

(19)



Евразийское
патентное
ведомство

(11) 026483

(13) B1

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОМУ ПАТЕНТУ

(45) Дата публикации и выдачи патента
2017.04.28

(21) Номер заявки
201491882

(22) Дата подачи заявки
2013.04.12

(51) Int. Cl. A01N 43/40 (2006.01)
A01P 7/04 (2006.01)

(54) N-ЗАМЕЩЕННЫЕ (6-ГАЛОГЕНАЛКИЛПИРИДИН-3-ИЛ)АЛКИЛСУЛЬФОКСИМИНЫ
КАК СРЕДСТВО ДЛЯ ОБРАБОТКИ СЕМЯН С ЦЕЛЬЮ КОНТРОЛЯ НАСЕКОМЫХ
ОТРЯДА COLEOPTERAN

(31) 61/635,082

(32) 2012.04.18

(33) US

(43) 2015.03.31

(86) PCT/US2013/036409

(87) WO 2013/158499 2013.10.24

(71)(73) Заявитель и патентовладелец:
ДАУ АГРОСАЙЕНСИЗ ЭлЭлСи (US)

(72) Изобретатель:
Хендрикс Уилльям Х. III (US),
Тернбулл Гари (CA)

(74) Представитель:
Медведев В.Н. (RU)

(56) WO-A1-2011135831
WO-A1-2010074751
WO-A1-2010040623
US-A1-20070203191

(57) В изобретении представлены способы применения N-замещенных (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксиминов, таких как сульфоксафлор, в качестве средства для обработки семян с целью контроля насекомых отряда Coleopteran, таких как земляные блошки.

026483

B1

026483

B1

Притязание на приоритет

Заявка утверждает приоритет предварительной патентной заявки США с серийным № 61/635082, опубликованной 18 апреля 2012 г.

Область изобретения

Варианты настоящего раскрытия касаются способов применения N-замещенных (6-галоген-алкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксиминов как средства для обработки семян с целью контроля насекомых отряда Coleoptera.

Предпосылки

Существует более десяти тысяч видов насекомых, которые являются причиной потерь в сельском хозяйстве. Эти сельскохозяйственные потери ежегодно составляют миллиарды долларов США. Земляные блошки являются постоянным и серьезным вредителем, который питается многими коммерческими культурами, в том числе канолой (*Brassica napus*). Необходимо бороться с земляными блошками, чтобы уменьшить дорогостоящие коммерческие потери урожая, что не только существенно влияет на экономику, но также может лишать людей необходимой пищи. В настоящее время более 90% имеющегося на рынке канадского рапса обрабатывают средством для обработки семян с целью контроля земляных блошек. Такую обработку семян преимущественно проводят, применяя неоникотиноидные инсектициды, такие как 3-[(2-хлор-1,3-тиазол-5-ил)метил]-5-метил-N-нитро-1,3,5-оксадиазинан-4-имин, обычно обозначаемый как "тиаметоксам".

К сожалению, насекомые могут быстро вырабатывать устойчивость к инсектицидам, в том числе к инсектицидам, применяемым в настоящее время для обработки семян с целью контроля земляных блошек. Сотни видов насекомых являются устойчивыми к одному или большему количеству инсектицидов. Развитие устойчивости к некоторым давно используемым инсектицидам (например, DDT, карбаматам, органофосфатам) хорошо известно. Однако вырабатывается устойчивость также к некоторым более новым пестицидам.

Чтобы снизить развитие устойчивости, требуются контрагенты для ротации инсектицидов и/или альтернативные инсектициды. Поэтому было бы желательно иметь возможность использовать другие инсектициды в качестве средств для обработки семян с целью уничтожения насекомых, таких как земляные блошки. Также было бы желательно, чтобы применение таких инсектицидов в качестве средств для обработки семян способствовало относительному повышению инсектицидной эффективности по сравнению с инсектицидами, традиционно используемыми для обработки семян с целью контроля земляных блошек.

Краткое описание чертежей

На фиг. 1 представлена гистограмма, иллюстрирующая ущерб в результате поедания земляными блошками через пять дней после появления всходов канолы из семян, обработанных различными инсектицидами;

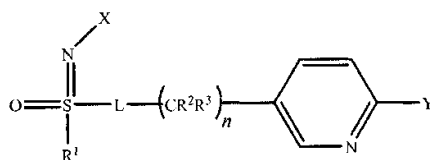
на фиг. 2 представлена гистограмма, иллюстрирующая ущерб в результате поедания земляными блошками через двадцать семь дней после появления всходов канолы из семян, обработанных различными инсектицидами;

на фиг. 3 представлена гистограмма, иллюстрирующая мощность растений канолы через тридцать дней после появления всходов канолы из семян, обработанных различными инсектицидами;

на фиг. 4 представлена гистограмма, иллюстрирующая урожай растений канолы через 107 дней после появления всходов канолы из семян, обработанных различными инсектицидами.

Раскрытие

Согласно одному варианту, описанному здесь выше, способ контроля насекомых включает контактирование по меньшей мере одного семени с инсектицидом для защиты растения, вырастающего по меньшей мере из одного семени, против повреждения насекомыми отряда Coleoptera, где инсектицид представляет собой N-замещенный (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксимин, имеющий следующую химическую структуру:



где X представляет собой диоксид азота (NO_2), цианид (CN) или COOR^4 ;

L представляет собой одинарную связь, или R^1 , S и L, взятые вместе, составляют 4-, 5- или 6-членный цикл;

R^1 представляет собой $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ алкил;

R^2 и R^3 независимо представляют собой атом водорода (H), метил, этил, атом фтора, хлора или брома;

n равно целому числу от 0 до 3;

Y представляет собой $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ галогеналкил;

R^4 представляет собой (C_1-C_4) алкил.

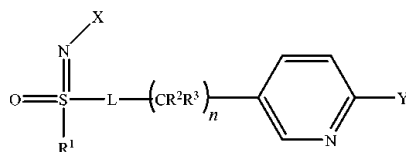
В дополнительных вариантах способ контроля насекомых включает применение сульфосафлора по меньшей мере на одном семени с целью контроля по меньшей мере одного вида земляных блошек.

В других дополнительных вариантах способ обработки семян включает контакт по меньшей мере одного семени с инсектицидно эффективным количеством сульфосафлора, по существу, с целью защиты по меньшей мере одного семени и других развивающихся из него частей растения от поражения, наносимого насекомыми отряда Coleoptera.

Способ(ы) осуществления изобретения

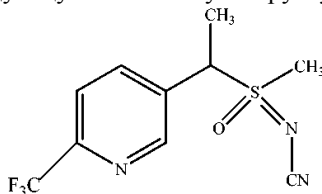
Раскрыты способы применения по меньшей мере одного N-замещенного (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксимины как средства для протравливания семян для борьбы с насекомыми отряда Coleoptera. Используемое здесь выражение "по меньшей мере одно семя" обозначает одно семя или множество семян; для простоты обсуждения везде в данной заявке, использование термина "семя(семена)" относится по меньшей мере к одному семени. Также используемое здесь выражение "по меньшей мере один N-замещенный (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксимин(ы)" относится по меньшей мере к одному N-замещенному (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксимины. Используемое здесь выражение "обработка семян" означает и включает контакт семени(семян) с инсектицидно эффективным количеством N-замещенного (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксимины(ов). Используемое здесь выражение "инсектицидно эффективное количество" означает и включает количество активного материала, которое оказывает неблагоприятное действие на насекомое, и включает отклонения от естественного развития, уничтожение, регулирование и подобное. Применение N-замещенного (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксимины(ов) как средства для обработки семян может, по существу, защищать семя(семена) от одного или большего количества видов насекомых отряда Coleoptera (например, от ущерба, наносимого в результате поедания одним или большим количеством видов насекомых) и также может защищать другие части растения (например, корни, листья проростка), развивающиеся из семени(семян). Например, N-замещенный (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксимин(ы) при развитии растения может перемещаться от семени(семян) (например, N-замещенный (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксимин(ы) может распространяться от семени(семян) по меньшей мере до одного из корней и/или листьев развивающегося ростка).

N-Замещенный (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксимин(ы) имеет следующую химическую структуру:



где X обозначает диоксид азота (NO_2), цианид (CN) или $COOR^4$; L обозначает одинарную связь, или R^1 , S и L, взятые вместе, представляют 4-, 5- или 6-членный цикл; R^1 обозначает (C_1-C_4) алкил; R^2 и R^3 независимо обозначают атом водорода (H), метил, этил, атом фтора, хлора или брома; N равно целому числу от 0 до 3; Y обозначает (C_1-C_4) галогеналкил и R^4 обозначает (C_1-C_4) алкил.

Подходящие N-замещенные (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксимины описаны в патенте США № 7687634. В качестве неограничительного примера: по меньшей мере, в некоторых вариантах N-замещенный (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксимин(ы) может представлять собой N-[6-дифторметилпирид-3-ил]этил(метил)оксидо-λ4-сульфанилиденцианамид, обычно обозначаемый как "сульфосафлор", который имеет следующую химическую структуру:



Применяя N-замещенный (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксимин(ы) в качестве средства для обработки семян, можно контролировать разнообразных насекомых отряда Coleoptera (жуки). Например, способ по настоящему раскрытию может содействовать инсектицидной активности относительно насекомых семейства Chrysomelidae (семейство жуков-листоедов), таких как земляные блошки по меньшей мере одного из следующих родов: Altica, Anthobiodes, Aphthona, Aphthonaltica, Aphthonoides, Apteopoda, Argopistes, Argopus, Arrhenocoela, Batophila, Blepharida, Chaetocnema, Clitea, Crepidodera, Derocrepis, Dibolia, Disonycha, Epitrix, Hermipyxis, Hermaeophaga, Hespera, Hippuriphila, Horaia, Hyphaxis, Lipromima, Liprus, Longitarsus, Luperomorpha, Lythraia, Manobia, Mantura, Meishania, Minota, Mniophila, Neicrepidodera, Nonarthra, Novofoudrasia, Ochrosis, Oedionychis, Oglobinia, Omeisphaera, Ophrida, Orestia, Paragopus, Pentamesa, Philopona, Phygasia, Phyllotreta, Podagrica, Podagricomela, Podontia, Pseudodera, Psylliodes, Sangariola, Sinaltica, Sphaeroderma, Systema, Trachyaphthona, Xuthea и Zipangia. В одном или не-

скольких вариантах способ по настоящему изобретению можно применять для борьбы по меньшей мере с одним видом насекомых, выбранных из следующих: *Phyllotreta armoraciae* (блошка земляная хреновая), *Phyllotreta cruciferae* (блошка земляная рапсовая), *Phyllotreta pusilla* (жук-блошка крошечная), *Phyllotreta nemorum* (блошка земляная светлоногая), *Phyllotreta robusta* (блошка земляная садовая), *Phyllotreta striolata* (жук-блошка полосатая), *Phyllotreta undulata*, *Psylliodes chrysocephala* и *Psylliodes punctulata* (блошка конопляная). В дополнительных вариантах, способ по настоящему раскрытию можно применять с целью контроля по меньшей мере одного вида насекомых из следующих: *Altica ambiens* (жук-блошка ольховая двухполосная), *Altica canadensis* (жук-блоха земляная), *Altica chalybaea* (жук-блошка виноградная), *Altica prasina* (жук-блошка тополиная), *Altica rosae* (тля розанная), *Altica Sylvia* (блошка черничная), *Altica ulmi* (жук-блошка вяза), *Chaetocnema pulicaria* (блошка стеблевая хлебная), *Chaetocnema conofinis* (жук-блошка бататная), *Epitrix cucumeris* (жук-блошка картофельная), *Systema blanda* (слоник гороховый полосатый) и *Systema frontalis* (блошка земляная красноголовая).

В других дополнительных вариантах способ по настоящему изобретению можно применять с целью контроля других насекомых отряда Coleoptera, в том числе, но не ограничиваясь этим, следующих: *Acanthoscelides* spp. (долгоносики), *Acanthoscelides obtectus* (зерновка фасоловая обыкновенная), *Agrius planipennis* (изумрудная ясеневая златка), *Agriotes* spp. (проволочники), *Anoplophora glabripennis* (азиатский жук-дровосек), *Anthonomus* spp. (долгоносики), *Anthonomus grandis* (долгоносик хлопковый), *Aphidius* spp., *Apion* spp. (долгоносики), *Arogonia* spp. (червовидные личинки), *Ataenius spretulus* (черный травяной навозник), *Atomaria linearis* (свекловичная крошка), *Aulacophore* spp., *Bothynoderes punctiventris* (долгоносик свекловичный), *Bruchus* spp. (долгоносики), *Bruchus pisorum* (зерновка гороховая), *Cacoesia* spp., *Callosobruchus maculatus* (четырепятнистая зерновка), *Carpophilus hemipteras* (блестянка полужесткокрылая), *Cassida vittata*, *Cerosterna* spp., *Cerotoma* spp. (листоеды), *Cerotoma trifurcata* (жук-листоед), *Ceutorhynchus* spp. (долгоносики), *Ceutorhynchus assimilis* (скрытнохоботник рапсовый семенной), *Ceutorhynchus napi* (скрытнохоботник репный), *Chaetocnema* spp. (листоеды), *Colaspis* spp. (земляные жуки), *Conoderus scalaris*, *Conoderus stigmatus*, *Conotrachelus nenuphar* (долгоносик сливовый), *Cotinus nitidis* (хрущ блестящий зеленый), *Crioceris asparagi* (трещалка спаржевая), *Cryptolestes ferrugineus* (мукоед ржаво-красный), *Cryptolestes pusillus* (мукоед крошечный), *Cryptolestes turcicus* (тунецкий мукоед), *Steniscera* spp. (проволочники), *Curculio* spp. (долгоносики), *Cyclocephala* spp. (червовидные личинки), *Cylindrocryptus adspersus* (стеблевой долгоносик подсолнечника), *Deporaus marginatus* (долгоносик-листорез манговый), *Dermestes lardarius* (кожеед ветчинный), *Dermestes maculatus* (кожеед пятнистый), *Diabrotica* spp. (листоеды), *Epilachna varivestis* (мексиканский бобовый жук), *Faustinus cubae*, *Hylobius pales* (долгоносик сосновый), *Hypera* spp. (долгоносики), *Hypera postica* (долгоносик люцерновый), *Hyperodes* spp. (долгоносик *Hyperodes*), *Hypothenemus hampei* (жук кофейный), *Ips* spp. (заболонники), *Lasioderma serricorne* (жук табачный), *Leptinotarsa decemlineata* (колорадский картофельный жук), *Liogenys fuscus*, *Liogenys suturalis*, *Lissorhoptrus oryzophilus* (долгоносик рисовый водяной), *Lyctus* spp. (жук-древогрыз/древогрыз бороздчатый), *Maecolaspis jolivetii*, *Megascelis* spp., *Melanotus communis*, *Meligethes* spp., *Meligethes aeneus* (цветоед рапсовый), *Melolontha melolontha* (обычный европейский майский жук), *Oberia brevis*, *Oberia linearis*, *Oryctes rhinoceros* (пальмовый жук-носорог), *Oryzaephilus mercator* (плоскотелка арахисовая), *Oryzaephilus surinamensis* (суринамский мукоед), *Otiorynchus* spp. (долгоносики), *Oulema melanopus* (пьявица красногрудая), *Oulema oryzae*, *Pantomorus* spp. (долгоносики), *Phyllophaga* spp. (майский/июньский жук), *Phyllophaga cuyabana* (листоеды), *Phynchites* spp., *Popillia japonica* (хрущик японский), *Prostephanus truncatus* (точильщик зерновой большой), *Rhizopertha dominica* (точильщик зерновой малый), *Rhizotrogus* spp. (European chafer), *Rhynchophorus* spp. (долгоносики), *Scolytus* spp. (древесные жуки), *Shenophorus* spp. (долгоносик Billbug), *Sitona lineatus* (слоник гороховый полосатый), *Sitophilus* spp. (зерновые долгоносики), *Sitophilus granaries* (долгоносик амбарный), *Sitophilus oryzae* (долгоносик рисовый), *Stegobium paniceum* (точильщик хлебный), *Tribolium* spp. (мучные жуки), *Tribolium castaneum* (хрущак каштановый), *Tribolium confusum* (хрущак малый мучной), *Trogoderma variabile* (капровой жук) и *Zabrus tenebrioides*.

Семя(семена) может представлять собой любой тип семян. Например, семя(семена) может представлять собой семя, продуцируемое высшим растением, таким как двудольное растение или однодольное растение. По меньшей мере, в некоторых вариантах семя(семена) может быть продуктом потребляемого растения, такого как коммерческий хлебный злак. В качестве неограничительного примера, семя(семена) может быть продуктом растения семейства Brassicaceae (семейство крестоцветных), такого как растение из рода Brassica, в том числе, например, одно из следующих: *B. napus* (семена рапса, в том числе культурные сорта, например канола и брюква), *B. juncea* (горчица индийская), *B. carinata* (горчица абиссинская), *B. rapa* (турнепс), *B. oleracea* (капуста дикая, в том числе культурные сорта, например брокколи, кочанная капуста, брокколи, цветная капуста, брюссельская капуста и др.), *B. rupestris* (горчица сарептская), *B. septiceps* (турнепс seventop), *B. nigra* (горчица черная), *B. narinosa* (капуста ноздреватая), *B. perviridis* (горчичный шпинат), *B. tournefortii* (горчица азиатская) и *B. fruticulosa* (средиземноморская кочанная капуста). В дополнительных вариантах семя(семена) может представлять собой продукт различных растений, в том числе, но не ограничиваясь этим, один из следующих: *Glycine max* (соевые бобы), *Linum usitatissimum* (льняное семя/лен), *Zea mays* (маис), *Carthamus tinctorius* (сафлор), *Helianthus*

annuus (подсолнечник), *Nicotiana tabacum* (табак), *Arabidopsis thaliana*, *Betholettia excelsa* (бразильский орех), *Ricinus communis* (клещевина обыкновенная), *Cocos nucifera* (кокосовый орех), *Coriandrum sativum* (кориандр), *Gossypium* spp. (хлопчатник), *Arachis hypogaea* (арахис), *Simmondsia chinensis* (жожоба), *Elaeis gdieneis* (масличная пальма), *Olea europaea* (олива), *Oryza sativa* (рис), *Cucurbita maxima* (тыква крупноплодная), *Hordeum vulgare* (ячмень), *Triticum aestivum* (пшеница) и *Lemnaceae* spp. (мокрица). Семя(семена) может быть продуктом любого генотипа и культурного сорта растения, выбор которого осуществляет практикующий специалист по своему усмотрению. По меньшей мере, в некоторых вариантах семя(семена) является продуктом растения канولا (т.е. по меньшей мере одно семя представляет собой по меньшей мере одно семя канолы).

N-Замещенный (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксимины можно наносить на семя(семена) любым из разнообразных общепринятых способов (например, разбрызгиванием, нанесением покрытия, распылением и пропитыванием). Сульфоксимин может оставаться, главным образом, на поверхности семени при обработке семян в течение их хранения. Затем семя высевает и оно начинает прорастать в почве, сульфоксимины могут абсорбироваться корнями растения, пронизывать и перемещаться к надземным тканям растения. Подходящие способы нанесения включают, например, способы, перечисленные в работе P. Rosters и др., "Seed Treatment: Progress and Prospects", 1994 BCPC Monograph № 57. Инсектицидно эффективное количество по меньшей мере одного N-замещенного (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксимины можно наносить на семя(семена) в любое время от сбора семени(семян) соответствующего растения до посева семени(семян). N-Замещенный (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксимины можно наносить на семя(семена) до посева семени(семян), во время посева семени(семян), или комбинируя эти способы. Если N-замещенный (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксимины наносят до посева семени(семян), то обработка семян может происходить в любое время в период между моментом, по существу, непосредственно перед посевом и примерно за 12 месяцев до посева. Можно многократно наносить N-замещенный (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксимины на семя(семена).

N-Замещенный (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксимины можно наносить (например, напылять) на семя(семена) без дополнительной обработки или можно наносить на семя(семена) препарат, содержащий N-замещенный (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксимины и по меньшей мере один инертный носитель. Применение препарата для обработки семени(ян) может, например, улучшать одну или более из следующих характеристик: применение, обработку, хранение и максимальную пестицидную активность. Если в препарате используют инертный носитель, то по меньшей мере один инертный носитель может представлять собой твердый носитель (например, тальк, пирофиллитовую глину, диоксид кремния, аттапульгитовую глину, каолиновую глину, кизельгур, мел, диатомовую землю, известь, карбонат кальция, бентонитовую глину, землю Фуллера, шелуху хлопковых семян, пшеничную муку, соевую муку, пемзу, древесную муку, муку из скорлупы грецких орехов, лигнин, их комбинации и подобное), или может представлять собой жидкий носитель (например, воду, толуол, ксилол, лигроин, сельскохозяйственное масло, ацетон, метилэтилкетон, циклогексанон, трихлорэтилен, перхлорэтилен, этилацетат, амилацетат, монометиловый эфир пропиленгликоля и монометиловый эфир диэтиленгликоля, метанол, этанол, изопропанол, амиловый спирт, этиленгликоль, пропиленгликоль, глицерин, их комбинации и подобное). Кроме того, N-замещенный (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксимины и по меньшей мере один инертный носитель, если таковой используют в препарате, можно наносить в виде любого из разнообразных общепринятых типов препаратов, включая, но не ограничиваясь этим, смачиваемый порошок, эмульгируемый концентрат, суспензионный концентрат, разбавленная эмульсия (например, водная эмульсия), разбавленная суспензия (например, водная суспензия), а непосредственно разбрызгиваемый или разбавляемый раствор, наносимая в виде покрытия паста и пыль. Указанные выше типы препаратов можно получить по методикам, которые являются общепринятыми в области агрохимикатов.

Например, если препарат наносят на семя(ена) в виде смачиваемого порошка, то смачиваемый порошок может содержать смесь N-замещенного (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксимины(ов) и по меньшей мере одного твердого носителя. Смесь можно прессовать с получением диспергируемых в воде гранул. По меньшей мере один твердый носитель и по меньшей мере одно ПАВ можно смешать с N-замещенным (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксимином(ами) и измельчить. Концентрация N-замещенного (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксимины(ов) в смачиваемом порошке может составлять величину в диапазоне примерно от 10 до примерно 90 мас.%, например от 25 до примерно 75 мас.%. Смачиваемый порошок может необязательно включать по меньшей мере одно ПАВ, такое как сульфированный лигнин, конденсированный нафталинсульфонат, нафталинсульфонат, алкилбензолсульфонат, алкилсульфат и неионногенное ПАВ (например, аддукт алкилфенола с метиленоксидом этилена). Концентрация по меньшей мере одного ПАВ, если присутствует, в смачиваемом порошке может составлять величину в диапазоне примерно от 0,5 до примерно 10 мас.%. По меньшей мере одно ПАВ может способствовать по меньшей мере одной характеристике из образования и стабилизации смачиваемого порошка.

Например, если препарат наносят на семя(семена) в виде эмульгируемого концентрата, то эмульги-

руемый концентрат может включать по меньшей мере один N-замещенный (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксмин и по меньшей мере один жидкий носитель. N-замещенный (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксмин(ы) может быть, по существу, растворен по меньшей мере в одном жидком носителе. Эмульгируемый концентрат может, необязательно, включать по меньшей мере один эмульгатор при концентрации примерно от 1 до примерно 30 мас.%. Используемое здесь выражение "эмульгатор" означает и включает материал, который стабилизирует суспензию капелек одной жидкой фазы в другой жидкой фазе. По меньшей мере один эмульгатор может представлять собой неионногенное, анионногенное, катионногенное вещество или их комбинацию. Неограничительные примеры неионных эмульгаторов включают простые эфиры полиалкиленгликолей и продукты конденсации алкил- и арилфенолов, алифатических спиртов, алифатических аминов или жирных кислот с этиленоксидом, пропиленоксидами, такими как этоксилированные алкилфенолы и эфиры карбоновых кислот, солюбилизованные полиолом или полиоксиалкиленом. Неограничительные примеры анионногенных эмульгаторов включают растворимые в маслах соли (например, кальция)алкиларилсульфоновых кислот, растворимые в маслах соли, простые эфиры сульфатированных полигликолей и соли простых эфиров фосфатированных полигликолей. Неограничительные примеры катионногенных эмульгаторов включают соединения четвертичного аммония и соли жирных аминов. Эмульгируемый концентрат может также содержать другие совместимые добавки, такие как регуляторы роста растений и другие биологически активные соединения, используемые в сельском хозяйстве. Например, концентрация N-замещенного (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксмина(ов) в эмульгируемом концентрате может, например, составлять примерно от 10 до примерно 50 мас.%. В одном или нескольких вариантах эмульгируемый концентрат можно разбавлять водой или маслом, получая разбрызгиваемые смеси в виде эмульсий "масло в воде".

Например, если препарат наносят на семя(семена) в виде водной суспензии, то водная суспензия может включать N-замещенный (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксмин(ы), диспергированный в жидком водном носителе (например, воде). Концентрация N-замещенного (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксмина(ов) в водной эмульсии может составлять примерно от 5 до примерно 50 мас.%.

Концентрация N-замещенного (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксмина(ов) в водной суспензии может составлять примерно от 5 до примерно 50 мас.%. Водную суспензию можно приготовить, мелко измельчая N-замещенный (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксмин(ы) и подмешивая N-замещенный (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксмин(ы) в жидкий водный носитель. Водная суспензия может необязательно включать по меньшей мере одно ПАВ, которое способствует образованию и/или стабилизации водной суспензии. Можно добавлять другие материалы, такие как неорганические соли и синтетические или природные камеди, для повышения одной или более характеристик из плотности и вязкости водной суспензии.

Например, если препарат наносят на семя(семена) в виде водной эмульсии, то водная эмульсия может включать N-замещенный (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксмин(ы), эмульгированный в жидком носителе (например, воде). Концентрация N-замещенного (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксмина(ов) в водной эмульсии может составлять примерно от 5 до примерно 50 мас.%. N-замещенный (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксмин(ы) до получения водной эмульсии можно растворить в смешивающемся с водой растворителе. Неограничительные примеры подходящих смешивающихся с водой растворителей включают ароматические углеводороды, производные бензола, такие как толуол, ксилолы, другие алкилированные бензолы и подобные, и производные нафталина, алифатические углеводороды, такие как гексан, октан, циклогексан и подобные, минеральные масла из алифатических или изопарафиновых серий, и смеси ароматических и алифатических углеводородов; галогенированные ароматические или алифатические углеводороды; растительные масла, масла из семян или животные масла, например соевое масло, рапсовое масло, оливковое масло, касторовое масло, подсолнечное масло, кокосовое масло, кукурузное масло, хлопковое масло, льняное масло, пальмовое масло, арахисовое масло, сафлоровое масло, кунжутное масло, тунговое масло и подобное, и C1-C6 сложные моноэфиры, производные растительных масел, масел семян или животных масел; C1-C6 диалкиламиды C6-C20 насыщенных и ненасыщенных алифатических карбоновых кислот, такие как N-N-диметилалкиламид; C1-C12 эфиры ароматических карбоновых кислот и дикарбоновых кислот и C1-C12 эфиры алифатических и цикло-алифатических карбоновых кислот; C4-C12 сложные полиэфиры двухатомных, трехатомных или других низших полиспиртов, такие как пропиленгликольдиолеат, диоктилсукцинат, дибутиладипат, диоктилфталат и подобные. Водную эмульсию можно получать, эмульгируя N-замещенный (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксмин(ы) или его раствор, смешивающийся с водой, в водном жидком носителе. Водная эмульсия необязательно может включать по меньшей мере одно ПАВ, которое может содействовать по меньшей мере одной характеристике: образованию или стабилизации водной эмульсии.

Например, если препарат наносят на семя(семена) в виде гранулированной пыли, то гранулированный препарат может включать N-замещенный (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксмин(ы), диспергированный по меньшей мере в одном твердом носителе (например, каолиновой глине, измельченной вулканической породе и др.). По меньшей мере один твердый носитель может быть представлен

в виде порошка. Концентрация N-замещенного (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксими́на (ов) в пыли может составлять примерно от 1 до примерно 10 мас. %.

N-Замещенный (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксими́н(ы) или препарат, включающий N-замещенный (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксими́н(ы), можно необязательно наносить на семя(семена) параллельно (т.е. одновременно) по меньшей мере с одним дополнительным материалом или последовательно (например, до или после). По меньшей мере один дополнительный материал может представлять собой материал или соединение, которое имеет необходимую пригодность и которое существенно не препятствует инсектицидной активности N-замещенного (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксими́на(ов). Специалист в данной области может на деле определить, существенно ли мешает или нет по меньшей мере один дополнительный материал инсектицидной активности N-замещенного (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксими́на(ов), применяя стандартные тестовые форматы, в том числе, но не ограничиваясь этим, тесты, включающие прямые сравнения эффективности N-замещенного (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксими́на(ов) по настоящему раскрытию по меньшей мере с одним дополнительным материалом или без такового. В качестве неограничительного примера по меньшей мере один дополнительный материал может представлять собой один или более из вспомогательных материалов.

По меньшей мере один вспомогательный материал, если таковой используется, может представлять собой общеизвестный адъювант, применяемый в агрономии, в том числе, но не ограничиваясь этим, смачивающий агент, диспергирующее средство, связующее, проникающий агент, удобрение, буфер, краситель, комплексон, агент снижения текучести, агент для совместимости, регулятор вязкости, антипенный агент, осветляющий агент, ПАВ, эмульгатор, их комбинации и подобное. Подходящие вспомогательные материалы хорошо известны в агрономии (смотри, например, "Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations" под редакцией D.A. Knowles, авторское право 1998, Kluwer Academic Publishers; смотри также "Insecticides in Agriculture and Environment-Retrospects and Prospects", A.S. Perry, I. Yamamoto, I. Ishaaya и R. Perry, авторское право 1998, Springer-Verlag). По меньшей мере, в некоторых вариантах по меньшей мере один вспомогательный материал включает по меньшей мере одно связующее (например, полиакрилат, полиметакрилат, полибутен, полиизобутилен, полиэфир, полиэтиленамин, полиэтиленамид, полиэтиленмин полистирол, полиуретан, поливиниловый спирт, поливинилпирролидон, поливинилацетат, сополимеры, производные таких полимеров и их комбинации), которое может усиливать адгезию N-замещенного (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксими́на(ов) к семенам).

Применение N-замещенного (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксими́на(ов), такого как сульфосафлор, в качестве средства для обработки семян с целью контроля насекомых отряда Coleoptera, таких как земляные блошки, благоприятным образом снижает развитие устойчивости насекомых к современным инсектицидам, применяемым в качестве средств для обработки семян с целью контроля насекомых отряда Coleoptera, расширяет применимость и эффективность N-замещенного (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксими́на в качестве инсектицида и способствует повышению инсектицидной активности и эффективности по сравнению с инсектицидами, обычно применяемыми в качестве средств для обработки семян с целью контроля насекомых отряда Coleoptera.

Следующие примеры служат для более подробного объяснения вариантов настоящего раскрытия. Эти примеры не следует толковать как исчерпывающие или исключительные относительно области данного изобретения.

Примеры

Пример 1. Сравнительные примеры.

Оценивают эффективность сульфосафлора в качестве средства для обработки семян канолы (*Brassica napus*) с целью контроля ущерба в результате поедания блошкой крестоцветной (*Phyllotreta stusciferae*) относительно коммерческого стандарта тиаметоксама (*Helix Xtra*). На семена канолы распыляют инсектициды из ряда, включающего *Helix Xtra* при уровне около 0,4 мг тиаметоксама АИ/семя, спинозин А и спинозин D (спиносад) при низком уровне около 0,2 мг АИ/семя и высоком уровне около 0,6 мг АИ/семя, спинеторам при низком уровне около 0,2 мг АИ/семя и высоком уровне около 0,6 мг АИ/семя и сульфосафлор при низком уровне около 0,2 мг АИ/семя и высоком уровне около 0,6 мг АИ/семя. Каждую обработку повторяют четыре (4) раза. Семена канолы высевают и затем подвергают заражению природными паразитами (блошка крестоцветная) вскоре после появления всходов.

На основании описанного выше эксперимента оценивают ущерб в результате поедания земляными блошками через пять (5) дней и двадцать семь (27) дней после появления всходов из семян канолы. На фиг. 1 показан ущерб в результате поедания земляными блошками через 5 дней и на фиг. 2 показан ущерб в результате поедания земляными блошками через 27 дней. На фиг. 1 и 2 и на каждой из фиг. 3 и 4, описанных ниже, "Ck" обозначает необработанные семена канолы, "Std" обозначает семена канолы, обработанные *Helix Xtra*, "Sp" обозначает семена канолы, обработанные спиносадом, "Set" обозначает семена канолы, обработанные спинеторамом, и "Sxf" обозначает семена канолы, обработанные сульфосафлором. Как описано на фиг. 1, обработка семян при низком уровне сульфосафлора и при высоком уровне сульфосафлора способствует увеличению инсектицидной активности относительно *Phyllotreta stusciferae*, по сравнению с *Helix Xtra* через 5 дней. Через 5 дней низкий уровень сульфосафлора дает

ущерб в результате поедания земляными блошками около 4%, высокий уровень сульфоксафлора дает ущерб в результате поедания земляными блошками около 3%, и применение Helix Xtra дает ущерб в результате поедания земляными блошками около 22%. Необработанные семена канолы демонстрируют ущерб в результате поедания земляными блошками около 93%. Кроме того, как описано на фиг. 2, оба варианта (при низкой степени сульфоксафлора и высокой степени сульфоксафлора) способствуют повышению инсектицидной активности относительно *Phyllotreta cruciferae* по сравнению с Helix Xtra через 27 дней. Через 27 дней после появления всходов канолы низкая степень сульфоксафлора дает ущерб в результате поедания земляными блошками около 18%, высокая степень сульфоксафлора дает ущерб в результате поедания земляными блошками около 23%, и применение Helix Xtra дает ущерб в результате поедания земляными блошками около 53%. Необработанные семена канолы демонстрируют ущерб в результате поедания земляными блошками около 100%. На каждой из фиг. 1 и 2 показано, что семена канолы, обработанные сульфоксафлором, гораздо лучше защищены относительно *Phyllotreta cruciferae*, чем семена канолы, обработанные Helix Xtra, которые гораздо лучше защищены относительно *Phyllotreta cruciferae*, чем необработанные семена канолы.

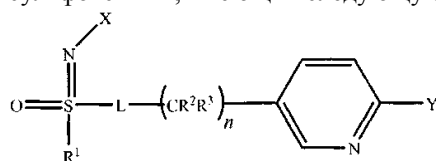
На основании описанных выше экспериментов оценивают мощность растений канолы через 13 дней после появления всходов из семян канолы. На фиг. 3 показана мощность растений канолы через 13 дней. Как описано на фиг. 3, оба варианта (при низкой степени сульфоксафлора и высокой степени сульфоксафлора) способствуют повышению мощности растений канолы по сравнению с применением Helix Xtra. Низкая степень сульфоксафлора дает мощность растений канолы около 87%, высокая степень сульфоксафлора дает мощность растений канолы около 69%, и применение Helix Xtra дает мощность растений канолы около 61%. Необработанные семена канолы демонстрируют мощность растений канолы около 10%.

На основании описанных выше экспериментов оценивают урожай растений канолы через 107 дней после появления всходов из семян канолы. На фиг. 4 показан урожай растений канолы через 107 дней. Как описано на фиг. 4, низкая степень сульфоксафлора способствует получению урожая растений канолы аналогично применению Helix Xtra, и высокая степень сульфоксафлора способствует получению повышенного урожая растений канолы по сравнению с применением Helix Xtra. Низкая степень сульфоксафлора дает урожай растений канолы около 4050 кг/га, высокая степень сульфоксафлора дает урожай растений канолы около 4500 кг/га, и применение Helix Xtra дает урожай растений канолы около 3900 кг/га. Необработанные семена канолы демонстрируют урожай растений канолы около 3000 кг/га.

Притом что настоящее раскрытие допускает различные модификации и альтернативные формы, здесь показаны посредством примеров на чертежах и подробно описаны специфические варианты. Однако настоящее раскрытие не предполагает ограничения конкретными раскрытыми формами. Скорее, настоящее раскрытие охватывает все модификации, эквиваленты и альтернативы, входящие в область настоящего изобретения, которая определена следующей приложенной формулой изобретения и ее правовыми эквивалентами.

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Способ борьбы с насекомыми, включающий контактирование по меньшей мере одного семени с инсектицидом для защиты растения, вырастающего по меньшей мере из одного семени, против повреждения насекомыми отряда Coleoptera, где инсектицид представляет собой N-замещенный (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксмин, имеющий следующую химическую структуру:



где X представляет собой диоксид азота (NO₂), цианид (CN) или COOR⁴;

L представляет собой одинарную связь или R¹, S и L, взятые вместе, составляют 4-, 5- или 6-членный цикл;

R¹ представляет собой (C₁-C₄)алкил;

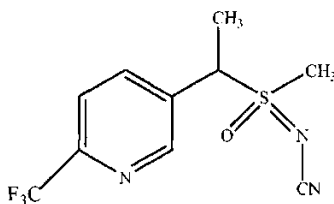
R² и R³ независимо представляют собой атом водорода (H), метил, этил, атом фтора, хлора или брома;

n равно целому числу от 0 до 3;

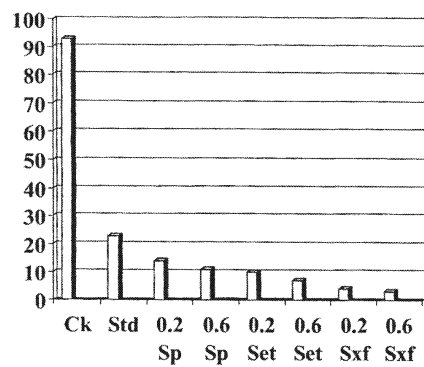
Y представляет собой (C₁-C₄)галогеналкил;

R⁴ представляет собой (C₁-C₄)алкил.

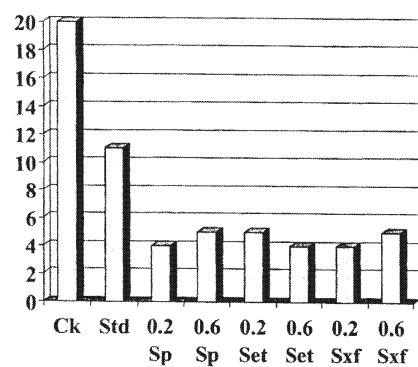
2. Способ по п.1, где инсектицид, представляющий собой N-замещенный (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксмин, имеет следующую химическую структуру:



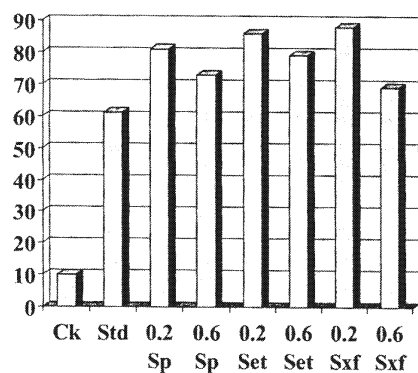
3. Способ по п.1, где насекомыми отряда Coleopteran являются земляные блошки.
4. Способ по п.3, где земляными блошками являются земляные блошки по меньшей мере одного рода из *Phyllotreta* и *Psylliodes*.
5. Способ по п.4, где земляные блошки по меньшей мере одного рода из *Phyllotreta* и *Psylliodes* являются земляными блошками по меньшей мере одного вида из *Phyllotreta armoraciae*, *Phyllotreta cruciferae*, *Phyllotreta pusilla*, *Phyllotreta nemorum*, *Phyllotreta robusta*, *Phyllotreta striolata*, *Phyllotreta undulata*, *Psylliodes chrysocephala* и *Psylliodes punctulata*.
6. Способ по п.1, где по меньшей мере одно семя является продуктом растения рода *Brassica*.
7. Способ по п.6, где по меньшей мере одно семя представляет по меньшей мере один вид из *B. napus*, *B. juncea*, *B. carinata*, *B. rapa*, *B. oleracea*, *B. rupestris*, *B. septiceps*, *B. nigra*, *B. narinosa*, *B. perviridis*, *B. tournefortii* и *B. fruticulosa*.
8. Способ по п.1, где контактирование по меньшей мере одного семени с инсектицидом включает нанесение инсектицида, представляющего собой N-замещенный (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксмин по меньшей мере на одно семя перед посевом по меньшей мере одного семени.
9. Способ по п.1, где контактирование по меньшей мере одного семени с инсектицидом осуществляется по меньшей мере одним из способов: разбрызгиванием, нанесением покрытия, распылением и пропитыванием по меньшей мере одного семени инсектицидом, представляющим собой N-замещенный (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксмин.
10. Способ по п.1, где контактирование по меньшей мере одного семени с инсектицидом включает применение многократных нанесений инсектицида, представляющего собой N-замещенный (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксмин по меньшей мере на одно семя.
11. Способ по п.1, где контактирование по меньшей мере одного семени с инсектицидом включает контактирование по меньшей мере одного семени с инсектицидом, представленным в форме препарата, содержащего инсектицид и по меньшей мере один инертный носитель, где инсектицидом является N-замещенный (6-галогеналкилпиридин-3-ил)алкилсульфоксмин.
12. Способ по п.11, где препарат дополнительно содержит по меньшей мере один вспомогательный материал.
13. Способ борьбы с насекомыми, включающий нанесение инсектицида сульфоксафлора по меньшей мере на одно семя с целью контроля по меньшей мере одного вида земляных блошек.
14. Способ по п.13, где по меньшей мере одно семя включает по меньшей мере одно семя канолы.
15. Способ по п.13, где по меньшей мере один вид земляных блошек включает *Phyllotreta cruciferae*.
16. Способ протравливания семян, включающий контактирование по меньшей мере одного семени с эффективным количеством инсектицида с целью защиты по меньшей мере одного семени и других развивающихся из него частей растения от повреждения, наносимого насекомыми отряда Coleopteran, где инсектицидом является сульфоксафлор.
17. Способ по п.16, где контактирование по меньшей мере одного семени с инсектицидно эффективным количеством инсектицида включает нанесение инсектицида в форме препарата, содержащего инсектицид, по меньшей мере один инертный носитель, по меньшей мере один вспомогательный материал, где инсектицидом является сульфоксафлор.
18. Способ по п.16, где по меньшей мере одно семя является по меньшей мере одним семенем канолы.



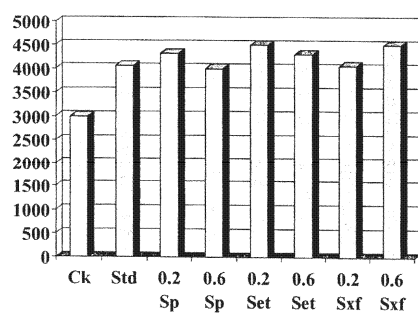
Фиг. 1



Фиг. 2



Фиг. 3



Фиг. 4



Евразийская патентная организация, ЕАПВ

Россия, 109012, Москва, Малый Черкасский пер., 2