *Otiorynchus sulcatus*, на рослину. Проте, винахід можна використовувати також у лікувальних цілях, у тому розумінні, що середовище, заражене довгоносиками, такими як *Otiorynchus sulcatus* або іншими, зазначеними вище, можна обробити для знищення основної частини комах після того, як рослина була уражена. Звичайно при лікувальній обробці переважно застосовувати 1-арилпіразол у вигляді рідкої композиції для швидкого проникнення його в середовище.

Коли використовують рідку композицію, концентрація 1-арилпіразолу звичайно складає від 0,2 г на 100 літрів до 5 г на 100 літрів рідкої композиції, наприклад, від 0,5 до 2 г на 100 літрів, наприклад, біля 1 г на 100 літрів.

Спосіб винаходу можна використовувати для забезпечення довгострокового захисту рослин, декоративних рослин, від довгоносиків, таких як *Otiorynchus sulcatus*. Звичайно, спосіб винаходу забезпечує захист на період від 0,1 року до 5 років, переважно, від 0,3 року до 3 років, найбільше переважно від 0,5 року до 2 років.

Наступні приклади ілюструють винахід.

Приклад 1

У іспиті з двадцятьма повтореннями з'єднання А вводили в компост змішуванням 2% мас./мас. гранул з компостом (субстрат 2 Класманна (на основі торфу)) із використанням невеликого механічного змішувача. Рослини атровієни, *Thuja plicata*, висаджувалися в горщиках у компост і залишалися для росту протягом двох

місяців, і потім у ґрунт добавляли біля 15 яєчок *Otiorynchus sulcatus* і покривали невеликим шаром компосту. Для порівняння такий же компост не оброблявся, інший компост оброблявся стандартним хлорпірифосом у формі комерційного продукту suSCon Green ®. Через 27 днів ґрунт повторно заражали ще 15 яєчками. Горщики з рослинами розташовувалися так, щоб рослини піддавалися дії світла, і дорослі жуки, що з'являлися, не могли втекти.

З двадцятьох повторів кожного іспиту п'ять оцінювали через 6 місяців і п'ятнадцять оцінювали через 18 місяців на кількість личинок і дорослих особень. Через 6 місяців були відзначені такі результати:

З'єднання	Доза, г/м ³	Загальна кільк. личинок	Кількість на горщик	% знищення
Необроблені	0	31	3,1	0
A	2,5	0	0	100
A	5	0	0	100
A	7,5	0	0	100
A	15	0	0	100
Хлорпірифос	75	4	0,8	87

Такі результати були отримані через 18 місяців:

З'єднання	Доза, г/м ³	Всього рослин, що загинули	% рослин, що вижили	Загальна кількість личинок	Кількість на горщик	% знищення
Необроблене	0	7	72	51	3,1	0
A	2,5	0	100	0	0	100
A	5	0	100	0	0	100
A	7,5	0	100	0	0	100
A	15	0	100	0	0	100
Хлорпірифос	75	0	100	47	3,1	0

Приклад 2

У іспитах із 20 повтореннями гібрид cv. Koralle Fuchsia triphylla заражувався 15 яєчками на горщик слоника сірого. З'єднання А в формі 80% гранул (Регент 800 WG), що диспергуються у воді, суспендирували у воді і подавали в кожний горщик при зазначеній нормі на площу поверхні горщика при різних розбавленнях. Іспити оцінювали через 6 місяців. З'єднання А захищало рослини значно краще, чим комерційний стандартний фонофос при лікувальній обробці.

Обробка просочуванням

№ обробки		Доза, мг/м ²	у літрі	Загальна кількість личинок	Кількість на горщик	Контроль
1	Необроб. Контроль			44	2,2	
2	регент 800WG	1,25	5	25	1,25	43%
3	регент 800WG	1,25	10	30	1,5	32%
4	регент 800WG	1,25	20	12	0,6	73%
5	регент 800WG	2,5	5	10	0,5	77%
6	регент 800WG	2,5	10	18	0,9	59%
7	регент 800WG	2,5	20	10	0,5	77%
8	регент 800WG	5	5	8	0,4	82%
9	регент 800WG	5	10	11	0,55	75%
10	регент 800WG	5	20	15	0,75	66%
11	регент 800WG	10	10	5	0,25	89%
12	Cudgel, мл (фонофос)	2,5	10	32	1,6	27%