Союз Советских Социалистических Республик

Государственный комитет Совета Министров СССР по делам изобретений и открытий

ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ

К ПАТЕНТУ

(11) 849977

(61) Дополнительный к патенту -

(22) Заявлено 20.08.76 (21) 2389055/23-04

(51) М. Кл.[3] A 01 N 47/12

(23) Приоритет - (32) 22.08.75

(31) 10902/75 (33) Швейцария

(43) Опубликовано 23.07.81. Бюллетень №27

(53) УДК 632.951.2(088.8)

(45) Дата опубликования описания 30.07.81

(72) Автор изобретения: Иностранец Фридрих Каррер (Швейцария)

(71) Заявитель: Иностранная фирма "Циба-Гейги АГ" (Швейцария)

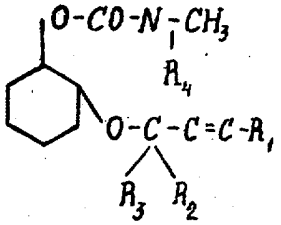
ВСЕСОЮЗНАЯ ПАТЕНТНО-ТЕХНИЧЕСКАЯ БИБЛИОТЕКА 13

(54) ИНСЕКТОАКАРИЦИДНОЕ СРЕДСТВО

1

Изобретение относится к средствам защиты растений и животных, в частности для уничтожения представителей семейств ряда Акарина, обладающим ювенильно-гормональным действием.

Известно средство на основе N-метилкарбаматов общей формулы



где R_1 - водород или метил;

R_2 и R_3 - одинаковые или различные, водород, метил или этил при условии, что два радикала из

2

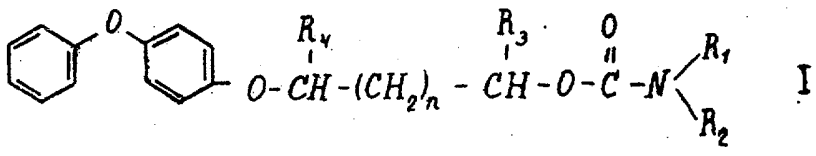
R_1, R_2 или R_3 одновременно обозначают водород;

R_4 - водород, метил или оксиметил [1].

Однако указанное средство действует только на взрослых насекомых, например тараканов, саранчу, жуков и т.д.

Цель изобретения - расширение ассортимента инсектоакарицидных средств, воздействующих на определенные стадии развития насекомых, обладающих более высокой активностью по сравнению с известными.

Поставленная цель достигается применением инсектоакарицидного средства, включающего в качестве активного начала карбаматы формулы



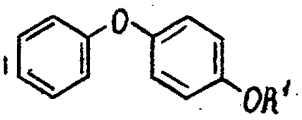
где R_1-C_1-C_4 – алкил, галогенэтил или C_3-C_4-алкенил;

R_2 и R_3 – водород, метил или этил;

R_4 – водород или метил;

или R_3 и R_4 при n=0 вместе означают остаток CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-(n-0,1,2)

в количестве от 0,1 до 95%, а остальное – вспомогательные добавки.

Физические константы предлагаемых активнодействующих соединений формулы I  представлены в табл. 1.

Соединения формулы I могут быть использованы для уничтожения различного рода животных и растительных вредителей, в частности для уничтожения представителей ряда Акарина семейств иксодидае, аргазидае, тетранихидае, а также насекомых семейств, акридидае, блаттидае, гриллидае и др.

Пестицидное действие может быть существенно расширено за счет добавления других инсекцидов и/или акарицидов.

В качестве добавок могут быть использованы, например органические соединения фосфора, нитрофенолы и их производные, формамидины, мочевина, карбаматы, производные хризантемовой кислоты или хлорированные углеводороды.

Добавки могут быть твердыми или жидкими и соответствуют обычно применяемым в технике приготовления рецептур веществам, например природным или регенерированным веществам, растворителям, диспергаторам, смачивателям, прилипателям, загустителям, связующим и/или удобрениям.

Для применения соединения формулы I могут быть переработаны в пылевидные препараты, эмульсионные концентраты, грануляты, дисперсии, аэрозольные препараты, в растворы или взвести.

Получение предлагаемого средства осуществляют известным способом посредством тщательного перемешивания и/или измельчения действующих начал формулы I с подходящими наполнителями, в случае необходимости с добавлением инертных по отношению к действующим началам диспергаторов или растворителей.

Действующие начала могут находиться или применяться в твердых формах переработки, например, в виде пылевидных или химических препаратов для внесения в почву, гранулятов (грануляты с оболочкой, пропиточные грануляты и гомогенные грануляты), или же в жидких формулах переработки, например, в виде диспергирующихся в воде концентратов действующего начала (смачивающихся порошков, паст, эмульсий) и растворов.

Содержание активных веществ в описанных средствах находится в пределах от 0,1 до 95%.

Для получения 5%-ного пылевидного препарата действующего начала формулы I применяется 5 ч действующего начала и 95 ч талька.

Для получения 2%-ного пылевидного препарата необходимо 2 ч действующего начала, 1 ч высокодисперсной кремневой кислоты и 97 ч талька.

Для получения 5%-ного гранулята применяется 5 ч действующего начала, 0,25 ч эпихлорпидрина, 0,25 ч цетилполигликолевого эфира, 3,50 ч полиэтиленгликоля и 91 ч каолина (размер частиц 0,3-0,8 мм).

Активное начало перемешивается с эпихлоргидрином и растворяется с 6 ч ацетона. После этого добавляют полиэтиленгликоль и цетилполигликолевый эфир. Полученный таким образом раствор разбрызгивают на каолин и после этого ацетон выпаривают в вакууме.

Для получения 40%-ного смачивающего порошка применяют 40 ч действующего начала, 5 ч натриевой соли лигнинсульфокислоты, 1 ч натриевой соли дибутилнафталинсульфокислоты и 53 ч кремневой кислоты.

Для получения 25%-ного смачивающего порошка применяют 25 ч действующего начала, 1,5 ч смеси мела и оксиэтилцеллюлозы (1:1); 1,5 ч дибутил-нафталинсульфоната натрия, 19,5 ч кремневой кислоты, 19,5 ч мела, 28,1 ч каолина и 4,5 ч лигнинсульфоната кальция.

25%-ный смачивающийся порошок получают также смешивая 25 ч действующего начала, 2,5 ч изооктилфеноксиполиоксиэтиленэтанола, 1,7 ч смеси мела и оксиэтилцеллюлозы (1:1), 8,3 ч алюмосиликата натрия, 16,5 ч кизельгура и 46 ч каолина.

Для получения 10%-ного смачивающегося порошка применяют 10 ч действующего начала. 3 ч смеси натриевых солей насыщенных сульфатов жирных спиртов, 5 ч продукта конденсации нафталинсульфокислоты с формальдегидом и 82 ч каолина.

Действующие начала тщательно перемешивают в подходящих смесителях с добавками и измельчают на соответствующих мельницах и вальцах. Получают смачивающиеся порошки, которые могут быть разбавлены водой до получения суспензии любой желательной концентрации.

Для получения 10%-ного эмульгирующегося концентрата применяют 10 ч действующего начала, 3,4 ч эпоксидированного растительного масла, 3,4 ч комбинированного эмульгатора, состоящего из полигликолевого эфира жирного спирта и кальциевой соли алкиларисульфоната, 40 ч диметилформамида и 43,2 ч ксилола.

Для получения 25%-ного эмульгирующегося концентрата применяют 25 ч действующего начала, 2,5 ч эпоксидированного растительного масла, 10 ч смеси алкиларилсульфоната и полигликолевого эфира жирного спирта, 3 ч диметилформамида и 57,5 ч ксилола.

Для получения 50%-ного смачивающегося порошка применяют 50 ч действующего начала, 4,2 ч полигликолевого эфира трибутилфенола, 5,8 ч додецилбензолсульфоната кальция, 20 ч циклогексанона и 20 ч ксилола.

Из таких концентратов могут быть путем разбавления водой получены эмульсии любой желательной концентрации.

Для получения 5%-ного препарата для опрыскивания применяют 5 ч действующего начала, 1 ч эпихлоргидрина, 94 ч бензина (пределы выкипания 160-190°С).

Эту же концентрацию препарата получают смешивая 95 ч действующего начала и 5 ч эпихлоргидрина.

Сравнительные испытания на инсекто-акарицидную активность.

Указанные в табл. 2 соединения подвергают при сравниваемых условиях биологическим тестам-способам А, В, и С, которые осуществляют следующим образом.

А/ Контактное действие на куколки Tenebrio molitor

Определенное количество 0,1%-ного раствора биологически активного вещества в ацетоне, соответствующее количеству биологически активного вещества 10 мг/м^2, вносят пипеткой в алюминиевую чашку и равномерно распределяют. После испарения ацетона на обработанную поверхность помещают 10 свежевылупившихся куколок Tenebrio molitor. Чашку затем закрывают сетчатой крышкой.

После того, как необработанные контрольные насекомые покинут оболочку куколок в виде взрослых особей, исследуют подопытных насекомых развившихся из обработанных описанным способом куколок, в отношении количества нормально развитых взрослых особей.

Оценка 5 - летальные особые формы экстра-куколки и взрослое состояние (Adultoide), 100%-ное действие;

4 - летальные особые формы и не летальные особые формы (взрослое состояние);

3 - летальные особые формы, не летальные особые формы и нормально развивавшиеся взрослые особи;

2 - не летальные особые формы и нормально развитые взрослые особи;

1 - нормально развитые взрослые особи, 0% активности.

В/ Контактное действие на личинки Dysercus fasciatus

Определенное количество 0,1%-ного раствора биологически активного вещества в ацетоне, соответствующее количеству биологически активного вещества 10 мг/м^2, вносят пипеткой в алюминиевую чашку и равномерно распределяют. После улетучивания ацетона на обработанную поверхность чашки, которая содержит корм и влажную вату, помещают 10 личинок Dysercus fasciatus в 5-й стадии развития. Чашку затем закрывают сетчатой крышкой.

Спустя примерно 10 дней, т.е. как только необработанные контрольные насекомые прошли полную линьку до взрослых особей, исследуют подопытных насекомых, развившихся из обра-

ботанных указанным образом личинок, в отношении количества нормальных взрослых особей.

Оценка 5 - летальные особые формы (гибель при линьке и экстра-личинки) 100%-ное действие;

4 - летальные особые формы и не летальные особые формы (взрослое состояние);

3 - летальные особые формы, не летальные особые формы ил нормальные взрослые особи;

2 - не летальные особые формы и нормальные взрослые особи;

1 - нормальные взрослые особи, 0% действия.

С/ Действие на Aedes algypti (личинки)

Пипеткой на поверхность 150 мл воды, находящейся в стакане, вносят такое количество 0,1%-ного раствора биологически активного вещества, чтобы получить его концентрации, равные 10,5 и 1 м.д. После улетучивания ацетона в каждый из наполненных раствором биологически активного вещества стаканов помещают по 30-40 двухдневных личинок Aedes algypti. Затем в стаканы добавляют размолотый корм, потом их закрывают пропускающей воздух крышкой.

Спустя 1, 2 и 5 дней определяют возможную смертность. Затем обращают внимание на торможение окукливания, метаморфозы и линьки до взрослых особей.

Оценка 1 - комары при 10 м.д. (0%-ное действие)

2 - отсутствие комаров при 10 м.д.

3 - отсутствие комаров при 5 м.д.

5 - отсутствие комаров при 1 м.д. (100%-ное действие)

Взяв за основу указанные оценки, получают результаты, представленные в табл. 3.

Как видно из табл. 3 известные соединения не являются активными на 100% по отношению к взятым для испытания вредителям, в то время, как большинство из предлагаемых соединений 1-12 активно во всех испытаниях на 100%.

Действие против пастбищных клещей Рапицефалус бурса.

По 5 взрослых клещей или 50 личинок клещей отсчитывают в стеклянную трубочку и погружают на 1-2 мин в 2 мл водной эмульсии из разряда разбавлений, с содержанием исследуемого соединения по 100, 10, 1 или 0,1 ч на млн. Трубочку затем закрывают стандартным ватным тампоном и переворачивают с тем, чтобы эмульсия действующего начала могла впитаться ватой.

Оценка производится в случае взрослых организмов спустя 2 недели, а в случае личинок - спустя 2 дня. Каждый эксперимент повторяют 2 раза.

Боофилус микроплус (личинки)

С использованием аналогичного ряда разбавлений осуществляют эксперименты с применением по 20 чувствительных или же ОП-устойчивых личинок (устойчивость относится к переносимости диазинона).

Соединения формулы I эффективны в данном испытании против взрослых организмов и личинок Рапицефалус бурса и чувствительных или ОП-устойчивых личинок Боофилус микроплус.

Действие против яиц Сподоптера литторалис.

Кладку яиц Сподоптера литторалис погружают в 0,05%-ный ацетоновый раствор действующего начала. Обработанную кладку яиц выдерживают затем в пластмассовых чашах при 21°С и в условиях 60%-ной относительной влажности.

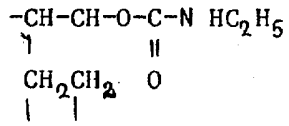
Спустя 3-4 дня определяют коэффициент вылупления.

Соединения формулы I показали в этом испытании хорошее действие против яиц Сподоптера литторалис.

Таблица 1

Значение радикала R^1 в формуле I	$T_{пл}$, °С
$-CH_2-CH_2-O-\overset{O}{\overset{\|}{C}}-N\ HC_2-H_5$	55-56
$-CH_2-CH_2-O-\overset{O}{\overset{\|}{C}}-N\ (CH_3)_2$	54-55
$-CH_2-CH_2-O-\overset{O}{\overset{\|}{C}}-N\ HC_2-CH=CH_2$	51-52
$-CH_2-\overset{CH_3}{\overset{\|}{CH}}-O-\overset{O}{\overset{\|}{C}}-N\ HC_2H_5$	62-63

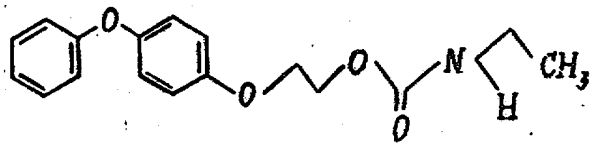
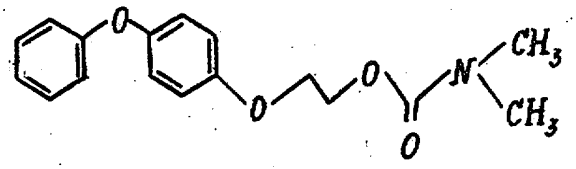
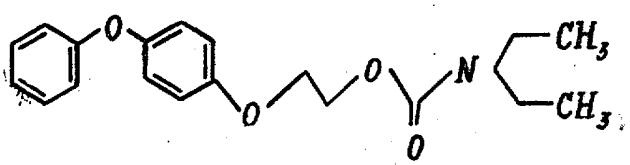
Продолжение табл. 1

1	2
$-CH_2-CH(CH_3)-O-C(=O)-NHC_4H_9$ (H)	59-60
$-CH_2-CH(C_2H_5)-O-C(=O)-NHC_2H_5$	61-62
$-CH_2-CH_2-CH_2-O-C(=O)-NHCH_2-CH=CH_2$	42-43
$-CH_2-CH_2-CH_2-O-C(=O)-NHC_2H_5$	42-43
	90-91
$-CH_2-CH_2-O-C(=O)-NH-CH_3$	63-64
$-CH(CH_3)-CH_2-O-C(=O)-NHC_2H_5$	72-73
$-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-O-C(=O)-NHCH_3$	77-79
$-CH_2-CH_2-O-C(=O)-NHC_3H_7$(изо)	68-69

Продолжение табл. 1

1	2
$-CH_2-CH(CH_3)-O-C(=O)-NHC_4H_9$(изо)	71-72
$-CH_2-CH(CH_3)-O-C(=O)-N(C_2H_5)_2$	n_D^{20} 1,5358
$-CH_2-CH(CH_3)-O-C(=O)-NHCH_2-CH=CH_2$	n_D^{20} 1,5534
$-CH_2-CH(CH_3)-O-C(=O)-NHC_3H_7$(изо)	74-75
$-CH_2-CH(CH_3)-O-C(=O)-NHCH_3$	n_D^{20} 1,5522
$-CH_2-CH_2-O-C(=O)-NH-CH_2-CH=CH-CH_3$ -	
$-CH_2-CH_2-O-C(=O)-NH-CH_2-CH_2-Cl$	61-63
$-CH_2-CH_2-CH_2-O-C(=O)-N(C_2H_5)_2$	n_D^{20} 1,5387
$-CH_2-CH_2-O-C(=O)-NH-C_4H_9$(трет.)	69-70

Таблица 2

Соединение №	Формула испытуемого соединения
1	2
1	
2	
3	

Продолжение табл.2

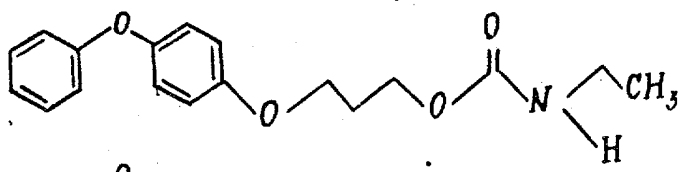
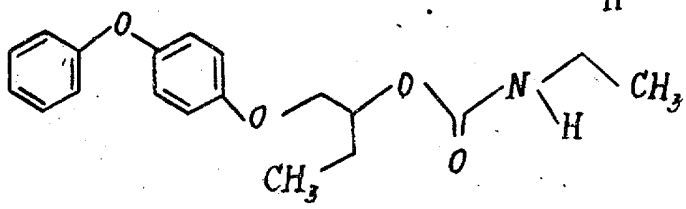
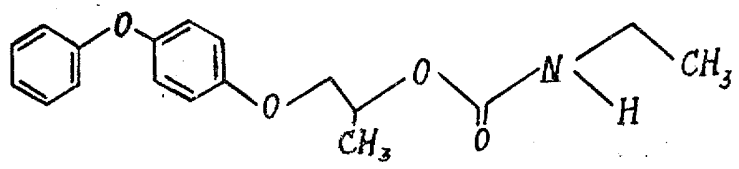
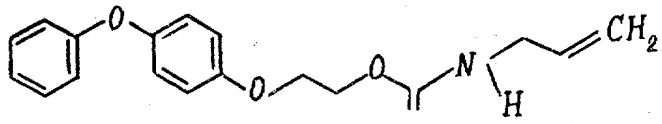
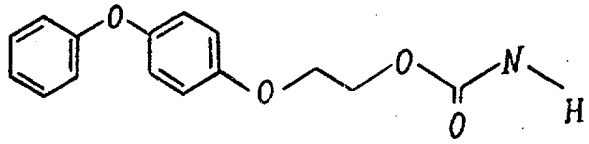
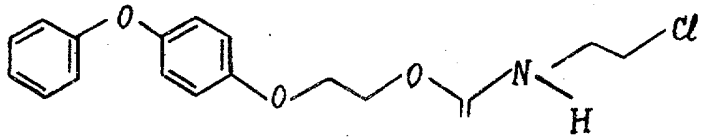
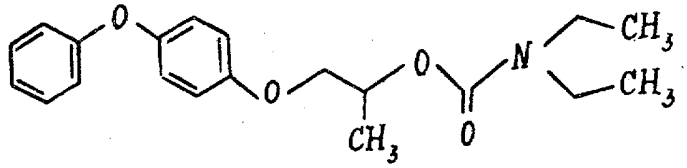
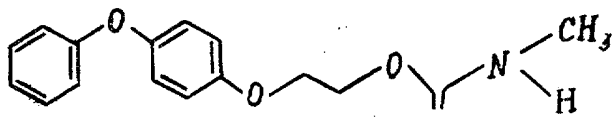
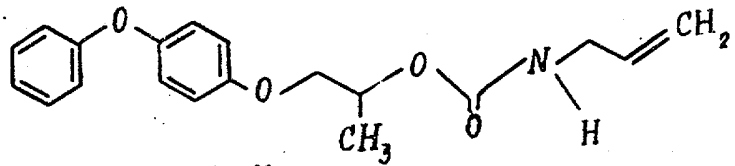
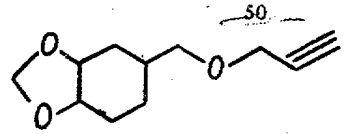
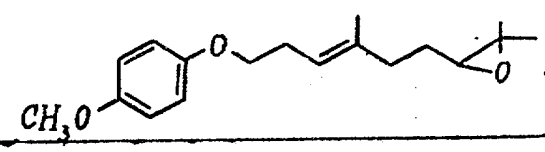
1	2
4	
5	
6	
7	
8	
9	
10	
11	
12	
Известное[2]	
Известное[3]	

Таблица 3

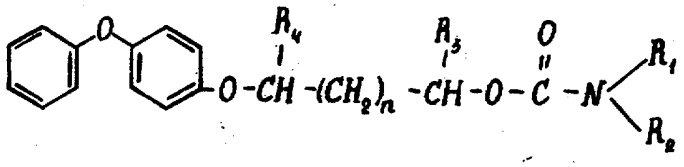
Соединение №	Тест-способ		
	A	B	C
	Инсектицидная активность		
1	5	5	5
2	3	5	5
3	5	5	5
4	5	5	5
5	5	1	5
6	5	5	5
7	5	5	5
8	1	5	5

Продолжение табл.3

Соединение №	Тест-способ		
	A	B	C
	Инсектицидная активность		
9	5	5	5
10	3	5	5
11	5	5	5
12	5	5	5
Известное [2]	4	1	3
Известное [3]	3	1	2

Формула изобретения

Инсектоакарицидное средство, включающее активное начало и вспомогательные добавки, отличающееся тем, что, с целью повышения активности, в качестве активного начала используют карбаматы формулы I



I

где R_1-C_1-C_4 – алкил, галогенэтил или C_3-C_4-алкенил;

R_2 и R_3 – водород, метил или этил;

R_4 – водород или метил;

или R_3 и R_4 при n=0 вместе означают остаток $-CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-$(n-0, 1,2).

в количестве от 0,1 до 95%, а остальное – вспомогательные добавки.

Источники информации, принятые во внимание при экспертизе

1. Патент СССР № 431655, кл. A 01 N 9/24, 1969.

2. Патент Франции № 2083648, кл. A 61 h 13/00, опублик. 1965.

3, Патент Франции № 2086145, кл. C 07 C 41/00, опублик. 1967.

Составитель М.Меркулова
Редактор Н.Егорова Техред С. Мигунова Корректор М.Пожо
Заказ 6124/81 Тираж 700 Подписное
ВНИИПИ Государственного комитета СССР
по делам изобретений и открытий
113035, Москва, Ж-35, Раушская наб., д. 4/5
Филиал ППП "Патент", г. Ужгород, ул. Проектная, 4