

(19) HU

MAGYAR  
NÉPKÖZTÁRSASÁGORSZÁGOS  
TALÁLMÁNYI  
HIVATALSZABADALMI  
LEÍRÁS

B

(11) 190 788

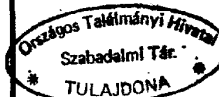
A bejelentés napja: (22) 82. 02. 05.

(21) 363/82

A bejelentés elsőbbsége: (33) (32) (31)  
FR: 81. 03. 27. (81 06170)

A közzététel napja: (41) (42) 1984. 04. 30.

Megjelent: (45) 1988. IX. 30.

Nemzetközi  
osztályjelzet:  
(51) NSZO<sub>4</sub>  
A 01 N 53/00  
A 01 N 43/50  
C 07 C 61/04

Feltaláló(k): (72)

MARTEL Jacques, mérnök, Bondy, TESSIER Jean, vegyészmérnök,  
Vincennes, TECHE André, kutatómérnök, Párizs, FR

Szabadalmaz: (73)

Roussel Uclaf, Department des Brevets, Párizs, FR

(54) HATÓANYAGKÉNT POLIHALOGÉNEZETT CIKLOPROPÁNKARBONSAV-ÉSZTEREKET  
TARTALMAZÓ INSZEKTICID, AKARICID ÉS NEMATOCID KÉSZÍTMÉNYEK ÉS ELJÁRÁS  
A HATÓANYAGOK ELŐÁLLÍTÁSÁRA

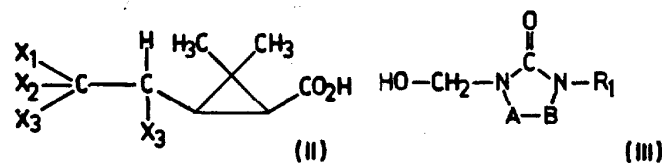
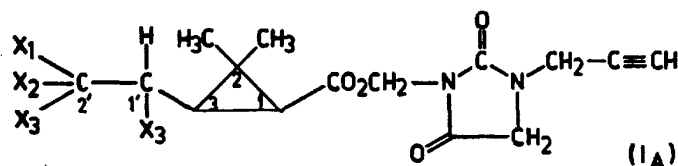
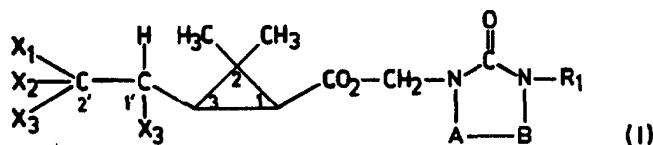
## (57) KIVONAT

A találmány szerinti készítmények hatóanyagá-  
nak (I) általános képletében

- X<sub>1</sub> jelentése fluor-, klór- vagy brómatom;
- X<sub>2</sub> jelentése X<sub>1</sub>-től függetlenül fluor-, klór-  
vagy brómatom;

- X<sub>3</sub> jelentése klór-, bróm- vagy jódatom;
- A és B közül az egyik jelentése karbonilcso-  
port, a másik jelentése 1-4 szénatomos alkilén-  
csoport és

- R<sub>1</sub> jelentése 2-5 szénatomos alkinilcsoport.

A készítmények a hatóanyagot hordozóanya-  
gokkal és/vagy segédanyagokkal összekeverve tar-  
talmazzák.A (I) általános képletű hatóanyagot - a helyette-  
sítők jelentése az előzőekben megadott - (II) általá-  
nos képletű sav vagy annak funkcionális származé-  
ka és (III) általános képletű alkohol vagy annak  
funkcionális származéka reagáltatásával állítják  
elő.

(III)

A találmány (I) általános képletű polihalogénezett ciklopropánkarbonsav-észter hatóanyagot tartalmazó inszekticid, akaricid és nematocid készítményekre, valamint a (I) általános képletű vegyületek összes lehetséges izomerjeinek, vagy ezek elegyeinek előállítására szolgáló eljárásra vonatkozik.

A (I) általános képletben:

- $X_1$  jelentése fluor-, klór- vagy brómatom,
- $X_2$  jelentése  $X_1$ -től függetlenül fluor-, klór- vagy brómatom,
- $X_3$  jelentése klór-, bróm- vagy jódatom,
- A és B közül az egyik jelentése karbonilcsoport, a másik jelentése 1-4 szénatomos alkilén-csoport és
- $R_1$  jelentése 2-5 szénatomos alkinilcsoport.

A (I) általános képletű vegyületek előfordulhatnak számos izomer formában. A (I) általános képletű észterek savrészét képező ciklopropán-karbonsav-maradékok legalább három aszimmetrikus szénatomot tartalmaznak, nevezetesen a ciklopropilcsoport, 1-es és 3-as helyzetű aszimmetrikus szénatomjait és a 3-as helyzetű polihalogénezett etiloldallánc 1' helyzetű szénatomját.

Abban az esetben, ha az  $X_1$ ,  $X_2$  és  $X_3$  szubsztituensek egymástól különbözőek, egy további aszimmetrikus szénatom is létezik a polihalogénezett oldalláncban, a 2' helyzetben.

Abban az esetben, ha az  $X_1$  és  $X_2$  szubsztituensek azonosak, a ciklopropángyűrű 1-es és 3-as helyzetű aszimmetrikus szénatomjai által meghatározott térbeli konfiguráció következtében a (I) általános képletű vegyületek két diasztereoizomer formában létezhetnek, az 1' helyzetű aszimmetriás szénatom jelenléte miatt. Ezeket főleg az NMR spektrumok vagy a vékonyréteg kromatográfiás vizsgálat során mutatott vándorlási sebességük alapján lehet megkülönböztetni. Ezek az izomerek általában szétválaszthatók, és főleg kromatográfiás eljárással izolálhatók tiszta állapotban.

$R_1$  jelentése célszerűen a  $-\text{CH}_2-\text{C}\equiv\text{CH}$  képletű csoport.

A találmány szerinti eljárással előállított vegyületek közül előnyösen alkalmazhatók a (I<sub>A</sub>) képletű vegyületek, valamint az olyan, (I) általános képletű vegyületek, amelyekben a ciklopropil-karbonsav rész 1R transz vagy 1R cisz konfigurációjú, valamint amelyeknek (I) általános képletében  $X_1$ ,  $X_2$  és  $X_3$  ugyanazt a halogénatomot – például brómatomot – jelenti.

A találmány szerint a (I) általános képletű vegyületeket úgy állítjuk elő, hogy (II) általános képletű vegyületet –  $X_1$ ,  $X_2$  és  $X_3$  jelentései a fentiek – vagy azok funkcionális származékát (III) általános képletű alkohollal vagy ennek az alkoholnak funkcionális származékával reagáltatjuk – A, B és  $R_1$  jelentései a fentiek.

A sav funkcionális származékaiként célszerűen savkloridot, vagy savanhidridet használunk.

Az észterezési reakciót célszerűen úgy játszattuk le, hogy a (II) általános képletű savat a (III) általános képletű alkohollal diciklo-hexil-karbodiimid vagy diizopropil-karbodiimid jelenlétében reagáltatjuk.

A (I) általános képletű vegyületek olyan tulajdonságokat mutatnak, amelyek alkalmassá teszik

őket paraziták irtására. Gondot okozhat például a növényeken, melegvérű állatokon és a ház körül élő paraziták irtása. A találmány szerinti vegyületek egyaránt használhatók a növényeken, állatokon és a ház körül élő parazitáknak, így a rovaroknak, fonálférgeknek és atka-féléknek az irtására.

A (I) általános képletű vegyületek főleg a mezőgazdaságban előforduló rovarok, például a levéltetvek, a pikkelyes szárnyúak lárváinak és a bogaraknak az irtására használhatók. Ezeket 10 g és 300 g közötti aktív anyagot tartalmazó dózisokban használják hektáronként.

A későbbiek során leírt kísérleti részben bemutatjuk a találmány szerinti termékek rovarölő képességét.

A találmány szerinti vegyületeknek, de különösen a 4. példa szerint előállított B-izomernek további előnye az is, hogy fénnyel szemben stabilak és emiatt előnyösen használhatók például a mezőgazdaságban.

A (I) általános képletű vegyületek a ház körüli rovarok, főleg legyek, szúnyogok és svábbogarak irtására is használhatók.

A (I) általános képletű vegyületek használhatók továbbá a növényeken élősködő atkafélék és fonálférgek irtására is.

Használhatók továbbá az állatokon élősködő atkafélék, pl. kullancsok irtására, különösen a Boophilus, a Hyalomnia, az Amblyomma és a Rhipicephalus fajok esetében, de használhatók mindenféle rühátka ellen, különösen a sarcoptic, a psoroptic és a choriopic fajok irtására.

A találmány tárgyát képezik azok a kompozíciók is, amelyeket a növényeken, melegvérű állatokon és a ház körül előforduló paraziták irtására használhatunk, és amelyek hatóanyagként legalább egy, találmányunk szerinti vegyületet tartalmaznak.

Ezeket a kompozíciókat a mezőgazdaságban az állatgyógyászatban vagy az állati táplálékot előállító iparban használt módszerek szerint állíthatjuk elő.

Ezek a kompozíciók a hatóanyag vagy a hatóanyagok mellett egy vagy több más peszticid hatású szert is tartalmazhatnak. A kompozíciókat porok, granulátumok, szuszpenziók, emulziók, oldatok, aeroszolok, csálétek vagy egyéb formában készíthetjük el, amelyeket az ilyen fajta vegyületeknél általában alkalmazni szoktak.

Ezek a kompozíciók a hatóanyag mellett tartalmazhatnak hordozókat és/vagy nemionos felületaktív anyagokat, amelyek biztosítják az elegyben az anyagok egyenletes eloszlását. A felhasználható hordozók lehetnek folyadékok – például víz, alkohol, szénhidrogének vagy egyéb szerves oldószerek, ásványi-, állati- vagy növényi olajok – továbbá porok – így például talkum, agyagfészeségek vagy szilikátok – vagy éghető szilárd anyagok.

A találmány szerinti kompozíciókat házi használatra célszerűen füstölők formájában alkalmazzuk.

A találmány szerinti kompozíciók formálásakor hordozóként előnyösen használhatunk éghető tekerceset vagy még inkább éghetetlen szálas szerkezetű anyagot. Ez utóbbi esetben a hatóanyaggal való impregnálás után kapott füstölőt égető berendezés-

be, például elektromos szúnyogirtó berendezésbe helyezzük.

Abban az esetben, ha éghető tekercset használunk, közömbös hordozóként, például kerti székfű törkölyt, tabuport, (vagy *Machilus Thumbergii* levelek porát) kerti székfű szárából készült port, cédrustűport, fűrészporth, (pl. fenyőfa fűrészporth) keményítőt, és/vagy kókuszdió héjából készült port alkalmazhatunk.

A hatóanyag mennyisége célszerűen 0,03–1 t%.

Abban az esetben, ha nem gyűlékony szálal hordozót használunk, a hatóanyag mennyisége célszerűen 0,03–95 t%.

A házi használatra szánt találmány szerinti kompozíciót úgy is elkészíthetjük, hogy a hatóanyag felhasználásával permetezhető olajat készítünk, ezzel az olajjal impregnáljuk egy lámpa kanócat, amelyet aztán meg lehet gyújtani.

Az olajban a hatóanyag koncentrációja célszerűen 0,03–95 t%.

A rovarölő kompozíciókhoz hasonlóan, az atkaölő és fonalféregölő kompozíciókhoz is hozzáadhatunk egy vagy több peszticid hatású szert. Ezeket a kompozíciókat főleg porok, granulátumok, szuszpenziók, emulziók és oldatok formájában készíthetjük el.

Az atkák pusztítására célszerűen olyan, levélpermet formájában használható nedvesíthető porokat használunk, melyek egy 1–80 t% hatóanyagot tartalmaznak, vagy olyan levélpermet formájában alkalmazható folyadékokat, amelyek literenként 1–500 g hatóanyagot tartalmaznak. Hasonlóképpen levélporzásra alkalmas porok is használhatók, amelyek 0,05–3 t% hatóanyagot tartalmaznak.

A fonalférgek irtására célszerűen a talaj kezelésére alkalmas folyadékokat használunk, amelyek literenként 300–500 g hatóanyagot tartalmaznak.

A találmány szerinti, atkaölő és fonalféregölő vegyületeket célszerűen olyan dózisban alkalmazzuk, amelyek hektáronként 1 és 1000 g közötti mennyiségben tartalmaznak hatóanyagot.

A (I) általános képletű vegyületekkel szembeni tolerancia általában kitűnő, és ezért gyógyszerként is alkalmazhatók kullancsok és rühatkák által okozott betegségek gyógyításánál.

A találmány szerinti vegyületeket tartalmazó szerek mind az ember, mind pedig az állatgyógyászatban használhatók.

A találmány szerinti vegyületeket tartalmazó szerek az embergyógyászatban főleg a tetvek irtására, megelőzés vagy kezelés útján, valamint rühatkák irtására használhatók. Féreghajtószerként is használhatók.

A találmány szerinti szerek külsőleg alkalmazhatók, gőzölés, fürdő vagy bedörzsölés útján.

Az állatorvosi gyakorlatban használt találmány szerinti szereket is alkalmazhatjuk külsőleg, a hátgerinc tájékán, az ún. „ráöntéses” módszer szerint. De adagolhatók az emésztőrendszer útján vagy parenterális úton is.

A (I) általános képletű vegyületek tehát felhasználhatók olyan készítmények előállítására, amelyek az állatokon élősködő atkafélék – például kullancsok és rühatkák – elpusztítására használhatók.

Az állatokon élősködő atkafélék elpusztítása ér-

dekében a találmány szerinti termékeket összekeverhetjük az állatok etetésére használt tápanyagokkal vagy tápkompozíciókkal. A tápanyag az állat fajta szerint változhat: tartalmazhat gabonaféléket, cukrot és szemes terményeket, szójabab-, földimogyoró- és napraforgómag pogácsát, állati eredetű táplálékot, pl. hallisztet, szintetikus aminosavakat, ásványi sókat, vitaminokat és antioxidánsokat.

Megemlítjük még, hogy a találmány szerinti termékek kiváló rovarriasztó hatással is rendelkeznek. Végül, kimutatható, hogy a találmány szerinti termékek mint biocidok és növekedésszabályozók is használhatók.

A találmány szerinti termékek biológiai hatásának növelése érdekében alkalmazhatunk ilyen esetekben szokásos aktivátorokat, ilyenek például az 1-(2,5,8-trioxadodecil)-2-propil-4,5-metilén-dioxibenzol (vagy piperonil-butoxid) vagy az N-(2-etilheptil)-biciklo-(2,2,1)-5-heptán-2,3-dikarboximid vagy a piperonil-bisz-2-(2'-n-butoxi-etoxi)-etilacetál (vagy tropitál), vagy pedig az S,S,S-tributilfoszfor-tritioát.

A (I) általános képletű vegyületeket a találmány szerinti úgy állítjuk elő, hogy (II) általános képletű savat, vagy annak funkcionális származékát –  $X_1$ ,  $X_2$  és  $X_3$  jelentései a fentiek – (III) általános képletű alkohollal, vagy ennek az alkoholnak valamilyen funkcionális származékával reagáltatjuk – A, B és  $R_1$  jelentései a fentiek.

A sav funkcionális származéka célszerűen savklorid vagy savanhidrid.

Az észterezési reakciót célszerűen úgy játszátjuk le, hogy a (II) általános képletű savat a (III) általános képletű alkohollal diciklohexil-karbodiimid vagy diizopropil-karbodiimid jelenlétében reagáltatjuk.

A kiindulási anyagként használt (II) általános képletű vegyületek ismert anyagok, amelyeket a 2 364 884 számú francia szabadalmi leírás szerint állíthatunk elő.

A kiindulási anyagként használt (III) általános képletű vegyületek hasonlóképpen ismert anyagok, amelyeket a 2 415 105. számú francia találmányi bejelentésben leírt eljárás szerint állíthatunk elő.

#### 1. példa

Az (1R,transz)-2,2-dimetil-3-[1'-(R S)-2',2',2'-tetrabrom-etil]-ciklopropán-karbonsav [3-(propin-2-il)-2,5-dioxo-imidazolidinil]-metil-észterének előállítása

4 g (1R,transz)-2,2-dimetil-3-[1'-(RS)-2',2',2'-tetrabrom-etil]-ciklopropán-karbonsavat, 50 ml metilén-kloridot, 15 mg dimetil-amino-piridint és 1,8 g diciklohexil-karbodiimidet tartalmazó elegyet nitrogénatmoszférában, 30 percig keverjük. 1,5 g [3-(propin-2-il)-2,5-dioxo-imidazolidinil]-metanolt adunk ezután hozzá, a reakcióelegyet 16 óráig keverjük, majd az elegyet leszűrjük és a szűrletet szárazra pároljuk. A kívánt termékből 6,17 g-ot kapunk nyers állapotban. A nyersterméket szilikagelen kromatográfiával tisztítjuk, az eluálást 73 : 27 tér-

fogatarányú ciklohexán etilacetát eleggyel végezve. Így 3,5 g kívánt terméket kapunk.

NMR  $\text{CDCl}_3$  ppm

- 1,27 - 1,31 - 1,33 - a 2-es helyzetű metilcsoportok hidrogénje

- 1,62 - 2,33 Az 1-es és 3-as helyzetű szénatomok hidrogénje

- 4,3 - 4,4 és 4,4 - 4,6 az 1,2,2,2-tetrabrom-etilcsoport hidrogénje

- 5,6 és 5,63 A lánc  $\alpha$ -helyzetű  $\text{CO}_2$  csoportjánál levő szénatom hidrogénje

- 4,03 és 4,06 az imidazolidinilcsoport 3-as helyzetű szénatomjának hidrogénje

- 4,2 - 4,3 a  $\text{H H}$  helyzetű hidrogénatomok

- 2,34 - 2,38 - 2,43  $\text{A}-\text{C}\equiv\text{CH}$  hármaskötés hidrogénje.

## 2. példa

A

(1*R*,*cisz*)-2,2-dimetil-3-[1'-(*S*)-2',2'-tetrabrom-  
etil]-ciklopropán-karbonsav és az  
(1*R*,*cisz*)-2,2-dimetil-3-[1'-(*R*)-2',2'-tetrabrom-  
etil]-ciklopropán-karbonsav  
[3-(propin-2-il)-2,5-dioxo-imidazolidinil]-metil-  
észterének előállítása

Keverés közben nitrogénatmoszférában 2 g ciklohexilkarbodiimidet adunk az alábbi oldathoz, amely 5,2 g (1*R*,*cisz*)-2,2-dimetil-3-(1'-(*RS*)-2',2'-tetrabrom-etil)-ciklopropán-karbonsavat, 20 ml metilén-kloridot és 150 mg dimetil-aminopiridint tartalmaz. A reakcióelegyet 15-20 percig keverjük szobahőmérsékleten, majd 1,8 g 3-(propin-2-il)-2,5-dioxo-imidazolidinil-metanolt adunk hozzá. A reakcióelegyet 2 óra 30 percig keverjük, és a képződött karbamidot szűréssel eltávolítjuk és metilén-kloriddal öblítjük. A szűrletet 1*n* sósav oldattal, majd vízzel mossuk, megszáritjuk, és csökkentett nyomáson szárazra pároljuk. 8,2 g olajat kapunk, amelyet szilikagélén kromatografálunk, az eluálást 85 : 15 térfogatarányú benzol - etil-acetát eleggyel végezve. Így a következő termékeket izoláljuk:

(A) 2,2 g *S*-diasztereoizomer

( $\alpha$ )<sub>D</sub> = -101° 5 ± 3° (c = 0,75%  $\text{CHCl}_3$ )

NMR  $\text{CDCl}_3$  ppm

- 1,36 és 1,42

- 5,3 - 5,4

- 5,4 - 5,5

5,6 - 5,7

- 4,1

a ciklopropil-csoport kettes helyzetű metilcsoportjainak hidrogénje

a tetrabrom-etil-csoport hidrogénje

a lánc  $\alpha$ -helyzetű  $\text{CO}_2$  csoport szénatomjának hidrogénje

$\text{O}=\text{C}-\text{CH}_2$  csoport hidrogénje

- 4,2 - 4,3

5 - 2,37 - 2,39 - 2,41

(B) 1,6 g *R* diasztereoizomer

( $\alpha$ )<sub>D</sub> = +71,5° (c = 1,5%  $\text{CHCl}_3$ -ban)

NMR  $\text{CDCl}_3$  ppm

10 - 1,23 és 1,47

- 5,0 - 5,1

- 5,4 - 5,6

15 5,6 - 5,7

- 4,03 - 4,05

20 - 4,2 - 4,3

25 - 2,36 - 2,38 - 2,40

30

35

40

45

50

55

60

65

N  
|  
 $\text{H}_2\text{C}-\text{C}\equiv\text{CH}$ -csoport  
hidrogénje

„acetilénés” hidrogén

(B) 1,6 g *R* diasztereoizomer

( $\alpha$ )<sub>D</sub> = +71,5° (c = 1,5%  $\text{CHCl}_3$ -ban)

NMR  $\text{CDCl}_3$  ppm

2-es helyzetű metilcsoportok hidrogénje

a tetrabrom-etil-csoport hidrogénje

az oldallánc  $\alpha$ -helyzetű  $\text{CO}_2$  csoport szénatomjának a hidrogénje

$\text{O}=\text{C}-\text{CH}_2$  csoport hidrogénje

$\text{H}-\text{C}-\text{H}$  csoport hidrogénje

$\text{H}-\text{C}-\text{H}$  csoport hidrogénje

$\text{N}-\text{C}-\text{N}$  csoport hidrogénje

$\text{H}-\text{C}-\text{H}$  csoport hidrogénje

$\text{N}-\text{C}-\text{N}$  csoport hidrogénje

$\text{H}-\text{C}-\text{H}$  csoport hidrogénje

$\text{N}-\text{C}-\text{N}$  csoport hidrogénje

$\text{H}-\text{C}-\text{H}$  csoport hidrogénje

$\text{N}-\text{C}-\text{N}$  csoport hidrogénje

$\text{H}-\text{C}-\text{H}$  csoport hidrogénje

$\text{N}-\text{C}-\text{N}$  csoport hidrogénje

$\text{H}-\text{C}-\text{H}$  csoport hidrogénje

$\text{N}-\text{C}-\text{N}$  csoport hidrogénje

$\text{H}-\text{C}-\text{H}$  csoport hidrogénje

$\text{N}-\text{C}-\text{N}$  csoport hidrogénje

$\text{H}-\text{C}-\text{H}$  csoport hidrogénje

$\text{N}-\text{C}-\text{N}$  csoport hidrogénje

$\text{H}-\text{C}-\text{H}$  csoport hidrogénje

$\text{N}-\text{C}-\text{N}$  csoport hidrogénje

$\text{H}-\text{C}-\text{H}$  csoport hidrogénje

$\text{N}-\text{C}-\text{N}$  csoport hidrogénje

$\text{H}-\text{C}-\text{H}$  csoport hidrogénje

$\text{N}-\text{C}-\text{N}$  csoport hidrogénje

$\text{H}-\text{C}-\text{H}$  csoport hidrogénje

$\text{N}-\text{C}-\text{N}$  csoport hidrogénje

$\text{H}-\text{C}-\text{H}$  csoport hidrogénje

$\text{N}-\text{C}-\text{N}$  csoport hidrogénje

$\text{H}-\text{C}-\text{H}$  csoport hidrogénje

$\text{N}-\text{C}-\text{N}$  csoport hidrogénje

$\text{H}-\text{C}-\text{H}$  csoport hidrogénje

$\text{N}-\text{C}-\text{N}$  csoport hidrogénje

$\text{H}-\text{C}-\text{H}$  csoport hidrogénje

$\text{N}-\text{C}-\text{N}$  csoport hidrogénje

$\text{H}-\text{C}-\text{H}$  csoport hidrogénje

$\text{N}-\text{C}-\text{N}$  csoport hidrogénje

$\text{H}-\text{C}-\text{H}$  csoport hidrogénje

$\text{N}-\text{C}-\text{N}$  csoport hidrogénje

$\text{H}-\text{C}-\text{H}$  csoport hidrogénje

$\text{N}-\text{C}-\text{N}$  csoport hidrogénje

$\text{H}-\text{C}-\text{H}$  csoport hidrogénje

$\text{N}-\text{C}-\text{N}$  csoport hidrogénje

$\text{H}-\text{C}-\text{H}$  csoport hidrogénje

$\text{N}-\text{C}-\text{N}$  csoport hidrogénje

$\text{H}-\text{C}-\text{H}$  csoport hidrogénje

$\text{N}-\text{C}-\text{N}$  csoport hidrogénje

$\text{H}-\text{C}-\text{H}$  csoport hidrogénje

$\text{N}-\text{C}-\text{N}$  csoport hidrogénje

$\text{H}-\text{C}-\text{H}$  csoport hidrogénje

$\text{N}-\text{C}-\text{N}$  csoport hidrogénje

$\text{H}-\text{C}-\text{H}$  csoport hidrogénje

$\text{N}-\text{C}-\text{N}$  csoport hidrogénje

$\text{H}-\text{C}-\text{H}$  csoport hidrogénje

$\text{N}-\text{C}-\text{N}$  csoport hidrogénje

$\text{H}-\text{C}-\text{H}$  csoport hidrogénje

$\text{N}-\text{C}-\text{N}$  csoport hidrogénje

$\text{H}-\text{C}-\text{H}$  csoport hidrogénje

vegyületeket 5 t% aceton és 95 t% Isopar L petróleum oldószer elegyében feloldva használtuk (kb.  $2 \times 0,2$  ml-nyi oldatot). Kezelésenként kb. 50 rovarat használtunk. A vizsgálatot 10 percenként minden percben elvégeztük, majd ezután 15 perc múlva, és meghatároztuk a  $KT_{50}$  értéket a szokásos módszerekkel.

A kapott kísérleti eredményeket a következő táblázat tartalmazza:

$KT_{50}$  (percekben) 0,25 g/l koncentráció mellett

|                                       |     |
|---------------------------------------|-----|
| Az 1. példa szerinti termék           | 2,8 |
| A 2. példa szerinti termék (S izomer) | 1   |
| A 2. példa szerinti termék (R izomer) | 1,1 |

**Következtetések:** Az alkalmazott termékek jelentős pusztítóhatást mutattak ebben a vizsgálatban.

#### 2. kísérlet

A fenti eljárást és a fenti koncentrációkat használtuk, de az ellenőrzést minden 15 másodpercben elvégeztük, 10 percig és a  $KT_{50}$  értéket a szokásos módszerekkel határoztuk meg.

A kísérleti eredményeket a következő táblázatban összegeztük.

$KT_{50}$  (percekben) 0,25 g/l koncentrációnál

|                                       |      |
|---------------------------------------|------|
| Az 1. példa szerinti termék           | 1,82 |
| A 2. példa szerinti termék (S izomer) | 1,34 |
| A 2. példa szerinti termék (R izomer) | 1,32 |

**Következtetés:** Az 1. kísérlet eredményét megerősítve mondhatjuk, hogy az alkalmazott termékek jelentős pusztítóhatással rendelkeznek ebben a vizsgálatban.

#### B: Az alkalmazott termékek hatásfelerősítésének vizsgálatai

A vizsgált rovarok laboratóriumi körülmények között ( $25^\circ\text{C}$  és 70% relatív nedvességtartalom) tenyésztett 4–5 napos nőtény házilegyek voltak. Az  $LD_{50}$  érték meghatározását helyi alkalmazással végeztük, Arnold-féle mikroapplikátor segítségével juttatva a mérgező anyag acetonos oldatát az előzőleg szén-dioxiddal elkábított rovarokra.

A használt aktivátor részben piperonil-butoxid (PB) illetve DEF- vagy SSS-tributil-foszfór-tritioát volt. Ezeket a vizsgált termékekkel együtt oldatban használtuk. Az aktivátor mennyisége mindenütt a hatóanyag dózis tizszerese.

Az elhalálási arányt a helyi alkalmazás után 24 órával végeztük. A kapott kísérleti eredményeket a következő táblázatban összegezzük:

| Vizsgált anyag                               | $LD_{50}$ (ng/rovar) |
|----------------------------------------------|----------------------|
| Az 1. példa szerinti termék                  | 191                  |
| Az 1. példa szerinti termék + PB 10          | 87                   |
| Az 1. példa szerinti termék + DEF 10         | 35                   |
| Az 1. példa szerinti termék + PB 10 + DEF 10 | 13                   |

Vizsgált anyag  $LD_{50}$  (ng/rovar)

|                                               |      |
|-----------------------------------------------|------|
| A 2. példa szerinti R izomer                  | 327  |
| A 2. példa szerinti R izomer + PB 10          | 77   |
| A 2. példa szerinti R izomer + DEF 10         | 38   |
| A 2. példa szerinti R izomer + PB 10 + DEF 10 | 13,7 |

10 **Következtetés:** Az alkalmazott termék hatását aktivátorokkal nagymértékben felerősíthetjük.

#### 6. példa

15 **Oldható koncentrátum vagy vizes permet készítése**

Homogén elegyet készítünk az alábbi összetevőkkel:

|                                                                                      |        |
|--------------------------------------------------------------------------------------|--------|
| Az 1. példa szerinti termék                                                          | 0,25 g |
| Piperonil-butoxid                                                                    | 1 g    |
| Tween 80 szorbítanhidrid- és szorbitoleát – etilén-oxid 1 : 20 molarányú kopolimerje | 0,25 g |
| Topanol A (2,4-dimetil-6-terc-butil-fenol)                                           | 0,1 g  |
| Víz                                                                                  | 98,5 g |

#### 7. példa

30 **Emulgeálható koncentrátum készítése**

Az alábbi anyagokat keverjük össze:

|                              |          |
|------------------------------|----------|
| Az 1. példa szerinti termék: | 0,015 g  |
| Piperonil-butoxid            | 0,5 g    |
| Tween 80                     | 3,5 g    |
| Topanol A                    | 0,1 g    |
| Xilol                        | 98,885 g |

#### 8. példa

40 **Emulgeálható koncentrátum készítése**

Homogén elegyet készítünk az alábbiakból:

|                           |        |
|---------------------------|--------|
| 1. példa szerinti termék: | 1,5 g  |
| Tween 80                  | 20 g   |
| Topanol A                 | 0,1 g  |
| Xilol                     | 78,4 g |

#### 9. példa

50 **Füst-képző kompozíciók készítése**

|                           |         |
|---------------------------|---------|
| 1. példa szerinti termék: | 0,25 g  |
| Tabupor                   | 25 g    |
| Cédrustüpor               | 40 g    |
| Fenyőfa fűrészpor         | 33,75 g |
| Brillant zöld             | 0,5 g   |
| p-nitro-fenol             | 0,5 g   |

60

10. példa  
Emulgeálható koncentrátum előállítása

Az alábbi komponensekből homogén elegyet készítünk:

|                             |        |
|-----------------------------|--------|
| Az 1. példa szerinti termék | 10 g   |
| Tween 80                    | 20 g   |
| Topanol A                   | 0,5 g  |
| Xilol                       | 69,5 g |

Szabadalmi igénypontok

1. Inszekticid, akaricid és nematocid hatású kompozíciók *azzal jellemezve*, hogy hatóanyagként (I) általános képletű vegyületeket tartalmaznak 0,015–10 t% mennyiségben – a képletben

–  $X_1$  jelentése fluor-, klór- vagy brómatom;  
–  $X_2$  jelentése  $X_1$ -től függetlenül fluor-, klór- vagy brómatom;

–  $X_3$  jelentése klór-, bróm- vagy jódatom;  
– A és B közül az egyik jelentése karbonilcsoport, a másik jelentése 1-4 szénatomos alkilén-csoport és

–  $R_1$  jelentése 2-5 szénatomos alkinilcsoport – a szokásos hordozóanyagokkal, előnyösen acetonnal vagy növényi eredetű szilárd hordozóanyagokkal és/vagy felületaktív szerekkel, előnyösen 2,4-dimetil-6-terc-butil-fenollal és adott esetben aktiválószerrel, előnyösen piperonil-butoxiddal és adott esetben más, szokásosan alkalmazott adalékanyagokkal összekeverve.

2. Az 1. igénypont szerinti készítmények, *azzal jellemezve*, hogy hatóanyaguk (I) általános képletében  $R_1$  jelentése 2-propinil-csoport.

3. Eljárás a (I) általános képletű vegyületek összes lehetséges izomerjének, illetőleg ezek elegyeinek előállítására – a (I) általános képletben:

–  $X_1$  jelentése fluor-, klór- vagy brómatom;  
–  $X_2$  jelentése  $X_1$ -től függetlenül fluor-, klór- vagy brómatom;

5 –  $X_3$  jelentése klór-, bróm- vagy jódatom;  
– A és B közül az egyik jelentése karbonilcsoport, a másik jelentése 1-4 szénatomos alkilén-csoport és

10 –  $R_1$  jelentése 2-5 szénatomos alkinilcsoport – *azzal jellemezve*, hogy (II) általános képletű savat vagy annak funkcionális származékát –  $X_1$ ,  $X_2$  és  $X_3$  jelentései a fentiek – (III) általános képletű alkohollal vagy annak funkcionális származékával reagáltatjuk – A, B és  $R_1$  jelentései a fentiek.

15 4. A 3. igénypont szerinti eljárás a (IA) általános képletű vegyületek előállítására –  $X_1$ ,  $X_2$  és  $X_3$  jelentése a 3. igénypontban megadott – *azzal jellemezve*, hogy kiindulási anyagként (II) általános képletű savat vagy annak funkcionális származékát – a helyettesítők jelentése a 3. igénypontban megadott –, (III') képletű alkohollal vagy annak funkcionális származékával reagáltatjuk.

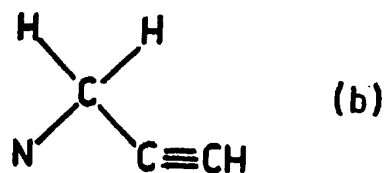
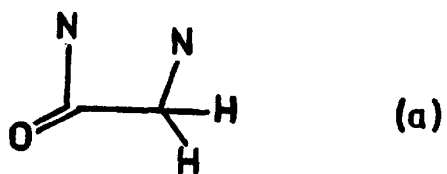
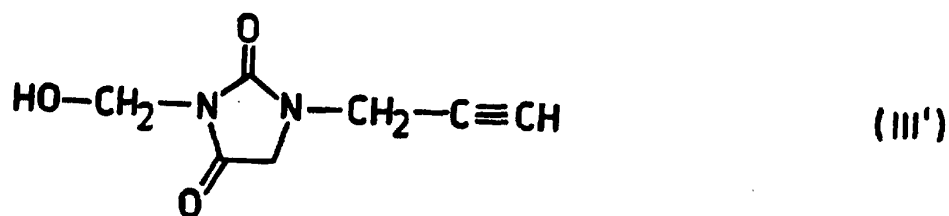
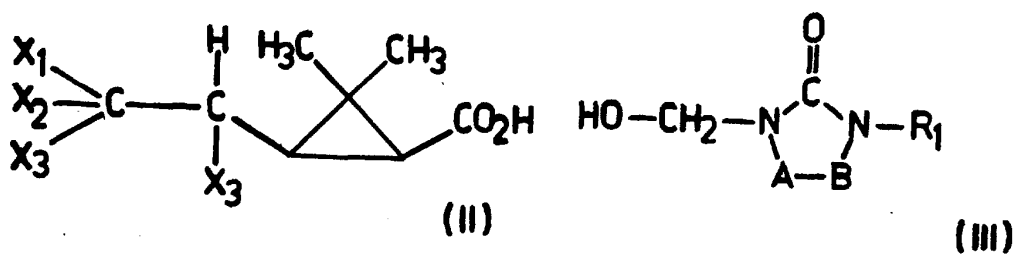
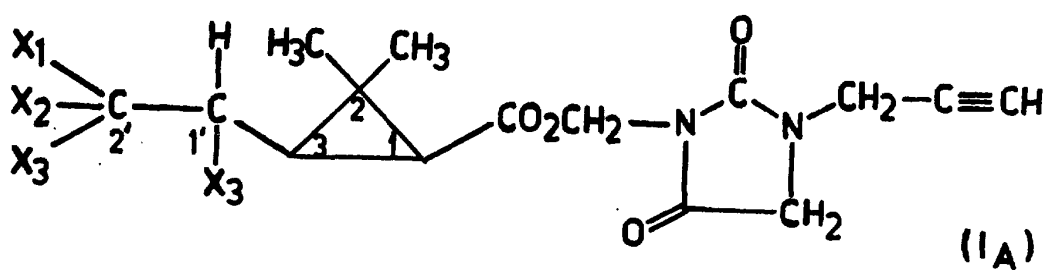
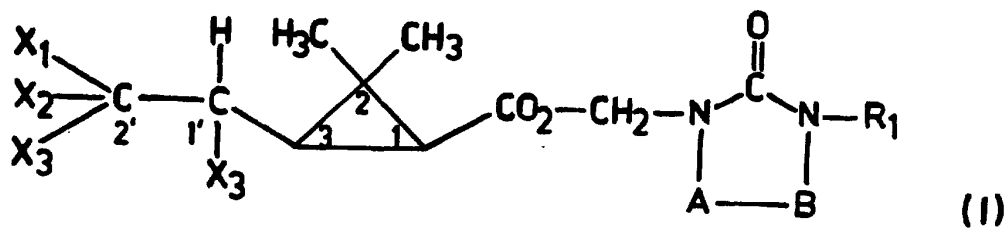
20 5. A 3. vagy 4. igénypontok szerinti eljárás, *azzal jellemezve*, hogy kiindulási anyagként IR-transz vagy IR-cisz konfigurációjú (II) általános képletű savat használunk.

25 6. A 3–5. igénypontok bármelyike szerinti eljárás, *azzal jellemezve*, hogy kiindulási anyagként olyan savat használunk, amelynek (II) általános képletében  $X_1$ ,  $X_2$  és  $X_3$  jelentése azonos.

30 7. A 6. igénypont szerinti eljárás *azzal jellemezve*, hogy kiindulási anyagként olyan savat használunk, amelynek (II) általános képletében  $X_1$ ,  $X_2$  és  $X_3$  jelentése egyaránt brómatom.

35 8. A 3. igénypont szerinti eljárás *azzal jellemezve*, hogy kiindulási anyagként olyan alkoholt használunk, amelynek (III) általános képletében  $R_1$  jelentése 2-propinil-csoport.

NSZO<sub>4</sub>: A 01 N 53/00  
A 01 N 43/50  
C 07 C 61/04



190 788

Kiadja az Országos Találmányi Hivatal  
A kiadásért felel: Himer Zoltán osztályvezető  
Szedte a Nyomdaipari Fényszedő Üzem (878351/09)  
**88-1913 — Dabasi Nyomda, Budapest — Dabas**  
**Felelős vezető: Bálint Csaba igazgató**