

POLSKA
RZECZPOSPOLITA
LUDOWA



URZĄD
PATENTOWY
PRL

OPIS PATENTOWY

67153

9/28
Kl. 451,9/28

Patent dodatkowy
do patentu _____

Zgłoszono: 20.II.1968 (P 125 361)

Pierwszeństwo: 21.II.1967 Wielka
Brytania

MKP A01n 9/28

Opublikowano: 28.II.1973

UKD

Współtwórcy wynalazku: Peter Stuart Gates; John Gillon

Właściciel patentu: Fisons Pest Control Limited, Harston
(Wielka Brytania)

Środek szkodnikobójczy

1

Przedmiotem wynalazku jest środek szkodnikobójczy w którym składnikiem czynnym są pochodne benzodioksolu.

Stwierdzono, że pochodne benzodioksolu o wzorze ogólnym przedstawionym na rysunku, w którym R^1 i R^2 oznaczają wodór lub rodnik alkilowy na przykład zawierający 1—6 atomów węgla, taki jak metylowy, etylowy lub butylowy lub R^1 i R^2 tworzą wraz z atomem węgla, z którym są połączone, pierścień cykloalkanowy albo cykloalkenowy o 5—7 atomach węgla; R^3 oznacza wodór, rodnik alkilowy na przykład zawierający 1—4 atomów węgla, taki jak metylowy lub etylowy, albo rodnik acylowy na przykład acetylowy, propionylowy lub benzoilowy, R^4 oznacza rodnik alkilowy na przykład zawierający 1—4 atomów węgla, taki jak metylowy lub etylowy, rodnik alkenylowy zawierający na przykład 1—4 atomów węgla, taki jak alilowy, lub rodnik alkinyłowy zawierający na przykład 1—4 atomów węgla, taki jak propargilowy. R^5 , R^6 i R^7 oznaczają wodór, chlorowec na przykład chlor, brom, jod lub fluor albo rodnik alkilowy na przykład zawierający 1—4 atomów węgla, taki jak grupa metylowa lub etylowa, mają właściwości szkodnikobójcze.

Stwierdzono, że wykazują one właściwości insektobójcze. Działają one jako trujący układowe zwłaszcza na muchę domową, gąsienicę i mszyce. Pochodne benzodioksolu mogą być także użyte do

2

walki z pasożytami zwierząt, na przykład przeciwko kleszczom.

Korzystne jest gdy jako substancję czynną stosuje się związek w którym R^1 i R^2 oznaczają wodór albo rodnik alkilowy, lub jeśli wraz z łączącym je węglem tworzą pierścień cykloalkanowy zawierający 5—6 atomów węgla, R^3 oznacza wodór, rodnik alkilowy bądź acylowy, R^4 oznacza rodnik alkilowy, alkenylowy lub alkinyłowy, a R^5 , R^6 i R^7 oznaczają wodór lub rodnik alkilowy.

Szczególnie korzystnymi właściwościami odznaczają się pochodne benzodioksolu, w których R^5 — R^6 — i R^7 oznaczają wodór lub alkil, a R^1 i R^2 oznaczają rodniki metylowe, a zwłaszcza N-metylokarbaminian 2,2-dwumetylo-4-benzodioksol-1,3-ylu. Ponadto, w skład środka według wynalazku wchodzi nośniki, substancje zwilżające, obojętne rozcieńczalniki lub rozpuszczalniki.

Środek według wynalazku znajduje zastosowanie do ochrony upraw, zwierząt, gleby, surowców i obszarów ziemi zaatakowanych przez szkodniki.

Pochodne benzodioksolu są na ogół nierozpuszczalne w wodzie. Można z nich sporządzać formy użytkowe konwencjonalnymi sposobami stosowanymi w stosunku do związków nierozpuszczalnych. I tak na przykład pochodne benzodioksolu mogą być rozpuszczalne w niemieszkających się z wodą rozpuszczalnikach, takich jak wysokowrzące węglowodory, przy czym pożądanym jest, aby zawierały one domieszkę substancji emulgujących, dzie-

ki którym mogą tworzyć przy dodaniu do wody układy samoemulgujące.

Pochodne benzodioksolu można także mieszać z substancjami zwilżającymi i ewentualnie z obojętnymi rozcieńczalnikami, uzyskując proszki rozpuszczalne w wodzie lub proszki do sporządzania zawiesin; można je także mieszać z obojętnymi rozcieńczalnikami, uzyskując preparaty stosowane w postaci stałej, na przykład pylistej.

Jako obojętne rozcieńczalniki stosowane wraz z pochodnymi benzodioksolu, używa się stałe substancje o odpowiednio rozdrobnionej postaci na przykład pylistej, takie jak glina, piasek, mika, nawozy sztuczne i inne.

Jako substancje zwilżające stosuje się substancje anionowo-czynne, takie jak mydła, estry kwasu siarkowego wyższych alkoholi alifatycznych na przykład sól sodowa siarczanu dodecylowego, sól sodowa siarczanu okta decylowego i sól sodowa siarczanu etylowego, alkiloarylosulfoniany na przykład alkilobenzenosulfoniany lub sulfonian butylonaftalenowy i bardziej złożone alifatyczne sulfoniany na przykład produkty kondensacji amidowej kwasu oleinowego i N-metylotauryny albo sulfonian sodowy bursztynianu dwuoktylowego.

Można także stosować substancje zwilżające typu niejonowego, takie jak produkty kondensacji kwasów tłuszczowych, wyższych alkoholi alifatycznych lub alkilofenoli z tlenkiem etylenu, estry i etery alkilowe cukrów lub wielowodorotlenowych alkoholi oraz produkty otrzymywane z tych ostatnich przez kondensację z tlenkiem etylenu, albo produkty blokowej kopolimeryzacji tlenku etylenu i tlenku propylenu.

Do substancji zwilżających typu kationowo-czynnego, które mogą być stosowane do wytwarzania środków według wynalazku, należy bromek cetylotrójmetyloamonioowy i związki podobne.

Środek według wynalazku może mieć również postać aerozolu. W tym przypadku korzystnie stosuje się substancje zwilżające i rozpuszczalniki jako dodatki do nośnika, takiego jak związek z grupy polichlorowcopochodnych alkanów, na przykład dwuchlorodwufuorometan.

Środek według wynalazku może zawierać inne aktywne biologicznie związki o działaniu owado-, bakterio- lub grzybobójczym. Szczególnie korzystne rezultaty uzyskuje się stosując mieszaniny pochodnych benzodioksolu ze środkami owadobójczymi.

Stosowane dawki substancji czynnej środka według wynalazku mogą być różne w zależności od przeznaczenia. I tak na przykład stosując środek do ochrony roślin przed szkodnikami, substancję czynną stosuje się w dawkach 17—1120 g/ha, a korzystnie 35—280 g/ha. Stosując środek według wynalazku do ochrony zwierząt przed kleszczami zwilża się ich skórę, na przykład przez opryskanie roztworem substancji aktywnej o stężeniu 30—300 ppm.

Poniżej podane przykłady ilustrują wynalazek.

Przykład I. Krążki bibuły filtracyjnej o średnicy 9 cm nasyciono wodno-acetonowymi roztworami następujących związków: N-metylokarbaminianu, 2,2-dwumetylo-4-benzodioksol-1,3-ylu, N-

-acetylo-N-metylokarbaminianu 2,2-dwumetylo-4-benzodioksol-1,3-ylu i N-metylokarbaminianu 4-benzodioksol-1,3-ylu. Każdą z badanych substancji czynnych stosowano w ilości 100 mg/0,09 m². Krążki umieszczano w 9 cm szalkach Petriego, do których wprowadzono grupę dorosłych samic muchy domowej (*Musca domestica*) lekko znarkotyzowanych dwutlenkiem węgla i szalki przykrywano szklanymi pokrywkami. Po upływie 24 godzin stwierdzono, że wszystkie muchy w każdej z szalek były martwe.

Przykład II. Krążki liści kapuścianych o średnicy 7 cm zwilżano 1 ml wodno-acetonowych roztworów następujących związków: N-metylokarbaminianu, 2,2-dwumetylo-4-benzodioksol-1,3-ylu; N-acetylo-N-metylo-4-benzodioksol-1,3-ylu; N-metylokarbaminianu 2,2,7-trójmetylo-4-benzodioksol-1,3-ylu; N-allylokarbaminianu 2,2-dwumetylo-4-benzodioksol-1,3-ylu; N-propargilokarbaminianu 2,2-dwumetylo-4-benzodioksol-1,3-ylu; N-acetylo-N-propargilokarbaminianu 2,2-dwumetylo-4-benzodioksol-1,3-ylu; N-metylokarbaminianu 2-metylo-2-4-benzodioksol-1,3-ylu i N-metylokarbaminianu 2,2-czterometyleno-4-benzodioksol-1,3-ylu. Każdy z wymienionych związków stosowano w pięciu stężeniach, odpowiadających dawkom 11,2; 5,6; 1,12; 0,56 i 0,28 kg substancji aktywnej na hektar. Po odparowaniu rozpuszczalnika, każdy z liści umieszczano w szalce Petriego o średnicy 9 cm i wprowadzano 10 larw drugiego stadium bielinka kapustnika (*Pieris brassicae*). Szalki przykrywano szklanymi pokrywkami. Z każdym z wymienionych związków i przy każdym z podanych stężeń doświadczenie przeprowadzano trzykrotnie. Po upływie 48 godzin stwierdzono, że wszystkie larwy były martwe.

Przykład III. Wodną zawiesiną zawierającą 100 ppm N-metylokarbaminianu 2,2-dwumetylo-4-benzodioksol-1,3-ylu albo N-acetylo-N-metylokarbaminianu 2,2-dwumetylo-4-benzodioksol-1,3-ylu spryskiwano pole młodego bobu (*Vicia faba*), na którym żerowały dorosłe osobniki bezskrzydłej mszyce wykowej (*Megoura viciae*), stosując dawkę odpowiadającą 585 l na hektar. Po dokonaniu zabiegu rośliny przykrywano szklanym kloszem zaopatrzonym u góry w siatkę wentylacyjną. Po upływie 24 godzin stwierdzono, że wszystkie mszyce są martwe, podczas gdy w próbkach kontrolnych bez użycia substancji aktywnej, wszystkie mszyce pozostały żywe.

Przykład IV. Proszek do zawiesin sporządza się przez drobne zmielenie (mikronizację) następujących składników: N-metylokarbaminianu, 2,2-dwumetylo-4-benzodioksol-1,3-ylu w ilości 25% wagowych, preparatu Hoe SI/263 to jest soli sodowej sulfonowanego produktu kondensacji wyższego alkoholu alifatycznego z tlenkiem etylenu w ilości 3% wagowych oraz kaolinu w ilości 72% wagowych.

Tak sporządzony środek tworzy zawiesinę w wodzie i nadaje się do opryskiwania roślin w celu zwalczania szkodników.

Przykład V. Środek w postaci granulek o zawartości 5% substancji aktywnej, sporządza się w następujący sposób: miesza się w ciągu 20 minut

sproszkowaną kredę z dodatkiem 2% Carbowaxu (polimer glikolu etylenowego o średnim ciężarze cząsteczkowym 380—420) dodaje 5% drobno zmiełonego N-metylokarbaminianu 2,2-dwumetylo-4-benzodioksol-1,3-ylu i miesza przez następne 15 minut, po czym dodaje się 25% preparatu Calflo E (środek zawierający krzemian wapniowy) i dalej miesza w ciągu 75 minut, tak aby nie dopuścić do zlepiania się granulek. Całość przesiewa się przez sito o prześwicie około 1,6 mm.

Przykład VI. Tampony o kształcie cylindrycznym o średnicy około 1 cm długości 2 cm wykonane z waty zwilżono 0,5 ml acetonowych roztworów następujących związków: N-metylokarbaminianu 2,2-dwumetylo-4-benzodioksol-1,3-ylu; N-metylokarbaminianu 2-metylo-4-benzodioksol-1,3-ylu; N-metylokarbaminianu 2,2,7-trójmetylo-4-benzodioksol-1,3-ylu; N-metylokarbaminianu 2,2,6-trójmetylo-4-benzodioksol-1,3-ylu; N-metylokarbaminianu 2-metylo-2-etylo-4-benzodioksol-1,3-ylu; N-metylokarbaminianu 2,2-dwuetylo-4-benzodioksol-1,3-ylu; N-metylokarbaminianu 2-metylo-2-III rzęd. butylo-4-benzodioksol-1,3-ylu.

Próbki pozostawiono na 12 godzin w celu odprowadzenia rozpuszczalnika, a następnie zwilżono 1 ml

surowicy krwi owczej i wprowadzono 20 larw pierwszego stadium owczej muchy plujki (*Lucilia sericata*). Po upływie 24 godzin stwierdzono, że wszystkie osobniki były martwe; w próbkach kontrolnych, w których nie stosowano wymienionych wyżej związków były one żywe.

Zastrzeżenie patentowe

Środek szkodnikobójczy, **znamienny tym**, że jako substancję czynną zawiera pochodną benzodioksolu o ogólnym wzorze 1 w którym R^1 i R^2 oznaczają wodór lub rodnik alkilowy lub R^1 i R^2 tworzą razem z łączącym je atomem węgla pierścień cykloalkanowy lub cykloalkenowy o 5—7 atomach węgla, R^3 oznacza wodór, rodnik alkilowy lub rodnik acylowy, R^4 oznacza rodnik alkilowy, alkenylowy lub alkinyłowy, a R^5 , R^6 i R^7 oznaczają wodór, chlorowec lub rodnik alkilowy oraz ewentualnie co najmniej jeden ze znanych dodatków takich jak nośnik, substancja zwilżająca, obojętny rozcieńczalnik lub rozpuszczalnik jak również co najmniej jedną znaną substancję o działaniu owado-, bakterio- lub grzybobójczym.

