

(19) Országkód:

HU



**MAGYAR
KÖZTÁRSASÁG
ORSZÁGOS
TALÁLMÁNYI
HIVATAL**

SZABADALMI LEÍRÁS

(11) Lajstromszám:

209 631 B

(21) A bejelentés száma: 1351/91
(22) A bejelentés napja: 1991. 04. 23.
(30) Elsőbbségi adatok:
109 840/901990. 04. 24. JP

(51) Int. Cl.⁵

A 01 N 53/00

(40) A közzététel napja: 1991. 10. 28.
(45) A megadás meghirdetésének dátuma a Szabadalmi
Közlönyben: 1994. 09. 28. SZKV 94/09

(72) Feltalálók:

Dohara, Kazunobu, Hirakata-shi (JP)
Makita, Mitsuyasu, Nishinomiya-shi (JP)
Abe, Yasuo, Toyonaka-shi (JP)

(73) Szabadalmas:

Sumitomo Chemical Co. Ltd., Osaka (JP)

(74) Képviselő:

DANUBIA Szabadalmi és Védjegy Iroda Kft.,
Budapest

(54)

Inszehticid készítmények

(57) KIVONAT

A találmány szerinti inszehticid készítmény

- (a) 2,4-dioxo-1-(2-propinil)-imidazolidin-3-il-metil-k
rizantemátot,
(b) legalább egy 16–19 szénatomos monokarbonsav-
észtert vagy 16–19 szénatomos dikarbonsav-ész-
tert és kívánt esetben

(c) legalább egy inert hordozóanyagot
tartalmaz, mimellett az (a) és (b) komponens tömeg-
aránya 3:1–1:100.

A találmány fokozott hatású inszekticid készítményekre vonatkozik.

Az (I) képletű 2,4-dioxo-1-(2-propinil)-imidazolidin-3-il-metil-krizantemátot (továbbiakban A vegyületet) a 4176189 számú amerikai egyesült államokbeli szabadalmi leírásban ismertetik, mint inszekticid készítmények hatóanyagát. Azonban ez a vegyület nem mutat megfelelően nagy inszekticid aktivitást, ha ön-magában alkalmazzák.

A T/34100 számon publikált magyar szabadalmi leírásban 3-fenoxi-benzil-alkohollal vagy tetrahidro-ftálimido-metil-alkohollal észterezett krizanténsav-származékok hatásának fokozását alkohol/víz elegyben a p H szabályozásával érik el. A vegyületeket savas p H beállításával stabilizálják.

A 184614 számú magyar szabadalmi leírásban a fenti krizanténsav-észterek hatásának szinergikus fokozását a cinerin-I (a természetes piretrinek egyik komponense) hozzáadásával érik el.

Az A vegyület inszekticid aktivitásának fokozására irányuló kutatásaink során azt tapasztaltuk, hogy ha az (a) A vegyülethez

(b) legalább egy 16-19 szénatomos monokarbonsav-észtert vagy 16-19 szénatomos dikarbonsav-észtert adunk, úgy, hogy az (a) és (b) tömegaránya 3:1 - 1:100 legyen az A vegyület inszekticid aktivitása jelentősen fokozódik. A találmány ezen a felismerésen alapul.

A találmány szerinti inszekticid készítmény ennek megfelelően

(a) 2,4-dioxo-1-(2-propinil)-imidazolidin-3-il-metil-krizantemátot (A vegyületet),

(b) legalább egy 16-19 szénatomos monokarbonsav-észtert vagy

16-19 szénatomos dikarbonsav-észtert és kívánt esetben

(c) legalább egy inert hordozóanyagot tartalmaz, mimellett az (a) és (b) komponens tömegaránya 3:1-1:100.

Az A vegyületnek számos optikai és geometriai izomerje van. A találmány szerinti inszekticid készítményben bármely inszekticid aktivitást mutató izomer vagy izomerelegy alkalmazható. Az A vegyület mennyisége a találmány szerinti inszekticid készítményben rendszerint 0,0001-75 tömeg%.

A 16-19 szénatomos monokarbonsav-észterekre és a 16-19 szénatomos dikarbonsav-észterekre példaként említhetjük a dibutil-ftalátot, izopropil-palmitátot, izopropil-mirisztátot, hexil-laurátot, stb. Ezek a vegyületek egymással kombinálva is alkalmazhatók. A fenti vegyületek közül választott egy vagy több vegyületet általában 0,0003-75 tömeg% mennyiségben keverjük a találmány szerinti készítménybe.

A találmány szerinti inszekticid készítmény tartalmazhat ezenkívül illatosítót, oldószert, hajtóanyagot, szilárd hordozóanyagot stb. is, továbbá összekeverhető egy vagy több egyéb inszekticiddel, hatásfokozóval, fungiciddel.

Az egyéb inszekticid hatóanyag például (RS)-3-allil-2-metil-4-oxo-ciklopent-2-enil-(1RS)-cisz,transzkrizantemát (alletrin),

3,4,5,6-tetrahidro-ftálimido-metil-(1RS)-cisz,transzkrizantemát (tetrametrin),

(S)-2-metil-4-oxo-3-(2-propinil)-ciklopent-2-enil-(1R)-cisz,transz-krizantemát (pralletrin),

5 3-fenoxi-benzil-(1 RS)-cisz,transz-krizantemát (fenotrin),

5-benzil-3-furil-metil-(1 RS)-cisz,transz-krizantemát (rezmetrin),

10 (RS)-a-ciano-3-fenoxi-benzil-(1R)-cisz,transz-krizantemát (cifenotrin),

3-fenoxi-benzil-(1RS)-cisz,transz-3-(2,2-diklórvinil)-2,2-dimetil-ciklopropánkarboxilát (permetrin),

(RS)- α -ciano-3-fenoxi-benzil-(1RS)-cisz,transz-3-(2,2-diklórvinil)-2,2-dimetil-ciklopropánkarboxilát

15 (cipermetrin),

(S)-a-ciano-3-fenoxi-benzil-(1R)-cisz-3-(2,2-dibromvinil)-2,2-dimetil-ciklopropánkarboxilát (deltametrin),

20 (RS)-a-ciano-4-fluor-3-fenoxi-benzil-(1 RS)-cisz,transz-3-(2,2-diklórvinil)-2,2-dimetil-ciklopropánkarboxilát (ciflutrin),

5-(2-propinil)-furfuril-(1 RS)-cisz,transz-krizantemát (furametrin),

2-(4-etoxi-fenil)-2-metil-propil-3-fenoxi-benzil-éter (etofenprox)

25 2,2-diklórvinil-dimetil-foszfát (diklórvosz)

0,0-dimetil-0-(3-metil-4-nitro-fenil)-foszfortioát (fenitroton),

2-(1-metoxi-etoxi)-fenil-metil-karbamát (propoxur),

30 4-fenoxi-fenil-(RS)-2-(2-piridil-oxi)-propil-éter (piriproxifen),

izopropil-(2E,4E)-11-metoxi-3,7,11-trimetil-2,4-dodekadienoát (metopren)

etil-(2E,4E)-3,7,11-trimetil-dodeka-2,4-dienoát

35 (hidropren),

1-(4-klór-fenil)-3-(2,6-difluor-benzoil)-karbamid (diflubenzuron), és

N-ciklopropil-1,3,5-triazin-2,4,6-triamin (ciromazin) lehet.

40 A hatásfokozókra példaként említhetjük az a-[2-(2-butoxi-etoxi)-etoxi]-4,5-(metilén-dioxi)-2-propil-toluolt (piperonil-butoxidot), N-(2-etil-hexil)-biciklo[2.2.1]hept-5-én-2,3-dikarboximidet (MGK-264-et), okta-klór-dipropil-étert (S-421-et) stb.

45 Az oldószer például izopropil-alkohol, kerozin, dodecyl-benzol, stb. lehet.

Hajtóanyagként például propán/butánt, dimetil-étert, freonTM gázt (fluorozott szénvegyületeket) stb. használhatunk.

50 A találmány szerinti inszekticid készítményeket például úgy állíthatjuk elő, hogy az A vegyület meghatározott mennyiségét legalább egy fent megadott karbonsavészter meghatározott mennyiségével, és kívánt esetben illatosítókkal, oldószerekkel, hajtóanyagokkal, szilárd hordozóanyagokkal, stb. elegyítjük, szobahőmérsékleten vagy hűtés alkalmazása közben.

A fenti módon előállított készítmények például az alábbi rovarok és atkák ellen hatásosak.

55 Lepidoptera: szücsmoly (*Tinea pellionella*), ruhamoly (*Tineola bisselliella*); stb.,

Diptera: *Culex* spp., például közönséges szúnyog (*Culex pipiens pallens*) és *Culex tritaeniorhynchus*; *Aedes* spp., például *Aedes aegypti* és *Aedes albopictus*; *Anopheles* spp., például *Anopheles sinensis* midges (*Chironomidae*); *Muscidae*, például házilég (Musca domestica) és kiritéslég (Muscina stabulans); *Calliphoridae*; *Sarcophagidae*; kis házilég (*Fannia canicularis*); *Anthomyiidae*, például babszárrontó lég (Delia platura) és hagymalég (Delia antiqua); gyümölcslegyek (*Tephritidae*); *Drosophilidae*; lepkeszúnyogok (*Psychodidae*); púposzúnyogok (*Simuliidae*); *Tabanidae*; szuronyoslegyek (*Stomoxys* *dinae*), stb.;

Dictyoptera: kis házi csótány (*Blattella germanica*), füstbarna csótány (*Periplaneta fuliginosa*), amerikaicsótány (*Periplaneta americana*), barna csótány (*Periplaneta brunnea*), konyhai csótány (*Blatta orientalis*) stb.;

Hymenoptera: hangyák (*Formicidae*), darazsak (*Vespididae*), Bethylidae, levéldarazsak (*Tenthredinidae*), például káposzta-levéldarázs (*Athalia rosae ruficornis*); stb.

Isoptera: *Reticulitermes speratus*, *Coptotermes formosanus*, stb.;

Ixodidae: *Boophilus microplus*, stb.;

Háziporatkák: *Acaridae*, például *Tyrophagus putrescentiae*; *Pyrolyphidae*, például *Dermatophagoides farinae*; *Cheyletidae*, például *Chelacaropsis moorei*; *Macronyssidae*, például *Ornithonyssus bacoti*, stb.

10 A találmány szerinti kompozíció, mint olyan használható rovarkártévk írtására, azonban rendszerint valamilyen készítménnyé - például aeroszollá, olajos spray-vé, stb. - alakítva használjuk. Ez utóbbi esetben az A vegyület koncentrációja az aeroszolban vagy olajos spray-ben előnyösen 0,001 és 5 tömeg% között van.

15 A találmányt közelebből - a korlátozás szándéka nélkül - az alábbi példákkal, összehasonlító példákkal, és hatástani példákkal kívánjuk ismertetni.

20

1. példa

50,0 tömegrész A vegyületet (amelyben a savrész d-transz konfigurációjú) és 50,0 tömegrész izopropil-mirisztátot melegítés közben (mintegy 40 - 50 °C-on) összekeverve cseppfolyós inszekticid készítményt kapunk.

25 A fentiek szerint eljárva állítjuk elő az 1. táblázatban ismertetett inszekticid készítményeket is.

1. táblázat

		Összetétel (tömegrész)							
		A vegyület (sav-rész d-transz)	Karbonsav-észter						
			1.	2.	3.	4.	5.	6.	7.
Példa	1.	1	99	0	0	0	0	0	0
	2.	10	90	0	0	0	0	0	0
	3.	50	50	0	0	0	0	0	
	4.	70	30	0	0	0	0	0	0
	5.	50	0	50	0	0	0	0	0
	6.	50	0	0	50	0	0	0	0
	7.	50	0	0	0	50	0	0	0
Összehasonlító példa	1.	100	0	0	0	0	0	0	0
	2.	50	0	0	0	0	50	0	0
3.	50	0	0	0	0	0	50	0	
4.	50	0	0	0	0	0	0	0	

- 1: izopropil-mirisztát;
- 2: izopropil-palmitát;
- 3: hexil-laurát;
- 4: dibutil-ftalát;
- 5: diizopropil-adipát
- 6: butil-sztearát;
- 7: etil-acetát

8. példa

0,1 tömegrész A vegyületet, 0,1 tömegrész izopropilmirisztátot és 0,3 tömegrész cifenotrint 20,0 tömegrész dodecil-benzol és 39,5 tömegrész kerozin elegyében oldunk. A kapott elegyet tartályba töltjük. A tartályra szórófejet szerelünk. A szórófejen keresztül 40 tömegrész propán-bután hajtógázelegyet nyomtatunk az inszekticid készítménybe, így aeroszol készítményt kapunk.

9. példa

1,0 tömegrész A vegyületet és 1,0 tömegrész izopropilmirisztátot 20,0 tömegrész izopropil-alkohol és 28,0 tömegrész kerozin elegyében oldunk. A kapott elegyet tartályba töltjük. A tartályra szórófejet szerelünk. A szórófejen keresztül 50,0 tömegrész propán-bután-dimetil-éter hajtógázelegyet nyomtatunk az inszekticid készítménybe, így aeroszol készítményt kapunk.

10. példa

1,0 tömegrész A vegyületet és 31,0 tömegrész izopropilmirisztátot 18,0 tömegrész kerozinban oldunk. A kapott elegyet tartályba töltjük. A tartályra szórófejet szerelünk. A szórófejen keresztül 50,0 tömegrész propán-bután-dimetil-éter hajtógázelegyet nyomtatunk az inszekticid készítménybe, így aeroszol készítményt kapunk.

11. példa

1,0 tömegrész A vegyületet és 1,0 tömegrész dibutilftalátot 2,5 tömegrész izopropil-alkohol és 45,5 tömegrész dodecil-benzol elegyében oldunk. A kapott elegyet tartályba töltjük. A tartályra szórófejet szerelünk. A szórófejen keresztül 50,0 tömegrész propán-bután-dimetil-éter hajtógázelegyet nyomtatunk az inszekticid készítménybe, így aeroszol készítményt kapunk.

Hatástani példa

Az 1-7. példa és 1-4. összehasonlító példa szerint előállított inszekticid készítményeket acetonnal hígítva 0,189 g/l A vegyületet tartalmazó oldatokat állítunk elő. Az oldatokból 0,3 ml mennyiségeket 8,5 cm átmérőjű Petri-csészékbe rétegezzük, így az egyes Petri-csészékbe 0,0567 mg A vegyület jut. Ez azt jelenti, hogy az A vegyület a Petri-csészékben 10 mg/m² koncentrációban van jelen. Az aceton elpárolgása után a száraz Petri-csészékbe 10-10 kis házi csótányt (*Blattella germanica*) helyezünk, és meghatározzuk a KT₅₀ értéket (azt az időt, amely a csótányok 50 %-ának ledöntéséhez szükséges). Az eredményeket a 2. táblázatban ismertetjük.

2. táblázat

		KT ₅₀ érték (perc) kis házi csótány ellen
5	Példa	1.
		2.
		3.
10		4.
		5.
		6.
15		7.
	Összehasonlító példa	1.
		2.
20		3.
		4.

Szabadalmi igénypontok

1. Fokozott hatású inszekticid készítmén, *azzal jellemezve*, hogy

(a) 2,4-dioxo-1-(2-propinil)-imidazolidin-3-il-metil-krizantemátot

(b) legalább egy 16-19 szénatomos monokarbonsav-észtert vagy 16-19 szénatomos dikarbonsav-észtert és kívánt esetben

(c) legalább egy inert hordozóanyagot tartalmaz, *mellette* az (a) és (b) komponens tömegaránya 3:1-1:100.

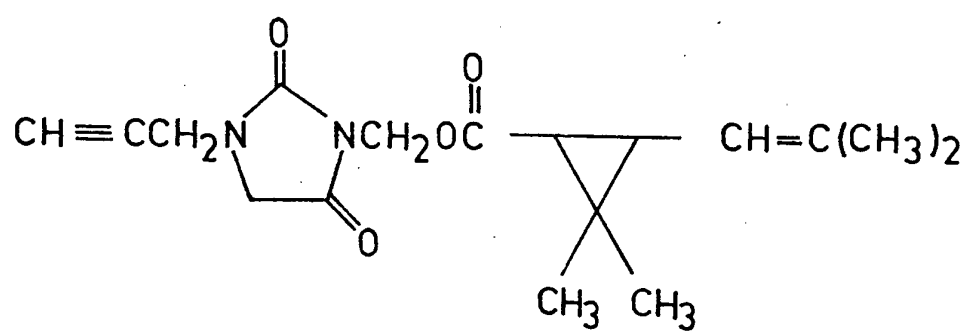
2. Az 1. igénypont szerinti inszekticid készítmény *azzal jellemezve*, hogy karbonsav-észterként dibutilftalátot, izopropil-palmitátot, izopropil-mirisztátot vagy hexil-laurátot tartalmaz.

3. Az 1. igénypont szerinti inszekticid készítmény *azzal jellemezve*, hogy karbonsav-észterként dibutilftalátot tartalmaz.

4. Az 1. igénypont szerinti inszekticid készítmény *azzal jellemezve*, hogy karbonsav-észterként izopropilpalmitátot tartalmaz.

5. Az 1. igénypont szerinti inszekticid készítmény *azzal jellemezve*, hogy karbonsav-észterként izopropilmirisztátot tartalmaz.

6. Az 1. igénypont szerinti inszekticid készítmény *azzal jellemezve*, hogy karbonsav-észterként hexil-laurátot tartalmaz.



(I)