



УКРАЇНА

(19) UA (11) 48176 (13) C2

(51) 6 A01N47/02,43/56

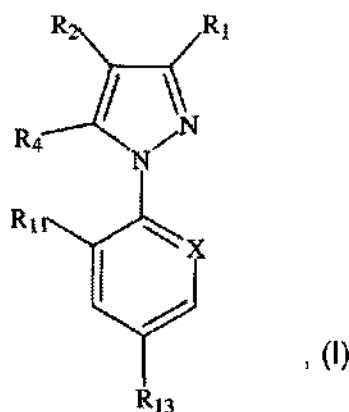
МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ
І НАУКИ УКРАЇНИДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІОПИС
ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД

(54) СПОСІБ ПРИВАБЛЮВАННЯ ТА БОРОТЬБИ З КОМАХАМИ

1

2

(21) 97115389
(22) 27 03 1996
(24) 15 08 2002
(86) PCT/EP96/01334, 27 03 1996
(31) 08/419,609
(32) 10 04 1995
(33) US
(46) 15 08 2002, Бюл. № 8, 2002 р.
(72) Девідсон Томас Чарльз, US, Вернер Георгіна М., US
(73) РОН-ПУЛЕНК АГРОШІМІ, FR
(56) UA, С 1, 26376, 30 08 1999, кл. C07D 231/14 RU, С 1, 2088580, 27 08 1997, кл. C07D 401/04 US, А, 5 232 940, 03 08 1993, кл. A01N 43/56 WO 87/03781, 02 07 1987, кл. A01N 43/56 WO 93/06089, 01 04 1993, кл. C07D 231/44 WO 94/21606, 29 09 1994, кл. C07D 207/36
(57) 1 Спосіб приваблювання та боротьби з комахами, який включає пропонування згаданим комахам для ковтання ефективної кількості сполуки формули



в якій
R₁ - є CN або метилом,
R₂ - є S(O)_nR₃,
R₃ - є алкілом або галогеналкілом,
R₄ - вибраний із групи, що включає атом водню, атом галогену та радикал, який може бути -NR₅R₆, -S(O)_mR₇, алкілом, галогеналкілом, -OR₈ або -N=C(R₉)(R₁₀),
R₅ та R₆ незалежно вибрані з атома водню, алкілу, галогеналкілу, -C(O)алкілу -S(O)_qCF₃ або R₅ та R₆

разом утворюють двовалентний радикал, який може бути перерваний одним або більше гетероатомами,
R₇ - вибраний із алкілу або галогеналкілу,
R₈ - вибраний із алкілу, галогеналкілу або атома водню,
R₉ - вибраний із атома водню й алкілу,
R₁₀ - вибраний із фенілу або гетероарилу, який необов'язково заміщений одним або більше замісниками, вибраними із гідрокси, атома галогену, -O-алкілу, -S-алкілу, ціано та алкілу або їх сполук,
R₁₁ та R₁₂ - незалежно вибрані з атома галогену або атома водню,
R₁₃ - вибраний із атома галогену, галогеналкілу, галогеноалкокси S(O)_qCF₃, -SF₅,
m, n, q, r - незалежно вибрані з 0, 1 та 2,
X - вибраний із елементу азоту та радикала C-R₁₂, при умові, що коли R₁ є метилом, R₃ є галогеналкілом, R₄ є NH₂, R₁₁ є Cl, R₁₃ є CF₃ та X є N

2 Спосіб приваблювання і боротьби з комахами за п 1, який відрізняється тим, що для приваблювання комах використовують інсектицидно-активну сполуку формули (I), яку розташовують серед альтернативно близько розташованої їжі або харчових продуктів

3 Спосіб приваблювання та боротьби з комахами за п 1, який відрізняється тим, що згаданим комахам надають можливість вибору між різною приваблюючою для них і розташованою поблизу їжею або харчовими продуктами і вони переважно приваблюються і обирають їжу, яка містить згадану інсектицидно-активну сполуку формули (I)

4 Спосіб за будь-яким із попередніх пунктів, який відрізняється тим, що інсектицидно-активною сполукою є сполука формули (I), в якій
R₁ - є CN, та/або
R₃ - є галогеналкілом, та/або
R₄ - є NH₂, та/або
R₁₁ та R₁₂ - незалежно вибрані із галогену, та/або
R₁₃ - є галогеналкілом

5 Спосіб за будь-яким із попередніх пунктів, який відрізняється тим, що сполука формули (I) є 5-аміно-3-ціано-1-(2,6-дихлор-4-трифторметил)феніл-4-трифторметилсульфінілпіразол

6 Спосіб за будь-яким із попередніх пунктів, який відрізняється тим, що популяція комах знаходиться в громадському або приватному житловому

(13) C2

(11) 48176

(19) UA

приміщенні, громадських або приватних будівлях, в громадських або приватних будинках

7 Спосіб за будь-яким із попередніх пунктів, який відрізняється тим, що популяція комах здатна проникати або існувати в громадських або приватних житлових приміщеннях, громадських або приватних будівлях або в громадських або приватних будинках

8 Спосіб приваблювання й боротьби з комахами за п 1, який відрізняється тим, що комахам, що підлягають знищенню, пропонують атрактант, який одночасно є інсектицидно-активним, як їжу серед альтернативної їжі або продуктів харчування, які розташовані поблизу

9 Спосіб за будь-яким із попередніх пунктів, який відрізняється тим, що в місцях поблизу місць зберігання, приготування, роздачі або прийому їжі використовують принаду для знищення популяції комах, які знаходяться в локусі

10 Спосіб за будь-яким із попередніх пунктів, який відрізняється тим, що атрактант використовують у формі принади, яка може бути твердою, рідкою або желеподібною принадою

11 Спосіб за будь-яким із попередніх пунктів, який відрізняється тим, що комах, які підлягають знищенню належать до родини Blatidae або Formicidae

12 Спосіб за будь-яким із попередніх пунктів, який відрізняється тим, що комах, що підлягають знищенню, є американськими тарганами (*Periplaneta americana*) або тарганами-прусаками (*Blattella germanica*)

13 Спосіб за будь-яким із попередніх пунктів, який відрізняється тим, що кількість атрактанту складає близько від 0,00001 г до 20 г активного інгредієнта формули (I) на 100 квадратних метрів площі

14 Спосіб за будь-яким із попередніх пунктів, який відрізняється тим, що кількість атрактанту складає приблизно від 0,001г до 1г на 100 м²

15 Спосіб за будь-яким із попередніх пунктів, який відрізняється тим, що кількість атрактанту складає приблизно від 0,0001 до 15% вага/вага активного інгредієнта формули (I), переважно приблизно від 0,01 до 6% вага/вага

16 Спосіб за будь-яким із попередніх пунктів, який відрізняється тим, що композиція атрактанту знаходиться в твердій або рідкій формі

17 Спосіб за будь-яким із попередніх пунктів, який відрізняється тим, що атрактант змішують з поверхнево-активною речовиною або носієм або примішують до нього

18 Спосіб за будь-яким із попередніх пунктів, який відрізняється тим, що атрактант змішують або примішують до іншого пестициду

Винахід належить до способів приваблення комах і боротьби з ними в локусі вирощування культур, особливо культур на плантаціях, або в локусі, де небажано присутність комах з точки зору охорони здоров'я

Відомо багато інсектицидно-аспективних сполук, таких як інсектицидні піразоли, описані в Міжнародних патентних публікаціях N WO 87/03781, WO 93/06089 та WO 94/21606, а також в Європейських Патентних публікаціях 0295117, 0500209, 0403300, 0385809 та 0679650, Патентної Публікації Німеччини 19511269 та Патентах США 5 232 940 та 5 236 938

Зокрема, Європейські Патентні публікації 029117 та 0500209 розкривають N-фенілпіразоли, такі як використовуються по даному винаходу, корисні для боротьби з комахами

Особлива проблема боротьби з надокучливими комахами, особливо з комахами, що мешкають в приватних або громадських будинках або приміщеннях, заключається в тому, що утруднений доступ до обробки всіх комах, звідси виникає нагальна необхідність в способах знищення популяції комах, особливо тих комах, які недоступні для обробки або залишилися необробленими з яких-небудь інших причин

Додатковою перепорою для знищення або

зменшення популяції шкідливих комах є те, що згадані комах, часто здатні виявляти присутність інсектицидно-активних інгредієнтів, таким чином згадані інгредієнти діють як репелленти або відвертаючи від їжі речовини

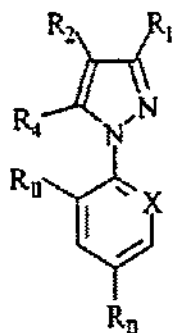
До даного часу загальноприйнятим способом боротьби з великою популяцією комах, особливо з тими, які недоступні для безпосередньої обробки, було використання програми багаторазової обробки або багаторазове розміщення принади з інсектицидно-активними інгредієнтами, або в сполучення атрактантів з інсектицидно-активними інгредієнтами

Метою даного винаходу - забезпечити простий і ефективний спосіб боротьби з комахами

Ще однією метою даного винаходу є забезпечення простого і ефективного способу боротьби з комахами, за яким комахам дають привертальний їх інгредієнт, тобто атрактант

Більш переважною метою винаходу є забезпечення простого та ефективного способу боротьби з комахами, за допомогою якого комахам дають аттрактант, при цьому згаданий аттрактант є одночасно інсектицидно-активним

Даний винахід забезпечує, таким чином, нове використання як аттрактанта для комах сполуки, що має формулу



, (1)

в якій

R_1 - є CN або метилом,

R_2 - є $S(O)_nR_3$,

R_3 - є алкілом або галогеналкілом,

R_4 - вибраний із групи, що включає атом водню, атом галогена та радикал, який може бути - NR_5R_6 , - $S(O)_mR_7$ алкілом, галогеналкілом, - OR_8 або - $N=C(R_9)(R_{10})$,

R_5 та R_6 незалежно вибрані із атому водню, алкіла, галогеналкіла, - $C(O)$ алкіла - $S(O)_rCF_3$ або R_5 та R_6 разом утворюють двовалентний радикал, який може бути перерваний одним або більше гетероатомами,

R_7 - вибраний із алкіла або галогеналкіла,

R_8 - вибраний із алкіла, галогеналкіла або атома водню,

R_9 - вибраний із атома водню і алкіла,

R_{10} - вибраний із феніла або гетероарипа, який необов'язково заміщений одним або більше замісниками, вибраними із гідрокси, атома галогена, -O-алкіла, -S-алкіла, ціано та алкіла або їх сполук,

R_{11} та R_{12} - незалежно вибрані із атому галогена або атома водню,

R_{13} - вибраний із атому галогену, галогеналкіла, галогеноалкокси $S(O)_qCF_3$, - SF_5 ,

m , n , q , r - незалежно вибрані із 0, 1 та 2,

X - вибраний із елементу азоту та радикалу C- R_{12} ,

при умові, що коли R_1 являє метил, R_3 є ало-геналкілом, R_4 є NH_2 , R_{11} є Cl, R_{13} є CF_3 та X є N

Пріоритетною групою сполук формули 1 є сполуки, в яких

R_1 - є CN, та/або,

R_3 - є галогеналкілом, та/або,

R_4 - є NH_2 , та/або,

R_{11} та R_{12} - незалежно вибрані із галогену, та/або,

R_{13} - є галогеналкілом

Особливо пріоритетним для використання у відповідності з даним винаходом є інсектицид 5-аміно-3-ціано-1-(2,6-дихлор-4-трифторметил)феніл-4-трифторметилсульфілпропан. Дану сполуку далі позначають як сполуку (A)

В поданому вище опису алкіл може бути алкілом з розгалуженим або лінійним ланцюгом, що

містить від 1 до 6 атомів вуглецю. Галоген може бути фтором, хлором, бромом або йодом, переважно фтором або хлором

Сполуки формули (1) для використання по даному винаходу можуть бути одержані у відповідності з будь-яким способом, описаним в приведених вище патентних документах, або іншим способом, що відомий фахівцям в галузі хімічного синтезу

В одному своєму аспекті даний винахід забезпечує, таким чином, спосіб приваблення комах, що включає пропозицію згаданим комахам для ковтання сполуки формули (1), визначеної вище

У відповідності ще до одного аспекту, винахід забезпечує спосіб приваблення та знищення комах, що передбачає пропозицію комахам для ковтання сполуки формули (1), визначеної вище, в кількості, ефективній і як аттрактант, і як інсектицид

У відповідності з спідуючим аспектом, винахід забезпечує спосіб боротьби з популяцією комах, особливо комах, здатних рухатися або пересуватися в громадських або приватних будівлях або приміщеннях, в будинках або житлових приміщеннях, а саме, комах, здатних проникнути та жити в будинках, відповідно до якого аттрактанта або інтенсектицида кількість сполуки формули (1), визначеної вище, пропонують або надають комахам, які потрібно знищити, як їжу поруч з альтернативною їжею або продуктами харчування, які можуть знаходитися поблизу

Спосіб, відповідно даному винаходу є особливо пріоритетним, оскільки він забезпечує більше можливостей і має більшу свободу вибору місць розташування інсектицидно-активного інгредієнта. Внаслідок його приваблюючих властивостей інсектицидно-активний інгредієнт можна розташувати в будь-якому місці, а не лише в спеціальних місцях очікуваного переміщення та харчування

Відповідно переважному втіленню винахід забезпечує спосіб боротьби з популяцією комах в покусі, що знаходиться в місцях зберігання, приготування, подачі або вживання їжі, або поблизу з ними, причому згаданий спосіб містить пропозицію згаданим комахам як альтернативне джерело їжі ефективною кількості сполуки формули (1), визначеної вище, як аттрактанта, так і як інсектицида. Таким чином, ефективну аттрактантну та інсектицидну кількість сполук формули (1), переважно пропонують комахам в місцях або поблизу місць, де присутня інша їжа для комах як практичний наслідок звичайного використання приміщень або ведення домашнього господарства

Активний інгредієнт формули (1) у відповідності до даного винаходу звичайно використовують у вигляді твердої, рідкої або желеподібної принади. Спосіб виготовлення принади зрозумілий фахівцям в даній галузі техніки. Принади вже описувалися в патентних документах, на які даються посилання вище. Немає необхідності додавати аттрактант до активного інгредієнту формули (1) і до носіїв або розріджувачів для одержання

принади, оскільки сполука формули (1) в даному випадку діє і як аттрактант і як інсектицид

Спосіб відповідно до винаходу є зокрема, як спосіб боротьби з популяцією комах, таких як таргани, мурахи і подібні, особливо комах, що накле-

жать до родини Blatidae та Formacide. Обробка тарганів в місцях, де їх присутність може бути шкідлива для здоров'я людей, а саме, в житлових будинках або приміщеннях, є пріоритетною особливистю даного винаходу, який особливо корисний для боротьби з так званими американськими тарганами (*Periplaneta americana*), а також із іншими тарганами, такими як таргани-прусаки (*Blattella germanica*)

Атрактантні композиції або принади відповідно до даного винаходу, які можуть застосовуватися на практиці, можуть пропонуватися або даватися комахам в різній кількості. Однак звичайно перевага надається композиціям або принадам, які включають сполуки формули (1) у відповідній формі і в кількості приблизно 0,001г до 20г активного інгредієнту формули (1) на 100м²

Ахтрактантні композиції, які корисні у відповідності до даного винаходу, звичайно вміщують приблизно від 0,001 до 15% активного інгредієнту формули (1), переважно близько 0,01 до 6% вага/вага. Ці композиції можуть бути у формі твердої речовини, наприклад, дуетів, або гранул або зволожених порошків, або в рідкій формі, такий як емульгуючий концентрат або звичайний розчин.

Композиції атрактантів можуть містити також будь-які сумісні поверхнево-активні речовини та/або носії, переважно вибрані з інгредієнтів, які комахи можуть їсти. Носій сам по собі може бути твердий або рідкий.

Сполуки формули (1) можна використовувати послідовно або в суміші, особливо в сумішах з іншими пестицидами, наприклад, інсектицидом, акарицидом або фунгіцидом.

Композиції атрактантів можна одержати простим змішуванням інгредієнтів.

Винахід ілюструється такими прикладами, які не варто розглядати як лімітуючі або обмежуючі даний винахід.

Приклади

На великому колі, що розташоване на обмеженому просторі у 1 кв метр, розподілили різні продукти та дві принади сполуки (A) по периметру кола діаметром 75см. Такі ж шматочки принади розташували в діаметрально протилежних точках на колі.

За 24 години до початку експерименту випус-

кали дорослих особів тарганів (25 чоловічих та 25 жіночих). Всі досліди проводили вночі при інфрачервоному освітленні. Досліди повторювали три рази для кожного виду. Спостереження почали через годину після виключення світла в лабораторії. Протягом 120 хвилин з 10 хвилинними інтервалами відзначали кількість тарганів, що поїдали їжу в кожній точці.

Приклад 1

Як інсектицид використовували лише сполуки (A).

Як альтернативну їжу використовували 2 шматочки суміші для гризунів, 2 шматочки желе для гризунів і 2 посудини з водою.

Підраховували і кумулятивно сумували кількості тарганів-прусаків, що поїдали принаду протягом 3 годин доступу тарганів до їжі.

62 таргани направилися до сполуки (A), 43 - до суміші, 25 - до желе і 22 - до води.

Приклад 2

Як інсектицид використовували лише сполуку (A). Як альтернативну їжу використовували 2 шматочки суміші для гризунів, 2 посудини з маслом і 2 посудини з водою.

Протягом трьох годин доступу до їжі підраховували і кумулятивно підсумували кількість тарганів-прусаків, що їли.

68 тарганів направилися до сполуки (A), 25 - до суміші, 23 - до масла і 14 - до води.

Приклад 3

Одна інсектицидна принада містила сполуку (A) і одна містила гідраметилнон.

Як альтернативну їжу використовували 2 шматочки суміші для гризунів, 2 шматочки желе для гризунів, 2 посудини з водою і 1 шматочок гідраметилнону.

Протягом 3 годин доступу до їжі кількість американських тарганів, що їли, підраховували і кумулятивно підсумували.

35 тарганів направилися до сполуки (A), (до іншого інсектициду значно менше), 17 - до суміші, 15 - до желе, 18 - до води.

Незважаючи на те, що винахід описано за допомогою його пріоритетних втілень, кваліфіковані фахівці зможуть оцінити, що можуть бути втілені різні модифікації, зміни та доповнення, не відступаючи від суті винаходу.