



УКРАЇНА

(19) UA (11) 39936 (13) C2

(51) 7 A01N43/76, C07D263/14

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ
І НАУКИ УКРАЇНИ

ДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ

ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД

(54) 2-(2,6-ДИФТОРФЕНИЛ)-4-(2-ЕТОКСИ-4-ТРЕТ-БУТИЛФЕНИЛ)-2-ОКСАЗОЛІН, СПОСІБ МІТИЦИДНОЇ ОБРОБКИ ТА МІТИЦИДНА КОМПОЗИЦІЯ

(21) 94105973

(22) 28.04.1992

(24) 16.07.2001

(86) PCT/JP92/00559, 28.04.1992

(46) 16.07.2001, Бюл. № 6, 2001 р.

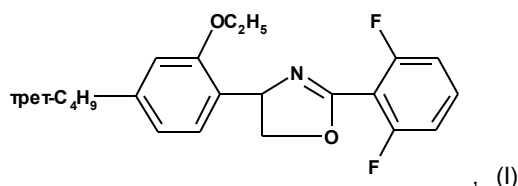
(72) Джунджі Сузукі, JP, Йасуо Кікучі, JP, Казуйа Тода, JP, Йошиакі Ітох, JP, Татсуйа Ішида, JP, Та-тсуфумі Ікеда, JP, Йокіші Тоукідате, JP

(73) Йашима Кемікал Індастріал Ко., Лтд, JP

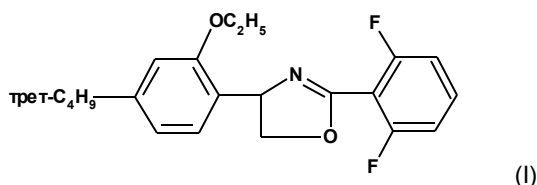
(56) 1. JP, А, 3-232867.

2. JP, А, 2-85268

(57) Соединение 2-(2,6-дифторфенил)-4-(2-этокси-4-трет-бутилфенил)-2-оксазолин, представленное формулой (I):



Данное изобретение относится к определенному виду производных оксазолина, более конкретно - к 2-(2,6-дифторфенил)-4-(2-этокси-4-трет-бутилфенил)-2-оксазолину, представленному следующей формулой (I):



и к содержащему его митициду.

К настоящему времени имеется несколько публикаций, описывающих соединения на основе 2,4-дифенил-4-оксазолина. См. например, Tetrahedron letters, v. 45, № 22, p. 4471-4474 (1981); Chemical abstracts, 98, 160087k (1983); и J. Org. Chem., 52, p.2523-2530 (1987) и т.д.

В патенте Японии № 501962/1982 (которому соответствует патент PCT № WO 82/02046) опи-

предназначенное для использования в качестве активного компонента митицидного препарата.

2. Соединение формулы (I) по п. 1, **отличающе-ся** тем, что используется для борьбы с клещами.

3. Способ митицидной обработки, включающий применение эффективного количества активного вещества к клещам или к месту их обитания, **отличающийся** тем, что в качестве активного вещества используют соединение формулы (I) по п. 1.

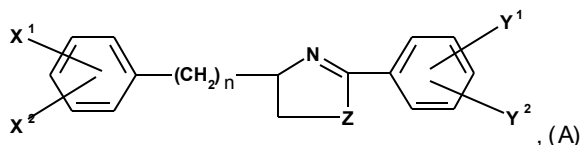
4. Митицидная композиция, содержащая активный компонент и вспомогательный компонент или компоненты, пригодные для приготовления композиции, **отличающаяся** тем, что в качестве активного компонента содержит эффективное количество соединения формулы (I) по п. 1.

саны Δ^2 -N-гетероциклические соединения, например, производные 2,4-дифенил-2-окса- или -тиа-золина и производные 2-фенил-4-бензил-2-окса- или -тиа-золина, пригодные для использования в качестве промежуточных продуктов в производстве активных компонентов для фармации и/или в качестве соединений, проявляющих, как в данном случае, биологическую активность, например, в качестве лекарства от диабета.

Однако вышеупомянутые литературные источники не упоминают обо всех видах воздействия описанных в них соединений на вредителей сельскохозяйственных и садовых культур, например, насекомых, клещей и т.д.

Представляет интерес патент Японии N 85268/1990, которому соответствуют патент США N 4977171 и патент EP N 345775 A1, и который принят в качестве прототипа. В соответствии с указанным патентом ряд производных 2,4-дифенил-2-окса- или -тиа-золина, представлены следующей общей формулой (A):

(19) UA (11) 39936 (13) C2



где X^1 и X^2 имеют одинаковые или различные значения, и обозначают, каждый, атом водорода, низшую алкильную группу, низшую алкоксигруппу, атом галогена, трифторметильную группу или трифторметоксигруппу;

Y^1 и Y^2 имеют одинаковые или различные значения, и обозначают, каждый, атом водорода, низшую алкильную группу, низшую алкоксигруппу, низшую алкилтиогруппу, цианогруппу, атом галогена или трифторметильную группу;

Z обозначает атом кислорода или серы и n равно 0 или 1, при условии, что:

(1) Y^1 и Y^2 не являются одновременно атомами водорода;

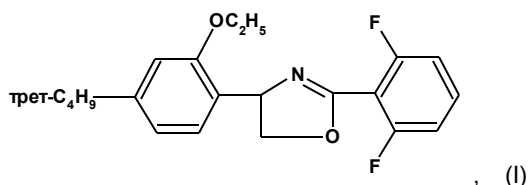
(2) если n - 0 и оба радикала X^1 и X^2 являются атомами водорода, или если n - 1 и оба радикала X^1 и X^2 , будучи одинаковыми или различными, являются атомами водорода, хлора, фтора или брома, то оба радикала Y^1 и Y^2 , будучи одинаковыми или различными, являются низшей алкильной группой, низшей алкоксигруппой, низшей алкилтиогруппой, цианогруппой, атомом иода или трифторметильной группой; и

(3) X^1 или X^2 и Y^1 или Y^2 не могут обозначать алкильные группы, содержащие от 4 до 6 атомов C в положениях 2 или 6 бензольного кольца. Они обладают хорошим инсектицидным и митицидным действием по отношению к вредным насекомым, паразитирующим на культурных растениях.

Соединения общей формулы (A) проявляют достаточную активность против насекомых и клещей, являющихся вредителями растений, при сравнительно малых дозировках. Однако указанные соединения обладают недостаточной активностью в отношении устойчивых видов клещей-вредителей и недостаточной степенью безвредности в отношении теплокровных животных.

Следовательно, задачей настоящего изобретения является выявление соединений, обладающих повышенной митицидной активностью и высокой степенью безвредности для теплокровных животных.

Однако были проведены дополнительные исследования инсектицидного и митицидного действия соединений общей формулы (A) и поставленная задача была решена определением, что соединение 2-(2,6-дифторфенил)-4-(2-этокси-4-трет-бутилфенил)-2-оксазолин, представленное формулой (I):



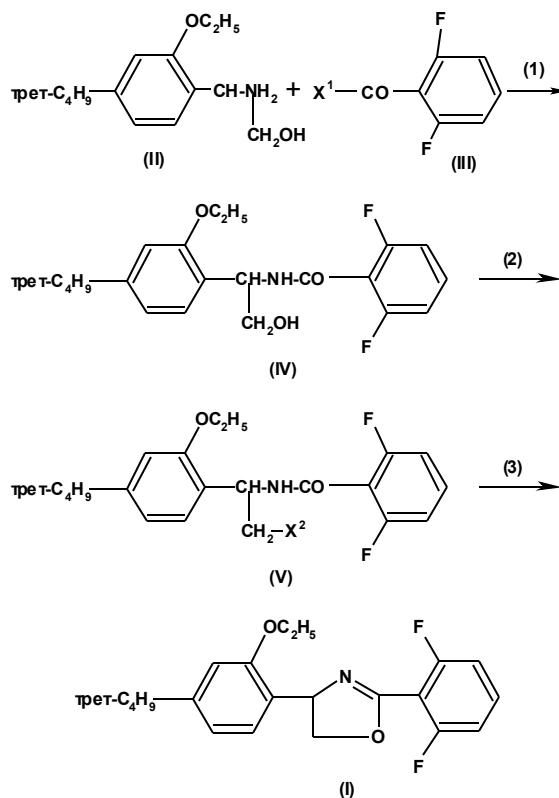
предназначенное для использования в качестве активного компонента митицидного препарата, предложено использовать соединение формулы

(I) для борьбы с клещами в соответствии со способом митицидной обработки, включающем применение эффективного количества соединения формулы (I) к клещам или к месту их обитания.

Соединение указанной выше формулы (I), описанное по настоящему изобретению, обладает весьма высокой митицидной активностью, в частности, имеет очень высокую митицидную активность даже по отношению к устойчивому виду *Panonychus citri* и устойчивому виду *Tetranychus kanzawai*, которые в настоящее время считаются трудно поддающимися контролю, оно позволяет контролировать клещей-вредителей при использовании его в малых дозах; кроме того, оно характеризуется очень высокой степенью безвредности для теплокровных животных, не проявляет фитотоксичности по отношению к культурным растениям и может использоваться в качестве активного компонента митицидного препарата.

Соединение формулы (I) по настоящему изобретению может, например, быть получено в соответствии со следующей схемой реакции A:

Схема реакции A



В приведенной выше формуле X^1 и X^2 обозначают, каждый, атом галогена.

В схеме реакции A, проводимая на первой стадии реакция 2-амино-2-(2-этокси-4-трет-бутилфенил)-этанол формулы (II) с 2,6-дифторбензоилхлоридом формулы (III), обычно может быть проведена в пригодном растворителе в присутствии основания. В качестве растворителя могут быть использованы, например, простой эфир, такой как диэтиловый эфир или тетрагидрофуран, ароматический углеводород, такой как бензол, толуол или ксилол, или другие подобные растворители, а в качестве основания успешно могут быть

использованы, например, третичные органические основания, такие как триэтиламин, N,N-диметиланилин, пиридин или 4-N,N-диметиламинопиридин.

Стехиометрическое соотношение компонентов в реакции 2,6-дифторбензоилгалида формулы (III) с 2-амино-2-(2-этокси-4-трет-бутилфенил)-этанолом формулы (II) строго не ограничивается, но обычно на 1 моль соединения формулы (II) удобно брать от 0,8 до 1,2 моля соединения формулы (III).

Приведенная выше реакция обычно может быть проведена при температуре от, примерно, 0 до, примерно, 50°C, а время, необходимое для ее завершения в указанных выше условиях, составляет обычно от 1 до 6 часов.

Полученный в результате этой реакции N-(2,6-дифторбензоил)-2-амино-2-(2-этокси-4-трет-бутилфенил)-этанол формулы (IV) может затем быть превращён в N-(2,6-дифторбензоил)-2-амино-2-(2-этокси-4-трет-бутилфенил)-1-галогенированный этан формулы (V) путём обработки его галогенирующим агентом без растворителя или в пригодном растворителе. В качестве пригодных для этой цели растворителей могут быть названы, например, ароматические углеводороды, такие как бензол, толуол или ксилол; галогенированные углеводороды, такие как дихлорметан, хлороформ или четыреххлористый углерод или подобные растворители, а в качестве галогенирующего агента могут быть использованы, например, тионилхлорид, пятихлористый фосфор, треххлористый фосфор, трехбромистый фосфор или подобные соединения.

Количество используемого галогенирующего агента также строго не ограничивается, однако обычно он может быть использован в количестве от 1 до 5 молей, предпочтительно, от 1,5 до 2,5 молей на 1 моль соединения формулы (IV).

Температура проведения реакции может изменяться в зависимости от того, проводится реакция в присутствии растворителя или без него, от вида растворителя, от вида галогенирующего агента и т. п., однако обычно реакцию желательно проводить при температуре от, примерно, 0°C до температуры кипения растворителя с обратным холодильником в течение от 1 до 4 часов.

Полученный таким образом N-(2,6-дифторбензоил)-2-амино-2-(2-этокси-4-трет-бутилфенил)-1-галогенированный этан формулы (V) затем может быть обработан основанием в подходящем растворителе для проведения реакции циклизации с образованием соединения формулы (I) по настоящему изобретению. В качестве пригодного растворителя могут быть названы, например, спирты, такие как метанол или этанол, N,N-диметилформамид, диметилсульфоксид или подобные растворители, а в качестве основания могут быть использованы неорганические основания, такие как гидроксид натрия, гидроксид калия или карбонат калия.

Количество используемого вышеупомянутого основания строго не ограничивается, но, как правило, основание может использоваться в количестве от 1 до 5 молей, предпочтительно от 2 до 4 молей, на 1 моль соединения формулы (V). Реакция может проводиться при температуре от 0°C до температуры кипения растворителя, а реакция

при такой температуре может быть завершена в течение от 0,5 до 3 часов.

Соединение формулы (I) по настоящему изобретению, полученное по приведенным выше реакциям, может быть выделено и очищено известными способами, например, посредством колонной хроматографии и рекристаллизации. В качестве растворителей для колонной хроматографии и рекристаллизации могут быть использованы, например, бензол, хлороформ, н-гексан, этилацетат, диизопропиловый эфир и т.д. или их смеси.

Соединение формулы (I) по настоящему изобретению, как показано ниже в примерах испытаний, обладает очень сильным митицидным действием и, особенно, оказывает прекрасное сдерживающее воздействие по отношению к листовым клещам, таким как, например, *Tetranychus urticae*, *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus kanzawai*, *Panonychus ulmi* и *Panonychus citri*, которые в настоящее время представляют собой значительную проблему для сельского хозяйства и садоводства.

Более того, соединение по настоящему изобретению обладает лишь крайне слабой фитотоксичностью по отношению к полезным культурам, таким как овощи и фруктовые деревья, и низкой токсичностью по отношению к теплокровным животным.

Благодаря этому, соединение по настоящему изобретению может успешно использоваться в качестве активного компонента митицида (или митицидной композиции).

В тех случаях, когда соединение по настоящему изобретению предназначено для непосредственного использования в качестве активного компонента митицида, соединение формулы (I) может быть использовано как таковое, но обычно оно может быть использовано в виде композиций с другими пригодными нетоксичными добавками в различных формах.

В качестве дополнительных компонентов, пригодных для получения композиций, можно назвать носители, эмульгаторы, диспергенты, стабилизаторы и т.д., которые, в случае необходимости, могут быть использованы соответствующим образом.

Носители включают твердые носители и жидкие носители; твердые носители включают, например, минеральные порошки, такие как диатомовую землю, тальк, глину, оксид алюминия, каолин, монтмориллонит, кремневую кислоту и белую сажу, порошкообразные материалы животного и растительного происхождения, такие как крахмал, соевую муку, пшеничную муку и рыбную муку; а жидкие носители включают воду, спирты, такие как метиловый спирт и этиленгликоль, кетоны, такие как ацетон и метилэтилкетон, простые эфиры, такие как тетрагидрофуран и диоксан, алифатические углеводороды, такие как керосин, бензин и циклогексан, ароматические углеводороды, такие как ксилол, триметилбензол и тетраметилбензол, галогенированные углеводороды, такие как хлороформ и хлорбензол, амиды кислот, такие как диметилформамид, сложные эфиры, такие как этилацетат, нитрилы, такие как ацетонитрил, серосодержащие соединения, такие как диметилсульфоксид, и т.д.

Эмульгаторы включают, например, неионогенные эмульгаторы, такие как простые алкильные эфиры полиоксипропилена, простые алкилаллильные эфиры полиоксипропилена, сложные эфиры полиоксипропилена и жирных кислот и сложные эфиры полиоксипропиленсорбитана и жирных кислот; анионные эмульгаторы, такие как сложные эфиры алкилаллилсульфатов и сложные эфиры полиоксипропиленалкилаллилсульфатов; или их смеси.

Диспергенты включают, например, этиленгликоль, глицерин, соли лигносульфонатов, метилцеллюлозу, сложные эфиры алкилсульфатов, соли алкилбензолсульфонатов, соли сложных эфиров диалкилсульфоянтарной кислоты, соли сложных эфиров полиоксипропиленалкилсульфатов и продукты конденсации нафталинсульфокислоты и формалина или их смеси.

Стабилизаторы включают, например, сложные эфиры фосфорной кислоты, эпихлоргидрин, простой фенилглицидиловый эфир, гликоли, неионогенные поверхностно-активные вещества, ароматические диамины и т.д.

Композиции, содержащие соединение по настоящему изобретению, при необходимости, могут быть использованы в смеси или в сочетании с другими пестицидами, такими как, например, инсектициды, митициды, гермициды, аттрактанты и регуляторы роста растений; при этом в некоторых случаях может быть достигнут превосходный эффект.

Такие инсектициды или пестициды включают, например, соединения типа сложных органических эфиров фосфорной кислоты, таких как фенитроцион (Fenitrothion, 0,0-диметил-0-4-нитро-м-толил-фосфотиоат), диазинон (Diazinon, 0,0-диэтил-0-2-изопропил-6-метилпиримидин-4-ил фосфотиоат), хлорпирифос-метил (Chlorpyrifos-methyl, 0,0-диметил-0-(3,5,6-трихлор-2-пиридил)-фосфотиоат) и ацефат (Acephate, 0,0-диметил-ацетил-фосфоамидотиоат); соединения на основе карбамата, такие как карбарил (Carbaryl, 1-нафтилметил-карбамат), карбофуран (Carbofuran, 2,3-дигидро-2,2-диметилбензофуран-7-ил-метилкарбамат) и метомил (Methomyl, S-метил-N-(метилкарбамоил-окси)-тиоацетимидат); хлорированные органические соединения, такие как дикофол (Dicofol, 2,2,2-трихлор-1,1-бис-(4-хлорфенил)-этанол; металлорганические соединения, такие как фенбутатин-оксид (Fenbutatin oxide, гекса-кис-(β,β-диметилфенэтил)-дис-танноксан); пиретроиды, такие как фенвалерат (Fenvalerate, (RS)-α-циано-3-феноксибензил-(RS)-2-(4-хлорфенил)-3-метил-бутират) и перметрин (Permethrin, 3-феноксибензил-(IRS)-цис,транс-3-(2,2-дихлорвинил)-2,2-диметил-циклопропанкарбоксилат); соединения на основе бензоилмочевин, такие как дифлубензурон (Diflubenzuron, 1-(4-хлорфенил)-3-(2,6-дифторбензоил)-мочевина) и хлорфлуазурон (Chlorfluazuron, 1-(3,5-дихлор-4-(3-хлор-5-трифторметил-2-пиридил-окси)-фенил)-3-2,6-дифторбензоил)-мочевина; и соединения, такие как бупрофезин (2-трет-бутилмино-3-изопропил-5-фенил)-3,4,5,6-тетрагидро-2H-1,3,5-тиадиазин-4-он) и гекситиазокс (Hexythiazox, транс-5-(4-хлорфенил)-N-циклогексил-4-метил-2-оксотиазолидин-3-карбоксамид).

Гермициды включают, например, фосфорорганические соединения, такие как ипробенфос (Iprobenfos, S-бензил-0,0-диизопропилфосфотиоат) и эдифенфос (Edifenphos, 0-этил-S,S-дифенилфосфодитиоат); хлорорганические соединения, такие как фталид (Phthalide, 4,5,6,7-тетрахлорфталид); дитиокарбаматные соединения, такие как полимер зинеб (Zineb, цинк-этилен-бис-дитиокарбамат) и поликарбамат (Polycarbamate, дицинк-бис-диметилдитиокарбамат); N-галогентииоалкильные соединения, такие как каптан (Captan, 3a,4,7,7a-тетрагидро-N-(трихлор-метансульфенил)-фталимид) и каптафол (Captafol, 3a,4,7,7a-тетрагидро-N-(1,1,2,2-тетрахлорэтансульфенил)-фталимид); дикарбоксимидные соединения, такие как; гликофен (Glycophene, 3-(3,5-дихлорфенил)-N-изопропил-2,4-диоксоимидазолидин-1-карбоксамид), винклозолин (Vinclozolin, (RS)-3-(3,5-дихлорфенил)-5-метил-5-винил-1,3-оксазолидин-2,4-дион) и процимидокс (Procymidox, N-(3,5-дихлорфенил)-1,2-диметилциклопропан-1,2-дикарбоксимид); бензимидазольные соединения, такие как беномил (Benomyl, метил-1-(бутилкарбамоил)-бензимидазол-2-ил-карбамат); азольные соединения, такие как байкор (Baycor, 1-(бифенил-4-илокси)-3,3-диметил-1-(1H-1,2,4-триазол-1-ил)-бутан-2-ол) и трифлумизол (Triflumizole, 1-(N-(4-хлор-2-трифторметилфенил)-2-пропоксиацетимидоил)-имидазол); и бензанилидные соединения, такие как мепронил (Mepronil, 3-изопропокси-0-толуанилид) и фулутолуанил (Fulutoluanil, α,α,α-трифтор-3-изопропокси-0-толуанилид).

Аттрактанты включают, например, соединения типа бензойной кислоты, 4-аллил-2-метоксифенола и 4-(п-ацетоксифенил)-2-бутанона.

Соединение формулы (I) по настоящему изобретению может быть приготовлено в виде различных дозированных форм, таких как смачиваемые порошки, гранулы, порошки, эмульсии и текучие композиции, известными способами приготовления композиций и с использованием вышеперечисленных ингредиентов.

Содержание активного соединения формулы (I) в таких композициях может изменяться в широком интервале в зависимости от вида дозированной формы, однако, как правило, содержание соединения в композиции составляет от 0,01 до 80% масс.; более предпочтительно, его содержание определяется в зависимости от вида соответствующей дозированной формы: например, в случае жидких композиций, эмульсий и смачиваемых порошков содержание соединения формулы (I) может составлять от 0,01 до 50% масс., более предпочтительно, от 0,1 до 20% масс., а в случае порошков и гранул содержание соединения формулы (I) может составлять от 0,01 до 20% масс., более предпочтительно, от 0,1 до 10% масс.

Композиции, содержащие соединение формулы (I) по настоящему изобретению, могут быть использованы для борьбы с вредными клещами путем их непосредственного применения к взрослым особям, личинкам или гнидам клещей, являющихся вредителями сельскохозяйственных и садовых культур, или путем их применения в местах обитания взрослых особей, личинок или гнид. Доза соединения формулы (I) может изменяться в зависимости от потребности с учетом вида дозиро-

ванной формы, общей ситуации с вредными насекомыми и т.д., но обычно может составлять от 0,01 до 100 г, предпочтительно, от 0,1 до 100 г на 10 ар (0,1 га); более конкретно, например, в случае вышеупомянутых эмульсий, жидких композиций и смачиваемых порошков, они могут обычно быть разбавлены до концентраций от 0,001 до 10000 м.д. (миллионных долей), предпочтительно, от 0,01 до 1000 м.д. в пересчете на концентрацию соединения формулы (I), и разбавленные композиции используются из расчета от 100 до 1000 л на 10 ар, а в случае порошков и гранул, они обычно могут быть использованы в количестве от 0,2 до 4 кг на 10 ар.

Примеры.

Настоящее изобретение описано более подробно в приведенных ниже примерах.

Пример 1.

Смесь 23,6 г (0,10 моль) 2-амино-2-(2-этокси-4-трет-бутилфенил)-этанола, 12,2 г (0,12 моля) триэтиламина и 200 мл тетрагидрофурана охлаждают и перемешивают, добавляют по каплям 17,7 г (0,10 моля) 2,6-дифторбензоилхлорида, и смесь перемешивают при комнатной температуре в течение 5 часов. Реакционную смесь фильтруют, и фильтрат концентрируют под разрежением, получая 32,5 г N-(2,6-дифторбензоил)-2-амино-2-(2-этокси-4-трет-бутилфенил)-этанола.

Смесь 5,21 г (13,8 ммоль) N-(2,6-дифторбензоил)-2-амино-2-(2-этокси-4-трет-бутилфенил)-этанола, 3,94 г (33,12 ммоль) тионилхлорида и 50 мл бензола кипятят с обратным холодильником при перемешивании на масляной бане в течение 2 часов. Реакционную смесь охлаждали до комнатной температуры и концентрировали под разрежением; к концентрату добавляли 100 мл этилацетата и смесь промывали насыщенным водным раствором бикарбоната натрия, а затем насыщенным соевым раствором, осушали безводным сульфатом натрия и концентрировали под разрежением. К концентрату прибавляли по очереди 50 мл метанола и 10 мл водного 20%-ного раствора гидроксида натрия, и смесь перемешивали при 70°C в течение 30 минут. Реакционную смесь концентрировали под разрежением, прибавляли к концентрату 100 мл бензола и промывали смесь насыщенным соевым раствором и осушали безводным сульфатом натрия.

Осушенный раствор концентрировали под разрежением, и концентрат подвергали очистке методом колоночной хроматографии на силикагеле (в качестве подвижной фазы использовали смесь гексан : этилацетат - 7:3). Очищенный материал растворяли при нагревании в 50 мл гексана и раствор оставляли при комнатной температуре на ночь. Выделившиеся кристаллы собирали на фильтре, получая 3,60 г 2-(2,6-дифторфенил)-4-(2-этокси-4-трет-бутилфенил)-2-оксазолин в виде бесцветных кристаллов, температура плавления от 101,0 до 102,0°C, выход 62,5 %.

Спектр ядерного магнитного резонанса (растворитель CDCl₃):

δ_{TMS} , М.Д.	
1,30 (с)	9 Н
1,37 (т), J = 7,2 Гц	3 Н
4,01 (кв), J = 7,2 Гц	2 Н
4,11 (т), J = 8,0 Гц	1 Н

4,78 (дд), J ₁ = 9,6 Гц, J ₂ = 8,0 Гц	1 Н
5,58 (дд), J ₁ = 9,8 Гц, J ₂ = 8,5 Гц	1 Н
6,6 - 7,6 (м)	6 Н.

Спектр ИК-поглощения (пластинка KBr), ν_{max} (см⁻¹):

2850 - 2960 (C-H), 1660 (C=N).

Пример приготовления композиции 1 (эмульсия).

10 частей соединения по настоящему изобретению, 12 частей полиэтиленнонилфенильного простого эфира и 78 частей ксилола равномерно перемешивают до получения эмульсии.

Пример приготовления композиции 2 (смачиваемый порошок).

10 частей соединения по настоящему изобретению, 5 частей додецилбензолсульфоната натрия, 3 части полиоксиэтиленнонилфенильного простого эфира, 30 частей глины и 52 части диатомовой земли равномерно перемешивают и размалывают, получая смачиваемый порошок.

Пример приготовления композиции 3 (текучая композиция).

5 частей сульфата полиоксиэтиленстирилфенильного простого эфира и 3 части смектитного минерала равномерно растворяют в 62 частях воды; прибавляют 10 частей соединения по настоящему изобретению, смесь достаточно интенсивно перемешивают и подвергают мокрому помолу в песчаной мельнице; затем прибавляют 20 частей водного 1%-ного раствора смолы зансун; полученную смесь перемешивают достаточно интенсивно для получения текущей композиции.

Пример испытаний 1.

Испытания на овицидное действие по отношению к *Ranonychus citri*.

В каждую из вазочек для мороженого (диаметр 9 см) наливали воду, в крышечках проделывались отверстия, в которые вставляли полоску, образовавшуюся в результате надреза листа фильтровальной бумаги, так, чтобы вся фильтровальная бумага увлажнялась водой, и клали на бумагу лист персикового дерева. На каждый лист высаживали 20 взрослых особей самок *Ranonychus citri*, устойчивых к действию различных митицидов, и оставляли на 24 часа для кладки яиц, после чего клещей удаляли. Листья обрабатывали препаратами определенной концентрации (полученными путем разбавления водой эмульсий, приготовленных таким же образом, как было описано в Примере приготовления композиции 1). Каждую вазочку выдерживали в течение 8 суток в термостатируемой камере (25°C), после чего под микроскопом подсчитывали количество личинок и определяли овицидное действие препарата. Испытания для каждого участка повторяли три раза. Результаты приведены в таблице 1.

Пример испытаний 2.

Испытания на овицидное действие по отношению к *Tetranychus kanzawai*.

В каждую из вазочек для мороженого (диаметр 9 см) наливали воду, в крышечках проделывались отверстия, в которые вставляли полоску, образовавшуюся в результате надреза листа фильтровальной бумаги, так, чтобы вся фильтровальная бумага увлажнялась водой, и клали на бумагу лист фасоли обыкновенной. На каждый лист высаживали 20 взрослых особей самок *Tet-*

ganychus kanzawai, устойчивых к действию различных митицидов, и оставляли на 24 часа для кладки яиц, после чего клещей удаляли. Листья обрабатывали препаратами определенной концентрации (полученными путем разбавления водой текучих композиций, приготовленных таким же образом, как было описано в примере приготовления композиции 3). Каждую вазочку выдерживали в течение 8 суток в термостатируемой камере (25°C), после чего под микроскопом подсчитывали количество личинок и определяли овицидное действие препарата. Испытания для каждого участка

повторяли три раза. Результаты приведены в таблице 2.

Как отмечалось выше, 2-(2,6-дифторфенил)-4-(2-этокси-4-трет-бутилфенил)-2-оксазолин, описываемый в настоящем изобретении, обладает очень высокой митицидной активностью, имеет весьма низкую токсичность по отношению к теплокровным животным, не проявляет фитотоксичности по отношению к культурным растениям, и, таким образом, может быть использован в качестве митицида.

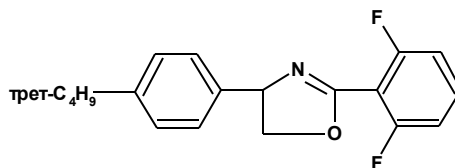
Таблица 1

Испытываемое соединение	Овицидное действие препарата (%)*			
	2,0 м.д.	1,0 м.д.	0,5 м.д.	0,25 м.д.
Соединение по настоящему изобретению	100 %	100 %	95 %	85 %
Соединение 1 ^{а)}	10 %	0 %	0 %	0 %
Соединение 2 ^{б)}	10 %	0 %	0 %	0 %
Соединение 3 ^{в)}	0 %	0 %	0 %	0 %

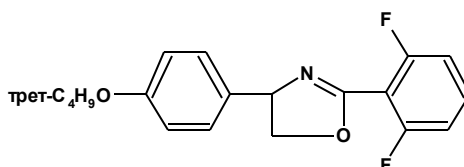
* Овицидное действие препарата (%) -

$$\frac{(\text{Количество отложенных яиц}) - (\text{Количество выведшихся личинок})}{(\text{Количество отложенных яиц})} \times 100$$

^{а)} Соединение 1 (Соединение № 44 по изложенной заявке Японии № 85268/1990):



^{б)} Соединение 2 (Соединение № 64 по изложенной заявке Японии № 85268/1990):



^{в)} Соединение 3 (Соединение № 76 по изложенной заявке Японии № 85268/1990):

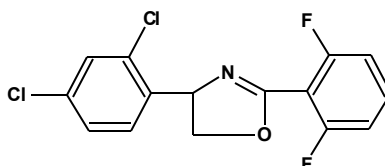


Таблица 2

Испытываемое соединение	Овицидное действие препарата (%)*			
	2,0 м.д.	1,0 м.д.	0,5 М.Д.	0,25 м.д.
Соединение по настоящему изобретению	100 %	100 %	90 %	80 %
Соединение 1 ^{а)}	10 %	0 %	0 %	0 %
Соединение 2 ^{б)}	5 %	0 %	0 %	0 %
Соединение 3 ^{в)}	0 %	0 %	0 %	0 %

* Овицидное действие препарата (%)Х -

$$= \frac{(\text{Количество отложенных яиц}) - (\text{Количество выведшихся личинок})}{(\text{Количество отложенных яиц})} \times 100$$

Соединения ^{а) - в)} те же, что и в таблице 1.

ДП "Український інститут промислової власності" (Укрпатент)
Україна, 01133, Київ-133, бульв. Лесі Українки, 26
(044) 295-81-42, 295-61-97

Підписано до друку _____ 2001 р. Формат 60х84 1/8.
Обсяг _____ обл.-вид. арк. Тираж 50 прим. Зам. _____

УкрІНТЕІ, 03680, Київ-39 МСП, вул. Горького, 180.
(044) 268-25-22
