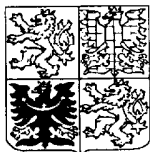


# PATENTOVÝ SPIS

(11) Číslo dokumentu:

## 286 333

(19)  
ČESKÁ  
REPUBLIKA



ÚŘAD  
PRŮMYSLOVÉHO  
VLASTNICTVÍ

(21) Číslo přihlášky: 1993 - 1868

(22) Přihlášeno: 08.09.1993

(30) Právo přednosti:

10.09.1992 CH 1992/2847

20.11.1992 CH 1992/3558

(40) Zveřejněno: 13.04.1994

(Věstník č. 4/1994)

(47) Uděleno: 20.01.2000

(24) Oznámeno udělení ve Věstníku: 15.03.2000

(Věstník č. 3/2000)

(13) Druh dokumentu: B6

(51) Int. Cl.<sup>7</sup>:

A 01 N 47/34

A 01 N 43/707

A 01 N 43/40

C 07 D 253/06

C 07 D 213/53

(73) Majitel patentu:

NOVARTIS AG, Basle, CH;

(72) Původce vynálezu:

Flückiger Claude, Magden, CH;

Rindlisbacher Alfred, Muttenz, CH;

Senn Robert, Basle, CH;

Uk Solang, Rheinfelden, CH;

(74) Zástupce:

Kubát Jan ing. patentový zástupce,

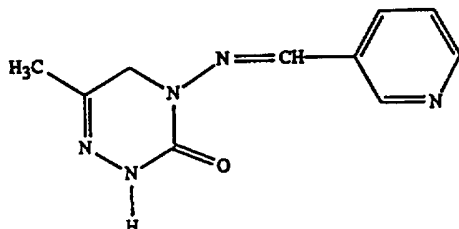
U průhonu 36, Praha 7, 170 00;

(54) Název vynálezu:

### Způsob hubení hmyzu

(57) Anotace:

Způsob hubení hmyzu, při kterém se na hmyz nebo na jeho životní prostředí aplikuje insekticidní prostředek, který obsahuje alespoň jednu sloučeninu vzorce I ve volné formě nebo ve formě agrochemicky použitelné soli jako účinnou látku a případně alespoň jednu pomocnou látku, jehož podstata spočívá v tom, že se hubí hmyz čeledi Aleyrodidae, Cicadellidae a Delphacidae řádu Homoptera.

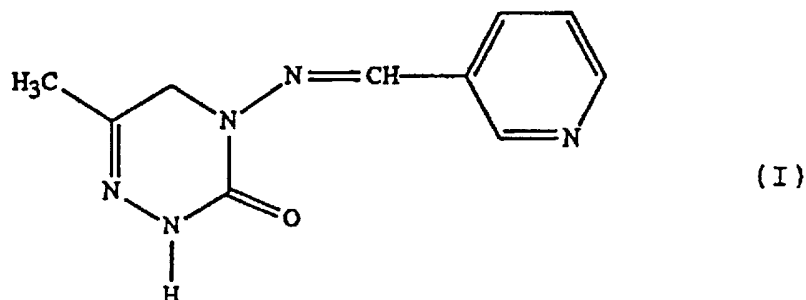


CZ 286333 B6

**Způsob hubení hmyzu**Oblast techniky

5

Vynález se týká způsobu hubení hmyzu, při kterém se na hmyz nebo na jeho životní prostředí aplikuje insekticidní prostředek, který obsahuje alespoň jednu sloučeninu vzorce I



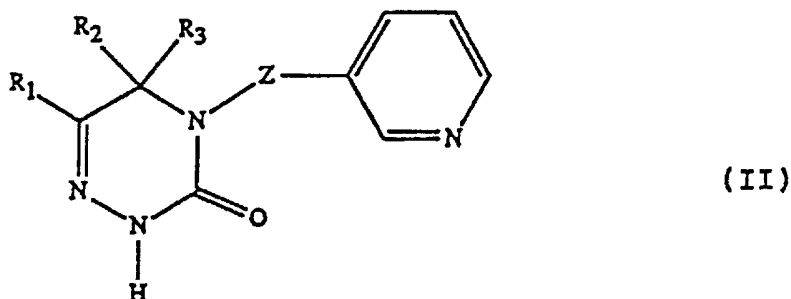
10

ve volné formě nebo ve formě agrochemicky použitelné soli jako účinnou látku a případně alespoň jednu pomocnou látku.

15 Dosavadní stav techniky

Sloučeniny vzorce I použité v rámci vynálezu jsou známými sloučeninami, které jsou například popsány v patentovém spisu EP-A-0 314 615. V EP-A-0 314 615 je popsána všeobecná účinnost sloučenin obecného vzorce II

20



ve kterém buď

25 R<sub>1</sub> znamená atom vodíku, alkylovou skupinu obsahující 1 až 12 uhlíkových atomů, cykloalkylovou skupinu obsahující 3 až 6 uhlíkových atomů, alkoxyalkylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 až 4 uhlíkové atomy a alkylový zbytek obsahuje 1 až 6 uhlíkových atomů, halogenalkylovou skupinu, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 nebo 2 uhlíkové atomy, fenylovou skupinu, benzylovou skupinu, fenethylovou skupinu, fenpropylovou skupinu, fenbutylovou skupinu, fenpentylovou skupinu nebo fenylovou, benzylovou, fenethylovou, fenpropylovou, fenbutylovou nebo fenpentylovou skupinu, která je jednou nebo dvakrát substituovaná atomem halogenu, alkylovou skupinou obsahující 1 až 5 uhlíkových atomů, halogenalkylovou skupinou, ve které alkylový zbytek obsahuje 1 nebo 2 uhlíkové atomy, methoxylovou skupinu a/nebo ethoxylovou skupinou, a

35

R<sub>2</sub> znamená atom vodíku, alkylovou skupinu obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů, cykloalkylovou skupinu obsahující 3 až 6 uhlíkových atomů, nebo nesubstituovanou fenylovou skupinu nebo fenylovou skupinu substituovanou alkylovou skupinou obsahující 1 až 12

uhlíkových atomů, atomem halogenu nebo halogenalkylovou skupinou, jejíž alkylový zbytek obsahuje 1 až 12 uhlíkových atomů nebo

R<sub>1</sub> a R<sub>2</sub> společně tvoří nasycený nebo nenasycený 3- až 7-členný uhlíkový kruh,

5

R<sub>3</sub> znamená atom vodíku nebo alkylovou skupinu obsahující 1 až 6 uhlíkových atomů a

Z znamená –N=CH– nebo –NH–CH<sub>2</sub>–,

10 ve volné formě nebo ve formě adiční soli s kyselinou,

při hubení škůdců, především hmyzu, zejména hmyzu řádů Anoplura, Coleoptera, Diptera, Heteroptera, Homoptera, Hymenoptera, Isoptera, Lepidoptera, Mallophaga, Orthoptera, Psocoptera, Siphonaptera, Thysanoptera a Thysanura, především sajícího hmyzu, zejména hmyzu čeledi Aphididae náležející řádu Homoptera. Specificky prokázán je však pouze účinek sloučenin vzorce II proti třem druhům z řádu Homoptera, a sice proti k rodům Aphis a Myzus náležejícím druhům Aphis Craccivora, Aphis fabae a Myzus persicae z čeledi Aphididae, jakož i proti druhu z řádu Diptera, a sice proti k rodu Aedes náležejícímu druhu Aedes aegypti z čeledi Culicidae. Naproti tomu není jako cílový hmyz z čeledi Aphididae navržena žádná další čeleď z řádu Homoptera. Stejně tak není navržen žádný rod z čeledi Aphididae a kromě druhů Aphis cracivora a Aphis fabae není také navržen jako cílový hmyz žádný další druh z rodu Aphis. Stejně tak není v patentovém spisu EP-A-0 314 615 žádná zmínka týkající se použití sloučenin obecného vzorce II pro ochranu rostlinného propagačního materiálu před napadením škůdci.

25

#### Podstata vynálezu

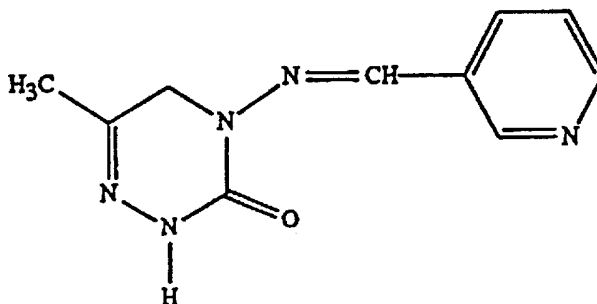
Neočekávaně a vzhledem k obsahu patentového dokumentu EP-A-0 314 615 zcela překvapivě bylo nyní zjištěno, že sloučenina vzorce I se znamenitě hodí pro hubení určitých specifických čeledí řádu Homoptera, a sice pro hubení hmyzu čeledi Aleyrodidae, Cicadellidae a Delphacidae.

30

Tato vynikající schopnost sloučeniny vzorce I hubit určitý hmyz řádu Homoptera je proto tak překvapující, že sloučenina vzorce I spadá do rozsahu sloučenin obecného vzorce II, uvedených v patentovém dokumentu EP-A-0 314 615 a je dokonce specificky zmíněna v příkladu H.3 patentového dokumentu EP-A-0 314 615 a přesto není v patentovém dokumentu EP-A-0 314 615 žádná zmínka o uvedené znamenité účinnosti, popřípadě schopnosti sloučeniny podle vynálezu, a to ani o účinnosti sloučenin obecného vzorce II proti vynálezem specifikovaným čeledím řádu Homoptera.

35

40 Předmětem vynálezu proto je způsob hubení hmyzu, při kterém se na hmyz nebo na jeho životní prostředí aplikuje insekticidní prostředek, který obsahuje alespoň jednu sloučeninu vzorce I



( I )

ve volné formě nebo ve formě agrochemicky použitelné soli jako účinnou látku a případně alespoň jednu pomocnou látku, jehož podstata spočívá v tom, že se hubí hmyz čeledi Aleyrodidae, Cicadellidae a Delphacidae.

- 5 Výhodně se účinná látka použije ve volné formě. Výhodně se v rámci způsobu podle vynálezu hubí hmyz rodů Bemisia, Trialeurodes, Empoasca, Erythroneura, Laudelphax a Nilaparvata a hmyz druhu Bemisia tabaci a Trialeurodes vaporariorum.

10 Zemědělsky použitými solemi sloučenin vzorce I jsou například adiční soli s kyselinami. Tyto soli mohou být například vytvořeny se silnými anorganickými kyselinami, jakými jsou minerální kyseliny, jako například kyselina chloristá, kyselina sírová, kyselina dusičná, kyselina dusitá, kyselina fosforečná nebo kyselina halogenovodíková, se silnými karboxylovými kyselinami, jakými jsou případně například halogen substituované  $C_1$  až  $C_4$ -alkankarboxylové kyseliny, jako například kyselina mravenčí, kyselina octová nebo kyselina trifluorooctová, případně nenasycené  
15 dikarboxylové kyseliny, jako například kyselina šťavelová, kyselina malonová, kyselina jantarová, kyselina maleinová, kyselina fumarová nebo kyselina ftalová, hydroxykarboxylové kyseliny, jako například kyselina askorbová, kyselina mléčná, kyselina jablečná, kyselina vinná nebo kyselina citronová, nebo kyselina benzoová, nebo s organickými sulfonovými kyselinami, jakými jsou případně například halogenem substituované  $C_1$  až  $C_4$ -alkan- nebo arylsulfonové  
20 kyseliny, jako například methan- nebo p-toluensulfonová kyselina. Vzhledem k těsnému vztahu mezi sloučeninami vzorce I ve volné formě a ve formě jejich zemědělsky použitelných solí je třeba v předcházejícím a následujícím textu pod označením sloučeniny vzorce I ve volné formě, popřípadě zemědělsky použitelné soli sloučenin vzorce I rozumět v příslušném smyslu také odpovídající zemědělsky přijatelné soli, popřípadě volné sloučeniny vzorce I. Výhodnými  
25 sloučeninami podle vynálezu jsou sloučeniny vzorce I ve volné formě.

Sloučeniny vzorce I ve volné formě nebo ve formě zemědělsky přijatelných solí se vyskytují ve formě isomerů (E) nebo (Z) a sice podle toho, zda dílčí struktura  $-N=C(H)-$ , která váže oba heterocykly uvedené ve výše zobrazených vzorcích, vykazuje konfiguraci (E) nebo (Z).  
30 Vzhledem k tomu je třeba pod sloučeninami vzorce I ve volné formě nebo ve formě zemědělsky přijatelné soli v předcházejícím a následujícím textu rozumět také odpovídající isomery (E) nebo (Z) a to v čisté formě nebo ve formě směsi isomerů (E)/(Z), a to i v případě, že tyto izomery nejsou specificky zmíněny.

35 Sloučeniny vzorce I ve volné formě nebo ve formě zemědělsky přijatelných solí se mohou vyskytovat ve formě tautomerů. Tak se může například sloučenina vzorce I, která ve výše uvedeném strukturním vzorci vykazuje dílčí strukturu  $-N(H)-C(=O)-$ , nacházet v rovnováze s tautomerem, který má namísto struktury  $-N(H)-C(=O)-$  dílčí strukturu  $-N=C(OH)-$ . Vzhledem k tomu je třeba pod sloučeninami vzorce I ve volné formě nebo ve formě zemědělsky  
40 použitelných solí rozumět v předcházejícím a následujícím textu také případně odpovídající tautomery, a to i v případě, kdy tyto tautomery nejsou specificky zmíněny.

Sloučeniny vzorce I mohou být v rámci vynálezu aplikovány přímo na hmyz nebo jeho životní prostředí (aplikace A) nebo specificky v rámci aplikace na životní prostředí hmyzu preventivně  
45 na rostlinný propagační materiál (aplikace B).

Sloučeniny vzorce I použité v rámci vynálezu jsou v oblasti hubení hmyzu podle A) a v oblasti hubení škůdců podle B) preventivními nebo/a kurativními cennými účinnými látkami již při nízkých aplikačních koncentracích a při příznivé snášenlivosti teplokrevnými živočichy, rybami  
50 a rostlinami. Sloučeniny vzorce I použité podle vynálezu jsou účinné proti všem nebo proti jednotlivým vývojovým stádiím normálně senzibilního, ale také resistantního hmyzu podle A), popřípadě podle B). Účinek účinných látek použitých podle vynálezu může být přitom přímý, který spočívá v zahubení hmyzu podle A), popřípadě podle B) a který se projeví bezprostředně nebo teprve po určitém čase, například při zbavování se blan, nebo nepřímý, který se například

projeví ve snížení snůšce vajíček a/nebo ve sníženém počtu vylíhnutých jedinců, přičemž dobrý účinek odpovídá míře zahubení (mortalita) alespoň rovné 50 až 60 %. Účinné látky použité podle vynálezu se zejména vyznačují tím, že obzvláště šetří užitečné živočichy, jakými jsou *Amblyseius fallacis*, *Chrysopa carnea*, *Coccinella septempunctata*, *Orium majusculus* a *Typhlodromus pyri*, a ptáky.

Použitím účinných látek podle vynálezu může být podle A) huben hmyz, vyskytující se na rostlinách, především na užitkových a okrasných rostlinách v zemědělství, v zahradnictví a v lese, nebo na částech takových rostlin, jakým jsou plody, květy, listoví, stonky, hlízy nebo kořeny, přičemž pod uvedených hubením se rozumí omezení nebo zničení hmyzí populace a později narostlé části rostlin jsou také ještě částečně chráněny proti uvedenému hmyzu. Účinnými látkami použitými podle vynálezu mohou být podle B) hubení tzn. omezení nebo zničení škůdci vyskytující se na rostlinném propagačním materiálu, především na propagačním materiálu užitkových a okrasných rostlin v zemědělství, zahradnictví a lese, přičemž později narostlé části rostlin jsou také ještě chráněny proti těmto škůdcům a ochrana rovněž trvá například až do doby, kdy se vyvinou vzrostlé, rezistence-schopné rostliny, přičemž propagační rostlinný materiál, popřípadě z tohoto materiálu vyrostlé rostliny, jsou chráněné jak proti škůdcům, kteří napadají nadzemní části rostlin, tak proti škůdcům žijícím v půdě.

Jako cílové kultury podle A), popřípadě jako rostlinný propagační materiál podle B) přichází v úvahu zejména kultury, popřípadě propagační materiál obilovin, jakými jsou pšenice, ječmen, oves, žito, rýže, kukuřice nebo čirok, řepy, například cukrovky nebo krmné řepy, ovoce, jakým jsou například jádrovité ovoce, peckovité ovoce a bobulovité ovoce, jako například jablka, hušky, švestky, broskve, mandle, třešně, jahody, maliny a ostružiny, luštěnin, jakými jsou fazole, čočka, hrách nebo sója, olejovin, jakými jsou řepka olejná, hořčice, mák, olivy, slunečnice, kokosové ořechy, plody poskytující ricinový olej, kakaové boby nebo podzemnice olejná, okurkovin, jakými jsou dýně, okurky nebo melouny, vláknin, jakými jsou bavlna, len, konopí nebo juta, citrusové ovoce, jakými jsou pomeranče, citrony nebo mandarinky, zeleniny, jako je špenát, hlávkový salát, chřest, kapusta, zelí, mrkev, cibule, rajčata, brambory nebo paprika, vavřínových rostlin, jako avokádo, skořice nebo kamfr, nebo tabáku vlašských ořechů, plodů kávovníku, cukrové třtiny, čaje, pepře, vinné révy, chmele, banánových rostlin, kaučukovníku nebo ozdobných rostlin.

Cílovými kulturami jsou především obiloviny, ovoce, luštěniny, okurkoviny, bavlna, citrusové ovoce, zelenina, vinná réva, chmel nebo ozdobné rostliny.

Cílovými kulturami jsou obzvláště kultury broskví, fazolí, hrachu, okurek, citrusové ovoce, kapusty, zelí, rajčat, brambor a špendlíků.

Cílovými kulturami jsou zejména kultury broskví, okurek, rajčat nebo brambor.

Dalšími aplikačními oblastmi sloučenin použitých podle vynálezu jsou ochrana zásob nebo skladů.

Pro realizaci vynálezu lze použít odpovídající prostředky, tj. prostředky proti hmyzu pro použití podle A) a prostředky proti škůdcům pro použití podle B), mající formu, která podle požadovaného účelu a daných podmínek zahrnuje emulgovatelné koncentráty, suspenzní koncentráty, přímo postřikovatelné nebo zředitelné roztoky, natíratelné pasty, zředěné emulze, postřikovatelné prášky, rozpustné prášky, dispergovatelné prášky, smáčitelné prášky, popraše, granuláty nebo zapouzdřené formulace v polymerních látkách, které obsahují alespoň jednu účinnou látku použitou podle vynálezu.

Uvedená účinná látka se v těchto prostředcích nachází v čisté formě jako pevná účinná látka, která má například specifickou velikost částic, nebo výhodně společně s alespoň jednou

pomocnou obvyklou látkou, jakou je plnivo, například rozpouštědlo nebo pevná nosičová látka, nebo povrchově aktivní látka (tenzid).

5 Jako rozpouštědla přichází v úvahu například: případně částečně hydrogenované aromatické uhlovodíky, výhodně frakce C<sub>8</sub> až C<sub>12</sub> alkybenzenů, jakými jsou xylenové směsi, alkylované naftaleny nebo tetrahydronaftalen, alifatické nebo cykloalifatické uhlovodíky, jakými jsou parafiny nebo cyklohexan, alkoholy, jakými jsou ethanol, propanol nebo butanol, glykoly a jejich ethery a estery, jakými jsou propylenglykol, dipropylenglykoether, thylenglykol nebo ethylenglykolmonomethyl- nebo ethylether, ketony, jakými jsou cyklohexanon, isoforon nebo 10 diacetonalkohol, silně polární rozpouštědla, jakými jsou N-methylpyrrolid-2-on, dimethylsulfoxid nebo N,N-dimethylformamid, voda, případně epoxidované rostlinné oleje, jakými jsou případně epoxidovaný řepkový, ricínový kokosový, sójový a silikonový olej.

15 Jako pevné nosičové látky, například pro popraše a dispergovatelné prášky, se zpravidla používají kamenné moučky, jakými jsou kacit, talek, kaolin, montmorillonit nebo attapulgit. Za účelem zlepšení fyzikálních vlastností mohou být také použity vysoce disperzní kyseliny křemičité nebo vysoce disperzní nasáklivé polymery. Jako zrněné adsorpční granulační nosiče přichází v úvahu porézní typy látek, jakými jsou pemza, antuka, sepiolit nebo bentonit, zatímco 20 jako nesorpční nosičové látky přichází v úvahu kalcit nebo písek. Kromě toho může být použita množina granulovaných látek anorganického nebo organického původu, zejména dolomit nebo desintegrované rostlinné zbytky.

Jako povrchově aktivní sloučeniny přichází v úvahu podle typu účinné látky, která má být v prostředí obsažena, kationtové nebo/a aniontové tenzidy nebo směsi tenzidů s dobrými 25 emulgačními, dispergačními a smáčivými vlastnostmi. Dále uvedené tenzidy je třeba považovat pouze za příklady tohoto typu látek. V příslušné literatuře je popsán velký počet dalších tenzidů, které jsou vhodné pro použití v rámci vynálezu a které jsou obvyklé při formulování prostředků uvedeného typu.

30 Jako neionogenní tenzidy přichází v první řadě v úvahu polyglykoetherové deriváty alifatických nebo cykloalifatických alkoholů, nasycených nebo nenasycených mastných kyselin a alkyfenolů, které mohou obsahovat 3 až 30 glykoetherových skupin a 8 až 20 uhlíkových atomů v (alifatickém) uhlovodíkovém zbytku a 6 až 18 uhlíkových atomů v alkylovém zbytku 35 alkyfenolů. Kromě toho jsou vhodné ve vodě rozpustné, 20 až 250 ethylenglykoetherových a 10 až 100 propylenglykoetherových skupin obsahující polyethylenoxid-adykty s polypropylenglykolem, ethylendiaminopolypropylenglykolem a alkylpolypropylenglykolem s 1 až 10 uhlíkovými atomy v alkylovém řetězci. Jmenované sloučeniny obvykle obsahují 1 a 5 ethylenglykolových jednotek na jednu propylenglykolovou jednotku. Jako příklady těchto látek lze zmínit nonylfenolpolyethoxyethanol, polyglykoether ricínového oleje, adukty polypropylenu a polyethylenoxidu, tributylfenoxypolyethoxyethanol, polyethylenglykol a oktyl- 40 fenoxypolyethoxyethanol. Dále přichází v úvahu estery mastných kyselin a polyoxyethylen-sorbitanu, jako například polyoxyethylen-sorbitan.

U kationtových tenzidů se především jedná o kvartérní amoniové soli, která jsou substituenty 45 obsahují alespoň jeden alkylový zbytek s 8 až 22 uhlíkovými atomy a které jako další substituenty obsahují nižší, případně halogenované alkylové, benzylové nebo nižší hydroxyalkylové zbytky. Výhodné amoniové soli mají formu halogenidů, methylsulfátů nebo ethylsulfátů. Příklady těchto solí jsou stearyltrimethylamoniumchlorid a benzyl-di-(2-chlor-ethyl)ethylamoniumbromid.

50 Vhodnými aniontovými tenzidy mohou být jak ve vodě rozpustná mýdla, tak i ve vodě rozpustné syntetické povrchově aktivní látky. Jako mýdla jsou vhodné soli vyšších mastných kyselin (C<sub>10</sub> až C<sub>22</sub>) odvozené od alkalických kovů a kovů alkalických zemin a případně substituované amonné soli vyšších mastných kyselin, jakým jsou sodná a draselná sůl kyseliny olejové nebo

kyseliny stearové nebo přírodní směsi mastných kyselin, které mohou být například získané z kokosového nebo tallového oleje. Dále lze zmínit methyltaurinové sole mastných kyselin. Častěji jsou však používány syntetické tenzidy, zejména mastné sulfonáty, mastné sulfáty, sulfonované benzimidazolové deriváty nebo alkylarylsulfonáty. Mastné sulfonáty a sulfáty se zpravidla vyskytují jako soli alkalických kovů, kovů alkalických zemin nebo jako případně substituované amonné soli a mají obecně alkylový zbytek s 8 až 22 uhlíkovými atomy, přičemž alkyl zahrnuje i alkylovou část acylových zbytků. Je například možné uvést sodnou nebo vápenatou sůl kyseliny lignosulfonové, dodecylesteru kyseliny sírové nebo směsi mastných alkoholsulfátů vyrobených z přirozených mastných kyselin. Sem patří také soli esterů kyseliny sírové a sulfonových kyselin odvozené od aduktů mastných alkoholů s ethylenoxidem. Uvedené sulfonované benzimidazolové deriváty s výhodou obsahují 2 skupiny sulfonové kyseliny a jeden zbytek mastné kyseliny s asi 8 až 22 uhlíkovými atomy. Alkylarylsulfonáty jsou například sodná, vápenatá nebo triethanolamoniová sůl kyseliny dodecylbenzensulfonové, kyseliny dibutyl-naftalensulfonové nebo kondenzačního produktu kyseliny naftalensulfonové a formaldehydu. Dále přichází v úvahu také odpovídající fosfáty, jako soli esteru kyseliny fosforečné aduktu p-nonylfenol-(4-14)-ethylenoxidu.

Uvedené prostředky obsahují zpravidla 0,1 až 99 %, zejména 0,1 až 95 %, účinné látky a 1 až 99,9 %, zejména 5 až 99,9 %, alespoň jedné pevné nebo kapalné pomocné látky, přičemž zpravidla 0 až 25 %, zejména 0,1 až 20 %, hmotnosti prostředku může být tvořeno tenzidem (procentické obsahy jsou hmotnostní procentickými obsahy). Ve fázi prodeje má prostředek výhodně koncentrovanou formu, zatímco finální spotřebitel zpravidla používá prostředek ve zředěné formě, který obsahuje podstatně nižší koncentraci účinné látky. Výhodně prostředky mají zejména následující složení, přičemž procentické obsahy jsou hmotnostními procentickými obsahy.

#### Emulgovatelné koncentráty:

30	účinné látky	1 až 90 %, výhodně 5 až 20 %,
	tenzid	1 až 30 %, výhodně 10 až 20 %,
	rozpouštědlo	5 až 98 %, výhodně 70 až 85 %.

#### Popraše:

35	účinná látka	0,1 až 10 %, výhodně 0,1 až 1 %,
	pevný nosič	99,9 až 90 %, výhodně 99,9 až 99 %.

#### Suspenní koncentráty:

40	účinná látka	5 až 75 %, výhodně 10 až 50 %,
	voda	94 až 24 %, výhodně 88 až 30 %,
	tenzid	1 až 40 %, výhodně 2 až 30 %.

#### Smáčitelné prášky:

45	účinná látka	0,5 až 90 %, výhodně 1 až 80 %,
	tenzid	0,5 až 20 %, výhodně 1 až 15 %,
	pevný nosič	5 až 99 %, výhodně 15 až 98 %.

50

#### Granuláty:

	účinná látka	0,5 až 30 %, výhodně 3 až 15 %,
	pevný nosič	99,5 až 70 %, výhodně 97 až 85 %.

Účinnost uvedených prostředků může být rozšířena a přizpůsobena daným okolnostem přidáním dalších, například insekticidně, akaricidně nebo/a fungicidně účinných látek. Jako takové účinné přísady přichází v úvahu například zástupci následujících tříd účinných látek: organofosforové sloučeniny, nitrofenoly a jejich deriváty, formamidiny, močoviny, pyrethroidy, chlorované uhlovodíky a preparáty na bázi mikroorganismu *Bacillus thuringiensis*. Prostředky podle vynálezu mohou rovněž obsahovat další pevné nebo kapalné pomocné látky, jakými jsou stabilizátory, například případně epoxidované rostlinné oleje (například epoxidovaný kokosový olej, řepkový olej nebo sójový olej), odpěňovadla, například silikonový olej, konzervační prostředky, regulátory viskozity, pojiva nebo/a adheziva, jakož i hnojiva nebo další účinné látky, vhodné k dosažení požadovaných specifických účinků, například baktericidy, nematocidy, molluskicidy nebo selektivní herbicidy.

Výše uvedené prostředky se vyrobí o sobě známým způsobem, a to v případě absence pomocných látek například mletím nebo/a prosetím, například k získání určité velikosti částic, nebo lisováním pevné účinné látky, nebo v případě přítomnosti alespoň jedné pomocné látky například dokonalým smíšením nebo/a semletím účinné látky s pomocnou látkou nebo s pomocnými látkami. Tyto způsoby výroby prostředků podle vynálezu a použití sloučenin vzorce I k výrobě těchto prostředků spadají rovněž do rozsahu vynálezu.

Jako způsob aplikace uvedených prostředků podle A) a rovněž jako způsob hubení hmyzu podle A) přichází podle požadovaného výsledku a daných okolností v úvahu například postřik, zamlžení, poprášení, natření, rozptýlení nebo zalití.

Typické aplikační koncentrace leží přitom mezi 0,1 a 1000 ppm, výhodně mezi 0,1 a 500 ppm účinné látky. Zejména se používají postřikové suspenze s koncentracemi účinné látky 50, 100, 200, 300 nebo 500 ppm. Aplikační dávky na jeden hektar činí obecně 1 až 2000 g/ha účinné látky, zejména 10 až 1000 g/ha účinné látky, výhodně 20 až 600 g/ha účinné látky. Výhodnými aplikačními dávkami jsou dávky 100, 200, 250, 300, 400 nebo 450 g účinné látky na hektar. Při aplikaci účinné látky na stromy jsou výhodnými aplikačními dávkami dávky 0,25, 0,75, 1,0 nebo 2,0 g účinné látky/strom. Výhodným aplikačním postupem pro prostředky podle A) je nanesení na listoví rostlin (foliární aplikace), přičemž lze četnost aplikací a aplikační dávky přizpůsobit míře napadení daným hmyzem. Účinná látka se může do rostlin také dospět kořenovým systémem (systemický účinek) tím, že se růstové prostředí rostliny zvlhčí kapalným prostředkem nebo se účinná látka zavede do růstového prostředí rostliny, například do půdy, například ve formě granulátu (půdní aplikace). U vodních kultur rýže může být takový granulát dávkován do závlahové vody.

Aplikační postupy pro prostředky podle B) a tedy postupy pro ochranu rostlinného propagačního materiálu, kterým je v rámci vynálezu každý rostlinný materiál, ze kterého se po vysazení nebo zasetí vyvinou na místě vysazení nebo zasetí celé rostliny, například semenáče, rhizomy, sazenice nebo zejména osivo, jako plody, hlízy, zrní nebo cibule, před napadením škůdci, jsou například vyznačeny tím, že se odpovídající prostředek aplikuje takovým způsobem, že jeho aplikace probíhá v blízkém prostorovém sousedství nebo prostorově společně s vysazením nebo zasetím propagačního materiálu na místo vysazení nebo zasetí. Aplikace těchto prostředků v blízkém prostorovém sousedství s vysazením nebo zasetím propagačního materiálu na místo vysazení nebo zasetí se přitom podle vynálezu s výhodou provádí před vysazením nebo zasetím propagačního materiálu půdní aplikací prostředku přímo na místo vysazení nebo zasetí propagačního materiálu, například výhodně přisetbou, do brázdy nebo na úzce omezenou plochu okolo místa vysazení nebo zasetí propagačního materiálu, přičemž tato půdní aplikace podle B) může být například provedena způsobem, který je analogický s výše popsanou půdní aplikací podle A). Aplikaci odpovídajících prostředků, která se děje prostorově společně s vysazením nebo zasetím propagačního materiálu na místo vysazení nebo zasetí, je třeba chápat tak, že se na místo vysazení nebo zasetí zasadí nebo zaseje propagační materiál, který byl předběžně ošetřen



uvedenými prostředky, přičemž se může uvedené předběžné ošetření propagačního materiálu provést podle požadovaného výsledku a daných okolností například tak, že se propagační materiál postříká, zamlží, popráší, potře nebo zalije uvedeným prostředkem anebo v případě osiva se toto osivo uvedeným prostředkem namoří.

- 5 Při moření osiva podle vynálezu, tzn. při suchém, mokřém, vlhkém nebo suspenzním moření, se k osivu před zasetím přidá v mořicím zařízení vhodný prostředek proti škůdcům a tento prostředek se na osivu rovnoměrně rozdělí, například mícháním obsahu mořicího zařízení a/nebo otáčením celého mořicího zařízení nebo třepáním celým mořicím zařízením. Zvláštní forma tohoto moření je například vyznačena tím, že se osivo impregnuje kapalným prostředkem nebo že se osivo ovrství pevným prostředkem (ovrstvení osiva, Seed Coating) anebo že se zabudování účinné látky dosáhne přidáním prostředku do vody použité pro předběžné zbobtnání osiva (zvlhčení osiva, Seed Soaking).
- 10
- 15 Při moření osiva podle vynálezu se typické dávky použitých prostředků pohybují například mezi 0,1 a 20 g účinné látky na kilogram osiva, zejména mezi 0,5 a 15 g/kg osiva a výhodně mezi 1 a 10 g/kg osiva, zatímco pro ostatní aplikační postupy podle B) přichází v úvahu aplikační koncentrace a aplikační dávky, které již byly uvedeny výše pro aplikační postupy podle A). Moření osiva podle vynálezu se zejména vyznačuje tím, že vzhledem k nepatrné toxicitě
- 20 použitých účinných látek byla pozorována dobrá snášenlivost mořeného osiva u ptáků, například u ptáků, kteří mají ve volné přírodě sklon k požívání osiva z čerstvě osetých polí a mezi které například patří strnadi, kosové, drozdi, kachny, bažanti, pěnkavy, husy, jiřice, koroptve, vrány, skřivani, sýkory, rackové, havrani, hřivnáči, stehlíci, holubi nebo čížci. Moření osiva podle vynálezu zahrnuje také moření zásob osiva. Obchoduschopný rostlinný propagační materiál,
- 25 který byl předběžně ošetřen podle vynálezu, spadá rovněž do rozsahu vynálezu.

#### Příklady provedení vynálezu

- 30 V následující části popisu bude vynález blíže objasněn pomocí příkladů jeho konkrétního provedení, které mají pouze ilustrační charakter a nikterak neomezují rozsah vynálezu, který je vymezen formulací patentových nároků.
- 35 Příklady formulací (% = hmotnostní procento)

#### Příklad F1

Roztoky	a)	b)	c)	d)
Účinná látka	80 %	10 %	5 %	95 %
Ethylenglykolmonomethylether	20 %	-	-	-
Polyethylenglykol MG 400	-	70 %	-	-
N-methyl-2-pyrrolidon	-	20 %	-	-
Epoxidový kokosový olej	-	-	1 %	5 %
Benzín (rozmezí teploty varu 160 až 190 °C)	-	-	94 %	-

- 40 Tyto roztoky se používají ve formě postřiku s velmi malými kapičkami.

## Příklad F2

Granuláty	a)	b)	c)	d)
Účinná látka	5 %	10 %	8 %	21 %
Kaolin	94 %	-	79 %	54 %
Vysoce dispersní kyselina křemičitá	1 %	-	13 %	7 %
Attapulgit	-	90 %	-	18 %

5 Účinná látka se rozpustí v dichlormethanu, získaný roztok se nastříká na nosič a rozpouštědlo se potom odpaří za vakua.

## Příklad F3

Popraše	a)	b)
Účinná látka	2 %	5 %
Vysoce dispersní kyselina křemičitá	1 %	5 %
Talek	97 %	-
Kaolin	-	90 %

10 Důkladným smíšením nosičových látek s účinnou látkou se získá popraš schopný bezprostředního použití.

## 15 Příklad F4

## Postřikovatelný prášek

Účinná látka	25 %
Síran sodný	5 %
Polyethylenglykolether ricínového oleje (36 až 37 mol EO)	10 %
Sílikonový olej	1 %
Agridex	2 %
Vysoce dispersní kyselina křemičitá	10 %
Kaolinový prášek	37 %
Sulfitový výluh ve formě prášku	5 %
Ultravon W-300% (dvojsodná sůl kyseliny 1-benzyl-2-heptadecylbenzimidazol-X,X'-disulfonové)	5 %

20 Účinná látka se smísí s přísadami a takto získaná směs se semele ve vhodném mlýnu. Získá se postřikovatelný prášek, který může být zředěn vodou za vzniku suspenze s libovolnou požadovanou koncentrací účinné látky.

## Příklad F5

Popraše	a)	b)
Účinná látka	5 %	8 %
Talek	95 %	-
Kaolin	-	92 %

Popraš schopný okamžitého použití se získá tak, že se účinná látka smísí s nosiči a získaná směs se semele ve vhodném mlýnu.

5

## Příklad F6

Vytlačovaný granulát

Účinná látka	10 %
Lignosulfonát sodný	2 %
Karboxymethylcelulóza	1 %
Kaolin	87 %

10

Účinná látka se smísí s přísadami a takto získaná směs se semele a zvlhčí vodou. Vlhká směs se potom vytlačuje a granuluje, načež se získaný granulát vysuší proudem vzduchu.

## Příklad F7

Zapouzdřený granulát

Účinná látka	3 %
Polyethylenglykol (MG 200)	3 %
Kaolin	94 %

15

Jemně rozemletá účinná látka se ve směšovači rovnoměrně nanese na kaolin zvlhčený polyethylenglykolem. Tímto způsobem se získá neprašný zapouzdřený granulát.

20

## Příklad F8

Suspensní koncentrát

Účinná látka	40 %
Ethylenglykol	10 %
Nonylfenolpolyethylenglykolether (15 mol EO)	6 %
Lignosulfonát sodný	10 %
Karboxymethylcelulóza	1 %
Vodný roztok formaldehydu (37%)	0,2 %
Vodná emulze silikonového oleje (75%)	0,8 %
Voda	32 %

25

Jemně rozemletá účinná látka se důkladně promísí s přísadami. Tímto způsobem se získá suspensní koncentrát, ze kterého mohou být zředěním vodou získány vodné suspenze s libovolnou požadovanou koncentrací účinné látky.

## Příklad F9

Emulzní koncentráty	a)	b)	c)
Účinná látka	25 %	40 %	50 %
Dodecylbenzensulfonát vápenatý	5 %	8 %	6 %
Polyethylenglykolether ricínového oleje (36 molů EO)	5 %	–	–
Tributylfenolpolyethylenglykolether (30 molů EO)	–	12 %	4 %
Cyklohexanon	–	15 %	20 %
Xylenová směs	65 %	25 %	20 %

- 5 Z takových koncentrátů mohou být zředěním vodou získány emulze s libovolnou požadovanou koncentrací účinné látky.

## Příklad F10

10

Postřikovatelné prášky	a)	b)	c)
Účinná látka	25 %	50 %	75 %
Lignosulfonát sodný	5 %	5 %	–
Laurylsulfát sodný	3 %	–	5 %
Diisobutylnaftalensulfonát sodný	–	6 %	10 %
Oktylfenolpolyethylenglykolether (7 až 8 molů EO)	–	2 %	–
Vysoce dispersní kyselina křemičitá	5 %	10 %	10 %
Kaolin	62 %	27 %	–

Účinná látka se smísí s přísadami a získaná směs se semele ve vhodném mlýnu. Získá se postřikovatelný prášek, který může být zředěn vodou za vzniku suspenze s libovolnou požadovanou koncentrací účinné látky.

15

## Příklad F11

## Emulzní koncentrát

Účinná látka	10 %
Oktylfenolpolyethylenglykolether (4 až 5 molů EO)	3 %
Dodecylbenzensulfonát vápenatý	3 %
Polyglykolether ricínového oleje (36 molů EO)	4 %
Cyklohexanon	30 %
Xylenová směs	50 %

- 20 Z tohoto koncentráty mohou být získány zředěním vodou emulze s libovolnou požadovanou koncentrací účinné látky.

Biologické příklady (% = hmotnostní procento, pokud není uvedeno jinak)

Příklad B1

5

Účinnost proti *Bemisia tabaci*

Rostliny keříčkových fazolí se uloží do klecí zhotovených z gázy a osídlí dospělci *Bemisia tabaci*. Po snůšce vajíček se všichni dospělci odstraní. Po deseti dnech se rostliny společně s nymfami, které se na nich nachází, podrobí postřiku vodnou postřikovou suspenzí, která obsahuje 50 ppm účinné látky. Po dalších 14 dnech se vyhodnotí v procentech počet vylíhlých jedinců ve srovnání s kontrolní neošetřenou násadou. Sloučeniny vzorce I vykazují při tomto testu 100% účinnost.

15

Příklad B2

Účinnost proti *Nilaparvata lugens*

Dva týdny staré rýžové rostliny se ošetří vodnou postřikovou suspenzí, která obsahuje 50 ppm účinné látky. Po vysušení postřikového povlaku se rostliny osídlí nymfami *Nilaparvata lugens* a ponechají po dobu 14 dnů při teplotě 28 °C. Potom se provede vyhodnocení. Ze srovnání počtu vyklubaných nymf následující generace na ošetřených a neošetřených rostlinách se stanoví procentická redukce následující generace (procentický účinek). Sloučeniny vzorce I vykazují při tomto testu 100% účinnost.

25

Příklad B3

Účinnost moření proti *Nilaparvata lugens*

Do skleněné láhve nebo zásobníku z umělé hmoty se nasype 100 g rýžových semen a přidá tolik formulace účinné látky, aby se dosáhlo poměru 0,1; 1 nebo 10 g účinné látky na jeden kilogram semen. Otáčením zásobníku nebo/a třepáním zásobníku se dosáhne toho, že se účinná látka rovnoměrně rozdělí na povrchu semen. Takto namořená semena se potom vysadí do kořenáčů. Po uplynutí dvou týdnů se mladé rostliny pěstují ve skleníku a potom se ve válci z plexiskla osídlí vždy 20 nymfami (N-3) *Nilaparvata lugens*. Válec se potom uzavře sítkou. Pět dnů po osídlení rostlin se provede vyhodnocení. Ze srovnání počtu přeživších jedinců na rostlinách vzešlých z ošetřených semen a na rostlinách vzešlých z neošetřených semen se stanoví procentická redukce populace (procentická účinnost). Sloučeniny vzorce I vykazují při tomto testu dobrou účinnost.

35

40

Příklad B4

45

Účinnost moření proti *Aphis fabae*

Do skleněné láhve nebo do zásobníku z umělé hmoty se nasype 100 g fazolových semen a přidá takové množství formulace účinné látky, aby se dosáhlo poměru 0,1; 1 nebo 10 g účinné látky na jeden kilogram semen. Otáčením zásobníku nebo/a jeho třepáním se dosáhne toho, že se účinná látka rovnoměrně rozdělí po povrchu semen. Takto namořená semena se potom zasadí do kořenáčů (3 semena do každého kořenáče). Mladé rostliny se potom pěstují ve skleníku při teplotě 25 až 30 °C až do stádia druhého listu, načež se osídlí jedinci *Aphis fabae*. Šest dnů po osídlení se provede vyhodnocení. Ze srovnání počtu přeživších jedinců na rostlinách vzešlých

50

z namořených semen a na rostlinách vzešlých z neošetřených semen se stanoví procentická redukce populace (procentická účinnost). Sloučeniny vzorce I vykazují při tomto testu dobrou účinnost.

5

## Příklad B5

Účinnost moření proti *Myzus persicae*

10 Do skleněné láhve nebo zásobníku z umělé hmoty se nasype 100 g semen řepy cukrovky a přidá tolik pastovité formulace účinné látky, připravené z postřikovatelného prášku a malého množství vody, aby se dosáhlo poměru 0,1; 1 nebo 10 g účinné látky na jeden kilogram semen. Uzavřená mořicí nádoba se potom pohybuje na rotační stolici tak dlouho, až se uvedená pasta rovnoměrně rozdělí na povrchu semen. Takto namořená (ovrstvená) semena se potom vysuší a zasadí do  
15 sprašovitě půdy v plastických květináčích. Klíčky se potom kultivují ve skleníku při teplotě 24 až 26 °C, relativní vlhkosti 50 až 60 °C a 14 hodin osvětlení denně. Čtyři týdny po vyklíčení se rostliny s výškou 10 cm osídí smíšenou populací *Myzus persicae*. Dva a sedm dnů po tomto osídlení se provede vyhodnocení. Ze srovnání počtu přeživších jedinců na rostlinách vzešlých z namořených semen a na rostlinách vzešlých z neošetřených semen se stanoví procentická redukce populace (procentická účinnost).  
20 Sloučeniny vzorce I vykazují při tomto testu dobrou účinnost.

Důkaz o výrazně zvýšené účinnosti sloučeniny vzorce I poskytuje následující tabulka, ve které jsou shrnuty účinnosti sloučeniny vzorce I vůči jednotlivých typů škůdců (provedení podle  
25 vynálezu jsou zde označena specifikací „podle vynálezu“, zatímco provedení podle dosavadního stavu techniky jsou ponechána bez označení).

Škůdce	Řád	LC <sub>50</sub> (mg/l)**
1. <i>Bemisia tabaci</i> (podle vynálezu)	Homoptera	0,9
2. <i>Nilaparvata lugens</i> (podle vynálezu)	Homoptera	2,8
3. <i>Aonidiella aurantii</i>	Homoptera	> 400
4. <i>Musca domestica</i>	Diptera	> 1000
5. <i>Diabrotica balteata</i>	Coleoptera	> 1000
6. <i>Anthonomus grandis</i>	Coleoptera	> 400
7. <i>Heliothis virescens</i>	Lepidoptera	> 1000
8. <i>Ephestia kuehniella</i>	Lepidoptera	> 400
9. <i>Spodoptera littoralis</i>	Lepidoptera	> 1000
10. <i>Tetranychus urticae</i>	Acarina	> 1000
11. <i>Orius majusculus</i>	Heteroptera	> 8100
12. <i>Coccinella septempunctata</i>	Coleoptera	> 8100
13. <i>Chrysoperla carnea</i>	Neuroptera	> 8100
14. <i>Amblyseium fallacis</i>	Acarina	> 1000
15. <i>Encarsia formosa</i>	Hymenoptera	> 200
16. <i>Phytoseiulus persimilis</i>	Acarina	> 200

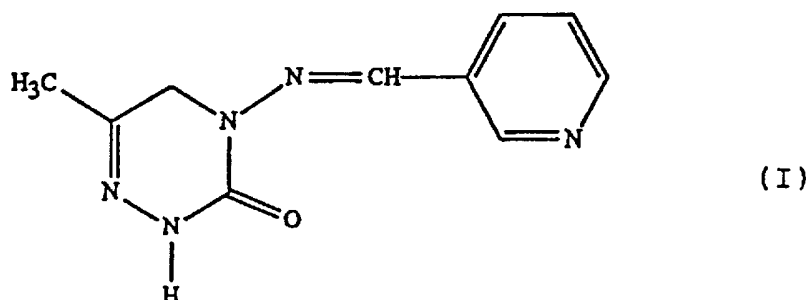
30 Z výsledků uvedených v této tabulce vyplývá, že uvedenou sloučeninou mohou být účinně hubeni pouze někteří stejnořídlí škůdci, zatímco sloučenina vzorce I je v podstatě netoxická vůči ostatním stejnořídlým škůdcům a vůči všem ostatním řádům škůdců. Z výsledků uvedených v této tabulce dále vyplývá, že účinnost sloučeniny vzorce I vůči uvedené úzké skupině stejnořídlých škůdců podle vynálezu a vůči ostatním škůdcům není stejného řádu, nýbrž se dokonce liší o několik řádů. Množství sloučeniny vzorce I, které je nezbytné k hubení

uvedené úzké skupiny stejnokřídlých škůdců, je takto alespoň 70 až 100 krát nižší než množství požadované pro hubení ostatních škůdců uvedených v tabulce.

5

## PATENTOVÉ NÁROKY

- 10 1. Způsob hubení hmyzu, při kterém se na hmyz nebo na jeho životní prostředí aplikuje insekticidní prostředek, který obsahuje alespoň jednu sloučeninu vzorce I



- 15 ve volné formě nebo ve formě agrochemicky použitelné soli jako účinnou látku a případně alespoň jednu pomocnou látku, **v y z n a ě n ý t í m**, že se hubí hmyz čeledi Aleyrodidae, Cicadellidae a Delphacidae.
- 20 2. Způsob podle nároku 1, **v y z n a ě n ý t í m**, že se účinná látka použije ve volné formě.
3. Způsob podle nároku 1 nebo 2, **v y z n a ě n ý t í m**, že se hubí hmyz čeledi Aleyrodidae.
- 25 4. Způsob podle některého z nároků 1 až 3, **v y z n a ě n ý t í m**, že se hubí hmyz rodů Bemisia a Trialeurodes.
5. Způsob podle některého z nároků 1 až 4, **v y z n a ě n ý t í m**, že se hubí hmyz druhu Bemisia tabaci.
- 30 6. Způsob podle některého z nároků 1 až 4, **v y z n a ě n ý t í m**, že se hubí hmyz druhu Trialeurodes vaporariorum.
7. Způsob podle nároku 1 nebo 2, **v y z n a ě n ý t í m**, že se hubí hmyz čeledi Cicadellidae.
- 35 8. Způsob podle některého z nároků 1, 2 a 7, **v y z n a ě n ý t í m**, že se hubí hmyz rodů Empoasca a Erythroneura.
- 40 9. Způsob podle nároku 1 nebo 2, **v y z n a ě n ý t í m**, že se hubí hmyz čeledi Delphacidae.

**10.** Způsob podle některého z nároků 1, 2 a 9, **v y z n a ě n ý t í m**, že se hubí hmyz rodů Laodelphax a Nilaparvata.

5

---

Konec dokumentu

---

10