



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU K PATENTU

208682

(11)

(B2)

(22) Přihlášeno 07 11 79
(21) (PV 7593-79)
(32)(31)(33) Právo přednosti
od 09 11 78 (11531/78)
od 24 08 79 (7728/79)

(40) Zveřejněno 31 12 80

(45) Vydáno 15 03 84

(51) Int. Cl.³

A 01 N 43/78

A 01 N 47/24

(72) Autor vynálezu WINTERNITZ PAUL dr., GREIFENSEE (ŠVÝCARSKO)

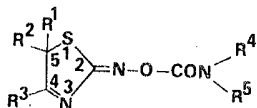
(73) Majitel patentu F. HOFFMANN - LA ROCHE & CO. AKTIENGESELLSCHAFT, BASILEJ (ŠVÝCARSKO)

(54) Insekticidní, akaricidní a nematocidní prostředek a způsob výroby účinné složky

1

Vynález se týká insekticidního, akaricidního a nematocidního prostředku a způsobu výroby účinných látek.

Předmětem vynálezu je insekticidní, akaricidní a nematocidní prostředek, který obsahuje jako účinnou složku alespoň jeden nový karbamoyloxim obecného vzorce I



(I)

v němž

R¹ a R³ znamenají alkylovou skupinu s 1 až 5 atomy uhlíku, alkenylovou skupinu se 2 až 5 atomy uhlíku, cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, fenylovou skupinu nebo naftyllovou skupinu, přičemž fenylová nebo naftyllová skupina je popřípadě substituována atomem halogenu,

R² znamená alkylovou skupinu s 1 až 5 atomy uhlíku,

R⁴ znamená alkylovou skupinu s 1 až 5 atomy uhlíku nebo cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 atomy uhlíku a

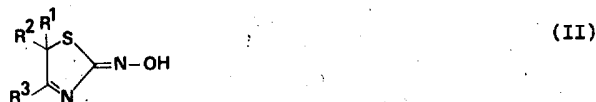
R⁵ znamená vodík, alkylovou skupinu s 1 až 5 atomy uhlíku, alkylkarbonylovou skupinu se 2 až 6 atomy uhlíku nebo alkylkarbonylovou skupinu se 2 až 6 atomy uhlíku, která je substituována halogenem,

nebo jeho adiční sůl s kyselinou.

208682

Sloučeniny obecného vzorce I a jejich soli jsou účinné jako prostředky k potírání škůdců a jsou vhodné zejména k potírání hmyzu, roztočů a nematodů. Uvedený vynález tedy zahrnuje insekticidní, akaricidní a nematocidní prostředky, které obsahují alespoň jednu sloučeninu obecného vzorce I, popřípadě její sůl, dále způsob výroby účinných sloučenin a jejich použití.

Předmětem vynálezu je dále způsob výroby sloučenin obecného vzorce I a jejich solí. Způsob výroby sloučenin podle vynálezu spočívá v tom, že se oxim obecného vzorce II



v němž

R^1 , R^2 a R^3 mají shora uvedený význam, uvádí v reakci s isokyanátem obecného vzorce III



v němž

R^4 má shora uvedený význam, při teplotě mezi 0 a 100 °C, v přítomnosti ředidla a popřípadě v přítomnosti katalyzátoru, načež se získaná sloučenina vzorce I popřípadě převede působením kyseliny na adiční sůl s kyselinou.

Sloučeniny obecného vzorce I se mohou vyrábět také tím, že se oxim shora definovaného obecného vzorce II nechá reagovat s karbamoylhalogenidem obecného vzorce IV



v němž

R^4 a R^5 mají shora uvedený význam a

X znamená halogen,

v přítomnosti ředidla a činidla vázajícího kyselinu, načež se popřípadě získaná sloučenina vzorce I převede působením kyseliny na adiční sůl s kyselinou.

V dalším textu bude tento druhý způsob výroby sloučenin obecného vzorce I označován jako postup b), zatímco postup podle vynálezu bude označován jako postup a).

Výraz "alkyl" zahrnuje - pokud není výslovně definován jiným způsobem - jak přímé, tak i rozvětvené uhlovodíkové zbytky s 1 až 5 atomy uhlíku, jako je skupina metylová, etylová, propylová, isopropylová apod. To platí také pro zbytky, které obsahují alkylové skupiny, jako je alkylkarbonylová skupina a halogenem substituovaná alkylkarbonylová skupina. Výraz "alkenyl" zahrnuje jak přímé, tak i rozvětvené uhlovodíkové zbytky se 2 až 5 atomy uhlíku. Jako příklady lze uvést: skupinu vinylovou, skupinu allylovou, skupinu butenylovou a skupinu pentenylovou. Výraz "halogen" zahrnuje čtyři atomy halogenu fluor, chlor, brom a jód, pokud není výslovně uvedeno jinak.

Jako adiční soli sloučenin vzorce I s kyselinami, které však ve srovnání s bázemi vzorce I mají menší význam, přicházejí v úvahu fyziologicky použitelné soli. K těm náleží výhodně soli sloučenin vzorce I s halogenvodíkovými kyselinami, jako například s chlorovodíkovou kyselinou a bromovodíkovou kyselinou, dále s fosforečnou kyselinou, dusičnou kyselinou, dále s jednosytnými a dvojsytnými karboxylovými kyselinami a hydroxykarboxylovými kyselinami, jako s octovou kyselinou, maleinovou kyselinou, jantarovou kyselinou, fumarovou

kyselinou, vinnou kyselinou, citrónovou kyselinou, salicylovou kyselinou, sorbovou kyselinou a mléčnou kyselinou, a konečně se sulfonovou kyselinou, jako s 1,5-naftalendisulfonovou kyselinou.

Vynález se týká také syn- a anti-forem sloučenin vzorce I.

Sloučeniny vzorce I, v němž R^1 , R^2 a R^3 znamenají alkylovou skupinu s 1 až 3 atomy uhlíku, jsou výhodné.

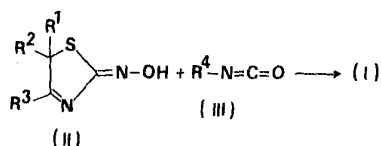
Dále jsou výhodné sloučeniny vzorce I, v němž R^4 znamená alkylovou skupinu s 1 až 3 atomy uhlíku a R^5 znamená vodík.

Zvláště výhodnými sloučeninami jsou:

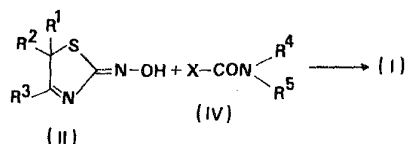
2-oxo-4,5,5-trimetyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim,
2-oxo-4,5-dimetyl-5-etyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim a
2-oxo-4,5-dietyl-5-metyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim.

Průběh reakce se dá při použití zmíněných oximů vzorce II, isokyanátů vzorce III a karbamoylhalogenidů vzorce IV jako výchozích látek znázornit následujícím reakčním schématem:

varianta a):

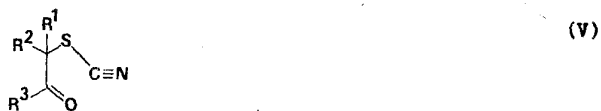


varianta b):



Oximy používané jako výchozí látky jsou definovány vzorcem II. Ve vzorci II znamenají symboly R^1 , R^2 a R^3 výhodně přímou nebo rozvětvenou alkylovou skupinu s 1 až 3 atomy uhlíku.

Oximy vzorce II nebyly dosud známy. Mohou se však vyrábět jednoduchým způsobem tím, že se alfa-thiokyanatoketon obecného vzorce V



v němž

R^1 , R^2 a R^3 mají shora uvedený význam,

uvádí v reakci s hydroxylaminem v přítomnosti rozpouštědla, výhodně alkoholu, popřípadě vodného alkoholu, při teplotách mezi 5 a 100 °C, výhodně mezi 25 a 40 °C. Přitom se hydroxylamin používá výhodně ve formě soli, zejména ve formě hydrochloridu, v přítomnosti činidla vázajícího kyselinu, jako například kyselého uhličitanu sodného nebo octanu sodného.

Isolace sloučenin vzorce II se provádí tím, že se pevná látka vznikající během reakce digeruje po oddestilování rozpouštědla s vodou, odfiltruje se, vysuší se a popřípadě se překrytaluje nebo se vyjme vhodným rozpouštědlem, roztok se promyje vodou, vysuší se síranem sodným a po oddestilování rozpouštědla se zbytek překrytaluje nebo se čistí chromatograficky.

Alfa-thiokyanatomy vzorce V, které se používají jako výchozí látky, jsou zčásti známé a dají se vyrábět obvyklými postupy, například výměnou atomu halogenu v alfa-halogenketonu thiokyanatovou skupinou působením rhodanidů kovů ve vhodném rozpouštědle, jako je například aceton nebo dimetylformamid. Potřebné alfa-halogenatomy jsou zčásti známé a mohou se vyrábět obvyklými postupy, jako například halogenací karbonylových sloučenin působením bromu v dioxanu nebo působením N-bromosukcinimidu v tetrachlormetanu.

Isokyanáty, popřípadě karbamoylhalogenidy, které jsou nutné jako výchozí látky pro postup podle vynálezu, jsou obecně definovány vzorci III, popřípadě IV. V těchto vzorcích znamená symbol R^4 výhodně alkylovou skupinu s 1 až 3 atomy uhlíku. R^5 znamená výhodně vodík nebo alkylovou skupinu s 1 až 3 atomy uhlíku, zejména metylovou skupinu.

Isokyanáty vzorce III jsou známé nebo se dají vyrobit obecně obvyklými a známými postupy, například reakcí aminů s fosgenem a následujícím zahříváním.

Karbamoylhalogenidy vzorce IV jsou známé nebo se dají vyrábět obecně obvyklými a známými postupy, například reakcí aminů s fosgenem.

Jako ředidla přicházejí pro reakci podle varianty a) v úvahu výhodně všechna inertní organická rozpouštědla. K těm náleží výhodně étery jako 1,2-dimethoxyetan, tetrahydrofuran nebo dioxan, ketony jako dietylketon, zejména aceton a metyletylketon, nitrily jako propionitril, zejména acetonitril, formamidy jako zejména dimetylformamid a halogenované uhlovodíky jako metylenchlorid, tetrachlormetan nebo chloroform.

Jako katalyzátory se mohou při postupu a) používat výhodně: terciární báze jako triethylamin, pyridin, 1,4-diazabicyklo[2,2,2]oktan a organické sloučeniny cínu jako dibutylcindiacetát.

Reakční teploty se mohou při provádění postupu podle varianty a) měnit v širokém rozsahu. Obecně se pracuje při teplotách mezi 0 a 100 °C, výhodně mezi 30 a 85 °C. Za přítomnosti rozpouštědla se pracuje účelně při teplotě varu dotyčného rozpouštědla.

Při provádění postupu podle varianty a) se pracuje výhodně za použití nadbytku isokyanátu. Za účelem izolace sloučenin vzorce I se rozpouštědlo oddestiluje a zbytek se zpracuje podle obvyklých metod.

Pro provádění postupu podle varianty b) přicházejí jako ředidla v úvahu výhodně všechna inertní organická rozpouštědla. K těm náleží výhodně rozpouštědla uvedená při variantě postupu a).

Reakce podle varianty postupu b) se provádí v přítomnosti činidla vázajícího kyselinu. Přidávat lze všechna obvykle použitelná anorganická a organická činidla k vázání kyselin. K těm náleží výhodně uhličitany alkalických kovů, jako například uhličitany sodný, uhličitany draselný a kyselý uhličitany sodný. Dále nižší terciární alkylaminy, cykloalkylaminy nebo arylalkylaminy, jako například triethylamin a dimethylbenzylcyklohexylamin, dále pyridin a diazabicyklo[2,2,2]oktan.

Reakční teploty při provádění reakce podle varianty b) se mohou měnit v širokém rozsahu. Obecně se pracuje při teplotách mezi 0 a 100 °C, výhodně mezi 0 a 40 °C.

Při provádění postupu b) se používá výhodně na 1 mol sloučeniny vzorce II 1 až 2 mol

karbamoylhalogenidu vzorce IV. Ukázalo se účelným přidávat činidlo vázající kyselinu v mírném nadbytku (až do asi 30 % hmotnostních). Izolace sloučenin vzorce I se provádí obvyklým způsobem.

Převedení získané sloučeniny vzorce I na adiční sůl s kyselinou působením kyseliny se provádí o sobě známým způsobem.

Sloučeniny vzorce I jsou zcela obecně použitelné jako pesticidy. Tyto sloučeniny jsou cenné zejména při potírání hmyzu, roztočů a nematodů, zejména těch, které náleží do následujících čeledí.

brouci (Coleoptera), jako například

Epilachna spec.,
mandelinka bramborová (Leptinotarsa decemlineata),
květopas (Anthonomus spec.),
Conotrachelus nenuphar,
kohoutek (Lema spec.),
Lissorhoptrus cryzaeophilus,
Phyllotreta spec.,
dřepčík olejkový (Psylliodes chrysocephala),
blýskáček řepkový (Meligethes aeneus),
krytonosec šešulový (Ceutorrhynchus assimilis),
kovařík (Agriotes spec.),
chroust obecný (Melolontha melolontha),
Diabrotica spec.,

motýli (Lepidoptera), jako například

Laspeyresia spec.,
Adoxophyes orana,
obaleč dubový (Tortrix viridana),
Cheimatobia brumata,
podkopníček ovocný (Lyonetia clerkella),
pídalka podzimní (Operophtera brumata),
klíněnka jabloňová (Lithocolletis blancardella),
Porthetria dispar,
můra zelná (Mamestra brassicae),
osenice polní (Agrotis segetum),
předivka (Plutella spec.),
bělásek zelný (Pieris brassicae),
Choristoneura fumiferana,
šedavka (Heliothis spec.),
Spodoptera spec.,
Pectinophora gossypiella,
Chilo spec.,
Ostrinia nubilalis,
Clysia ambiguella,
Lobesia botrana;

dvoukřídlí (Diptera), jako například

octomilka obecná (*Drosophila melanogaster*),
vrtule (*Ceratitis spec.*),
bzunka ječná (*Oscinella frit*),
Dacus spec.,
vrtule (*Rhagoletis spec.*),
Leatherjacket spec.;

stejnokřídlí (Homoptera),

tj. mšice, jako například
mšice maková (*Aphis fabae*),
mšice broskvoňová (*Myzus persicae*),
a další druhy z těchto skupin,
mšice (*Rhopalosiphon spec.*),
Schizaphis spec.,
Dysaphis spec.,
vlnatka (*Eriosoma spec.*),
kyjatka (*Macrosiphum spec.*),
korovnice (*Adelges spec.*),
kyjatka osenní (*Sitobium avenae*),
kyjatka travní (*Metopolophium dirhodum*),
jakož i štítenkovití, jako například
štítenka (*Aspidiotus spec.*),
puklice (*Saissetia spec.*),
štítenka zhoubná (*Quadraspidiotus perniciosus*),
Aonidiella aurantii,
Coccus spec.,
štítenka (*Lepidosaphes spec.*),
Planococcus spec.,
červec (*Pseudococcus spec.*),
puklice (*Ceroplaster spec.*),
perlovec zhoubný (*Icerya purchasi*),
Chrysomphelus spec.,
štítenka (*Parlatoria spec.*),
jakož i cikády, jako například
Nephotettix spec.,
Laodelphax spec.,
Nilaparvata spec.,
Sogatella spec.,
Erythroneura spec.;

molícovití (Aleurodidae), jako například

molice skleníková (*Trialeurodes vaporariorum*),
Dialeurodes spec.,
Aleurothrixus spec.,
Bemisia spec.,
molice (*Aleurodes spec.*),
kromě toho dále druhy *Trips* a štěnice;

roztoči (Acarina), jako například

sviluška obecná (*Tetranychus urticae*),
sviluška (*Panonychus ulmi*) a
další druhy Tetranychidae,
roztočik (*Tarsonemidae*), jako
Steneotarsonemus spec.,
Tenuipalpidae, jako
Brevipalpus,
vlnovníkovití (*Eriophyidae*), jako
Phyllocopturata oleivora,
Aceria sheldoni,
vlnovník (*Eriophyes spec.*),
Aceria spec.,
dále klíšťata;

hlístice (Nematoda), jako například

volně žijící hlístice (kromě jiných
háďátka (*Pratylenchus spec.*), jako
například *Pratylenchus penetrans*),
hlístice parazitující na listech
(kromě jiných háďátka /*Aphelenchoides*/),
hlístice parazitující na kořenech
(kromě jiných *Meloidogyne spec.*, jako
Meloidogyne incognita, *Globodera spec.*,
jako *Globodera rostochiensis*).

Účinné látky podle vynálezu se mohou převádět na obvyklé prostředky jako jsou roztoky, emulze, suspenze, prášky, pasty a granuláty. Tyto prostředky se vyrábějí známým způsobem, například smísením účinných látek s nosnými látkami, tj. s kapalnými rozpouštědly, s plyny nacházejícími se v kapalném stavu pod tlakem nebo/a pevnými nosnými látkami, popřípadě za použití povrchově aktivních činidel, tedy emulgátorů nebo/a dispergátorů. V případě použití vody jako nosné látky se mohou jako pomocná rozpouštědla používat také organická rozpouštědla. Jako kapalná rozpouštědla přicházejí v podstatě v úvahu: aromatické uhlovodíky jako xylén, toluén, benzen a alkylnaftaleny, chlorované aromatické uhlovodíky a chlorované alifatické uhlovodíky jako chlorbenzeny, chloretyleny a metylenchlorid, alifatické uhlovodíky jako cyklohexan a parafiny, jako například ropné frakce, alkoholy jako butanol a glykol, jakož i jejich étery a estery, ketony jako aceton, metyletylketon, metylisobutylketon a cyklohexanon, silně polární rozpouštědla jako dimetylformamid a dimetylsulfoxid, jakož i voda.

Zkapalněnými plynnými nosnými látkami jsou míněny takové kapaliny, které jsou při normální teplotě a za normálního tlaku plynné, jako jsou například aerosolové propelanty jako halogenované uhlovodíky, například freon. Jako pevné nosné látky přicházejí v úvahu přírodní kamenné moučky jako kaolín, jíly, mastek, křída, křemen, attapulgit, montmorillonit a diatomit a syntetické kamenné moučky jako vysocedisperzní kyselina křemičitá, kysličník hlinitý a křemičitany. Jako emulgátory přicházejí v úvahu neionogenní a anionické emulgátory jako polyoxyetylenestery mastných kyselin, polyoxyetylenétery mastných alkoholů jako například alkylarylpolyglykolétery, alkylsulfonáty, alkylsulfáty a arylsulfonáty a jako dispergátory, například lignin, sulfitové odpadní louhy a metylcelulóza.

Účinné látky podle vynálezu mohou být v uvedených prostředcích přítomny ve směsi s dalšími známými účinnými látkami. Prostředky obsahují obecně mezi 0,1 a 95 % hmotnostní-

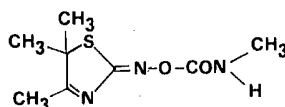
mi účinné látky, výhodně mezi 0,5 a 40 procenty hmotnostními účinné látky. Účinné látky se mohou používat jako takové, ve formě koncentrátů nebo ve formě aplikačních forem připravených z těchto koncentrátů, jako jsou přímo upotřebitelné roztoky, emulze, pěny, suspenze, prášky, pasty, rozpustné prášky, popraše a granuláty. Aplikace se provádí obvyklým způsobem, například postřikem, rozstřikováním, zamlžováním, poprašováním, posypem, zapracováním do půdy, vykuřováním, zaléváním, mořením nebo inkrustací.

Koncentrace účinných látek v přímo aplikovatelných formách se mohou měnit v širokém rozmezí. Obecně se pohybují mezi 0,0001 a 10 % hmotnostními, výhodně mezi 0,01 a 1 % hmotnostními.

Účinné látky se mohou také s dobrým výsledkem používat takzvaným ULV postupem (Ultra-Low-Volume), přičemž je možné aplikovat prostředky obsahující až 95 % účinné látky nebo dokonce samotnou 100 % účinnou látku.

Dobrý účinek vůči hmyzu, nematodům a roztočům, škodícím rostlinám, vyplývá z následujících příkladů, přičemž bylo jako pokusného hmyzu používáno mšic, cikád, svlušek a dalších škůdců.

V následujících příkladech je sloučenina vzorce



označována jako sloučenina A.

Příklad 1

Test na mandelinku bramborovou (*Leptinotarsa decemlineata*)

metoda: larvicidní test na kruhových výřezech listů

Kruhové výřezy listů brambor se postřikají roztokem účinných látek v acetonu. Každý kruhový výřez se obsadí 5 čerstvě svléknutými larvami mandelinky bramborové v prvním larválním stadiu. Listy se inkubují při teplotě 25 °C a při 60 % relativní vlhkosti vzduchu a po 2 dnech se jako potrava podají 2 neošetřené kruhové výřezy na 1 pokus. Neošetřené a acetonem ošetřené kruhové výřezy listů slouží jako kontrola. Trvání testu: 4 dny. Výsledky se vyjadřují jako procentuální snížení počtu přežitých larev ve srovnání s neošetřenou kontrolou.

účinná látka	dávka (10^{-x} g účinné látky/cm ²)	účinek v %
sloučenina A	x = 5	100
	6	100
	7	100
	8	0

(Neošetřená kontrola: 5 % mortalita)

Výsledky testu dosažené za použití dalších sloučenin podle vynálezu:

účinná látka (10 ^{-x} g účinné látky/cm ²)	dávka	x = 5 účinek v %	6
2-oxo-4,5,5-trimetyl-3-thiazolin-0-(dimetylkarbamoyl)oxim		100	80
2-oxo-4-etyl-5,5-dimetyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim		100	100
2-oxo-4-isopropyl-5,5-dimetyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim		100	95
2-oxo-4,5,5-trimetyl-3-thiazolin-0-(etylkarbamoyl)oxim		100	100
2-oxo-4-fenyl-5,5-dimetyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim		100	95
2-oxo-4,5,5-trimetyl-3-thiazolin-0-(isopropylkarbamoyl)oxim		100	68
2-oxo-4,5,5-trimetyl-3-thiazolin-0-(cyklopropylkarbamoyl)oxim		100	100
2-oxo-4,5,5-trimetyl-3-thiazolin-0-(cyklobutylkarbamoyl)oxim		100	89
2-oxo-4-propyl-5,5-dimetyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim		100	100
2-oxo-4-cyklohexyl-5,5-dimetyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim		100	100
2-oxo-4,5-dimetyl-5-etyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim		100	100
2-oxo-4,5-dietyl-5-metyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim		100	100
2-oxo-4,5-dimetyl-5-propyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim		100	100
2-oxo-4-propyl-5-etyl-5-metyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim		100	100
2-oxo-4-butyl-5,5-dimetyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim		100	100
2-oxo-4,5-dimetyl-5-isobutyl-3-thiazolin-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)-oxim		100	100
2-oxo-4,5-dimetyl-5-pentyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim		100	26
2-oxo-4-(p-chlorfenyl)-5,5-dimetyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim		100	100
2-oxo-4,5-dimetyl-5-butyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim		100	100
2-oxo-4,5,5-trimetyl-3-thiazolin-0-(metyl/acetyl/karbamoyl)oxim		100	100
2-oxo-4,5-dimetyl-5-etyl-3-thiazolin-0-(metyl/acetyl/karbamoyl)oxim		100	100
Metomyl(2-metylthioacetaldehyd-0-/metylkarbamoyl)oxim		100	17
neošetřené kontrolní parcely: 5 % mortalita			

Příklad 2

Test na svilušku snovací (Tetranychus urticae)

metoda: ovicidní test na kruhových výřezích listů

Kruhové výřezy z listů keříčkového fazolu se obsadí 10 adulty samičky svilušky snovací. Po 1 dni se samičky odstraní a kruhové výřezy listů se 70 až 100 vajíčky se postříkají roztokem účinné látky v acetonu. Ošetřené kruhové výřezy se potom položí na vlhkou pěnovitou hmotu a inkubují se při teplotě 25 °C a při 60% relativní vlhkosti vzduchu. Neošetřené a acetonem ošetřené kruhové výřezy listů slouží jako kontrola. Trvání testu: 6 dnů. Výsledky se vyjadřují jako procentuální snížení vylíhnutých vajíček.

účinná látka	dávka (10^{-x} g účinné látky/cm ²)	účinek v %
sloučenina A	x = 5	100
	6	100
	7	44

(Neošetřená kontrola: 3% mortalita vajíček)

Výsledky testu dosažené za použití dalších sloučenin podle vynálezu:

účinná látka	dávka (10^{-x} g účinné látky/cm ²)	x = 5 účinek v %	6
2-oxo-4,5,5-trimetyl-3-thiazolin-0-(dimetylkarbamoyl)oxim		100	2
2-oxo-4-etyl-5,5-dimetyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim		100	100
2-oxo-4-isopropyl-5,5-dimetyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim		100	100
2-oxo-4,5,5-trimetyl-3-thiazolin-0-(etylkarbamoyl)oxim		100	93
2-oxo-4-fenyl-5,5-dimetyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim		92	5
2-oxo-4,5,5-trimetyl-3-thiazolin-0-(isopropylkarbamoyl)oxim		100	27
2-oxo-4,5,5-trimetyl-3-thiazolin-0-(cyklopropylkarbamoyl)oxim		100	100
2-oxo-4,5,5-trimetyl-3-thiazolin-0-(cyklobutylkarbamoyl)oxim		100	1
2-oxo-4-propyl-5,5-dimetyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim		100	100
2-oxo-4-cyklohexyl-5,5-dimetyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim		100	35
2-oxo-4,5-dimetyl-5-etyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim		100	100
2-oxo-4,5-dietyl-5-metyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim		100	100
2-oxo-4,5-dimetyl-5-propyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim		100	100
2-oxo-4-propyl-5-etyl-5-metyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim		100	100
2-oxo-4-butyl-5,5-dimetyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim		100	100
2-oxo-4,5-dimetyl-5-isobutyl-3-thiazolin-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)-oxim		100	100
2-oxo-4,5-dimetyl-5-pentyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim		100	100
2-oxo-4-(p-chlorfenyl)-5,5-dimetyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim		22	17
2-oxo-4,5-dimetyl-5-butyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim		100	100
2-oxo-4,5-dimetyl-5-(3-metyl-2-pentenyl)-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)-oxim		100	98
2-oxo-4,5,5-trimetyl-3-thiazolin-0-(metyl/acetyl/karbamoyl)oxim		100	8
2-oxo-4,5-dimetyl-5-etyl-3-thiazolin-0-(metyl/acetyl/karbamoyl)oxim		100	67
Metomyl(2-metylthioacetaldehyd-0-/metylkarbamoyl/oxim)		100	0

neošetřené kontrolní parcely: 3% mortalita vajíček

P ř í k l a d 3

Test na mouchu domácí (*Musca domestica*)

metoda: test na stálost vůči ultrafialovému záření na skle (síla účinných látek se vedle účinku po 72 hodinách předběžné inkubace za ozáření ultrafialovým světlem, zjišťuje také srovnáním s variantou bez předběžné inkubace).

Dna Petriho misek (o průměru 9 cm) se ošetří roztokem účinné látky v acetonu a po dobu 72 hodin se za ozáření ultrafialovým světlem (Philips TOA 40 W/05) předběžně inkubují při teplotě 28 °C a při 60% relativní vlhkosti vzduchu. Po této době se každá Petriho miska obsadí 10 samičkami mouchy domácí (o stáří 4 až 5 dnů) a pokusné exempláře se inkubují při teplotě 25 °C a při 60% relativní vlhkosti vzduchu. Neošetřené a acetonem ošetřené Petriho misky slouží jako kontrola. Doba trvání pokusu: 72 hodin (za ozáření ultrafialovým světlem) a 24 hodin (po použití pokusného hmyzu). Výsledky se vyjadřují jako procentuální snížení počtu přežívajících exemplářů pokusného hmyzu ve srovnání s neošetřenou kontrolou.

účinná látka	dávka (10-x g účinné látky na 1 cm ²)	účinek v % (po 72 hodinách předběžné inkubace za ozáření ultra- fialovým světlem)	účinek v % (bez předběžné inkubace)
sloučenina A	x = 5	100	100
	6	100	100
	7	0	95
	8		2

(Neošetřená kontrola: mortalita 0 %)

Způsob výroby sloučenin vzorce I je ilustrován v následujících příkladech 4 až 25.

P ř í k l a d 4

[varianta postupu a)]

15,8 g (0,1 mol) 2-oxo-4,5,5-trimetyl-3-thiazolinoximu a 8,5 g (0,15 mol) metylisokyanátu se rozpustí ve 100 ml bezvodého dichlormetanu. K tomuto roztoku se přidá několik kapek triethylaminu. Směs se po krátké době zahřeje na 40 až 45 °C, popřípadě se krátkou dobu zahřívá na 50 až 60 °C. Potom se rozpouštědlo oddestiluje ve vakuu. Zbytek se rozpustí v horkém etylacetátu, přidá se aktivní uhlí, směs se zfiltruje a horký filtrát se zahustí na objem 20 až 30 ml a ke zbytku se přidá 20 až 30 ml hexanu. Vyloučené krystaly se odfiltrují, promyjí se éterem a vysuší se. Získá se 2-oxo-4,5,5-trimetyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim, teplota tání 123 až 125 °C.

P ř í k l a d 5

[varianta postupu b)]

15,8 g (0,1 mol) 2-oxo-4,5,5-trimetyl-3-thiazolinoxim a 15,2 g (0,15 mol) triethylaminu se rozpustí ve 100 ml bezvodého 1,2-dimetoxyetanu a k tomuto roztoku se přikape 16,1 g (0,15 mol) dimetylkarbamoylchloridu. Směs se zahřívá 3 hodiny k varu pod zpětným chladičem a potom se rozpouštědlo oddestiluje ve vakuu. Zbytek se rozpustí ve 100 ml tri-chlormetanu, získaný roztok se promyje vodou, organická fáze se vysuší síranem sodným a rozpouštědlo se oddestiluje. Zbytek se chromatograficky čistí na silikagelu (rozpouštědlo-

vý systém směs éteru a dichlormetanu 9:1). Získá se 2-oxo-4,5,5-trimetyl-3-thiazolin-0-(dimetylkarbamoyl)oxim. Teplota tání 108 až 110 °C.

P ř í k l a d 6

Analogickým postupem jako je popsán v příkladu 4 se nechá reagovat 2-oxo-4-etyl-5,5-dimetyl-3-thiazolinoxim s metylisokyanátem. Získá se 2-oxo-4-etyl-5,5-dimetyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim. Teplota tání 98 až 100 °C. Výchozí látka: 2-metyl-2-thiokyanato-3-pentanon, teplota varu 56 až 58 °C/4 Pa. 2-oxo-4-etyl-5,5-dimetyl-3-thiazolinoxim. Teplota tání 178 až 180 °C.

P ř í k l a d 7

Analogickým způsobem jako je popsán v příkladu 4 se nechá reagovat 2-oxo-4-isopropyl-5,5-dimetyl-3-thiazolinoxim s metylisokyanátem. Získá se 2-oxo-4-isopropyl-5,5-dimetyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim. Teplota tání 89 až 91 °C. Výchozí látka: 2,4-dimetyl-2-thiokyanato-3-pentanon, teplota varu 64 až 66 °C/2,7 Pa. 2-oxo-4-isopropyl-5,5-dimetyl-3-thiazolinoxim, teplota tání 220 až 222 °C.

P ř í k l a d 8

Analogickým postupem jako je popsán v příkladu 4 se nechá reagovat 2-oxo-4,5,5-trimetyl-3-thiazolinoxim s etylisokyanátem. Získá se 2-oxo-4,5,5-trimetyl-3-thiazolin-0-(etylkarbamoyl)oxim. Teplota tání 84 až 86 °C.

P ř í k l a d 9

Analogickým postupem jako je popsán v příkladu 4 se nechá reagovat 2-oxo-4-fenyl-5,5-dimetyl-3-thiazolinoxim s metylisokyanátem. Získá se 2-oxo-4-fenyl-5,5-dimetyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim. Teplota tání 135 až 137 °C. Výchozí látka: 2-metyl-1-fenyl-2-thiokyanato-1-propanon. Teplota varu 98 až 100 °C/2,7 Pa. 2-oxo-4-fenyl-5,5-dimetyl-3-thiazolinoxim. Teplota tání 147 až 149 °C.

P ř í k l a d 10

Analogickým postupem jako je popsán v příkladu 4 se nechá reagovat 2-oxo-4,5,5-trimetyl-3-thiazolinoxim s isopropylisokyanátem. Získá se 2-oxo-4,5,5-trimetyl-3-thiazolin-0-(isopropylkarbamoyl)oxim. Teplota tání 114 až 116 °C.

P ř í k l a d 11

Analogickým postupem jako je popsán v příkladu 4 se nechá reagovat 2-oxo-4,5,5-trimetyl-3-thiazolinoxim s cyklopropylisokyanátem. Získá se 2-oxo-4,5,5-trimetyl-3-thiazolin-0-(cyklopropylkarbamoyl)oxim. Teplota tání 86 až 89 °C.

P ř í k l a d 12

Analogickým postupem jako je popsán v příkladu 4 se nechá reagovat 2-oxo-4,5,5-trimetyl-3-thiazolinoxim s cyklobutylisokyanátem. Získá se 2-oxo-4,5,5-trimetyl-3-thiazolin-0-(cyklobutylkarbamoyl)oxim. Teplota tání 94 až 96 °C.

P ř í k l a d 13

Analogickým způsobem jako je popsán v příkladu 4 se nechá reagovat 2-oxo-4-propyl-5,5-dimetyl-3-thiazolinoxim s metylisokyanátem. Získá se 2-oxo-4-propyl-5,5-dimetyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim. Teplota tání 112 až 114 °C. Výchozí látka: 2-oxo-4-propyl-5,5-dimetyl-3-thiazolinoxim. Teplota tání 145 až 147 °C.

P ř í k l a d 14

Analogickým postupem jako je popsán v příkladu 4 se nechá reagovat 2-oxo-4-cyklohexyl-5,5-dimetyl-3-thiazolinoxim s metylisokyanátem. Získá se 2-oxo-4-cyklohexyl-5,5-dimetyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim. Teplota tání 158 až 160 °C. Výchozí látka 2-oxo-4-cyklohexyl-5,5-dimetyl-3-thiazolinoxim. Teplota tání 159 až 162 °C.

P ř í k l a d 15

Analogickým postupem jako je popsán v příkladu 4 se nechá reagovat 2-oxo-4,5-dimetyl-5-etyl-3-thiazolinoxim s metylisokyanátem. Získá se 2-oxo-4,5-dimetyl-5-etyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim. Teplota tání 115 až 117 °C. Výchozí látka: 2-oxo-4,5-dimetyl-5-etyl-3-thiazolinoxim. Teplota tání 143,5 až 144,5 °C.

P ř í k l a d 16

Analogickým postupem jako je popsán v příkladu 4 se nechá reagovat 2-oxo-4,5-dietyl-5-metyl-3-thiazolinoxim s metylisokyanátem. Získá se 2-oxo-4,5-dietyl-5-metyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim. Teplota tání 88 až 90 °C. Výchozí látka: 2-oxo-4,5-dietyl-5-metyl-3-thiazolinoxim. Teplota tání 125 až 128 °C.

P ř í k l a d 17

Analogickým postupem jako je popsán v příkladu 4 se nechá reagovat 2-oxo-4,5-dimetyl-5-propyl-3-thiazolinoxim s metylisokyanátem. Získá se 2-oxo-4,5-dimetyl-5-propyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim. Teplota tání 66 až 69 °C. Výchozí látka: 2-oxo-4,5-dimetyl-5-propyl-3-thiazolinoxim. Teplota tání 94 až 96 °C.

P ř í k l a d 18

Analogickým postupem jako je popsán v příkladu 4 se nechá reagovat 2-oxo-4-propyl-5-etyl-5-metyl-3-thiazolinoxim s metylisokyanátem. Získá se 2-oxo-4-propyl-5-etyl-5-metyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim. Teplota tání 124 až 126 °C. Výchozí látka 2-oxo-4-propyl-5-etyl-5-metyl-3-thiazolinoxim. Teplota tání 132 až 135 °C.

P ř í k l a d 19

Analogickým postupem jako je popsán v příkladu 4 se nechá reagovat 2-oxo-4-butyl-5,5-dimetyl-3-thiazolinoxim s metylisokyanátem. Získá se 2-oxo-4-butyl-5,5-dimetyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim. Teplota tání 128 až 130 °C. Výchozí látka: 2-oxo-4-butyl-5,5-dimetyl-3-thiazolinoxim. Teplota tání 117 až 119 °C.

P ř í k l a d 20

Analogickým postupem jako je popsán v příkladu 4 se nechá reagovat 2-oxo-4,5-dimethyl-5-isobutyl-3-thiazolinoxim s metylisokyanátem. Získá se 2-oxo-4,5-dimethyl-5-isobutyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim. Teplota tání 99 až 101 °C. Výchozí látka: 2-oxo-4,5-dimethyl-5-isobutyl-3-thiazolinoxim. Teplota tání 105 až 107 °C.

P ř í k l a d 21

Analogickým postupem jako je popsán v příkladu 4 se nechá reagovat 2-oxo-4,5-dimethyl-5-pentyl-3-thiazolinoxim s metylisokyanátem. Získá se 2-oxo-4,5-dimethyl-5-pentyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim ve formě viskózního kapalného oleje. $n_D^{44,5}$: 1,5256. Výchozí látka: 2-oxo-4,5-dimethyl-5-pentyl-3-thiazolinoxim. Teplota tání 104 až 106 °C.

P ř í k l a d 22

Analogickým postupem jako je popsán v příkladu 4 se nechá reagovat 2-oxo-4-(p-chlorfenyl)-5,5-dimethyl-3-thiazolinoxim s metylisokyanátem. Získá se 2-oxo-4-(p-chlorfenyl)-5,5-dimethyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim. Teplota tání 147 až 149 °C. Výchozí látka: 2-oxo-4-(p-chlorfenyl)-5,5-dimethyl-3-thiazolinoxim. Teplota tání 205 až 207 °C.

P ř í k l a d 23

Analogickým postupem jako je popsán v příkladu 4 se nechá reagovat 2-oxo-4,5-dimethyl-5-butyl-3-thiazolinoxim s metylisokyanátem. Získá se 2-oxo-4,5-dimethyl-5-butyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim ve formě hustého kapalného oleje. $n_D^{44,5}$: 1,5324. Výchozí látka: 2-oxo-4,5-dimethyl-5-butyl-3-thiazolinoxim. Teplota tání 100 až 102 °C.

P ř í k l a d 24

Analogickým postupem jako je popsán v příkladu 4 se nechá reagovat 2-oxo-4,5-dimethyl-5-(3-methyl-2-pentenyl)-3-thiazolinoxim s metylisokyanátem. Získá se 2-oxo-4,5-dimethyl-5-(3-methyl-2-pentenyl)-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oxim ve formě velmi viskózního oleje, n_D^{20} : 1,5424.

3-brom-3,6-dimethyl-5-okten-2-on, který je nutný jako výchozí látka, se může vyrobit následujícím způsobem:

Předloží se 5 g 3,6-dimethyl-5-okten-2-onu a přikape se roztok 18,5 g 2-karboxyetyltri-fenylfosfoniumpribromidu ve 30 ml tetrahydrofuranu. Potom se nechá reakční směs míchat přes noc. Nerozpustný bromid se odfiltruje, filtrát se vylíje na 5% vodný roztok uhličitanu sodného a dvakrát se provede extrakce éterem. Extrakty se promyjí vodou a roztokem chloridu sodného, vysuší se síranem sodným a odpaří se. Zbytek se destiluje v límcové baňce při 60 °C/8 Pa. Získá se surový 3-brom-3,6-dimethyl-5-okten-2-on, který se postupem popsáním dále v příkladu 26 nechá reagovat na rhodanid a dále na 2-oxo-4,5-dimethyl-5-(3-methyl-2-pentenyl)-3-thiazolin-oxim, n_D^{20} : 1,5432.

Příklad 25

7,9 g 2-oxo-4,5,5-trimetyl-3-thiazolinoximu se rozpustí ve 100 ml acetonitrilu. K tomuto roztoku se přidá 6,9 g uhličitanu draselného. Reakční směs se ochladí na 0 °C a za intenzivního míchání se přikape roztok 6,8 g chloridu N-acetyl-N-metylkarbamové kyseliny ve 25 ml acetonitrilu. Po přidání se lázeň s ledem odstraní a reakční směs se míchá po dobu 2 hodin při teplotě místnosti. Za účelem zpracování se reakční směs zfiltruje a filtrát se zahustí na rotační odparce. Zbytek se vylíje do polonasyceného roztoku chloridu sodného a třikrát se extrahuje etylacetátem. Tyto extrakty se promyjí polonasyceným roztokem chloridu sodného a nasyceným roztokem chloridu sodného, vysuší se síranem sodným a odpaří se. Krystalizací ze směsi hexanu a etylacetátu se získá čistý 2-oxo-4,5,5-trimetyl-3-thiazolin-0-(metyl/acetyl/karbamoyl)oxim. Teplota tání 119 až 124 °C.

Analogicky podle shora popsaného postupu se nechá reagovat 2-oxo-4,5-dimetyl-5-etyl-3-thiazolinoxim s chloridem N-acetyl-N-metylkarbamové kyseliny. Získá se 2-oxo-4,5-dimetyl-5-etyl-3-thiazolin-0-(metyl/acetyl/karbamoyl)oxim o teplotě tání 98 až 101 °C.

Příklad 26

2-oxo-4,5,5-trimetyl-3-thiazolinoxim, který se používá jako výchozí látka v příkladech 4, 5, 8, 10 až 12 a 25, se může vyrobit následujícím způsobem:

16,5 g (0,1 mol) 3-brom-3-metyl-2-butanonu a 11,6 g (0,12 mol) rhodanidu sodného se zahřívá ve 150 ml bezvodého acetonu 1 až 2 hodiny k varu pod zpětným chladičem. Po ochlazení se vyloučený bromid draselný odfiltruje, promyje se malým množstvím acetonu a odpaří se ve vakuu k suchu. Zbytek se vyjme 200 ml éteru, éterický roztok se třikrát promyje 100 ml vody, éterická fáze se vysuší síranem sodným a odpaří se ve vakuu k suchu. Surový produkt se frakcionuje na krátké Vigreuxově koloně. Získá se 3-metyl-3-thiokyanato-2-butanon. Teplota varu 52 °C/5,3 Pa.

8,3 g (0,12 mol) hydroxyaminhydrochloridu se rozpustí v 50 ml vody a k tomuto roztoku se přidá 10,1 g (0,12 mol) kyselého uhličitanu sodného. Tento roztok (pH 6 až 7) se při teplotě místnosti za míchání přidá k roztoku 14,3 g (0,1 mol) 3-metyl-3-thiokyanato-2-butanonu ve 100 ml etanolu. Teplota reakční směsi rychle vystoupí na 37 °C. Potom se reakční směs dále míchá 1 hodinu a při teplotě 50 °C se ve vakuu oddestiluje 120 ml rozpouštědla. Zbytek se třikrát extrahuje vždy 100 ml éteru, organická fáze se promyje malým množstvím vody, vysuší se síranem sodným a zahustí se až k počínající krystalizaci. Po ochlazení se ke krystalické kaši přidá 10 ml hexanu, krystaly se odfiltrují, promyjí se směsí éteru a hexanu (2:1) a vysuší se. Získá se 2-oxo-4,5,5-trimetyl-3-thiazolinoxim. Teplota tání 151 až 153 °C.

Odpovídající výchozí látky v příkladech 6, 7, 9 a 13 až 24 se vyrobí analogickým způsobem, jako je popsán ve shora uvedeném příkladu.

Příklad 27

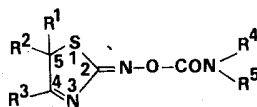
Sloučeniny vzorce I se mohou používat v prostředcích například následujícího složení:

	g/litr
a) Účinná látka	
N-metyl-2-pyrrolidon	250
	500
směsný emulgátor sestávající: z vápenaté soli alkylarylsulfonové kyseliny, alkylfenoletoxylátu, blokového polymeru propylenoxidu a etylenoxidu	

vápenatá sůl dodecylbenzensulfonové kyseliny	25
rozpouštědlo (směs mono-, di- a tri(nižší)alkylbenzenů)	do 1 000 ml
	g/litr
b) účinná látka vzorce I	250
N-metyl-2-pyrrolidon	do 1 000 ml
c) účinná látka vzorce I	50 g
vysocedisperzní kyselina křemičitá	5 g
natriumlaurylsulfát	1 g
natriumligninsulfonát	2 g
kaolin	42 g
	100 g

PŘEDMĚT VYNÁLEZU

1. Insekticidní, akaricidní a nematocidní prostředek, vyznačující se tím, že jako účinnou složku obsahuje alespoň jednu sloučeninu obecného vzorce I



(I)

v němž

R^1 a R^3 znamená alkylovou skupinu s 1 až 5 atomy uhlíku, alkenylovou skupinu se 2 až 5 atomy uhlíku, cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, fenylovou skupinu nebo naftyllovou skupinu, přičemž fenylová nebo naftyllová skupina je popřípadě substituována atomem halogenu,

R^2 znamená alkylovou skupinu s 1 až 5 atomy uhlíku,

R^4 znamená alkylovou skupinu s 1 až 5 atomy uhlíku nebo cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 atomy uhlíku a

R^5 znamená vodík, alkylovou skupinu s 1 až 5 atomy uhlíku, alkylkarbonylovou skupinu se 2 až 6 atomy uhlíku nebo alkylkarbonylovou skupinu se 2 až 6 atomy uhlíku, která je substituována halogenem,

nebo adiční sůl takové sloučeniny s kyselinou, společně s inertní nosnou látkou.

2. Prostředek podle bodu 1, vyznačující se tím, že obsahuje účinné množství alespoň jedné sloučeniny obecného vzorce I, v němž R^1 , R^2 a R^3 znamenají alkylovou skupinu s 1 až 3 atomy uhlíku, a R^4 a R^5 mají význam uvedený v bodě 1, nebo adiční sůl takové sloučeniny s kyselinou, jakož i inertní nosnou látkou.

3. Prostředek podle bodů 1 nebo 2, vyznačující se tím, že obsahuje účinné množství alespoň jedné sloučeniny obecného vzorce I, v němž R^4 znamená alkylovou skupinu s 1 až 3 atomy uhlíku a R^5 znamená vodík, a R^1 , R^2 a R^3 mají význam uvedený v bodě 1 nebo 2 nebo adiční sůl takové sloučeniny s kyselinou, jakož i inertní nosnou látku.

4. Prostředek podle bodu 1, vyznačující se tím, že obsahuje účinné množství 2-oxo-4,5,5-trimetyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oximu, nebo jeho adiční soli s kyselinou, jakož i inertní nosnou látku.

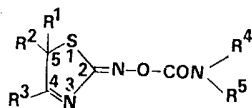
5. Prostředek podle bodu 1, vyznačující se tím, že obsahuje účinné množství 2-oxo-4,5-dimetyl-5-etyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oximu, nebo jeho adiční soli s kyselinou, jakož i inertní nosnou látku.

6. Prostředek podle bodu 1, vyznačující se tím, že obsahuje účinné množství 2-oxo-4,5-dietyl-5-metyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oximu nebo jeho adiční soli s kyselinou, jakož i inertní nosnou látku.

7. Prostředek podle bodu 1, vyznačující se tím, že obsahuje účinné množství alespoň jedné ze sloučenin vybrané ze skupiny tvořené:

2-oxo-4,5,5-trimetyl-3-thiazolin-0-(dimetylkarbamoyl)oximem,
 2-oxo-4-etyl-5,5-dimetyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oximem,
 2-oxo-4-isopropyl-5,5-dimetyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oximem,
 2-oxo-4,5,5-trimetyl-3-thiazolin-0-(etylkarbamoyl)oximem,
 2-oxo-4-fenyl-5,5-dimetyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oximem,
 2-oxo-4,5,5-trimetyl-3-thiazolin-0-(isopropylkarbamoyl)oximem,
 2-oxo-4,5,5-trimetyl-3-thiazolin-0-(cyklopropylkarbamoyl)oximem,
 2-oxo-4,5,5-trimetyl-3-thiazolin-0-(cyklobutylkarbamoyl)oximem,
 2-oxo-4-propyl-5,5-dimetyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oximem,
 2-oxo-4-cyklohexyl-5,5-dimetyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oximem,
 2-oxo-4,5-dimetyl-5-propyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oximem,
 2-oxo-4-propyl-5-etyl-5-metyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oximem,
 2-oxo-4-butyl-5,5-dimetyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oximem,
 2-oxo-4,5-dimetyl-5-isobutyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oximem,
 2-oxo-4,5-dimetyl-5-pentyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oximem,
 2-oxo-4-(p-chlorfenyl)-5,5-dimetyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oximem,
 2-oxo-4,5-dimetyl-5-butyl-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oximem,
 2-oxo-4,5-dimetyl-5-(3-metyl-2-pentenyl)-3-thiazolin-0-(metylkarbamoyl)oximem,
 2-oxo-4,5,5-trimetyl-3-thiazolin-0-(metyl/acetyl/karbamoyl)oximem a
 2-oxo-4,5-dimetyl-5-etyl-3-thiazolin-0-(metyl/acetyl/karbamoyl)oximem.

8. Způsob výroby účinné složky podle bodu 1, obecného vzorce I



(I)

v němž

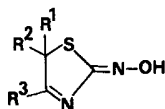
R^1 a R^3 znamenají alkylovou skupinu s 1 až 5 atomy uhlíku, alkenylovou skupinu se 2 až 5 atomy uhlíku, cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, fenylovou skupinu nebo naftyllovou skupinu, přičemž fenylová nebo naftyllová skupina je popřípadě substituována atomem halogenu,

R^2 znamená alkylovou skupinu s 1 až 5 atomy uhlíku,

R^4 znamená alkylovou skupinu s 1 až 5 atomy uhlíku, nebo cykloalkylovou skupinu se 3 až 6 atomy uhlíku a

R^5 znamená vodík, alkylovou skupinu s 1 až 5 atomy uhlíku, alkylkarbonylovou skupinu se 2 až 6 atomy uhlíku nebo alkylkarbonylovou skupinu se 2 až 6 atomy uhlíku, která je substituována halogenem,

jakož i soli těchto sloučenin, vyznačující se tím, že se oxim obecného vzorce II



(II)

v němž

R^1 , R^2 a R^3 mají shora uvedený význam,
nechá reagovat s isokyanátem obecného vzorce III



(III)

v němž

R^4 má shora uvedený význam,

při teplotě mezi 0 a 100 °C v přítomnosti ředidla a popřípadě v přítomnosti katalyzátoru, načež se získaná sloučenina vzorce I popřípadě převede působením kyseliny na adiční sůl s kyselinou.