

(19) **KG** (11) **162** (13) **C2**

ГОСУДАРСТВЕННОЕ АГЕНТСТВО
ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ
ПРИ ПРАВИТЕЛЬСТВЕ КЫРГЫЗСКОЙ РЕСПУБЛИКИ (КЫРГЫЗПАТЕНТ)

(51)⁶ **C07C 261/00**

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ к патенту Кыргызской Республики

(10) 686596

(21) 2512152/SU

(22) 17.08.1977

(31) 99071/76

(32) 18.08.1976

(33) JP

(46) 01.01.1997, Бюл. №3, 1997

(71)(73) Сумитомо Кемикал Компани Лимитед, JP

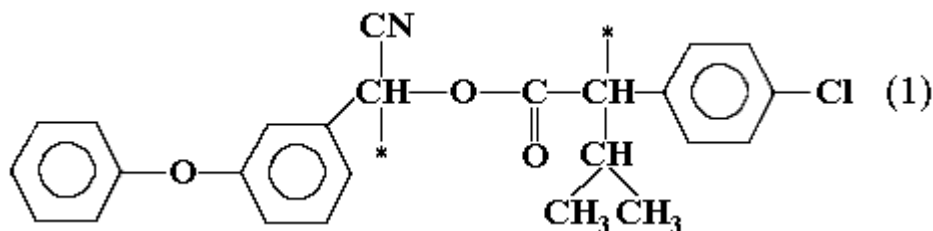
(72) Масатика Хирано, Исао Оно, Нобуо Оно, Акихико Мине, JP

(56) 1. Патент США № 962 458, кл. 424-304, опубл. 18.06.1976

2. Патент США № 3 996 244, кл. 260-332.2, опубл. 1976 (прототип)

(54) Инсектицидная композиция

(57) Инсектицидная композиция, содержащая действующее начало на основе оптически активного α -циано-3-феноксibenзил-2-(4-хлорфенил)-изовалерианата, а также вспомогательные компоненты из числа твердых и жидких носителей, отличающаяся тем, что, с целью повышения инсектицидной активности, она содержит в качестве оптически активного α -циано-3-феноксibenзил-2-(4-хлорфенил)-изовалерианата, описываемого формулой



сложный эфир S(+) кислоты и рацемического спирта или сложный эфир S(+) кислоты и S(-) спирта, причем содержание действующего начала в композиции составляет 0.1 - 90 вес.%.

Изобретение относится к химическим средствам защиты растений, конкретно к инсектицидной композиции на основе оптически активного α -циано-3-феноксibenзил-2-(4-хлорфенил)-изовалерианата.

Известно использование сложных эфиров α -циано-3-феноксibenзильного спирта в

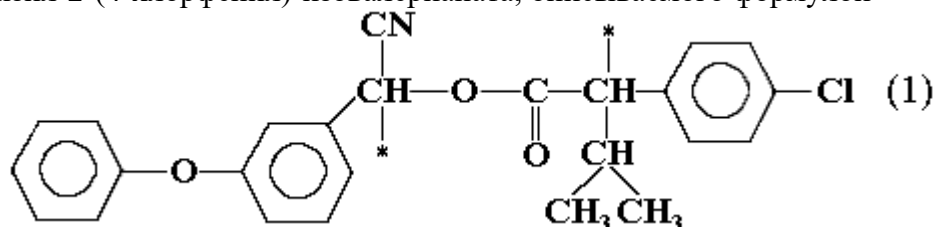
качестве инсектицидов [1].

Известно также использование в качестве инсектицида рацемического α -циано-3-феноксibenзил-2-(4-хлорфенил)-изовалерианата [2].

Однако указанные инсектициды обладают недостаточной активностью при малых концентрациях и, кроме того, токсичны для многих растений.

Цель изобретения - изыскание новых инсектицидных средств, обладающих высокой инсектицидной активностью и малой токсичностью для растений и млекопитающих.

Указанная цель достигается тем, что в качестве оптически активного α -циано-3-феноксibenзил-2-(4-хлорфенил)-изовалерианата, описываемого формулой



используют сложный эфир S(+) кислоты и рацемического спирта (соединение А) или сложный эфир S(+) кислоты и S(-) спирта (соединение Б) в количестве 0.1-90 вес. %.

Соединения формулы (1) могут быть получены обычными способами получения сложных эфиров, например взаимодействием соответствующей кислоты или галоидпроизводного кислоты с соответствующим спиртом или галоидпроизводным углеводорода.

Формы применения соединений формулы (1) обычные: пылевидные препараты, грануляты, смачивающие порошки, пасты, эмульсии, растворы.

Сложные эфиры формулы (1) могут применяться совместно с другими пестицидами, а также с веществами, которые оказывают синергическое действие.

Пример 1. Инсектицидная активность против *Spodoptera litura*.

20 %-ные эмульгируемые концентраты разбавляли 10 мл воды и наносили опрыскиванием на китайскую кочанную капусту, выращенную в горшочках до стадии развития 3-4 листьев.

Листья сушили в токе воздуха, затем срезали и помещали в стеклянные камеры диаметром 14 см, высотой 7 см. 10 трехдневных личинок *Spodoptera litura* были помещены в камеру и число личинок, выживших и погибших после 2 дней, регистрировали для определения показателя LC_{50} (50 %-ная летальная концентрация).

Полученные результаты даны в табл. 1.

Пример 2. Инсектицидная эффективность против *Musca domestica*.

Соединения А и Б и рацемат разбавляли по отдельности до желательной концентрации при помощи ацетона и 0.5 мкл наносили каплями на спинную часть грудной клетки *Musca domestica* штамма CSMA при помощи микро-шприца. Обработанные насекомые помещались в чашку из пластического материала диаметром 11 см, в которую была внесена пища (3 %-ный водный раствор сахара). Через 24 ч подсчитывали число живых и погибших мух для определения показателя LD_{50} . Полученные результаты даны в табл. 2.

Пример 3. Инсектицидная эффективность против личинок *Culex pipiens pallens*.

200 мл эмульсии соединений А и Б и рацемат разбавляли до желательной концентрации и вводили в стеклянные стаканы на 300 мл вместе с группой 30-дневных личинок *Culex pipiens pallens*. Через 24 дня подсчитывали число живых и погибших личинок для определения величины LC_{50} .

Полученные результаты даны в табл.3.

Пример 4. Фитотоксичность по отношению к растениям.

Семена растений были высеяны в горшочки диаметром 10 см и выращивались до стадии 1-2 главных листьев. Фитотоксичность оценивали по прошествии 1 недели после опрыскивания. Использованные для проведения испытаний растения приведены в табл. 4.

Степень фитотоксичности приведена в табл. 5

Пример 5. Испытания проводились в полевых условиях. 20 %-ные эмульгируемые концентраты соединений А и Б, рацемата и смачивающегося порошка ланатты (5-метил-N-[(метилкарбамил)]-окси]-тиоацетимидат были разбавлены в 2000 раз.

Каждую разбавленную жидкость наносили путем опрыскивания на поля китайской кочанной капусты «жиго» в стадии 5-6 листьев и по прошествии 1 недели после опрыскивания все растения были собраны. Было подсчитано число выживших насекомых и зарегистрирована степень фитотоксичности для растений.

Проводили 3 параллельных опыта на площади 5 м² каждый.

Наносили опрыскиванием 100 л раствора на 10 а.

Данные приведены в табл. 5.

Пример 6. Фитотоксичность по отношению к фруктовым деревьям.

20 %-ные эмульгируемые концентраты соединений А и Б и рацемата наносили опрыскиванием на новые побеги взрослых фруктовых деревьев. Обработывали одну главную ветвь, проводили 5 повторных обработок. Результат опрыскивания приведен в табл. 7.

Все опрысканные листья подвергались осмотру и повреждения листьев подразделяли на 6 степеней, а степень фитотоксичности вычисляли по следующему уравнению:

$$\text{Степень фитотоксичности} = \frac{\text{индекс повреждения листьев} \times \text{число листьев, к которым относятся повреждения}}{5 \times \text{общее число наблюдающих хм}} \times 100\%$$

Индекс повреждения листьев. Повреждение площади листьев, %.

0	-
1	следы
2	10-30
3	30-60
4	60-80
5	80-100.

Для оценки фитотоксичности в опытах определяли хлорозис. Полученные результаты приведены в табл. 8.

Таким образом, предложенные соединения обладают высокой инсектицидной активностью при малых концентрациях и слабой токсичностью для растений.

Таблица 1

Соединение	LC ₅₀ , млн ⁻¹ x 10 ⁶	Относительная эффективность
А	5.0	240
Б	1.7	587
Рацемат	12	100

Таблица 2

Соединение	LD ₅₀ , мкг/муху	Относительная эффективность
А	0.014	221
Б	0.0055	564
Рацемат	0.031	100

Таблица 3

Соединение	LC ₅₀ , млн ⁻¹ x 10 ⁶	Относительная эффективность
А	0.018	244

Б	0.010	440
Рацемат	0.044	100

Таблица 4

Растение	Сорт	Стадия, на которой производили опрыскивание, количество листьев	
Китайская капуста	"Musa"	1.5	2
Японский редис	"Muno Wase"	2	2.5
Томаты	"Sekai Ochi"	2	2.5
Огурцы	"Kaga Aonaga"	1.5	2
"Яичное" растение	"Makuro"	2	2.5

Таблица 5

Соединение	Концентрация, млн ⁻¹ x 10 ⁸	Степень фитотоксичности растения				
		китайская капуста	японский редис	томаты	огурцы	яичное растение
А	800	1.7	1.5	1.0	1.8	1.6
	400	1.4	1.0	0.6	0.8	0.4
	200	0.8	0.1	0	0.2	0
	100	0	0	0	0	0
	50	0	0	0	0	0
Б	800	0	0.2	0.1	0	0
	400	0	0	0	0	0
	200	0	0	0	0	0
	100	0	0	0	0	0
	50	0	0	0	0	0
Рацемат	800	3.8	4.0	2.3	3.0	2.6
	400	2.5	2.8	1.0	2.5	1.8
	200	2.3	2.2	1.0	2.1	1.5
	100	1.3	1.5	0.5	1.2	0.2
	50	0.9	0.2	0.4	1.0	0

х) Оценку производили по шкале от 0 (нормальное состояние) до 5 (полный хлорозис) баллов и подсчитывали средние значения.

Таблица 6

Соединение	Концентрация, %	Общее число насекомых, шт.		Фитотоксичность
		обычные капустные черви	алмазная моль	
А	20	0	1	-
Б	20	0	0	-
Рацемат	20	3	6	+ ¹
Ланатта	45	5	56	-
Не опрыскивались	-	29	148	-

1) Хлорозис наблюдался частично для новых побегов

Таблица 7

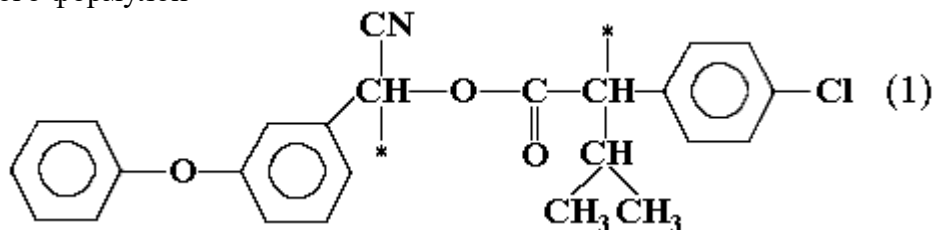
Фруктовое дерево	Сорт	Дата опрыскивания	Дата наблюдений
Груша (Pyrus serofina)	"Коджуро"	15. IV	22.IV
Цитрусовое дерево	Уазе-уншу	7.V	16.V

Таблица 8

	Концентрация,	Степень фитотоксичности	
Соединение	млн ⁻¹ x 10 ⁶	груша	цитрус
	400	0.9	5.6
	200	0.2	4.2
А	100	0.0	0.0
	50	0.0	0.0
	400	0.5	1.0
	200	0.0	0.0
Б	100	0.0	0.0
	50	0.0	0.0
	400	17.0	37.4
	200	6.8	29.8
Рацемат	100	5.1	5.9
	50	0.5	4.1
Необработанные растения	-	0.0	0.0

Формула изобретения

Инсектицидная композиция, содержащая действующее начало на основе оптически активного α -циано-3-феноксibenзил-2-(4-хлорфенил)-изовалерианата, а также вспомогательные компоненты из числа твердых и жидких носителей, отличающаяся тем, что, с целью повышения инсектицидной активности, она содержит в качестве оптически активного α -циано-3-феноксibenзил-2-(4-хлорфенил)-изовалерианата, описываемого формулой



сложный эфир S(+) кислоты и рацемического спирта или сложный эфир S(+) кислоты и S(-) спирта, причем содержание действующего начала в композиции составляет 0.1 - 90 вес. %.

Ответственный за выпуск

Ногай С.А.

Кыргызпатент, 720021, г.Бишкек, ул. Московская, 62, тел. (312) 680819, 681641, факс (312) 681703