

ORSZÁGOS  
TALÁLMÁNYI  
HIVATAL

# SZABADALMI LEÍRÁS

(11)  
**182 642**

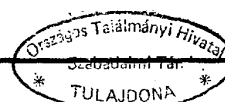
A bejelentés napja: (22) 23. 09. 77. (21) BA—3587)

A bejelentés elsőbbsége: (33) DE: (32) 25. 09. 76. (31)  
(P 26 43 262.2) (32) 14. 02. 77. (31) (P 27 06 127.4)

Megjelent: 1986. június 30.

Nemzetközi  
osztályozás:

(51) NSZÖ;  
A 01 N 57/16;  
C 07 F 9'65;  
C 07 F 9/24;  
C 07 F 9'38



Feltaláló(k):

(72) Dr. MAURER Fritz, vegyész, Dr. SCHRÖDER Rolf, vegyész,  
Wuppertal, Dr. HAMMANN Ingeborg, zoológus, Köln, Dr. BEHRENSZ  
Wolfgang, parazitológus, Overath, Dr. HOMEYER Bernhard, biológus,  
Leverkusen, DE

Szabadalmas:

(73) Bayer AG., Leverkusen, DE

**(54) (Pirimidin-5-il)-(tion)(tiol) foszfor(foszfonsav)-észtereket, illetve -észter-amidokat tartalmazó inszekticid, akaricid és nematocid készítmények és eljárás a hatóanyagok előállítására**

1

2

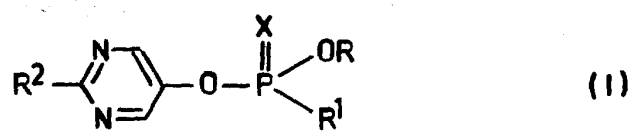
(57) Kivonat

A találmány inszekticid, akaricid és nematocid hatású készítményekre vonatkozik. A készítmények hatóanyagként valamely (I) általános képletű (pirimidin-5-il)-(tion)-(tiol)foszfor(foszfonsav)-észtert, illetve -észter-amidot — az (I) általános képletben  
R 1—4 szénatomos alkilcsoportot  
R<sup>1</sup> 1—4 szénatomos alkil-, 1—4 szénatomos alkoxi-  
csoportot, fenilcsoportot vagy az alkilrészben 1—4  
szénatomot tartalmazó alkil-amino-csoportot és  
R<sup>2</sup> 1—4 szénatomos alkilcsoportot, fenilcsoportot  
vagy hidrogénatomot jelent, míg  
X jelentése oxigén- vagy kénatom —  
tartalmaznak 0,1—95 súly% mennyiségben, szilárd  
hordozóanyagok, előnyösen természetes és mesterséges  
kőporok és/vagy folyékony vivőanyagok, előnyösen  
ásványolaj frakciók vagy aromás szénhidrogének, va-  
lamint felületaktív anyagok, előnyösen alkil-aril-poli-  
(glikol-éter) mellett.

Az (I) általános képletű vegyületeket (tion)(tiol)-  
foszfor(foszfonsav)-észter-halogenidek, illetve -észter-  
amid-halogenidek és a megfelelően helyettesített 5-hid-  
roxi-pirimidin-származékok reagáltatása útján állítják  
elő.

182 642

1



A találmány új (pirimidin-5-il)-(tion)(tiol)-foszfor(foszfon)sav-észtereket, illetve -észter-amidokat tartalmazó inszekticid, akaricid és nematocid készítményekre és a hatóanyagok előállítására vonatkozik.

Ismeretes, hogy a primidin-6-il-(tion)(tiol)-foszfor(foszfon)sav-észterek, így például a 0,0-dietil-0-(2-izopropil-4-metil-pirimidin-6-il)-, illetve az 0-etil-S-(n-propil)-0-(2-izopropil-4-metil-pirimidin-6-il)-tiol-tion foszforsav-észter és az 0-etil-0-(2,4-dimetil-pirimidin-6-il)-tionetanfoszfonsav-észter inszekticid és akaricid tulajdonságokkal rendelkeznek (2 754 243 sz. amerikai egyesült államokbeli szabadalmi leírás, 2 360 877 sz. NSZK-beli közrebocsátási irat, 2 360 877 sz. NSZK-beli közzétételi irat).

Azt találtuk, hogy az új (I) általános képletű (pirimidin-5-il)-(tion)(tiol)foszfor(foszfon)sav-észterek, illetve -észter-amidok — az (I) általános képletben

R<sup>1</sup> 1—4 szénatomos alkilsoportot,

R<sup>1</sup> 1—4 szénatomos alkil-, 1—4 szénatomos alkoxi-csoportot, fenilcsoportot vagy az alkilrészben 1—4 szénatomot tartalmazó alkil-amino-csoportot és

R<sup>2</sup> 1—4 szénatomos alkilsoportot, fenilcsoportot vagy hidrogénatomot jelent, míg

X jelentése oxigén- vagy kénatom —

kiváló inszekticid, akaricid és nematocid hatást mutatnak.

Azt találtuk továbbá, hogy az új (I) általános képletű (pirimidin-5-il)-(tion)(tiol)foszfor(foszfon)sav-észtereket, illetve -észter-amidokat úgy állíthatjuk elő, hogy (II) általános képletű (tion)(tiol)foszfor(foszfon)sav-észter-halogenideket, illetve -észter-amid-halogenideket — a (II) általános képletben R, R<sup>1</sup> és X jelentése a fenti és Hal halogénatomot, előnyösen klóratomot jelent — (III) általános képletű 5-hidroxi-pirimidin-származékokkal — a (III) általános képletben R<sup>2</sup> jelentése a fenti — adott esetben valamilyen oldó- vagy hígítószer jelenlétében reagáltatunk.

A reakciót adott esetben savmegkötő szer jelenlétében folytatjuk le.

A találmány értelmében előállított (pirimidin-5-il)-(tion)(tiol)foszfor(foszfon)sav-észterek, illetve -észter-amidok meglepő módon jobb inszekticid, akaricid és nematocid hatást mutatnak, mint a hasonló szerkezetű és azonos hatásirányú ismert pirimidin-6-il-tion-(tiol)foszfor(foszfon)sav-észterek. A találmány szerinti eljárással előállítható vegyületek tehát haladást jelentenek az adott szakterületen.

Amennyiben kiindulási anyagként például 0-etil-S-(n-propil)-(tion)(tiol)foszforsav-diészter-kloridot és 4-metil-5-hidroxi-piridint használunk, a lejátszódó reakciót a csatolt reakcióvázlattal szemléltethetjük.

A kiindulási anyagként használható (II) általános képletű (tion)(tiol)foszfor(foszfon)sav-észterek, illetve -észter-amidok ismertek és az irodalomból ismert eljárásokkal ipari méretben is jól előállíthatók. Példaképpen a következő konkrét vegyületeket említjük meg: 0,0-dimetil-, 0,0-dietil-, 0,0-di(n-propil)-, 0,0-diizopropil-, 0,0-di(n-butil)-, 0,0-diizobutil-, 0,0-di(szek-butil)-, 0-metil-0-etil-, 0-metil-0-(n-propil)-, 0-metil-0-izopropil-, 0-metil-0-(n-butil)-, 0-metil-0-izobutil-, 0-metil-0-

(szek-butil)-, 0-etil-, 0-(n-propil)-, 0-etil-0-izopropil-, 0-etil-0-(n-butil)-, 0-etil-0-(szek-butil)-, 0-etil-0-izobutil-, 0-(n-propil)-0-butil-, illetve 0-izopropil-0-butil-foszforsav-diészter-klorid, továbbá az 0,S-dimetil-, 0,S-dietil-, 0,S-di(n-propil)-, 0,S-diizopropil-, 0,S-di(n-butil)-, 0,S-diizobutil-, 0-etil-S-(n-propil)-, 0-etil-S-(n-butil)-, 0-etil-S-(szek-butil)-, 0-(n-propil)-S-etil-, 0-(n-propil)-S-izopropil-, 0-(n-butil)-S-(n-propil)- és 0-(szek-butil)-S-etil-tiolfoszforsav-diészter-klorid, továbbá 0-metil-0-etil-, 0-(n-propil)-, 0-izopropil-0-(n-butil-, 0-izobutil-, illetve 0-(szek-butil)-metán-, illetve -etán-, (n-propán)-, -izopropán-, -(n-bután)-, izobután-, -(szek-bután)-, illetve -fenil-foszforsav-észter-klorid és a megfelelő tio-analógok, és 0-metil-N-metil-, 0-metil-N-etil-, 0-metil-N-(n-propil)-, 0-metil-N-izopropil-, 0-etil-N-metil-, 0-etil-N-etil-, 0-etil-N-(n-propil)-, 0-etil-N-izopropil-, 0-(n-propil)-N-metil-, 0-(n-propil)-N-etil-, 0-(n-propil)-N-(n-propil)-, 0-(n-propil)-N-izopropil-, 0-izopropil-N-metil-, 0-izopropil-N-etil-, 0-izopropil-N-(n-propil)-, 0-izopropil-N-izopropil-, 0-(n-butil)-N-metil-, 0-(n-butil)-N-(n-propil)-, 0-(n-butil)-N-izopropil-, 0-izobutil-N-metil-, 0-izobutil-N-etil-, 0-izobutil-N-(n-propil)-, 0-izobutil-N-izopropil-, 0-(szek-butil)-N-metil-, 0-(szek-butil)-N-etil-, 0-(szek-butil)-N-(n-propil)- és 0-(szek-butil)-N-izopropil-foszforsav-monoészteramid-klorid.

A kiindulási anyagként használható (III) általános képletű 5-hidroxi-pirimidin származékok részben új vegyületek, előállításuk azonban az irodalomból ismert eljárásokkal történhet.

Példaképpen a következő vegyületeket nevezzük meg: 5-hidroxi-pirimidin, 2-fenil-, illetve 2-metil-, 2-etil-, 2-n-propil-, 2-izopropil-, 2-(n-butil)-, 2-izobutil-, 2-(szek-butil)-, 2-(terc-butil)-5-hidroxi-pirimidin.

Az (I) általános képletű új vegyületek előállítására szolgáló eljárást előnyösen alkalmas oldószerek, illetve hígító anyagok jelenlétében hajtjuk végre. Erre a célra gyakorlatilag bármely inert szerves oldószer számításba jöhet. Ide tartoznak különösen az alifás és aromás, adott esetben klórozott szénhidrogének, mint például a benzol, toluol, xilol, benzin, metilén-klorid, kloroform, széntetraklorid, klór-benzol vagy különféle éterek, például dietil- vagy dibutil-éter, dioxán, továbbá ketonok, például aceton, metil-etil-, metil-izopropil- és metil-izobutil-eton, ezen kívül a nitrilek, mint az aceto- és propionitril.

Savakceptorként valamennyi szokásos savmegkötő szer alkalmazásra kerülhet. Különösen alkalmasak a alkálifém-karbonátok és -alkoholátok, úgy mint a nátrium- és kálium-karbonát, -metilát, illetve -etilát, továbbá az alifás, aromás vagy heterociklusos aminok, például a trietil-amin, trimetil-amin, dimetil-anilin, dimetil-benzil-amin és a piridin.

A reakcióhőmérséklet széles tartományban változtatható. Általában 0 és 100 °C, előnyösen 20 és 60 °C között hajtjuk végre a reakciót.

A reagáltatást általában légköri nyomáson végezzük.

A reakció során a reagenseket többnyire ekvimoláris mennyiségekben alkalmazzuk. Egyik vagy másik kom-

ponens feleslegben való alkalmazása nem jár lényeges előnyökkel. A reagenseket többnyire a korábban felsorolt oldószerek valamelyikében, egy savakceptor jelenlétében egyesítjük és az elegyet a reakció teljessé tétele érdekében magasabb hőmérsékleten egy vagy több órán át keverjük. Ezután az elegyet egy szerves oldószerral, például toluollal megbontjuk, és a szerves fázist szokásos lépésekkel, mosással, szárítással, az oldószert maradványainak ledesztillálásával dolgozzuk fel.

Az új vegyületek olajos formában válnak ki, és többnyire nem desztillálhatók bomlás nélkül. Tisztításukat úgy végezzük, hogy a vegyületeket csökkentett nyomáson, mérsékelt emelt hőmérsékleten hosszabb időn át melegítjük. Ez a kezelés megszabadítja a terméket a jelenlevő illékony szennyeződésektől. A visszamaradó anyag jellemzésére a törésmutató szolgál.

Mint már többször említettük, az új (I) általános képletű (pirimidin-5-il)-(tiono)(tiol)foszfor(foszfonsav)-észterek, illetve -észter-amidok kiváló inszekticid, akaricid, illetve nematocid hatásukkal tűnnek ki. Ennek következtében kiválóan alkalmazhatók a növényvédelemben, az egészségvédelemben és a raktározott készletek védelme, valamint az állatgyógyászat területén is. A vegyületek kevésbé fitotoxikusak és jó hatást mutatnak szívó- és rágó rovarokkal, valamint atkákkal szemben egyaránt.

A vegyületek fenti előnyös tulajdonságai következtében igen előnyösen felhasználhatók a növényvédelemben, az egészségvédelemben, a raktározott készletek védelme és az állatgyógyászat területén alkalmazott készítmények komponenseiként.

A vegyületek a növények számára igen jól elviselhetők. Különösen az állati kártevők, így rovarok, pókok, atkák elpusztítására a mezőgazdaságban, erdőgazdaságban, a raktározott készletek védelmében és az anyagvédelem területén való felhasználásnál fontos, hogy igen kedvező a melegvérű toxicitásuk. A vegyületek a normál és rezisztens törzsekkel, valamint valamennyi fejlődési stádiumban levő rovarokkal szemben hatásosak. A fenti kártevőkhöz tartoznak a következők:

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

A Diplopoda rendből például: *Balanulus gutturalis*.

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*, *Grylotalpa* 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., *Damalinea* spp.,

5 A Thysanoptera rendből például: *Hercinothrips femoralis*, *Thrips tabaci*.

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

10 A homoptera rendből például: *Aleurodes brassicae*, *Bemisia tabaci*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Aphis gossypii*, *Brevicoryne brassicae*, *Cryptomyzus ribis*, *Doralis 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.

20 A Lepidoptera rendből például: *Pectinophora gossypiella*, *Bupalus piniarius*, *Cheimatobia brumata*, *Lithocolletis blancardella*, *Hyponomeuta padella*, *Plutella maculipennis*, *Malacosoma neustria*, *Euproctis chrysorrhoea*, *Lymantria* spp., *Bucculatrix thurberialla*, 25 *Phyllocnistis citrella*, *Agrotis* spp., *Euxoa* spp., *Feltia* spp., *Earias insulana*, *Heliothis* spp., *Laphygma exigua*, *Mamestra brassicae*, *Panolis flammea*, *Prodenia litura*, *Spodoptera* spp., *Trichoplusia ni*, *Carpocapsa pomonella*, *Pieris* spp., *Chilo* spp., *Pyrausta nubilalis*, 30 *Ephestia kuehniella*, *Galleria mellonella*, *Cacoecia podana*, *Capua reticulana*, *Choristoneura fumiferana*, *Clysia ambiguella*, *Homona magnanima*, *Tortrix viridana*.

A Coleoptera rendből például: *Anobium punctatum*,

35 *Rhizophthera dominica*, *Bruchidius obtectus*, *Acanthoscelides obtectus*, *Hypotrupes bajulus*, *Agelastica alni*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Phaedon cochleariae*, *Diabrotica* spp., *Psylliodes chrysocephala*, *Epilachna varivestis*, *Atomaria* spp., *Oryzaephilus surinamensis*, 40 *Anthonomus* spp., *Sitophilus* spp., *Otiorrhynchus sulcatus*, *Cosmopolites sordidus*, *Ceuthorrhynchus assimilis*, *Hypera postica*, *Dermestes* spp., *Trogoderma* spp., *Anthrenus* spp., *Attagenus* spp., *Lyctus* spp., *Meligethes aeneus*, *Ptinus* spp., *Niptus hololeucus*, 45 *Gibbium psyllodes*, *Tribolium* spp., *Tenebrio molitor*, *Agriotes* spp., *Conoderus* spp., *Melolontha melolontha*, *Amphimallon solstitialis*, *Costelytra zealandica*.

A Hymenoptera rendből például: *Diprion* spp., *Hopllocampa* spp., *Lasius* spp., *Monomorium pharaonis*, *Vespa* spp.

50 A Diptera rendből például: *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Drosophila melanogaster*, *Musca* spp., *Fannia* spp., *Calliphora erythrocephala*, *Lucilia* spp.,

55 *Chrysomya* spp., *Cuterebra* spp., *Gastrophilus* spp., *Hyppobosca* spp., *Stomoxys* spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Tabanus* spp., *Tannia* spp., *Bibio hortulanus*, *Oscinella frit*, *Phorbia* spp., *Pegomya hyoseyami*, *Ceratitis capitata*, *Dacus oleae*, 60 *Tipula paludosa*.

A Siphonaptera rendből például: *Xenopsylla cheopis*, *Ceratophyllus* spp.

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

Az Acarina rendből például: *Acarus siro*, *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Eriophyes* spp., *Phyllocoptura oleivora*, *Boophilus* spp., *Rhipicephalus* spp., *Amblyomma* spp., *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Sarcoptes* spp., *Tarsonemus* spp., *Bryobia praetiosa*, *Panonychus* spp., *Tetranychus* spp.

A növényparazita nematodák közé tartoznak: *Pratylenchus* spp., *Radopholus similis*, *Ditylenchus dipsaci*, *Tylenchulus semipenetrans*, *Heterodera* spp., *Meloidogyne* spp., *Aphelenchoides* spp., *Longidorus* spp., *Xiphinema* spp., *Trichodorus* spp.

A vegyületek felhasználása kereskedelmi forgalmazásra alkalmas készítmények és/vagy az ezekből készült felhasználási formák alakjában történik.

A vegyületek %-os mennyisége a kereskedelmi forgalmazásra kerülő készítményekből készült felhasználási formákban igen széles tartományon belül változtatható. Így koncentrációjuk terjedhet 0,00000001 súly%-tól 99,9 súly%-ig, előnyösen azonban a 0,01—10 súly% tartományban mozog.

A felhasználás maga is felhasználási formától függően megválasztott, szokásos módon történik.

A higiénia és raktározott készletek védelme területén a vegyületek azzal tűnnek ki, hogy kiváló maradékhatóást mutatnak fa- és agyagfelületeken és jó alkális stabilitást meszelt felületeken.

A fentiek alapján tehát az új vegyületek szokásos készítményekké, így oldatokká, emulziókká, permetporokká, szuszpenziókká, porokká, porozószerrekké, habokká, pasztákká, oldható porokká, granulátumokká, aeroszol készítményekké, szuszpenziós-emulziós koncentrátumokká, csávázószerrekké, a vegyületekkel impregnált természetes és szintetikus alapanyagú készítményekké, polimer anyagokkal és töltőanyagokkal csávázási célokra készült finom kapszulákká, valamint elegetésre szánt készítményekké, így például füstpatronokká, -dózisokká, -spirálokká szerelhetők ki, ezenkívül ULV-hideg és melegköd-készítmények is előállíthatók felhasználásukkal.

A készítmények előállítása ismert módon történik, például úgy, hogy a hatóanyagokat elkeverjük inert adalékanyagokkal, tehát folyékony oldószerekkel, nyomás alatt álló cseppfolyósított gázokkal és/vagy szilárd vivőanyagokkal, adott esetben felületaktív szerek, tehát emulgeálószeres és/vagy diszpergálószeres és/vagy habzást elősegítő szerek felhasználása mellett. Ha vizet használunk inert adalékanyagként, szerves oldószerek is felhasználhatók segédoldószerként. Folyékony oldószerként főként a következő vegyületek jönnek számításba: aromás vegyületek, mint a xilol, toluol vagy alkil-naftalin; klórozott aromás szénhidrogének, mint a klór-benzol, klór-etilén vagy metilén-klorid; alifás szénhidrogének, mint a ciklohexán vagy paraffinok, például kőolaj-frakciók; alkoholok, mint a butanol vagy glikol,

valamint ezek étereit és észtereit; ketonok, így az acetone, metil-etil-keton, metil-izobutil-keton vagy ciklohexanon; erősen poláros oldószerek, mint a dimetil-formamid és dimetil-szulfoxid, valamint víz.

Cseppfolyósított gázalmazállapotú adalék- vagy vivőanyagok alatt olyan folyadékokat értünk, amelyek szobahőmérsékleten és légköri nyomáson gázalakúak, például aeroszolos vivőgázokat, úgy mint a halogénezett szénhidrogének valamint bután, propán, nitrogén és szén-dioxid. Szilárd vivőanyagok, például a természetes kőzetlisztek, mint a kaolin, agyagok, talkum, kréta, kvarc, attapulgit, montmorillonit vagy diatomaföld és mesterséges kőzetlisztek, mint a nagy-diszperzítási kovasav, alumínium-oxid és szilikátok.

Granulátumok számára alkalmas szilárd hordozóanyagok például a megtört és frakcionált természetes kőzetek, mint a kálcit, márvány, csillámok, szepiolit, dolomit, valamint a szintetikus granulátumok, amelyek szerves és szerves lisztekkel készülhetnek, ezenfelül a szerves anyagokból készült granulátumok, úgy mint a magliszt, kakaóbabhéj, kukoricacső és dohányszár.

Emulgeáló és/vagy habzásnövelő szerek például a következők: nem-ionos és anionos emulgeátorok, mint a poli(oxi-etilén)-zsírsav-észterek, poli(oxi-etilén)-zsíralkohol-éterek, például az alkil-aril-poli(glikol-éterek), alkil-szulfonátok, alkil-szulfátok, aril-szulfonátok, valamint a fehérje hidrolizátumok.

Diszpergálószeresek például a következők lehetnek: lignin, szulfitszennylugok és metil-cellulóz.

A készítmények a fentiekén kívül tartalmazhatnak még a tapadást elősegítő anyagokat, így karboximetil-cellulózt; természetes és szintetikus, por alakú, szemcsés és latex alakú polimereket, például gumiarábitumot, poli(vinil-alkohol)t, poli(vinil-acetát)ot.

Színezőanyagok, így szerves és szervetlen színezékek, például vas-oxid, titán-oxid, berlini kék és szerves színezékek, úgy mint az alizarin típusú, azo-fém-ftalocianin-típusú színezékek és nyomnyi mennyiségű tápanyagok, mint vas-, mangán-, bór-, réz-, kobalt-, molibdén- és cink-sók is alkalmazhatók a készítményekben.

A készítmények általában 0,1—95 súly% hatóanyagot, előnyösen 0,5—90 súly% hatóanyagot tartalmaznak.

#### A) példa

Phaedon lárva próba  
Oldószer: 3 súlyrész acetone  
Emulgeátor: 1 súlyrész alkil-aril-poli(glikol-éter)  
Alkalmas készítmény előállítása céljából 1 súlyrész hatóanyagot elkeverünk a fenti mennyiségű oldószerekkel, amely a fenti mennyiségű emulgeátort tartalmazza. Az így kapott koncentrátumot vízzel a kívánt koncentrációra hígítjuk.  
A hatóanyagkészítménnyel káposztaleveleket (*Brassica oleracea*) csomóvizesre permetezünk és a növényeket torma levélbogarak lárváival (*Phaedon Cochleariae*) fertőzzük meg.

Adott idő múlva meghatározzuk a %-os pusztulási fokot. 100% a pusztulási fok, ha valamennyi bogárlárva elpusztult, mint 0% azt jelenti, hogy egyetlen bogárlárva sem pusztult el.

A hatóanyagokat, hatóanyagkoncentrációkat, kiértékelési időket és a kapott eredményeket a következő 1. táblázatban adjuk meg.

1. táblázat

| Hatóanyag                      | Ható-<br>anyag-<br>koncent-<br>ráció<br>(%) | Pusztulási<br>fok<br>(%)<br>3 nap<br>után |
|--------------------------------|---------------------------------------------|-------------------------------------------|
| 1 képletű vegyület<br>(ismert) | 0,01<br>0,001                               | 100<br>0                                  |
| 2 képletű vegyület<br>(ismert) | 0,01<br>0,001                               | 100<br>0                                  |
| 3 képletű vegyület             | 0,01<br>0,001                               | 100<br>100                                |
| 4 képletű vegyület             | 0,01<br>0,001                               | 100<br>100                                |
| 5 képletű vegyület             | 0,01<br>0,001                               | 100<br>100                                |
| 6 képletű vegyület             | 0,01<br>0,001                               | 100<br>100                                |
| 7 képletű vegyület             | 0,01<br>0,001                               | 100<br>100                                |
| 8 képletű vegyület             | 0,01<br>0,001                               | 100<br>100                                |
| 9 képletű vegyület             | 0,01<br>0,001                               | 100<br>100                                |
| 10 képletű vegyület            | 0,01<br>0,001                               | 100<br>100                                |
| 11 képletű vegyület            | 0,01<br>0,001                               | 100<br>100                                |
| 12 képletű vegyület            | 0,01<br>0,001                               | 100<br>100                                |
| 13 képletű vegyület            | 0,01<br>0,001                               | 100<br>100                                |

## B) példa

Tetranychus próba (rezisztens)

Oldószer: 3 súlyrész acetone

Emulgeátor: 1 súlyrész alkil-aril-poli(glikol-éter)

Alkalmas készítmény előállítása céljából 1 súlyrész hatóanyagot elkeverünk a fenti mennyiségű oldószerrel, és a fenti mennyiségű emulgeátorral és a kapott koncentrátumot vízzel a kívánt koncentrációra hígítjuk.

A készítménnyel a közönséges fonóatkával vagy a babfonóatkával (*tetranychus urticae*) erősen meg-

fertőzött babnövényeket (*Phaseolus vulgaris*) csuromvizesre permetezzünk.

Adott idő után meghatározzuk a %-os pusztulást. 100% a pusztulási fok, ha valamennyi atka elpusztult, míg 0% azt jelenti, hogy egyetlen atka sem pusztult el.

A hatóanyagokat, hatóanyag koncentrációkat, kiértékelési időket és a kapott eredményeket a következő táblázatban adjuk meg.

2. táblázat

(Tetranychus próba)

| Hatóanyag                      | Ható-<br>anyag-<br>koncent-<br>ráció<br>(%) | Pusztulási<br>fok<br>(%)<br>2 nap<br>után |
|--------------------------------|---------------------------------------------|-------------------------------------------|
| 1 képletű vegyület<br>(ismert) | 0,1<br>0,01                                 | 95<br>0                                   |
| 2 képletű vegyület<br>(ismert) | 0,1<br>0,01                                 | 98<br>0                                   |
| 3 képletű vegyület             | 0,1<br>0,01                                 | 100<br>90                                 |
| 4 képletű vegyület             | 0,1<br>0,01                                 | 100<br>95                                 |
| 5 képletű vegyület             | 0,1<br>0,01                                 | 100<br>70                                 |
| 6 képletű vegyület             | 0,1<br>0,01                                 | 100<br>90                                 |
| 7 képletű vegyület             | 0,1<br>0,01                                 | 98<br>80                                  |
| 8 képletű vegyület             | 0,1<br>0,01                                 | 100<br>90                                 |
| 9 képletű vegyület             | 0,1<br>0,01                                 | 100<br>90                                 |

## C) példa

50 LD<sub>100</sub> próba

Vizsgált állatok: *Sitophilus granarius*

Oldószer: acetone

2 súlyrész hatóanyagot felveszünk 1000 térfogat-rész oldószerben. Az így kapott oldatot további oldó-  
55 szerrel a kívánt koncentrációra hígítjuk.

2,5 ml fenti módon elkészített oldatot Petri-  
csészébe pipetázunk, amelynek alját mintegy 9,5 cm  
átmérőjű szűrőpapír borítja. A Petri-csésze mind-  
addig nyitva marad, míg az oldószer teljesen el nem  
60 párolog. Az oldat koncentrációjától függően a szűrő-

papíron maradó hatóanyag-mennyiség a szűrőpapír 1 m<sup>2</sup>-ére számítva különböző. Ezután 25 vizsgálati állatot adunk a Petri-csészébe, amelyet ezután üveg tetővel fedünk be.

A kísérleti állatok állapotát 3 nappal a kísérlet megindítása után vizsgáljuk meg.

A hatóanyagokat, hatóanyag-koncentrációkat, kísérleti állatokat és a kapott eredményeket a következő 3. táblázatban adjuk meg.

3. táblázat

| Hatóanyag                    | Az oldat hatóanyag koncentrációja (%) | Pusztulási fok (%) |
|------------------------------|---------------------------------------|--------------------|
| 2 képletű vegyület (ismert)  | 0,002                                 | 0                  |
| 14 képletű vegyület (ismert) | 0,002                                 | 0                  |
| 6 képletű vegyület           | 0,002                                 | 100                |
| 7 képletű vegyület           | 0,002                                 | 100                |
| 10 képletű vegyület          | 0,002                                 | 100                |

D) példa

LD<sub>100</sub> próba

Kísérleti állatok: Blatta orientalis

Oldószer: acetone

2 súlyrész hatóanyagot felveszünk 1000 térfogatrész oldószerben. Az így kapott oldatot további oldószerrel a kívánt koncentrációra hígítjuk.

2,5 ml oldatot Petri-csészébe pipettázunk, amelynek alját egy mintegy 9,5 cm átmérőjű szűrőpapír borítja.

A Petri-csészét mindaddig állni hagyjuk, míg az oldószer teljesen el nem párolog. Az oldat koncentrációjától függően a szűrőpapír 1 m<sup>2</sup>-ére számított hatóanyagréteg különböző magas. Végül 25 kísérleti állatot juttatunk a Petri-csészébe, melyet ezután üveg tetővel befedünk.

A kísérleti állatok állapotát 3 nappal a kísérlet megindítása után vizsgáljuk meg.

A hatóanyagokat, hatóanyag-koncentrációkat, kísérleti állatokat és a kapott eredményeket a következő 4. táblázatban adjuk meg:

4. táblázat

(LD<sub>100</sub> próba Blatta orientalis)

| Hatóanyag                   | Az oldat hatóanyag koncentrációja (%) | Pusztulási fok (%) |
|-----------------------------|---------------------------------------|--------------------|
| 2 képletű vegyület (ismert) | 0,02                                  | 0                  |
| 6 képletű vegyület          | 0,02                                  | 100                |
| 7 képletű vegyület          | 0,002                                 | 100                |
| 10 képletű vegyület         | 0,02                                  | 100                |

E) példa

Határkoncentráció próba

Vizsgált nematoda: Meloidogyne incognita

Oldószer: 3 súlyrész acetone

Emulgeátor: 1 súlyrész alkil-aril-poli(glikol-éter)

Alkalmias készítmény előállítása céljából 1 súlyrész hatóanyagot elkeverünk a fenti mennyiségű oldószerrel, majd hozzáadjuk a fenti mennyiségű emulgeátort és a kapott koncentrátumot vízzel a kívánt koncentrációra hígítjuk.

A készítményt a vizsgált nematodákkal erősen megfertőzött talajjal bensőségesen elkeverjük. Így a hatóanyag koncentrációja a készítményben gyakorlatilag egyáltalán nem játszik szerepet, döntő csupán a talaj térfogategységére eső hatóanyag-mennyiség, amelyet ppm-ben adunk meg. A kezelt talajt edényekbe töltjük, salátát vetünk bele és az edényeket melegházban, 27 °C-os hőmérsékleten tartjuk.

Négy hét múlva megvizsgáljuk a saláta gyökerek nematoda fertőzöttségét és meghatározzuk a hatóanyag %-os hatásfokát. A hatásfok 100%, ha a fertőzöttséget teljes mértékben elkerüljük és 0%, ha a fertőzöttség éppen olyan mértékű, mint a kezeletlen, de egyébként azonos módon nevelt növényeken.

A hatóanyagokat, hatóanyag-mennyiségeket és a kapott eredményeket a következő 5. táblázatban adjuk meg.

Nematocid  
Meloidogyne incognita

| Hatóanyag                   | Pusztulási fok (%)<br>10 ppm hatóanyag-<br>koncentráció mellett |
|-----------------------------|-----------------------------------------------------------------|
| 2 képletű vegyület (ismert) | 0                                                               |
| 15 képletű vegyület         | 100                                                             |
| 16 képletű vegyület         | 100                                                             |
| 17 képletű vegyület         | 100                                                             |

## F) példa

Határkoncentráció próba / talaj kártevők

Vizsgált kártevők: *Tenebrio molitor* lárvák a talajban

Oldószer: 3 súlyrész aceton

Emulgeátor 1 súlyrész alkil-aril-poli(glikol-éter)

Alkalmas készítmény előállítása céljából 1 súlyrész hatóanyagot elkeverünk a fenti mennyiségű oldószerrel, hozzáadjuk a fenti mennyiségű emulgeátort és a kapott koncentrátumot vízzel a kívánt koncentrációra hígítjuk.

A készítményt bensőségesen elkeverjük a talajjal. A hatóanyag koncentrációja a készítményben gyakorlatilag nem játszik szerepet, döntő szerepe csupán a talaj térfogategységére eső hatóanyag mennyiségnek van, amit ppm-ben (mg/liter) fejezünk ki. A talajt edényekbe töltjük, amelyeket szobahőmérsékleten állni hagyunk.

24 óra múlva a vizsgált állatokat a kezelt talajba adjuk és további 2—7 nap múlva meghatározzuk a hatóanyag hatásfokát az elhullott és élő vizsgált kártevők megszámlálásával. 100%-os a hatásfok, ha valamennyi vizsgált kártevő elhullik és 0%, ha még ugyanannyi kártevő él, mint a kezeletlen kontrollban.

A hatóanyagokat, felhasznált mennyiségeket és a kapott eredményeket a következő 6. táblázatban adjuk meg.

6. táblázat

Talaj kártevők  
*Tenebrio molitor* lárvák a talajban

| Hatóanyag                    | %-os pusztulási fok<br>2,5 ppm hatóanyag-<br>koncentráció mellett |
|------------------------------|-------------------------------------------------------------------|
| 18 képletű vegyület (ismert) | 0                                                                 |
| 2 képletű vegyület (ismert)  | 0                                                                 |
| 15 képletű vegyület          | 100                                                               |
| 16 képletű vegyület          | 100                                                               |
| 19 képletű vegyület          | 100                                                               |

Határkoncentráció próba / gyökér szisztémás hatás

Vizsgált kártevő: *Phaedon cochleariae* lárvák

Oldószer: 3 súlyrész aceton

Emulgeátor: 1 súlyrész alkil-aril-poli(glikol-éter)

Alkalmas készítmény előállítása céljából 1 súlyrész hatóanyagot elkeverünk a fenti mennyiségű oldószerrel, hozzáadjuk a fenti mennyiségű emulgeátort, és a koncentrátumot vízzel a kívánt koncentrációra hígítjuk.

A kapott készítményt bensőségesen elkeverjük a talajjal. Így a készítmény hatóanyag koncentrációja egyáltalán nem játszik szerepet, döntő csupán a talaj térfogategységére eső hatóanyag mennyiség, amelyet ppm-ben (mg/liter) fejezünk ki. A kezelt talajt edényekbe töltjük és az edényekbe káposztát ültetünk (*Brassica oleracea*). A hatóanyagot így a növények gyökerei felveszik a talajból és a levelekbe szállítják.

A gyökér szisztémás hatás igazolására 7 nap múlva kizárólag a leveleket fertőzzük meg a fenti vizsgált állatokkal. További 2 nap múlva a kiértékelést az elpusztult állatok megszámlálásával vagy megbecslésével végezzük el. A pusztulási számokból levezetjük a hatóanyag gyökér szisztémás hatását. 100% a hatás, ha valamennyi vizsgált állat elpusztult és 0%, ha még ugyanannyi vizsgált kártevő van életben, mint a kezeletlen kontroll esetében.

A hatóanyagokat, felhasznált mennyiségeket és a kapott eredményeket a következő 7. táblázatban adjuk meg.

7. táblázat

Gyökér szisztémás hatás  
*Phaedon cochleariae* lárvák

| Hatóanyag                    | Pusztulási fok (%) 20<br>ppm hatóanyag-<br>koncentrációnál |
|------------------------------|------------------------------------------------------------|
| 18 képletű vegyület (ismert) | 0                                                          |
| 2 képletű vegyület (ismert)  | 0                                                          |
| 15 képletű vegyület          | 100                                                        |
| 16 képletű vegyület          | 100                                                        |
| 5 képletű vegyület           | 100                                                        |
| 3 képletű vegyület           | 100                                                        |
| 17 képletű vegyület          | 100                                                        |

H) példa

8. táblázat

Határkoncentráció próba / gyökér szisztémás hatás

Gyökér szisztémás hatás

Myzus persicae

Vizsgált kártevő: Myzus persicae

5

Oldószer: 3 súlyrész acetone

Emulgeátor: 1 súlyrész alkil-aril-poli(glikol-éter)

Alkalmas készítmény előállítása céljából 1 súlyrész hatóanyagot elkeverünk a fenti mennyiségű oldószerrel, hozzáadjuk a fenti mennyiségű emulgeátort és a koncentrátumot vízzel a kívánt koncentrációra hígítjuk.

A készítményt bensegésesen elkeverjük a talajjal. Így a készítmény koncentrációja gyakorlatilag egyáltalán nem játszik szerepet, döntő csupán a talaj térfogatyságára eső hatóanyag-mennyiség, amelyet ppm-ben (mg/liter) fejezünk ki. A kezelt talajt edényekbe töltjük és káposztát (*Brassica oleracea*) ültetünk bele. A hatóanyagot így a növények a gyökéren keresztül felvehetik a talajból és a levelekbe transzportálhatják.

A gyökér szisztémás hatás bizonyítására 7 nap múlva kizárólag a leveleket megfertőzzük a fenti vizsgált állatokkal. További 2 nap múlva a kiértékelést az elpusztult állatok megszámlálásával, illetve megbecslésével végezzük el. A pusztulási számokból levezetjük a hatóanyag gyökér szisztémás hatását. Így 100% a hatás, ha valamennyi vizsgált állat elpusztult, míg 0%, ha éppen annyi vizsgált állat van életben, mint a kezeletlen kontrollban.

A hatóanyagokat, felhasznált mennyiségeket és a kapott eredményeket a következő 8. táblázatban adjuk meg.

| Hatóanyag                      | Pusztulási fok (%)<br>2,5 ppm hatóanyag<br>koncentrációnál |
|--------------------------------|------------------------------------------------------------|
| 2 képletű vegyület<br>(ismert) | 0                                                          |
| 15 képletű vegyület            | 100                                                        |
| 16 képletű vegyület            | 100                                                        |
| 4 képletű vegyület             | 100                                                        |
| 15 5 képletű vegyület          | 100                                                        |
| 3 képletű vegyület             | 100                                                        |
| 17 képletű vegyület            | 100                                                        |

20 Előállítási példák

1. példa

A 8. képletű vegyület előállítása

300 ml acetonnitril, 13,8 g (0,1 mól) 2-izopropil-5-hidroxi-pirimidin, 20,7 g (0,15 mól) kálium-karbonát és 18,8 g (0,1 mól) 0,0-dietil-tionfoszforsav-diészterklorid elegyét 45 °C-on 2 órán át keverjük. A reakcióelegyet ezután 400 ml toluolba öntjük és kétszer 300—300 ml vízzel mossuk. A toluolos oldatot nátrium-szulfát felett szárítjuk és vákuumban bepároljuk. A maradékot nagy vákuumban desztilláljuk. 17,4 g (az elméleti érték 62%-a) 0-(2-izopropil-pirimidin-5-il)-tionfoszforsav-0,0-dietilésztert kapunk barna olaj formájában, amelynek törésmutatója:  $n_D^{21} = 1,4970$ . Analóg módon állíthatók elő a következő (I) általános képletű vegyületek:

| Példa száma | R                                   | R <sup>1</sup>                         | R <sup>2</sup>                      | R <sup>3</sup>   | X   | Kitermelés (az elméleti %-a) | Törésmutató         |
|-------------|-------------------------------------|----------------------------------------|-------------------------------------|------------------|-----|------------------------------|---------------------|
| 2           | —C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -izo | —CH <sub>3</sub>                       | C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -izo  | —H               | —S— | 74                           | $n_D^{21} = 1,5102$ |
| 3           | —CH <sub>3</sub>                    | —OCH <sub>3</sub>                      | C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -izo  | —H               | —S— | 66                           | $n_D^{24} = 1,5080$ |
| 4           | —C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>      | —SC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -n     | C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -izo  | —H               | —S— | 69                           | $n_D^{26} = 1,5284$ |
| 5           | —C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>      | —C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>         | C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -izo  | —H               | —S— | 74                           | $n_D^{26} = 1,5570$ |
| 6           | —C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>      | —OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>        | C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -izo  | —H               | —O— | 82                           | $n_D^{32} = 1,4630$ |
| 7           | —C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>      | —NH—C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -izo | C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -izo  | —H               | —S— | 57                           | $n_D^{32} = 1,5057$ |
| 8           | —C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -n   | —OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>        | C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -izo  | —H               | —S— | 73                           | $n_D^{32} = 1,4929$ |
| 9           | —C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>      | —OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>        | —CH <sub>3</sub>                    | —H               | —S— | 92                           | $n_D^{32} = 1,4992$ |
| 10          | —C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>      | —C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>         | —CH <sub>3</sub>                    | —H               | —S— | 80                           | $n_D^{32} = 1,5169$ |
| 11          | —C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>      | —OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>        | —C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>      | —H               | —S— | 80                           | $n_D^{32} = 1,5643$ |
| 12          | —C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>      | —C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>         | —C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>      | —H               | —S— | 80                           | $n_D^{32} = 1,5827$ |
| 13          | —C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>      | —OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>        | —H                                  | —H               | —S— | 72                           | $n_D^{32} = 1,5028$ |
| 14          | —C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>      | —OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>        | —C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>      | —H               | —S— |                              |                     |
| 15          | —C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>      | —OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>        | —C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -n   | —H               | —S— |                              |                     |
| 16          | —C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>      | —OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>        | —C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -n   | —H               | —S— |                              |                     |
| 17          | —C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>      | —OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>        | —C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -izo | —CH <sub>3</sub> | —S— |                              |                     |

A kiindulási anyagként használt (III) általános képletű 5-hidroxi-pirimidinek például a következő módon állíthatók elő:

A 20. képletű vegyület előállítására.

49,5 g (0,45 mól) 5-metoxi-pirimidin (előállítását lásd H. Bredereck és mtsai, Chem. Ber. 91, (1958/2848. old.) és 38 g (0,68 mól) kálium-hidroxid 80 ml vízzel és 170 ml metanollal készült elegyét autoklávban 3 órán át 190 °C-on melegítjük. A metanolt ezután vákuumban ledesztilláljuk, a maradékot 50 ml jeges vízzel elegyítjük és a lehűtött oldat pH-értékét koncentrált sósav-oldattal 4,5-re állítjuk be. 30 perc múlva a kristályos terméket leszívjuk és így 30 g (az elméleti érték 70%-a) 5-hidroxi-pirimidint kapunk gyengén barnára színezett kristálypor formájában, melynek olvadáspontja: 208 °C.

Analóg módon állíthatók elő a következő (III) általános képletű vegyületek:

| Példa-<br>szám | R <sup>2</sup>                      | R <sup>3</sup> | Kiter-<br>melés<br>(az el-<br>méleti<br>%-a) | Olvadás-<br>pont<br>(°C) |
|----------------|-------------------------------------|----------------|----------------------------------------------|--------------------------|
| b)             | —C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -izo | —H             | 72                                           | 185                      |
| c)             | —CH <sub>3</sub>                    | —H             | 64                                           | 173                      |
| d)             | —C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>      | —H             | 94                                           | 144                      |
| e)             | —C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>      | —H             |                                              |                          |
| f)             | —C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -n   | —H             |                                              |                          |
| g)             | —C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -n   | —H             |                                              |                          |

A találmány szerinti készítmények előállítására az alábbi példákat adjuk.

a) példa

0,5 súlyrész hatóanyagot (1. példa szerintit) 99,5 súlyrész mészporral összekeverünk, és a keveréket finomra őrljük.

b) példa

2. példa szerinti hatóanyag 25 súlyrész  
dibutil-naftalin-szulfonát 1 súlyrész  
lignin-szulfonát 4 súlyrész  
nagydiszperzitású kovasav 8 súlyrész  
természetes kőpor 62 súlyrész  
A fenti anyagokat összekeverjük és finom porrá őrljük. Diszpergálható porkészítményt kapunk.

c) példa

A 13. hatóanyagból 25 súlyrészt feloldunk 55 súlyrész xilol és 10 súlyrész ciklohexán elegyében. Keverés

10

közben dodecil-benzolszulfonsavas-kalcium és nonil-fenil-poli(glikol-éter) elegyből 10 súlyrészt adunk az oldathoz. Emulgeálható koncentrátumot kapunk.

d) példa

Az 5. példa szerinti hatóanyag 10 súlyrészét 90 súlyrész nedvszívó granulált anyagra permetezzük. Szórható granulátumot kapunk.

e) példa

A 10. példa szerint előállított hatóanyag 90 súlyrészét a 3 súlyrész poli(etilén-oxid) emulgeátor és 7 súlyrész aromás olajfrakció elegyében feloldjuk. Az elegyet homogenizáljuk. A kapott készítmény az ULV eljárásban alkalmazható.

#### Szabadalmi igénypontok:

25 1. Inszekticid, akaricid és nematocid hatású készítmények, azzal jellemezve, hogy hatóanyagként valamely (I) általános képletű (pirimidin-5-il)-(tion)(tiol)-foszfor(foszfon)sav-észtert, illetve -észter-amidot — az (I) általános képletben

30

R 1—4 szénatomos alkilcsoportot,

R<sup>1</sup> 1—4 szénatomos alkil-, 1—4 szénatomos alkoxi-csoportot, fenilcsoportot vagy az alkilrészben 1—4 szénatomot tartalmazó alkil-amino-csoportot és

35

R<sup>2</sup> 1—4 szénatomos alkilcsoportot, fenilcsoportot vagy hidrogénatomot jelent, míg

X jelentése oxigén- vagy kénatom —

tartalmaz 0,1—95 súly% mennyiségben, szilárd hordozóanyagok, előnyösen természetes és mesterséges

40

kőporok és/vagy folyékony vivőanyagok, előnyösen ásványolajfrakciók vagy aromás szénhidrogének, valamint felületaktív anyagok, előnyösen alkil-aril-poli(glikol-éter) mellett. (Elsőbbsége: 1977. 02. 14.)

45

2. Inszekticid és akaricid hatású készítmények, azzal jellemezve, hogy hatóanyagként valamely (I) általános képletű (pirimidin-5-il)-(tion)(tiol)foszfor(foszfon)sav-észtert, illetve -észter-amidot — az (I) általános képletben

50

R 1—4 szénatomos alkilcsoportot,

R<sup>1</sup> 1—4 szénatomos alkil-, 1—4 szénatomos alkoxi-csoportot, fenilcsoportot vagy az alkilrészben 1—4 szénatomot tartalmazó alkil-amino-csoportot és

55

R<sup>2</sup> 1—4 szénatomos alkilcsoportot, fenilcsoportot vagy hidrogénatomot jelent, míg

X jelentése oxigén- vagy kénatom —

tartalmaz 0,1—95 súly% mennyiségben, szilárd hordozóanyagok, előnyösen természetes és mesterséges

60

kőporok és/vagy folyékony vivőanyagok előnyösen

ásványolaj frakciók vagy aromás szénhidrogének, valamint felületaktív anyagok, előnyösen alkil-aril-poli-(glikol-éter) mellett. (Elsőbbsége: 1976. 09. 25.)

3. Eljárás az 1. és 2. igénypont szerinti készítmények hatóanyagaként felhasználható (I) általános képletű (pirimidin-5-il)-(tion)(tiol)foszfor(foszfonsav)-észterek, illetve -észter-amidok — az (I) általános képletben

R 1—4 szénatomos alkilcsoportot,

R<sup>1</sup> 1—4 szénatomos alkil-, 1—4 szénatomos alkoxi vagy 1—4 szénatomos alkil-tio-csoportot, fenilcsoportot vagy az alkilrészben 1—4 szénatomot tartalmazó alkil-amino-csoportot és

R<sup>2</sup> 1—4 szénatomos alkilcsoportot, fenilcsoportot vagy hidrogénatomot jelent, míg

X jelentése oxigén- vagy kénatom —

előállítására, azzal jellemezve, hogy valamely (II) általános képletű (tion)(tiol)foszfor(foszfonsav)-észter-halogenidet, illetve -észter-amid-halogenidet — a (II) általános képletben R, R<sup>1</sup> és X jelentése a fenti, míg Hal halogénatomot, előnyösen klóratomot jelent — valamely (III) általános képletű 5-hidroxi-pirimidin-10 nel — a (III) általános képletben R<sup>2</sup> jelentése a fenti — adott esetben valamilyen savmegkötő szer jelenlétében és adott esetben oldó- vagy hígítószer jelenlétében reagáltatunk. (Elsőbbsége: 1976. 09. 25.)

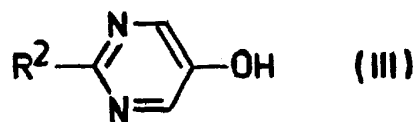
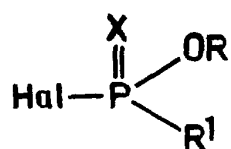
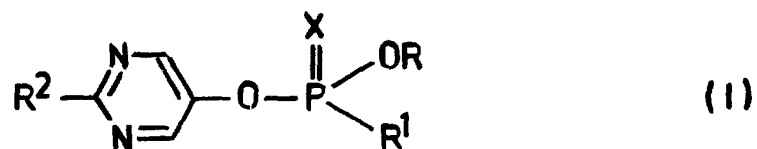
---

4 rajz

---

182 642  
 Nemzetközi  
 osztályozás:  
 (51) NSzO<sub>3</sub>  
 A 01 N 57/16:  
 C 07 F 9/65:  
 C 07 F 9/24:  
 C 07 F 9/38

4/1



### Reakcióvázlat

