

6441/90

KÖZZÉTETELI
PÉLDÁNY

A

52.740/SZE

Kivonat

-54864-

Hatóanyagként tienil-tiokarbamidokat, -izotio-
karbamidokat és ~~INSEKTIKID ÉS AKARICID KÉRTIMÉNEK~~
-karbodiimideket tartalmazó ~~kártevőirtószerek~~ és eljárás a
hatóanyag előállítására

CIBA-GEIGY AG., BASEL, SVÁJC

A bejelentés napja: 1990. 10. 12.

Elsőbbsége: 1989. 10. 13. /3750/89-5 sz./

SVÁJC

A találmány hatóanyagként tienil-tiokarbamidokat, -izotio-
karbamidokat és -karbodiimideket tartalmazó ~~INSEKTIKID ÉS AKARICID KÉRTIMÉNEK~~
és a hatóanyagok előállítására alkalmas eljárásra vonatkozik.

A kártevőirtószerek hatóanyagként legalább egy /I/ általá-
nos képletű tienil-tiokarbamidot, -izotio-karbamidot vagy -karbo-
diimidet, e képletben

R_1 jelentése 1 - 12 szénatomos alkilcsoport, 3 - 6 szén-
atomos cikloalkilcsoporttal helyettesített 1 - 4 szénatomos al-
kilcsoport, 3 - 8 szénatomos cikloalkilcsoport vagy 1 - 4 szén-
atomos alkilcsoporttal helyettesített 3 - 6 szénatomos cikloal-
kilcsoport;

R_2 , R_3 és R_4 egymástól függetlenül hidrogénatom, 1 - 6
szénatomos alkilcsoport, fenilcsoport vagy 1 - 3, a halogénato-
mok, 1 - 6 szénatomos alkilcsoportok, 1 - 4 szénatomos alkoxi-
csoportok és 1-9 halogénatomot tartalmazó 1 - 6 szénatomos halo-
gén-alkil-csoportok közül kikerülő, csoporttal helyettesített

fenilcsoport;

Z jelentése -NH-CS-NH- , $\text{-N=C/SR}_5\text{-NH-}$ vagy -N=C=N- csoport; és

R_5 jelentése 1 - 6 szénatomos alkilcsoport vagy 3 - 5 szénatomos alkenilcsoport,

azzal a megszorítással, hogy az R_2 , R_3 vagy R_4 csoportok legalább egyikének a jelentése eltér hidrogénatomtól; valamint olyan /I/ általános képletű vegyületek sőt, amelyekben Z jelentése $\text{-N=C/SR}_5\text{-NH-}$ csoport, továbbá a kártevőirtószerek előállításánál szokásosan alkalmazott szilárd vagy folyékony vivőanyagot vagy higítószert, adott esetben felületaktív és/vagy más segédanyagot és kívánt esetben más hatóanyagot tartalmaz.

DK.

6441/90

**KÖZZÉTETELI
PÉLDÁNY**

A 54864

52.740/SZE

S.B.G. & K.
BUDAPESTI NEMZETKÖZI ÜGYVÉDI
ÉS SZABADALMI IRODA
1061 BUDAPEST, DALSZÍNHÁZ U. 10.
TELEFON: 153-3733

N205:AOIN43/10
COTD 333/36

Hatóanyagként tienil-tiokarbamidokat, -izotio-karbamidokat és
-karbodiimideket tartalmazó ~~INSEKTIKID ÉS AKARIKID KÉZITHÉNYEK~~
~~kártevőirtószerek~~ és eljárás a
hatóanyagok előállítására

CIBA-GEIGY AG., BASEL, SVÁJC

Feltaláló: Dr. PASCUAL Alfons, BASEL, SVÁJC

A bejelentés napja: 1990. 10. 12.

Elsőbbsége: 1989. 10. 13. /3750/89-5 sz./

SVÁJC

A találmány hatóanyagként tienil-tiokarbamidokat, -izotio-
karbamidokat és -karbodiimideket tartalmazó kártevőirtószerekre
és a hatóanyagok előállítására alkalmas eljárásra vonatkozik.

A találmány kiterjed a kártevőirtószerek alkalmazására, valamint a közbenső vegyületek előállítására is.

A tienil-tiokarbamidok, -izotiokarbamidok és -karbodiimidek az /I/ általános képletnek felelnek meg. Ebben a képletben

R_1 jelentése 1 - 12 szénatomos alkilcsoport, 3 - 6 szénatomos cikloalkilcsoporttal helyettesített 1 - 4 szénatomos alkilcsoport, 3 - 8 szénatomos cikloalkilcsoport vagy 1 - 4 szénatomos alkilcsoporttal helyettesített 3 - 6 szénatomos cikloalkilcsoport;

R_2 , R_3 és R_4 egymástól függetlenül hidrogénatom, 1 - 6 szénatomos alkilcsoport, fenilcsoport vagy 1 - 3 a halogénatomok, 1 - 6 szénatomos alkilcsoportok, 1 - 4 szénatomos alkoxycsoportok és 1 - 9 halogénatomot tartalmazó 1 - 6 szénatomos halogén-alkil-csoportok közül kikerülő csoporttal helyettesített fenilcsoport;

Z jelentése $-NH-CS-NH-$, $-N=C/SR_5/-NH-$ vagy $-N=C=N-$ csoport; és

R_5 jelentése 1 - 6 szénatomos alkilcsoport vagy 3 - 5 szénatomos alkenilcsoport, azzal a megszorítással, hogy az R_2 , R_3 vagy R_4 csoportok legalább egyikének a jelentése eltér hidrogénatomtól; valamint olyan /I/ általános képletű vegyületek sói, amelyekben Z jelentése $-N=C/SR_5/-NH-$ csoport.

A szubsztituensekként számításba jövő halogénatomok mind fluor- és klóratomok, mind bróm- és jódatomok lehetnek, amelyek közül a fluoratom és a klóratom részesül előnyben.

A más csoportok közül is szubsztituensekként számításba jövő alkilcsoportok egyenes vagy elágazó láncúak lehetnek. Ilyen alkilcsoportok például a metil-, etil-, propil-, izopropil-, butil-, izobutil-, szek-butil-, terc-butil-csoportok és a pentil-, hexil-, oktilcsoportok, valamint hasonló csoportok és ezek izomerjei.

A szubsztituensekként számításba jövő alkenilcsoportok egyenes vagy elágazó láncúak lehetnek és egy vagy több kettős-kötést tartalmazhatnak. Ilyen alkenilcsoportok például többek között az allil-, 1-propenil-, allenil-, butenil- vagy pentenil-csoportok.

A találmány szerinti meghatározás keretében szubsztituensekként számításba jövő egyszeresen vagy többszörösen halogén-alkilcsoportok atommal vagy -atomokkal helyettesített 1 - 6 szénatomos egyenes vagy elágazó láncúak lehetnek és csak részben halogénezettek vagy perhalogénezettek, mimellett a halogénatomok az előzőekben megadottak lehetnek. Ilyen szubsztituensek megfelelő példái többek között az egyszeresen, kétszeresen vagy háromszorosan fluorklór- és/vagy brómatommal helyettesített metilcsoport, így például a $-\text{CHF}_2$ vagy $-\text{CF}_3$ csoport; az 1 - 5-szörösen fluor-, klór- és/vagy brómatommal helyettesített etilcsoport, így például a $-\text{CH}_2\text{CF}_3$, $-\text{CF}_2\text{CCl}_3$, $-\text{CF}_2\text{CF}_3$, $-\text{CF}_2\text{CHCl}_2$, $-\text{CF}_2\text{CHF}_2$, $-\text{CF}_2\text{CFCl}_2$, $-\text{CF}_2\text{CHBr}_2$, $-\text{CF}_2\text{CHClF}$, $-\text{CF}_2\text{CHBrF}$ vagy $-\text{CClFCHClF}$ csoportok; az 1 - 7-szeresen fluor-, klór- és/vagy brómatommal helyettesített propil- vagy izopropilcsoport, így 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 $-\text{CH}/\text{CF}_3/2$ csoportok; az 1 - 9-szeresen fluor-, klór- és/vagy brómatommal helyettesített butil-

- 4 -

csoport vagy ennek valamely izomerje, így például a $-\text{CF}/\text{CF}_3/\text{CHFCH}_3$ vagy a $-\text{CH}_2/\text{CF}_2/2\text{CF}_3$ csoport.

A szubsztituensekként számításba jövő cikloalkilcsoportok például ciklopropil-, ciklobutil-, ciklopentil-, ciklohexil- vagy ciklooktilcsoportok lehetnek. A cikloalkilok a találmány szerinti meghatározás keretében egyszeresen vagy többszörösen 1 - 4 szénatomos alkilcsoporttal helyettesítettek és/vagy 1 - 4 szénatomos alkilénhidon keresztül a molekula maradékával összekötve lehetnek.

Az olyan /I/ általános képletű vegyületek, amelyekben Z jelentése $-\text{N}=\text{C}/\text{SR}_5/-\text{NH}-$ általános képletű csoport, azaz az /I/ általános képletű izotiokarbamidok, savaddíciós sók formájában is létezhetnek. Ilyen sók képzéséhez mind szerves, mind szervetlen savak alkalmasak. Ilyen savak például többek között a hidrogénhalogenidek, így a hidrogénklorid, hidrogénbromid, hidrogénjodid, a kénsav, különböző foszforsavak, a salétromsav, a hangyasav, ecetsav, propionsav, vajsav, valeriánsav, oxálsav, malonsav, borostyánkősav, almasav, maleinsav, fumársav, tejsav, citromsav, benzoésav, itálsav, fahéjsav, fenil-szulfonsav vagy a szalicilsav, előnyösen az oxálsav.

Az olyan /I/ általános képletű vegyületek, amelyekben Z jelentése $-\text{N}=\text{C}/\text{SR}_5/-\text{NH}-$ általános képletű csoport, a megfelelő $-\text{N}=\text{C}/\text{SR}_5/-\text{NH}- \rightleftharpoons -\text{NH}-\text{C}/\text{SR}_5/= \text{N}-$ szerkezetű tautomer formákban létezhetnek. Az előállítás kiterjed mind az egyes tautomerekre, mind a tautomerelegekre is.

Az /I/ általános képletű vegyületek közül biológiai hatásuk alapján azok kerülnek előtérben, amelyeknél az R_2 , R_3 vagy

R_4 szubsztituensek közül legalább kettőnek a jelentése eltér hidrogénatomtól.

Továbbá olyan /I/ általános képletnek megfelelő vegyületek előnyösek, amelyekben R_4 hidrogénatom, valamint azok, amelyekben R_1 jelentése 1 - 4 szénatomos alkilcsoport vagy 3 - 5 szénatomos cikloalkilcsoport, mégpedig a -terc- C_4H_9 vagy az -izo- C_3H_7 csoportok.

Különösen jelentősek azok az /I/ általános képletnek megfelelő vegyületek, amelyekben R_2 és R_3 egymástól függetlenül 2 - 5 szénatomos alkilcsoport, továbbá azok, amelyekben R_2 és/vagy R_3 jelentése -izo- C_3H_7 csoport, valamint azok, amelyekben R_5 metil- vagy etilcsoportot jelent.

Az /I/ általános képletű vegyületeket például a 0 304 025. számú európai találmányi bejelentésben ismertetett elvek szerint állítjuk elő. Az eljárásváltozatok szerint úgy járunk el, hogy

a/ olyan /I/ általános képletű vegyületek előállítására, amelyekben Z jelentése -NH-CS-NH- csoport, valamely /II/ általános képletű vegyületet egy /III/ általános képletű vegyülettel reagáltatunk; vagy

b/ adott esetben olyan /I/ általános képletű vegyületek előállítására, amelyekben Z jelentése $-N\dot{C}/SR_5/-NH-$ csoport, azokat a kapott /I/ általános képletű vegyületeket, amelyekben Z jelentése -NH-CS-NH- csoport, valamely /IV/ általános képletű vegyülettel reagáltatjuk; és kívánt esetben olyan kapott /I/ általános képletű vegyületet, amelyben Z jelentése $-N\dot{C}/SR_5/-NH-$ általános képletű csoport, önmagában ismert módon sóvá alakítunk; vagy

- 6 -

c/ adott esetben olyan /I/ általános képletű vegyületek előállítására, amelyekben Z jelentése $-N=C=N-$ csoport, olyan /I/ általános képletű vegyületekről, amelyekben Z jelentése $-NH-CS-NH-$ csoport, a kénatomot lehasítjuk; mimellett a /II/ - - /IV/ általános képletekben $R_1 - R_5$ szubsztituensek jelentése a fentiekben megadott és X valamely lehasítható csoport.

Az a/ eljárásváltozatot szokásosan légköri nyomáson és valamely szerves oldószerben vagy hígítószer jelenlétében vitelezzük ki. Az átalakítást $0\text{ }^{\circ}\text{C}$ és $150\text{ }^{\circ}\text{C}$ közötti, előnyösen 10 és $70\text{ }^{\circ}\text{C}$ közötti hőmérsékleten játszadjuk le. Oldószerekként vagy hígítószerekként alkalmasak például az éterek és az éterszerű vegyületek, így a dietil-éter, dipropil-éter, dibutil-éter, dioxán, dimetoxi-etán vagy a tetrahidrofurán; az N,N-dialkilezett karbon-savamidok; alifás, aromás, valamint halogénezett szénhidrogének, így benzol, toluol, xilolok, kloroform, metilén-klorid, széntetraklorid vagy klórbenzol; nitrilek, így acetonitril vagy propionitril; ketonok, így acetón, metil-etil-keton, metil-izopropil-keton vagy a ciklohexanon.

A b/ eljárásváltozatot célszerűen valamely közömbös szerves oldószerben és kissé emelt vagy normális nyomáson hajtjuk végre. A hőmérsékletet $10\text{ }^{\circ}\text{C}$ és $250\text{ }^{\circ}\text{C}$, előnyösen az alkalmazott oldószer forráspontján vagy $50\text{ }^{\circ}\text{C}$ -tól $150\text{ }^{\circ}\text{C}$ -ig terjedő hőmérséklettartományban tartjuk. Alkalmas oldó- vagy hígítószerek például az éterek és éterszerű vegyületek, így a dietil-éter, diizopropil-éter, dioxán vagy a tetrahidrofurán; az aromás szénhidrogének, így a benzol, toluol vagy a xilolok; a ketonok, így az acetón, metil-etil-keton vagy a ciklohexanon; az alkoholok vagy a

dimetil-formamid. A reakciót vagy egy bázis jelenlétében vitelezzük ki vagy a minden esetben keletkezett sót ezt követően bázissal utánkezeljük, ahogy J.B. Hendricksen et al. leírják az "Organic Chemistry", Mc Graw Hill Book Co., 1970, p. 378 - 382 irodalmi helyen.

Alkalmas lehasítható csoportok a /IV/ általános képletű kiindulási vegyületekben például a halogénatomok, különösen a klór-, bróm- vagy jódatom, vagy adott esetben halogénezett vagy alkilezett szulfonsavészterek, például a tozilát, brozilát vagy a mono- vagy dialkil-szulfát /mezilát, dimetil-szulfát/.

A c/ eljárásváltozatot valamely protonmentes, szerves oldó- vagy higítószerben normál nyomáson vitelezzük ki. A hőmérsékletet eközben 0°C és 150°C , előnyösen 10°C és 50°C között tartjuk. Alkalmas oldó- vagy higítószerrek például az éterek vagy éterszerű vegyületek, így a dietil-éter, dipropil-éter, dibutil-éter, dioxán, dimetoxi-etán vagy a tetrahidrofurán; N,N-dialkilezett karbonsavamidok, alifás, aromás, valamint halogénezett szénhidrogének, így benzol, toluol, xilolok, kloroform, metilén-klorid, széntetraklorid vagy klórbenzol; nitrilek, így acetonitril vagy propionitril; ketonok, így aceton, metil-etil-keton, metil-izopropil-keton vagy ciklohexanon lehetnek. A kén lehasítását az irodalomban leírt módszerekkel végezzük /T. Shibamura, Chemistry Letters 1977, p. 575-576; S. Kim, Tetrahedron Letters 1985, p. 1661-1664; W. Weith, B. 6, 1873, p 1398; G. Amiard, Bull. Soc. chim. 1956, p. 1360/. Lehasító reagenssekként emellett például HgO-t, bizonyos piridiniumsók, klórecetsavésztert, cianursav-kloridot, p-toluol-szulfokloridot

vagy bizonyos foszforsavészter-származékokat alkalmazunk.

A kiindulási anyagokként alkalmazott /II/ általános képletű izotiocianátok új vegyületek. Ezeket a vegyületeket alapjában ismert módszerek szerint állíthatjuk elő. Az eljárás abban áll, hogy valamely /V/ általános képletű anilint, amelyben R_2 , R_3 és R_4 jelentése az /I/ általános képletnél megadott, tiofoszfénnel reagáltatunk /Helv. Chem. Acta 66, 148; 043 054. számú európai találmányi bejelentés/.

A fenti /II/ általános képletnek megfelelő vegyületek előállítását célszerűen valamely szerves vagy szervetlen bázis és egy a reakcióban résztvevő anyagokkal szemben közömbös oldó- vagy hígítószer jelenlétében, $0\text{ }^{\circ}\text{C}$ és $100\text{ }^{\circ}\text{C}$ közötti hőmérsékleten, normál nyomáson végezzük. Alkalmas oldó- és hígítószerek többek között az éterek és éterszerű vegyületek, így például a dietil-éter, diizopropil-éter, dioxán vagy a tetrahidrofurán; aromás szénhidrogének, így benzol, toluol vagy a xilolok; ketonok, így aceton, metil-etil-ke-ton vagy ciklohexanon; vagy klórozott szénhidrogének, így a diklór-metán vagy a tetraklór-metán. Az alkalmas bázisok szerves vagy szervetlen eredetűek lehetnek, így például nátrium-hidrid, nátrium- vagy kalcium-karbonát, tercier aminok, így trietil-amin, trietilén-diamin vagy 4-dimetil-aminopiridin vagy a piridin.

Az előzőekben említett /V/ általános képletű anilínok ismertek vagy elvileg ismert módszerek szerint előállíthatók, amelynek során megfelelő oximot /Synthesis 1977, 200/ aromatiszálás közben aminocsoporttá alakítjuk /69-12 895. számú közzétett japán találmányi bejelentés; J. Org. Chem. 1953, 138; Arch. Pharm. 314, 557/.

A /III/ és /IV/ általános képletű kiindulási vegyületek ismertek vagy elvileg ismert módszerek szerint előállíthatók.

Már ismert a 26 57 772., a 27 27 416. és a 26 27 529. számú német nyilvánossádrahozatali iratokból, hogy helyettesített N-fenil-N'-alkil-, illetve -N'-cikloalkil-tiokarbamidok akaricid és/vagy inszekticid hatással rendelkeznek. Továbbá a 0300 972. számú európai találmányi bejelentésben inszekticid és akaricid hatású, helyettesített N-tienil-N'-benzoil-karbamidok és -tiokarbamidok vannak leírva, mimellett az N-[4-metil-5-
-/4-klór-fenil/-tien-3-il-7-N'-/2,6-difluor-benzoil/-tiokarbamid ott specifikusan meg van nevezve. Ezzel szemben a találmány szerinti eljárással előállított /I/ általános képletű vegyületek szerkezetileg lényegében különböznek ezektől azáltal, hogy egyidejűleg egy N-tien-3-il-, valamint egy N'-alkil-csoport van jelen és másrészt hiányzik egy N'-benzoilcsoport.

Meglepő módon felismertük, hogy a találmány szerinti eljárással előállítható vegyületeket a melegvérűek, a halak és a növények jól tűrik és értékes kártevőirtószerek hatóanyagaiként alkalmazhatók. Ezeket a vegyületeket hatóanyagként tartalmazó készítmények különösen jól használhatók rovarok és fonóállatok ellen, amelyek a haszon és dísznövényeket károsítják a mezőgazdaságban, különösen károsak a gyapot-, zöldség- és gyümölcsstermesztésben, az erdőkben, kedvezően alkalmazhatók a készlet- és anyagvédelemben, valamint a higiénia területén, különösen pedig a házi- és haszonállatok védelmére. Az /I/ általános képletű vegyületeket hatóanyagként tartalmazó készítmények különösen alkalmasak növénykárosító szírórovarok és szövőatkák, valamint

a talajban tenyésző kártevők, így például a *Diabrotica baltea* irtására. Ezek a hatóanyagok nagyon hatásosak normál érzékenységű és különösen rezisztens fajták minden vagy egyes fejlődési állapotokban lévő egyedei ellen. Emellett ezeknek a készítményeknek a hatása közvetlenül a kártevők azonnali elpusztításában mutatkozik meg vagy csak egy idő elteltével jelentkezik, például a védlésnél, vagy csökkent peterakásban és/vagy kikelés csökkenésében nyilvánul meg. A fent említett kártevőkhöz tartoznak a következők:

a lepidoptera rendből az alábbiak:

Acleris spp., *Adoxophes* spp., *Aegeria* spp., *Alabama argillaceae*, *Amylois* spp., *Anticarsia gemmatilis*, *Archips* spp., *Argyrotaenia* spp., *Autographa* spp., *Busseola fusca*, *Cadra castella*, *Carposina nipponensis*, *Chilo* spp., *Choristoneura* spp., *Clysia ambiguella*, *Cnaphalocrosis* spp., *Cnephasia* spp., *Cochylis* spp., *Coleophora* spp., *Crocidolomia binotalis*, *Cryptophlebia leucotreta*, *Cydia* spp., *Diparopsis castanea*, *Earias* spp., *Ephestia* spp., *Eucosma* spp., *Eupoecilia ambiguella*, *Ezproctis* spp., *Euxoa* spp., *Grapholita* spp., *Hedya nubiferana*, *Heliothis* spp., *Hellula undalis*, *Hyphantria cunea*, *Keiferia lycopersicella*, *Leucoptera scitella*, *Lithocollethis* spp., *Lobesia botrana*, *Lymantria* spp., *Lycaetia* spp., *Malacosoma* spp., *Mamestra brassicae*, *Manduca sexta*, *Operophtera* spp., *Ostrinia nubilalis*, *Pammene* spp., *Pandemis* spp., *Panolis flammea*, *Pectinophora gossypiella*, *Phthorimaea operculella*, *Pieris rapae*, *Pieris* spp., *Plutella xylostella*, *Prays* spp., *Scirpophaga* spp., *Sesamia* spp., *Sparganothis* spp., *Spodoptera* spp., *Synanthedon* spp., *Thaumetopea*

spp., *Tortrix* spp., *Trichoplusia* ni és *Yponomeuta* spp.;

a *koleoptera* rendből például a következők:

Agriotes spp., *Anthonomus* spp., *Atomaria linearis*, *Chaetocnema tibialis*, *Cosmopolites* spp., *Curculio* spp., *Dermestes* spp., *Epilachna* spp., *Eremnus* spp., *Leptinotarsa decemlineata*, *Lissorhoptrus* spp., *Melolontha* spp., *Orycaephilus* spp., *Otiorhynchus* spp., *Phlyctinus* spp., *Popillia* spp., *Psylliodes* spp., *Rhizopertha* spp., *Scarabeidae*, *Sitophilus* spp., *Sitotroga* spp., *Tenebrio* spp., *Tribolium* spp. és *Trogoderma* spp.;

az *orthoptera* rendből pedig az alábbiak:

Blatta spp., *Blattella* spp., *Gryllotalpa* spp., *Leucophaea maderae*, *Locusta* spp., *Periplaneta* spp. és a *Schistocerca* spp.;

az *izoptera* rendből például a következők:

Reticulitermes spp.,

a *pszokoptera* rendből például a *Liposcelis* spp.;

az *anoplura* rendből például a *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Pemphigus* spp. és a *Phylloxera* spp.;

a *mallofaga* rendből például a *damalinae* spp. és a *Trichodectes* spp.;

a *thysanoptera* rendből például az alábbiak:

Frankliniella spp., *Hercinothrips* spp., *Taeniothrips* spp., *Thrips palmi*, *Thrips tabaci* és a *Scirtothrips aurantii*;

a *heteroptera* rendből például a következők:

Cimex spp., *Distantiella theobroma*, *Dysdercus* spp., *Euchistus* spp., *Eurygaster* spp., *Leptocorisa* spp., *Nezara* spp., *Piesma* spp., *Rhodnius* spp., *Salbergella singularis*, *Scotinophara* spp. és a *Triatoma* spp.;

a homoptera rendből például a következők:

Aleurothrixus floccosus, Aleyrodes brassicae, Aonidiella spp., Aphididae, Aphis spp., Aspidiotus spp., Bemisia tabaci, Ceroplaster spp., Chrysomphalus aonidium, Chrysomphalus dictyospermi, Coccus hesperidum, Empoasca spp., Eriosoma larigerum, Erythroneura spp., Gascardia spp., Laodelphax spp., Lecanium sorni, Lepidosaphes spp., Macrosiphus spp., Myzus spp., Nephotettix spp., Nilaparvata spp., Paratoria spp., Pemphigus spp., Planococcus spp., Pseudaulacaspis spp., Pseudococcus spp., Psylla spp., Pulvinaria aethiopica, Quadraspidiotus spp., Rhopalosiphum spp., Saissetia spp., Scaphoideus spp., achizaphis spp., Stribion spp., Trialeurodes vaporariorum, Trioza erytreae és Unaspis citri;

a hymenoptera rendből például az alábbiak:

Acromyrmex, Atta spp., Cephus spp., Diprion spp., Diprionidae, Gilpinia polytoma, Hoplocampa spp., Lasius spp., Monomorium pharaonis, Neodiprion spp., Solenopsis spp. és a Vespa spp.;

a diptera rendből például a következők:

Aedes spp., Antherigona soecata, Bibio hortulanus, Calliphora erythrocephala, Ceratitis spp., Chrysomya spp., Culex spp., Cuterebra spp., Dacus spp., Drosophila melanogaster, Fannia spp., Gastraphilus spp., Glossina spp., Hypoderma spp., Hyppobosca spp., Liriomyza spp., Lucilia spp., Melanagromyza spp., Musca spp., Oestrus spp., Orseolia spp., Oscinella frit, pegomya hyoscyami, Phorbia spp., Rhagoletis pomonella, Sciara spp., Stomoxys spp. Tabanus spp., Tannia spp. és Tipula spp.;

a siphonaptera rendből például az alábbiak:

Ceratophyllus spp., *Xenopsylla cheopis*;
az akarina rendből például az alábbiak:

Acarus siro, *Aceria sheldoni*, *Aculus schlechtendali*, *Amblyomma* spp., *Argas* spp., *Boophilus* spp., *Brevipalpus* spp., *Bryobia pretiosa*, *Calipitrimerus* spp., *Chorioptes* spp., *Dermanyssus galinae*, *Eotetranychus carpini*, *Eriophyes* spp., *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Olygonychus pratensis*, *Ornithorodos* spp., *Panonychus* spp., *Phyllocoptuata oleivora*, *Polyphagotarsomenus latus*, *Psoroptes* spp., *Rhipicephalus* spp., *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp., *Tarsonemus* spp. és *Tetranychus* spp.; valamint a *thysanura* rendből például a *Lepisma saccharina*.

Az /I/ általános képletű vegyületeket hatóanyagként tartalmazó kártevőirtószerek említett jó peszticid hatása azt jelenti hogy azok az említett kártevők legalább 50 - 60 %-át elpusztítják /megölik/.

Az /I/ általános képletű hatóanyagok és ezeket tartalmazó készítmények hatását más inszekticid és/vagy akaricid szerek hozzáadása útján jelentős mértékben kiszélesíthetjük és az adott körülményekhez igazíthatjuk. Adalékokként például a következő hatóanyagosztályok képviselői jönnek számításba: szerves foszforvegyületek, nitrofenolok és származékaik, formamidinek, karbamidok, karbamátok, piretroidok, klórozott szénhidrogének és a *Bacillus thuringiensis*-készítmények.

Az /I/ általános képletű vegyületeket változatlan formában is alkalmazhatjuk ugyan, előnyösen azonban a formálótéchnikában szokásos segédanyagokkal együtt használjuk azokat és így például emulgeálható koncentrátumokká, közvetlenül perme-

tezhető vagy hígítható oldatokká, hígított emulziókká, permetezhető porokká, oldható porokká, porozószerekké, granulátumokká dolgozhatjuk fel vagy ismert módon polimer anyagokban kapszulázva készítjük el a hatóanyagokat felhasználásra. Az alkalmazási eljárásokat, így a permetezést, ködösítést, porozást, szórást vagy az öntözést ugyanúgy, mint a szereket a céloknak és az adott viszonyoknak megfelelően választjuk meg.

A formálást, azaz az /I/ általános képletnek megfelelő hatóanyagokat tartalmazó készítményeket, illetve ezeknek a hatóanyagoknak más inszekticidekkel vagy akaricidekkel és a legtöbb esetben szilárd vagy folyékony adalékkal és segédanyagokkal való kombinációját ismert módon alakítjuk ki, azaz a szereket, összetételeket vagy a készítményeket alapos keveréssel és/vagy a hatóanyagok és a töltőanyagok összeörklésével készítjük el, így például oldószerekkel, szilárd vivőanyagokkal és adott esetben felületaktív vegyületekkel /tenzidekkel/ való alapos elegyítés útján állítjuk elő azokat.

Oldószerekként a következők jöhetnek számításba: aromás szénhidrogének, előnyösen a 8 - 12 szénatomos frakciók, így a xilolelegyek, helyettesített naftalinok; továbbá ftálsavészterek, így a dibutil- vagy dioktil-ftalát, alifás szénhidrogének, így a ciklohexán; valamint paraffinok, alkoholok és glikolok, továbbá ezek ésterai és észterei, így az etanol, etilén-glikol, etilén-glikol-monometil- vagy -etiléter, ketonok, így a ciklohexanon, erősen poláros oldószerek, így az N-metil-2-pirrolidon, a dimetil-szulfoxid vagy a dimetil-formamid, valamint az adott esetben epoxidált növényolajok, így az epoxidált

kókuszdíóolaj vagy szójaolaj, valamint a víz.

Szilárd vivőanyagokként, például porozószeres és diszpergálható porok számára, rendszerint természetes kőzetliszteket, így kalcitot, talkumot, kaolint, montmorillonitot vagy attapulgitot alkalmazunk. A fizikai tulajdonságok javítása érdekében nagy diszperzitású kovasavakat vagy nagy diszperzitású szívóképes polimerizátumokat adhatunk a készítményekhez. Szemcsézett, adszorpcióképes granulátumhordozókként pórusos típusú anyagok, így horzsakő, téglatörmelék, szepiolit vagy bentonit jönnek számításba, de használhatóak nem-szorpciós vivőanyagok is, így kalcit vagy homok. Ezeken túlmenően egész sor szervetlen vagy szerves természetű granulált anyag, különösen dolomit vagy aprított növénymaradékok alkalmazhatóak erre a célra.

Felületaktiv vegyületekként a formálendő /I/ általános képzetű hatóanyagok vagy ezeknek a hatóanyagoknak más inszekticidekkel vagy akaricidokkal való kombinációi szerint nem-ionos, kationos és/vagy anionos tenzidek kerülnek felhasználásra, amelyek jó emulgeáló, diszpergáló és nedvesítő tulajdonságokkal rendelkeznek. Tenzideken tenzidelegeket is érteni kell.

Alkalmas anionos tenzidek mind az úgynevezett vízzoldható szappanok, mind pedig a vízzoldható, szintetikus felületaktív vegyületek lehetnek.

Szappanokként alkalmasak nagyobb szénatomszámú /10 - 22 szénatomos/ zsírsavak alkálifém-, alkáliföldfém- vagy adott esetben helyettesített ammóniumsói, így az olajsav vagy a sztearinsav nátrium- vagy káliumsói, vagy természetes zsírsavelegek, így például a kókuszdíóolajból vagy a tallolajból kapott zsírsav-

elegyek hasonló sói. Tenzidekként megemlíthetjük továbbá a zsírsav-metil-aurinsókat, valamint a módosított és nem-módosított foszfolipideket.

Gyakrabban azonban úgynevezett szintetikus tenzideket alkalmazunk, ilyenek a zsírszulfonátok, zsírszulfátok, szulfonált benzimidazol-származékok vagy az alkil-aril-szulfonátok.

A zsírszulfátok vagy -szulfonátok rendszerint alkálifém-, alkáliföldfém- vagy adott esetben helyettesített ammóniumsók formájában vannak jelen és általában 8 - 22 szénatomos alkil-csoportokkal rendelkeznek, mimellett az alkilcsoportok az acil-csoportok alkilrészét is magukban foglalják, ilyenek például a ligninszulfonsav, a dodecil-kénsavészter vagy egy a természetes zsírsavakból előállított zsíralkohol-szulfát-elegy nátrium- vagy kalciumsója. Ide tartoznak a kénsavészterek és a zsíralkohol-etilénoxid-adduktumok szulfonsavjainak a sói is. A szulfonált benzimidazol-származékok előnyösen 2 szulfonsavcsoportot és egy 8 - 22 szénatomos zsírsavmaradékot tartalmaznak. Az alkil-aril-szulfonátok például a dodecil-benzol-szulfonsav, a dibutil-naftalin-szulfonsav vagy egy naftalinszulfonsav-formaldehid-kondenzációs termék nátrium-, kalcium- vagy trietanolamin-sói. Számításba jönnek megfelelő foszfátok is, így például valamely p-nonil-fenol-/4-14/-etilénoxid-adduktum foszforsavészterének a sói is.

Nem-ionos tenzidekként elsősorban alifás vagy cikloalifás alkoholok, telített vagy telítetlen zsírsavak és alkil-fenolok poliglikol-éterszármazékai jönnek számításba, amelyek 3 - 30 glikolétercsoportot és 8 - 20 szénatomot tartalmazhatnak az ali-

fás/ szénhidrogénrészben és 6 - 18 szénatomot az alkil-fenol alkilrészében. Továbbá alkalmas nem-ionos tenzidek a vízzoldható 20 - 250 etilén-glikol-éter-csoportot és 10 - 100 propilén-glikol-éter-csoportot tartalmazó polietilén-oxid-adduktumok polipropilén-glikol, etilén-diaminopolipropilén-glikol és alkil-polipropilén-glikol alapon, amelyek 1 - 10 szénatomot tartalmaznak az alkilláncban. Az említett vegyületek egyébként 1 - 5 etilén-glikol-egységet tartalmaznak propilén-glikol-egységként.

Nem-ionos tenzidekként számításba jönnek a nonil-fenol-polietoxi-etanolok, ricinusolaj-poliglikol-éterek, ricinusolaj-tioxilát, polipropilén-polietilén-oxid-adduktumok, tributil-fenoxi-polietoxi-etanol, polietilén-glikol és az oktil-fenoxi-polietoxi-etanol. Ugyancsak számításba jönnek a polioxi-etilén-szorbitán zsírsavészterei is, így a polioxi-etilén-szorbitán-trioleát.

Kationos tenzidek mindenek előtt a kvaterner ammónium-só, amelyek N-szubsztituensként legalább egy 8 - 22 szénatomos alkilcsoportot tartalmaznak és további szubsztituensekként, rövidszénláncú, adott esetben halogénezett alkil-, benzil- vagy rövidszénláncú hidroxil-alkil-csoportokat foglalnak magukban. A sók előnyösen halogénidek, metil-szulfátok vagy etil-szulfátok, például a stearyl-trimetil-ammónium-klorid vagy a benzil-di/2-klóretil/-etil-ammónium-bromid.

A formálótechnikában használatos tenzidek például a következő publikációkban vannak leírva:

"1985 International Mc Cutcheron's Emulsifiers & Detergents",

Glen Rock NJ USA, 1985".

"H. Stache, "Tensid-Taschenbuch", 2. Aufl., C. Hanser Verlag München, Wien 1981,

M. and J. Ash. "Encyclopedia of Surfactants", Vol. I-III. Chemical Publishing Co., New York, 1980-1981.

A találmány szerinti kártevőirtó készítmények rendszerint 0,1 - 99 tömeg %, különösen 0,1 - 95 tömeg % /I/ általános képletnek megfelelő hatóanyagot vagy e hatóanyagoknak más inszekticid vagy akaricid hatású anyagokkal alkotott kombinációjából ilyen mennyiséget, 1 - 99,9 tömeg % szilárd vagy folyékony adalékananyagot és 0 - 25 tömeg %, különösen 0,1 - 20 tömeg % tenzidet tartalmaznak. Amíg kereskedelmi áruként inkább a koncentrált szerek részesülnek előnyben, addig a közvetlen felhasználók rendszerint a hígított készítményeket használják szívesebben, amelyek jóval kisebb hatóanyagkoncentrációval rendelkeznek. A jellegzetes alkalmazási koncentrációk 0,1 - 1000 ppm, előnyösen 0,1 - 500 ppm tartományban vannak. A hektáronkénti alkalmazási mennyiségek általában 1 - 1000 g hatóanyag /hektár, előnyösen 25 - 500 g/ha nagyságúak.

A találmány szerinti előnyös formált készítmények összetétele a következő: /% = tömegszázalék/

Emulgeálható koncentrátumok:

hatóanyag	1 - 20 %, előnyösen 5 - 10 %
felületaktiv anyag	5 - 30 %, előnyösen 10 - 20 %
folyékony vivóanyag	50 - 94 %, előnyösen 70 - 85 %

- 19 -

Porok:

Hatóanyag	0,1 - 10 %, előnyösen 0,1 - 1 %
szilárd vivőanyag	99,9 - 90 %, előnyösen 99,9-99 %

Szuszpendálható koncentrátumok:

hatóanyag	5 - 75 %, előnyösen 10 - 50 %
víz	94 - 24 %, előnyösen 88 - 30 %
felületaktív anyag	1 - 40 %, előnyösen 2 - 30 %

Nedvesíthető porok:

hatóanyag	0,5 - 90 %, előnyösen 1 - 80 %
felületaktív anyag	0,5 - 20 %, előnyösen 1 - 15 %
szilárd vivőanyag	5 - 95 %, előnyösen 15 - 90 %

Granulátumok:

hatóanyag	0,5 - 30 %, előnyösen 3 - 15 %
szilárd vivőanyag	99,5 - 70 %, előnyösen 97 - 85 %

A találmány szerinti készítmények további adalékanyagokat, így stabilizáló szereket, habzásgátlókat, tartósító szereket, viszkozitást szabályozó anyagokat, kötőanyagokat, tapadásjavító szereket és műtrágyákat vagy más, különleges célokat szolgáló hatóanyagokat is tartalmazhatnak.

A következő példák a találmány további bemutatására szolgálnak. A részek, százalékok és arányok tömegekre vonatkoznak,

- 20 -

amennyiben másként nem jelöljük.

1. példa

2,4-diizopropil-3-tienil-izotiocianát előállítása

/kiindulási vegyület/

5,60 g 2,4-diizopropil-tienil-3-amin-hidrokloridot keverés közben kis adagokban $0 - 5^{\circ}\text{C}$ -on hozzáadunk 5,50 g kalcium-karbonátból, 40 ml vízből, 3,75 g tiofoszfénből, 70 ml diklór-metánból és 2,70 g nátrium-hidrogénkarbonátból álló elegyhez. A reakcióelegyet 3 óra hosszat keverjük szobahőmérsékleten és utána kovaföldön szűrjük. A szerves fázist elkülönítjük, 50 ml telített NaCl-oldattal és 50 ml vízzel mossuk, magnézium-szulfát felett szárítjuk és ezt követően bepároljuk. Az /I/ képletű címszerűti vegyületet erősen elszíneződött olajként kapjuk, amelyet további tisztítás nélkül tovább alkalmazunk.

Hasonló módon állítjuk elő a megadott tienil-3-aminokból, amelyek az /V/ általános képletnek felelnek meg, a /II/ általános képletű ezek után felsorolt /II/ általános képletű tienil-3-izotiocianátokat:

/V/ általános képletű anilínok

A táblázat fejlécében megadjuk az R_2 , R_3 és R_4 szubsztituensek értékei, valamint a fizikai jellemzőket.

R_2	R_3	R_4	Fizikai adatok/ $^1\text{H-NMR}$ /60 MHz, CDCl_3 /
CH_3	CH_3	CH_3	3,30 br, s/2/; 2,20 s/3/; 2,15 s/3/; 1,95 s/3/;
CH_3	H	C_6H_5	7,6-7,1 m/5/; 6,70 s/1/; 3,25 br s/2/; 2,25 s/3/
CH_3	C_3H_7-1	C_4H_9-1	3,55 br s/2/; 3,05 hept/1/; 2,50 d/2/ $J=7$, 2,10 s/3/; 1,9-1,16 m/1/; 1,25 d/6/ $J=7$; 0,90 d/6/ $J=7$
$1-\text{C}_3\text{H}_7$	H	C_6H_5	7,5-7,1 m/5/; 6,65 s/1/; 3,30 br s/2/; 3,00 hept/1/ $J=7$; 1,20 d/6/ $J=7$
$1-\text{C}_3\text{H}_7$	H	CH_3	6,15 q/1/ $J=1$; 3,15 br s/2/; 2,95 hept/1/ $J=7$; 2,30 d/3/ $J=1$; 1,20 d/6/ $J=7$
$1-\text{C}_3\text{H}_7$	CH_3	CH_3	3,90 br s/2/; 3,00 hept/1/ $J=7$; 2,20 s/3/, 1,90 s/3/; 1,20 d/6/ $J=7$
$1-\text{C}_3\text{H}_7$	C_3H_7-1	H	6,55 s/1/ 3,55 br s/2/; 3,05 hept/1/ $J=7$; 2,75 hept/1/ $J=7$; 1,20 d/6/ $J=7$

R_2	R_3	R_4	Fizikai adatok/ $^1\text{H-NMR}$ /60 MHz, CDCl_3
C_2H_5	C_3H_7-1	H	6,65 s/1/, 2,73 hept /1/ $J=7$, 2,52 q/2/ $J=7$, 1,55 bs/2/, 1,28 t/3/ $J=7$, 1,25 d/6/ $J=7$

/II/ általános képletű vegyületek

A táblázat fejlécében megadjuk az R_2 , R_3 és R_4 szubsztituensek értékeit, valamint a fizikai adatokat.

R_2	R_3	R_4	Fizikai adatok/ $^1\text{H-NMR}$ /60 MHz, CDCl_3
H	H	C_6H_5	7,50-7,15 m/5/; 7,05 d/1/ $J=1,5$; 6,95 d/1/ $J=1,5$
H	H	CH_3	6,85 d/1/ $J=1$; 6,60 m/1/; 2,40 d/3/ $J=1$
H	CH_3	CH_3	6,85 s/1/; 2,30 s/3/; 2,10 s/3/
CH_3	CH_3	CH_3	2,30 s/6/; 2,10 s/3/
CH_3	H	C_6H_5	7,50-7,20 m/5/; 6,95 s/1/; 2,45 s/3/

R_2	R_3	R_4	Fizikai adatok/ $^1\text{H-NMR}$ /60 MHz, CDCl_3
CH_3	$\text{C}_3\text{H}_7\text{-1}$	$\text{C}_4\text{H}_9\text{-1}$	3,05 hept/1/ $J=7$; 2,50 d/2/ $J=7$; 2,30 s/3/, 1,90-1,60 m/1/; 1,25 d/6/ $J=7$; 0,90 d/6/ $J=7$
$\text{C}_3\text{H}_7\text{-1}$	H	C_6H_5	7,50-7,15 m/5/; 6,85 s/1/; 3,30 hept/1/ $J=7$; 1,30 d/6/ $J=7$
$\text{C}_3\text{H}_7\text{-1}$	H	CH_3	6,45 d/1/ $J=1$; 3,25 hept/1/ $J=7$; 2,35 br s/3/; 1,30 d/6/ $J=7$
$\text{C}_3\text{H}_7\text{-1}$	CH_3	CH_3	3,25 hept/1/ $J=7$; 2,25 s/3/; 2,05 s/3/, 1,20 d/6/ $J=7$
$\text{C}_3\text{H}_7\text{-1}$	$\text{C}_3\text{H}_7\text{-1}$	H	6,60 s/1/, 3,35 hept/1/ $J=7$; 2,95 hept/1/ $J=7$; 1,30 d/6/ $J=7$; 1,25 d/6/ $J=7$
C_2H_5	$\text{C}_3\text{H}_7\text{-1}$	H	6,68 s/1/, 2,94 hept/1/ $J=7$, 2 2,85 q/2/ $J=7$, 1,29 t/3/ $J=7$; 1,24 d/6/ $J=7$

2. példa

1-terc-butil-3-/2,4-diizopropil-3-tienil/-tiokarbamid
előállítás

- 24 -

5,75 g 1. példa szerint előállított 2,4-diizopropil-tienil-3-izotiocianátot 70 ml toluollal hígítunk és keverés közben, cseppenként hozzáadunk 2,16 g terc-butil-amint. Ezt követően az elegyet körülbelül 80 °C-on 2 óra hosszat tovább keverjük. Ezután a reakcióelegyet betöményítjük és a maradékhoz hexánt adunk. A keletkező szilárd anyagot szűrőssel elkülönítjük, hexánnal utána mossuk és végül kovagél-oszlopon kromatografáljuk, a futtatást 1:3 arányú etil-acetát/hexán-eleggyel végezzük. Ily módon a címszerinti vegyületet kapjuk, amely a /2/ képletnek felel meg.

A kapott termék szintelen kristályos por, amelynek az olvadáspontja 168 - 169 °C /vegyületszám 1.01/.

Hasonló módon állítjuk elő az /Ia/ általános képletnek megfelelő találmány szerinti tiokarbamidokat is.

/Ia/ általános képletű vegyületek

A táblázat fejlécében a vegyületek sorszáma mellett megadjuk az R_1 , R_2 , R_3 és R_4 szubsztituensek értékeit, valamint az olvadáspontokat.

Vegyület száma	R_1	R_2	R_3	R_4	Op. °C
1.02	C_3H_7-1	H	H	C_6H_5	151-154
1.03	C_4H_9-t	H	H	C_6H_5	130-133
1.04	$C/CH_3/2C_2H_5$	H	H	C_6H_5	124-125
1.05	$C_6H_9-ciklo$	H	H	C_6H_5	110-113
1.06	C_4H_9-t	H	H	CH_3	102-105

Vegyület száma	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Op. C°
1.07	C ₄ H ₉ -t	H	CH ₃	CH ₃	143-146
1.08	C ₃ H ₇ -1	H	CH ₃	CH ₃	120-122
1.09	C ₄ H ₉ -t	CH ₃	CH ₃	CH ₃	169-170
1.10	C ₃ H ₇ -1	CH ₃	CH ₃	CH ₃	125-126
1.11	C ₄ H ₉ -t	CH ₃	H	C ₆ H ₅	153-154
1.12	C ₄ H ₉ -t	CH ₃	C ₃ H ₇ -1	C ₄ H ₉ -1	87-90
1.13	C ₃ H ₇ -1	CH ₃	C ₃ H ₇ -1	C ₄ H ₉ -1	93-95
1.14	C ₄ H ₉ -t	C ₃ H ₇ -1	H	C ₆ H ₅	157-158
1.15	C ₃ H ₇ -1	C ₃ H ₇ -1	H	C ₆ H ₅	155-156
1.16	C ₄ H ₉ -t	C ₃ H ₇ -1	H	CH ₃	122-123
1.17	C ₃ H ₇ -1	C ₃ H ₇ -1	H	CH ₃	125-127
1.18	C ₄ H ₉ -t	C ₃ H ₇ -1	CH ₃	CH ₃	95-96
1.19	C ₃ H ₇ -1	C ₃ H ₇ -1	CH ₃	CH ₃	101-103
1.20	C ₃ H ₇ -1	C ₃ H ₇ -1	C ₃ H ₇ -1	H	171-172
1.21	C ₄ H ₉ -t	C ₂ H ₅	C ₃ H ₇ -1	H	92-94

Ahogy az előzőekben megadtuk, úgy állítjuk elő a következő /Ia/ általános képletnek megfelelő vegyületeket is. A táblázat fejlécében az R₁, R₂, R₃ és R₄ szubsztituenseket tüntetjük fel.

R_1	R_2	R_3	R_4
$C/CH_3/2-C_2H_5$	C_3H_7-1	C_3H_7-1	H
C_5H_9 -ciklo	C_3H_7-1	C_3H_7-1	H
C_3H_7-1	C_2H_5	C_3H_7-1	H

3. példa

1-terc-butil-3-/2,4-diizopropil-3-tienil/-S-metil-izotiokarbamid előállítása

1,50 g 2. példa szerint előállított 1-terc-butil-3-/2,4-di-izopropil-3-tienil/-tiokarbamidhoz 30 ml etanolban szobahőmérsékleten hozzáadunk 1,65 g metil-jodidot és az elegyet 5 óra hosszat $75^\circ C$ -on melegítjük. Ezt követően az elegyet bepároljuk, a maradékot diklór-metánban felvesszük és hígított nátrium-hidrogénkarbonát-oldattal kétszer mossuk. Az elkülönített szerves fázist magnézium-szulfát felett szárítjuk és az oldószert lepároljuk. A nyers terméket oszlopkromatográfiásan tisztítjuk kovagélen, a futtatást pedig 1:10 arányú etil-acetát/hexán-eleggyel végezzük. Ily módon a címszerinti vegyületet kapjuk, amely a /3/ képletnek felel meg.

A vegyület színtelen, sűrűnfolyó olaj, amelynek az n_D^{22} értéke 1.5404 /2.01 számú vegyület/.

Hasonló módon állítjuk elő a következő táblázatban megadott

/Ib/ általános képletnek megfelelő vegyületeket is, amelyek izotio-karbamidok.

/Ib/ általános képletű vegyületek

A táblázat fejlécében a vegyületek sorszáma mellett megadjuk az R_1 , R_2 , R_3 és R_4 szubsztituensek értékeit, valamint a fizikai adatait.

Vegyület száma	R_1	R_2	R_3	R_4	Fizikai adatok
2.02	C_3H_7-i	H	H	C_6H_5	$n_D^{22} = 1.6445$
2.03	C_4H_9-t	H	H	C_6H_5	Op. 51-54 °C
2.04	$C/CH_3/2C_2H_5$	H	H	C_6H_5	$n_D^{23} = 1.6205$
2.05	$C_5H_9-ciklo$	H	H	C_6H_5	$n_D^{23} = 1.6480$
2.06	C_4H_9-t	H	H	CH_3	
2.07	C_4H_9-t	H	CH_3	CH_3	$n_D^{24} = 1.5665$
2.08	C_3H_7-i	H	CH_3	CH_3	Op. 50-53 °C
2.09	C_4H_9-t	CH_3	CH_3	CH_3	$n_D^{23} = 1.5520$
2.10	C_3H_7-i	CH_3	CH_3	CH_3	$n_D^{23} = 1.5625$
2.11	C_4H_9-t	CH_3	H	C_6H_5	
2.12	C_4H_9-t	CH_3	C_3H_7-i	C_4H_9-i	$n_D^{25} = 1.5378$
2.13	C_3H_7-i	CH_3	C_3H_7-i	C_4H_9-i	$n_D^{25} = 1.5380$
2.14	C_4H_9-t	C_3H_7-i	H	C_6H_5	$n_D^{23} = 1.6045$

Vegyület száma	R_1	R_2	R_3	R_4	Fizikai adatok
2.15	C_3H_7-i	C_3H_7-i	H	C_6H_5	Op. 83-86 °C
2.16	C_4H_9-t	C_3H_7-i	H	CH_3	$n_D^{23} = 1.5495$
2.17	C_3H_7-i	C_3H_7-i	H	CH_3	$n_D^{23} = 1.5555$
2.18	C_4H_9-t	C_3H_7-i	CH_3	CH_3	Op. 63-66 °C
2.19	C_3H_7-i	C_3H_7-i	CH_3	CH_3	$n_D^{25} = 1.5470$
2.20	C_4H_9-t	C_2H_5	C_3H_7-i	H	$n_D^{20} = 1.5312$
2.21	C_3H_7-i	C_3H_7-i	C_3H_7-i	H	$n_D^{23} = 1.5421$

Ahogy az előzőekben megadtuk, úgy állítjuk elő a következő /Ib/ általános képletnek megfelelő vegyületeket is. A táblázat fejlécében az R_1 , R_2 , R_3 és R_4 szubsztituenseket tüntetjük fel.

R_1	R_2	R_3	R_4
$C/CH_3/2-C_2H_5$	C_3H_7-i	C_3H_7-i	H
$C_5H_9-ciklo$	C_3H_7-i	C_3H_7-i	H
C_3H_7-i	C_2H_5	C_3H_7-i	H

4. példa

Az 1-terc-butyl-3-/2-izopropil-5-metil-3-tienil/-S-metil-izotio-

karbamid oxálsavsójának előállítása

0,85 g 3. példa szerint előállított 1-terc-butil-3-/2-izopropil-5-metil-3-tienil/-S-metil-izotiokarbamidot éterben /diethyl-éterben/ oldunk és hozzáadunk 3,5 ml telített oxálsav-oldatot, amelyet éterrel készítettünk, keverés közben. Az elegyet 10 ml éterrel hígítjuk és az egészet 15 percig tovább keverjük szobahőmérsékleten. A keletkező szilárd anyagot leszivatással elkülönítjük és 10 - 10 ml éterrel háromszor alaposan utánamossuk. Ily módon szintelen kristályport kapunk, amely a címszerinti vegyület. Op. 138-140 C° /vegyületszám 3.01/.

Hasonló módon állítjuk elő az /Ic/ általános képletnek megfelelő találmány szerinti izotiokarbamidsókat is.

/Ic/ általános képletű vegyületek

A táblázat fejlécében a vegyületek sorszáma mellett megadjuk az R_1 , R_2 , R_3 , R_4 , R_5 szubsztituensek és Y értékeit, valamint az olvadáspontokat.

Vegyület száma	R_1	R_2	R_3	R_4	R_5	Y	Op. C°
3.02	C_3H_7-1	C_3H_7-1	H	C_6H_5	CH_3	H/COO/2	200-202
3.03	C_3H_7-1	CH_3	CH_3	CH_3	CH_3	H/COO/2	175-178
3.4	C_4H_9-t	CH_3	CH_3	CH_3	CH_3	H/COO/2	110-112

- 30 -

Ahogy az előzőekben megadtuk, úgy állítjuk elő a következő /Ic/ általános képletű sókat is. A táblázat fejlécében az R_1 , R_2 , R_3 , R_4 , R_5 szubsztituenseket és X értékét adjuk meg.

R_1	R_2	R_3	R_4	R_5	X
C_4H_9-t	C_3H_7-1	C_3H_7-1	H	CH_3	H/COO/2
C_3H_7-1	C_3H_7-1	CH_3	CH_3	CH_3	H/COO/2
C_4H_9-t	C_2H_5	C_3H_7-1	H	CH_3	H/COO/2

5. példa

1-terc-butil-3-/2,4-diizopropil-3-tienil/-karbodiimid előállítása

2,50 g 2. példa szerint előállított 1-terc-butil-3-/2,4-diizopropil-3-tienil/-tiokarbamidot és 2,60 g 2-klór-1-metil-piridinium-jodidot beviszünk 25 ml acetonitrilbe és az elegyhez szobahőmérsékleten hozzáadunk 1,90 g trietil-amint 12 ml acetonitrilben oldva. Ezt követően a reakcióelegyet 2 óra hosszat keverjük körülbelül $45^\circ C$ -on. Ezután az oldószert lepároljuk és a maradékot felvesszük hexán/víz-elegyben, majd a szerves fázist leválasztjuk. Az elkülönített szerves fázist magnézium-szulfát felett szárítjuk és az oldószert vákuumban eltávolítjuk. A nyers terméket oszlopkromatográfiásan tisztítjuk kovagélén és a futtatást 1:20 arányú etil-acetát/hexán-eleggyel végezzük. Ily módon a cím-

- 31 -

szerinti vegyületet kapjuk, amely a /4/ képletnek felel meg.
A termék szintelen olaj, amelynek n_D^{23} értéke 1.5249 /4.01 számú
vegyület/.

Hasonló módon állítjuk elő az /Id/ általános képletnek meg-
felelő találmány szerinti karbodiimideket is.

/Id/ általános képletű vegyületek

A táblázat fejlécében a vegyületek sorszáma mellett meg-
adjuk az R_1 , R_2 , R_3 , R_4 szubsztituenseket és a fizikai adatokat.

Vegyület száma	R_1	R_2	R_3	R_4	Fizikai adatok
4.02	C_3H_7-1	H	H	C_6H_5	$n_D^{23} = 1.6185$
4.03	C_4H_9-t	H	H	C_6H_5	$n_D^{23} = 1.6040$
4.04	$C/CH_3/2C_2H_5$	H	H	C_6H_5	$n_D^{24} = 1.5955$
4.05	$C_5H_9-ciklo$	H	H	C_6H_5	viaszhoz hasonló tömeg
4.06	C_6H_9-t	H	CH_3	CH_3	$n_D^{24} = 1.5360$
4.07	C_4H_9-t	CH_3	CH_3	CH_3	$n_D^{24} = 1.5335$
4.08	C_3H_7-1	CH_3	CH_3	CH_3	$n_D^{24} = 1.5375$
4.09	C_4H_9-t	CH_3	C_3H_7-1	C_4H_9-1	$n_D^{25} = 1.5215$
4.10	C_3H_7-1	CH_3	C_3H_7-1	C_4H_9-1	$n_D^{25} = 1.5323$
4.11	C_4H_9-t	C_3H_7-1	H	C_6H_5	$n_D^{23} = 1.5875$
4.12	C_3H_7-1	C_3H_7-1	H	C_6H_5	$n_D^{23} = 1.5985$

Vegyület száma	R ₁	R ₂	R ₃	R ₄	Fizikai adatok
4.13	C ₄ H ₉ -t	C ₃ H ₇ -i	H	CH ₃	n _D ²³ = 1.5235
4.14	C ₃ H ₇ -i	C ₃ H ₇ -i	H	CH ₃	n _D ²³ = 1.5285
4.15	C ₄ H ₉ -t	C ₃ H ₇ -i	CH ₃	CH ₃	n _D ²⁴ = 1.5265
4.16	C ₃ H ₇ -i	C ₃ H ₇ -i	CH ₃	CH ₃	n _D ²⁴ = 1.5335
4.17	C ₄ H ₉ -t	C ₂ H ₅	C ₃ H ₇ -i	H	n _D ²⁰ = 1.5490
4.18	C ₃ H ₇ -i	C ₃ H ₇ -i	C ₃ H ₇ -i	H	n _D ²³ = 1.5309

Ahogy az előzőekben megadtuk, úgy állítjuk elő a következő /Id/ általános képletű vegyületeket is. A táblázatban a fejléc-ben megadjuk R₁, R₂, R₃ és az R₄ szubsztituenseket.

R ₁	R ₂	R ₃	R ₄
C/CH ₃ / ₂ -C ₂ H ₅	1-C ₃ H ₇	C ₃ H ₇ -i	H
C ₅ H ₉ -ciklo	1-C ₃ H ₇	C ₃ H ₇ -i	H
C ₃ H ₇ -i	C ₂ H ₅	C ₃ H ₇ -i	H
C ₄ H ₉ -t	H	H	CH ₃
C ₃ H ₇ -i	H	CH ₃	CH ₃
C ₄ H ₉ -t	CH ₃	H	C ₆ H ₅

6. példa

A 2 - 5 előállítási példák szerinti /I/ általános képletnek
megfelelő hatóanyagok formálása

/% = tömegszázalék/

6.1 példa

Emulgeálható koncentrátumok

	a/	b/	c/
hatóanyag /vegyületszámok: 1.01-1.21; 2.01-2.21; 3.01-3.04; 4.01-4.18/	25 %	40 %	50 %
Ca-dodecil-benzol-szulfonát	5 %	8 %	6 %
ricinusolaj-polietylénglikol-éter /36 mól etilénoxid/	5 %	-	-
tributil-fenol-polietylénglikol-éter /30 mól etilénoxid/	-	12 %	4 %
ciklohexanon	-	15 %	20 %
xilolelegy	65 %	25 %	20 %

Ilyen koncentrátumokból vízzel való hígítással minden kívánt
töménységű emulziót előállíthatunk.

6.2 példa

Oldatok

	a/	b/	c/	d/
hatóanyag /vegyületszámok: 1.01-1.21; 2.01-2.21; 3.01-3.04; 4.01-4.18;/	80 %	10 %	5 %	95 %

- 34 -

	a/	b/	c/	d/
etilénglikol-monometil-éter	20 %	-	-	-
polietilénglikol /móltömeg = 400/	-	70 %	-	-
N-metil-2-pirrolidon	-	20 %	-	-
epoxidált kókuszdióolaj	-	-	1 %	5 %
benzin /forráshatárok = 160-190 C°/	-	-	94 %	-

Az oldatok kis cseppek formájában való felhasználásra alkalmasak.

6.3 példa

Granulátum

	a/	b/
hatóanyag /vegyületszámok: 1.01-1.21; 2.01-2.21; 3.01-3.04; 4.01-4.18/	5 %	10 %
kaolin	94 %	-
nagy diszperzitású kovasav	1 %	-
attapulgit	-	90 %

A hatóanyagot metilén-kloridban oldjuk, vivőanyagra rápermetezzük az oldatot és az oldószert ezt követően vákuumban lepároljuk.

6.4 példa

Porozószer

	a/	b/
hatóanyag /vegyületszámok: 1.01-1.21; 2.01-2.21; 3.01-3.04; 4.01-4.18/	2 %	5 %
nagy diszperzitású kovasav	1 %	5 %
talkum	97 %	-
kaolin	-	90 %

A vivőanyagokat alaposan összekeverjük a hatóanyaggal és így használatra kész porozószeret kapunk.

6.5 példa

Permetezőpor

	a/	b/	c/
hatóanyag /vegyületszámok: 1.01-1.21; 2.01-2.21; 3.01-3.04; 4.01-4.18/	25 %	50 %	75 %
Na-ligninszulfonát	5 %	5 %	-
Na-laurilszulfonát	3 %	-	5 %
Na-diizobutil-naftalin-szulfonát	-	6 %	10 %
oktilfenol-polietylénglikol-éter /7-8 mól etilénoxid/	-	2 %	-
nagy diszperzitású kovács	5 %	10 %	10 %
kaolin	62 %	27 %	-

A hatóanyagot vagy a hatóanyagkombinációt összekeverjük az adalékanyagokkal és alkalmas malomban jól megőröljük. Ily módon permetezőporokat kapunk, amelyeket vízzel minden kívánt koncentrációra hígíthatunk.

6.6 példa

Emulgeálható koncentrátum

hatóanyag /vegyületszámok: 1.01-1.21; 2.01-2.21; 3.01-3.04; 4.01-4.18/	10 %
oktilfenol-polietylénglikol-éter /4-5 mól etilénoxid/	3 %

- 36 -

Ca-dodecil-benzol-szulfonát	3 %
ricinusolaj-poliglikoléter	
/36 mól etilénoxid/	4 %
ciklohexanon	30 %
xiloleleg	50 %

Ebből a koncentrátumból vízzel minden kívánt töménységű emulziót előállíthatunk.

6.7 példa

Porozószer

	a/	b/
hatóanyag /vegyületszámok: 1.01-1.21;		
2.01-2.21; 3.01-3.04; 4.01-4.18/	5 %	8 %
talkum	95 %	-
kaolin	-	92 %

A hatóanyagot a vivőanyaggal összekeverjük és alkalmas malomban megőröljük, ily módon használatra kész porozószer állítunk elő.

6.8 példa

Extrudált granulátum

hatóanyag /vegyületszámok: 1.01-1.21; 2.01-2.21;	
3.01-3.04; 4.01-4.18/	10 %
Na-ligninszulfonát	2 %
karboxi-metil-cellulóz	1 %
kaolin	87 %

- 37 -

A hatóanyagot vagy a hatóanyagkombinációt az adalékanyagokkal összekeverjük, megőröljük és vízzel megnedvesítjük. Az elegyet extrudáljuk, granuláljuk és ezt követően levegőáramban szárítjuk.

6.9 példa

Bevont granulátum

hatóanyag /vegyületszámok: 1.01-1.21;	
2.01-2.21; 3.01-3.04; 4.01-4.18/	3 %
polietilén-glikol /móltömeg 200/	3 %
kaolin	94 %

A finoman megőrölt hatóanyagot vagy hatóanyagkombinációt keverőben felhordjuk egyenletesen polietilén-glikollal megnedvesített kaolinra. Ily módon pormentes bevont granulátumokat állítunk elő.

6.10 példa

Szuszpendálható koncentrátum

hatóanyag /vegyületszámok: 1.01-1.21;	
2.01-2.21; 3.01-3.04; 4.01-4.18/	40 %
etilén-glikol	10 %
nonilfenol-polietilén-glikol-éter	
/15 mól etilén-oxid/	6 %
Na-ligninszulfonát	10 %

- 38 -

karboxi-metil-cellulóz	1 %
37 %-os vízes formaldehyd-oldat	0,2 %
szilikonolaj 75 %-os vízes emulzió formájában	0,8 %
víz	32 %

A finomra megőrölt hatóanyagot vagy hatóanyagkombinációt az adalékanyagokkal alaposan összekeverjük. Ily módon szuszpen-dálható koncentrátumot kapunk, amelyből vízzel való hígítással minden kívánt töménységű szuszpenziót készíthetünk.

7. példa

Hatás Boophilus microplus ellen

Jól táplált nőtény kullancsokat egy PVC lapra felragasztunk és egy vattacsomóval letakarunk. Kezelés céljából az állatokat 10 ml vizsgálándó oldattal, amely 400 ppm vizsgálándó hatóanyagot tartalmaz meglocsoljuk. Ezt követően a vattacsomót eltávolítjuk és a kullancsokat inkubáljuk 4 hétig peterakás végett. A Boophilus microplus elleni hatás a nőtényeknek pusztulásként vagy sterilitásként, vagy a petéknél ovicid hatásként mutatkozik meg.

A 2. - 5. példák szerinti /I/ általános képletnek megfelelő vegyületek ennél a kísérletnél jó hatást mutatnak Boophilus microplus ellen. A 4.01, a 4.11 és a 4.13 számú vegyületekkel 80 % feletti hatást értünk el.

8. példaHatás Nilaparvata lugens ellen

Rizsnövényeket megpermetezünk vizes permetlé-emulzióval, amely 400 ppm hatóanyagot tartalmaz. A permetlé rászáradása után a rizsnövényekre 2. és 3. lárvaállapotú kabócalárvákat telepítünk. Az értékelést 21 nap elteltével végezzük. A kezelt és a kezeletlen növényeken lévő túlélő kabócák számának az összehasonlításából meghatározzuk a szaporodáscsökkenést százalékban /%-os hatás/.

A 2 - 5. példa szerinti /I/ általános képletű vegyületek jó hatást mutatnak Nilaparvata lugens ellen ennél a vizsgálatnál. Különösen az 1.01, 1.14, 1.16, 1.18, 2.01, 2.14, 2.18, 4.01, 4.11 és a 4.15 számú vegyületekkel 80 % feletti hatást értünk el.

9. példaHatás Nephotettix cincticeps ellen

Rizsnövényeket megpermetezünk vizes permetlé-emulzióval, amely 400 ppm hatóanyagot tartalmaz. A permetlé rászáradása után a rizsnövényekre 2. és 3. lárvaállapotú kabócalárvákat telepítünk. Az értékelést 21 nappal a kezelés után végezzük. A kezelt és a kezeletlen növényeken lévő túlélő kabócák számának az összehasonlításából meghatározzuk a szaporodáscsökkenést százalékban /%-os hatás/.

A 2 - 5. példa szerinti /I/ általános képletű vegyületek jó hatást mutatnak Nephotettix cincticeps ellen ennél a vizsgálatnál.

- 40 -

Az 1.01, 1.18, 2.01. 2.18 és a 4.15 számú vegyületek különösen 80 % feletti hatást mutattak.

10. példa

Hatás Bemisia tabaci ellen

Bokorbab-növényeket gézketrecbe viszünk és kifejlett Bemisia tabaci-kat /fehér legyeket/ telepítünk rájuk. A peterakás megtörténte után valamennyi kifejlett legyet eltávolítjuk és 10 nappal később a rajtuk lévő nimfákkal együtt megpermetezzük a vizsgálandó hatóanyagok vízes permetlé-emulziójával /400 ppm/. Az értékelést 14 nappal a hatóanyag alkalmazása után végezzük és megállapítjuk a kikelt egyedek százalékos mennyiségét a kezeletlen kontrollhoz viszonyítva.

A 2 - 5. példa szerinti /I/ általános képletű vegyületek jó hatást mutatnak Bemisia tabaci ellen ennél a vizsgálatnál. Különösen az 1.01 és 4.01 számú vegyületek 80 % feletti hatás mutattak.

11. példa

Hatás Diabrotica balteata lárvák ellen

Kukoricapalántákat megpermetezzünk vízes permetlé-emulzióval, amely 400 ppm hatóanyagot tartalmaz. A permetlé rászáradása után a kukoricapalántákra a Diabrotica balteata második lárvaállapotú lárváiból 10 lárvát telepítünk és műanyagtartályba tesszük azokat. Az értékelést 6 nap elteltével végezzük. A kezelt és a kezeletlen

növényeken lévő elpusztult lárvák számának az összehasonlításából meghatározzuk a szaporodáscsökkenést százalékban /%-os hatás/.

A 2 - 5. példa szerinti /I/ általános képletű vegyületek jó hatást mutatnak *Diabrotica balteata* ellen ennél a vizsgálatnál. Az 1.01, 1.09 és a 4.01 számú vegyületek különösen jó, 80 % feletti hatást mutattak, míg a 2.01 vegyület hatása 100 %-os volt.

12. példa

Hatás *Tetranychus urticae* ellen

Fiatál babnővényeket betelepítünk *Tetranychus urticae* vegyes szaporulatával és 1 nappal ezután megpermetezzük ezeket vízes permetlé-emulzióval, amely 400 ppm hatóanyagot tartalmaz. A növényeket 6 napig inkubáljuk 25 °C-on és utána elvégezzük az értékelést. A kezelt és a kezeletlen növényeken lévő elpusztult peték, lárvák és a kifejlett egyedek számának az összehasonlításából meghatározzuk a szaporodáscsökkenést százalékban /%-os hatás/.

A 2 - 5. példa szerinti /I/ általános képletű vegyületek jó hatást mutatnak *Tetranychus urticae* ellen ennél a vizsgálatnál. Az 1.01, 1.14, 1.15, 1.18, 4.01 és 1.04 számú vegyületek különösen jó, 80 % feletti hatást mutattak.

13. példa

Hatás *Spodoptera littoralis* hernyók ellen

Fiatal szójanövényeket megpermetezzünk vízes permetlé-emulzióval, amely 400 ppm hatóanyagot tartalmaz. A permetlé rászáradása után a szójanövényekre telepítünk 10 darab *Spodoptera littoralis* harmadik állapotú hernyót és műanyagtartályba helyezzük el azokat. Az értékelést 3 nap elteltével végezzük. A kezelt és kezeletlen növényeken lévő elpusztult hernyók számának és a rágáskárosodásnak az összehasonlításából meghatározzuk a szaporodás százalékos csökkenését, valamint a rágáskárok csökkenésének a százalékát /%-os hatás/.

A 2 - 5. példa szerinti /I/ általános képletű vegyületek jó hatást mutatnak *Spodoptera littoralis* ellen ennél a vizsgálatnál. Az 1.16, 1.18, 1.19, 2.04, 2.14 és 4.11 számú vegyületek különösen jó, 80 % feletti hatást mutattak.

14. példa

Hatás *Aphis craccivora* ellen

Borsópalántákat megfertőzünk *Aphis craccivora*-val és ezt követően olyan permetével megpermetezzük azokat, amely 400 ppm hatóanyagot tartalmaz és utána 20 °C-on inkubáljuk. Az értékelést 3 és 6 nap elteltével végezzük. A kezelt és kezeletlen növényeken lévő ^{elpusztult} levéltetvek számának az összehasonlításából meghatározzuk a szaporodás százalékos csökkenését /%-os hatás/.

A 2 - 5. példa szerinti /I/ általános képletű vegyületek jó hatást mutatnak *Aphis craccivora* ellen ennél a vizsgálatnál. Az 1.01, 4.01, 4.11 és a 4.15 számú vegyületek jó, 80 % feletti hatást mutattak.

15. példaHatás Tetranychus cinnabarinus ellen /OP-rezisztens/

Phaseolus vulgaris növények első leveleit 24 órával az akaricid hatás vizsgálata előtt egy a Tetranychus cinnabarinus tömeg-
tenyészetből származó fertőzött levéllet megfertőzünk /a rezisz-
tencia diazinonnal szembeni elviselhetőségre vonatkozik/.

Az így kezelt, megfertőzött növényeket megpermetezzük 400
ppm mennyiséget tartalmazó mindenkori vizsgálandó vegyülettel
lecsepegésig. Az értékelést előbb 48 óra elteltével, majd 7 nap
mulva végezzük és megszámoljuk az imágókat és a lárvákat /min-
den mozgó állapotú egyedet/ binokulár alatt és megállapítjuk
az élő és elpusztult egyedeket. A vizsgálat idején a növényeket
hajtatőházban tartjuk 25 C° hőmérsékleten.

A 2 - 5. példa szerinti /I/ általános képletű vegyületek jó
hatást mutatnak Tetranychus cinnabarinus ellen ennél a vizsgálat-
nál. Az 1.14, 1.18 és a 4.01 vegyületekkel 80 - 100 %-os hatást
értünk el.

16. példaHatás Musca domestica ellen

50 - 50 g frissen készített CSMA-táptalajt viszünk be főző-
poharakba. A vizsgálandó hatóanyag 1 tömegszázalékos oldatából
meghatározott mennyiséget viszünk rá a poharakban lévő tápanyag-
ra pipetta segítségével úgy, hogy a hatóanyagkoncentráció 800 ppm

legyen. A táptalaj átkeverése után az acetont legalább 20 óra hosszat engedjük elpárologni.

Ezután hatóanyagoként 25 - 25 darab egynapos *Musca domestica* álcát adunk az ilyen módon kezelt táptalajt tartalmazó főzőpohár mindegyikébe. Miután az álcák bebábozódtak, a képződött bábokat vízzes való kimosással elkülönítjük a táptalajtól és utána ezeket szitafedővel lezárt edényekbe visszük.

Az egyes poharakból kimosott bábokat megszámláljuk / a hatóanyag toxikus befolyása az álcafejlődésre/, majd 10 nap múlva meghatározzuk a bábokból kikelt legyek számát.

A 2 - 5. példa szerinti /I/ általános képletű vegyületek jó hatást mutattak a fenti vizsgálatnál.

17. példa

Hatás *Dermanyssus gallinae* ellen

Valamely ~~felül~~ nyitott üvegtartóba 2 - 3 ml 10 ppm hatóanyagtartalmú oldatot és körülbelül 200 atkát helyezünk, amelyek különböző fejlődési állapotban vannak. Ezt követően a tartót egy vattacsomóval lezárjuk, 10 percig az atkák teljes benedvesedéséig rázzuk, utána megfordítjuk azzal a céllal, hogy a maradék vizsgálati oldatot a vatta felvegye, majd 3 nap elteltével megállapítjuk az elpusztult atkák számát.

A 2 - 5. példa szerinti /I/ általános képletű vegyületek jó hatást mutattak *Dermanyssus gallinae* ellen.

18. példa

Hatás *Blattella germanica* ellen

- 45 -

10 cm átmérőjű Petri-csészébe annyi 0,1 %-os acetonos hatóanyagoldatot adunk, hogy a felhasznált mennyiség 1 g/m^2 -nek feleljen meg. Abban az esetben, amikor az oldószer már elpárolgott, 10 darab *Blattella germanica* nimfát /utolsó nimfaállapot/ adunk az így előkészített csészébe és 2 óra hosszat a vizsgálandó anyag hatásának tesszük ki azokat. Ezután a nimfákat CO_2 -vel elkábítjuk, friss Petri-csészébe visszük és sötétben körülbelül 25°C -on tartjuk 70 %-os légnedvességben. Az inszekticid hatást 48 óra múlva a pusztulási arány megállapítása útján határozzuk meg.

A 2 - 5. példa szerinti /I/ általános képletű vegyületek jó hatást mutattak a fenti vizsgálatnál.

Szabadalmi igénypontok

1. Kártevőirtószer, a z z a l j e l l e m e z v e , hogy hatóanyagként legalább egy /I/ általános képletű tienil-tiokarbamidot, -izotiocarbamidot vagy -karbodiimidet, e képletben

R_1 jelentése 1 - 12 szénatomos alkilcsoport, 3 - 6 szénatomos cikloalkilcsoporttal helyettesített 1 - 4 szénatomos alkilcsoport, 3 - 8 szénatomos cikloalkilcsoport vagy 1 - 4 szénatomos alkilcsoporttal helyettesített 3 - 6 szénatomos cikloalkilcsoport;

R_2 , R_3 és R_4 egymástól függetlenül hidrogénatom, 1 - 6 szénatomos alkilcsoport, fenilcsoport vagy 1 - 3, a halogénatomok, 1 - 6 szénatomos alkilcsoportok, 1 - 4 szénatomos alkoxycsoportok és 1 - 9 halogénatomot tartalmazó 1 - 6 szénatomos halogén-alkil-csoportok közül kikerülő, csoporttal helyettesített fenilcsoport;

Z jelentése $-NH-CS-NH-$, $-N=C/SR_5/-NH-$ vagy $-N=C=N-$ csoport; és

R_5 jelentése 1 - 6 szénatomos alkilcsoport vagy 3 - 5 szénatomos alkenilcsoport,

azzal a megszorítással, hogy az R_2 , R_3 vagy R_4 csoportok legalább egyikének a jelentése eltér hidrogénatomtól; valamint olyan /I/ általános képletű vegyületek sóit, amelyekben Z jelentése $-N=C/SR_5/-NH-$ csoport,

valamint a kártevőirtószer előállításánál szokásosan alkalma-

zott szilárd vagy folyékony vivóanyagot vagy higítószer, adott esetben felületaktív és/vagy más segédanyagot és kívánt esetben más hatóanyagot tartalmaz.

2. Az 1. igénypont szerinti kártevőirtószer, azzal jellemezve, hogy hatóanyagként olyan /I/ általános képletnek megfelelő vegyületet tartalmaz, amelyben az R_2 , R_3 vagy R_4 csoportok közül legalább kettőnek a jelentése eltér hidrogénatomtól.

3. Az 1. vagy 2. igénypont szerinti kártevőirtószer, azzal jellemezve, hogy hatóanyagként olyan /I/ általános képletnek megfelelő vegyületet tartalmaz, amelyben R_4 hidrogénatom.

4. Az 1 - 3. igénypontok bármelyike szerinti kártevőirtószer, azzal jellemezve, hogy hatóanyagként olyan /I/ általános képletnek megfelelő vegyületet tartalmaz, amelyben R_1 jelentése 1 - 4 szénatomos alkilcsoport vagy 3 - 5 szénatomos cikloalkilcsoport.

5. A 4. igénypont szerinti kártevőirtószer, azzal jellemezve, hogy hatóanyagként olyan /I/ általános képletnek megfelelő vegyületet tartalmaz, amelyben R_1 jelentése $-t-C_4H_9$ vagy $-i-C_3H_7$ csoport.

6. Az 1 - 5 igénypontok bármelyike szerinti kártevőirtószer, azzal jellemezve, hogy hatóanyagként olyan /I/ általános

képletnek megfelelő vegyületet tartalmaz, amelyben R_2 és R_3 jelentése egymástól függetlenül 2 - 5 szénatomos alkilcsoport.

7. Az 1 - 6. igénypontok bármelyike szerinti kártevőirtószer, azzal jellemezve, hogy hatóanyagként olyan /I/ általános képletnek megfelelő vegyületet tartalmaz, amelyben R_2 és/vagy R_3 jelentése $-i-C_3H_7$ csoport.

8. Az 1 - 7. igénypontok bármelyike szerinti kártevőirtószer, azzal jellemezve, hogy hatóanyagként olyan /I/ általános képletnek megfelelő vegyületet tartalmaz, amelyben R_5 metil- vagy etilcsoport.

9. A 7. igénypont szerinti kártevőirtószer, azzal jellemezve, hogy hatóanyagként /2/ képletű vegyületet tartalmaz.

10. A 7. igénypont szerinti kártevőirtószer, azzal jellemezve, hogy hatóanyagként /3/ képletű vegyületet tartalmaz.

11. A 7. igénypont szerinti kártevőirtószer, azzal jellemezve, hogy hatóanyagként /4/ képletű vegyületet tartalmaz.

12. A 7. igénypont szerinti kártevőirtószer, azzal jellemezve, hogy hatóanyagként /5/ képletű vegyületet tartalmaz.

13. A 7. igénypont szerinti kártevőirtószer, azzal jellemezve, hogy hatóanyagként /6/ képletű vegyületet tartalmaz.

14. A 7. igénypont szerinti kártevőirtószer, azzal jellemezve, hogy hatóanyagként /7/ képletű vegyületet tartalmaz.

15. Eljárás /I/ általános képletű tienil-tiokarbamidok, -izotiókarbamidok vagy -karbodiimidok előállítására, a képletben

R_1 jelentése 1 - 12 szénatomos alkilcsoport, 3 - 6 szénatomos cikloalkilcsoporttal helyettesített 1 - 4 szénatomos alkilcsoport, 3 - 8 szénatomos cikloalkilcsoport vagy 1 - 4 szénatomos alkilcsoporttal helyettesített 3 - 6 szénatomos cikloalkilcsoport;

R_2 , R_3 és R_4 egymástól függetlenül hidrogénatom, 1 - 6 szénatomos alkilcsoport, fenilcsoport vagy 1 - 3, a halogénatomok, 1 - 6 szénatomos alkilcsoportok, 1 - 4 szénatomos alkoxilcsoportok és 1 - 9 halogénatomot tartalmazó 1 - 6 szénatomos halogén-alkil-csoportok közül kikerülő, csoporttal helyettesített fenilcsoport;

Z jelentése $-NH-CS-NH-$, $-N=C/SR_5/-NH-$ vagy $-N=C=N-$ csoport; és

R_5 jelentése 1 - 6 szénatomos alkilcsoport vagy 3 - 5 szénatomos alkenilcsoport,

azzal a megszorítással, hogy az R_2 , R_3 vagy R_4 csoportok legalább egyikének a jelentése eltér hidrogénatomtól; valamint olyan /I/ általános képletű vegyületek sóinak a képzésére, amelyekben Z jelentése $-N=C/SR_5/-NH-$ csoport,

a z z a l j e l l e m e z v e , hogy

a/ olyan /I/ általános képletű vegyületek előállítására,

amelyekben Z jelentése -NH-CS-NH- csoport, valamely /II/ általános képletű vegyületet egy /III/ általános képletű vegyülettel reagáltatunk; vagy

b/ adott esetben olyan /I/ általános képletű vegyületek előállítására, amelyekben Z jelentése $\text{-N=SR}_5\text{-NH-}$ csoport, azokat a kapott /I/ általános képletű vegyületeket, amelyekben Z jelentése -NH-CS-NH- csoport, valamely /IV/ általános képletű vegyülettel reagáltatjuk; és kívánt esetben olyan kapott /I/ általános képletű vegyületet, amelyben Z jelentése $\text{-N=C/SR}_5\text{-NH-}$ általános képletű csoport, sóvá alakítunk; vagy

c/ adott esetben olyan /I/ általános képletű vegyületek előállítására, amelyekben Z jelentése -N=C-N- csoport, olyan /I/ általános képletű vegyületekről, amelyekben Z jelentése egy -NH-CS-NH- csoport, a kénatomot lehasítjuk; mimellett a /II/ - /IV/ általános képletekben $R_1 - R_5$ szubsztituensek jelentése fent megadott és X valamely lehasítható csoport.

16. Eljárás /II/ általános képletű izotiocianátok előállítására, a z z a l j e l l e m e z v e, hogy valamely /V/ általános képletű enilint, amelyben R_2 , R_3 és R_4 jelentése az /I/ általános képletnél megadott, tiofoszfémmel reagáltatunk.

17. Az 1 - 14. igénypontok szerinti kártevőirtószerek, azzal jellemezve, hogy az állatokon és növényeken élősködő rovarok és az akarina rend képviselőinek az irtására alkalmazzuk azokat.

- 51 -

18. A 17. igénypont szerinti módszer, azzal jellemezve, hogy a kártevőirtószereket növénykárosító rovarok irtására használjuk.

19. Eljárás rovarok és az akarina rend képviselőinek irtására, azzal jellemezve, hogy a kártevőket, illetve ezek különböző fejlődési állapotban lévő egyedeit vagy tartózkodási helyüket az /I/ általános képletű vegyületeket hatóanyagként tartalmazó 1 - 14. igénypontok bármelyike szerinti kártevőirtószerek hatásos mennyiségével érintkeztetjük vagy kezeljük.

3 oldal rajzzal

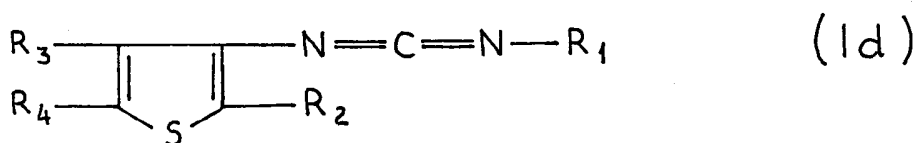
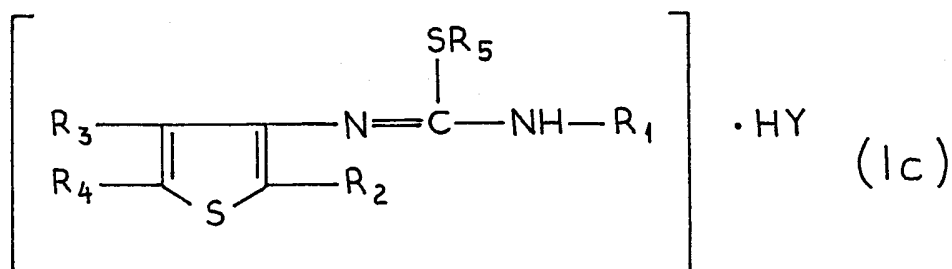
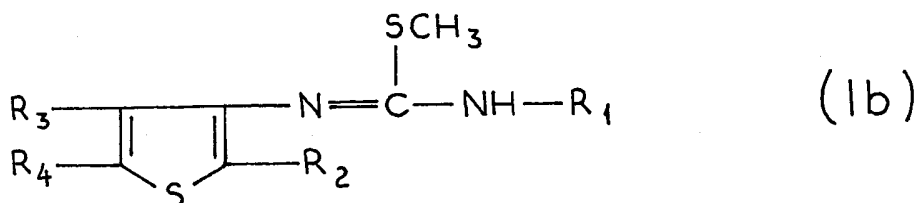
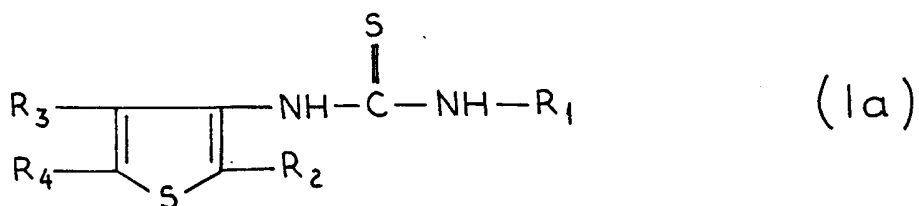
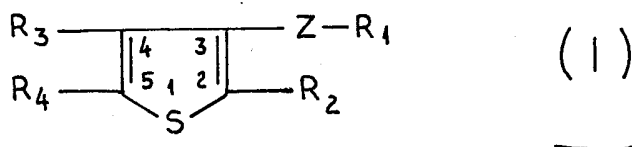
1991. 02. 08

P2.

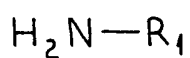
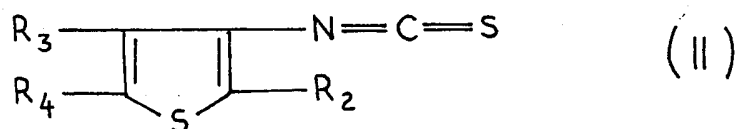
A meghatalmazott:

1991. 02. 08
BUDAPESTI NEMZETKÖSI SZ. TV. ...
BUDAPEST, BALASZUTZ U. 10.
TELEFON: 15-3738

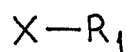
92740



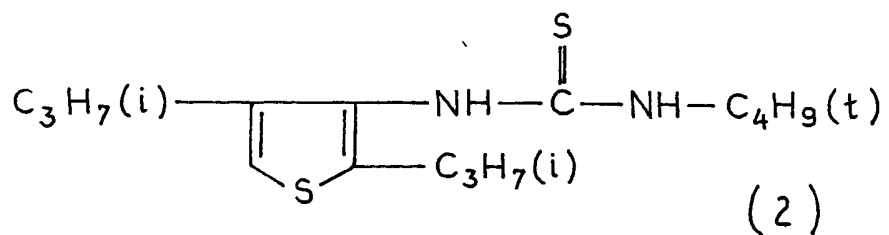
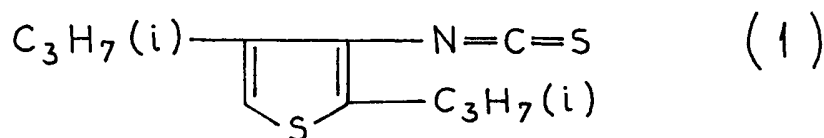
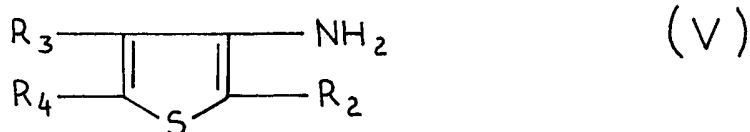
3/2



(III)



(IV)



3/3

