

A 4"-HELYZETBEN AMINO-SZULFONIL-OXI-SZUBSZTITUENST TARTALMAZÓ
AVERMEKTIN B1-SZÁRMAZÉKOK

SYNGENTA PARTICIPATIONS AG, Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel, Svájc

A bejelentés napja: 2002. 12. 20.

Elsőbbségei: 2001. 12. 21. (CH; 2363/01)

2002. 07. 05. (CH; 1190/02)

A nemzetközi bejelentés száma: PCT/EP02/14671

A nemzetközi közzététel száma: WO 03/053988 A3

K i v o n a t

A találmány (I) általános képletű vegyületekre és azok sóira vonatkozik, amelyek adott és lehetséges esetben E- és Z-izomerek, E/Z izomer-elegyek és/vagy tautomer módosulatok lehetnek - a képletben

R_1 1-12 szénatomos alkil-, 3-8 szénatomos cikloalkil- vagy 2-12 szénatomos alkenilcsoportot jelent,

R_2 hidrogénatomot, adott esetben szubsztituált 1-12 szénatomos alkil-, 2-12 szénatomos alkenil- vagy 2-12 szénatomos alkinilcsoportot vagy $-C(O)R_4$ vagy $-SO_2R_4$ csoportot jelent, és

R_3 hidrogénatomot vagy adott esetben szubsztituált 1-12 szénatomos alkil-, 2-12 szénatomos alkenil- vagy 2-12 szénatomos alkinilcsoportot jelent, vagy

R_2 és R_3 együtt 3-7 tagú alkilén-csoportot vagy 4-7 tagú alkenilén-csoportot képez, amelyekben az alkilén- vagy alkenilén-lánc egyik CH_2 csoportja helyén -O-, -S- vagy $-NR_5$ - csoport állhat, vagy együtt $=N^+=N^-$ csoportot alkotnak.

P 0 4 0 2 2 9 0

Képviselő: Dr.Jalsovszky Györgyné ügyvéd

Társképviselő: Dr.Miskolczi Mária ügyvéd

158/1295

A 4"-HELYZETBEN AMINO-SZULFONIL-OXI-SZUBSZTITUENST TARTALMAZÓ
AVERMEKTIN B1-SZÁRMAZÉKOK

SYNGENTA PARTICIPATIONS AG, Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel, Svájc

Feltaláló:

CASSAYRE Jerome, Syngenta Crop Protection AG, Schwarzwaldallee 215,
CH-4058 Basel, Svájc

A bejelentés napja: 2002. 12. 20.

Elsőbbségei: 2001. 12. 21. (CH; 2363/01)

2002. 07. 05. (CH; 1190/02)

A nemzetközi bejelentés száma: PCT/EP02/14671

A nemzetközi közzététel száma: WO 03/053988 A3

A találmány tárgyát képezik

(1) az (I) általános képletű vegyületek és azok sói, amelyek adott és lehetséges esetben E- és Z-izomerek, E/Z izomer-elegyek és/vagy tautomer módosulatok lehetnek - a képletben

R_1 1-12 szénatomos alkil-, 3-8 szénatomos cikloalkil- vagy 2-12 szénatomos alkenilcsoportot jelent,

R_2 hidrogénatomot, szubsztituálatlan vagy 1-5 szubsztituenst hordozó 1-12 szénatomos alkilcsoportot, szubsztituálatlan vagy 1-5 szubsztituenst hordozó 2-12 szénatomos alkenilcsoportot, szubsztituálatlan vagy 1-5 szubsztituenst hordozó 2-12 szénatomos alkinilcsoportot vagy $-C(O)R_4$ vagy $-SO_2R_4$ csoportot jelent, és

R_3 hidrogénatomot, szubsztituálatlan vagy 1-5 szubsztituenst hordozó 1-12 szénatomos alkilcsoportot, szubsztituálatlan vagy 1-5 szubsztituenst hordozó 2-12 szénatomos alkenilcsoportot vagy szubsztituálatlan vagy 1-5 szubsztituenst hordozó 2-12 szénatomos alkinilcsoportot jelent, vagy

R_2 és R_3 együtt 3-7 tagú alkilén-csoportot vagy 4-7 tagú alkenilén-csoportot képez, amelyekben az alkilén- vagy alkenilén-lánc egyik CH_2 csoportja helyén $-O-$, $-S-$ vagy $-NR_5-$ csoport állhat, vagy együtt $=N^+=N^-$ csoportot alkotnak; mimellett

az R_2 és R_3 csoport meghatározásában szereplő alkil-, alkenil-, alkinil-, alkilén-, alkenilén- és cikloalkil-csoportokhoz adott esetben kapcsolódó szubsztituensek a következők lehetnek: hidroxilcsoport, halogénatom, halogén-(1-2 szénatomos alkil)-csoport, cianocsoport, nitrocsoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport, szubsztituálatlan vagy 1-3 metilcsoporttal szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, norbornilén-csoport, szubsztituálatlan vagy 1-3 metilcsoporttal szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkenil-csoport, halogén-(3-8 szénatomos cikloalkil)-csoport, 1-12 szénatomos alkoxi-, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-, 3-8 szénatomos cikloalkoxi-, halogén-1-12 szénatomos

alkoxi-, (1-12 szénatomos alkil)-tio-, (3-8 szénatomos cikloalkil)-tio-, halogén-(1-12 szénatomos alkil)-tio-, (1-12 szénatomos alkil)-szulfinil-, (3-8 szénatomos cikloalkil)-szulfinil-, halogén-(1-12 szénatomos alkil)-szulfinil-, halogén-(3-8 szénatomos cikloalkil)-szulfinil-, (1-12 szénatomos alkil)-szulfonil-, (3-8 szénatomos cikloalkil)-szulfonil-, halogén-(1-12 szénatomos alkil)-szulfonil-, halogén-(3-8 szénatomos cikloalkil)-szulfonil-, 2-8 szénatomos alkenil-, 2-8 szénatomos alkinil-, -NH(1-6 szénatomos alkil)-, -N(1-6 szénatomos alkil)₂, -C(=O)R₄, -NHC(=O)R₇ vagy -P(=O)(O1-6 szénatomos alkil)₂ csoport; aril-, heterociklil-, aril-oxi- vagy heterociklil-oxi-csoport, amelyekhez adott esetben 1-5 azonos vagy eltérő szubsztituens, éspedig halogénatom, hidroxil-, ciano-, nitro-, 1-12 szénatomos alkil-, 3-8 szénatomos cikloalkil-, halogén-(1-12 szénatomos alkil)-, 1-12 szénatomos alkoxi-, halogén-(1-12 szénatomos alkoxi)-, (1-12 szénatomos alkil)-tio-, halogén-(1-12 szénatomos alkil)-tio-, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-, dimetil-amino-(1-6 szénatomos alkoxi)-, 2-8 szénatomos alkenil-, 2-8 szénatomos alkinil-, fenoxi- vagy fenil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport kapcsolódhat, fenoxicssoport, amelyhez adott esetben 1-3 azonos vagy eltérő szubsztituens, éspedig halogénatom vagy metoxi-, trifluor-metil- vagy trifluor-metoxi-csoport kapcsolódhat, fenil-(1-6 szénatomos alkoxi)-csoport, amelynek aromás gyűrűjéhez adott esetben 1-3 azonos vagy eltérő szubsztituens, éspedig halogénatom vagy metoxi-, trifluor-metil- vagy trifluor-metoxi-csoport kapcsolódhat, továbbá fenil-(2-6 szénatomos alakenil)-, fenil-(2-6 szénatomos alkinil)-, metilén-dioxi-, -C(=O)R₄, -NH-C(=O)R₇, -NH₂, -NH(1-12 szénatomos alkil), -N(1-12 szénatomos alkil)₂, (1-6 szénatomos alkil)-szulfinil-, (3-8 szénatomos cikloalkil)-szulfinil-, halogén-(1-6 szénatomos alkil)-szulfinil-, halogén-(3-8 szénatomos cikloalkil)-szulfinil-, (1-6 szénatomos alkil)-szulfonil-, (3-8 szénatomos cikloalkil)-szulfonil-, halogén-(1-6 szénatomos alkil)-szulfonil- és halogén-(3-8 szénatomos cikloalkil)-szulfonil-csoport;

és a korábban felsorolt képletekben

R₄ jelentése hidrogénatom, hidroxilcsoport, 1-8 szénatomos alkilcsoport, 1-7 halogén-, nitro-, 1-8 szénatomos alkoxi-, hidroxil, merkaptó-, amino-, (1-12 szénatomos alkil)-amino- és/vagy di-(1-12 szénatomos alkil)-amino-szubsztituenst hordozó 1-8 szénatomos alkilcsoport, vagy 1-8 szénatomos alkoxi-, halogén-(1-8 szénatomos alkoxi)-, 3-8 szénatomos cikloalkil-, 3-8 szénatomos cikloalkoxi-, 2-8 szénatomos alkenil-, 2-8 szénatomos alkenil-oxi-, 2-8 szénatomos alkinil-, 2-8 szénatomos alkinil-oxi-, amino-, (1-12 szénatomos alkil)-amino-, di-(1-12 szénatomos alkil)-amino-, aril-, aril-oxi-, benzil-, benzil-oxi-, heterociklil-, heterociklil-oxi-, heterociklil-metil- vagy heterociklil-metoxi-csoport, ahol az aril-, aril-oxi-, benzil-, benzil-oxi-, heterociklil-, heterociklil-oxi-, heterociklil-metil- és heterociklil-metoxi-csoportok adott esetben 1-3 azonos vagy eltérő szubsztituenst, éspedig halogénatomot vagy 1-12 szénatomos alkil-, halogén-(1-12 szénatomos alkil)-, 1-12 szénatomos alkoxi-, halogén-(1-12 szénatomos alkoxi)-, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkoxi)-, (1-12 szénatomos alkil)-tio-, halogén-(1-12 szénatomos alkil)-tio-, 2-8 szénatomos alkenil-oxi-, 2-8 szénatomos alkinil-oxi-, nitro- vagy cianocsoportot hordozhatnak;

R₅ 1-8 szénatomos alkil-, 3-8 szénatomos cikloalkil-, 2-8 szénatomos alkenil-, 2-8 szénatomos alkinil-, benzil- vagy -C(=O)-R₆ csoportot jelent;

R₆ jelentése hidrogénatom, hidroxil-, merkaptó-, amino-, (1-12 szénatomos alkil)-amino-, di-(1-12 szénatomos alkil)-amino-, 1-12 szénatomos alkil-, halogén-(1-12 szénatomos alkil)-, 1-12 szénatomos alkoxi-, halogén-(1-12 szénatomos alkoxi)-, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkoxi)-, (1-12 szénatomos alkil)-tio-, 2-8 szénatomos alkenil-oxi- vagy 2-8 szénatomos alkinil-oxi-csoport, fenil-, fenoxi-, benzil-oxi-, NH-fenil, N(1-6 szénatomos alkil)-fenil, NH-(1-6 szénatomos alkil)-C(=O)-R₈ vagy N(1-6 szénatomos alkil)-(1-6 szénatomos alkil)-C(=O)-R₈ csoport, vagy olyan fenil-, fenoxi-, benzil-oxi-, NH-fenil vagy N(1-6 szénatomos alkil)-fenil csoport, amelyek aromás gyűrűjéhez 1-3 azonos vagy eltérő szubsztituens, éspedig halogénatom

vagy 1-6 szénatomos alkoxi-, halogén-(1-6 szénatomos alkil)- vagy halogén-(1-6 szénatomos alkoxi)-csoport kapcsolódik;

R₇ jelentése hidrogénatom vagy 1-12 szénatomos alkil-, halogén-(1-12 szénatomos alkil)-, 2-8 szénatomos alkenil-, 2-8 szénatomos alkinil-, fenil-, benzil-, amino-, (1-12 szénatomos alkil)-amino-, di-(1-12 szénatomos alkil)-amino-, NH-fenil- vagy N(1-12 szénatomos alkil)-fenil csoport; és

R₈ jelentése hidrogénatom vagy hidroxil-, 1-12 szénatomos alkil-, 1-12 szénatomos alkoxi-, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkoxi)-, 2-6 szénatomos alkenil-, -oxi-, fenil-, fenoxi-, benzil-oxi-, amino-, (1-12 szénatomos alkil)-amino-, di-(1-12 szénatomos alkil)-amino-, NH-fenil vagy N(1-12 szénatomos alkil)-fenil csoport.

A találmány tárgyát képezik továbbá az (I) általános képletű vegyületek előállítására szolgáló eljárások, az (I) általános képletű vegyületek, izomerjeik és tautomerjeik felhasználása, az (I) általános képletű vegyületek előállításához felhasználható közbenső termékek, az (I) általános képletű vegyületeket vagy tautomerjeiket hatóanyagként tartalmazó kártevőirtó készítmények, valamint a készítmények felhasználásával végzett kártevőirtó kezelések.

Az (I), (II) és (IV) általános képletben hullámos vonallal jelölt kötés azt jelenti, hogy az adott vegyület 4''(S)- és 4''(R)-izomer egyaránt lehet.

A szakirodalomban már ismertettek kártevőirtó hatású makrolid vegyületeket. Az ismert vegyületek biológiai jellemzői azonban nem felelnek meg minden szempontból az igényeknek, ezért szükség van újabb kártevőirtó hatású - elsősorban rovarkártevők és az Acarina rendbe tartozó kártevők irtására alkalmas - vegyületekre. A találmány szerinti (I) általános képletű vegyületek ennek az igénynek a kielégítésére szolgálnak.

A találmány szerinti vegyületek avermektin-származékok. Az avermektinek szakember számára jól ismertek. Az avermektinek a *Streptomyces avermitilis* mik-

roorganizmus fermentációjával kialakítható, szerkezetileg nagymértékben hasonló kártevőirtó hatású anyagok. Az avermektin-származékok hagyományos kémiai szintézisekkel állíthatók elő.

A *Streptomyces avermitilis* fermentációjával kialakítható avermektineket A1a, A1b, A2a, A2b, B1a, B1b, B2a és B2b jelzéssel jelölik. Az "A" jelzésű vegyületek az 5-ös helyzetben metoxicsoportot, míg a "B" jelzésű vegyületek ugyanebben a helyzetben hidroxilcsoportot tartalmaznak. Az "a" sorozatba azok a vegyületek tartoznak, amelyekben az R_1 szubsztituens (azaz a 25-ös helyzetű szubsztituens) szek-butil-csoport, míg a "b" sorozatba tartozó vegyületek a 25-ös helyzetben izopropil-csoportot hordoznak. Az "1" jelzés arra utal, hogy a vegyületek 22-es és 23-as helyzetű atomjait kettős kötés kapcsolja össze, míg a "2" jelzés azt jelenti, hogy ebben a helyzetben egyszeres kötés helyezkedik el, és a 23-as helyzetű szénatomhoz hidroxilcsoport kapcsolódik. Ezeket a jelöléseket a jelen leírásban is használjuk annak érdekében, hogy a vegyületeket besoroljuk a természetes avermektinek speciális altípusaiba. A találmány szerinti vegyületek a B1 jelzetű avermektinek származékai, közelebbről az avermektin B1a és B1b olyan származékainak keverékei, amelyek a 4" helyzetben (S) vagy (R) konfigurációjúak.

Az (I) általános képletű vegyületek egyes képviselői tautomer módosulatok formájában létezhetnek. Az ilyen vegyületek megnevezése és képlete csak az egyik tautomert tükrözi, de a megnevezésbe és a képletbe az egyéb tautomer módosulatok is beleértendők.

Az (I) általános képletű vegyületek és tautomerjeik sókat, például savaddíciós sókat képezhetnek. A savaddíciós sók képzésére alkalmas savak közül példaként a következőket soroljuk fel: erős szervetlen savak, így ásványi savak, például kénsav, foszforsav és hidrogén-halogenidek; erős szerves karbonsavak, így szubsztituálatlan és szubsztituált (például halogénatommal szubsztituált) 1-4 szénatomos alkán-

karbonsavak (például ecetsav), telítetlen és telített dikarbonsavak (például oxálsav, malonsav, maleinsav, fumársav és ftálsav), hidroxikarbonsavak (például aszkorbinsav, tejsav, almasav, borkősav és citromsav) és benzoésav; továbbá szerves szulfonsavak, így szubsztituálatlan és szubsztituált (például halogénatommal szubsztituált) 1-4 szénatomos alkán- vagy aril-szulfonsavak (például metánszulfonsav és p-toluol-szulfonsav). A legalább 1 savas csoportot tartalmazó (I) általános képletű vegyületek bázisokkal is képezhetnek sókat. A bázisokkal képezett sók például fém-sók, így alkálifém-sók és alkáliföldfém-sók (például nátrium-, kálium- vagy magnéziumsók), ammóniumsók, továbbá szerves aminokkal, így morfolinnal, piperidinnel, pirrolidinnal, mono-, di- vagy tri-rövidszénláncú alkil-aminokkal (például etil-amin, dietil-amin, trietil-amin és dimetil-propil-amin) és mono-, di- vagy tri-hidroxirövidszénláncú alkil-aminokkal (például mono-, di- vagy tri-etanol-amin) képezett sók lehetnek. Adott esetben a vegyületek belső sókat is képezhetnek. A találmány szerinti vegyületek közül a vegyületek szabad formái az előnyösek. Az (I) általános képletű vegyületek sói közül előnyösek az agrokémiai alkalmazható sók. Ahol - ellenkező kikötés hiányában - a leírásban a találmány szerinti vegyületeket (I) általános képletű vegyületeknek nevezzük, ezen a megjelölésen a vegyületek sóit is értjük; hasonlóan az "(I) általános képletű vegyületek sói" megjelölés a szabad vegyületeket is magában foglalja; mindkét esetben a megjelöléseken a megfelelő tautomerek és a tautomerek sói is értendők.

Ha a leírásban mást nem közlünk, az általános megjelöléseket a következőképpen értelmezzük:

A széntartalmú csoportok és vegyületek 1-6, előnyösen 1-4, célszerűen 1 vagy 2 szénatomot tartalmazhatnak.

A "halogén" megjelölésen - ami önállóan vagy más csoport, például halogén-

-alkil-, halogén-alkoxi- és halogén-alkil-tio-csoport részeként egyaránt szerepelhet - fluor-, klór-, bróm- és jódatomot, előnyösen fluor-, klór- és brómatomot, célszerűen fluor- és klóratomot értünk.

Az alkilcsoportok - amelyek más csoportok, például halogén-alkil-, alkoxi- és alkil-tio-csoportok részeként is szerepelhetnek - a közölt szénatomszámú egyenes vagy elágazó láncú csoportok lehetnek; ezek közül példaként a metil-, etil-, propil-, butil-, pentil-, hexil-, heptil-, oktil-, izopropil-, izobutil-, szek-butil-, terc-buti-, izopentil-, neopentil- és izohexil-csoportot említjük meg.

A cikloalkil-csoportok közül - amelyek más csoportok, például halogén-cikloalkil-, cikloalkoxi- és cikloalkil-tio-csoportok részeként is szerepelhetnek - példaként a ciklopropil-, ciklobutil-, ciklopentil-, ciklohexil-, cikloheptil- és ciklooktil-csoportot említjük meg.

Az alkenilcsoportok - amelyek más csoportok részeként is szerepelhetnek - a megadott szénatomszámú, egy vagy több (az utóbbi esetben konjugált vagy izolált) kettős kötést tartalmazó, egyenes vagy elágazó láncú csoportok lehetnek, amelyek közül példaként a vinil-, allil-, 2-butenil-, 3-pentenil-, 1-hexenil-, 1-heptenil-, 1,3-hexadienil-, 1,3-oktadienil-, izopropenil-, izobutenil-, izoprenil-, terc-pentenil-, izohexenil-, izoheptenil- és izooktenil-csoportot említjük meg. Az alkenilcsoportok előnyösen 3-12, célszerűen 3-6, különösen előnyösen 3 vagy 4 szénatomos csoportok lehetnek.

Az alkinilcsoportok - amelyek más csoportok részeként is szerepelhetnek - a megadott szénatomszámú, telítetlen, legalább 1 hármas kötést tartalmazó, egyenes vagy elágazó láncú csoportok lehetnek, amelyek közül példaként az etinil-, propargil-, 2-butinil-, 3-pentinil-, 1-hexinil-, 1-heptinil-, 3-hexen-1-inil-, 1,5-heptadien-3-inil-, 3-metil-but-1-inil-, 4-etil-pent-1-inil-, 4-metil-hex-2-inil- és 2-metil-hept-3-inil-csoport-

tot említjük meg. Az alkinilcsoportok előnyösen 3-12, célszerűen 3-6, különösen előnyösen 3 vagy 4 szénatomos csoportok lehetnek.

Az alkilén- és alkenilénecsoportok egyenes vagy elágazó láncú kapcsoló csoportok lehetnek, amelyek közül példaként a $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{CH}_3)_2-\text{CH}_2-$, $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-$ és $-\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ csoportot említjük meg.

A halogén-szubsztituenst hordozó széntartalmú csoportok és vegyületek, például a halogén-szubsztituenst hordozó alkil-, alkenil-, alkinil-, cikloalkil-, alkoxi- és alkil-tio-csoportok részlegesen halogénezett és perhalogénezett csoportok egyaránt lehetnek. A perhalogénezett csoportok akár azonos, akár eltérő halogénatomokat tartalmazhatnak. A halogén-alkil-csoportok közül - amelyek más csoportok, így halogén-alkoxi- és halogén-alkil-tio-csoportok részeként is előfordulhatnak - példaként a következőket említjük meg: 1-3 fluor-, klór- és/vagy brómatommal szubsztituált metilcsoport (például CHF_2 vagy CF_3 csoport), 1-5 fluor-, klór- és/vagy brómatommal szubsztituált etilcsoport (például CH_2CF_3 , CF_2CF_3 , CF_2CCl_3 , CF_2CHCl_2 , CF_2CHF_2 , CF_2CFCl_2 , CF_2CHBr_2 , CF_2CHClF , CF_2CHBrF vagy CClFCHClF csoport), 1-7 fluor-, klór- és/vagy brómatommal szubsztituált propil- vagy izopropilcsoport [például $\text{CH}_2\text{CHBrCH}_2\text{Br}$, $\text{CF}_2\text{CHFCF}_3$, $\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ vagy $\text{CH}(\text{CF}_3)_2$ csoport], 1-9 fluor-, klór- és/vagy brómatommal szubsztituált izomer butilcsoportok [például $\text{CF}(\text{CF}_3)\text{CHFCF}_3$ vagy $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_2\text{CF}_3$ csoport], 1-11 fluor-, klór- és/vagy brómatommal szubsztituált izomer pentilcsoportok [például $\text{CF}(\text{CF}_3)(\text{CHF})_2\text{CF}_3$ vagy $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_2\text{CF}_3$ csoport], és 1-13 fluor-, klór- és/vagy brómatommal szubsztituált izomer hexilcsoportok [például $(\text{CH}_2)_4\text{CHBrCH}_2\text{Br}$, $\text{CF}_2(\text{CHF})_4\text{CF}_3$, $\text{CH}_2(\text{CF}_2)_4\text{CF}_3$ vagy $\text{C}(\text{CF}_3)_2(\text{CHF})_2\text{CF}_3$ csoport].

Az arilcsoport például fenil-, naftil-, antraceni- vagy perilenilcsoport, előnyösen fenilcsoport lehet.

A heterociklil-csoport például piridil-, pirimidil-, s-triazinil-, 1,2,4-triazinil-, tienil-, furil-, tetrahidrofuranil-, piranil-, tetrahidropiranil-, pirrolil-, pirazolil-, imidazolil-, tiazolil-, triazolil-, tetrazolil-, oxazolil-, tiadiazolil-, oxadiazolil-, benzotienil-, kinolinil-, kinoxalinil-, benzofuranil-, benzimidazolil-, benzopirrolil-, benzotiazolil-, indolil-, kumarinil- vagy indazolil-csoport lehet; a felsoroltak előnyösen szénatomon keresztül kapcsolódhatnak a molekula többi részéhez. A heterociklil-csoport előnyösen tienil-, tiazolil-, benzofuranil-, benzotiazolil-, furil-, tetrahidropiranil- vagy indolilcsoport, célszerűen piridil- vagy tiazolilcsoport lehet.

A találmány szerinti vegyületek előnyös csoportjait alkotják a következők:

- (2) az (1) csoportban felsorolt (I) általános képletű vegyületek, amelyekben R_1 izopropil- vagy szek-butil-csoportot jelent, előnyösen az izopropil- és szek-butil-származékok keverékei;
- (3) a (2) csoportba tartozó (I) általános képletű vegyületek, amelyekben R_2 1-8 szénatomos alkilcsoportot 1-5 halogénatommal, hidroxilcsoporttal és/vagy cianocsoporttal szubsztituált 1-8 szénatomos alkilcsoportot, 3-12 szénatomos alkenilcsoportot, 3-12 szénatomos alkinilcsoportot vagy $-C(O)R_4$ csoportot jelent;
- (4) az (1)-(3) csoport bármelyikébe tartozó (I) általános képletű vegyületek, amelyekben R_2 1-4 szénatomos alkilcsoportot, előnyösen metilcsoportot jelent;
- (5) a (2) csoportba tartozó (I) általános képletű vegyületek, amelyekben R_2 etilcsoportot jelent;
- (6) a (2) csoportba tartozó (I) általános képletű vegyületek, amelyekben R_2 n-propil-csoportot jelent;
- (7) az (1)-(6) csoport bármelyikébe tartozó (I) általános képletű vegyületek, amelyekben R_3 hidrogénatomot, 1-8 szénatomos alkilcsoportot, halogén-, hidroxil- és/vagy ciano-szubsztituenst hordozó 1-8 szénatomos alkilcsoportot vagy 3-12 szénatomos alkenil- vagy alkinilcsoportot jelent;

- (8) az (1)-(6) csoport bármelyikébe tartozó (I) általános képletű vegyületek, amelyekben R_3 hidrogénatomot jelent;
- (9) az (1)-(6) csoport bármelyikébe tartozó (I) általános képletű vegyületek, amelyekben R_3 metilcsoportot jelent;
- (10) az (1)-(6) csoport bármelyikébe tartozó (I) általános képletű vegyületek, amelyekben R_3 etilcsoportot jelent;
- (11) az (1)-(6) csoport bármelyikébe tartozó (I) általános képletű vegyületek, amelyekben R_3 n-propil-csoportot jelent;
- (12) az (1)-(6) csoport bármelyikébe tartozó (I) általános képletű vegyületek, amelyekben R_3 izopropil-csoportot jelent;
- (13) a (3) és (7)-(12) csoport bármelyikébe tartozó (I) általános képletű vegyületek, amelyekben R_4 jelentése hidrogénatom vagy hidroxil-, 1-4 szénatomos alkil-, 1-4 szénatomos alkoxi-, halogén-(1-4 szénatomos alkil)-, halogén-(1-4 szénatomos alkoxi)-, 3-8 szénatomos cikloalkoxi-, 2-8 szénatomos alkenil-oxi-, 2-8 szénatomos alkinil-oxi-, amino-, (1-12 szénatomos alkil)-amino-, di-(1-12 szénatomos alkil)-amino-, aril-, aril-oxi-, benzil- vagy benzil-oxi-csoport, és az aril-, aril-oxi-, benzil- és benzil-oxi-csoport adott esetben 1-3 halogén-, 1-4 szénatomos alkil-, halogén-(1-4 szénatomos alkil)-, 1-4 szénatomos alkoxi, halogén-(1-4 szénatomos alkoxi)-, halogén-(1-4 szénatomos alkil)-tio-, nitro- és/vagy ciano-szubsztituenst hordozhat;
- (14) az (1) vagy (2) csoportba tartozó (I) általános képletű vegyületek, amelyekben R_2 és R_3 együtt $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ vagy $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ csoportot alkot;
- (15) az (1) vagy (2) csoportba tartozó (I) általános képletű vegyületek, amelyekben R_2 és R_3 együtt $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ vagy $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{N}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ csoportot alkot;

(16) az (1) és (7)-(12) csoport bármelyikébe tartozó (I) általános képletű vegyületek, amelyekben R_2 jelentése hidroxil-, halogén-, ciano- és/vagy 3-8 szénatomos cikloalkil-szubsztituenst hordozó 1-4 szénatomos alkilcsoport; adott esetben 1-3 metil-szubsztituenst hordozó 3-8 szénatomos cikloalkenil-csoport; 1-12 szénatomos alkoxi-, 2-8 szénatomos alkinil-, $-C(=O)R_4$, $-NHC(=O)R_6$ vagy $-P(=O)(O-1-6 \text{ szénatomos alkil})_2$ -csoport; vagy adott esetben 1-5 szubsztituenst hordozó fenil-, naftil-, antraceni-, fenantrenil-, fluorenil-, perilenil- vagy heterociklil-csoport, ahol

előnyösen ahol az R_2 szubsztituens jelentése halogénatom, ciano-, 3-8 szénatomos cikloalkil-, 2-8 szénatomos alkinil-, $-C(=O)R_4$, $-NHC(=O)-R_6$ vagy $-P(=O)(O-1-6 \text{ szénatomos alkil})_2$ csoport, vagy adott esetben 1-3 szubsztituenst hordozó fenil-, naftil-, antraceni-, piridil-, tiazolil-, imidazolil-, furil-, kinolinil- vagy pirazolil-csoport;

(17) az (1)-(6) és (16) csoport bármelyikébe tartozó (I) általános képletű vegyületek, amelyekben

R_3 jelentése az aromás gyűrűn 1-3 hidroxil-, halogén-, ciano-, nitro-, 1-2 szénatomos alkil-, dimetil-amino-1-4 szénatomos alkoxi-, 3-6 szénatomos cikloalkil-, halogén-(1-2 szénatomos alkil)-, 1-2 szénatomos alkoxi-, halogén-(1-2 szénatomos alkoxi)-, fenoxi-, fenil-(1-6 szénatomos alkil)- és/vagy fenil-(1-4 szénatomos alkenil)-szubsztituenst hordozó benzilcsoport, adott esetben klór- és/vagy metoxi-szubsztituenst hordozó fenoxicssoport; adott esetben klór-, metoxi- és/vagy trifluor-metil-szubsztituenst hordozó benzil-oxi-csoport, metilén-dioxi-csoport, vagy $-C(=O)R_5$, $-O-C(=O)R_6$ vagy $-NHC(=O)R_6$ csoport,

R_5 jelentése hidrogénatom, hidroxil-, amino-, (1-2 szénatomos alkil)-amino-, di-(1-2 szénatomos alkil)-amino-, $-O-(1-2 \text{ szénatomos alkil})-C(=O)-R_7$, $-NH-(1-2 \text{ szénatomos alkil})-C(=O)-R_7$, 1-6 szénatomos alkil-, 1-2 szénatomos alkoxi-, (1-2 szén-

atomos alkoxi)-(1-2 szénatomos alkoxi)-, 2-4 szénatomos alkenil-oxi-, 2-4 szénatomos alkinil-oxi-, fenil-, fenoxi-, benzil-oxi-, NH-fenil vagy NH-(1-6 szénatomos alkil)-C(=O)-R₇ csoport, vagy halogén-, nitro-, metoxi-, trifluor-metil- és/vagy trifluor-metoxi-szubsztituenst hordozó fenil-, fenoxi-, benzil-oxi- vagy NH-fenil csoport;

R₆ hidrogénatomot vagy 1-3 szénatomos alkil-, fenil- vagy benzilcsoportot jelent; és

R₇ hidrogénatomot vagy hidroxil-, amino-, (1-12 szénatomos alkil)-amino-, di-(1-12 szénatomos alkil)-amino-, 1-12 szénatomos alkil-, 1-12 szénatomos alkoxi-, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkoxi)-, 2-8 szénatomos alkenil-oxi-, fenil-, fenoxi-, benzil-oxi- vagy NH-fenil csoportot jelent;

(18) az (1)-(6) csoport bármelyikébe tartozó (I) általános képletű vegyületek, amelyekben

R₃ -(1-4 szénatomos alkil)-C(=O)-R₅ csoportot, előnyösen -CH₂-C(=O)-R₅ csoportot jelent, és

R₅ jelentése hidrogénatom vagy hidroxil-, amino-, (1-2 szénatomos alkil)-amino-, di-(1-2 szénatomos alkil)-amino-, 1-4 szénatomos alkil-, 1-12 szénatomos alkoxi-, 2-4 szénatomos alkenil-oxi-, fenil-, fenoxi-, benzil-oxi-, NH-fenil, NH-(1-2 szénatomos alkil)-C(=O)-O-(1-2 szénatomos alkil)-fenil vagy -P(=O)(O-1-6 szénatomos alkil)₂ csoport, vagy klór-, fluor-, metoxi-, trifluor-metil- és/vagy trifluor-metoxi-szubsztituenst hordozó fenil-, fenoxi-, benzil-oxi- vagy NH-fenil csoport; előnyösen 1-12 szénatomos alkoxicsoprot;

(19) az (1)-(6) csoport bármelyikébe tartozó (I) általános képletű vegyületek, amelyekben R₄ szubsztituálatlan benzilcsoportot jelent;

(20) az (1)-(19) csoport bármelyikébe tartozó, a 4" helyzetben R konfigurációjú (I) általános képletű vegyületek;



(21) az (1)-(19) csoport bármelyikébe tartozó, a 4" helyzetben S konfigurációjú (I) általános képletű vegyületek.

A találmány szerinti vegyületek különösen előnyös képviselői a P.1-P.17 példában és az 1-3. táblázatban felsorolt vegyületek, továbbá - ahol ilyen izomériára lehetőség van - a megfelelő E- és Z- izomerek és az E/Z izomerek elegyei.

A találmány tárgya továbbá eljárás az (I) általános képletű vegyületek és tautomer módosulataik előállítására oly módon, hogy

(A) egy ismert vagy ismert módszerekkel előállítható (II) általános képletű vegyületet - a képletben a hullámos vonallal jelölt kötés (S) vagy (R) konfigurációt jelöl, R_1 jelentése az (I) általános képletnél megadott, és Q védőcsoportot jelent - egy ismert vagy ismert módszerekkel előállítható (III) általános képletű vegyülettel - a képletben R_2 és R_3 jelentése az (I) általános képletnél megadott, és Hal halogénatomot, előnyösen bróm- vagy jódatomot jelent - reagáltatva (IV) általános képletű vegyületté alakítunk - a képletben Q, R_1 , R_2 és R_3 jelentése a fenti -, és

(B) egy kapott (IV) általános képletű vegyület Q védőcsoportját lehasítjuk; vagy

(C) egy (I) általános képletű vegyületet, amelyben R_1 és R_3 jelentése a fenti és R_2 hidrogénatomot jelent, egy Hal- R_2 általános képletű vegyülettel reagáltatunk - a képletben R_2 jelentése az (I) általános képletnél megadott, és Hal halogénatomot, előnyösen bróm- vagy jódatomot jelent -; vagy

(D) egy (IV) általános képletű vegyületet, amelyben Q, R_1 és R_3 jelentése a fenti és R_2 hidrogénatomot jelent, egy Hal- R_2 általános képletű vegyülettel reagáltatunk - a képletben R_2 jelentése az (I) általános képletnél megadott, és Hal halogénatomot, előnyösen bróm- vagy jódatomot jelent - reagáltatunk, majd az így kapott (IV) általános képletű vegyület Q védőcsoportját a (B) eljárással analóg módon lehasítjuk; vagy



(E) olyan (I) általános képletű vegyületek előállítására, amelyekben R_1 jelentése a fenti, és R_2 és R_3 a (I) általános képletnél meghatározott, egymással megegyező csoportot jelent a hidrogénatom kivételével, egy (I) általános képletű vegyületet, amelyben R_1 jelentése a fenti és R_2 és R_3 egyaránt hidrogénatomot jelent, 2 mól Hal- R_2 általános képletű vegyülettel - a képletben R_2 jelentése az (I) általános képletnél megadott, és Hal halogénatomot, előnyösen bróm- vagy jódatomot jelent - reagáltatunk; vagy egy (IV) általános képletű vegyületet, amelyben R_1 és Q jelentése a fenti és R_2 és R_3 egyaránt hidrogénatomot jelent, 2 mól Hal- R_2 általános képletű vegyülettel - a képletben R_2 jelentése az (I) általános képletnél megadott, és Hal halogénatomot, előnyösen bróm- vagy jódatomot jelent - reagáltatunk, majd az így kapott vegyület Q védőcsoportját a (B) eljárásnál megadottakkal analóg módon lehasítjuk; vagy

(F) olyan (I) általános képletű vegyületek előállítására, amelyekben R_1 jelentése a fenti, és R_2 és R_3 együtt 3-7 tagú alkilén kapcsoló csoportot vagy 4-7 tagú alkenilén kapcsoló csoportot jelent, amelyekben az egyik CH_2 csoport helyén -O-, -S- vagy -NR₅- csoport állhat, egy (I) általános képletű vegyületet, amelyben R_1 jelentése a fenti és R_2 és R_3 hidrogénatomot jelent, 1 mól Hal-A-Hal általános képletű vegyülettel - a képletben A az R_2 és R_3 együttes jelentésére megadott csoportokat jelenti és Hal halogénatomot, előnyösen bróm- vagy jódatomot jelent - reagáltatunk; vagy, az (E) eljárással analóg módon, egy (IV) általános képletű vegyületet, amelyben R_1 és Q jelentése a fenti és R_2 és R_3 egyaránt hidrogénatomot jelent, 1 mól Hal-A-Hal általános képletű vegyülettel - a képletben A és Hal jelentése a fenti - reagáltatunk, majd a kapott termék Q védőcsoportját a (B) eljárásnál megadottakkal analóg módon lehasítjuk; vagy

(G) olyan (I) általános képletű vegyületek előállítására, amelyekben R_2

-C(O)R₄ csoportot jelent és R₁, R₃ és R₄ jelentése a fenti, egy (I) általános képletű vegyületet, amelyben R₁ és R₃ jelentése a fenti és R₂ hidrogénatomot jelent, egy Hal-C(O)R₄ általános képletű vegyülettel - a képletben Hal halogénatomot jelent és R₄ jelentése a fenti - reagáltatunk; vagy egy (IV) általános képletű vegyületet, amelyben R₁, R₃ és Q jelentése a fenti és R₂ hidrogénatomot jelent, egy Hal-C(O)R₄ általános képletű vegyülettel - a képletben Hal halogénatomot jelent és R₄ jelentése a fenti - reagáltatunk, majd a kapott vegyületről lehasítjuk a Q védőcsoportot.

Az (I) általános képletű vegyületekkel kapcsolatban közöltekkel hasonlóan azoknál a kiindulási anyagoknál vagy közbelső termékeknél, amelyek tautomer módosulatok formájában létezhetnek, a megadott képletben a vegyület összes lehetséges tautomer módosulatát értjük.

A fent ismertetett és a későbbiekben ismertetendő reakciókat önmagukban ismert módon hajtjuk végre, például oldószer távollétében vagy (a leggyakrabban) alkalmas oldószer vagy hígítószer jelenlétében, hűtés közben, szobahőmérsékleten vagy melegítés közben (a reakció hőmérséklet-tartománya például -80°C és a reakcióelegy visszafolyási pontja közötti érték, előnyösen körülbelül 0°C és 150°C közötti érték lehet), szükség esetén zárt edényben, atmoszferikusnál nagyobb nyomáson, szükség esetén inert gáz atmoszférában és/vagy szükség esetén vízmentes körülmények között. Különösen előnyös reakciókörülmények a példákban közlendők.

A reakcióidő nem döntő jelentőségű tényező. A reakcióidő például körülbelül 0,1-72 óra, előnyösen körülbelül 0,5-24 óra lehet.

A terméket szokásos módszerekkel (például szűréssel, kristályosítással, desztillációval, kromatografálással vagy a felsorolt módszerek bármilyen célszerű kombinálásával) különíthetjük el és tisztíthatjuk.



Az (I) általános képletű vegyületek előállítására felhasználható kiindulási anyagok ismertek vagy önmagukban ismert módszerekkel (például a későbbiekben közlendők szerint) állíthatók elő.

A (IIa) és (IIb) általános képletű kiindulási anyagok, azaz az 5-ös helyzetben védőcsoportot hordozó abamektin B1a és 4"-epi-abamektin B1 ismert anyagok, vagy önmagukban ismert módszerekkel állíthatók elő.

(A) eljárás:

A reakcióhoz például a következő oldószereket és hígítószereket használhatjuk: aromás, alifás és aliciklusos szénhidrogének és halogénezett szénhidrogének, így benzol, toluol, xilol, mezitilén, tetralin, klórbenzol, diklór-benzol, brómbenzol, petroléter, hexán, ciklohexán, diklór-metán, triklór-metán, tetraklór-metán, diklór-etán, triklór-etén vagy tetraklór-etén; éterek, így dietil-éter, dipropil-éter, di-izopropil-éter, dibutil-éter, terc-butil-metil-éter, etilén-glikol-monometil-éter, etilén-glikol-monoetil-éter, etilén-glikol-dimetil-éter, dimetoxi-dietil-éter, tetrahidrofurán vagy dioxán; karbonsav-észterek, így etil-acetát; amidok, így dimetil-formamid, dimetil-acetamid vagy 1-metil-2-pirrolidinon; nitrilek, így acetonitril; szulfoxidok, így dimetil-szulfoxid; továbbá a fenti oldószerek elegyei. Előnyös oldószerek az amidok, így a dimetil-formamid és a dimetil-acetamid, amelyek közül különösen előnyös a dimetil-acetamid.

A (IV) általános képletű vegyületek a Q védőcsoport jellegének megfelelően például a következők lehetnek: alkil-éterek, így metoxi-metil-, metil-tio-metil-, terc-butil-tio-metil-, benzil-oxi-metil-, p-metoxi-benzil-, 2-metoxi-etoxi-metil-, 2,2,2-triklór-etoxi-metil-, 2-(trimetil-szilil)-etoxi-metil-, tetrahidropiranyl-, tetrahidrofuranil-, 1-etoxi-etil-, 1-(2-klór-etoxi)-etil-, 1-metil-1-metoxi-etil-, 1-metil-1-(benzil-oxi)-etil-, triklór-etil-, 2-(trimetil-szilil)-etil-, terc-butil-, allil-, p-metoxi-fenil-, 2,4-dinitro-fenil-, benzil-, p-metoxi-benzil-, o-nitro-benzil-, p-nitro-benzil- és trifenil-metil-éterek; trialkil-szilil-éterek, így trimetilszilil-, trietil-szilil-, dimetil-terc-butil-szilil-, dimetil-izopropil-szilil-, di-

metil-1,1,2-trimetil-propil-szilil-, dietil-izopropil-szilil- és dimetil-terc-hexil-szilil-éterek; fenil-terc-alkil-szilil-éterek, így difenil-terc-butil-szilil-éterek; észterek, így formiátok, acetátok, klóracetátok, diklór-acetátok, triklór-acetátok, trifluor-acetátok, metoxi-acetátok, fenoxi-acetátok, pivaloátok és benzoátok; alkil-karbonátok, így metil-, 9-fluorenil-metil-, etil-, 2,2,2-triklór-etil-, 2-(trimetil-szilil)-etil-, vinil-, allil-, benzil-, p-metoxi-benzil-, o-nitro-benzil- és p-nitro-benzil-karbonátok; és fenil-karbonátok, így p-nitro-fenil-karbonátok.

Előnyös védett vegyületek a trialkil-szilil-éterek, így a trimetil-szilil-, trietil-szilil-, dimetil-terc-butil-szilil- és difenil-terc-butil-szilil-éterek; az észterek, így a metoxi-acetátok és fenoxi-acetátok; továbbá a karbonátok, így a 9-fluorenil-metil- és allil-karbonátok. Kiemelkedően előnyös védőcsoport a dimetil-terc-butil-szilil-csoport.

A reakciót előnyösen körülbelül -70°C és 50°C közötti hőmérsékleten, célszerűen körülbelül -10 és 25°C közötti hőmérsékleten hajtjuk végre.

Különösen előnyösek a P.1. példában ismertetendő reakciókörülmények.

(B) eljárás:

Oldószerekként és hígítószerekként például az (A) eljárásnál felsoroltakat, továbbá vizet vagy alkoholokat, így metanolt, etanolt vagy 2-propanolt használhatunk.

A reakciót előnyösen körülbelül -70°C és 100°C közötti hőmérsékleten, célszerűen körülbelül -10°C és 25°C közötti hőmérsékleten hajtjuk végre.

A védőcsoport lehasításához például a következő reagenseket használhatjuk: Lewis savak, így sósav, metánszulfonsav, bór-trifluorid-éterát, piridin jelenlétében hidrogén-fluorid, $\text{Zn}(\text{BF}_4)_2 \cdot \text{H}_2\text{O}$, p-toluol-szulfonsav, alumínium-triklorid és higany(II)-klorid; ammónium-fluoridok, így tetrabutil-ammónium-fluorid; bázisok, így ammónia, trialkil-amin és heterociklusos bázisok; katalizátor, így csontszénre felvitt palládium jelenlétében hidrogén; továbbá redukálószer, így nátrium-bórhidrid vagy tributil-

-ón-hidrod katalizátor, például $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$ jelenlétében, vagy cink és ecetsav keveréke.

A védőcsoport lehasításához előnyösen a következő reagenseket használhatjuk: savak, így metánszulfonsav vagy piridin jelenlétében hidrogén-fluorid; nátrium-bórhidrid $\text{Pd}(0)$ katalizátor jelenlétében; bázisok, így ammónia, trietil-amin vagy piridin. Különösen előnyösen használhatunk savakat, így piridin jelenlétében hidrogén-fluoridot vagy metánszulfonsavat.

Különösen előnyösek a P.1. példában ismertetendő reakciókörülmények.

(C) eljárás:

Oldószerekként és hígítószerekként például az (A) eljárásnál felsoroltakat, továbbá alkoholokat, így metanolt, etanolt vagy 2-propanolt használhatunk. Előnyös oldószerek az amidok, így a dimetil-formamid, és a nitrilek, így az acetonitril. Oldószerként különösen előnyösen használhatunk acetonitrilt.

A reakciót előnyösen körülbelül -10°C és 120°C közötti hőmérsékleten, célszerűen körülbelül $20-100^\circ\text{C}$ -on hajthatjuk végre.

Bázisokként előnyösen karbonátokat (így nátrium-karbonátot, nátrium-hidrogén-karbonátot és kálium-karbonátot), trialkil-aminokat (így trietil-amint) és heterociklusos bázisokat (így piridint) használhatunk.

Különösen előnyösek a P.4. példában ismertetendő reakciókörülmények.

A (D) - (F) eljárást lényegében a (C) eljárásnál ismertetett körülmények között hajthatjuk végre.

(G) eljárás:

Oldószerekként és hígítószerekként például a (B) eljárásnál felsoroltakat, különösen előnyösen etil-acetátot és vizet használhatunk.

A reakciót előnyösen körülbelül -10°C és 120°C közötti hőmérsékleten, célszerűen $20-80^\circ\text{C}$ -on hajthatjuk végre.

Bázisként előnyösen karbonátokat (így nátrium-karbonátot, nátrium-hidrogén-karbonátot és kálium-karbonátot), trialkil-aminokat (így trietil-amint) és heterociklusos bázisokat (így piridint) használhatunk.

Különösen előnyösek a P.11. példában ismerttetendő reakciókörülmények.

Az (I) általános képletű vegyületek egyetlen izomer vagy több izomer keveréke, tiszta izomerek vagy izomer-elegyek (például racém elegyek) formájában képződhetnek. Oltalmi igényünk a tiszta izomerekre és a racém elegyekre egyaránt kiterjed. A vegyületek képletei és megnevezései abban az esetben is magukban foglalják ezeket a variációkat, ha azokat a képletben vagy a megnevezésben külön nem szerepeltettük.

A racémátokból ismert rezolválási módszerekkel különíthetjük el az egyedi optikai izomereket. Ilyen módszerek például a következők: átkristályosítás optikailag aktív oldószerből; királis adszorbenseken végzett kromatográfia [például acetil-cellulózra végzett nagynyomású folyadékkromatográfálás (HPLC)]; alkalmas mikroorganizmusok felhasználása; specifikus immobilizált enzimekkel való hasítás; továbbá zárványvegyületek képzése például királis koronaéterekkel, amelyek csak az egyik izomert komplexálják.

A fent ismertetett rezolválási módszereken kívül a tiszta optikai izomerek más általánosan ismert enantioszelektív szintézismódokkal is kialakíthatók, például úgy, hogy a találmány szerinti eljárásban a megfelelő sztereokémiájú optikailag aktív kiindulási anyagokat használjuk.

Ha az egyedi izomerek biológiai aktivitása eltérő, célszerűen a nagyobb biológiai aktivitású izomert különítjük el vagy szintetizáljuk.

Az (I) általános képletű vegyületek esetenként hidrátokat és/vagy más szolvátokat (például a szilárd vegyületek kristályosításához használt oldószereket tartalmazó szolvátokat) képezhetnek.

Ötalmi igényünk a fent felsorolt eljárások összes olyan változatára kiterjed, amikor egy adott közbenső terméket használunk kiindulási anyagként, és csak a szintézis fennmaradó lépését vagy lépéseit hajtjuk végre, vagy amikor a kiindulási anyagot származéka vagy sója és/vagy racemátja vagy adott antipódja formájában használjuk, vagy amikor a kiindulási anyagot magában a reakcióelegyben alakítjuk ki.

A találmány szerinti eljárásokban célszerűen olyan kiindulási anyagokat és közbenső termékeket használunk, amelyek az (I) általános képletű vegyületek különösen előnyös képviselőihez vezetnek.

A találmány tárgyát képezik továbbá a (IV) általános képletű vegyületek, továbbá lehetséges esetekben azok E- és Z-izomerjei, az E/Z izomerek elegyei és/vagy tautomer módosulataik, és a felsoroltak sói.

A találmány szerinti (I) általános képletű vegyületek értékes kártevőirtó hatóanyagok, amelyek preventív és/vagy kuratív kezelésre egyaránt alkalmasak, rendkívül előnyös biocid spektrummal és igen széles hatásspektrummal rendelkeznek, még kis koncentrációban is igen hatékonyak, és melegvérűek, halak és növények által jól tolerálhatók. Meglepő módon azt tapasztaltuk, hogy a találmány szerinti vegyületek növényeken élősködő kártevők és embereken és állatokon (az élelemtermelés céljából tenyésztett állatokat, háziállatokat és hobbiállatokat egyaránt ide értve) élősködő ekto- és endoparaziták irtására egyaránt alkalmasak. A vegyületek az állatokon élősködő kártevőkkel szemben az adott kártevő valamennyi vagy egyedi kifejlődési szakaszában hatékonyak, és nemcsak az érzékeny kártevőkkel, hanem a rezisztens kártevőkkel, így rovarokkal és az Acarina rendbe tartozó kártevőkkel, nematódákkal, cestódákkal és trematódákkal szemben is aktívak, és egyben védik az értékes szervezeteket. A találmány szerinti hatóanyagok inszekticid vagy akaricid hatása közvetlenül is megnyilvánulhat, azaz a kártevők pusztulásában jelentkezik (a vegyületek például legalább 50-60 %-os pusztulást idézhetnek elő), ami akár az-

zonnal, akár bizonyos idő elteltével (például a vedlés során) léphet fel; de ez a hatás közvetetten, például a peterakás és/vagy a petékből való kikelés visszaszorításában is megíjlvánulhat.

A találmány szerinti vegyületek és az azokat tartalmazó készítmények állatokon élősködő kártevőkkel szembeni hatásossága lényegesen szélesíthető és az adott körülményekhez illeszthető, ha azokat más inszekticid, akaricid vagy nematocid anyagokkal együtt használjuk. Ilyen alkalmas egyéb hatóanyagok például a következő csoportokba sorolható kártevőirtó anyagok: szerves foszforvegyületek, nitrofenolok és származékaik, formamidinek, karbamidok, karbamátok, piretroidok, klórozott szénhidrogének, neonikotinoidok és *Bacillus thuringiensis*-készítmények.

A találmány szerinti vegyületekkel kombinálva felhasználható más kártevőirtó hatóanyagok különösen előnyös képviselői a következők: azametrifosz, klórfenvinfosz, cipermetrin, cipermetrin hig-cisz, cipromazin, diafentiuron, diazinon, diklorvosz, dikrotofosz, diciklanil, fenoxikarb, fluazuron, furatiokarb, iszazofosz, jódfenfosz, kinoprén, lufenuron, metakrifosz, metidation, monokrotofosz, foszfamidon, profenfosz, diofenolan, a CG91 vagy NCTC 11821 *Bacillus thuringiensis*-törzsből nyerhető vegyületek, pimetrozin, brómpropilát, metoprén, diszulfoton, kvinalfosz, tau-fluvalinát, tiociklám, tiometon, aldikarb, azinfosz-metil, benfurakarb, bifentrin, buprofezin, karbofuran, dibutil-amino-tio, kartap, klórfluazuron, klórpírifosz, ciflutrin, lambda-cihalotrin, alfa-cipermetrin, zéta-cipermetrin, deltametrin, diflubenzuron, endoszulfán, etiofenkarb, fenitroton, fenobukarb, fenvalerát, formotion, metiokarb, heptenofosz, imidakloprid, izoprokarb, metamidofosz, metomil, mevinfosz, paration, paration-metil, foszalon, pirimikarb, propoxur, teflubenzuron, terbufosz, triazamát, fenobukarb, tebufenozid, fipronil, béta-ciflutrin, szilafluofen, fenpiroximát, piridaben, fenazakvin, piroproxifen, pirimidifen, nitenpiram, acetamiprid, emamektin, emamektin-benzoát, szpinozad, rovarokkal szemben hatékony növényi kivonatok, rovarokkal szemben

hatékony, nematódákat tartalmazó készítmények, *Bacillus subtilis*ből nyerhető készítmények, rovarokkal szemben hatékony, gombákat tartalmazó készítmények, rovarokkal szemben hatékony, vírusokat tartalmazó készítmények, klórfenapir, acefát, akrinatrín, alanikarb, alfametrin, amitraz, AZ 60541, azinfosz A, azinfosz M, azociklotin, bendiokarb, benszultap, béta-ciflutrin, BPMC, brofenprox, bromofosz A, bufenkarb, butokarboxin, butilpiridaben, kaduzafosz, karbaril, karbofenotion, klóretokarb, klóretoxifosz, klórmefosz, cisz-rezmetrin, ciklotrin, klofentezin, cianofosz, cikloprotin, cihexatin, demeton M, demeton S, demeton-S-metil, diklofention, diklifosz, dietion, dimetoát, dimetilvinfosz, dioxation, edifenfosz, esfenvalerát, etion, etofenproxi, etoprofosz, etrimfosz, fenamifosz, fenbutatin-oxid, fenotiokarb, fenpropatrín, fenpirad, fention, fluazinam, flucikloxuron, flucitrinát, flufenoxuron, flufenprox, fonofosz, fosztiazát, fubfenprox, HCH, hexaflumuron, hexitiazox, IKI-220, iprobenfosz, izofenfosz, izoxation, ivermektin, malation, mekarbam, meszulfenfosz, metaldehid, metolkarb, milbemektin, moxidektin, naled, NC 184, ometoát, oxamil, oxidemeton M, oxideprofosz, permetrin, fentoát, forát, foszmet, foxim, pirimifosz M, pirimifosz E, promekarb, propafosz, protiofosz, protoát, piraklofosz, piradafention, pirezmetrin, piretrum, tebufenozid, szalition, szebufosz, szulfotep, szulprofosz, tebufenpirad, tebupirimfosz, teflutrin, temefosz, terbam, tetraklórvinfosz, tiakloprid, tiafenox, tiodikarb, tiofanox, tionazin, turingienzin, tralometrin, triartén, triazofosz, triazuron, triklórfon, triflumuron, trimetakarb, vamidotion, xililkarb, YI 5301/5302, zetametrin, DPX-MP062 - indoxakarb, metoxifenozyd, bifenazát, XMC (3,5-xilil-metil-karbamát) vagy a gombapatogén *Metarhizium anisopliát*. Kiemelkedően előnyös egyéb hatóanyag a fipronil, tiametoxam és lambda-cihalotrin.

A találmány szerinti vegyületekkel és készítményekkel irtható, állatokon élősködő kártevők például az EP-A-736 252 sz. európai közzétételi irat 5. oldalának 55. sorától 6. oldalának 55. soráig felsoroltak lehetnek.

A találmány szerinti vegyületek fonalférgek irtására is alkalmasak. Ilyen kártevők például a gyömércsomó-nematódák, a hólyagképző nematódák és a szárazon és leveleken élősködő nematódák, köztük elsősorban a *Heterodera*-fajták (így *Heterodera avenae* és *Heterodera trifolii*), a *Globodera*-fajták (így *Globodera rostochiensis*), a *Meloidogyne*-fajták (így *Meloidogyne incognita* és *Meloidogyne javanica*), a *Radopholus*-fajták (így *Radopholus similis*), a *Pratylenchus*-fajták (így *Pratylenchus neglectans* és *Pratylenchus penetrans*), a *Tylenchulus*-fajták (így *Tylenchulus semipenetrans*) és a *Longidorus*-, *Trichodorus*-, *Xiphinema*-, *Ditylenchus*-, *Apheenchoides* és *Anguina*-fajták, különösen a *Meloidogyne*-fajták (így *Meloidogyne incognita*) és a *Heterodera*-fajták (így *Heterodera glycines*).

A találmány szerinti (I) általános képletű vegyületek különösen fontos előnye, hogy a növényekkel táplálkozó élősdiek ellen is védelmet nyújtanak.

A találmány szerinti vegyületek mezőgazdasági, kertészeti és erdészeti haszonnövények és dísznövények és növényi részek (így termés, virág, levél, szár, gumó és gyökér) védelmére alkalmasak a fent felsorolt kártevőkkel szemben. Esetenként a találmány szerinti vegyületek a kezeléskor még ki nem fejlődött növényi részeknek és védelmet nyújthatnak. A leírásban a "kártévőirtás" megjelölésen a kártevők növekedésének gátlását vagy visszaszorítását is értjük.

A találmány szerinti vegyületekkel védhető haszonnövények elsősorban a következők lehetnek: gabonafélék, így búza, árpa, rozs, zab, rizs, kukorica és köles; répafélék, így cukorrépa és takarmányrépa; gyümölcsök, így magvas gyümölcsök, csonthéjas gyümölcsök és lággyümölcsök, például alma, körte, szilva, őszibarack, mandula, cseresznye és bogyós gyümölcsök (így földieper, málna és szeder); hüvelyesek, így bab, lencse, borsó, és szójabab; olajos magvú növények, így repce, mustár, mák, oliva, napraforgó, kókuszdió, ricinus, kakaó és földimogyoró; tökfélék, így tök, uborka és dinnye; rostonövények, így len, kender és juta; citrusfélék, így narancs,

citrom, grapefruit és mandarin; zöldségfélék, így paraj, saláta, spárga, káposzta, karotta, hagyma, paradicsom, burgonya és paprika; borostyánfélék, így avokádó, fahéj és kámforfa; továbbá dohány, diófélék, kávé, padlizsán, cukornád, tea, bors, szőlő, komló, banán, természetes gumicserjék és dísznövények.

A találmány szerinti vegyületek raktározott áruk, raktárhelyiségek és nyersanyagok védelmére is felhasználhatók. A találmány szerinti vegyületek közegészségügyi és higiéniai célokra is felhasználhatók elsősorban haszonállatok és háziállatok védelmére a fent felsorolt kártevőkkel szemben. Az utóbbi terület egyik fontos részterülete a háziállatok (elsősorban macskák és kutyák) bolha-, kullancs- és fonalféreg-fertőzésekkel szembeni védelme.

A találmány tárgyát képezik továbbá a találmány szerinti vegyületek legalább egyikét tartalmazó kártevőirtó készítmények, amelyek például emulgeálható koncentrátumok, szuszpenziós koncentrátumok, közvetlenül vagy hígítás után kipermetezhető oldatok, szétteríthető pépek, híg emulziók, nedvesíthető porok, oldható porok, diszpergálható porok, nedvesíthető porok, porozószerkezetek, granulátumok és polimerbe kapszulázott készítmények lehetnek. A készítménytípust a felhasználás céljának és körülményeinek megfelelően választjuk meg.

Ezek a készítmények kizárólag a hatóanyagból állhatnak (ilyenek például a szilárd hatóanyagok adott részecskeméretű formái), előnyösen azonban a hatóanyag mellett legalább egy szokásos formálási segédanyagot, például hordozóanyagot vagy hígítószeret (így oldószeret vagy szilárd hordozóanyagot) vagy felületaktív anyagot is tartalmaznak. Nyilvánvaló, hogy az embereken, háziállatokon, hobbiállatokon és tenyészállatokon élősködő kártevők irtására szánt készítmények csak életlenül elfogadható segédanyagokat tartalmazhatnak.

A formálási segédanyagok például szilárd hordozóanyagok, oldószerkezetek, stabilizálószerkezetek, lassú hatóanyag-felszabadulást biztosító segédanyagok, színezékek

és felületaktív anyagok lehetnek. Ezekre a célokra a szokásos formálási segédanyagok bármelyikét felhasználhatjuk. A készítmények kialakításához felhasználható segédanyagok, például oldószerek, szilárd hordozóanyagok, anionos, nemionos és kationos felületaktív anyagok és más funkciót betöltő segédanyagok például az EP-A-736 252 sz. szabadalmi leírás 7. oldalának 51. sorától 8. oldalának 39. soráig terjedő részében felsoroltak lehetnek.

A növényvédelemben, továbbá emberek, háziállatok és haszonállatok védelmére felhasználandó készítmények rendszerint 0,1-99 tömeg %, előnyösen 0,1-95 tömeg % hatóanyagot és összesen 1-99,9 tömeg %, előnyösen 5-99,9 tömeg % egy vagy több szilárd vagy folyékony segédanyagot tartalmaznak. A készítmények rendszerint 0-25 tömeg %, előnyösen 0,1-20 tömeg % felületaktív anyagot tartalmaznak. A kereskedelemben forgalmazott készítmények előnyösen koncentrátumok lehetnek, a végső felhasználó azonban általában hígított készítményeket használ, amelyek hatóanyagtartalma a fent közöltekénél sokkal kisebb lehet. Ezek a hígított készítmények is a találmány tárgyát képezik.

Növényvédelem céljára előnyösen a következő összetételű készítményeket használhatjuk (a %-os értékek tömeg %-ot jelentenek):

Emulgeálható koncentrátumok:

hatóanyag:	1-90 %, előnyösen 5-20 %
felületaktív anyag:	1-30 %, előnyösen 10-20 %
oldószer:	5-98 %, előnyösen 70-85 %

Porozószer:

hatóanyag:	0,1-10 %, előnyösen 0,1-1 %
szilárd hordozóanyag:	99,9-90 %, előnyösen 99,9-99 %

Szuszpenziós koncentrátumok:

hatóanyag:	5-75 %, előnyösen 10-50 %
------------	---------------------------

víz: 94-24 %, előnyösen 88-30 %

felületaktív anyag: 1-40 %, előnyösen 2-30 %

Nedvesíthető porkészítmények:

hatóanyag: 0,5-90 %, előnyösen 1-80 %

felületaktív anyag: 0,5-20 %, előnyösen 1-15 %

szilárd hordozóanyag: 5-99 %, előnyösen 15-98 %

Granulátumok:

hatóanyag: 0,5-30 %, előnyösen 3-15 %

szilárd hordozóanyag: 99,5-70 %, előnyösen 97-85 %

A találmány szerinti készítmények egyéb szilárd vagy folyékony segédanyagokat, például stabilizálószereket (így növényi olajokat vagy epoxidált növényi olajokat, köztük epoxidált kókusz-, repce- vagy szójaolajat), habzásgátlókat (például szilikonolajat), konzerválószereket, viszkozitásszabályozó anyagokat, kötőanyagokat és/vagy tapadásfokozó anyagokat, továbbá műtrágyákat vagy - speciális hatás elérése céljából - más hatóanyagokat (például akaricid, baktericid, fungicid, nematocid, molluszkicid vagy szelektív herbicid hatóanyagokat) is tartalmazhatnak.

A találmány szerinti növényvédőszereket szokásos módszerekkel állíthatjuk elő. Segédanyagot nem tartalmazó készítmények előállítása esetén például úgy járhatunk el, hogy a szilárd hatóanyagot vagy hatóanyag-keveréket őröljük, szitáljuk és/vagy préseljük (ezzel például adott részecskeméretű készítményt alakíthatunk ki). Az egy vagy több segédanyagot is tartalmazó készítmények előállítása során például a hatóanyagokat vagy azok keverékét alaposan összekeverjük és/vagy összeőröljük a segédanyagokkal. Oltalmi igényünk ezekre az eljárásokra, valamint az (I) általános képletű vegyületek ilyen készítmények előállításában való felhasználására is kiterjed.

A találmány tárgyát képezi továbbá a növényvédőszer felhasználása, azaz a találmány tárgya továbbá eljárás a fent felsorolt típusú kártevők irtására oly módon, hogy a találmány szerinti növényvédőszert az elérendő célnak és az adott körülményeknek megfelelő módon (például permetezéssel, porlasztással, porozással, bevonással, csávázással, kiszórással vagy elárasztással) felvisszük a kezelendő területre. A kezelésre közvetlenül felhasznált készítmények hatóanyagtartalma jellemzően 0,1-1000 ppm, előnyösen 0,1-500 ppm lehet. A hatóanyag hektáronkénti felviteli aránya jellemzően 1-2000 g hatóanyag/hektár, előnyösen 10-1000 g hatóanyag/hektár, célszerűen 20-600 g hatóanyag/hektár lehet.

A növényvédelem terén a hatóanyagokat előnyösen a növények levélzetére vesszük fel (levélkezelés) a kártevővel való megfertőződés kockázatának megfelelő mennyiségben és gyakorisággal. A hatóanyag azonban a gyökereken keresztül is be tud hatolni a növényekben (szisztémás hatás); ennek megfelelően eljárhatunk úgy is, hogy a növények termőterületét itatjuk át a folyékony készítménnyel, vagy a hatóanyagot szilárd készítmény (például granulátum) formájában ágyazzuk be a növények termesztőközegébe, például a talajba (talajkezelés). Elárasztásos rizskultúrák esetén eljárhatunk úgy is, hogy az elárasztott rizsföldre viszünk fel mért mennyiségű granulátumot.

A találmány szerinti növényvédőszerekkel a növények szaporítóanyagai [például a növények termései (így a gyümölcsök, gumók vagy magvak) vagy dugványai] is védhetők állati kártevőkkel szemben. A szaporítóanyagot kiültetés előtt kezelhetjük a találmány szerinti készítményekkel; így például a magvakat vetés előtt a találmány szerinti készítményekkel csávázhatjuk. A találmány szerinti hatóanyagokat közvetlenül is felvihetjük a magvakra (bevonás) például úgy, hogy a magvakat folyékony készítménnyel impregnáljuk, vagy azokat szilárd készítménnyel vonjuk be. Más megoldás szerint a találmány szerinti készítményeket a szaporítóanyag kiültetése

előtt juttathatjuk a növények természetközegébe, például vetés során a barázdákba. Oltalmi igényünk ezekre a kezelésmódokra és az így kezelt növényi szaporítóanyagokra is kiterjed.

A találmány további részleteit az oltalmi kör korlátozása nélkül a következő példákkal szemléltetjük.

Példák a találmány szerinti vegyületek előállítására

A következő példákkal az avermektin B1 származékok (avermektin B1a és B1b származékok keverékei) előállítását szemléltetjük. A B1b származék rendszerint a keverék 5-10 tömeg %-át képezi, ezért az NMR spektrumokban általában csak a B1a származéokra jellemző vonalak jelennek meg.

Minthogy a vegyületek rendszerint az adott avermektin B1a és avermektin B1b származék keveréke formájában képződnek, a szokásos fizikai állandók (például olvadáspont vagy törésmutató) kevésbé alkalmasak a vegyületek jellemzésére. Ezért a vegyületeket a kromatográfiás tisztítás után felvett NMR spektrumukkal a HPLC (nagy felbontóképességű folyadékkromatográfia) elemzés során meghatározott retenciós idővel jellemeztük. A példákban a fizikai állandóknál közölt "B1a" megjelölés a fő komponenst jelenti, azaz azt a vegyületet, amelyben R_1 szek-butil-csoportot jelent, míg a "B1b" megjelölés a mellékkomponentet, azaz az R_1 helyén izopropil-csoportot tartalmazó vegyületet jelenti. Ahol a példákban csak a B1a komponens retenciós idejét közöltük, ez azt jelenti, hogy a B1b komponens retenciós idejét - annak csekély részaránya miatt - nem tudtuk meghatározni. A B1a és B1b komponens szerkezetét tömegspektrometriával azonosítottuk.

A HPLC elemzésekhez 125 mm hosszú, 2 mm belső átmérőjű YMC-Pack OSD-AQ oszlopot (gyártja: YMC, Alte Raesfelderstrasse 6, 46514 Schermbeck, Németország) használtunk 40°C hőmérsékleten. "A" oldószerként 0,01 % trifluor-ecetsavat tartalmazó vizet, "B" oldószerként pedig 0,01 % trifluor-ecetsavat tartalma-

zó acetonitrilt használtunk. A futtatószer összetétele gradiens szerint változott a következőknek megfelelően:

Idő, perc	"A" oldószer	"B" oldószer	Áramlási sebesség, $\mu\text{l}/\text{perc}$
0	80	20	500
0,1	50	50	500
10	5	95	500
15	0	100	500
17	0	100	500
17,1	80	20	500
22	80	20	500

A példákban az "éter" megjelölésen dietil-étert, a TBDMS megjelölésen dimetil-terc-butil-szilil-csoportot $[-\text{Si}(\text{CH}_3)_2(\text{terc-butil})]$ értünk. Az oldószer-elegyek összetételénél közölt %-os adatok térfogat %-ok, a megadott arányok térfogatarányok.

P1. példa

Az (1) képletű 4"-(szulfamoil-oxi)-avermektin B1 előállítása

A reagensként felhasznált szulfamoil-klorid (ClSO_2NH_2) előállítása:

35 ml klórszulfonil-izocianátba -10°C -on 15,5 ml hangyasavat csepegtettünk, miközben az elegy hőmérsékletét jeges hűtéssel $+10^\circ\text{C}$ alatti értéken tartottuk. A hangyasav beadagolása után az elegyet a gázfejlődés megszűnéséig szobahőmérsékleten kevertük. A kapott elegyet benzolban felvettük, szűrtük, és csökkentett nyomáson bepároltuk. A kívánt reagenst kaptuk.

(A) lépés: 15 g O-TBDMS-avermektin B1 90 ml dimetil-acetamiddal készített oldatához -10°C -on, részletekben, argon atmoszférában 3,51 g szulfamoil-kloridot adtunk. Az elegyet szobahőmérsékletre hagytuk melegedni, és még 1 órán át kevertük. Ezután az elegyet telített vizes nátrium-klorid oldatba öntöttük, és a kapott ele-



gyet terc-butilmetil-éterrel kétszer extraháltuk. Az extraktumokat egyesítettük, vízmentes nátrium-szulfát fölött szárítottuk, és bepároltuk. 5-O-TBDMS-4''-(O-szulfamoil-oxi)-avermektin B1-et kaptunk.

(B) lépés: Az (A) lépés szerint kapott nyers terméket 75 ml metanolban oldotunk, és az oldatba 1 óra alatt, -5°C -on 1,5 ml metánszulfonsav 75 ml metanollal készített oldatát csepegtettük. Az elegyet szobahőmérsékletre hagytuk melegedni, és 4 órán át szobahőmérsékleten tartottuk. Az oldatot telített vizes nátrium-hidrogén-karbonát oldatba öntöttük, a kapott elegyet csökkentett nyomáson betöményítettük, és a maradékot terc-butil-metil-éterrel extraháltuk. Az extraktumot telített vizes nátrium-klorid oldattal mostuk, vízmentes nátrium-szulfát fölött szárítottuk, majd bepároltuk. A kapott nyers terméket szilikagél oszlopon gyorskromatografálva tisztítottuk, eluálószerként diklór-metán és etil-acetát 9:1 arányú elegyét használtuk. A kívánt terméket kaptuk szintelen hab formájában.

A 4''-(szulfamoil-oxi)-avermektin B1 fizikai állandói a következők:

molekulatömeg ($\text{C}_{48}\text{H}_{73}\text{NO}_{16}\text{S}$): 951,5.

LCMS: t_{R} B1a: 9,08 perc, 974 (M+Na), 952,2 (M+H); B1b: 8,44 perc.

NMR (250 MHz, CDCl_3) δ : 1,48 (s, 3H, CH_3 -14a), 1,86 (s, 3H, CH_3 -4a), 3,21 (t, 1H, $J=9,2$ Hz, CH-4'), 3,28 (m, 1H, CH-2), 3,40 (s, 3H, OCH_3), 3,42 (s, 3H, OCH_3), 3,95 (d, 1H, $J=6,4$ Hz, CH-6), 4,05 (s, 1H, HO-C-7), 4,14 (t, 1H, $J=9,6$ Hz, CH-4''), 4,28 (m, 1H, CH-5), 4,67 (m, 2H, CH_2 -8a), 4,76 (d, 1H, $J=2,75$ Hz, CH-1'), 4,96 (m, 1H, CH-15), 5,10 (szs, 2H, $\text{H}_2\text{NSO}_2\text{OC}$ -4'')

P2. példa

A (2) képletű 4''-(metil-amino-szulfonil-oxi)-avermektin B1 előállítása

A reagensként felhasznált N-metil-szulfamoil-klorid (ClSO_2NHMe) előállítása:

65 ml szulfuril-klorid 50 ml acetonitrillel készített oldatához 16,9 g metil-amin-



-hidroklorid 80 ml acetonitrillel készített oldatát adtuk. Az elegyet 24 órán át 60°C-on tartottuk, majd szobahőmérsékletre hűtöttük, szűrtük, és a szűrletet bepároltuk. A barna, olajos maradék vákuumdesztillálásával a kívánt reagenst kaptuk színtelen olaj formájában.

(A) lépés: 400 mg 5-O-TBDMS-avermektin B1 5 ml dimetil-acetamiddal készített oldatához argon atmoszférában, 0°C-on 240 mg N-metil-szulfamoil-kloridot adtunk, és az elegyet 2 órán át szobahőmérsékleten tartottuk. Az elegyet telített vizes nátrium-klorid oldatba öntöttük, és a kapott elegyet etil-acetáttal kétszer extraháltuk. Az extraktumokat egyesítettük, vízmentes nátrium-szulfát fölött szárítottuk, majd bepároltuk. 5-O-TBDMS-4"-O-(N-metil-szulfamoil-oxi)-avermektin B1-et kaptunk.

(B) lépés: Az (A) lépésben kapott nyers termék 5 ml abszolút tetrahidrofuránnal készített oldatához 1 ml HF-piridin reagenst (összetétele: 25 g kereskedelmi minőségű 70 %-os piridines HF oldat, 27,5 ml tetrahidrofurán, 12,5 ml piridin) adtunk, és az elegyet 12 órán át szobahőmérsékleten állni hagytuk. A reakcióelegyet vízbe öntöttük, és a kapott elegyet éterrel kétszer extraháltuk. Az extraktumokat egyesítettük, telített vizes nátrium-hidrogén-karbonát oldattal mostuk, vízmentes nátrium-szulfát fölött szárítottuk, majd bepároltuk. A kapott nyers terméket szilikagélen kromatografálva tisztítottuk, eluálószerként hexán és etil-acetát 1:1 arányú elegyét használtuk. A kívánt terméket kaptuk színtelen hab formájában.

A 4"-(metil-amino-szulfonil-oxi)-avermektin B1 fizikai állandói a következők:

molekulatömeg ($C_{49}H_{75}O_{16}S$): 965,5.

LCMS: t_R B1a: 9,88 perc, 988,3 (M+Na), 966,6 (M+H); B1b: 9,24 perc.

NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ : 1,48 (s, 3H, CH_3 -14a), 1,86 (s, 3H, CH_3 -4a), 2,80 (d, 3H, $J=5,5$ Hz, H_3CNHSO_2OC -4"), 3,21 (t, 1H, $J=9,2$ Hz, CH-4'), 3,28 (m, 1H, CH-2), 3,40 (s, 3H, OCH_3), 3,42 (s, 3H, OCH_3), 3,95 (d, 1H, $J=6,4$ Hz, CH-6), 4,08 (t, 1H, $J=9,1$ Hz, CH-4"), 4,28 (m, 1H, CH-5), 4,67 (m, 2H, CH_2 -8a), 4,76 (d, 1H, $J=2,75$ Hz, CH-

-1'), 4,78 (q, 1H, J=5,5 Hz, HN(CH₃)SO₂OC-4"), 4,96 (m, 1H, CH-15).

P3. példa

A (3) képletű 4''-(etil-amino-szulfonil-oxi)-avermektin B1 előállítása

A reagensként felhasznált N-etil-szulfamoil-klorid (CISO₂NHEt) előállítása:

7,3 ml szulfuril-klorid 15 ml acetonitrillel készített oldatához 16,9 g etil-amin-hidrokloridot adtunk. Az elegyet 12 órán át keverés és visszafolyatás közben forraltuk, majd szobahőmérsékletre hűtöttük, szűrtük, és a szűrletet bepároltuk. A kapott maradékot 0,05 Hgmm nyomáson 100°C-on desztilláltuk. A kívánt reagenst kaptuk színtelen olaj formájában.

(A) lépés: 400 mg 5-O-TBDMS-avermektin B1 5 ml dimetil-acetamiddal készített oldatához 0°C-on, argon atmoszférában 240 mg N-etil-szulfamoil-kloridot adtunk, és az elegyet 12 órán át szobahőmérsékleten tartottuk. Az elegyet telített vizes nátrium-klorid oldatba öntöttük, és a kapott elegyet etil-acetáttal kétszer extraháltuk. Az extraktumokat egyesítettük, vízmentes nátrium-szulfát fölött szárítottuk, majd bepároltuk. 5-O-TBDMS-4''-O-(N-etil-szulfamoil-oxi)-avermektin B1-et kaptunk.

(B) lépés: Az (A) lépés szerint kapott nyers termék 1,5 ml metanollal készített oldatához 0°C-on 0,2 ml metánszulfonsavat adtunk, és az elegyet 20 percig szobahőmérsékleten tartottuk. A reakcióelegyet telített vizes nátrium-hidrogén-karbonát oldatba öntöttük, és a kapott elegyet bepárlással betöményítettük. A maradékot etil-acetáttal extraháltuk. Az extraktumot telített vizes nátrium-klorid oldattal mostuk, vízmentes nátrium-szulfát fölött szárítottuk, majd bepároltuk. A nyers terméket szilikagélen gyorskromatografálva tisztítottuk, eluálószerként hexán és etil-acetát 1:1 arányú elegyét használtuk. A kívánt terméket kaptuk sárga hab formájában.

A 4''-(etil-amino-szulfonil-oxi)-avermektin B1 fizikai állandói a következők:

molekulatömeg (C₅₀H₇₇NO₁₆S): 979.

LCMS: t_R B1a: 10,25 perc, 1002,2 (M+Na), 980,5 (M+H); B1b: 9,56 perc.



NMR (300 MHz, CDCl_3) δ : 1,21 (t, 3H, $J=7,3$ Hz, H_3CCH_2), 1,48 (s, 3H, CH_3 -14a), 1,86 (s, 3H, CH_3 -4a), 2,80 (d, 3H, $J=5,5$ Hz, $\text{H}_3\text{CNHSO}_2\text{OC-4''}$), 3,39 (s, 3H, OCH_3), 3,42 (s, 3H, OCH_3), 3,96 (d, 1H, $J=5,9$ Hz, CH-6), 4,10 (t, 1H, $J=9,1$ Hz, CH-4''), 4,28 (m, 1H, CH-5), 4,68 (m, 2H, CH_2 -8a), 4,73 (t, 1H, $J=4,6$ Hz, $\text{HN}(\text{CH}_2\text{CH}_3)\text{SO}_2\text{OC-4''}$), 4,96 (m, 1H, CH-15).

P4. példa

A (4) képletű 4''-(allil-amino-szulfonil-oxi)-avermektin B1 előállítása

238 mg 4''-(szulfamoil-oxi)-avermektin B1, 138 mg kálium-karbonát és 0,1 ml allil-bromid 5 ml acetonitrillel készített oldatát 5 órán át szobahőmérsékleten kevertük. Az oldatot vízbe öntöttük, a vizes elegyet éterrel extraháltuk, és az extraktumot vízmentes nátrium-szulfát fölött szárítottuk. A kívánt terméket szilikagél oszlopon végzett kromatografálással különítettük el a nyers elegyből; eluálószerként hexán és etil-acetát 65:35 arányú elegyét használtuk.

A 4''-(allil-amino-szulfonil-oxi)-avermektin B1 fizikai állandói a következők:
molekulatömeg ($\text{C}_{51}\text{H}_{77}\text{N}_{16}\text{S}$): 991,5.

LCMS t_R : B1a 9,78 perc, 1014,5 ($\text{M}+\text{Na}$), 992,5 ($\text{M}+\text{H}$); B1b 9,28 perc.

NMR (300 MHz, CDCl_3) δ : 1,48 (s, 3H), CH_3 -14a), 1,86 (s, 3H, CH_3 -4a), 3,21 (t, 1H, $J=9,2$ Hz, CH-4'), 3,29 (m, 1H, CH-2), 3,36 (s, 3H, OCH_3), 3,42 (s, 3H, OCH_3), 3,96 (d, 1H, $J=6,4$ Hz, CH-6), 4,13 (t, 1H, $J=9,6$ Hz, CH-4''), 4,28 (m, 1H, CH-5), 4,67 (m, 2H, CH_2 -8a), 4,77 (d, 1H, $J=2,8$ Hz, CH-1'), 4,90 (dd, 1H, $J=7,8$ és 4,6 Hz, $\text{NHSO}_2\text{OC-4''}$), 4,96 (m, 1H, CH-15).

P5. példa

Az (5) képletű 4''-(diallil-amino-szulfonil-oxi)-avermektin B1 előállítása

238 mg 4''-szulfamoil-oxi-avermektin B1, 138 mg kálium-karbonát és 0,1 ml allil-bromid 5 ml acetonitrillel készített oldatát 1 órán át keverés és visszafolytatás közben forraltuk. Az oldatot vízbe öntöttük, és éterrel extraháltuk. Az extraktumot



vízmentes nátrium-szulfát fölött szárítottuk, majd bepároltuk. A cím szerinti vegyületet kaptuk.

A 4''-(diallil-amino-szulfonil-oxi)-avermektin B1 fizikai állandói a következők:
molekulatömeg ($C_{59}H_{81}NO_{16}S$): 1031,5.

LCMS: t_R : B1a 11,47 perc, 1054,5 (M+Na), 1032,5 (M+H), B1b 10,89 perc.

NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ : 1,48 (s, 3H, CH_3 -14a), 1,86 (s, 3H, CH_3 -4a), 3,21 (t, 1H, $J=9,2$ Hz, CH-4'), 3,29 (m, 1H, CH-2), 3,43 (s, 3H, OCH_3), 3,48 (s, 3H, OCH_3), 3,96 (d, 1H, $J=6,4$ Hz, CH-6), 4,13 (t, 1H, $J=9,1$ Hz, CH-4''), 4,38 (m, 1H, CH-5), 4,67 (m, 2H, CH_2 -8a), 4,75 (m, 1H, CH-1'), 4,96 (m, 1H, C-15).

P6. példa

A (6) képletű 4''-[(2-hidroxi-etil)-amino-szulfonil-oxi]-avermektin B1 előállítása

238 mg 4''-szulfamoil-oxi-avermektin B1, 138 mg kálium-karbonát és 0,1 ml 2-bróm-etanol 5 ml acetonitrillel készített oldatát 12 órán át keverés és visszafolytatás közben forraltuk. Az oldatot vízbe öntöttük, és az elegyet éterrel extraháltuk. Az extraktumot vízmentes nátrium-szulfát fölött szárítottuk. A cím szerinti vegyületet szilikagél oszlopon végzett kromatografálással különítettük el a nyers elegyből; eluálószerként hexán és etil-acetát 30:70 arányú elegyét használtuk.

A 4''-[(2-hidroxi-etil)-amino-szulfonil-oxi]-avermektin B1 fizikai állandói a következők:

molekulatömeg ($C_{50}H_{77}NO_{17}S$): 995,5.

LCMS t_R : B1a 8,43 perc, 1018,45 (M+Na), 996,5 (M+H), B1b 7,79 perc.

NMR (250 MHz, $CDCl_3$) δ : 1,17 (t, 3H, $J=6,9$ Hz, H_2COH), 1,48 (s, 3H, CH_3 -14a), 1,86 (s, 3H, CH_3 -4a), 3,21 (t, 1H, $J=9,1$ Hz, CH-4'), 3,28 (m, 1H, CH-2), 3,31 (m, 2H, H_2CNH), 3,41 (s, 3H, OCH_3), 3,42 (s, 3H, OCH_3), 3,96 (d, 1H, $J=6,4$ Hz, CH-6), 4,14 (t, 1H, $J=9,1$ Hz, CH-4''), 4,28 (m, 1H, CH-5), 4,67 (m, 2H, CH_2 -8a), 4,76 (d, 1H, $J=3,2$ Hz, CH-1'), 4,96 (m, 1H, CH-15), 5,23 (dd, 1H, $J=6,9$ és 5,5 Hz, $HNSO_2OC$ -4'').

P7. példa

A (7) képletű 4''-(dimetil-amino-szulfonil-oxi)-avermektin B1 előállítása

238 mg 4''-(szulfamoil-oxi)-avermektin B1, 138 mg kálium-karbonát és 0,1 ml metil-jodid 5 ml acetonitrillel készített oldatát 5 órán át keverés és visszafolyatás közben forraltuk. Az oldatot vízbe öntöttük, és az elegyet éterrel extraháltuk. Az extraktumot vízmentes nátrium-szulfát fölött szárítottuk. A cím szerinti vegyületet szilikagél oszlopon végzett kromatografálással különítettük el a nyers elegyből; eluálószerként hexán és etil-acetát 1:1 arányú elegyét használtuk.

A 4''-(dimetil-amino-szulfonil-oxi)-avermektin B1 fizikai állandói a következők:
molekulatömeg ($C_{50}H_{77}NO_{16}S$): 979,5.

LCMS t_R : B1a 10,69 perc, 1002,5 (M+Na).

NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ : 1,48 (s, 3H, CH_3 -14a), 1,87 (s, 3H, CH_3 -4a), 2,91 (s, 6H, $(H_3C)_2N$), 3,21 (t, 1H, $J=9,1$ Hz, CH-4'), 3,28 (m, 1H, CH-2), 3,40 (s, 3H, OCH_3), 3,43 (s, 3H, OCH_3), 3,96 (d, 1H, $J=6,4$ Hz, CH-6), 4,08 (t, 1H, $J=9,1$ Hz, HC-4''), 4,68 (m, 2H, CH_2 -8a), 4,76 (szd, 1H, $J=2,8$ Hz, CH-1'), 4,96 (m, 1H, CH-15).

P8. példa

A (8) képletű 4''-(dipropargil-amino-szulfonil-oxi)-avermektin B1 előállítása

238 mg 4''-(szulfamoil-oxi)-avermektin B1, 138 mg kálium-karbonát és 0,14 ml 80 %-os toluolos propargil-bromid oldat 5 ml acetonitrillel készített oldatát 18 órán át szobahőmérsékleten kevertük. Az oldatot vízbe öntöttük, és a kapott elegyet éterrel extraháltuk. Az extraktumot vízmentes nátrium-szulfát fölött szárítottuk. A kívánt terméket szilikagél oszlopon végzett kromatografálással különítettük el a nyers elegyből; eluálószerként hexán és etil-acetát 65:35 arányú elegyét használtuk.

A 4''-(dipropargil-amino-szulfonil-oxi)-avermektin B1 fizikai állandói a következők:

molekulatömeg ($C_{54}H_{77}NO_{16}S$): 1027,5.



LCMS t_R : B1a 10,62 perc, 1050,4 (M+Na), 1028,5 (M+H), B1b 9,98 perc.

NMR (250 MHz, $CDCl_3$) δ : 1,48 (s, 3H, CH_3 -14a), 1,86 (s, 3H, CH_3 -4a), 2,34 (t, 2H, $J=2,3$ Hz, $HCCCH_2$), 3,20 (t, 1H, $J=8,7$ Hz, CH-4'), 3,28 (m, 1H, CH-2), 3,40 (s, 3H, OCH_3), 3,42 (s, 3H, OCH_3), 3,96 (d, 1H, $J=5,9$ Hz, CH-6), 4,23 (ABX rendszer, 4H, $J=17,8$ és $2,9$ Hz, H_2CNHSO_2OC -4''), 4,67 (m, 2H, CH_2 -8a), 4,76 (szd, 1H, $J=3,2$ Hz, CH-1'), 4,96 (m, 1H, CH-15).

P9. példa

A (9) képletű 4''-[bisz(ciano-metil)-amino-szulfonil-oxi]-avermektin B1 előállítása

238 mg 4''-(szulfamoil-oxi)-avermektin B1, 138 mg kálium-karbonát és 0,09 ml brómacetonitril 5 ml acetonitrillel készített oldatát 10 órán át szobahőmérsékleten kevertük. Az oldatot vízbe öntöttük, és az elegyet éterrel extraháltuk. Az extraktumot vízmentes nátrium-szulfát fölött szárítottuk. A cím szerinti vegyületet szilikagél oszlopon végzett kromatografálással különítettük el a nyers elegyből; eluálószerként hexán és etil-acetát 60:40 arányú elegyét használtuk.

A 4''-[bisz(ciano-metil)-amino-szulfonil-oxi]-avermektin B1 fizikai állandói a következők:

molekulatömeg ($C_{52}H_{75}N_3O_{16}S$): 1029,5.

LCMS t_R : B1a 9,88 perc, 1052,4 (M+Na), 1030,5 (M+H), B1b 9,29 perc.

NMR (250 MHz, $CDCl_3$) δ : 1,48 (s, 3H, CH_3 -14a), 1,86 (s, 3H, CH_3 -4a), 3,19 (t, 1H, $J=8,7$ Hz, CH-4'), 3,28 (m, 1H, CH-2), 3,40 (s, 3H, OCH_3), 3,42 (s, 3H, OCH_3), 3,96 (d, 1H, $J=6,4$ Hz, CH-6), 4,22 (t, 1H, $J=9,1$ Hz, CH-4''), 4,38 (AB rendszer, 4H, $J=18,3$ Hz, H_2CCN), 4,67 (m, 2H, CH_2 -8a), 4,76 (szd, 1H, $J=3,2$ Hz, CH-1'), 4,96 (m, 1H, CH-15).

P10. példa

A (10) képletű 4''-(pirrolidino-szulfonil-oxi)-avermektin B1 előállítása

238 mg 4''-(szulfamoil-oxi)-avermektin B1, 138 mg kálium-karbonát és 0,15 ml



1,4-dibrom-bután 5 ml acetonitrillel készített elegyét 12 órán át keverés és visszafolyatás közben forraltuk. Az oldatot vízbe öntöttük, és a kapott elegyet éterrel extraháltuk. Az extraktumot vízmentes nátrium-szulfát fölött szárítottuk. A kívánt terméket szilikagél oszlopon végzett kromatografálással különítettük el a nyers elegyből; eluálószerként hexán és etil-acetát 60:40 arányú elegyét használtuk.

A 4''-(pirrolidino-szulfonil-oxi)-avermektin B1 fizikai állandói a következők:
molekulatömeg ($C_{52}H_{79}NO_{16}S$): 1005,5.

LCMS t_R : B1a 10,67 perc, 1028,5 (M+Na), 1006,5 (M+H), B1b 10,03 perc.

NMR (250 MHz, $CDCl_3$) δ : 1,48 (s, 3H, CH_3 -14a), 1,86 (s, 3H, CH_3 -4a), 3,21 (t, 1H, $J=8,7$ Hz, CH-4'), 3,28 (m, 1H, CH-2), 3,38 (s, 3H, OCH_3), 3,42 (s, 3H, OCH_3), 3,96 (d, 1H, $J=5,9$ Hz, CH-6), 4,28 (m, 1H, HC-5), 4,67 (m, 2H, CH_2 -8a), 4,76 (szd, 1H, $J=3,2$ Hz, CH-1'), 4,96 (m, 1H, CH-15).

P11. példa

A (11) képletű 4''-(benzoil-amino-szulfonil-oxi)-avermektin B1 előállítása

200 mg 4''-(szulfamoil-oxi)-avermektin B1, 0,15 ml benzoil-klorid, 3 ml etil-acetát és 3 ml telített vizes nátrium-hidrogén-karbonát oldat elegyét 6 órán át 70°C-on kevertük. Az elegyet vízbe öntöttük, és a kapott elegyet éterrel extraháltuk. Az extraktumot vízmentes nátrium-szulfát fölött szárítottuk. A kívánt terméket szilikagél oszlopon végzett kromatografálással különítettük el a nyers elegyből; eluálószerként hexán és etil-acetát 1:1 arányú elegyét használtuk.

A 4''-(benzoil-amino-szulfonil-oxi)-avermektin B1 fizikai állandói a következők:
molekulatömeg ($C_{55}H_{77}O_{17}S$): 1055,5.

LCMS t_R : B1a 9,83 perc, 1078,4 (M+Na), 1056,5 (M+H), B1b 9,18 perc.

P12. példa

A (12) képletű 4''-epi-(szulfamoil-oxi)-avermektin B1 előállítása

197 mg (0,2 mmól) 4''-epi-5-O-TBDMS-avermektin B1 3 ml dimetil-acetamid-

A fenti 5-O-TBDS-4"-epi-(szulfamoil-oxi)-avermektin B1 5 ml abszolút tetra-
hidrofuránnal készített oldatához 1 ml HF-piridin reagenst (összetétele: 25 g 70 %-os
piridines HF oldat, 27,5 ml tetrahidrofurán, 12,5 ml piridin) adtunk, és az elegyet 12
órán át szobahőmérsékleten állni hagytuk. A reakcióelegyet vízbe öntöttük, és a ka-
pott elegyet éterrel kétszer extraháltuk. Az extraktumokat egyesítettük, telített vizes
nátrium-hidrogén-karbonát oldattal mostuk, vízmentes nátrium-szulfát fölött szárítot-
tuk, majd bepároltuk. A kapott nyers terméket szilikagélen kromatografálva tisztítot-
tuk, eluálószerként hexán és etil-acetát 1:1 arányú elegyét használtuk. A kívánt
terméket kaptuk.

LCMS t_R: B1a 9,13 perc, 974,5 (M+Na), 952,5 (M+H), B1b 8,49 perc.

A felsorolt példákban közöltekkel analóg módon állítottuk elő az A. táblázatban és az 1-6. táblázatban összefoglalt (Ia) és (Ib) általános képletű vegyületeket, amelyekben R₁ szek-butil-csoportot (B1a) vagy izopropil-csoportot (B1b), R₂ pedig hidrogénatomot jelent.

A. táblázat

Sor-szám	Képlet	R ₂	R ₃	Retenciós idő, perc	
				B1a	B1b
P.1.	(Ia)	H	H	9,08	8,44
P.2.	(Ia)	H	CH ₃	9,88	9,24
P.3.	(Ia)	H	CH ₂ CH ₃	10,25	9,56
P.4.	(Ia)	H	allil	9,47	9,28
P.5.	(Ia)	allil	allil	11,47	10,89
P.6.	(Ia)	H	CH ₂ CH ₂ OH	8,43	7,77
P.7.	(Ia)	CH ₃	CH ₃	10,69	
P.8.	(Ia)	propargil	propargil	10,62	9,98
P.9.	(Ia)	CH ₂ CN	CH ₂ CN	9,88	9,29
P.10.	(Ia)	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		10,67	10,03
P.11.	(Ia)	H	C(O)Ph	9,83	9,18
P.12.	(Ib)	H	H	9,13	8,49
P.13.	(Ia)	H	C(O)izoPr	9,65	8,98
P.14.	(Ia)	H	C(O)Me	9,12	8,43
P.15.	(Ia)	H	C(O)Et	9,28	8,54
P.16.	(Ia)	H	C(O)-ciklopropil	9,44	8,80
P.17.	(Ia)	H	C(O)OCH ₃	9,55	8,91

B. táblázat(I) általános képletű vegyületek

Sor-szám	R ₂	Retenciós idő, perc	
		B1a	B1b
B.1.	izopropil-		
B.2.	propil-		
B.3.	n-butyl-		
B.4.	szek-butyl-		
B.5.	izobutyl-		
B.6.	terc-butyl-		
B.7.	-CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂		
B.8.	-CH(CH ₂ CH ₃)CH ₂ Cl		

Sor- szám	R ₂	Retenció idő, perc	
		B1a	B1b
B.9.	CH(CH ₃)CH ₂ OCH ₃		
B.10.	2-klór-propil-		
B.11.	3-klór-propil-		
B.12.	2-klór-etil-		
B.13.	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃		
B.14.	2-fluor-etil-		
B.15.	2-morfolino-etil-		
B.16.	2-pirrolidino-etil-		
B.17.	ciklopropil-		
B.18.	ciklobutil-		
B.19.	ciklopentil-		
B.20.	ciklohexil-		
B.21.	bisz(trifluor-metil)-metil-		
B.22.	benzil-		
B.23.	2-metil-allil-		
B.24.	3-metil-allil-		
B.25.	-CH ₂ C(O)OCH ₃		
B.26.	-CH ₂ CH ₂ C(O)OCH ₃		
B.27.	2-ftálimido-etil-		
B.28.	2-amino-etil-		
B.29.	2-(metil-amino)-etil-		
B.30.	2-(dimetil-amino)-etil-		
B.31.	-CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅		
B.32.	-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OCH ₃		
B.33.	3-ftálimido-propil-		
B.34.	4-ftálimido-butil-		
B.35.	-CH ₂ CONH ₂		
B.36.	-CH ₂ COOH		
B.37.	(2-fluor-fenil)-metil-		
B.38.	(3-fluor-fenil)-metil-		
B.39.	(2,6-difluor-fenil)-metil-		
B.40.	(4-fluor-fenil)-metil-		
B.41.	[4-(trifluor-metil)-fenil]-metil-		

Sor- szám	R ₂	Retenciósi idő, perc	
		B1a	B1b
B.42.	(a) képletű csoport		
B.43.	[4-(trifluor-metoxi)-fenil]-metil-		
B.44.	[4-(difluor-metil)-fenil]-metil-		
B.45.	(b) képletű csoport		
B.46.	(c) képletű csoport		
B.47.	(d) képletű csoport		
B.48.	(e) képletű csoport		
B.49.	(f) képletű csoport		
B.50.	(4-metoxi-fenil)-metil-		

1. táblázat

(Ia) általános képletű vegyületek, amelyekben R₁ szek-butyl-csoportot (B1a) vagy izopropil-csoportot (B1b) jelent, R₃ hidrogénatomot jelent, és R₂ a B. táblázatban B.1-B.50. sorszámon felsorolt csoportokat jelenti.

2. táblázat

(Ib) általános képletű vegyületek, amelyekben R₁ szek-butyl-csoportot (B1a) vagy izopropil-csoportot (B1b) jelent, R₃ hidrogénatomot jelent, és R₂ a B. táblázatban B.1-B.50. sorszámon felsorolt csoportokat jelenti.

C. táblázat

(I) általános képletű vegyületek

Sor- szám	R ₄	Retenciósi idő, perc	
		B1a	B1b
C.001.	izopropil-		
C.002.	propil-		
C.003.	n-butyl-		
C.004.	szek-butyl-		
C.005.	izobutyl-		
C.006.	terc-butyl-		
C.007.	metil-		

Sor- szám	R ₄	Retenciósidő, perc	
		B1a	B1b
C.008.	etil-		
C.009.	vinil-		
C.010.	2-klór-propil-		
C.011.	3-klór-propil-		
C.012.	2-klór-etil-		
C.013.	-CH ₂ CH ₂ OCH ₃		
C.014.	allil-		
C.015.	-CH ₂ OCH ₃		
C.016.	-CH ₂ O-fenil		
C.017.	ciklopropil-		
C.018.	ciklopentil-		
C.019.	ciklohexil-		
C.020.	-CH ₂ CH ₂ NH ₂		
C.021.	benzil-		
C.022.	fluor-metil-		
C.023.	difluor-metil-		
C.024.	(g) képletű csoport		
C.025.	(h) képletű csoport		
C.026.	-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ OMe		
C.027.	-OCH ₃		
C.028.	-OCH ₂ CH ₃		
C.029.	-O-allil		
C.030.	-OCH ₂ CH ₂ OH		
C.031.	-NH ₂		
C.032.	-NHCH ₃		
C.033.	-N(CH ₃) ₂		
C.034.	benzil-		

3. táblázat

(Ia) általános képletű vegyületek, amelyekben R_1 szek-butil-csoportot (B1a) vagy izopropil-csoportot (B1b) jelent, R_3 hidrogénatomot jelent, és R_2 $-C(=O)R_4$ csoportot jelent, amelyben R_4 a C. táblázatban C.001-C.034. sorszámon felsorolt csoportokat jelenti.

4. táblázat

(Ib) általános képletű vegyületek, amelyekben R_1 szek-butil-csoportot (B1a) vagy izopropil-csoportot (B1b) jelent, R_3 hidrogénatomot jelent, és R_2 $-C(=O)R_4$ csoportot jelent, amelyben R_4 a C. táblázatban C.001-C.034. sorszámon felsorolt csoportokat jelenti.

D. táblázat(I) általános képletű vegyületek

Sor-szám	R_2	R_3	Retenció idő, perc	
			B1a	B1b
D.001.		$-CH_2CH_2-$		
D.002.		$-CH_2CH_2CH_2-$		
D.003.		$-CH_2(CH_2)_3CH_2-$		
D.004.		$-CH_2CH_2OCH_2CH_2-$		
D.005.	etil-	etil-		
D.006.	etil-	metil-		
D.007.	allil-	metil-		
D.008.	$-CH_2CH_2OH$	metil-		
D.009.	$-C(O)CH_3$	metil-		
D.010.	$-C(O)OCH_3$	metil-		
D.011.	$-C(O)Ph$	metil-		
D.012.	$-SO_2NH_2$	H		
D.013.	$-SO_2NMe_2$	H		
D.014.		$=N^+=N^-$		
D.015.	benzil-	benzil-		
D.016.	(i) képletű csoport	(i) képletű csoport		
D.017.	(4-metoxi-fenil)-metil-	(4-metoxi-fenil)-metil-		

5. táblázat

(Ia) általános képletű vegyületek, amelyekben R_1 szek-butil-csoportot (B1a) vagy izopropil-csoportot (B1b) jelent, és R_2 és R_3 a D. táblázatban D.001-D.017. sorszámon felsorolt csoportokat jelenti.

6. táblázat

(Ib) általános képletű vegyületek, amelyekben R_1 szek-butil-csoportot (B1a) vagy izopropil-csoportot (B1b) jelent, és R_2 és R_3 a D. táblázatban D.001-D.017. sorszámon felsorolt csoportokat jelenti.

Példák a találmány szerinti növényvédőszerek összetételére és előállítására

A következőkben a találmány szerinti növényvédőszerek egyes típusainak összetételére és előállítására közlünk példákat. Az összetételeknél feltüntetett szám-
adatok tömeg %-okat jelentenek. A példákban feltüntetett EO rövidítés etilén-oxidot
jelent.

F1. példa

Emulgeálható koncentrátumok

A finoman őrölt hatóanyag és a további adalékok összekeverésével állítottuk
elő a következő összetételű, vízzel a kívánt koncentrációra hígítva emulziót képező
készítményeket:

	(a)	(b)	(c)
Hatóanyag	25	40	50
Kalcium-dodecil-benzolszulfonát	5	8	6
Ricinusolaj-poli(etilén-glikol)-éter (36 mól EO)	5	-	-
Tribotuil-fenol-poli(etilén-glikol)-éter (30 mól EO)	-	12	4
Ciklohexanon	-	15	20
Xilol-izomerek elegye	65	25	20

F.2. példaOldatok

A finoman elporított hatóanyag és az egyéb adalékok összekeverésével állítottuk elő a következő összetételű, mikrocseppecskék formájában felhasználható oldatokat:

	(a)	(b)	(c)	(d)
Hatóanyag	80	10	5	95
Etilén-glikol-monometil-éter	-	20	-	-
Poli(etilén-glikol) (móltömeg: 400)	-	-	70	-
N-metil-pirrolid-2-on	20	-	-	-
Epoxidált kókuszolaj	-	-	-	1
Benzin (fp.: 160-180°C)	-	-	94	-

F.3. példaGranulátumok

A hatóanyagot diklór-metánban oldottuk, az oldatot a hordozóanyag-keverékre permeteztük, és az oldószert elpárologtattuk. A következő összetételű granulátumokat állítottuk elő:

	(a)	(b)	(c)	(d)
Hatóanyag	5	10	8	21
Kaolin	94	-	79	54
Nagy diszperzitásfokú kovasav	1	-	13	7
Attapulgit	-	90	-	18

F4. példaNedvesíthető porkészítmények

A hatóanyagot összekevertük az adalékanyagokkal, és a keveréket alkalmas

malomban őröltük. Az így kapott nedvesíthető porkészítményekből vizes hígítással a kívánt hatóanyag-tartalmú szuszpenziók képezhetők.

	(a)	(b)	(c)
Hatóanyag	25	50	75
Nátrium-ligninszulfonát	5	5	-
Nátrium-lauril-szulfát	3	-	5
Nátrium-di-izobutil-naftalin-szulfonát	-	6	10
Oktil-fenol-poli-etilén-glikol-éter (7-8 mól EO)	-	2	-
Nagy diszperzitásfokú kovasav	5	10	10
Kaolin	62	27	-

F5. példa

Emulgeálható koncentrátum

A finoman őrölt hatóanyag és a további adalékok összekeverésével állítottuk elő a következő összetételű, vízzel a kívánt koncentrációra hígítva emulziót képező készítményt:

Hatóanyag	10
Oktil-fenol-poli-etilén-glikol-éter (4-5 mól EO)	3
Kalcium-dodecil-benzol-szulfonát	3
Ricinusolaj-poli-etilén-glikol-éter (36 mól EO)	4
Ciklohexanon	30
Xilol-izomerek elegye	50

F6. példa

Extrudált granulátum

A hatóanyagot és az adalékanyagokat összekevertük, a keveréket őröltük, vízzel megnedvesítettük, extrudáltuk, granuláltuk, és a kapott granulátumot levegő-áramban megszárítottuk. A következő összetételű granulátumot állítottuk elő:

Hatóanyag	10
Nátrium-ligninszulfonát	2
Karboxil-metil-cellulóz	1
Kaolin	87

F7. példa

Bevont granulátum

A poli(etilén-glikol)-al megnedvesített kaolinra alkalmas keverőberendezésben egyenletes eloszlásban felvittük a finoman elporított hatóanyagot. A következő összetételű nem porló granulátumot állítottuk elő:

Hatóanyag	3
Poli(etilén-glikol) (móltömeg: 200)	3
Kaolin	94

F8. példa

Szuszpenziós koncentrátum

A finomra őrölt hatóanyag és az adalékanyagok összekeverésével állítottuk elő a következő összetételű, vízzel hígítva a kívánt koncentrációjú szuszpenziót készítő készítményt:

Hatóanyag	40
Etilén-glikol	10
Nonil-fenol-poli-etilén-glikol-éter (15 mól EO)	6
Nátrium-ligninszulfonát	10
Karboxi-metil-cellulóz	1
37 %-os vizes formaldehid oldat	0,2
75 %-os vizes szilikonolaj emulzió	0,8
Víz	32

A vegyületek biológiai hatásának vizsgálatára vonatkozó példák

B1. példa

Spodoptera littoralis elleni hatás vizsgálata

Fiatal szójanövényeket 12,5 ppm vizsgálandó vegyületet tartalmazó vizes emulziós permetlével permeteztünk be. A permetlé beszáradása után a növényekre 10 darab, az első fejlettségi állapotban lévő *Spodoptera littoralis* hernyót helyeztünk, és az így megfertőzött növényeket műanyag tartóba helyeztük. 3 nap elteltével megszámoltuk az elpusztult hernyókat, és a kezeletlen kontrollokkal összehasonlítva kiszámítottuk a kártevő-populáció %-os csökkenését és a hernyók által felevett növényanyag %-os csökkenését.

Ebben a vizsgálatban a P1-P11. példa szerinti és az 1-3. táblázatban felsorolt vegyületek jó hatást fejtettek ki. A P1. és P2. példa szerinti vegyület 80 %-osnál nagyobb aktivitást mutatott.

B2. példa

Spodoptera littoralis elleni szisztémás hatás vizsgálata

A vizsgálandó vegyületet tartalmazó oldatba kukorica palántákat helyeztünk. 6 nap elteltével a leveleket levágtuk, Petri csészében nedves szűrőpapírra helyeztük, és a leveleket 12-15 darab L_1 fejlettségi állapotban lévő *Spodoptera littoralis* lárvával fertőztük meg. 4 nap elteltével megszámoltuk az elpusztult lárvákat, és a kezeletlen kontrollokkal összehasonlítva meghatároztuk a populáció %-os csökkenését (%-os aktivitás).

Ebben a vizsgálatban a P1-P11. példa szerinti és az 1-3. táblázatban felsorolt vegyületek jó hatást fejtettek ki. A P1. és P2. példa szerinti vegyület 80 %-osnál nagyobb aktivitást mutatott.

B3. példa

Heliothis virescens elleni hatás vizsgálata

Petri csészében szűrőpapíron elhelyezett mesterséges tápanyag-rétegre 30-35 darab 0-24 órás *Heliothis virescens* petét helyeztünk. Ezután a szűrőpapírra 0,8 ml oldatot pipettáztunk, ami a vizsgálandó vegyületet tartalmazta. 6 nap elteltével megszámoltuk az elpusztult petéket és lárvákat, és a kezeletlen kontrollokon észlelt adatokkal összehasonlítva meghatároztuk a populáció %-os csökkenését (%-os aktivitás).

Ebben a vizsgálatban a P1-P11. példa szerinti és az 1-3. táblázatban felsorolt vegyületek jó hatást fejtettek ki. A P1., P2., P3. és P7. példa szerinti vegyület 80 %-osnál nagyobb aktivitást mutatott.

B4. példa

Plutella xylostella hernyók elleni hatás vizsgálata

Fiatal káposztanövényeket 12,5 ppm vizsgálandó vegyületet tartalmazó vizes emulziós permetlével permeteztünk be. A permetlé beszáradása után a káposztanövényekre 10 darab, 1. fejlettségi állapotban lévő *Plutella xylostella* hernyót helyeztünk, és az így megfertőzött növényeket műanyag tartóba helyeztük. 3 nap elteltével megszámoltuk az elpusztult hernyókat, és a kezeletlen kontrollokkal összehasonlítva kiszámítottuk a kártevő-populáció %-os csökkenését és a hernyók által felevett növényanyag %-os csökkenését.

Ebben a vizsgálatban a P1-P11. példa szerinti és az 1-3. táblázatban felsorolt vegyületek jó hatást fejtettek ki. A P1., P2., P3. és P7. példa szerinti vegyület 80 %-osnál nagyobb aktivitást mutatott.

B5. példa

Diabrotica balteata elleni hatás vizsgálata

Kukorica palántákat 12,5 ppm vizsgálandó vegyületet tartalmazó vizes emul-

ziós permetlével permeteztünk be. A permetlé beszáradása után a növényekre 10 darab, 2. fejlettségi állapotban lévő *Diabrotica balteata* lárvát helyeztünk, és az így megfertőzött növényeket műanyag tartóba helyeztük. 3 nap elteltével megszámoltuk az elpusztult lárvákat, és a kezeletlen kontrollokkal összehasonlítva kiszámítottuk a kártevő-populáció %-os csökkenését.

Ebben a vizsgálatban a P1-P11. példa szerinti és az 1-3. táblázatban felsorolt vegyületek jó hatást fejtettek ki. A P1., P2., P3. és P7. példa szerinti vegyület 80 %-osnál nagyobb aktivitást mutatott.

B6. példa

Tetranychus urticae elleni hatás vizsgálata

Fiatal babnövényeket vegyes *Tetranychus urticae* populációval fertőztünk meg, majd 1 nap elteltével a növényeket 12,5 ppm vizsgálandó vegyületet tartalmazó vizes emulziós permetlével permeteztük be. A növényeket 6 napig 25°C-on inkubáltuk, majd megszámoltuk az elpusztult petéket, lárvákat és kifejlett atkákat, és az így kapott adatokat a kontrollokkal összehasonlítva kiszámítottuk a kártevő-populáció %-os csökkenését (%-os aktivitás).

Ebben a vizsgálatban a P1-P11. példa szerinti és az 1-3. táblázatban felsorolt vegyületek jó hatást fejtettek ki. A P1., P2., P3. és P7. példa szerinti vegyület 80 %-osnál nagyobb aktivitást mutatott.

Szabadalmi igénypontok

1. (I) általános képletű vegyületek és azok sói, amelyek adott és lehetséges esetben E- és Z-izomerek, E/Z izomer-elegyek és/vagy tautomer módosulatok lehetnek - a képletben

a hullámos vonallal jelölt kötés azt jelenti, hogy az adott vegyület 4"(S)- és 4"(R)-izomer egyaránt lehet,

R_1 1-12 szénatomos alkil-, 3-8 szénatomos cikloalkil- vagy 2-12 szénatomos alkenilcsoportot jelent,

R_2 hidrogénatomot, szubsztituálatlan vagy 1-5 szubsztituenst hordozó 1-12 szénatomos alkilcsoportot, szubsztituálatlan vagy 1-5 szubsztituenst hordozó 2-12 szénatomos alkenilcsoportot, szubsztituálatlan vagy 1-5 szubsztituenst hordozó 2-12 szénatomos alkinilcsoportot vagy $-C(O)R_4$ vagy $-SO_2R_4$ csoportot jelent, és

R_3 hidrogénatomot, szubsztituálatlan vagy 1-5 szubsztituenst hordozó 1-12 szénatomos alkilcsoportot, szubsztituálatlan vagy 1-5 szubsztituenst hordozó 2-12 szénatomos alkenilcsoportot vagy szubsztituálatlan vagy 1-5 szubsztituenst hordozó 2-12 szénatomos alkinilcsoportot jelent, vagy

R_2 és R_3 együtt 3-7 tagú alkiléncsoportot vagy 4-7 tagú alkeniléncsoportot képez, amelyekben az alkilén- vagy alkenilén-lánc egyik CH_2 csoportja helyén $-O-$, $-S-$ vagy $-NR_5-$ csoport állhat, vagy együtt $=N^+=N^-$ csoportot alkotnak; mimellett

az R_2 és R_3 csoport meghatározásában szereplő alkil-, alkenil-, alkinil-, alkilén-, alkenilén- és cikloalkil-csoportokhoz adott esetben kapcsolódó szubsztituensek a következők lehetnek: hidroxilcsoport, halogénatom, halogén-(1-2 szénatomos alkil)-csoport, cianocsoport, nitrocsoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport, szubsztituálatlan vagy 1-3 metilcsoporttal szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkilcsoport, norbornilénil-csoport, szubsztituálatlan vagy 1-3 metilcsoporttal szubsztituált 3-8 szénatomos cikloalkenil-csoport, halogén-(3-8 szénatomos cikloalkil)-csoport, 1-12 széna-

tomos alkoxi-, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-, 3-8 szénatomos cikloalkoxi-, halogén-1-12 szénatomos alkoxi-, (1-12 szénatomos alkil)-tio-, (3-8 szénatomos cikloalkil)-tio-, halogén-(1-12 szénatomos alkil)-tio-, (1-12 szénatomos alkil)-szulfinil-, (3-8 szénatomos cikloalkil)-szulfinil-, halogén-(1-12 szénatomos alkil)-szulfinil-, halogén-(3-8 szénatomos cikloalkil)-szulfinil-, (1-12 szénatomos alkil)-szulfonil-, (3-8 szénatomos cikloalkil)-szulfonil-, halogén-(1-12 szénatomos alkil)-szulfonil-, halogén-(3-8 szénatomos cikloalkil)-szulfonil-, 2-8 szénatomos alkenil-, 2-8 szénatomos alkinil-, -NH(1-6 szénatomos alkil)-, -N(1-6 szénatomos alkil)₂, -C(=O)R₄, -NHC(=O)R₇ vagy -P(=O)(O1-6 szénatomos alkil)₂ csoport; aril-, heterociklil-, aril-oxi- vagy heterociklil-oxi-csoport, amelyekhez adott esetben 1-5 azonos vagy eltérő szubsztituens, éspedig halogénatom, hidroxil-, ciano-, nitro-, 1-12 szénatomos alkil-, 3-8 szénatomos cikloalkil-, halogén-(1-12 szénatomos alkil)-, 1-12 szénatomos alkoxi-, halogén-(1-12 szénatomos alkoxi)-, (1-12 szénatomos alkil)-tio-, halogén-(1-12 szénatomos alkil)-tio-, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-, dimetil-amino-(1-6 szénatomos alkoxi)-, 2-8 szénatomos alkenil-, 2-8 szénatomos alkinil-, fenoxi- vagy fenil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport kapcsolódhat, fenoxicssoport, amelyhez adott esetben 1-3 azonos vagy eltérő szubsztituens, éspedig halogénatom vagy metoxi-, trifluor-metil- vagy trifluor-metoxi-csoport kapcsolódhat, fenil-(1-6 szénatomos alkoxi)-csoport, amelynek aromás gyűrűjéhez adott esetben 1-3 azonos vagy eltérő szubsztituens, éspedig halogénatom vagy metoxi-, trifluor-metil- vagy trifluor-metoxi-csoport kapcsolódhat, továbbá fenil-(2-6 szénatomos alakenil)-, fenil-(2-6 szénatomos alkinil)-, metilén-dioxi-, -C(=O)R₄, -NH-C(=O)R₇, -NH₂, -NH(1-12 szénatomos alkil), -N(1-12 szénatomos alkil)₂, (1-6 szénatomos alkil)-szulfinil-, (3-8 szénatomos cikloalkil)-szulfinil-, halogén-(1-6 szénatomos alkil)-szulfinil-, halogén-(3-8 szénatomos cikloalkil)-szulfinil-, (1-6 szénato-

mos alkil)-szulfonil-, (3-8 szénatomos cikloalkil)-szulfonil-, halogén-(1-6 szénatomos alkil)-szulfonil- és halogén-(3-8 szénatomos cikloalkil)-szulfonil-csoport;

és a korábban felsorolt képletekben

R₄ jelentése hidrogénatom, hidroxilcsoport, 1-8 szénatomos alkilcsoport, 1-7 halogén-, nitro-, 1-8 szénatomos alkoxi-, hidroxil, merkaptó-, amino-, (1-12 szénatomos alkil)-amino- és/vagy di-(1-12 szénatomos alkil)-amino-szubsztituenst hordozó 1-8 szénatomos alkilcsoport, vagy 1-8 szénatomos alkoxi-, halogén-(1-8 szénatomos alkoxi)-, 3-8 szénatomos cikloalkil-, 3-8 szénatomos cikloalkoxi-, 2-8 szénatomos alkenil-, 2-8 szénatomos alkenil-oxi-, 2-8 szénatomos alkinil-, 2-8 szénatomos alkinil-oxi-, amino-, (1-12 szénatomos alkil)-amino-, di-(1-12 szénatomos alkil)-amino-, aril-, aril-oxi-, benzil-, benzil-oxi-, heterociklil-, heterociklil-oxi-, heterociklil-metil- vagy heterociklil-metoxi-csoport, ahol az aril-, aril-oxi-, benzil-, benzil-oxi-, heterociklil-, heterociklil-oxi-, heterociklil-metil- és heterociklil-metoxi-csoportok adott esetben 1-3 azonos vagy eltérő szubsztituenst, éspedig halogénatomot vagy 1-12 szénatomos alkil-, halogén-(1-12 szénatomos alkil)-, 1-12 szénatomos alkoxi-, halogén-(1-12 szénatomos alkoxi)-, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkoxi)-, (1-12 szénatomos alkil)-tio-, halogén-(1-12 szénatomos alkil)-tio-, 2-8 szénatomos alkenil-oxi-, 2-8 szénatomos alkinil-oxi-, nitro- vagy cianocsoportot hordozhatnak;

R₅ 1-8 szénatomos alkil-, 3-8 szénatomos cikloalkil-, 2-8 szénatomos alkenil-, 2-8 szénatomos alkinil-, benzil- vagy -C(=O)-R₅ csoportot jelent;

R₆ jelentése hidrogénatom, hidroxil-, merkaptó-, amino-, (1-12 szénatomos alkil)-amino-, di-(1-12 szénatomos alkil)-amino-, 1-12 szénatomos alkil-, halogén-(1-12 szénatomos alkil)-, 1-12 szénatomos alkoxi-, halogén-(1-12 szénatomos alkoxi)-, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkoxi)-, (1-12 szénatomos alkil)-tio-, 2-8 szénatomos alkenil-oxi- vagy 2-8 szénatomos alkinil-oxi-csoport, fenil-, fenoxi-, benzil-oxi-, NH-fenil, N(1-6 szénatomos alkil)-fenil, NH-(1-6 szénatomos alkil)-C(=O)-R₆



vagy N(1-6 szénatomos alkil)-(1-6 szénatomos alkil)-C(=O)-R₈ csoport, vagy olyan fenil-, fenoxi-, benzil-oxi-, NH-fenil vagy N(1-6 szénatomos alkil)-fenil csoport, amelyek aromás gyűrűjéhez 1-3 azonos vagy eltérő szubsztituens, és pedig halogénatom vagy 1-6 szénatomos alkoxi-, halogén-(1-6 szénatomos alkil)- vagy halogén-(1-6 szénatomos alkoxi)-csoport kapcsolódik;

R₇ jelentése hidrogénatom vagy 1-12 szénatomos alkil-, halogén-(1-12 szénatomos alkil)-, 2-8 szénatomos alkenil-, 2-8 szénatomos alkinil-, fenil-, benzil-, amino-, (1-12 szénatomos alkil)-amino-, di-(1-12 szénatomos alkil)-amino-, NH-fenil- vagy N(1-12 szénatomos alkil)-fenil csoport; és

R₈ jelentése hidrogénatom vagy hidroxil-, 1-12 szénatomos alkil-, 1-12 szénatomos alkoxi-, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkoxi)-, 2-6 szénatomos alkenil-oxi-, fenil-, fenoxi-, benzil-oxi-, amino-, (1-12 szénatomos alkil)-amino-, di-(1-12 szénatomos alkil)-amino-, NH-fenil vagy N(1-12 szénatomos alkil)-fenil csoport.

2. Kártevőirtó készítmény, amely legalább egy az 1. igénypontban meghatározott (I) általános képletű vegyületet és legalább egy segédanyagot tartalmaz.

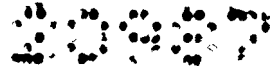
3. Eljárás kártevők irtására, azzal *jellemezve*, hogy a kártevőkre vagy a kártevők tartózkodási helyére a 2. igénypont szerinti készítményt viszünk fel.

4. Eljárás a 2. igénypont szerinti készítmények előállítására, azzal *jellemezve*, hogy a hatóanyagot alaposan összekeverjük és/vagy összeőröljük a segédanyaggal vagy segédanyagokkal.

5. Az 1. igénypont szerinti (I) általános képletű vegyületek felhasználása a 2. igénypont szerinti készítmények gyártásához.

6. A 2. igénypont szerinti készítmények felhasználása kártevők irtásához.

7. A 3. igénypont szerinti eljárás növények szaporítóanyagainak védelmére, azzal *jellemezve*, hogy a növények szaporítóanyagait vagy a szaporítóanyag kiültetésének helyét kezeljük.



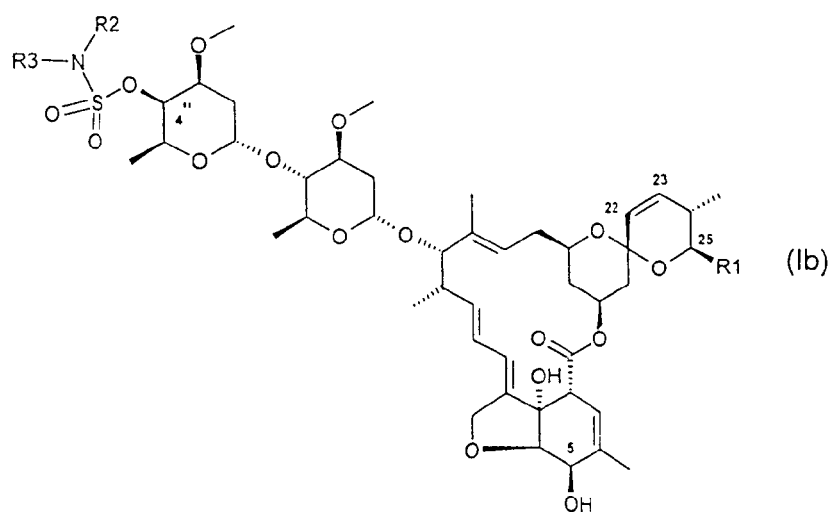
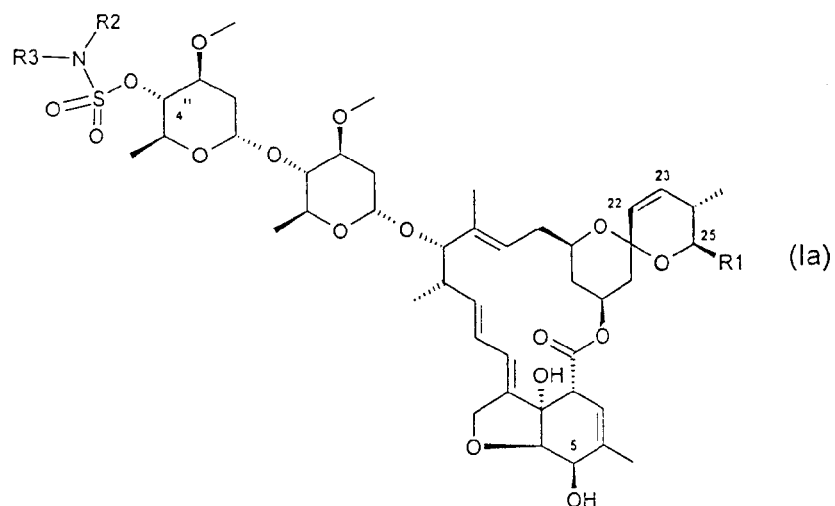
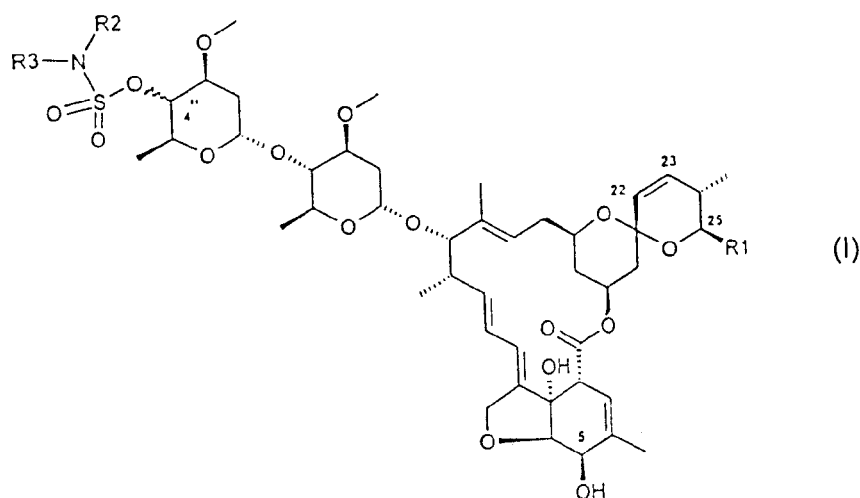
8. A 7. igénypont szerinti eljárással kezelt növényi szaporítóanyag.

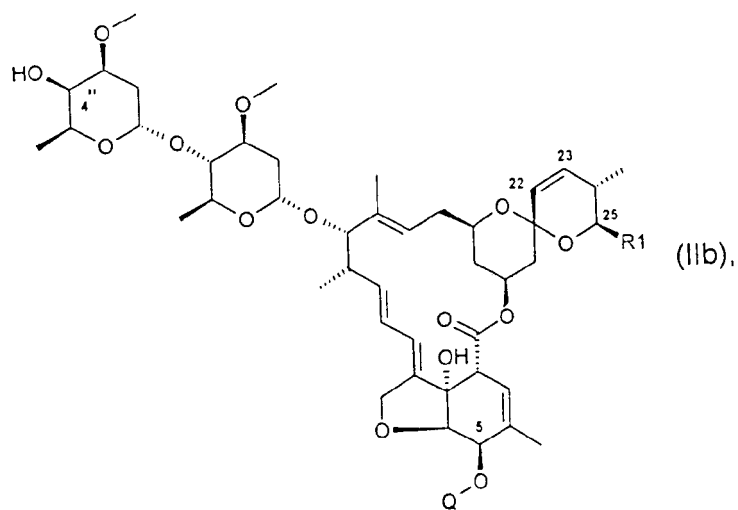
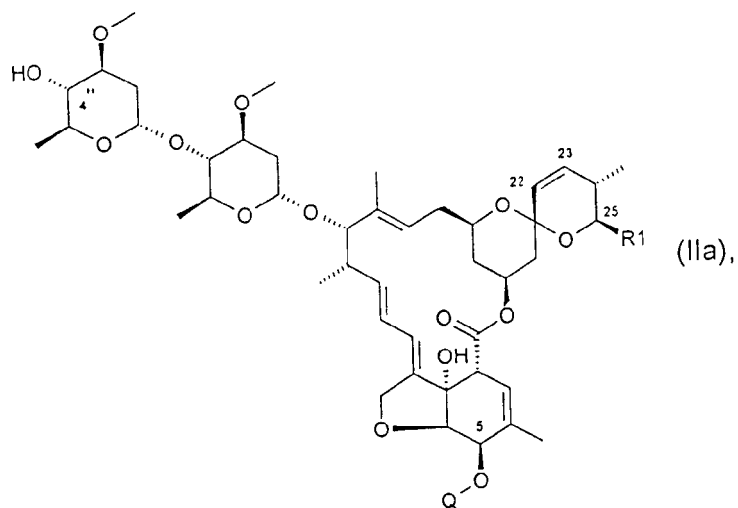
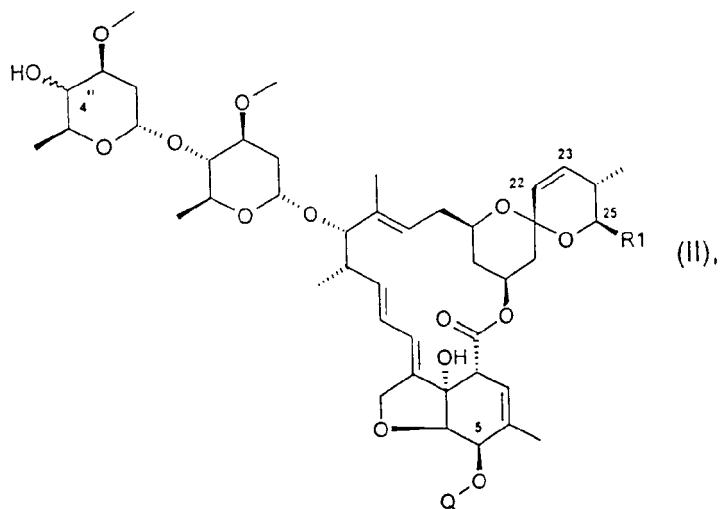
A bejelentő helyett

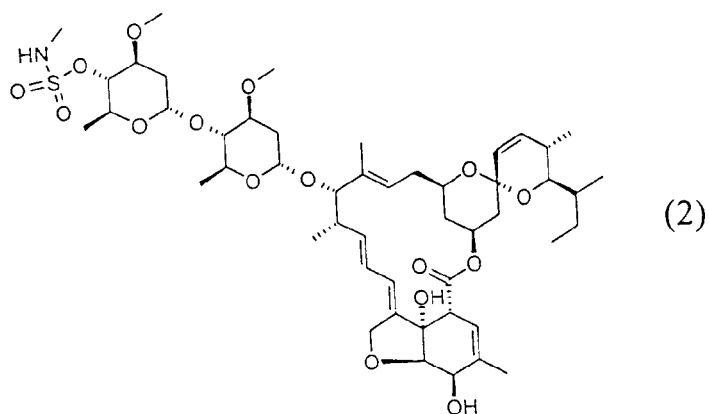
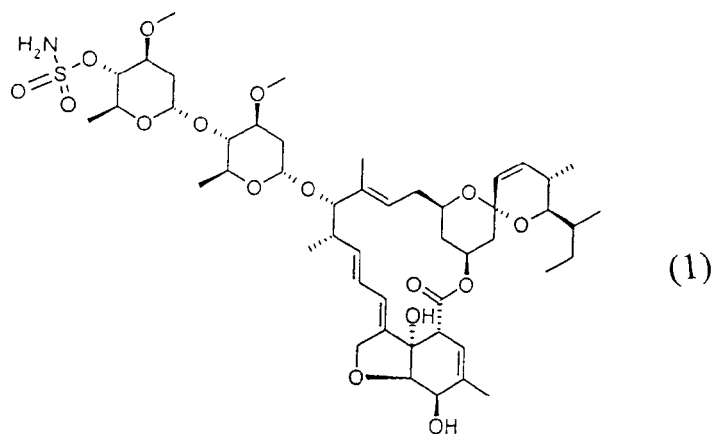
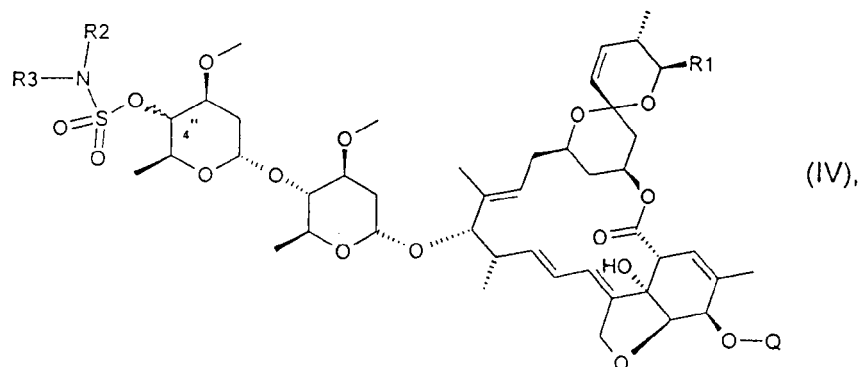
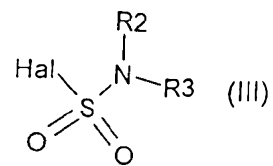
a meghatalmazott:

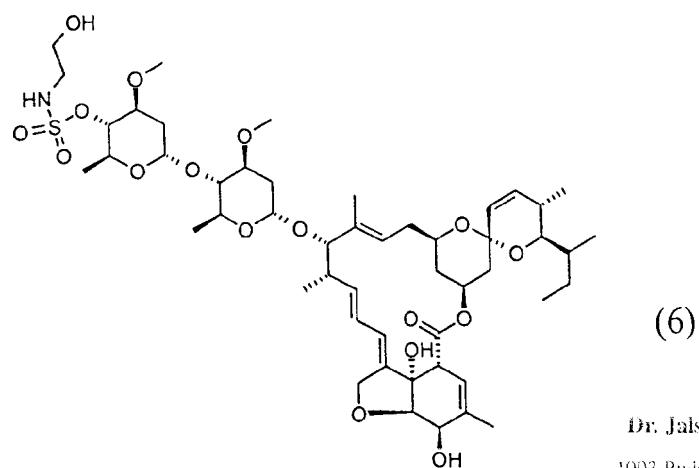
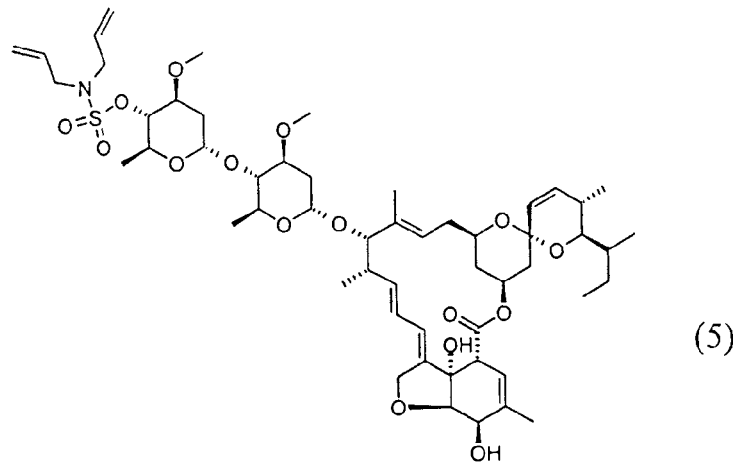
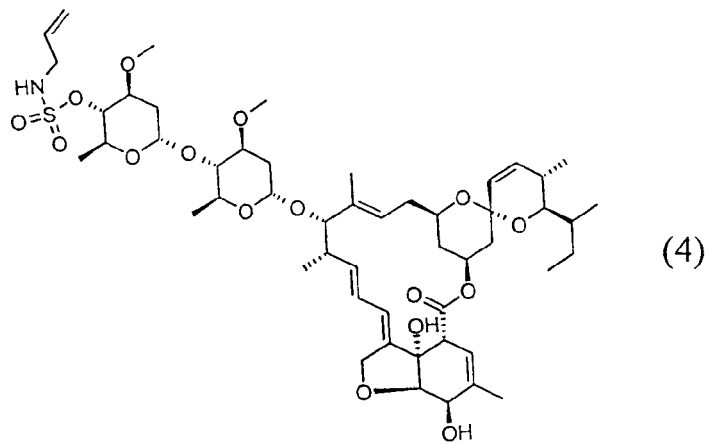
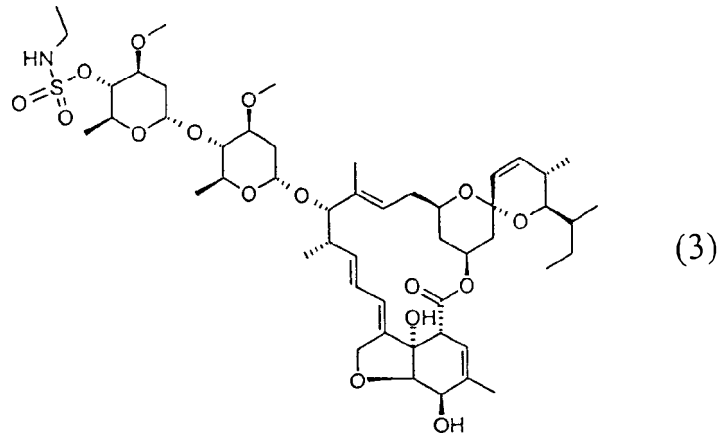
+ C. Rajz
Ruh

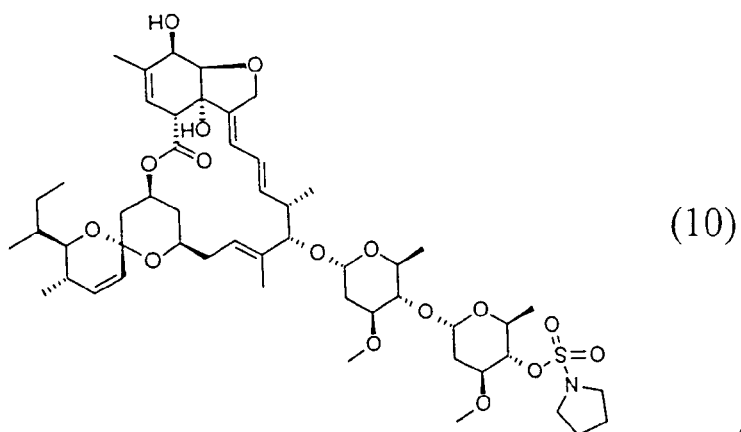
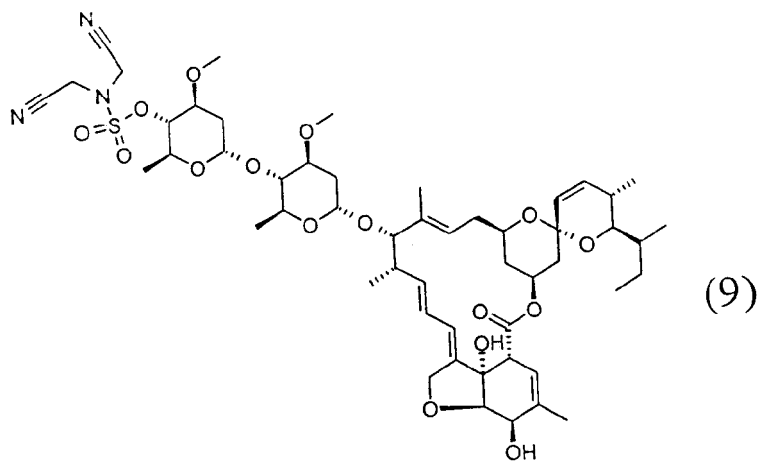
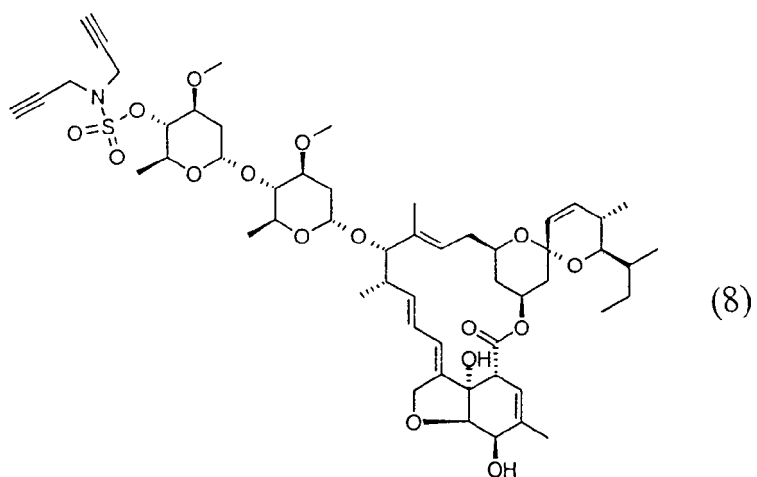
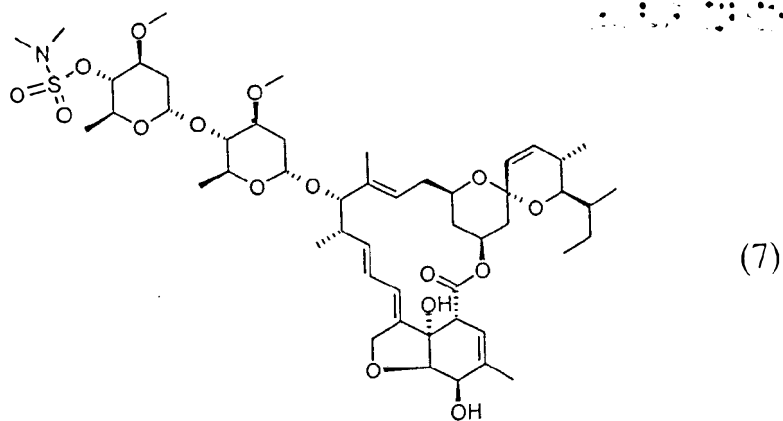
Dr. Juhász Zoltánné
1023 Budapest, ...
Tel: ...











Dr. Jalsovszky Györgyné

1093 Budapest, Főv. tér u. 24.
Tel.: 218-4148 / Fax: 218-4506

