

(19) Országkód

**HU**



**MAGYAR  
KÖZTÁRSASÁG**

**ORSZÁGOS  
TALÁLMÁNYI  
HIVATAL**

# SZABADALMI LEÍRÁS

(11) Lajstromszám

**201514 B**

(22) Bejelentés napja: 1987. 04. 03. (21) (1443/87)

Bejelentés elsőbbsége: (33) DE:  
(32) 1986. 04. 04.  
(31) (P 36 11 193.7)

(41) (42) Közzététel napja: 1988. 09. 28.

(45) Megadás meghirdetésének dátuma  
a Szabadalmi Közlönyben: 1990. 11. 28.

(51)

Int Cl<sup>5</sup>  
C07C 233/13  
A01N 37/18  
C07C 233/14

(72) Feltaláló(k):  
Dr. TARNOW Horst, Langenfeld,  
Dr. HOMEYER Bernhard, Leverkusen, DE

(73) Szabadalmas:  
BAYER AG., Leverkusen, DE

(74) Képviselő: Danubia Szabadalmi Iroda,  
Budapest

## (54) **HATÓANYAGKÉNT N-HELYETTESÍTETT-BENZAMID-SZÁRMAZÉKOKAT TARTALMAZÓ NEMATOCID KÉSZÍTMÉNYEK ÉS ELJÁRÁS A HATÓANYAGOK ELŐÁLLÍTÁSÁRA**

### (57) KIVONAT

A találmány tárgya nematocid szerek, melyek hatóanyagként 0,001–95 tömeg% mennyiségben legalább egy (I) általános képletű N-helyettesített benzamid-származékot – a képletben

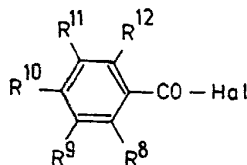
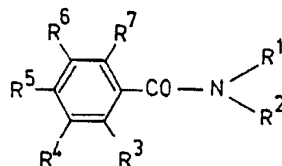
R<sup>1</sup> jelentése hidrogénatom vagy 1–4 szénatomos alkilcsoport,

R<sup>2</sup> jelentése halogénatommal háromszorosán helyettesített 1–4 szénatomszámú alkil- vagy trifluor-metil-csoporttal egyszeresen helyettesített 3–6 szénatomos cikloalkilcsoport,

R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> és R<sup>7</sup> legfeljebb négy szubsztituensnél hidrogénatom és egy vagy két szubsztituensnél halogénatom –

tartalmaznak.

A találmány tárgyát képezi az (I) általános képletű vegyületek előállítására szolgáló eljárás is. E vegyületeket úgy állítják elő, hogy egy (II) általános képletű benzoil-halogenidet – a képletben R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup>, R<sup>10</sup>, R<sup>11</sup> és R<sup>12</sup> jelentése R<sup>3</sup>–R<sup>7</sup> jelentésére a fentiekben megadottal azonos, vagy egyikük -CO-Hal általános képletű csoportot is jelenthet, ahol Hal jelentése halogénatom – egy (III) általános képletű aminnal – a képletben R<sup>1</sup> és R<sup>2</sup> jelentése az (I) általános képletnél megadottal azonos, illetve e vegyület hidrogén-halogenid-sójjával reagáltatnak.



**HU 201514 B**

A leírás terjedelme: 16 oldal, 4 ábra

A találmány tárgya hatóanyagként új N-helyettesített benzamid-származékokat tartalmazó nematocid szerek, valamint eljárás ezen hatóanyagok előállítására.

Ismert, hogy bizonyos foszforsavészter-amidok, így például O-etil-O-(3-metil-4-metil-tio-fenil)-N-izopropil-foszforsavészter-amid (Fenamiphos) jó inszekticid és nematocid hatásúak [2 978 479 számú amerikai egyesült államokbeli szabadalmi leírás, valamint Pesticide Manual (kiadó: British Crop Protection Council) 5. kiadás (1977), 262. oldal, a Fenamiphos kereskedelmi termék leírása].

2-halogén-etil-benzamidokat ismertetnek a 4 505 859 számú amerikai egyesült államokbeli szabadalmi leírásban.

Az (I) általános képletben

R<sup>1</sup> jelentése hidrogénatom vagy 1–4 szénatomos alkilcsoport,

R<sup>2</sup> jelentése halogénatommal háromszorosan helyettesített 1–4 szénatomszámú alkil- vagy trifluor-metil-csoporttal egyszerűen helyettesített 3–6 szénatomos cikloalkilcsoport,

R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> és R<sup>7</sup> jelentése legfeljebb négy szubsztituensnél hidrogénatom és egy vagy két szubsztituensnél halogénatom.

A találmány tárgyához tartozik azon (I) általános képletű vegyületeknek az előállítása is, amelyek képletében

R<sup>1</sup> jelentése hidrogénatom vagy 1–4 szénatomszámú alkilcsoport, R<sup>2</sup> jelentése halogénatommal 1–3-szorosan helyettesített 1–6 szénatomszámú alkilcsoport, trifluor-metil-csoporttal egyszerűen helyettesített 3–6 szénatomos cikloalkilcsoport,

R<sup>3</sup>–R<sup>7</sup> jelentése hidrogénatom, továbbá egy trifluor-metil-csoport és/vagy 1–5 halogénatom, vagy egy nitro- vagy egy 1–4 szénatomos alkilcsoport, vagy egy -CONR<sup>1</sup>R<sup>2</sup> általános képletű csoport, amelyben

R<sup>1</sup> jelentése hidrogénatom,

R<sup>2</sup> jelentése halogénatommal háromszorosan helyettesített 1–4 szénatomos alkilcsoport,

azzal a megkötéssel, hogy ha R<sup>2</sup> jelentése monohalogén-etilcsoport, akkor R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> és R<sup>7</sup> közül legalább az egyik szubsztituens jelentése hidrogénatomtól eltérő.

Az (I) általános képletű vegyületeket úgy állítjuk elő, hogy egy (II) általános képletű benzoil-halogenidet – a képletben R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup>, R<sup>10</sup>, R<sup>11</sup> és R<sup>12</sup> jelentése R<sup>3</sup>–R<sup>7</sup> jelentésére a fentiekben megadottal azonos, vagy egyikük -CO-Hal általános képletű csoportot is jelenthet, ahol Hal jelentése halogénatom – egy (III) általános képletű aminnal – a képletben R<sup>1</sup> és R<sup>2</sup> jelentése az (I) általános képletnél megadottal azonos, illetve e vegyület hidrogén-halogenid-sójával reagáltatunk.

Az új (I) általános képletű N-helyettesített benzamidok jó nematocid hatásúak.

A találmány tárgya előnyösen azoknak a (I) általános képletű vegyületeknek az előállítása, amelyek képletében

R<sup>1</sup> jelentése hidrogénatom vagy 1–4 szénatomos alkilcsoport,

R<sup>2</sup> jelentése halogén-alkil-csoport, amely 2–4 szénatomot és 1–3 halogénatomot, így fluoratomot és/vagy klóratomot tartalmaz, valamint halogénatommal, így fluoratommal és/vagy klóratommal, vagy halogén-(1–

–2 szénatomos alkil)-csoporttal helyettesített 3–6 szénatomos cikloalkilcsoport,

R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> jelentése hidrogénatom,

R<sup>3</sup> jelentése hidrogénatom vagy halogénatom, és R<sup>7</sup> jelentése halogénatom.

Különösen előnyösek azok a (I) általános képletű N-helyettesített benzamidok, amelyek képletében

R<sup>1</sup> jelentése hidrogénatom vagy 1–4 szénatomos alkilcsoport,

R<sup>2</sup> jelentése 2–4 szénatomos és 1–3 fluoratomot vagy 1–2 fluoratomot és klóratomot tartalmazó halogén-(1–4 szénatomos)-alkil-csoport, valamint fluoratommal, klóratommal és/vagy trifluor-metilcsoporttal helyettesített 3–6 szénatomos cikloalkilcsoport,

R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> jelentése hidrogénatom,

R<sup>3</sup> jelentése hidrogénatom vagy halogénatom,

R<sup>7</sup> jelentése halogénatom.

Rendkívül előnyösek azok az (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében

R<sup>1</sup> jelentése hidrogénatom, metil-, etil-, n-propil-, izopropil- vagy n-butil-csoport,

R<sup>2</sup> jelentése 2-fluor-etil-, 2,2-difluor-etil-, 2,2,2-trifluor-etil-, 3-fluor-prop-1-il-, 3-fluor-prop-2-il-, 3,3-difluor-prop-2-il-, 3,3-difluor-prop-2-il-, 3,3,3-trifluor-prop-2-il-, 2-fluor-2-metil-prop-2-il-, 2,2-difluor-2-metil-prop-2-il-, 2-metil-2,2,2-trifluor-prop-2-il-, 2-metil-3,3,3-trifluor-prop-1-il-, 2-metil-3,3,3-klór-difluor-prop-1-il-, 1,3-difluor-prop-2-il-, 3-fluor-2-fluor-metil-prop-2-il-, 1,3-difluor-2-fluor-metil-prop-2-il- és

1-trifluor-metil-cikloprop-1-il-csoport és R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> és R<sup>7</sup> jelentése azonos vagy eltérő, és jelentik a hidrogénatomot, fluoratomot, klóratomot, brómatomot, nitrocsoportot, metilcsoportot, trifluor-metil-csoportot, trifluor-metoxi-csoportot, trifluor-metil-tio-csoportot valamint a -CONR<sup>1</sup>R<sup>2</sup> általános képletű csoportot.

Ha a találmány szerinti kiindulási anyagként 2,6-difluor-benzoil-kloridot és 2-amino-3,3,3-trifluor-propánt alkalmazunk, akkor a megfelelő reakciót az A reakcióvázlat szemlélteti.

Ha például a találmány szerinti eljárásban kiindulási anyagként o-ftálsavdikloridot és 1-amino-3,3,3-trifluor-propánt alkalmazunk, akkor a megfelelő reakciót a B reakcióvázlat szemlélteti.

A találmány szerinti eljárásban kiindulási anyagként alkalmazható benzoil-halogenideket a (II) általános képlet határozza meg. A képletben R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup>, R<sup>10</sup>, R<sup>11</sup> és R<sup>12</sup> előnyös jelentése hidrogénatom, fluoratom, klóratom, brómatom, nitrocsoport, 1–4 szénatomos alkilcsoport, halogén-(1–4 szénatomos alkil)-csoport, halogén-(1–4 szénatomos alkoxi)- csoport és halogén-(1–4 szénatomos alkil)-tio-csoport. Hal jelentése halogénatom, különösen fluoratom vagy klóratom.

A (II) általános képletű vegyületek ismertek és/vagy ismert módszerrel előállíthatók (2 123 236 számú német szövetségi köztársasági közrebocsátási irat, 2 601 780, 2 637 974, 3 217 619, 3 217 620 számú német szövetségi köztársasági közrebocsátási iratok és 122 449 számú európai közrebocsátási irat.

A (II) általános képletű vegyületekre példaként az I. táblázatban felsorolt vegyületeket nevezzük meg. A (II) általános képletben Hal jelentése klóratom vagy fluoratom.

I. táblázat

R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R <sup>10</sup>	R <sup>11</sup>	R <sup>12</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	
F	H	H	H	H	5	H H H	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub> -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> F -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
H	H	H	H	H			
H	H	H	F	F			
H	H	F	H	H	10	H	-CH <sub>2</sub> -CH $\begin{matrix} \text{CH}_3 \\ \text{CClF}_2 \end{matrix}$
H	H	F	H	F			
F	H	F	H	F			
F	F	F	F	F			
H	F	Cl	H	Cl	15	H	-CH-CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>   CF <sub>3</sub>
F	Cl	F	Cl	F			
H	H	H	H	Cl			
H	H	H	Cl	H			
Cl	H	Cl	H	Cl			
H	Cl	H	H	Cl	20	H	-CH-CHF <sub>2</sub>   CH <sub>3</sub>
H	H	Cl	H	Cl			
H	H	H	H	CF <sub>3</sub>			
H	H	H	CF <sub>3</sub>	H			
H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	25	H	CH <sub>2</sub> F   -C-CH <sub>3</sub>   CH <sub>2</sub> F
H	H	H	H	CH <sub>3</sub>			
H	H	CH <sub>3</sub>	H	H			
H	H	NO <sub>2</sub>	H	H			
H	H	H	NO <sub>2</sub>	H			
H	H	Cl	NO <sub>2</sub>	H	30	H	-CH(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
H	H	H	H	COCl			
H	H	COCl	H	H			
H	H	H	H	COF			
H	H	COF	H	H	35	H	-CH <sub>2</sub> -CH $\begin{matrix} \text{CH}_3 \\ \text{CF}_3 \end{matrix}$

A találmány szerinti eljárásban ezenkívül kiindulási anyagként alkalmazható aminokat és ezek hidrogén-halogenidseit a (III) általános képlet határozza meg. A (III) általános képletben R<sup>1</sup> és R<sup>2</sup> előnyös jelentései azok a csoportok, amelyeket a találmány szerinti eljárással előállítható (I) általános képletű vegyületnél ezekre a szubsztituensekre előnyösként felsoroltunk. Hidrohalogenidekként előnyösen alkalmazhatók a hidrogén-kloridok vagy a hidrogén-bromidok.

A (III) általános képletű vegyületekre a II. táblázatban példákat sorolunk fel.

II. táblázat

R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
H	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CHF <sub>2</sub>
H	-CH-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub>   CF <sub>3</sub>
H	-CH-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>   CF <sub>3</sub>
H	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CClF <sub>2</sub>
H	-CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>
H	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>

H	-CH <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> F
H	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -CHF <sub>2</sub>
CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -CF <sub>3</sub>
H	-CH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>
H	1-(trifluor-metil)-ciklopropil

45 A (III) általános képletű vegyületek és a megfelelő hidrohalogenidek részben ismertek [J. Org. Chem. 24, 1256-1259 (1969); J. Org. Chem. 27, 1406-1409 (1962); Invest. Akad. Nauk. SSSR, Ser. Khim. 1966, 226-228; Invest. Akad. Nauk. SSSR; Ser. Khim. 1966, 1518-1523; J. Med. Chem. 22, 1130-1133 (1979); 30 18 020 számú német szövetségi köztársasági közrebozsátási irat; 39 813 számú európai közzétételi irat; 32 18 966 számú német szövetségi köztársasági közrebozsátási irat, 73 974 számú európai közzétételi irat, 33 07 234 számú német szövetségi köztársasági közrebozsátási irat; Ind. Eng. Chem. 48, 209-213 (1956); J. Am. Chem. Soc. 102, 4958-4959 (1980) és az előállítási példák].

60 A (III) általános képletű vegyületekhez tartozó új aminokat például a következő módon állíthatjuk elő.

A (IV) általános képletű aminokat - a képletben X<sup>1</sup>-X<sup>3</sup> jelentése azonos vagy eltérő, és jelenthetik a hidrogénatomot vagy a fluoratomot, amikor is legalább az X<sup>1</sup>-X<sup>3</sup> csoportok egyike fluoratomot jelent - előállíthatjuk az A előállítási változattal, amikor is

a) egy (V) általános képletű halogénezett piválsav-halogenidet – a képletben  $X^1-X^3$  jelentése a már megadott és Hal<sup>1</sup> jelentése fluoratom vagy klóratom –, azidcsoportot átvívó reagenssel a (VI) általános képletű fluorozott piválsav-aziddá alakítjuk – a képletben  $X^1-X^3$  jelentése a már megadott –, és

b) az adott esetben izolált (VI) általános képletű vegyületet termikusan a (VII) általános képletű fluorozott izocianátra bontjuk – a képletben  $X^1-X^3$  jelentése a már megadott –, és

c) adott esetben izolált (VII) általános képletű vegyületet, például sósavas hidrolízissel a (VIII) általános képletű fluorozott tercier butil-amin-hidroklorid-dá alakítjuk – a képletben  $X^1-X^3$  jelentése a már megadott –, és

d) adott esetben izolált (VIII) általános képletű vegyületet bázissal kezeljük, és a (IV) általános képletű fluorozott tercier butil-aminná alakítjuk,

vagy

a B) eljárásváltozattal a (VII) általános képletű izocianátot – a képletben  $X^1-X^3$  jelentése a már megadott –, lúgos hidrolízissel közvetlenül a (IV) általános képletű fluorozott tercier butil-aminná alakítjuk,

vagy a C) eljárásváltozattal –

egy (IX) általános képletű piválsavamidot – a képletben  $X^1-X^3$  jelentése a már megadott – hipohalogenittel átalakítjuk.

A (III) általános képletű vegyületekhez tartozó (X) általános képletű új ciklopropil-aminokat például úgy állíthatjuk elő, hogy egy (XI) általános képletű ismert ciklopropil-karbonsavamint SF<sub>4</sub>-gyel vízmentes hidrogén-fluoriddal autoklávban átalakítjuk.

A (XI) általános képletű ciklopropán-karbonsav-aminok ismertek [J. Chem. Soc. 1960, 2119–2132, ibid. 1962, 3977–3980; Synthesis 1978, 46; Coll. Czech. Chem. Comm. 47, 2291–2305 (1982)].

A (I) általános képletű új N-helyettesített benzamid-származékok találmány szerinti előállítási eljárását előnyösen hígítószert jelenlétében folytatjuk le. Hígítószerként alkalmazhatunk vizet és gyakorlatilag az összes különböző szerves oldószert. Ide tartoznak előnyösen az alifás, aromás, adott esetben halogénezett szénhidrogének, így a pentán, hexán, heptán, ciklohexán, petroléter, benzil, ligroin, benzol, toluol, xilol, metilén-klorid, etilén-klorid, kloroform, szén-tetraklorid, klór-benzol és o-diklór-benzol, éterek, így dietil- és dibutil-éter, glikol-dimetil-éter és diglikol-dimetil-éter, tetrahydrofuran és dioxán, ketonok, így aceton, metil-etil-, metil-izopropil- és metil-izobutil-eton, észter, így ecetsav-metil-észter és -etil-észter, nitrilek, így például acetonitril és propionitril, amidok, így például dimetil-formamid, dimetil-acetamid és N-metil-pirrolidon valamint dimetil-szulfoxid, tetrametilén-szulfon és hexametilén-foszforsav-triamid.

Savakceptorként a találmány szerinti eljárásban az összes ilyen jellegű átalakításokban szokásosan alkalmazható savmegkötőszert felhasználhatjuk. Előnyösen alkalmazhatunk alkálifém-hidroxidokat, így például nátrium- és kálium-hidroxidot, alkáliföldfém-hidroxidot, így például kalcium-hidroxidot, alkáli-karbonátokat és -alkoholátokat, így nátrium- és kálium-karbonátot, nátrium- és kálium-metilátot illetve -etilátot, továbbá alifás, aromás vagy heterociklusos aminokat, például trietil-amint, trimetil-amint, dimetil-anilint, di-

metil-benzil-amint, piridint, kinolint, 1,5-diazabiciklo-[4,3,0]-non-5-én-t (DBN), 1,8-diazabiciklo-[5,4,0]-undec-7-ént (DBU) és 1,4-diazabiciklo-[2,2,2]-oktánt (DABCO). A (III) általános képletű aminet feleslegben is alkalmazhatjuk, és a feleslegben alkalmazott amin ilyenkor savmegkötőszerként hat.

A találmány szerinti eljárásban a reakció hőmérsékletét széles tartományban változtathatjuk. Általában 0–100 °C, előnyösen 20–80 °C hőmérsékleten dolgozunk. A reakcióképes aminoknál többnyire alig szükséges melegíteni, ugyanis az átalakulás már magától lezajlik. A találmány szerinti eljárásban ha reakcióvívó aminokat alkalmazunk, akkor több órás hevítés szükséges.

Az átalakítást általában normál nyomáson folytatjuk le. Könnyen illó és reakcióvívó aminoknál azonban előnyös az átalakítást zárt edényben és magasabb nyomáson elvégezni.

A találmány szerinti eljárásban egy -CO-Hal csoportot tartalmazó (II) általános képletű benzoil-halogenidhez 1,00–1,6 mól, előnyösen 1,05–3 mól (III) általános képletű aminet, és 1–3 mól, előnyösen 1–2 mól savakceptort vagy egy újabb molekula (III) általános képletű aminet alkalmazunk. A reakcióelegy feldolgozása szokásos módon történik. A (I) általános képletű vegyületek többnyire szilárd formában kiválnak, vagy – adott esetben a reakcióoldat bepárlása után – víz hozzáadással leválaszthatók.

A hatóanyagok jó növényi kompatibilitás és kedvező melegvérű toxicitás esetén olyan állati kártevők, különösen inszektok nematodok pusztítására alkalmazhatók, amelyek erdőségekben, mezőgazdaságban, raktárakban, valamint higiéniai szektorokban előfordulnak. A hatóanyagok hatásosan alkalmazhatók a normál, érzékeny és a rezisztens fajokkal szemben, valamint az összes vagy egyedi fejlődési stádiumokkal szemben. Az említett kártevőkhöz tartoznak a következők:

Az Isopoda rendből például: Oniscus asellus, Armadillidium vulgare, Porcellio scaber.

A Diplopoda rendből például: Blaniulus guttulatus.

A Chilopoda rendből például: Geophilus carpophagus, Scutigera spec.

A Symphyla rendből például: Scutigera immaculata.

A Thysanura rendből például: Lepisma saccharina.

A Collembola rendből például: Onychiurus armatus.

Az Orthoptera rendből például: Blatta orientalis, Periplaneta americana, Leucophaea maderae, Blattella germanica, Acheta domesticus, Gryllotalpa spp., Locusta migratoria migratorioides, Melanoplus differentialis, Schistocerca gregaria.

A Dermaptera rendből például: Forficula auricularia.

Az Isoptera rendből például: Reticulitermes spp.

Az Anoplura rendből például: Phylloxera vastatrix, Pemphigus spp., Pediculus humanus corporis, Haematopinus spp., Linognathus spp.

A Mallophaga rendből például: Trichodectes spp., Damalinae spp.

A Thysanoptera rendből például: Hercinothrips femoralis, Thrips tabaci.

A Heteroptera rendből például: Eurygaster spp., Dysdercus intermedius, Piesma quadrata, Cimex lectularius, Rhodnius prolixus, Triatoma spp.

A Homoptera rendből például: *Aleurodes brassicae*, *Bemisia tabaci*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Aphis gossypii*, *Brevicoryne brassicae*, *Cryptomyzus ribis*, *Aphis fabae*, *Doralis pomi*, *Eriosoma lanigerum*, *Hyalopterus arundinis*, *Macrosiphum avenae*, *Myzus spp.*, *Phorodon humuli*, *Rhopalosiphum padi*, *Empoasca spp.*, *Euscelis bilobatus*, *Nephotettix cincticeps*, *Lecanium corni*, *Saissetia oleae*, *Laodelphax striatellus*, *Nilaparvata lugens*, *Aonidiella aurantii*, *Aspidiotus hederae*, *Pseudococcus spp.* *Psylla spp.*

A Lepidoptera rendből például: *Pectinophora gossypiella*, *Bupalus piniarius*, *Cheimatobia brumata*, *Lithocolletis blancardella*, *Hyponomeuta padella*, *Plutella maculipennis*, *Malacosoma neustria*, *Euproctis chrysoorhoea*, *Lymantria spp.* *Bucculatrix thurberiella*, *Phyllocnistis citrella*, *Agrotis spp.*, *Euxoa spp.*, *Feltia spp.*, *Earias insulana*, *Heliothis spp.*, *Spodoptera exigua*, *Mamestra brassicae*, *Panolis flammea*, *Prodenia litura*, *Spodoptera spp.*, *Trichoplusia ni*, *Carpocapsa pomonella*, *Pieris spp.*, *Chilo spp.*, *Pyrausta nubilalis*, *Ephesia kuehniella*, *Galleria mellonella*, *Tineola biselliella*, *Tinea pellionella*, *Hofmannophila pseudopretella*, *Cacoecia podana*, *Capua reticulana*, *Choristoneura fumiferana*, *Clysia ambiguella*, *Homona magnanima*, *Tortrix viridana*.

A Coleoptera rendből például: *Anobium punctatum*, *Rhizophorthera dominica*, *Acanthoscelides obtectus*, *Hylotrupes bajulus*, *Agelastica alni*, *Leptinotarsa de-cemlineata*, *Phaedon cochleariae*, *Diabrotica spp.*, *Psylliodes chrysocephala*, *Epilachna varivestis*, *Ato-maria spp.*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Anthonomus spp.*, *Sitophilus spp.*, *Otiorrhynchus sulcatus*, *Cosmo-polites sordidus*, *Ceuthorrhynchus assimilis*, *Hypera postica*, *Dermestes spp.*, *Trogoderma spp.*, *Anthrenus spp.*, *Attagenus spp.*, *Lyctus spp.*, *Meligethes aeneus*, *Ptinus spp.*, *Niptus hololeucus*, *Gibbium psyllodes*, *Tribolium spp.*, *Tenebrio molitor*, *Agriotes spp.*, *Conoderus spp.*, *Melolontha melolontha*, *Amphimallon sol-sitalis*, *Costelytra zealandica*.

A Hymenoptera rendből például: *Diprion spp.*, *Hopllocampa spp.*, *Lasius spp.*, *Monomorium phara-onis*, *Vespa spp.*

A Diptera rendből például: *Aedes spp.*, *Anopheles spp.*, *Culex spp.*, *Drosophila melanogaster*, *Musca spp.*, *Fannia spp.*, *Calliphora erythrocephala*, *Lucilia spp.*, *Chrysomyia spp.*, *Cuterebra spp.*, *Gastrophilus spp.*, *Hyppobosca spp.*, *Stomoxys spp.*, *Oestrus spp.*, *Hypo-derma spp.*, *Tabanus spp.*, *Tannia spp.*, *Bibio hortula-nus*, *Oscinella frit*, *Phorbia spp.*, *Pegomyia hyoscyami*, *Ceratitis capitata*, *Dacus oleae*, *Tipula paludosa*.

A Siphonaptera rendből például: *Xenopsylla cheo-pis*, *Ceratophyllus spp.*

Az Arachnida rendből például: *Scorpio maurus*, *Latrodectus mactans*.

A növényi parazita nematodokhoz a következők tartoznak: *Pratylenchus spp.*, *Radopholus similis*, *Ditylenchus dipsaci*, *Tylenchulus semipenetrans*, *Hete-rodera spp.*, *Meloidogyne spp.*, *Aphelenchoides spp.*, *Longidorus spp.*, *Xiphinema spp.*, *Trichodorus spp.*

A hatóanyagokat szokásos készítménnyé alakíthat-juk, így oldattá, emulzióvá, szuszpenzióvá, porokká, habbá, pasztává, granulátummá, aeroszollá, ható-anyaggal impregnált természetes és szintetikus anya-gokká. A hatóanyagokat polimer anyagba kapszuláz-hatjuk, és a vetőmag burkolóanyagába dolgozhatjuk,

valamint készíthetünk belőle éghető készítményeket, így füstpatronokat, -dobozokat, -spirálokat, valamint ULV hideg- és melegköd-készítményeket.

Ezeket a készítményeket ismert módon állíthatjuk elő, így például a hatóanyagot inert töltőanyaggal keverjük, így például folyékony oldószerrel, csepp-folyósított gázokkal, és/vagy szilárd vivőanyaggal, adott esetben felületaktív szert, tehát emulgeálószer-t és/vagy diszpergálószer-t és/vagy habosítóanyagot al-kalmazunk.

Ha a közömbös töltőanyagként vizet alkalmazunk, akkor oldódást segítő anyagként szerves oldószert is felhasználhatunk. Ilyen folyékony oldószerek a követ-kezők: aromás vegyületek, így például xilol, toluol vagy alkilnaftalinok, klórozott aromások és klórozott alifás szénhidrogének, így például klór-benzol, klór-etilén- vagy metilén-klorid, alifás szénhidrogének, így ciklohexán vagy paraffin, így például kőolajfrak-ciók, ásványi és növényi olajok, alkoholok, így buta-nol vagy glikol, valamint ezek étereit és észtereit, ketonok, így acetont, metil-etil-ketont, metil-izobu-til-ketont, vagy ciklohexanont, előnyösen poláris oldó-szerek, így dimetil-formamid és dimetil-szulfoxid, valamint vizet.

Folyékony gázhalmazállapotú inert töltőanyagon vagy vivőanyagon azokat a folyadékokat értjük, ame-lyek normál hőmérsékleten és nyomáson gáz halmaz-állapotúak, így például az aeroszolos hajtógázok, így a halogén-szénhidrogének, valamint a bután, a propán, a nitrogén és szén-dioxid.

Szilárd vivőanyagként a következő vegyületeket és anyagokat alkalmazhatjuk: például ammóniumsók és természetes kőzetlisztek, így például kaolin, agyag-föld, talkum, kréta, kvarc, attapulgit, montmorillonit vagy diatomaföld és szintetikus kőzetlisztek, így pél-dául nagydiszperzitású kovasav, alumínium-oxid és szilikát, granulátumokhoz szilárd vivőanyagként alka-lmazhatunk például zúzott és frakcionált természetes kőzeteket, így kalcitot, márványt, horzsakövet, szepi-olított, dolomitot valamint szerves és szerves lisztek-ből készített szintetikus granulátumokat, így például fűrészporból, kókuszdióhéjból, kukoricacsutkából és a dohánynövény szárából készített granulátumokat, emulgeáló- és/vagy habosítószerként a következő anyagokat alkalmazhatjuk: nemionos és anionos emul-geátorok, így poli(oxi-etilén)-zsírsav-észter, poli(oxi-etilén)-zsíralkohol-éter, például alkil-arilpoliglikol-éter, alkil-szulfonát, alkil-szulfát, alkil-szulfonát vala-mint fehérje hidrolizátumok; diszpergálószerként al-kalmazhatunk például lignin-szulfitszennylúgot és mel-til-cellulózt.

A készítményekben felhasználhatunk ragasztóanya-gokat, így például karboxi-metil-cellulózt, természetes és szintetikus por formájú szemcsés vagy látex formá-jú polimereket, így például gumi-arábikumot, poli(vi-nil-alkoholt), poli(vinil-acetátot), valamint természetes foszfolipideket, így kefalint és lecitint és szintetikus foszfolipideket. További adalékként alkalmazhatunk ásványi és növényi olajokat.

Felhasználhatunk színyanyagokat, így szerves pigmenteket, így például vas-oxidot, titán-oxidot, fer-rociánkéket és szerves színyanyagokat, így alizarin-, azo- és fémtalo-cianin-színyanyagokat és nyomeleme-ket, így például vas-, mangán-, bór-, réz-, kobalt-, molibdén- és cinksókat.

A készítmények általában 0,001–95 tömeg% előnyösen 0,5–90 tömeg% hatóanyagot tartalmaznak.

A találmány szerinti eljárással előállított hatóanyagokat felhasználhatjuk egyéb ismert hatóanyagokkal, valamint az ezekből egyéb hatóanyagok hozzáadásával előállított felhasználásra kész formában. Egyéb hatóanyagok lehetnek inszekticidek, lazítóanyagok, sterilizáló anyagok, akaricidek, nematocidek, fungicidek, növekedést szabályozó anyagok, valamint herbicidek. Inszekticidekhez soroljuk például a foszforsavésztereket, karbamátokat, karbonsavésztereket, klórozott szénhidrogéneket, fenil-karbamidokat, mikroorganizmusokkal előállított anyagokat.

A találmány szerinti eljárással előállított hatóanyagok felhasználhatók a kereskedelemben kapható készítményként, valamint ezekből szinergetikus anyagok hozzákeverésével előállított felhasználásra kész formaként. Szinergetikus anyagok azok a vegyületek, amelyek a hatóanyag hatását anélkül fokozzák, hogy maguk a hozzáadagolt szinergetikus vegyületek is aktívan hatékonyak lennének.

A kereskedelemben kapható készítményekből előállított felhasználásra kész formákban a hatóanyag tartalom széles tartományban változhat. A felhasználásra kész formában a hatóanyag koncentrációja 0,0001–95 tömeg%, előnyösen 0,001–1 tömeg%.

A felhasználás a felhasználásra kész formának megfelelően történik.

A találmány szerinti eljárással előállított (I) általános képletű új vegyületek a már korábban ismert vegyületekkel szemben meglepő módon rendkívül kedvező melegvérű toxicitásúak, és egyidejűleg az állati kártevőkkel szemben rendkívül hatásosak. Ezek a tulajdonságok rendkívül megkönnyítik a hatóanyagok alkalmazását különösen azokban az esetekben, amikor a készítmény kijuttatására nincs megfelelően tapasztalt személyzet, és a kártevők pusztításakor szükséges és szokásos előírásokat nem lehet teljes mértékben betartani.

#### Előállítás példák

##### 1. példa

###### (1) képletű vegyület előállítása

50 ml toluolban feloldunk 17,65 g (0,1 mól) 2,6-difluor-benzoil-kloridot, ezt 20–30 °C hőmérsékleten a következő oldathoz csepegtetjük: 200 ml toluolban feloldott 11,30 g (0,1 mól) 2-amino-1,1,1-trifluor-propán és 13,5 g (0,1 mól) N,N-dimetil-benzil-amin. Az így kapott elegyet 50–60 °C hőmérsékleten keverjük, miközben az N,N-dimetil-benzil-amin-hidroklorid kiválik. Ezután 20 °C hőmérsékletre lehűtjük, vízzel extraháljuk, és a szerves fázist vákuumban bepároljuk. A szintelen maradékot mosóbenzin és/vagy toluolból átkristályosítjuk.

5

##### 2. példa

###### (2) képletű vegyület előállítása

50 ml toluolban feloldunk 21,4 g (0,1 mól) 2,3,4,5,6-pentafluor-benzoil-fluoridot, és ezt 20–30 °C hőmérsékleten a következő oldathoz csepegtetjük: 250 ml toluolban feloldunk 9,9 g (0,1 mól) 2,2,2-trifluor-1-amino-etánt és 13,5 g (0,1 mól) N,N-dimetil-benzil-amint. Ezután 50–60 °C hőmérsékleten keverjük, 20 °C hőmérsékletre lehűtjük, vízzel elegyítjük, és a szilárd reakcióterméket leszívátjuk. A maradékot vízzel mossuk és szárítjuk.

10

Ily módon 25,2 g (86 % kitermelés) 2,3,4,5,6-pentafluor-benzoosav-N-(2,2,2-trifluor-etil)-amidot kapunk.

15

20

##### 3. példa

###### (3) képletű vegyület előállítása

50 ml toluolban feloldunk 18,55 g (0,1 mól) 3-nitrobenzoil-kloridot, és ezt a következő elegyhez csepegtetjük: 250 ml toluolban oldunk 14,95 g (0,1 mól) 2-amino-1,1,1-trifluor-propán-hidrokloridot és 27 g (0,2 mól) N,N-dimetil-benzil-amint. Az elegyet 50–60 °C hőmérsékleten keverjük, majd 20 °C hőmérsékletre hűtjük, vízzel elegyítjük, és a szilárd reakcióterméket leszívátjuk. A maradékot vízzel mossuk és szárítjuk.

25

30

35

Ily módon 19,8 g (75,6 % kitermelés) 3-nitro-benzoosav-N-(1,1,1-trifluor-prop-2-il)-amidot kapunk.

A termék olvadáspontja 130–131 °C.

##### 4. példa

###### (4) képletű vegyület előállítása

100 ml toluolban feloldunk 20,3 g (0,1 mól) o-ftalil-kloridot, és ezt 20–30 °C hőmérsékleten a következő oldathoz csepegtetjük: 300 ml toluolban feloldunk 22,6 g (0,2 mól) 2-amino-1,1,1-trifluor-propánt és 27,0 g (0,2 mól) N,N-dimetil-benzil-amint. Ezután az elegyet 50–60 °C hőmérsékleten keverjük, majd 20 °C hőmérsékletre lehűtjük, vízzel elegyítjük, és a szilárd reakcióterméket leszívátjuk. A maradékot vízzel mossuk és szárítjuk.

40

45

50

55

Ily módon 29,2 g (82 % kitermelés) o-ftálsav-bisz-[N-(1,1,1-trifluor-prop-2-il)-amid]-ot állítunk elő.

A termék olvadáspontja 230–231 °C. Az 1–4. példához hasonló módon állítjuk elő a III. táblázatban felsorolt (I) általános képletű vegyületeket.

#### III. táblázat

Példa száma	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	Op. (°C)
5.	H	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	F	H	H	H	F	107–109
6.	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	F	H	H	H	F	79–81

Példa száma	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	Op. (°C)
7.	H	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\   \\ -\text{CH}_2-\text{CH} \\   \\ \text{CClF}_2 \end{array}$	F	H	H	H	F	98–100
8.	H	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\   \\ -\text{CH}_2-\text{CH} \\   \\ \text{CCl}_2\text{F} \end{array}$	F	H	H	H	F	73–75
9.	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	F	H	H	H	F	74–76
10.	H	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	F	H	H	H	F	128–130
11.	H	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	F	H	H	H	F	105–107
12.	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	Cl	H	H	114–116
13.	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	Cl	88–89
14.	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	F	F	F	F	F	75–76
15.	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	H	CH <sub>3</sub>	H	58–60
16.	H	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	Cl	82–83
17.	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	H	CF <sub>3</sub>	H	nd <sup>20</sup> : 1,4465
18.	H	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \diagup \\ -\text{CH} \\ \diagdown \\ \text{CF}_3 \end{array}$	F	F	F	F	F	150–151
19.	H	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	F	Cl	F	Cl	F	131–132
20.	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	F	Cl	F	Cl	F	118–120
21.	H	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \diagup \\ -\text{CH} \\ \diagdown \\ \text{CF}_3 \end{array}$	F	Cl	F	Cl	F	175–177
22.	H	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	F	Cl	H	Cl	126–128
23.	H	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \diagup \\ -\text{CH} \\ \diagdown \\ \text{CF}_3 \end{array}$	H	F	Cl	H	Cl	137–139
24.	H	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	CF <sub>3</sub>	125–127
25.	H	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\ \diagup \\ -\text{CH} \\ \diagdown \\ \text{CF}_3 \end{array}$	H	H	H	H	CF <sub>3</sub>	118–120

Példa száma	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	Op. (°C)
26.	H	$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\   \\ -\text{CH} \\   \\ \text{CF}_3 \end{array}$	H	H	H	H	H	102–103
27.	H	$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\   \\ -\text{CH} \\   \\ \text{CH}_3 \end{array}$	H	H	Cl	H	H	130–131
28.	H	$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\   \\ -\text{CH} \\   \\ \text{CF}_3 \end{array}$	H	H	NO <sub>2</sub>	H	H	110–112
29.	H	$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\   \\ -\text{CH} \\   \\ \text{CF}_3 \end{array}$	H	H	H	H	Cl	128–129
30.	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	H	H	118–120
31.	H	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	-CONH-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	>250
32.	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	-CONH-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	211–212
33.	H	(trifluor-metil)- -ciklopropil	F	H	H	H	F	174–175
34.	H	-CH(CH <sub>2</sub> F) <sub>2</sub>	F	H	H	H	F	122–124
35.	H	$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\   \\ -\text{CH} \\   \\ \text{CF}_3 \end{array}$	H	H	H	CF <sub>3</sub>	H	77–78
36.	H	$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\   \\ -\text{CH} \\   \\ \text{CF}_3 \end{array}$	H	H	H	Cl	H	94–95
37.	H	$\begin{array}{c} \text{CH}_2\text{F} \\   \\ -\text{C}-\text{CH}_3 \\   \\ \text{CH}_2\text{F} \end{array}$	F	H	H	H	F	119–120
38.	H	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	H	F	Cl	H	Cl	80–81
39.	H	$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\   \\ -\text{CH}_2-\text{CH} \\   \\ \text{CCl}_2\text{F} \end{array}$	H	F	Cl	H	Cl	76–78
40.	H	$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\   \\ -\text{CH}_2-\text{CH} \\   \\ \text{CClF}_2 \end{array}$	H	H	H	H	Cl	98–99
41.	H	$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\   \\ -\text{CH} \\   \\ \text{CF}_3 \end{array}$	F	H	H	H	F	177–178

Példa száma	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	Op. (°C)
42.	H	$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\   \\ \text{-CH} \\   \\ \text{CF}_3 \end{array}$	H	H	H	H	F	82
43.	H	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	F	n <sub>D</sub> <sup>20</sup> : 1,4674
44.	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	F	67
45.	H	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	F	88
46.	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	F	n <sub>D</sub> <sup>20</sup> : 1,4655
47.	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	n <sub>D</sub> <sup>20</sup> : 1,4438
48.	H	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	116
49.	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	108
50.	H	$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\   \\ \text{-CH} \\   \\ \text{CF}_3 \end{array}$	H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	131
51.	CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	F	F	CF <sub>3</sub>	F	F	n <sub>D</sub> <sup>20</sup> : 1,4199
52.	H	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	F	F	CF <sub>3</sub>	F	F	118
53.	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	F	F	CF <sub>3</sub>	F	F	118
54.	H	$\begin{array}{l} \text{CH}_3 \\   \\ \text{-CH} \\   \\ \text{CF}_3 \end{array}$	F	F	CF <sub>3</sub>	F	F	124

*A (III) általános képletű kiindulási vegyületek előállítása*

*(III-1) példa*

*(5) képletű vegyület előállítása*

100 ml vízben szuszpendálunk 45 g (0,2 mól) N-(1,3-difluor-2-propil)-frálimidet, és hozzáadunk 200 ml tömény sósavoldatot, majd az oldatot 5 órán keresztül visszafolyató hűtő alatt hevítjük. Az oldat lehűlése után szilárd termék válik ki (ftálsav), amelyet leszűrünk, a szűrletet 20 %-os vizes nátronlúg oldattal extraháljuk, és az extraktumot magnézium-szulfáton szárítjuk. Az oldószer normál nyomáson ledesztilláljuk, majd a maradékot vízsugárszivattyús vákuum alkalmazásával fracionáljuk.

Ily módon 13,5 g (71 % kitermelés) 2-(1,3-difluor)-propil-amint állítunk elő. A termék forráspontja 30–34 °C/50 mbar.

n<sub>D</sub><sup>20</sup> : 1,3802.

*(IIIa-1) példa*

*(6) képletű vegyület előállítása*

40 g (0,4 mól) 1-amino-ciklopropán-karbonsavat 100 g SF<sub>4</sub>-gyel és 50 ml hidrogén-fluoriddal 8 órán keresztül egy V4A-keverő autoklávban 120

°C hőmérsékleten adott nyomáson (25–30 bar) átalakítjuk. Az illékony alkotókat ledesztilláljuk, majd 45 %-os nátronlúg oldattal a lúgos pH-t beállítjuk, és a terméket vízsugárszivattyúval desztilláljuk, elválasztjuk. A desztillátum pH-ját tömény sósav oldattal savasra állítjuk.

Az oldatot bepároljuk és szárítjuk. Ily módon 40 g (62 % kitermelés) 1-trifluor-metil-ciklopropil-amin-hidrokloridot kapunk. A termék olvadáspontja 260 °C.

*(IIIa-2) példa*

*(7) képletű vegyület előállítása*

A (IIIa-1) példában kapott 32,4 g (0,2 mól) 1-trifluor-metil-ciklopropil-amin-hidrokloridhoz csepegtetünk körülbelül 15 perc alatt 80–90 °C-os olajfürdőn 44 g (0,22 mól) 20 %-os vizes nátronlúg oldatot. Egyidejűleg a felszabaduló amint ledesztilláljuk. Az elegyet magnézium-szulfáton szárítjuk, és újból ledesztilláljuk.

Ily módon 22 g (89 % kitermelés) 1-trifluor-metil-ciklopropil-amint állítunk elő. A termék törésmutatója n<sub>D</sub><sup>20</sup> : 1,3483.

A találmány szerinti eljárással előállított (I) általános képletű új vegyületek kedvező melegvérű

toxicitását a következő összehasonlító értékekkel szemléltetjük:

*A példa*

*LD<sub>50</sub>-érték meghatározása patkányoknál (orális alkalmazás)*

Hatóanyag	LD <sub>50</sub> (mg hatóanyag/ testtömeg kg)
Fenamiphos (kereskedelmi név) „A” képletű technika állásából ismert vegyület	10–20
(1) képletű, a találmány szerinti eljárással előállított termék	>1000

Az értékeket a szokásos módon állapítottuk meg. A hatóanyagokat polietilén-glikolban oldottuk (LUTROL, BASF AG védjegy, Ludwigshafen, NSZK), és az oldatot a patkányoknak gégeszondán keresztül adagoltuk.

*B példa*

*Határkoncentráció vizsgálat*

Vizsgálati nematodok: *Globodera rostochiensis*

Oldószer: 3 tömegrész aceton

Emulgeátor: 1 tömegrész alkil-aril-poliglikol-éter

Célszerű hatóanyagkészítmény előállításához összekeverünk 1 tömegrész hatóanyagot megadott mennyiségű oldószerrel és emulgeátorral, és a koncentrátumot vízzel kívánt mértékben meghígítjuk.

A hatóanyagkészítményt a vizsgálati nematodokkal erősen fertőzött talajjal alaposan összekeverjük. A készítményben lévő hatóanyagkoncentrációnak gyakorlatilag nincs szerepe, döntő a térfogategységnyi talajra jutó hatóanyag mennyisége (ppm). A kezelt talajokat cserepekbe töltjük, burgonyapalántákkal beültetjük, és a cserepeket 18 °C hőmérsékletű üvegházban tartjuk.

6 hét múlva a burgonyagyökereket ciszta képződésre vizsgáljuk, és meghatározzuk a hatóanyag százalékos hatását. A hatás 100 %-os, ha teljes mértékben megakadályoztuk a pusztulást, 0 %-os, ha ugyanolyan mértékű károsodást tapasztalunk, mint a kezeletlen kontroll növényeknél, de azonos módon fertőzött talaj esetében.

Ebben a vizsgálatban például 2,5, 5 illetve 10 ppm hatóanyagkoncentráción az 1., 5., 29. és 33. előállítási példákban feltüntetett, a találmány szerinti eljárással kapott vegyületet tartalmazó készítmények, valamint az A ismert vegyület 95 %-os hatást mutatott.

*C példa*

*Határkoncentráció vizsgálat/nematodák esetében*

Vizsgált nematodák: *Meloidogyne incognita*

Oldószer: 3 tömegrész aceton

Emulgeátor: 1 tömegrész alkil-aril-poliglikol-éter

Célszerű hatóanyagkészítmény előállításához összekeverünk 1 tömegrész hatóanyagot megadott mennyiségű oldószerrel, hozzáadjuk a megadott mennyiségű emulgeátort, és a koncentrátumot vízzel kívánt mértékben meghígítjuk. A hatóanyagkészítményt a vizsgált nematodokkal erősen fertőzött talajjal

alaposan összekeverjük. A készítményben lévő hatóanyagkoncentrációnak nincs szerepe, döntő a térfogat egységnyi talajra jutó hatóanyag mennyisége (ppm). A kezelt talajt cserepekbe töltjük, salátát ültetünk bele, és a cserepeket 27 °C hőmérsékleten üvegházban tartjuk.

4 hét múlva a saláta gyökereket a nematodák károsító hatására vizsgáljuk, és meghatározzuk a hatóanyag százalékos hatását. A vizsgálatban 100 %-os a hatás, hogyha teljes mértékben megakadályoztuk a károsodást, és 0 %-os, ha ugyanolyan károsodást tapasztaltunk, mint a kezeletlen kontroll növényeknél, azonos módon fertőzött talaj esetében.

Ebben a vizsgálatban például 1,25 ppm–10 ppm hatóanyagkoncentráción az 1., 6., 29. és 33. példaszámú, találmány szerinti eljárással előállított vegyületeket tartalmazó készítmények és az A ismert vegyületek 95 %-os hatást mutattak.

20 *Formálási példák*

*1. Példa*

*Porozószer*

5 tömegrész, 1. példa szerinti hatóanyagot 95 tömegrész természetes közetzúzávalékkal elegyítünk, majd az elegyet finom porrá őröljük.

Az így kapott készítményt a növényekre és ezek életterére felpermetezzük.

30 *2. Példa*

*Diszpergálható porkészítmény*

50 tömegrész 6. példa szerinti hatóanyagot 1 tömegrész dibutil-naftalinszulfonáttal, 4 tömegrész ligninszulfonáttal, 8 tömegrész nagydiszperzitású szilícium-dioxiddal, továbbá 37 tömegrész természetes közetliszttel elegyítünk, majd az elegyet porrá őröljük.

A kapott nedvesíthető port kívánt mennyiségű vízzel meghígítjuk.

40 *3. Példa*

*Emulgeálható koncentrátum*

25 tömegrész 1. példa szerinti hatóanyagot 55 tömegrész xilol és 10 tömegrész ciklohexanon elegyében feloldunk. Ezt követően emulgeátorként 10 tömegrész, dodecil-benzolszulfonsavas-calciumból és nonilfenol-poli(glikol-éter)-ből álló elegyet adunk az oldathoz. Felhasználás előtt az emulzió-koncentrátumot kívánt mennyiségű vízzel meghígítjuk.

50 *4. Példa*

*Granulátum*

91 tömegrész, 0,5–1,0 mm szemcseméretű homokot, 2 tömegrész orsóolajat és 7 tömegrész hatóanyag-elegyet összekeverünk. A hatóanyag-elegyet 75 tömegrész 5. példa szerinti hatóanyagot és 25 tömegrész természetes közetzúzávalékot tartalmaz. Az elegyet keverőben addig kezeljük, amíg jól gördülő és nem porló granulátumot nem kapunk. A granulátumot kívánt mennyiségben a növényekre vagy ezek életterére felszórjuk.

55 *5. Példa*

*Diszpergálható por*

Célszerű hatóanyagkészítmény előállításához összekeverünk 90 tömegrész 1. példa szerinti ható-

anyagot 1 tömegrész dibutil-naftalinszulfonáttal, 5 tömegrész nátrium-ligninszulfonáttal, 2 tömegrész nagy diszperzításfokú kovasavval, 2 tömegrész természetes közetliszttel és a keveréket porrá őröljük. Alkalmazás előtt a kapott nedvesíthető port annyi vízzel keverjük el, hogy a keverék a hatóanyagot a kívánt koncentrációban tartalmazza.

#### SZABADALMI IGÉNYPONTOK

1. Nematocid készítmények, amelyekben szilárd vagy folyékony vivőanyagok, így célszerűen közetpor, finoman elporított homok, kovasav, xilol és ciklohexanon elegy vagy víz, továbbá adott esetben felületaktív anyag, így célszerűen ligninszulfonát vagy dodecyl-benzolszulfonsav-kalciumsó és nonilfenol-poliglikol-éter van, *azzal jellemezve*, hogy hatóanyagként 0,001–95 tömeg% mennyiségben legalább egy (I) általános képletű N-helyettesített benzamid-származékot – a képletben

$R^1$  jelentése hidrogénatom vagy 1–4 szénatomos alkilcsoport,

$R^2$  jelentése halogénatommal háromszorosan helyettesített 1–4 szénatomszámú alkil- vagy trifluor-metil-csoporttal egyszeresen helyettesített 3–6 szénatomos cikloalkilcsoport,

$R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  és  $R^7$  legfeljebb négy szubsztituensnél hidrogénatom és egy vagy két szubsztituensnél halogénatom – tartalmaz.

2. Eljárás a (I) általános képletű N-helyettesített benzamid-származékok előállítására – az (I) általános képletben

5  $R^1$  jelentése hidrogénatom vagy 1–4 szénatomszámú alkilcsoport,

$R^2$  jelentése halogénatommal 1–3-szorosan helyettesített 1–6 szénatomszámú alkilcsoport, trifluor-metil-csoporttal egyszeresen helyettesített 3–6 szénatomos cikloalkilcsoport,

10  $R^3$ – $R^7$  jelentése hidrogénatom, továbbá egy trifluor-metil-csoport és/vagy 1–5 halogénatom, vagy egy nitro- vagy egy 1–4 szénatomos alkilcsoport, vagy egy  $-\text{CONR}^1\text{R}^2$  általános képletű csoport, amelyben

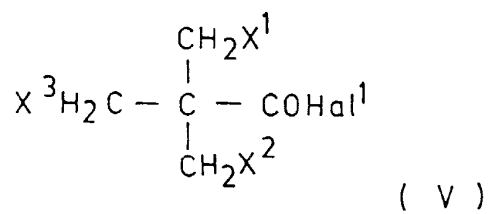
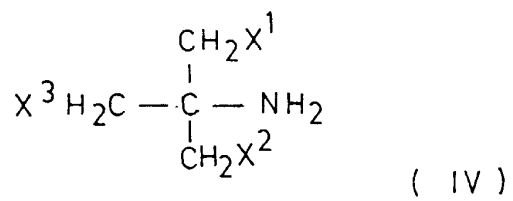
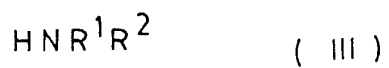
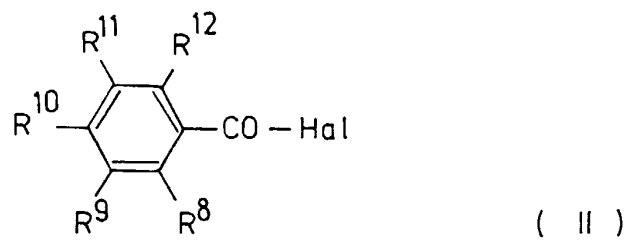
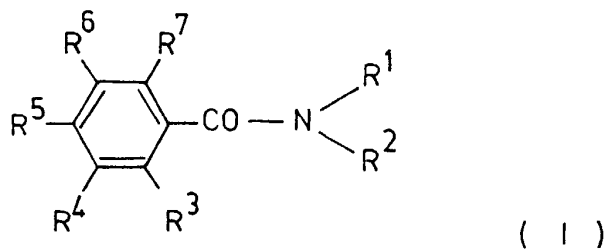
15  $R^1$  jelentése hidrogénatom,

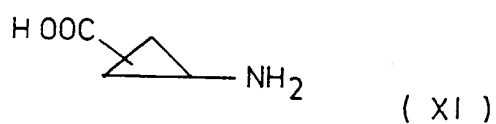
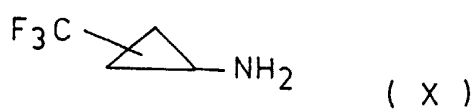
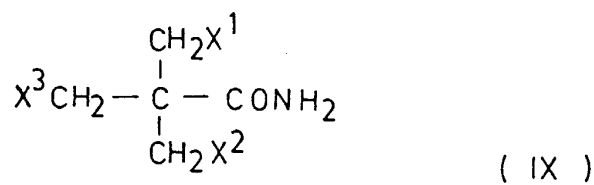
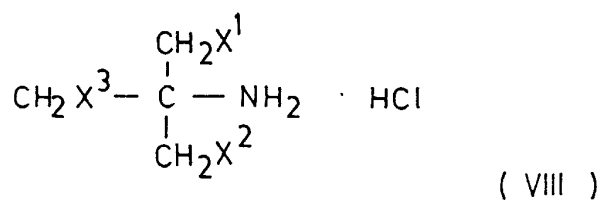
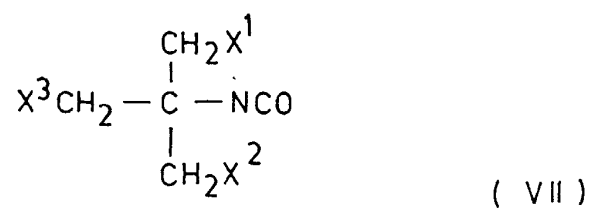
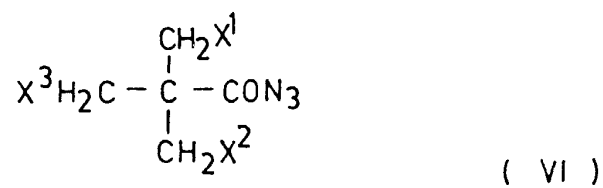
$R^2$  jelentése halogénatommal háromszorosan helyettesített 1–4 szénatomos alkilcsoport,

20 *azzal a megkötéssel*, hogyha  $R^2$  jelentése monohalogén-etilcsoport, akkor  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  és  $R^7$  közül legalább az egyik szubsztituens jelentése hidrogénatomtól eltérő, *azzal jellemezve*, hogy egy (II) általános képletű benzoil-halogenid – a képletben  $R^8$ ,  $R^9$ ,  $R^{10}$ ,  $R^{11}$  és  $R^{12}$  jelentése  $R^3$ – $R^7$  jelentésére a fentiekben megadottal azonos, vagy egyikük  $-\text{CO}-\text{Hal}$  általános képletű csoportot is jelenthet, ahol Hal

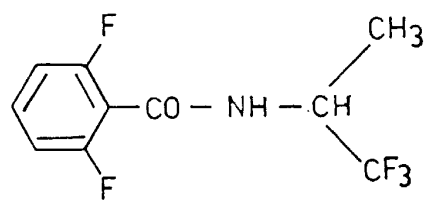
25 jelentése halogénatom – egy (III) általános képletű aminnal – a képletben  $R^1$  és  $R^2$  jelentése az (I) általános képletnél megadottal azonos, illetve e vegyület hidrogén-halogenid-sójával reagáltatunk.

4/1

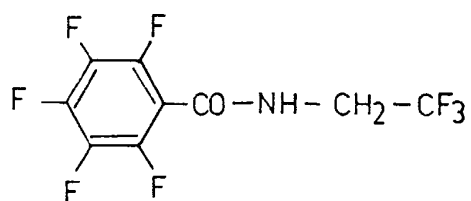




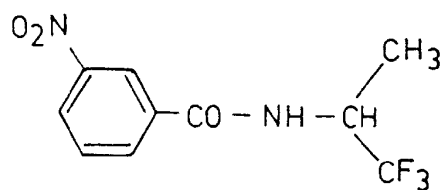
4/3



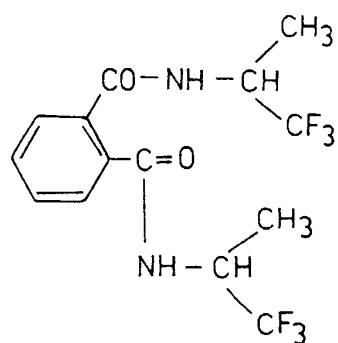
( 1 )



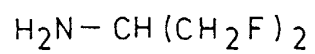
( 2 )



( 3 )



( 4 )



( 5 )

