

P 9500781

ROVARÖLŐSZER KOMBINÁCIÓK

2

23702

A

Sankyo Company Limited, Tokió, Japán

A bejelentés napja: 1995. 03. 14.

70701

Elsőbbsége: 1994. 03. 16. (6-45405) Japán

**KÖZZÉTÉTELI
PÉLDÁNY**

K i v o n a t

A találmány tárgyát mezőgazdaságban és kertészetben alkalmazható rovarölőszerek kombináció, mely pyrimidifent, melynek képlete 5-klór-N-{2-[2,3-dimetil-4-(2-etoxi-etil)-fenoxi]-etil}-6-etil-4-pirimidin-amin és egy vagy több (I) általános képletű vegyületet tartalmaz, ahol a képletben

X jelentése oxigénatom vagy kénatom;

Y jelentése oxigénatom, kénatom vagy egyes kötés;

R¹ jelentése 1-6 szénatomszámú alkilcsoport;

R² jelentése 1-8 szénatomszámú alkoxics csoport,
1-8 szénatomszámú alkil-tio-csoport,
1-4 szénatomszámú alkil-karbonil-amino-csoport vagy
fenilcsoport; és

R³ jelentése 1-8 szénatomszámú alkilcsoport,
2-6 szénatomszámú alkenilcsoport, aminocsoport, fenil-
csoport vagy hetero-aril-csoport, és szubsztituálatlan
vagy egy, két vagy három szubsztituenst tartalmaz,
melyek lehetnek azonosak vagy különbözők,

vagy

R³ jelentése egy (a) általános képletű csoport,

R¹', R²' és X' jelentése ugyanaz, mint az R¹, R² és X-re
fentiekben ^{megadott} lefektetett jelentés.

R¹

7 95 00781

02702

A

Képviselő:

DANUBIA SZABADALMI ÉS VÉDJEGY IRODA Kft.

Budapest

**KÖZZÉTÉTEL
PÉLDÁNY**

ROVARÖLŐSZER KOMBINÁCIÓK

Sankyo Company Limited, Tokió, Japán

Feltalálók:

YOKOI Shinji, Yasu-gun, Shiga-ken,
NISHIDA Akira, Yasu-gun, Shiga-ken,
OBATA Tokio, Ube-shi, Yamaguchi-ken,
GOKA Kouichi, Ube-shi, Yamaguchi-ken,

Japán

A bejelentés napja: 1995. 03. 14.

Elsőbbsége: 1994. 03. 16. (6-45405) Japán

81231-TF/SM

A találmány tárgya az ismert rovarölőszerekből, pyrimidifenből és egyéb foszfor tartalmú rovarölőszer(ek) kombinációjából álló készítmények.

Az A-196 524 sz. európai szabadalmi leírás rovarölőszerként és atkaölőszerként nagyszámú fenoxi-alkil-amino-pirimidin származékot ismertet. Ezek közül egyik vegyület, az 5-klór-N-{2-[2,3-dimetil-4-(2-etoxi-etil)-fenoxi]-etil}-6-etil-4-pirimidin-amin, pyrimidifen néven ismert (az A-196 524 sz. európai szabadalmi leírás 1. táblázatának 75. sz. vegyülete) és jó rovarölő valamint atkaölő aktivitást fejt ki (lásd (1) képletű vegyület).

A foszfor tartalmú rovarölőszerek jól ismertek a szakmában és jól ismertek a módszerek is további hasonló vegyületek előállítására, amennyiben még nem írták volna le őket. Az A-196 524 sz. európai szabadalmi leírás hosszú jegyzéket közöl azokról a rovarölőszerekről és gombaölőszerekről, melyek fenoxi-alkil-amino-pirimidinekkel kombinálva alkalmazhatók, és amelyektől "egyes esetekben szinergista hatás várható", bár nem szolgáltat bizonyítékot ezen állítás alátámasztására.

A pókatkák világszerte jelentős terméskártevők. Így eddig több csoport is megkísérelt megfelelő rovarölőszert találni ellenük. Fel is fedeztek számos hatóanyagot, ezek azonban rövid életűek voltak az új szerekkel szemben kifejlődő rezisztencia miatt. Az intenzív termeléssel művelt területeken gyakran előfordul, hogy az atkapopuláció rezisztens számos vegyszerrel szemben. Egyes atkafélékben még a legújabb atkaölő szerrel, a pyrimidifennel szemben is rezisztencia fejlődik ki.

Meglepő módon felfedeztük, hogy a pyrimidifen és egy vagy több foszfor tartalmú rovarölőszerek kombinációja jelentős szinergista hatást fejt ki, különösen pókatkával szemben, még azoknál is, melyek rezisztensnek bizonyultak magával a pyrimidifennel szemben.

Tehát a találmány tárgya az 5-klór-N-{2-[2,3-dimetil-4-(2-etoxi-etil)-fenoxi]-etil}-6-etil-4-pirimidin-amin (a továbbiakban pyrimidifen) és egy vagy több (I) általános képletű vegyület kombinációjából álló, mezőgazdaságban és kertészetben alkalmazható rovarölő készítmény, ahol a képletben

X jelentése oxigénatom vagy kénatom;

Y jelentése oxigénatom, kénatom vagy egyes kötés;

R¹ jelentése 1-6 szénatomszámú alkilcsoport;

R² jelentése 1-8 szénatomszámú alkoxicssoport,
1-8 szénatomszámú alkil-tio-csoport,
1-4 szénatomszámú alkil-karbonil-amino-csoport vagy
fenilcsoport; és

R³ jelentése 1-8 szénatomszámú alkilcsoport,
2-6 szénatomszámú alkenilcsoport, aminocsoport, fenil-
csoport vagy hetero-aril-csoport, és szubsztituátlan
vagy egy, két vagy három szubsztituenst tartalmaz,
melyek lehetnek azonosak vagy különbözők és a következő
(A) csoportból választhatók ki:

halogénatomok, fenilcsoportok, nitrocsoportok,
cianocsoportok, oxocsoportok, 1-8 szénatomszámú
alkilcsoportok, 1-8 szénatomszámú alkoxicssoportok,
1-6 szénatomszámú alifás acilcsoportok, 1-6
szénatomszámú alkoxi-karbonil-csoportok, 1-6

szénatomszámú alkil-tio-csoportok, 1-6 szénatomszámú alkil-amino-csoportok, dialkil-amino-csoportok, melyekben az alkilcsoportok egymástól függetlenül 1-6 szénatomosak, hetero-aril-csoportok, karbamoilcsoportok, alkil-karbamoil-csoportok, melyekben az alkilrész 1-6 szénatomos és heterociklil-csoportok, melyek lehetnek szubsztituálatlanok vagy amelyek egy, két, vagy három (A) csoportba tartozó, de nem heterociklusos szubsztituenst tartalmaznak

vagy

R^3 jelentése egy (a) általános képletű csoport, R^1 , R^2 és X jelentése megegyezik az R^1 , R^2 és X jelentésénél fentiekben megadottakkal.

A találmány szerinti készítményekben előnyösen alkalmazható (I) általános képletű vegyületek az isoxathion, diazinon, prothiofos, methidathion, thiometon, malathion, quinalphos, dimethoate, chlorpyrifos, profenofos, monocrotophos és ethion, melyek szisztematikus nevét az alábbiakban megadjuk. A fenti vegyületek közül különösen alkalmas a dimethoate, chlorpyrifos, profenofos, monocrotophos és ethion.

A találmány szerinti egyik rovarirtó készítmény pyrimidifent és a profenofost, monocrotophost és ethiont tartalmazó csoportból legalább egy vegyületet tartalmaz. A találmány tárgya továbbá vegetatív szaporító anyag, különösen a találmány szerinti készítménnyel kezelt vetőmag, és módszer az ilyen anyag találmány szerinti készítménnyel történő kezelésére.

A találmány tárgya továbbá eljárás mezőgazdasági és

-metil-pentil-, 2-metil-pentil-, 1-metil-pentil-, 3,3-dimetil-butyl-, 2,2-dimetil-butyl-, 1,1-dimetil-butyl-, 1,2-dimetil-butyl-, 1,3-dimetil-butyl-, 2,3-dimetil-butyl- és 2-etil-butyl-csoport, különösen a metil-és etilcsoport.

Ahol az (I) általános képletben az R^2 és $R^{2'}$, valamint az A szubsztituens-csoport jelentése 1-8 szénatomszámú alkoxics csoport, az előnyösen a következő egyenes vagy elágazó láncú alkoxics csoportok közül választható ki: metoxi-, etoxi-, n-propoxi-, izopropoxi-, n-butoxi-, izobutoxi-, szek-butoxi-, terc-butoxi-, n-pentiloxi-, izopentiloxi-, 2-metil-butiloxi-, neopentiloxi-, n-hexiloxi-, 4-metil-pentiloxi-, 3-metil-pentiloxi-, 2-metil-pentiloxi-, 3,3-dimetil-butiloxi-, 2,2-dimetil-butiloxi-, 1,1-dimetil-butiloxi-, 1,2-dimetil-butiloxi-, 1,3-dimetil-butiloxi-, 2,3-dimetil-butiloxi-, n-heptiloxi- és n-oktiloxics csoport, különösen a metoxi- és etoxics csoport.

Ahol az (I) általános képletben az R^3 és az A szubsztituenscsoport jelentése 1-8 szénatomszámú alkilcsoport, a csoport lehet egyenes vagy elágazó láncú alkilcsoport, mint az R^1 -nél fentiekben felsorolt csoportok, valamint az n-heptil- és n-oktilcsoport közül választható ki.

Ahol az (I) általános képletben az R^2 és $R^{2'}$ 1-8 szénatomszámú alkil-tio-csoport, ott az alkilcsoport lehet egyenes vagy elágazó láncú, és az R^1 , R^3 és A alatt felsorolt alkilcsoportok közül választható ki.

Ahol az (I) általános képletben R^2 és $R^{2'}$ 1-4 szénatomszámú alkil-karbonil-amino csoport, melyben a karbonil-amino-csoporthoz 1-4 szénatomszámú, egyenes, vagy elágazó láncú

kertészeti területek kezelésére nem-emplős-, nem-madár- és nem-hüllő-kártevőkkel szemben, azzal jellemezve, hogy a pyridimifenből és az (I) általános képletű vegyület(ek)ből álló készítmény hatásos mennyiségét a területre juttatjuk.

Külön értékelendő, hogy a találmány szerinti készítményt nem szükséges keverék formájában kijuttatni, hanem egyedi hatóanyagként is kiszállítható, sőt adagolható, feltéve, hogy magán a területen a hatóanyagok együttesen vannak jelen.

Lehetséges ugyan, hogy a találmány szerinti készítményben két vagy több (I) általános képletű vegyületet alkalmazunk, azonban általában mind az egyszerűség, mind a költségek szempontjából előnyösebb, ha csak egy (I) általános képletű vegyületet használunk.

A "rovarírtó" kifejezést olyan értelemben alkalmazzuk, hogy az nem-emplős-, nem-hüllő- és nem-madár-kártevőkre vonatkozik. A találmány szerinti készítmények különösen atkák, leginkább pókatkák ellen hatásosak, de a szakemberek számára az is kézenfekvő, hogy a találmány szerinti készítmények rákok és hasonlóak ellen is használhatók. A találmány szerinti készítmények különös előnye, hogy olyan pókatka populációk ellen is bevethetők, melyek rezisztensek pyrimidifennel szemben.

Ahol (I) általános képletben az R^1 és $R^{1'}$ jelentése 1-6 szénatomszámú alkilcsoport, az előnyösen a következő egyenes vagy elágazó láncú alkilcsoportok közül választható ki: metil-, etil-, n-propil-, izopropil-, n-butil-, izobutil-, szek-butil-, terc-butil-, n-pentil-, izopentil-, 2-metil-butil-, neopentil-, 1-etil-propil-, n-hexil-, 4-metil-pentil-, 3-

alkilcsoport kapcsolódik, a szubsztituens előnyösen lehet metil-karbonil-amid-, etil-karbonil-amid-, n-propil-karbonil-amid-, izopropil-karbonil-amid-, n-butil-karbonil-amid-, izobutil-karbonil-amid-, szek-butil-karbonil-amid- és terc-butil-karbonil-amid-csoport.

Ahol az (I) általános képletben R^3 jelentése 2-6 szénatomszámú alkenilcsoport, az előnyösen a következő egyenes, vagy elágazó láncú alkenilcsoportok közül választható ki: vinil-, allil-, 1-propenil-, 1-metil-2-propenil-, 2-metil-1-propenil-, 2-metil-2-propenil-, 2-etil-2-propenil-, 1-butenil-, 2-butenil-, 1-metil-2-butenil-, 2-metil-2-butenil-, 3-metil-2-butenil-, 1-etil-2-butenil-, 3-butenil-, 1-metil-3-butenil-, 2-metil-3-butenil-, 1-etil-3-butenil-, 1-pentenil-, 2-pentenil-, 1-metil-2-pentenil-, 2-metil-2-pentenil-, 3-pentenil-, 1-metil-3-pentenil-, 2-metil-3-pentenil-, 4-pentenil-, 1-metil-4-pentenil-, 2-metil-4-pentenil-, 1-hexenil-, 2-hexenil-, 3-hexenil-, 4-hexenil- és 5-hexenilcsoport, különösen a vinil- és az allilcsoport.

Ahol az (I) általános képletben R^3 és az A szubsztituens csoport jelentése hetero-aril-csoport, az lehet előnyösen 1-5 heteroatomot tartalmazó, 5-8-tagú, mono-, bi- vagy triciklusos heterociklusos gyűrű, melyben a heteroatom - mely lehet azonos, vagy különböző, és oxigén, kén és nitrogén lehet, - mely előnyös példái a következő csoportból választhatók ki: furanil-, tienil-, pirrolil-, oxazolil-, izoxazolil-, tiazolil-, tianil-, piridil-, piridazinil-, pirimidinil-, pirazolil-, imidazolil-, triazinil-, tiadiazolil-, imidazotiazolil-, benzizoxazolil-, kromenil-, kinolinil-, benzotianil-,

kinoxalinil és benzotriazinil-csoport.

Ahol az (I) általános képletben az A szubsztituens csoport jelentése alifás acilcsoport, az előnyösen a következő egyenes, vagy elágazó láncú alifás acilcsoportok közül választható ki: formil-, acetil-, propionil-, butiril- és valerilcsoport.

Ahol az (I) általános képletben az A szubsztituens csoport jelentése 1-6 szénatomszámú alkoxi-karbonil-csoport, az előnyösen a következő egyenes vagy elágazó láncú alkoxi-karbonil-csoportok közül választható ki: metoxi-karbonil-, etoxi-karbonil-, propoxi-karbonoil-, butoxi-karbonil-, izobutoxi-karbonil- és terc-butoxi-karbonil-csoport.

Ahol az (I) általános képletben az A szubsztituens csoport jelentése 1-6 szénatomszámú alkil-tio-csoport, az előnyösen a következő egyenes vagy elágazó láncú alkil-tio-csoportok közül választható ki: metil-tio-, etil-tio-, propil-tio- és butil-tio-csoport.

Ahol az (I) általános képletben az A szubsztituens csoport jelentése 1-6 szénatomszámú alkil-amino-csoport, az előnyösen az aminocsoporthoz kapcsolódó 1-6 szénatomszámú, egyenes vagy elágazó láncú alkilcsoportot tartalmaz. Az előnyös alkilcsoportok ugyanazok, mint az R^1 szubsztituensnél felsoroltak. Ilyen alkalmas alkil-amino-csoport a metil-amino-, etil-amino-, propil-amino-, -butil-amino-, pentil-amino- és hexil-amino-csoport.

Ahol az (I) általános képletben az A szubsztituens csoport jelentése dialkil-amino-csoport, az előnyösen az aminocsoporthoz kapcsolódó két azonos vagy különböző, 1-6 szénatomszámú, egyenes vagy elágazó láncú alkilcsoportot

tartalmaz. Ilyen alkalmas dialkil-amino-csoport a dimetil-amino-, dietil-amino-, metil-etil-amino-, dipropil-amino- és dibutil-amino-csoport.

Ahol az (I) általános képletben az A szubsztituens csoport jelentése halogénatom, előnyös halogénatom a fluor-, klór-, bróm- és jódatom, különösen a klór- és fluoratom, legelőnyösebb a klóratom.

Ahol az (I) általános képletben az A szubsztituens csoport jelentése heterociklusos csoport, a heterociklusos csoport lehet előnyösen telített, telítetlen vagy részlegesen telített, 5 vagy 6 tagú, 1-5 heteroatomot tartalmazó gyűrű, melyben a heteroatom lehet oxigén, kén és nitrogén, és ezek lehetnek azonosak vagy különbözőek. Előnyös heterociklusos csoportok a következők: szubsztituált vagy szubsztituálatlan tetrahidropiranil-csoport, mint a tetrahidropiran-2-il-, 3-bróm-tetrahidropiran-2-il- és 4-metoxi-tetrahidropiran-4-il-csoport; szubsztituált vagy szubsztituálatlan tetrahidrotiopiranil-csoport, mint a tetrahidro(tio-piran)-2-il- és 4-metoxi-tetrahidro(tio-piran)-4-il-csoport; szubsztituált vagy szubsztituálatlan tetrahidrofuranil-csoport, mint a tetrahidrofuran-2-il-csoport; szubsztituált vagy szubsztituálatlan tetrahidrotienil-csoport, mint a tetrahidrotien-2-il-csoport; tiadiazolil-csoport, mint az 5-metoxi-2-oxo-2,3-dihidro-1,3,4-tiadiazol-3-il-csoport; furanil-, tienil-, pirrolil-, oxazolil-, izoxazolil-, tiazolil-, tianil-, piri-dil-, piridazinil-, pirimidinil-, pirazolil-, imidazolil-, triazinil-, tiadiazolil-, imidazo-tiazolil-, benzizoxazolil-, kromenil-, kinolinil-, benztianil-, kinoxalinil- és

benzotriazinil-csoport.

Ahol az (I) általános képletben az A szubsztituens csoport jelentése alkil-karbamoil-csoport, az előnyös alkil csoportok azonosak a fentiekben R^1 szubsztituensnél felsoroltakkal.

Az (I) általános képlet számos jól ismert rovarölőszert is felölel, ilyenek a következők: 2,2-diklór-vinil-foszfát (dichlorvos), dimetil-2,2,2-triklór-1-hidroxi-etil-foszfónát (trichlorfon), O,O-dimetil-S-(2,3-dihidro-5-metoxi-2-oxo-1,3,4-tiadiazol-3-il-metil)-foszfor-ditioát (methidathion), O,O-dimetil-O-(3-metil-4-nitro-fenil)-tiofoszfát (fenitrothion), O,2,4-diklór-fenil-O-etil-S-propil-foszfor-ditioát (prothiofos), O,O-dipropil-O-4-metil-tio-fenil-foszfát (propaphos), O-4-bróm-2-klór-fenil-O-etil-S-propil-foszfor-tioát (profenofos), 3-(O,O-dietoxi-tio-foszforil-tio-metil)-6-klór-benzoxazonon (phosalone), O,O--dimetil-S-(N-formil-N-metil-karbamoil-metil)-foszfor-ditioát (formothion), S-1,2-bisz(etoxi-karbonil)-etil-O,O-dimetil--foszfor-ditioát (malathion), 2-klór-1-(2,4,5-tri-klór-fenil)-vinil-dimetil-foszfát (tetrachlorvinphos), 2-klór-1-(2,4-diklór-fenil)-vinil-dietil-foszfát (chlor-fenvinphos), O,O-dimetil-O-p-cián-fenil-foszfor-tioát (cyanophos), O,S-dimetil-N-acetil-foszforamid-tioát (acephate), O,O-dietil-O-(5-fenil-3-izoxazolil)-foszfor-tioát (isoxathion), O-etil-O-2-izopropoxi-karbonil-fenil-N-izopropil-foszfor-amid-tioát (isofenphos), O,O,O',O'-tetra-etil-S,S'-metilén-difoszfor-ditioát (ethion), O,O--dietil-S-2-etil-tio-etil-foszfor-ditioát (ethilthiometon), O-6-etoxi-2-etil-pirimidin-4-il-O,O-dimetil-foszfor-tioát

(etrimfos), O,O-dietil-O-kinoxalin-2-il-foszfor-tioát
 (quinalphos), O,O-dietil-O-3,5,6-triklór-2-piridil-foszfor-
 -tioát (chlor-pyrifos), O,O-dimetil-O-3,5,6-triklór-2-piridil-
 -foszfor-tioát (chlorpyrifosmetil), 2-klór-1-(2,4-diklór-
 -fenil)-vinil-dimetil-foszfát (demethylvinphos), O,O-dimetil-S-
 -(N-metil-karbamoil-metil)-foszfor-ditioát (dimethoate), O-
 -etil-O-4-metil-tio-fenil-S-propil-foszfor-ditioát (sulprofos),
 O,O-dietil-O-2-izopropil-6-metil-pirimidin-4-il-foszfor-tioát
 (diazinon), O,O-dimetil-S-etil-tio-etil-foszfor-ditioát
 (thiometon), O,O-dimetil-S-2-(1-metil-karbamoil-etil-tio)-
 -etil-foszfor-ditioát (vamidothion), (RS)-O-1-(4-klór-fenil)-
 -pirazol-4-il-O-etil-S-n-propil-foszfor-tioát (pyraclofos),
 O,O-dietil-O-(3-oxo-2-fenil-2H-piridazin-6-il-foszfor-tioát
 (pyridaphention), O-2-dietil-amino-6-metil-pirimidin-4-il-O,O-
 -dimetil-foszfor-tioát (pirimiphos-methyl), 2-metoxi-4H-1,3,2-
 -benzodioxafoszforin-2-szulfid (salithion), dimetil-etil-
 szulfinil-izopropil-tiofoszfát (ESP), O,O-dimetil-O-{3-metil-
 -4-(metil-tio)-fenil}-tiofoszfát (fenthion), etil-dimetil-
 -ditio-foszforil-fenil-acetát (phenthoate), 3-(dimetoxi-
 -foszfinil-oxi)-N-metil-cisz-kroton-amid (monocrotophos), O,S-
 -dimetil-foszfor-amid-tioát (methamidophos), O-1-fenil-1H-
 -1,2,4, triazol-3-il-foszfor-tioát (triazophos) és hasonló;
 előnyösen isoxathion, diazinon, prothiofos, methidathion,
 thiometon, malathion, quinalphos és dimethoate.

A találmány szerinti készítményben a hatóanyagok tömeg
 szerinti aránya 1-50 rész (I) általános képlet szerint
 hatóanyag(ok) és 1 rész pyrimidifen, előnyösen 5-35 tömegrész
 (I) általános képletű vegyület(ek) és 1 tömegrész pyrimidifen.

Általában a készítmény teljes hatóanyagtartalma folyadék kiszerezési formában 1-50 t%, por formájában 0,1-25 t%, nedvesíthető por formájában 1-90 t% és granulátum formájában 0,1-25 t%. Azonban más összetétel is kézenfekvő lehet a szakember számára, attól függően, hogy milyenek a felhasználás körülményei és az egyéb meghatározó tényezők.

A találmány szerinti hatóanyagokat célszerűen elkeverjük valamely mezőgazdasági vagy kertészeti készítményekben használatos vivőanyaggal. A pyrimidifen és az (I) általános képletű szerves foszfát hatóanyagokat ismert módon előállíthatjuk hígítatlan emulgeálható sűrítmény, permetezésre alkalmas paszta, permetezésre vagy hígításra alkalmas oldat, hígított, emulgeálható sűrítmény, vízoldékony por, por, granulátum, áramló formuláció, száraz áramló formuláció, füstölésre alkalmas formuláció vagy kapszula formájában, melyhez polimer kapszulát használunk.

A szilárd formuláció készítésénél adalékanyagot és/vagy vivőanyagot használhatunk, például növényi porokat, mint a szójaliszt vagy gabonaliszt, ásványi mikrokristályos porokat, mint a diatomaföld, apatitot, gipszet, talkumot, bentonitot vagy agyagot, valamint szerves és szervetlen vegyületeket, mint a nátrium-benzoát, karbamid, nátrium-szulfát és hasonlóak.

A találmány szerinti folyékony formulációk készítéséhez alkalmas oldószerek lehetnek növényi olajok, ásványi olajok; kőolaj termékek, mint a kerozin, xilol és könnyűbenzin; ciklohexán, ciklohexanon, dimetil-formamid, dimetil-szulfoxid, triklór-etilén, metil-izobutil-keton, víz és hasonlóak. Ezenkívül, amennyiben szükséges, a formuláció homogenitásának

és stabilitásának fokozására felületaktív anyagot is adhatunk a formulációhoz.

A fentiek szerint elkészített nedvesíthető porokat, emulgeálható sűrítményeket, vizes oldatokat, áramlásra alkalmas és száraz, áramlásra alkalmas formulációkat vízzel az előírt koncentrációra hígítva, vizes szuszpenzió vagy emulzió formájában visszük fel a növényre. A porokat és granulátumokat általában hígítás nélkül alkalmazzuk.

A találmány szerinti készítmények kitűnő szinergikus atkaölő aktivitást fejtenek ki, mely messze meghaladja az additív hatást vagy akármelyik komponens egyedi hatását, így lehetővé válik az alkalmazott hatóanyag mennyiségének csökkentése.

A találmány szerinti rovarölő ill. általánosságban rovarölő és atkaölő készítmények hatásosak kártékony rovarokkal szemben, mint a piros citrus atka (*Panonychus citri*), rózsaszínű citrus rozsdá atka (*Aculops pelekassi* európai piros atka (*Panonychus ulmi*), galagonya pókatka (*Tetranychus vinnensis*) és a kétfoltos pókatka (*Tetranychus urticae*), melyek károsítják a gyümölcsfákat, így a mandarin-, narancs-, alma- és őszibarackfákat, valamint a szőlőtöveket. Ezenkívül a találmány szerinti készítmények jól használhatók a kanzawa pókatkával (*Tetranychus kanzawai*) szemben, mely károsítja a teacserjét, és a kármin pókatkával (*Tetranychus cinnabarius*) szemben, mely zöldségfélét, padlizsánt, görögdinnyét és dinnyét támad meg.

A találmány szerinti készítmények nemcsak a fent említett kártevőkkel szemben hatásosak, de jól alkalmazhatók más

rovarkártevőkkel szemben is, mint a tortricidek; levéltetvek, mint a trópusi citrus levéltetű, alma levéltetű és almafalevelek fodrosodását okozó levéltetű; pajzstetvek, mint a nyílfű pajzstetű és az indián pajzstetvek, melyek károsítják a gyümölcsfákat, így a mandarin-, narancs- és almafákat. A tortricidek, pajzstetvek, mint a fehér őszibarack pajzstetű, és a fekete üröm araszoló lepkehernyók, károsítják a teacserjét és kezelhetők a találmány szerinti készítményekkel.

Bár a találmány szerinti készítmények szinergizmusának hatásmechanizmusa még nem tisztázott, lehetséges, hogy a szerves foszfátok gátolni tudják a megfelelő kártevőben - különösen az atkáknál, melyek kevésbé érzékenyek a pyrimidifennel szemben - a pyrimidifen enzimátikus detoxifikációját és katabolizmusát.

A találmányt nem korlátozó jelleggel a következő példák segítségével mutatjuk be. Egyéb megjelölés hiányában a példákban szereplő százalékok és arányok tömeg szerintiek. Ahol a következő példákban pyrimidifent használunk, azt az A-196 524 sz. európai szabadalmi leírásban lefektetett eljárással állítottuk elő.

1. formulációs példa

4 rész pyrimidifen, 50 rész isoxathion, 20 rész Paracol KPS (Nippon Nyukazai Co., Ltd., kombinált emulgeálószer) és 26 rész xilol elkeverésével emulgeálható sűrítményt állítottunk elő.

2. formulációs példa

4 rész pyrimidifen, 43 rész thiometon sűrítmény (hatóanyagtartalom 60 %), 8 rész Emulsifier AC 260 (Sandoz Co., Ltd., kombinált emulgeálószer) és 45 rész xilol elkeverésével emulgeálható sűrítményt állítottunk elő.

3. formulációs példa

4 rész pyrimidifen, 34 rész diazinon,, 2 rész Neogen Powder (Dai-ichi Kogyo Seiyaku Co., Ltd., nátrium-dodecil-benzol-szulfonát), 10 rész magnézium-karbonát-T (Tokuyama Soda Co., Ltd.), 12 rész Carplex #80 (Shionogi Seiyaku Co., Ltd., amorf szilícium-dioxid), 12 rész Carplex #1120 (Shionogi Seiyaku Co., Ltd., amorf szilícium-dioxid) és 23 rész kalcium-karbonát por összekeverésével, majd a kapott keverék Jet-0-Mizer-ben (Seichin Enterprise Co., Ltd., Japan) történő elporításával nedvesíthető por-formulációhoz jutottunk.

4. formulációs példa

Az áramlásra képes formuláció összetétele a következő:

- 1) 4 rész pyrimidifen;
- 2) 40 rész dimethoate;
- 3) 1 rész Newcol 291 PG (Nippon Nyukazai Co., Ltd., Japan, nátrium-dietil-hexil-szulfo-szukcinát);
- 4) 47,7 rész víz;
- 5) 3 rész Sunex P 201;
- 6) 1 rész Veegum R (Sanyo Chemical Industries);
- 7) 0,3 rész Rhodopol 23 (Rhone-Poulenc); és
- 8) 10 rész etilén-glikol.

A 3)-as és 5)-ös komponenst feloldtuk 40 rész vízben. Az oldathoz hozzáadtuk az 1)-es és 2)-es komponenst, majd Attritor készülékben (Mitsui Miike Engineering Co., Japan) porítottuk a keveréket. A 8)-as komponenst külön összekeverjük 7,7 rész vízzel, majd a kapott oldathoz hozzáadjuk a 6)-os és 7)-es komponenst. A két preparátum kombinálásával áramlásra képes formulációt nyertünk.

5. formulációs példa

4 rész pyrimidifen, 50 rész ethion (Tomono Agrica Co., Ltd., Japán), 20 rész Paracol KPS (Nippon Nyukazai Co., Ltd., Japán, kombinált emulgeálószer) és 26 rész xilol elkeverésével emulgeálható sűrítményt nyertünk.

6. formulációs példa

4 rész pyrimidifen, 40 rész profenofos (Nihon Nohyaku Co., Ltd., Japán), 20 rész Paracol KPS (Nippon Nyukazai Co., Ltd., Japán, kombinált emulgeálószer) és 36 rész xilol elkeverésével emulgeálható sűrítményhez jutottunk.

7. formulációs példa

4 rész pyrimidifen, 40 rész chlorpyrifos (Nissan Chemical Industries Ltd., Japán), 5 rész Neogen Powder (Dai-ichi Kogyo Seiyaku Co., Ltd., Japán., nátrium-dodecil-benzol-szulfonát) és 51 rész Kaolinite Clay (Georgia Kaolin Co., Inc.) elkeverésével és a kapott keverék Jet-O-Mizerben történő elporításával nedvesíthető por-formulációhoz jutottunk.

8. formulációs példa

4 rész pyrimidifen, 40 rész monocrotophos (Nihon Nohyaku Co., Ltd., Japán), 5 rész Neogen Powder (Dai-ichi Kogyo Seiyaku Co., Ltd., Japán, nátrium-dodecil-benzol-szulfonát) és 51 rész Kaolinite Clay (Georgia Kaolin Co., Inc.) összekeverésével, majd a keverék Jet-O-Mizer-ben végzett elporításával nedvesíthető por-formulációt nyertünk.

Formulációs referencia példa

4 rész pyrimidifen, 84 rész agyag, 1 rész Newcol 291 PG, 1 rész Carplex #80 és 10 rész Lavelin FAN (Dai-ichi Kogyo Co., Ltd., Japán, naftalin-szulfonsav kondenzátum nátrium sója) összekeverésével, majd a kapott keverék Jet-O-Mizerben történő porításával 4 % pyrimidifen tartalmú nedvesíthető port nyertünk.

A találmány szerinti készítmények rovarölő hatását a következő teszt példák mutatják be.

1. teszt példa

Atkaölő hatás Shizuoka Prefektúrából származó piros citrus-atkával szemben

1 cm vastag, vízzel telített szivacs lapot 9 cm átmérőjű petricsészébe helyeztünk és a petricsészét szűrőpapírral fedtük le. A szűrőpapírra 13 cm² nagyságú eperlevelet tettünk, majd kis író toll segítségével ráoltottunk a levélre 25-35 db felnőtt, nőstény piros citrus atkát. Mikor az atkák mozgása megszűnt, vízzel megadott koncentrációra hígított rovarölő

tesztoldatot permetezettünk az atkákra.

A tesztkészítmények a következők voltak:

Pyrimidifen 1. formulációs referencia példában leírt nedvesíthető por formulációja;

Karphos emulgeálható sűrítmény (isoxathion tartalom 50 %, Sankyo Co., Ltd., Japán);

Diazinon emulgeálható sűrítmény (diazinon tartalom 40 %, Sankyo Co., Ltd., Japán);

Tokuthion emulgeálható sűrítmény (prothiofos tartalom 45%, Japán Bayer Agrochem. Co., Ltf., Japán);

Supracide emulgeálható sűrítmény (methidathion tartalom 40 %, Nihon Nohyaku Co., Ltd., Japán);

Ekatin emulgeálható sűrítmény (thiometon tartalom 25 %, Sankyo Co., Ltd., Japán);

Malathon emulgeálható sűrítmény (malathion tartalom 50 %, Sankyo Co., Ltd., Japán);

Ekalux emulgeálható sűrítmény (quinalphos tartalom 40 %, Sankyo Co., Ltd., Japán);

Dimethoate emulgeálható sűrítmény (dimethoát tartalom 43 %, Kyushu Sankyo Co., Ltd., Japán).

Az oldatmintákat 7 ml-es dózisban, Mizuho típusú forgó permetezőtorony segítségével permeteztük a levélmetszetekre. Az oldatminták felvitele után a levélmintákat állandó hőmérsékleten, 25 C°-on, 60 % nedvességtartalmú szobában tároltuk 3 napig, majd meghatároztuk az elhullást. Az

eredményeket az 1. táblázatban foglaltuk össze. Az elhullást az elpusztult, valamint agonizáló atkák megszámlálásával határoztuk meg.

1. táblázat

Rovarölőszér kombináció	Koncentráció			Elhullás
	(ppm)		%	
Pyrimidifen + isoxathion	13	+	330	100
Pyrimidifen + isoxathion	6,5	+	165	100
Pyrimidifen + isoxathion	3,3	+	83	90
Pyrimidifen + diazinon	13	+	200	100
Pyrimidifen + diazinon	6,5	+	100	85
Pyrimidifen + prothiofos	13	+	450	100
Pyrimidifen + prothiofos	6,5	+	225	91
Pyrimidifen + methidathion	13	+	200	100
Pyrimidifen + methidathion	6,5	+	100	80
Pyrimidifen + thiometon	13	+	125	100
Pyrimidifen + thiometon	6,5	+	63	85
Pyrimidifen + malathion	13	+	250	100
Pyrimidifen + malathion	6,5	+	125	80
Pyrimidifen + quinalphos	13	+	400	100
Pyrimidifen + quinalphos	6,5	+	200	100
Pyrimidifen + dimethoate	13	+	430	100
Pyrimidifen + dimethoate	6,5	+	215	80
Pyrimidifen	13			60
Pyrimidifen	6,5			24
Pyrimidifen	3,3			15

1. táblázat (folytatás)

Rovarölőszér kombináció	Koncentráció (ppm)	Elhullás %
Isoxathion	330	80
Isoxathion	165	60
Isoxathion	83	30
Diazinon	200	50
Diazinon	100	40
Prothiofos	450	60
Prothiofos	225	7
Methidathion	200	30
Methidathion	100	14
Thiometon	125	26
Thiometon	63	23
Malathion	250	30
Malathion	125	26
Quinalphos	400	80
Quinalphos	200	70
Dimethoate	430	60
Dimethoate	215	51

2. teszt példa

Atkaölő hatás Nagasaki Prefektúrából származó piros citrus-atkával szemben

A tesztelést az 1. teszt példánál leírt eljárás szerint végeztük, azzal a különbséggel, hogy Nagasaki Prefektúrából származó piros citrus atkát alkalmaztunk a Shizuoka

Prefektúrából származó helyett. Az eredményeket a 2. táblázatban foglaltuk össze.

2. táblázat

Rovarölőszer kombináció	Koncentráció		Elhullás
	(ppm)	%	
Pyrimidifen + isoxathion	20 + 500		100
Pyrimidifen + diazinon	20 + 400		100
Pyrimidifen + prothiofos	20 + 450		100
Pyrimidifen + methidathion	20 + 400		100
Pyrimidifen + thiometon	20 + 250		100
Pyrimidifen + malathion	20 + 500		100
Pyrimidifen + quinalphos	20 + 400		100
Pyrimidifen	20		52
Isoxathion	500	54	
Diazinon	400	75	
Prothiofos	450	67	
Methidathion	400	11	
Thiometon	250	0	
Malathion	500	14	
Quinalphos	400	80	

Szabadalmi igénypontok

1. Mezőgazdaságban és kertészetben alkalmazható rovarölőszer kombináció, mely pyrimidifent, melynek képlete 5-klór-N-{2-[2,3-dimetil-4-(2-etoxi-etil)-fenoxi]-etil}-6-etil-4-pirimidin-amin és egy vagy több (I) általános képletű vegyületet tartalmaz,

ahol a képletben

X jelentése oxigénatom vagy kénatom;

Y jelentése oxigénatom, kénatom vagy egyes kötés;

R¹ jelentése 1-6 szénatomszámú alkilcsoport;

R² jelentése 1-8 szénatomszámú alkoxicsoport,
1-8 szénatomszámú alkil-tio-csoport,
1-4 szénatomszámú alkil-karbonil-amino-csoport vagy
fenilcsoport; és

R³ jelentése 1-8 szénatomszámú alkilcsoport,
2-6 szénatomszámú alkenilcsoport, aminocsoport, fenil-
-csoport vagy hetero-aril-csoport, és szubsztituátlan
vagy egy, két vagy három szubsztituenst tartalmaz,
melyek lehetnek azonosak vagy különbözők és a következő

(A) csoportból választhatók ki:

halogénatomok, fenilcsoportok, nitrocsoportok,
cianocsoportok, oxocsoportok, 1-8 szénatomszámú
alkilcsoportok, 1-8 szénatomszámú alkoxicsoportok,
1-6 szénatomszámú alifás acilcsoportok, 1-6
szénatomszámú alkoxi-karbonil-csoportok, 1-6
szénatomszámú alkil-tio-csoportok, 1-6 szénatomszámú
alkil-amino-csoportok, dialkil-amino-csoportok,

melyekben az alkilcsoportok egymástól függetlenül 1-6 szénatomosak, hetero-aril-csoportok, karbamoilcsoportok, alkil-karbamoil-csoportok, melyekben az alkilrész 1-6 szénatomos és heterociklil-csoportok, melyek lehetnek szubsztituálatlanok vagy amelyek egy, két, vagy három (A) csoportba tartozó, de nem heterociklusos szubsztituenst tartalmaznak

vagy

R^3 jelentése egy (a) általános képletű csoport,
 R^1 , R^2 és X jelentése ugyanaz, mint az R^1 , R^2 és X -re fentiekben lefektetett jelentés.

2. Az 1. igénypont szerinti készítmény, melyben legalább egy (I) általános képletű vegyület a következők közül kerül ki: isoxathion, diazinon, prothiofos, methidathion, thiometon, malathion, quinalphos, dimethoate, chlorpyrofos, profenofos, monocrotophos vagy ethion.

3. Az 1. igénypont szerinti készítmény, melyben legalább egy (I) általános képletű vegyület a következők közül kerül ki: dimethoate, chlorpyrofos, profenofos, monocrotophos vagy ethion.

4. Az 1. igénypont szerinti készítmény, melyben legalább egy (I) általános képletű vegyület a következők közül kerül ki: profenofos, monocrotophos vagy ethion.

5. Az előző igénypontok bármelyike szerinti készítmény, amely csak egyetlen (I) általános képletű komponenst tartalmaz.

A meghatalmazott:

rajz
Raduoczi

DANUBIA
 Szabadalmi és Védjegy Iroda Kft.
 29.

PGS, 00781.

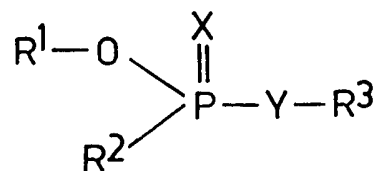
22702

A

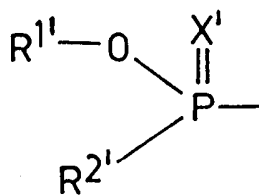
1 / 1

KÖZZÉTÉTEL
PÉLDÁNY

70701



(I)



(a)

1022