



УКРАЇНА

(19) UA (11) 43320 (13) C2

(51) 7 A01N43/40, A01N47/40

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

## (54) СПОСІБ БОРОТЬБИ З ЯЙЦЯМИ КОМАХ (ВАРІАНТИ)

(21) 94119073

(22) 21 05 1993

(24) 17 12 2001

(31) 891 848

(32) 01 06 1992

(33) US

(86) PCT/EP93/01286, 21 05 1993

(46) 17 12 2001, Бюл. № 11, 2001 р

(72) Хейфіз Аяд, US

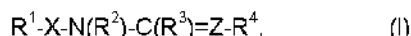
(73) АВЕНТИС КРОПСАЙНС С А, FR

(56) 1 EP, B1 0 456 826 1991

2 EP, B1, 0 303 670, 1988

3 EP, B1, 0 306 696, 1988

(57) 1 Способ борьбы с яйцами насекомых или с насекомыми на стадии яйцекладки, приносящими вред культурным растениям, заключающийся в том, что очаги заражения яйцами насекомых или предполагаемые очаги заражения яйцами насекомых, или места предстоящей яйцекладки обрабатывают активным действующим веществом, отличающийся тем, что в качестве активное действующего вещества используют соединение общей формулы (I)



где  $R^1$  представляет собой необязательно замещенное 5-6-членное ароматическое гетероциклическое кольцо, содержащее атом азота, за исключением незамещенного 2-пиридила,

$X$  представляет собой необязательно замещенный  $C_1-C_3$ -алкилен или алкилиден,

$R^2$  представляет собой водород, карбамоил, моно- или ди- $C_1-C_5$ -алкилкарбамоил, тиокарбамоил, моно- или ди- $C_1-C_5$ -алкилтиокарбамоил, сульфамойл, моно- или ди- $C_1-C_5$ -алкилсульфамойл, необязательно замещенный  $C_1-C_5$ -алкил, необязательно замещенный  $C_2-C_5$ -алкенил, необязательно замещенный  $C_2-C_5$ -алкинил, необязательно замещенный  $C_3-C_8$ -циклоалкил, необязательно замещенный  $C_3-C_8$ -циклоалкенил, необязательно замещенный арил или  $-Y-R^5$ ,

$Y$  представляет собой  $O$ ,  $S(O)_n$ ,  $CO$ ,  $CS$  или  $CO_2$ ,  $n$  является 0, 1 или 2,

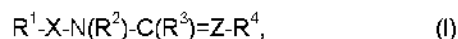
$R^5$  представляет собой водород, необязательно замещенный  $C_1-C_5$ -алкил, необязательно замещенный  $C_2-C_5$ -алкенил, необязательно замещенный  $C_2-C_5$ -алкинил, необязательно замещенный  $C_3-C_8$ -циклоалкенил или необязательно замещенный арил,

$R^3$  представляет собой водород, необязательно замещенный  $C_1-C_5$ -алкил, необязательно замещенный  $C_2-C_5$ -алкенил, необязательно замещенный  $C_2-C_5$ -алкинил, необязательно замещенный  $C_3-C_8$ -циклоалкил или необязательно замещенный  $C_3-C_8$ -циклоалкенил,

$R^4$  представляет собой цианогруппу или нитрогруппу,

$Z$  представляет собой  $CH$  или  $N$ , или его соли в эффективном количестве

2 Способ борьбы с яйцами насекомых, приносящими вред культурным растениям, заключающийся в обработке овицидной композицией, содержащей активное действующее вещество и обычные целевые добавки, отличающийся тем, что в качестве активное действующего вещества используют соединение формулы (I)



где  $R^1$  представляет собой необязательно замещенное 5-6-членное ароматическое гетероциклическое кольцо, содержащее атом азота, за исключением незамещенного 2-пиридила,

$X$  представляет собой необязательно замещенный  $C_1-C_3$ -алкилен или алкилиден,

$R^2$  представляет собой водород, карбамоил, моно- или ди- $C_1-C_5$ -алкилкарбамоил, тиокарбамоил, моно- или ди- $C_1-C_5$ -алкилтиокарбамоил, сульфамойл, моно- или ди- $C_1-C_5$ -алкилсульфамойл, необязательно замещенный  $C_1-C_5$ -алкил, необязательно замещенный  $C_2-C_5$ -алкенил, необязательно замещенный  $C_2-C_5$ -алкинил, необязательно замещенный  $C_3-C_8$ -циклоалкил, необязательно замещенный  $C_3-C_8$ -циклоалкенил, необязательно замещенный арил или  $-Y-R^5$ ,

$Y$  представляет собой  $O$ ,  $S(O)_n$ ,  $CO$ ,  $CS$  или  $CO_2$ ,  $n$  является 0, 1 или 2,

$R^5$  представляет собой водород, необязательно замещенный  $C_1-C_5$ -алкил, необязательно замещенный  $C_2-C_5$ -алкенил, необязательно замещенный  $C_2-C_5$ -алкинил, необязательно замещенный  $C_3-C_8$ -циклоалкенил или необязательно замещенный арил,

$R^3$  представляет собой водород, необязательно замещенный  $C_1-C_5$ -алкил, необязательно замещенный  $C_2-C_5$ -алкенил, необязательно замещенный  $C_2-C_5$ -алкинил, необязательно замещенный

C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-циклоалкил или необязательно замещенный C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-циклоалкенил, R<sup>1</sup> представляет собой цианогруппу или нитрогруппу,

Z представляет собой СН или N

и овицидная композиция содержит от 0,0001 до 90% указанного активнoдействующего вещества или его соли

3 Способ по любому из пп 1 - 2, отличающийся тем, что в соединении формулы (I) или его соли

R<sup>1</sup> представляет собой галогенопиридил,

R<sup>3</sup> представляет собой H или алкил,

R<sup>2</sup> представляет собой H или алкил,

X представляет собой CH<sub>2</sub>, а

Z представляет собой N

4 Способ по любому из пп 1 - 2, отличающийся

тем, что в соединении формулы (I) или его соли R<sup>1</sup>

представляет собой 6-галогенопиридил-3-ил,

R<sup>3</sup> и R<sup>2</sup> представляют собой метил,

X представляет собой CH<sub>2</sub>, а Z - N

5 Способ по любому из пп 1 - 4, отличающийся

тем, что обработку осуществляют путем опрыскивания листьев культурных растений

6 Способ по любому из пп 1 - 4, отличающийся тем, что культурными растениями являются хлопчатник, бобовые культуры, соевые культуры, картофель или плодовые культуры

7 Способ по любому из пп 1 - 4, отличающийся тем, что насекомым, яйца которого предназначены для уничтожения, является совка *Heliothis virescens* или совка *Heliothis virescens*, обладающая резистентностью к пиритроидам

8 Способ по любому из пп 1 - 4, отличающийся тем, что насекомым, яйца которого предназначены для уничтожения, является зерновка бобовая мексиканская

9 Способ по любому из пп 1 - 4, отличающийся тем, что насекомым, яйца которого предназначены для уничтожения, является копорадский жук

10 Способ по любому из пп 1 - 4, отличающийся тем, что обработку осуществляют при дозе от 0,04 до 2 кг/га

11 Способ по любому из пп 1 - 4, отличающийся тем, что обработку осуществляют при дозе от 0,1 до 1 кг/га

Настоящее изобретение относится к новому способу борьбы с насекомыми на стадии яйца, а в частности, настоящее изобретение относится к способу борьбы с яйцами совки *Heliothis virescens* (далее сокращенно обозначаемой TBW) в местах произрастания культурных растений, предпочтительно плантационных культур

Настоящее изобретение также относится к овицидным композициям

Серьезной проблемой, с которой часто сталкиваются фермеры, является уничтожение хлопкового волокна совкой *Heliothis virescens* (TBW). Важность этой проблемы заключается в том, что личинки насекомых живут на листьях растения очень короткий промежуток времени, например, около одного или двух дней, и большую часть своей жизни они проводят в семенной коробочке хлопчатника, где они защищены от неблагоприятного воздействия извне, например, от воздействия пестицидов. Поэтому, для того, чтобы предохранить культурное растение от уничтожения совками, очень важно проводить борьбу с этими насекомыми на стадии яйцекладки. В соответствии с этим, настоящее изобретение также относится к способу защиты хлопковых культур от насекомых

Многие инсектициды хорошо известны как активные ингредиенты, используемые для защиты растений от насекомых. Однако, соединения, которые могут быть рекомендованы как обладающие лишь овицидным действием, довольно редки. Редкостью также являются соединения, обладающие как инсектицидным, так и овицидным действием

Исходя из активности соединения в отношении насекомых (зрелых особей или личинок), нельзя сделать какого-либо вывода относительно их овицидной активности. Например, такие инсектициды, как карбарил или фосфат, не являются

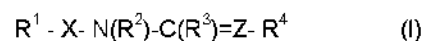
овицидами. Пиретроиды также не являются овицидными, хотя некоторое время они считались таковыми из-за своей способности к уничтожению личинок, однако, активность по отношению к личинкам, строго говоря, не является истинной овицидной активностью. Тиодикарб, который обладает как овицидным, так и инсектицидным действием, является, скорее, исключением

Так, например, в патентной заявке WO 91/04965 были описаны некоторые инсектициды, однако, исходя из вышеупомянутых соображений, трудно сказать, обладают ли эти соединения каким-либо овицидным действием

Целью настоящего изобретения является разработка способа защиты культурных растений путем уничтожения яиц насекомых, или насекомых на стадии яйцекладки, который заключается в том, что очаги заражения яйцами насекомых, или предполагаемые очаги заражения яйцами насекомых, или места предстоящей яйцекладки обрабатывают эффективным количеством соединения формулы (I) или его солей. Насекомые, яйца которых могут быть уничтожены способом настоящего изобретения, являются, предпочтительно, сельскохозяйственными вредителями

Другой целью настоящего изобретения является овицидная композиция, содержащая эффективное количество активного ингредиента, который представляет собой соединение формулы (I) или его соль

Соединение формулы (I) имеет следующую структуру



где R<sup>1</sup> представляет собой необязательно замещенное 5-6-членное ароматическое гетероциклическое кольцо, содержащее атом азота, за исключением незамещенного 2-пиридила,

X представляет собой необязательно замещенный  $C_{1-3}$ -алкилен или алкилиден,

$R^2$  представляет собой водород, карбамоил, моно- или ди- $C_{1-5}$ -алкилкарбамоил, тиокарбамоил, моно- или ди- $C_{1-5}$ -алкилтиокарбамоил, сульфамойл, моно- или ди- $C_{1-5}$ -алкилсульфамойл, необязательно замещенный  $C_{1-5}$ -алкил, необязательно замещенный  $C_{2-5}$ -алкенил, необязательно замещенный  $C_{2-5}$ -алкинил, необязательно замещенный  $C_{3-8}$ -циклоалкил, необязательно замещенный  $C_{3-8}$ -циклоалкенил, необязательно замещенный арил, или -Y- $R_5$ , Y представляет собой O, S(O) $_n$ , CO, CS или CO $_2$ ,

$n=0,1$  или  $2$ ,

$R^5$  представляет собой водород, необязательно замещенный  $C_{1-5}$ -алкил, необязательно замещенный  $C_{2-5}$ -алкенил, необязательно замещенный  $C_{2-5}$ -алкинил, необязательно замещенный циклоалкенил, или необязательно замещенный арил,

$R^3$  представляет собой водород, необязательно замещенный  $C_{1-5}$ -алкил, необязательно замещенный  $C_{2-5}$ -алкенил, необязательно замещенный алкинил, необязательно замещенный  $C_{3-8}$ -циклоалкил, или необязательно замещенный  $C_{3-8}$ -циклоалкенил,

$R^4$  представляет собой циано или нитро, и

Z представляет собой CN или N

Настоящее изобретение относится к способу защиты растений путем уничтожения яиц насекомых, способных приносить вред указанным культурным растениям, который заключается в том, что очаги заражения или предполагаемые очаги заражения яйцами насекомых, либо места предполагаемой яйцекладки обрабатывают эффективным количеством соединения формулы (I)

Настоящее изобретение также относится к овицидным композициям, содержащим эффективное количество соединения формулы (I) или его соли

Кроме того, настоящее изобретение относится к способу защиты культурных растений путем уничтожения яиц насекомых, способных приносить вред указанным культурным растениям, который заключается в том, что очаги заражения или предполагаемые очаги заражения яйцами насекомых, либо места яйцекладки, либо предполагаемые места яйцекладки обрабатывают эффективным количеством овицидной композиции, определенной в настоящей заявке

Еще один отличительный признак настоящего изобретения заключается в том, что указанной овицидной композицией обрабатывают места произрастания культурных растений, предпочтительно плантационных культур, а более предпочтительно хлопковых культур

Способ настоящего изобретения особенно предпочтительно использовать для уничтожения яиц следующих насекомых совки *Heliothis virescens*, зерновки бобовой мексиканской (*Epilachna varivestis*), колорадского жука (*Leptinotarsa decemlineata*)

Способ настоящего изобретения особенно предпочтителен для борьбы с яйцами совки *Heliothis virescens*, которая обладает резистентностью пиритроидам

Способ настоящего изобретения особенно предпочтительно использовать для защиты хлопчатника от совки *Heliothis virescens*, или совки *Heliothis virescens*, обладающей резистентностью к пиритроидам, для защиты бобовых и соевых культур от зерновки бобовой мексиканской, для защиты картофеля от колорадского жука, и для защиты плодовых культур от чешуекрылых насекомых

В соответствии с настоящим изобретением, предпочтительными активными ингредиентами являются соединения, в которых

$R^1$  представляет собой галогенопиридил, а более предпочтительно 6-галогенопирид-3-ил,

$R^2$  представляет собой H или алкил,

$R^6$  представляет собой H, или алкил,

X представляет собой CH $_2$ , а Z представляет собой = N

Соединения формулы (I) или их соли могут быть получены любым способом, описанным в патентной заявке W091/04965, либо другим стандартным способом, обычно используемым в химическом синтезе. Раскрытие заявки W091/04965 полностью приведено в настоящем описании путем ссылки

Используемый в настоящем описании термин "яйца" следует понимать в его обычном смысле, т.е., этот термин означает яйца, откладываемые в почву или на само растение, либо яйца, находящиеся внутри насекомого до момента яйцекладки. Настоящее изобретение направлено, в основном, на уничтожение яиц, откладываемых на листья растений, а поэтому способ настоящего изобретения заключается в том, что активный ингредиент формулы (I) или его соль наносят на листья культурных растений

В соответствии с вышеуказанным, соединения формулы (I) настоящего изобретения позволяют уничтожать яйца насекомых, а в частности, совки *Heliothis virescens* (TBW), до того, как эти насекомые могут нанести серьезный ущерб растению. Иначе говоря, соединения формулы (I) или его соли наносят на участки, предназначенные для обработки, еще до того, как данное растение будет значительно заражено личинками совки *Heliothis virescens* (TBW)

Например, при первой обработке, овицидная композиция, содержащая соединения формулы (I) или его соль, может быть нанесена на участки хлопкового растения, зараженные яйцами насекомых до того, как эти яйца достигнут стадии личинок, предпочтительно за 4-7 дней до достижения насекомыми личиночной стадии

Овицидная композиция настоящего изобретения может быть нанесена один или несколько раз. Так, например, овицидная композиция настоящего изобретения может периодически наноситься в соответствующее время жизненного цикла насекомого. Обычно, овицидную композицию настоящего изобретения наносят на возделываемую площадь при дозе активного ингредиента 0,04 - 2 кг/га, а предпочтительно 0,1-1 кг/га

Овицидная композиция настоящего изобретения может быть нанесена способом, безопасном для данной культуры

Овицидные концентрированные композиции настоящего изобретения могут быть изготовлены

в виде твердых препаратов, например, в виде дустов, гранул, или смачиваемых порошков, либо, что предпочтительней, в виде жидких препаратов, например, в виде эмульгируемых концентратов или истинных растворов. Концентрированные композиции представляют собой промышленные, транспортируемые или находящиеся на хранении препараты. Перед нанесением на растения, эти препараты обычно разбавляют водой.

Такие разведенные формы, как и концентрированные формы являются частью настоящего изобретения.

Концентрированные овицидные композиции настоящего изобретения содержат, в основном, от 0,001 до 90 % активного ингредиента формулы (I) или его соли. Концентрат может содержать от 5 до 90% активного ингредиента. В последующем описании, все части и проценты даны по массе, если это не оговорено особо.

Овицидная композиция настоящего изобретения может также содержать любой совместимый поверхностно-активный агент и/или носитель. Такой агрономически приемлемый носитель может быть жидким или твердым. Кроме того, данная композиция может содержать удобрение.

Соединения формулы (I) или их соли могут быть использованы как поочередно, так и в смеси (предпочтительно в смеси) с другими пестицидами, например, с инсектицидами, акарицидами, или фунгицидами.

Овицидные композиции могут быть получены путем смешивания ингредиентов.

Иллюстрацией осуществления настоящего изобретения могут служить нижеприведенные примеры, не ограничивающие его.

#### Пример 1.

(6-Cl-пирид-3-ил)-CH<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)-C(CH<sub>3</sub>)=N-CN диспергировали в смеси ацетона, поверхностно-активного вещества и диметилформамида, а затем разводили в воде.

В эксперименте использовали полоски серпанки (сырная салфетка для прессования сыров - прим пер), которые содержали около 30-40 однодневных яиц совки *Heliothis virescens*. Эти яйца принадлежали совкам, не обладающим резистентностью к пиретроидам.

Затем яйца опрыскивали водной дисперсией активного ингредиента. Условия опрыскивания выбирали так, чтобы концентрация 1000 млн д соответствовала дозе нанесения на культуру 188 г/га.

Через три дня после опрыскивания проводили оценку результатов. Погибшие яйца имели бурый цвет и не обнаруживали признаков вылупляемости (обычно вылупление из яиц происходит примерно на 3-4 день после кладки).

Было установлено, что при 1000 млн д летальная доза составляла 90%, а при 230 млн д, летальная доза составляла 50 %.

#### Пример 2.

Повторяли процедуру, описанную в примере 1, за исключением того, что для испытаний использовали яйца совки *Heliothis virescens*, резистентной к пиретроидам.

В результате этого эксперимента было установлено, что при 250 млн д, летальная доза составляла 64%.

#### Пример 3

(6-Cl-пирид-3-ил)-CH<sub>2</sub>-N(CH<sub>3</sub>)-C(CH<sub>3</sub>)=N-CN диспергировали в смеси ацетона, поверхностно-активного вещества и диметилформамида, а затем разводили в воде.

Для испытания использовали полоски листьев бобового растения, несущие около 65 однодневных яиц зерновки бобовой мексиканской.

Затем яйца опрыскивали водной дисперсией активного ингредиента. Условия опрыскивания выбирали так, чтобы концентрация 1000 млн д соответствовала дозе нанесения на культуру 188 г/га.

Через три дня после опрыскивания проводили оценку полученных результатов. Погибшие яйца имели бурый цвет, и не обнаруживали признаков вылупления (обычно, вылупление из яйца наблюдается примерно на 7 день после кладки).

При 250 млн д, летальная доза составляла 100%.

#### Пример 4.

(6-Cl-пирид-3-ил)-CH<sub>2</sub>-N(CH<sub>3</sub>)-C(CH<sub>3</sub>)=N-CN диспергировали в смеси ацетона, поверхностно-активного вещества и диметилформамида, а затем разводили в воде.

Для испытания использовали полоски листьев картофеля, несущие около 20 однодневных яиц колорадского жука. Причем, были использованы яйца жуков как резистентных, так и нерезистентных к пиретроидам.

Затем яйца опрыскивали водной дисперсией активного ингредиента. Условия опрыскивания выбирали так, чтобы концентрация 1000 млн д соответствовала дозе нанесения на культуру 188 г/га.

Через три дня после опрыскивания проводили оценку полученных результатов. Погибшие яйца имели бурый цвет, и не обнаруживали признаков вылупления (обычно, вылупление из яйца наблюдается на 5 день после кладки).

Было установлено, что для яиц жуков обоих типов, летальная доза при 250 млн д составляла 100%.

Тираж 50 экз

Відкрите акціонерне товариство «Патент»

Україна, 88000, м. Ужгород, вул. Гагаріна, 101

(03122) 3 – 72 – 89 (03122) 2 – 57 – 03

