



Государственный комитет  
СССР  
по делам изобретений  
и открытий

# О П И С А Н И Е ИЗОБРЕТЕНИЯ

К ПАТЕНТУ

(11) 841570

(61) Дополнительный к патенту —

(22) Заявлено 12.09.77 (21) 2527301/05

(23) Приоритет — (32) 17.09.76

(31) 11815/76 (33) Швейцария

(51) М. Кл.<sup>3</sup>

A 01 N 43/78  
C 07 D 277/42

Опубликовано 230681. Бюллетень № 23

Дата опубликования описания 25.06.81

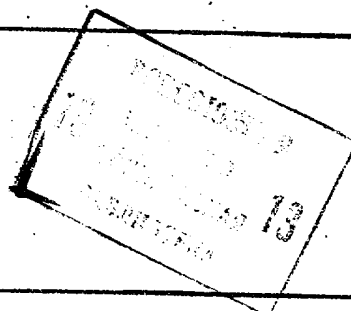
(53) УДК 632.951.  
.2 (088.8)

(72) Автор  
изобретения

Иностранец  
Дитер Дюрр  
(Швейцария)

(71) Заявитель

Иностранная фирма  
"Циба-Гейги АГ"  
(Швейцария)



(54) ИНСЕКТИЦИДНОЕ СРЕДСТВО

Изобретение относится к химическим средствам борьбы с насекомыми, а именно к инсектицидному средству на основе производных N-метилкарбамоилоксифенола.

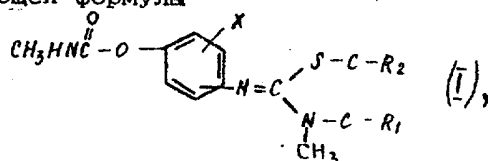
Известно средство для борьбы с вредителями, содержащее в качестве действующего начала 3,4-диметил-2-(п-хлорфенил)иминотиазол-(1,3) [1].

Известно также инсектицидное средство, содержащее 1-(N-метилкарбамоилокси)-2-(N,N-диметиламино)фенил и обычные добавки [2].

Однако оно недостаточно эффективно.

Цель изобретения — изыскание нового инсектицидного средства на основе производных N-метилкарбамоилоксифенола, обладающего усиленным инсектицидным действием.

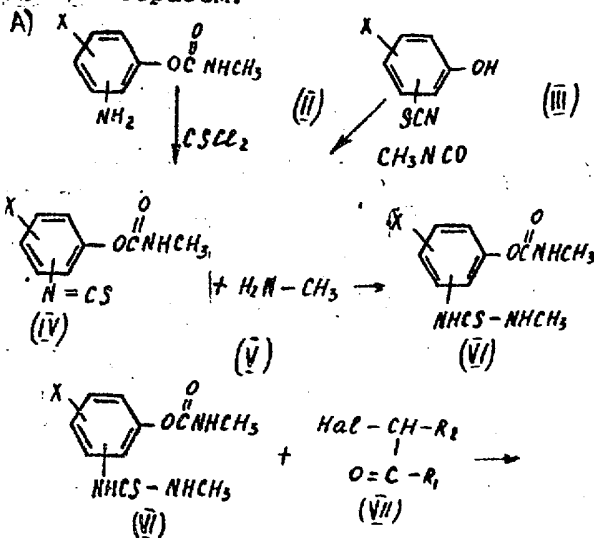
Поставленная цель достигается использованием в качестве производного N-метилкарбамоилоксифенола соединения общей формулы

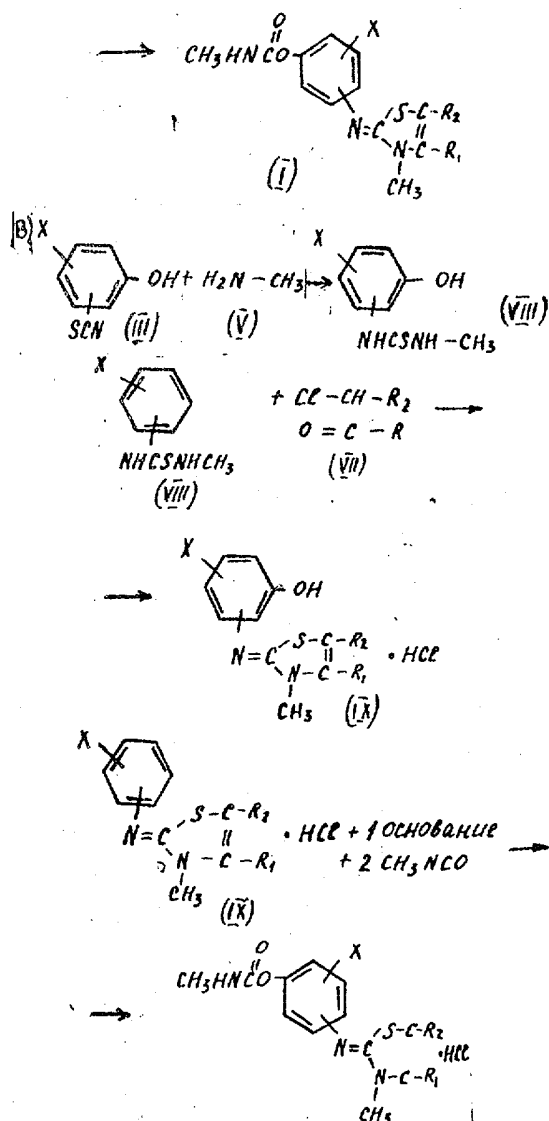


где R<sub>1</sub> и R<sub>2</sub> — водород или метил, X — водород или метил или его хлористоводородную соль, в количестве 0,1–95 вес. %.

Формы применения препаратов обычные.

Соединения формулы 1 можно получать известными способами, например следующим образом:





В формулах II-VIII  $R_1$ ,  $R_2$ , и X имеют указанное для формулы I значение и Hal означает атом галогена, в особенности хлор или бром.

В качестве оснований принимают во внимание в особенности третичные амины, как триалкиламины, и пиридин; далее, гидроокиси, окиси, карбонаты и бикарбонаты щелочных и щелочноземельных металлов. Способы А и В осуществляются при температуре реакции 20-120°C, предпочтительно при 20-80°C, при нормальном давлении с использованием растворителей и разбавителей.

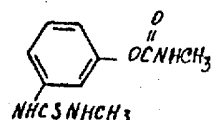
В качестве растворителей или разбавителей пригодны, например простые эфиры и эфироподобные соединения, как диэтиловый эфир, дипропиловый эфир, диоксан, диметоксиэтан, тетрагидрофуран; амиды, как N,N-диалкилированные амиды карбоновых кислот; алифатические, ароматические, а также галогенированные углеводороды, в особенности бензол, толуол, ксилолы, хлороформ, хлорбензол; нитрилы, как ацетонитрил, диметилсульфоксид, кетоны, как ацетон, метилэтилкетон, вода.

### Пример.

А) Получение 2-[3-N-метил-карбамоилоксифенилимино-3,4-диметил-тиазоли-на.

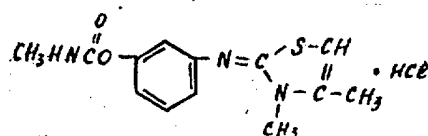
а) 66,5 г м-нитрофенола в 100 мл метилэтилкетона выдерживают в течение 24 ч при комнатной температуре с 0,5 мл триэтиламина и 30 г метилизотиоцианата. После выпаривания в вакууме и перемешивания остатка с гексаном, осадок отсасывают на нутче и высушивают. Получают 3-нитро-N-метилфенилкарбамат с т.пл. 128-130°C.

б) 79 г 3-нитро-N-метилфенилкарбамата в 900 мл диоксана гидрируют в присутствии 4 г платины — на угле. По окончании поглощения водорода катализатор отфильтровывают и фильтрат выпаривают. Остаток, состоящий из 3-амино-N-метилфенилкарбамата, смешивают с 30 г метилизотиоцианата и небольшим количеством диоксана и выдерживают при комнатной температуре в течение 6 ч. Образовавшийся 3-[N'-метилтиоуреидо]-метилфенилкарбамат осаждают гексаном, отсасывают на нутче и высушивают. Получают после перекристаллизации из ацетонитрила соединения формулы

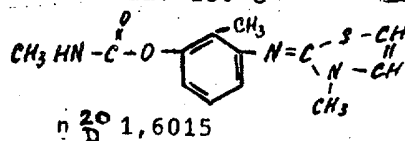
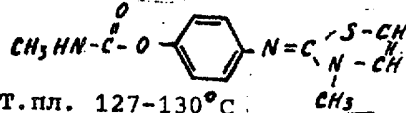
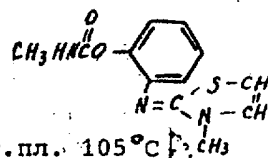


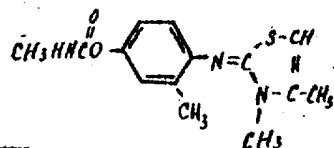
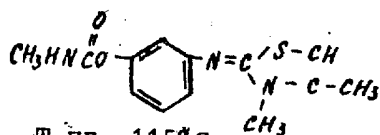
с т.пл. 145-146°C.

в) 22 г этого соединения в 100 мл метилэтилкетона кипятят с обратным холодильником в течение 15 мин с 9,5 г хлорацетона. После охлаждения и добавки эфира продукт выпадает в осадок, который собирают, промывают эфиром и высушивают. Получают соединения формулы

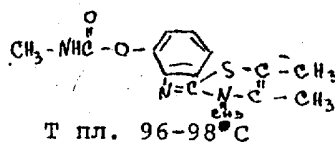


с точкой разложения 210°C. Свободное основание имеет т.пл. 121-122°C. Аналогичным образом также получают следующие соединения





Применяя способ В) получают соединения



#### Пример А.

А) Инсектицидное действие как кишечного яда.

Хлопковые растения опрыскивают 0,05%-ной водной эмульсией биологически активного вещества (полученной из 10%-ного эмульгируемого концентрата-

та). После высыхания налета хлопковые растения заражают личинками в стадии 2g, *Spodoptera littoralis* и *Heliothis virescens*. Опыт проводят при 24°C и 60%-ной относительной влажности воздуха. Результаты испытаний представлены в таблице.

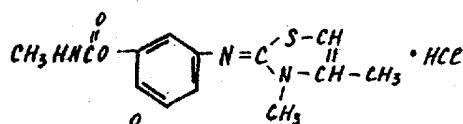
В) Системно-инсектицидное действие.

Для установления системного действия укорененные бобовые растения (*Vicia faba*), помещают в 0,01%-ный водный раствор биологически активного вещества (полученный из 10%-ного эмульгируемого концентрата). Спустя 24 ч на надземные части растений помещают тлей (*Aphis fabae*). Специальным устройством насекомых защищают от воздействия газа и контакта. Опыт проводят при 24°C и относительной влажности воздуха 70%.

Результаты испытаний представлены в таблице.

Таким образом, предложенное инсектицидное средство обладает усиленным действием.

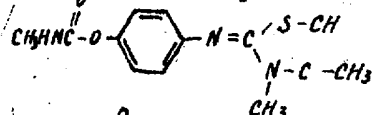
| Соединения     | Минимальная концентрация в ppm для 100%-ного умерщвления |                                    |                            |
|----------------|----------------------------------------------------------|------------------------------------|----------------------------|
|                | <i>Spodoptera littoralis</i> личинки                     | <i>Heliothis virescens</i> личинки | <i>Aphis fabae</i> личинки |
| Предлагаемые 1 | 2                                                        | 3                                  | 4                          |



> 200

> 200

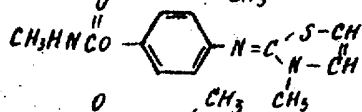
100



> 200

> 200

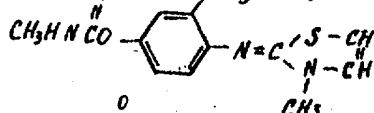
100



> 200

> 200

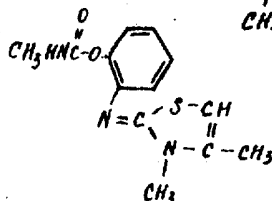
200



> 200

> 200

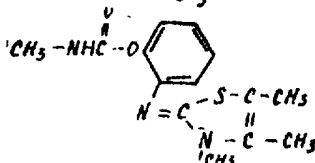
200



200

> 200

200

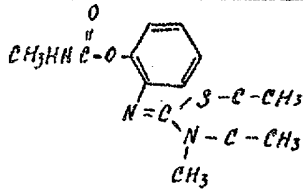
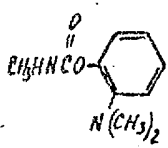


> 200

> 200

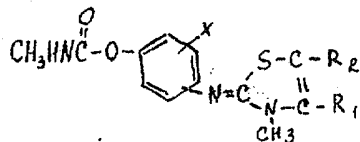
200

## Продолжение таблицы

| Соединения                                                                                                                                                             |   | Минимальная концентрация в ppm для 100%-ного умерщвления |                             |                     |
|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---|----------------------------------------------------------|-----------------------------|---------------------|
|                                                                                                                                                                        |   | Spodoptera littoralis личинки                            | Heliothis verescens личинки | Aphis fabae личинки |
| Предлагаемые                                                                                                                                                           | 1 | 2                                                        | 3                           | 4                   |
| <br> |   | 100                                                      | > 200                       | 200                 |
|                                                                                                                                                                        |   | -                                                        | -                           | > 800               |

## Формула изобретения

Инсектицидное средство, содержащее действующее начало на основе производных N-метилкарбамоилоксифенола и добавку, выбранную из группы носитель, разбавитель, наполнитель, отличающееся тем, что, с целью усиления инсектицидного действия, оно содержит в качестве производного N-метилкарбамоилоксифенола соединение общей формулы



где  $R_1$  и  $R_2$  — водород или метил,  $x$  — водород или метил, или его хлористоводородную соль, в количестве 0,1-95 вес. %.

Источники информации, принятые во внимание при экспертизе

1. Патент Швейцарии № 439858, кл. 45 § 9/12, опублик. 22.12.67.

2. Патент ФРГ № 1131050, кл. 45 § 9/20, опублик. 03.01.63 (прототип).

Редактор Н. Кончицкая      Составитель Н. Кибалова  
Техред Н. Ковалева      Корректор О. Билак

Заказ 4870/84

Тираж 700      Подписное  
ВНИИПИ Государственного комитета СССР

по делам изобретений и открытий  
113035, Москва, Ж-35, Раушская наб., д. 4/5

Филиал ИПИ "Патент", г. Ужгород, ул. Проектная, 4