

PATENTOVÝ SPIS

(11) Číslo dokumentu:

294 602

(13) Druh dokumentu:

B6

(19)
ČESKÁ
REPUBLIKA



ÚŘAD
PRŮMYSLOVÉHO
VLASTNICTVÍ

(21) Číslo přihlášky: **2002-819**
(22) Přihlášeno: **07.09.2000**
(30) Právo přednosti: **07.09.1999 FR 1999/9911312**
(40) Zveřejněno: **12.06.2002**
(Věstník č. 06/2002)
(47) Uděleno: **08.12.04**
(24) Oznámení o udělení ve Věstníku: **16.02.2005**
(Věstník č. 2/2005)
(86) PCT číslo: **PCT/FR2000/002460**
(87) PCT číslo zveřejnění: **WO 2001/017354**

(51) Int. Cl. : ⁷

A 01 N 43/56

A 01 N 47/02

A 01 N 25/12

A 01 N 25/00

(73) Majitel patentu:

**BASF Agro B.V., Arnhem (NL), Wädenswil-Branch,
Wädenswil/Au, CH**

(72) Původce:

**Gaulliard Jean-Michel, Montanay, FR
Segaud Christian, Saint Didier au Mont d'Or, FR**

(74) Zástupce:

**TRAPLOVÁ HAKR KUBÁT Advokátní a patentová
kancelář, Ing. Eduard Hakr, Přístavní 24, Praha 7, 17000**

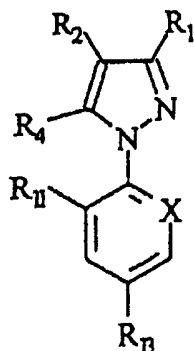
(54) Název vynálezu:

**Insekticidní prostředek, způsob kontroly hmyzu
a způsob ochrany plodin**

(57) Anotace:

Insekticidní prostředek, který obsahuje a) mezi 0,001 a 5 %, s výhodou mezi 0,05 a 1 % sloučeniny typu 1-fenyl-pyrazolu, zvláště 5-amino-3-kyano-1-[2,6-dichlor-4-(trifluormethyl)-fenyl]-4-[(trifluormethyl)-sulfinyl]-1H-pyrazol a b) mezi 0,05 a 10 %, s výhodou 0,1 a 5 % jedné nebo více látek organického typu, zadržujících vlhkost, a c) mezi 40 až 99 % s výhodou mezi 50 až 98 %, lépe mezi 70 až 97 % rostlinné mouky a způsob potírání hmyzu použitím tohoto prostředku, zejména kovařkovitých brouků.

CZ 294602 B6



(I)

Insekticidní prostředek, způsob kontroly hmyzu a způsob ochrany plodinOblast techniky

Vynález se týká nového insekticidního prostředku pro kontrolu půdního hmyzu v různých stádiích vývoje, zejména pro kontrolu kovaříkovitých brouků, jakož i způsobu kontroly hmyzu a způsobu ochrany plodin.

Dosavadní stav techniky

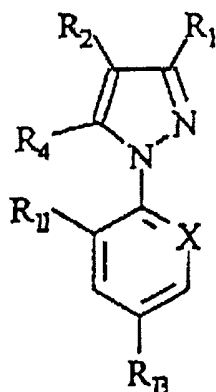
Insekticidní sloučeniny fenylypyrazolového typu, které jsou použitelné pro kontrolu hmyzu, jsou známy zejména z patentových dokumentů EP 259 117, WO 87/3781, WO 93/6089 a WO 94/21606. Patentové dokumenty EP 595 117 a EP 836 386 rovněž uvádějí prostředky, obsahující 0,01 až 5 % hmotnosti těchto látek. Kovaříkovití tvoří rod hmyzu, který je obzvláště škodlivý v některých plodinách, zejména v kukuřici, řepě, slunečnici, bramborách a řepce. Jejich škodlivý účinek je zřetelný zejména proto, že larvální formy kovaříkovitých se mohou vyskytovat v půdě po velmi dlouhou dobu dosahující až 5 let. Samozřejmě byly navrženy návnady pro různé druhy hmyzu, stejně jako prostředky, které se mohou konzumovat polknutím, ale tyto prostředky nejsou nutně aktivní pro všechny typy hmyzu a existuje tedy stále poptávka po insekticidních prostředcích, které by byly účinné i v okrajových situacích, a to zejména při kontrole kovaříkovitých. Navíc v případě insekticidů, aplikovaných do půdy nebo na půdu, je žádoucí nalézt podmínky a formulace, které umožňují dobrou účinnost v dávkách pokud možno co nejnižších.

Cílem vynálezu proto je eliminovat výše uvedené nedostatky a poskytnout účinné prostředky pro kontrolu nespolečenských druhů hmyzu. Dalším cílem vynálezu je poskytnutí účinných prostředků pro kontrolu půdního hmyzu, zejména kovaříkovitých a zejména kovaříkovitých brouků ve stadiu larev. Dalším cílem vynálezu je poskytnutí prostředků, obsahujících alespoň jednu insekticidně účinnou látku fenylypyrazolového typu, které by se snadno aplikovaly na půdu nebo do půdy. Konečně posledním cílem vynálezu je poskytnutí insekticidních prostředků, jejichž účinnost je dobrá i při nízkých aplikačních dávkách.

Podstata vynálezu

Předmětem vynálezu je takto insekticidní prostředek, jehož podstata spočívá v tom, že obsahuje

- a) 0,001 až 5 % hmotnosti, výhodně 0,05 až 1 % hmotnosti, a výhodněji 0,05 až 0,5 % hmotnosti, sloučeniny obecného vzorce I



(I)

ve kterém

R^1 znamená atom halogenu nebo skupinu CN nebo methylovou skupinu nebo skupinu CH_3CO ,

5 R^2 znamená skupinu $\text{S(O)}_n\text{R}^3$,

R^3 znamená alkylovou skupinu, obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů nebo halogenalkylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů,

10 R^4 znamená atom vodíku nebo atom halogenu nebo skupinu NR^5R^6 , skupinu $\text{S(O)}_m\text{R}^7$, skupinu C(O)R^7 nebo skupinu C(O)O-R^7 , alkylovou skupinu, obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů, halogenalkylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů nebo skupinu OR^8 nebo skupinu $\text{N=C(R}^9\text{)(R}^{10}\text{)}$,

15 R^5 a R^6 nezávisle jeden na druhém znamenají atom vodíku, alkylovou skupinu, obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů, halogenalkylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, C(O)-alkylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, nebo skupinu S(O),CF_3 , anebo R^5 a R^6 mohou dohromady tvořit dvojjazný alkylenový zbytek, který společně s atomem dusíku, ke kterému jsou R^5 a R^6 vázány, tvoří 5-, 6- nebo 7-
20 členný kruh, který může být přerušen jedním nebo dvěma dvojjaznými heteroatomy, kterými jsou atom kyslíku a atom síry,

R^7 znamená alkylovou skupinu, obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů nebo halogenalkylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů,

25 R^8 znamená alkylovou skupinu, obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů nebo halogenalkylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, nebo atom vodíku,

R^9 znamená alkylovou skupinu, obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů nebo atom vodíku,

30 R^{10} znamená fenylovou skupinu nebo skupinu, tvořenou 5-, 6- nebo 7-členným kruhem, obsahujícím 1, 2, 3 nebo 4 heteroatomy, zvolené z množiny, zahrnující dusík, kyslík a síru a případně kondenzovaným s benzenovým jádrem, případně substituovanou jedním nebo více atomy halogenu nebo skupinami, zvolenými z množiny, zahrnující hydroxylovou skupinu, -O-alkylo-
35 vou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, -S-alkylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, kyanoskupinu a alkylovou skupinu, obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů,

40 X znamená trojjazný atom dusíku nebo skupinu C-R^{12} , ve které tři zbývající valence atomu uhlíku jsou součástí aromatického kruhu,

R^{11} a R^{12} nezávisle jeden na druhém znamenají atom vodíku nebo atom halogenu,

45 R^{13} znamená atom halogenu nebo halogenalkylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, halogenalkoxylovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, skupinu $\text{S(O)}_q\text{CF}_3$ nebo skupinu SF_5 ,

m, n, q, r nezávisle jeden na druhém znamenají celé číslo 0, 1 nebo 2,

50 s výhradou spočívající v tom, že když R^1 znamená methylovou skupinu, potom R^3 znamená halogenalkylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, R^4 znamená skupinu NH_2 , R^{11} znamená atom chloru, R^{13} znamená trifluormethylovou skupinu a X znamená atom dusíku,

b) 0,05 až 10 % hmotnosti, výhodně 0,1 až 5 % hmotnosti alespoň jedné látky zadržující vlhkost, výhodně alespoň jedné látky organického původu zadržující vlhkost, a

c) 40 až 99 % hmotnosti, výhodně 50 až 98 % hmotnosti, a výhodněji 70 až 97 % hmotnosti, rostlinné mouky.

Výhodně je rostlinnou moukou mouka získaná mletím zrn obilniny, zvolené z množiny, zahrnující pšenici, ječmen, žito, tritikal, oves, rýži, čirok, sóju a kukuřici, přičemž výhodnou rostlinnou moukou je kukuřičná mouka.

Výhodně je látkou organického původu zadržující vlhkost makromolekulární hydrofilní derivát rostlinného původu, zejména hydrofilní derivát celulózy a samotná celulóza.

Insekticidní prostředek podle vynálezu dále obsahuje 3 až 30 % hmotnosti, výhodně 4 až 20 % hmotnosti, cukrů. Cukry jsou výhodně zvoleny z množiny, zahrnující monosacharidy, oligosacharidy a polysacharidy, a jsou jimi zejména sacharóza, laktóza, fruktóza, dextróza, glukóza, melasa nebo med.

Insekticidní prostředek podle vynálezu dále obsahuje konzervační činidlo, preventivně bránící degradaci složek prostředku a zvolené z množiny, zahrnující benzoát sodný, 1,2-benzothiazolin-3-on, kyselinu benzoovou, kyselinu para-hydroxybenzoovou a jejich estery a soli s alkalickými kovy a kovy alkalických zemin, zejména sodné soli, 2-fenylfenol a jeho soli s alkalickými kovy nebo kovy alkalických zemin, zejména sodnou sůl a paranitrofenol.

Insekticidní prostředek podle vynálezu dále obsahuje přísady, zvolené z množiny, zahrnující barviva, atraktanty pro hmyz, repelenty pro ptáky nebo jiná zvířata, která jsou užitečná nebo která by se měla chránit, pojidla, aglomerační činidla, ochucovadla, aglutinační činidla, želatinační činidla, zbobtnující činidla a antiadhezní činidla.

Výhodně insekticidní prostředek podle vynálezu jako sloučeninu obecného vzorce I obsahuje 5-amino-3-kyano-1-[2,6-dichlor-4-(trifluormethyl)fenyl]-4-[(trifluormethyl)sulfinyl]-1H-pyrazol.

Výhodně je insekticidní prostředek podle vynálezu ve formě granulí, které mají výhodně velikost 0,1 mm až 3 cm, výhodněji 0,5 až 4 mm, a jsou výhodně nerozpustné ve vodě.

Předmětem vynálezu je i způsob kontroly hmyzu, jehož podstata spočívá v tom, že se na půdu nebo do půdy, výhodně do půdy určené k obdělání, aplikuje účinné množství prostředku podle vynálezu ve formě granulí o velikosti 0,2 mm až 2 cm. Při dalším způsobu kontroly hmyzu podle vynálezu se na půdu nebo do půdy aplikuje prostředek podle vynálezu v dávce, která není smrtící při styku, ale je smrtící po spolknutí.

Předmětem vynálezu je rovněž způsob ochrany plodin, jehož podstata spočívá v tom, že se na půdu nebo do půdy, ve které plodiny budou růst nebo rostou, aplikuje účinné množství insekticidního prostředku podle vynálezu. Výhodně jsou plodinami, jejichž ochrana se provádí, obilniny, zejména kukuřice, nebo řepa nebo slunečnice nebo brambory nebo řepka. Výhodně se použije účinné množství jednoho z insekticidních prostředků podle vynálezu pro kontrolu kovaříkovitých brouků. Výhodně se použije účinné množství insekticidního prostředku podle vynálezu, odpovídající dávce sloučeniny obecného vzorce I 1 až 50 g/ha, výhodně 3 až 40 g/ha.

Sloučenina obecného vzorce I se může připravit jedním ze způsobů, popsanych v patentových dokumentech WO 87/3781, WO 93/6089, WO 94/21606 a EP 295 117 nebo libovolným jiným způsobem, známým pro přípravu uvedeného typu sloučenin. Tato sloučenina je dále v popisné části uváděna jako aktivní látka.

Z výše uvedeného je zřejmé, že jako rostlinné mouky, které je možno použít, lze uvést mouky připravené mletím obilovin, jako je pšenice, ječmen, žito, tritical, oves nebo také rýže, čirok, sója a kukuřice, přičemž výhodná mouka je na bázi kukuřice. V rámci tohoto vynálezu je možno také počítat se směsmi těchto rostlinných mouk.

Jako látky zadržující vlhkost je možno uvést makromolekulární hydrofilní deriváty rostlinného původu.

Jako látky organického původu zadržující vlhkost je možno uvést makromolekulární hydrofilní deriváty rostlinného původu, zejména celulóзовé hydrofilní deriváty, lépe celulózu a také jedno nebo více dezintegračních činidel. Výhodné je používat tyto sloučeniny zejména tehdy, kdy mouka, jako je hrubě mletá mouka, se používá ve formě granulí. Dezintegrační látky zahrnují: škrob, karboxymethylovaný škrob, celulózu, jako je mikrokrytalická celulóza, modifikované celulózy, jako je karboxymethylcelulóza sodná, bentonit, silikát hlinitý a silikát hořečnatý, polynaftalensulfonát sodný, dodecylbenzensulfonát sodný, dioktysulfosukcinát sodný, lignin sulfonát, cukerné deriváty, jako je laktóza, fruktóza, sacharóza, mannitol, dextróza, síťované deriváty polyvinylpyrrolidonu. Jestliže se používá dezintegrační činidlo, pak prostředek podle tohoto vynálezu může obsahovat 0,5 až 30 % a s výhodou 0,5 až 20 % hmotnostních této látky nebo látek.

Podle jedné varianty prostředek podle tohoto vynálezu může také obsahovat od 3 do 30 %, s výhodou od 4 do 20 % sacharidů. Tyto sacharidy se vybírají zejména z monosacharidů, oligosacharidů nebo polysacharidů, jako jsou zejména sacharóza, laktóza, fruktóza, dextróza, glukóza, nebo alternativně melasy a medu.

Prostředky podle tohoto vynálezu mohou také obsahovat konzervační činidla, preventivně bránící degradaci mouk, jako je benzoát sodný, 1,2-benzizothiazolin-3-on, kyselina benzoová, kyselina p-hydroxybenzoová a jejich estery, alkalické soli a soli kovů alkalických zemin, zejména jejich sodné soli, 2-fenylfenol a jeho alkalické soli nebo soli alkalických zemin, zejména sodné soli a para-nitrofenol.

Jako jiné přísady se mohou přidávat barviva nebo atraktanty pro hmyzí škůdce nebo repelenty pro ptáky nebo jiná užitečná zvířata, která by se měla chránit.

Jiné formulační přísady, které je možno použít, zahrnují pojidla, aglomerační činidla, chuťové přísady, aglutinační činidla, gelující činidla, látky pro bobtnání nebo antiadherentní látky a pod..

Výhodná skupina sloučenin obecného vzorce I zahrnuje sloučeniny obecného vzorce I, ve kterém R^1 je CN, a/nebo R^3 je halogenalkylová skupina a/nebo R^4 je NH_2 , a/nebo R^{11} a R^{12} jsou, na sobě nezávisle, atomy halogenu, a/nebo R^{13} je halogenalkylová skupina.

Podle zejména výhodné varianty tohoto vynálezu se v prostředcích podle vynálezu používá jako sloučenina vzorce I 5-amino-3-kyano-1-[2,6-dichlor-4-(trifluormethyl)-fenyl]-4-[(trifluormethyl)sulfinyl]-1H-pyrazol, který se v příkladech uvádí pod termínem „fipronil“.

Formulace podle vynálezu se obecně připravují ve formě granulí. Velikost granulí je s výhodou mezi 0,1 mm a 3 mm, lépe mezi 0,5 a 4 mm. Tyto granule jsou s výhodou nerozpustné ve vodě (z těchto důvodů, aby byly odolné k dezintegraci vodou).

Prostředky podle vynálezu se mohou připravit jednoduše smíšením různých složek, s výhodou extruzí nebo lisováním ve studeném nebo teplém stavu, technikou běžně známou pro granulaci nebo peletizaci. Pro přípravu těchto granulí je možno například použít postup podle Evropské patentové přihlášky publikované pod číslem EP 0 575 838 a/nebo jinou extruzní technikou, známou odborníkům v oboru.

Vynález se také týká způsobu ochrany plodin před hmyzími škůdci, zejména kovaříkovitými, která se vyznačuje tím, že se na půdu nebo do půdy (s výhodou do půdy), která má být kultivována, aplikuje účinné množství prostředku ve formě granulí o velikosti mezi 0,2 mm a 2 cm a obsahující aktivní látku, vybranou ze skupiny, zahrnující produkty vzorce I, imidacloprid, acetamiprid, nitenpyram a thiamethoxam.

Vynález se zejména týká způsobu ochrany plodin, jako jsou obiloviny, zejména kukuřice, nebo řepa nebo slunečnice nebo brambory nebo řepka. Aplikace prostředků podle vynálezu se s výhodou provádí před setím těchto plodin nebo současně se setím.

Vynález se také týká způsobu kontroly hmyzu, zejména kovaříkovitých brouků, který se vyznačuje tím, že se účinné množství prostředku podle vynálezu aplikuje na půdu nebo do půdy (s výhodou do půdy), kde se tyto škůdci vyskytují nebo pravděpodobně vyskytují.

Často se používá takové účinné množství nebo taková účinná množství prostředků, která odpovídají dávce sloučeniny obecného vzorce I mezi 1 a 50 g/ha, s výhodou mezi 3 a 40 g/ha.

Specifickou charakteristikou metody pro kontrolu hmyzu podle vynálezu je aplikace prostředku na půdu nebo do půdy v množství, které není smrtelné kontaktně, ale je smrtelné po požití.

Jinými slovy ve specifickém případě kovaříkovitých brouků metoda sestává v hubení kovaříkovitých aplikací dávky, která není letální při kontaktu, ale je letální při polknutí. Hypotézy pro dobrý účinek metody ošetřování podle vynálezu, které umožňuje značně snižovat aplikované dávky sloučenin vzorce I, spočívá na faktu, že brouk uhynulý po konzumaci návnady podle vynálezu slouží jako návnada pro další kovaříky, kteří tak znovu spolknou potravu (mrtvé kovaříky), obsahující insekticid.

Pro účely tohoto textu se slova insekticid a hmyz používají v obvyklém širokém smyslu a ne v jejich striktně vědeckém (zoologickém) smyslu. Podle toho výraz hmyz znamená jakéhokoli velmi malého živočicha, jako jsou členovci (hmyz ve striktním zoologickém smyslu, pavoukovci, stonožky a červi) a hlísti.

Jako půdní hmyz, na který jsou prostředky podle tohoto vynálezu zejména účinné, je možno uvést například:

brouky Coleoptera (kovaříci (*Agriotes* spp.), drátovci, chrousti) jako jsou například:

Agriotes lineatus (kovařík obilní, Elateridae),
Agriotes sordidus (Evropský kovařík, Elateridae),
Agriotes obscurus (kovařík tmavý, Elateridae),
Agriotes sputator (kovařík locikovým, Elateridae),
Athous spp. (Elateridae),
Atomaria linearis maločlenec čárkovitý (Cryptophagidae),
Melolontha spp. (chrousti, Scarabaeidae),
Bothynoderes rýhonosec,
Limoni spp. (US kovaříci),
Melanotus spp. (US kovaříci),
Diabrotica spp. (Chrysomelidae),
Tanymecus pallidus (nosatec řepný, Curculionidae).
motály Lepidoptera (Noctuidae), jako jsou:
můry *Autographa* spp., můry *Mamestra* spp., *Agrotis* spp. (osenice, ponravy), *Euxoa* spp. (osenice, ponravy), *Spodoptera* spp. (*Spodoptera exigua*, *Spodoptera littoralis*),
dvoukřídli (Diptera jako jsou *Tripula* spp.),
Myriapoda (Myriapoda):
- *Diplopoda* = mnohonozky, stonožky.

Z půdních kovaříkovitých brouků, na které je prostředek podle vynálezu zejména účinný, je možno uvést druhy *Agriotes*, *Athous* a *Limonius*.

- 5 Granule podle vynálezu se s výhodou aplikují do půdy do hloubky mezi 1 a 5 cm.

Prostředky podle vynálezu jsou zejména výhodné, protože dovolují použít nižší dávky aktivních látek než obdobné známé prostředky.

- 10 Následující příklady vynález blíže objasňují, nejsou však formulovány tak, aby jej jakýmkoli způsobem omezovaly. V těchto příkladech byla jako sloučenina obecného vzorce I použit fipronil.

15 Příklady provedení vynálezu

Příklad 1

- 20 Plocha 0,1 ha se oseje kukuřicí v množství 8000 neošetřených semen. Plocha se rozdělí na záhony velikosti 40 m².

Ve stejnou dobu jako bylo provedeno setí se do půdy do sacích řádků aplikují 2mm granule, obsahující prostředek složený z

- 25 0,25 % hmotn. fipronilu,
93,5 % hmotn. kukuřičné mouky,
2 % hmotn. celulózy,
4 % hmotn. laktózy,
30 0,2 % hmotn. para-nitrofenolu,
0,05 % hmotn. pigmentové modři 15.3.

- 35 Množství granulí takto rozprostřené se pohybovalo od 2,5 do 10 kg na hektar. Neošetřené plochy sloužily jako kontrola pro potvrzení rozsahu poškození hmyzem. Stejně tak byly plochy ošetřeny komerčním insekticidem s údajným účinkem a nazvány jako referenční. Každá modalita byla opakována čtyřikrát.

Přibližně 20 dnů po zasetí byly spočítány vzešlé kukuřičné rostlinky.

- 40 V lokalitě St Hilaire (30), 22 dnů po zasetí bylo v brázdách čtyřech neošetřených záhonů nalezeno 19 rostlin na 10 m oseté brázdy. V záhonech, ošetřených podle tohoto vynálezu s dávkou 6 g fipronilu na hektar, bylo na 10 m brázdy nalezeno 49 rostlin.

Při dávce fipronilu 12,5 g na hektar bylo v brázdě 10 m nalezeno 48 až 50,5 rostlin.

- 45 Při dávce fipronilu 25 g na hektar bylo v brázdě 10 m nalezeno 45,5 až 51,3 rostlin.

Při dávce fipronilu 50 g na hektar bylo v brázdě 10 m nalezeno 49 rostlin.

- 50 Pro získání stejných výsledků s konvenčními granulemi (nosič jíl), bylo zapotřebí 200 g fipronilu na hektar.

- 55 Půda byla vykopána a seškrabána tak, aby bylo možno zachytit a identifikovat hmyz odpovědný za škody. Na neošetřené kontrole bylo přítomno velké množství larev kovaříkovitých brouků rodu *Agriotes*, zejména *Agriotes sordidus*

Příklad 2

5 Plocha 1 ha byla oseta kukuřicí v množství 98 až 100 neošetřených rostlin. Tato plocha byla rozdělena na záhony 27 m².

Ve stejnou dobu jako při setí se do půdy v secích brázdách vnesou 2mm granule, obsahující prostředek následujícího složení.

- 10 0,25 % hmotn. fipronilu,
93,5 % hmotn. kukuřičné mouky,
2 % hmotn. celulózy,
4 % hmotn. laktózy,
0,2 % hmotn. para-nitrofenolu,
15 0,05 % hmotn. pigmentové modři 15.3.

Množství granulí takto použitých se pohybovalo od 2,5 do 10 kg na hektar. Neošetřené plochy byly udržovány jako kontrola a ověření rozsahu škod, způsobeného hmyzem. Stejně tak byly plochy ošetřeny komerčním insekticidem s údajným účinkem a nazvány jako referenční. Každá
20 modalita byla opakována čtyřikrát.

Přibližně 50 dnů po zasetí byly spočítány vzešlé kukuřičné rostliny.

25 V lokalitě Beaufort (62) bylo 50 dnů po zasetí, v brázdách 4 neošetřených záhonů nalezeno 30 rostlin na 10 m brázdy. Na záhonech, ošetřených podle tohoto vynálezu při dávce 6 g fipronilu na hektar, bylo nalezeno 40 rostlin na 10m brázdu.

Při dávce 12,5 g fipronilu na hektar bylo nalezeno 43 až 46 rostlin na 10m brázdu.

30 Při dávce 25 g fipronilu na hektar bylo nalezeno 44 až 50 rostlin na 10m brázdu.

Při dávce 50 g fipronilu na hektar bylo nalezeno 49,8 rostlin na 10m brázdu.

35 Pro získání stejných výsledků (52 rostlin na 10 m) za použití konvenčních granulí (nosič jíl), bylo zapotřebí 020 g fipronilu na hektar.

Půda byla vykopána a seškrabána tak, aby bylo možno zachytit a identifikovat hmyz odpovědný za škody. Na neošetřené kontrole bylo přítomno velké množství larev kovaříkovitých brouků rodu *Agriotes*, zejména *Agriotes lineatus*.
40

Příklad 3

45 Test účinnosti návnady granulí podle vynálezu na brambory jako plodinu.

Ve stejnou dobu se při sázení aplikují do půdy v sázecích brázdách granule podle vynálezu, skládající se z:

- 50 12,5 g/kg fipronilu (z koncentrátu obsahujícího 500 g/l fipronilu),
945,5 g/kg a) kukuřičné mouky (granule A) nebo b) rýžové mouky (granule B),
40 g/kg laktózy,
2 g/kg para-nitrofenolu.

Účinek na Agriotes (kovaříky), 90 dnů po zasazení obou typů granulí A a B v použitých dávkách 5 a 2,5 g fipronilu na hektar, byl srovnáván se stejným preparátem fipronilem, použitým jako postřik v dávkách 50 a 25 g/ha (od Regent® 800WG) (sloučenina C).

5 Získané výsledky jsou vyjádřeny jako počet otvorů na 10 (N) hlíz brambor.

Produkt	A	A	B	B	C	C	Kontrola*
dávka (g/ha)	2,5	5	2,5	5	25	50	—
N	6	1	7	3	6	1	14

*neošetřená kontrola

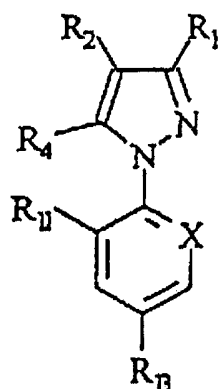
10 Tyto výsledky ukazují dobrou kontrolu na kovaříkovité brouky, získané při použití granulí podle vynálezu a které poskytují stejnou ochranu jako preparát Regent® 800WG, avšak v dávkách snížených o faktor 10.

15

PATENTOVÉ NÁROKY

20 1. Insekticidní prostředek, **v y z n a ě n ý t í m**, že obsahuje

a) 0,001 až 5 % hmotnosti, výhodně 0,05 až 1 % hmotnosti, a výhodněji 0,05 až 0,5 % hmotnosti, sloučeniny obecného vzorce I



(I),

25 ve kterém

R¹ znamená atom halogenu nebo skupinu CN nebo methylovou skupinu nebo skupinu CH₃CO,

R² znamená skupinu S(O)_nR³,

30

R³ znamená alkylovou skupinu, obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů nebo halogenalkylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů,

35

R⁴ znamená atom vodíku nebo atom halogenu nebo skupinu NR⁵R⁶, skupinu S(O)_mR⁷, skupinu C(O)R⁷ nebo skupinu C(O)O—R⁷, alkylovou skupinu, obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů, halogenalkylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů nebo skupinu OR⁸ nebo skupinu N=C(R⁹)(R¹⁰),

- 5 R^5 a R^6 nezávisle jeden na druhém znamenají atom vodíku, alkylovou skupinu, obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů, halogenalkylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, $C(O)$ -alkylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, nebo skupinu $S(O)_rCF_3$, anebo R^5 a R^6 mohou dohromady tvořit dvojbazný alkylenový zbytek, který společně s atomem dusíku, ke kterému jsou R^5 a R^6 vázány, tvoří 5-, 6- nebo 7-členný kruh, který může být přerušen jedním nebo dvěma dvojbaznými heteroatomy, kterými jsou atom kyslíku a atom síry,
- 10 R^7 znamená alkylovou skupinu, obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů nebo halogenalkylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů,
- R^8 znamená alkylovou skupinu, obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů nebo halogenalkylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, nebo atom vodíku,
- 15 R^9 znamená alkylovou skupinu, obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů nebo atom vodíku,
- R^{10} znamená fenylovou skupinu nebo skupinu tvořenou 5-, 6- nebo 7-členným kruhem, obsahujícím 1, 2, 3 nebo 4 heteroatomy, zvolené z množiny, zahrnující dusík, kyslík a síru a případně kondenzovaným s benzenovým jádrem, případně substituovanou jedním nebo více atomy halogenu nebo skupinami, zvolenými z množiny, zahrnující hydroxylovou skupinu, -O-alkylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, -S-alkylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, kyano-skupinu a alkylovou skupinu, obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů,
- 20 X znamená trojbazný atom dusíku nebo skupinu $C-R^{12}$, ve které tři zbývající valence atomu uhlíku jsou součástí aromatického kruhu,
- R^{11} a R^{12} nezávisle jeden na druhém znamenají atom vodíku nebo atom halogenu,
- 30 R^{13} znamená atom halogenu nebo halogenalkylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, halogenalkoxylovou skupinu, ve které alkoxylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, skupinu $S(O)_qCF_3$ nebo skupinu SF_5 ,
- m, n, q, r nezávisle jeden na druhém znamenají celé číslo 0, 1 nebo 2,
- 35 s výhradou spočívající v tom, že když R^1 znamená metylovou skupinu, potom R^3 znamená halogenalkylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, R^4 znamená skupinu NH_2 , R^{11} znamená atom chloru, R^{13} znamená trifluormetylovou skupinu a X znamená atom dusíku,
- 40 b) 0,05 až 10 % hmotnosti, výhodně 0,1 až 5 % hmotnosti alespoň jedné látky zadržující vlhkost, výhodně alespoň jedné látky organického původu zadržující vlhkost, a
- c) 40 až 99 % hmotnosti, výhodně 50 až 98 % hmotnosti, a výhodněji 70 až 97 % hmotnosti,
- 45 rostlinné mouky.
2. Insekticidní prostředek podle nároku 1, **v y z n a ě n ý t í m**, že rostlinnou moukou je mouka získaná mletím zrn obilniny, zvolené z množiny, zahrnující pšenici, ječmen, žito, tritikal, oves, rýži, čirok, sóju a kukuřici.
- 50 3. Insekticidní prostředek podle nároků 1 a 2, **v y z n a ě n ý t í m**, že rostlinnou moukou je kukuřičná mouka.

4. Insekticidní prostředek podle nároků 1 až 3, **v y z n a ě n ý t í m**, že látkou organického původu, zadržující vlhkost, je makromolekulární hydrofilní derivát rostlinného původu, zejména hydrofilní derivát celulózy a samotná celulóza.
- 5 5. Insekticidní prostředek podle nároků 1 až 4, **v y z n a ě n ý t í m**, že dále obsahuje 3 až 30 % hmotnosti, výhodně 4 až 20 % hmotnosti, cukrů.
- 10 6. Insekticidní prostředek podle nároku 5, **v y z n a ě n ý t í m**, že cukry jsou zvoleny z množiny, zahrnující monosacharidy, oligosacharidy a polysacharidy, a jsou jimi zejména sacharóza, laktóza, fruktóza, dextróza, glukóza, melasa nebo med.
- 15 7. Insekticidní prostředek podle nároků 1 až 6, **v y z n a ě n ý t í m**, že dále obsahuje konzervační činidlo, preventivně bránící degradaci složek prostředku a zvolené z množiny, zahrnující benzoát sodný, 1,2-benzizothiazolin-3-on, kyselinu benzoovou, kyselinu para-hydroxybenzoovou a jejich estery a soli s alkalickými kovy a kovy alkalických zemin, zejména sodné soli, 2-fenylfenol a jeho soli s alkalickými kovy nebo kovy alkalických zemin, zejména sodnou sůl a paranitrofenol.
- 20 8. Insekticidní prostředek podle nároků 1 až 7, **v y z n a ě n ý t í m**, že dále obsahuje přísady, zvolené z množiny, zahrnující barviva, atraktanty pro hmyz, repelenty pro ptáky nebo jiná zvířata, která jsou užitečná nebo která by se měla chránit, pojidla, aglomerační činidla, ochucovadla, aglutinační činidla, želatinační činidla, zbobtnující činidla a antiadhezní činidla.
- 25 9. Insekticidní prostředek podle nároků 1 až 8, **v y z n a ě n ý t í m**, že sloučeninou obecného vzorce I je 5-amino-3-kyano-1-[2,6-dichlor-4-(trifluormethyl)fenyl]-4-[(trifluormethyl)sulfinyl]-1H-pyrazol.
- 30 10. Insekticidní prostředek podle nároků 1 až 9, **v y z n a ě n ý t í m**, že je ve formě granulí, které mají výhodně velikost 0,1 mm až 3 cm, výhodněji 0,5 až 4 mm, a jsou výhodně nerozpustné ve vodě.
- 35 11. Způsob kontroly hmyzu, **v y z n a ě n ý t í m**, že se na půdu nebo do půdy, výhodně do půdy určené k obdělání, aplikuje účinné množství prostředku podle nároků 1 až 10 ve formě granulí o velikosti 0,2 mm až 2 cm.
- 40 12. Způsob ochrany plodin, **v y z n a ě n ý t í m**, že se na půdu nebo do půdy, ve které plodiny budou růst nebo rostou, aplikuje účinné množství insekticidního prostředku podle nároku 1.
- 45 13. Způsob podle nároku 12, **v y z n a ě n ý t í m**, že plodinami, jejichž ochrana se provádí, jsou obilniny, zejména kukuřice, nebo řepa nebo slunečnice nebo brambory nebo řepka.
14. Způsob podle nároku 11, **v y z n a ě n ý t í m**, že se použije účinné množství jednoho z insekticidních prostředků podle některého z nároků 1 až 10 pro kontrolu kovařikovitých brouků.
- 50 15. Způsob podle nároků 12 až 14, **v y z n a ě n ý t í m**, že se použije účinné množství insekticidního prostředku podle některého z nároků 1 až 10, odpovídající dávce sloučeniny obecného vzorce I 1 až 50 g/ha, výhodně 3 až 40 g/ha.
16. Způsob kontroly hmyzu, **v y z n a ě n ý t í m**, že se na půdu nebo do půdy aplikuje prostředek podle některého z nároků 1 až 10 v dávce, která není smrtící při styku, ale je smrtící po spolknutí.

Konec dokumentu
