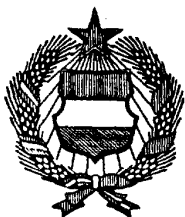


(19) HU

MAGYAR  
NÉPKÖZTÁRSASÁG



ORSZÁGOS  
TALÁLMÁNYI  
HIVATAL

# SZABADALMI LEÍRÁS

(11) 188 427

B

A bejelentés napja: (22) 83. 02. 14.

(21) 491/83

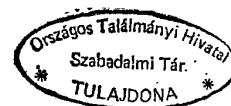
A bejelentés elsőbbsége: (33) JP: (32) 82. 02. 16.: (31) (Sho 57-22109)

A közzététel napja: (41) (42) 1984. 05. 28.

Megjelent: (45) 1988. 02. 28.

Nemzetközi  
osztályjelzet:  
(51) NSZO<sub>4</sub>

A 01 N 43/54  
C 07 D 239/10



Feltalálók: (72)

AYA Masahiro kutató biológus, SAITO Junichi kutatóvegyész, YASUI Kazuomi kutató biológus, Tokió, SHIOKAWA Kozo kutatóvegyész, Kanagawa-ken, JP

Szabadalmaz: (73)

Nihon Tokushu Noyaku Seizo K.K., Tokió, JP

(54)

## HERBICID KÉSZÍTMÉNY ÉS ELJÁRÁS A HATÓANYAGKÉNT ALKALMAZOTT METIL-TETRAHIDRO-2-PIRIMIDINON-SZÁRMAZÉKOK ELŐÁLLÍTÁSÁRA

(57) KIVONAT

A találmány szerinti készítmény hatóanyagként egy (I) általános képletű metil-szubsztituált tetrahidro-2-pirimidinon-származékot tartalmaz, a képletben

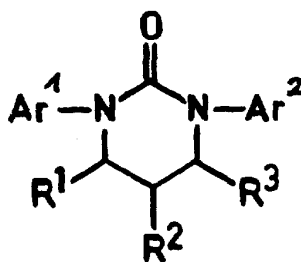
Ar<sup>1</sup> jelentése adott esetben halogénatommal, 1-4 szénatomos alkil- vagy 1-4 szénatomos alkoxicsoporttal egyszeresen helyettesített fenilcsoport,

Ar<sup>2</sup> jelentése naftilcsoport vagy adott esetben nitro-, fenoxi-, 1-4 szénatomos alkil-tio- vagy trifluor-metil-csoporttal egyszeresen vagy 1-4 szénatomos alkil- vagy 1-4 szénatomos alkoxicsoporttal legfeljebb kétszeresen vagy halogénatommal legfeljebb háromszorosan helyettesített fenilcsoport,

R<sup>1</sup> és R<sup>2</sup> közül az egyik jelentése metilcsoport, a másik jelentése hidrogénatom és

R<sup>3</sup> jelentése hidrogénatom.

A találmány szerinti eljárást úgy végzik, hogy valamely (II) általános képletű vegyületet – a képletben Ar<sup>1</sup>, Ar<sup>2</sup>, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> és R<sup>3</sup> jelentése a fenti, X jelentése halogénatom – valamely (III) általános képletű alkálifém-hidroxiddal – a képletben M jelentése alkálifématom – adott esetben egy oldószer vagy hígítószer jelenlétében reagáltatnak.



(II)

A találmány tárgya eljárás új (I) általános képletű, metilcsoporttal szubsztituált tetrahidro-2-pirimidon-származékok előállítására; a találmány szerinti eljárással előállított vegyületek herbicid hatásúak.

A találmány szerinti eljárás során új közbenső termékeket állítunk elő, amelyeket az új hatóanyagok előállításához használhatunk.

Az 1-metil-3-fenil-hexahidro-2-pirimidinon és az 1-metil-3-fenil-5-metil-2-imidazolidinon ismert [Chem. Abstracts 57, 9860a (1962)]. Az irodalomban nem történik utalás azonban e vegyület alkalmazhatóságára. A leírásban ismertetett vizsgálatok azt mutatják, hogy ezek a vegyületek alig mutatnak herbicid hatást.

Az (I) általános képletben

$Ar^1$  jelentése adott esetben halogénatommal, 1–4 szénatomos alkil- vagy 1–4 szénatomos alkoxicsoporttal egyszerűen helyettesített fenilcsoport,

$Ar^2$  jelentése naftilcsoport vagy adott esetben nitro-, fenoxi-, 1–4 szénatomos alkil-tio- vagy trifluor-metil-csoporttal egyszerűen vagy 1–4 szénatomos alkil- vagy 1–4 szénatomos alkoxicsoporttal legfeljebb kétszeresen vagy halogénatommal legfeljebb háromszorosan helyettesített fenilcsoport,

$R^1$  és  $R^2$  közül az egyik jelentése metilcsoport, a másik jelentése hidrogénatom és

$R^3$  jelentése hidrogénatom.

A találmány szerinti (I) általános képletű vegyületeket oly módon állítjuk elő, hogy valamely (II) általános képletű vegyületet – a képletben  $Ar^1$ ,  $Ar^2$ ,  $R^1$ ,  $R^2$  és  $R^3$  jelentése a fenti, X jelentése halogénatom – valamely (III) általános képletű alkálifém-hidroxiddal, a képletben R jelentése alkálifématom, reagáltatunk.

A találmány szerinti új, metil-szubsztituált tetrahidro-2-pirimidinon-származékok kiváló szelektív herbicid hatást mutatnak.

Az új közbenső termékeket a (II) általános képlettel jellemezhetjük. A (II) általános képletű N,N'-diaril-N-halogén-alkil-karbamid vegyületeket oly módon állíthatjuk elő, hogy valamely (IV) általános képletű vegyületet – a képletben  $Ar^1$ ,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  és X jelentése a fenti – valamely (V) általános képletű izocianáttal,  $Ar^2$  jelentése a fenti, reagáltatunk.

Az (I) általános képletű vegyületek meglepő módon kiváló szelektív herbicid hatást mutatnak és alkalmasak a nem kívánatos gyomnövényeknek haszonnövényekben, így például gyapot- és rizstetvényben való kiirtására, anélkül, hogy a haszonnövényekben bármilyen károsodás mutatkozna. Az (I) általános képletű vegyületek a gyomnövények szárainak és leveleinek elszíntelenedését és elhervadását idézik elő. Ennek következtében feltételezhető, hogy a találmány szerinti vegyületek hatása a klorofil-szintézis gátlásán alapul. E hatásmechanizmus következtében a találmány szerinti vegyületek a gyapot, rizs és egyéb haszonnövények fejlődését nem befolyásolják.

Fentieket figyelembe véve a találmány szerinti vegyületek jelentős mértékben gazdagítják a technika állását.

Az (I) általános képletű vegyületek közül célszerűen azokat állítjuk elő, amelyekben  $Ar^1$  és  $Ar^2$

jelentése fenil-, vagy  $\alpha$ -naftil-csoport, amelyek adott esetben fluor-, klór-, bróm- vagy jódatommal, metil-, etil-, propil-, izopropil-, n-butil-, izobutil-, szek-butil-, terc-butil-, metoxi-, etoxi- propoxi-, izopropoxi-, n-butoxi-, izobutoxi-, szek-butoxi-, terc-butoxi-, metil-tio-, etil-tio-, propil-tio-, izopropil-tio-, n-butil-tio-, izobutil-tio-, szek-butil-tio-, terc-butil-tio-, nitro-, fenoxi és trifluor-metil-csoporttal lehetnek szubsztituálva,  $R^1$ ,  $R^2$  és  $R^3$  jelentése a fenti.

Különösen előnyösek azok az (I) általános képletű vegyületek, amelyekben legalább az egyik Ar szubsztituens meta-helyzetben van.

Az (I) általános képletű vegyületek előállítását az A reakcióvázzal szemléltethetjük. (Az  $Ar^1$ ,  $Ar^2$ ,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$ , X és M szubsztituensek jelentése a fentiekben megadottal azonos.)

Előnyösen azok a (II) általános képletű vegyületeket állítjuk elő, amelyekben  $Ar^1$ ,  $Ar^2$ ,  $R^1$ ,  $R^2$  és  $R^3$  jelentése az (I) általános képletű vegyületek célszerű jelentésénél megadottal azonos, és ahol X jelentése fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom.

A (II) általános képletű vegyületek közül előnyösen az alábbiakat állítjuk elő:

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-N-fenil-N'-[3-fluor- (vagy -klór- vagy -bróm-) -fenil]-karbamid,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-N-[3-fluor- (vagy -klór- vagy -bróm-) -fenil]-N'-fenil-karbamid,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-N-fenil-N'-[3-metoxi- (vagy -metil-tio-) -fenil]-karbamid,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-N-[3-metoxi- (vagy -metil-tio-) -fenil]-N'-fenil-karbamid,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-N-[3-nitro-fenil]-N'-fenil-karbamid,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-N-[3-fenoxi-fenil]-N'-fenil-karbamid,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-N-[3-(trifluor-metil)-fenil]-N'-fenil-karbamid,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-N-[3,4-diklór-fenil]-N'-fenil-karbamid,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-N-fenil-N'-[3,4-diklór-fenil]-karbamid,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-N-[3,5-diklór- (vagy -dimetoxi-) -fenil]-N'-fenil-karbamid,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-N-fenil-N'-[3,5-diklór- (vagy -dimetoxi-) -fenil]-karbamid,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-N- $\alpha$ -naftil-N'-fenil-karbamid,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-N-fenil-N- $\alpha$ -naftil-karbamid,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-N-[2,4,5-triklór-fenil]-N'-fenil-karbamid,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-N-fenil-N'-[2,4,5-triklór-fenil]-karbamid,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-N-[2-

-klór-fenil]-N'-[3--klór (vagy -trifluor-metil-) -fenil]-karbamid,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-N-[3-klór- (vagy -/trifluor-metil/-) -fenil]-N'-[2-klór-fenil]-karbamid,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-N-[2-tolil]-N'-[3-klór- (vagy -/metil-tio/- vagy /trifluor-metil/-) -fenil]-karbamid,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-N-[3-klór- (vagy /metil-tio/- vagy -/trifluor-metil/-) -fenil]-N'-[2-tolil]-karbamid,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-N-[3,5-xilil]-N'-fenil]-karbamid,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-N-fenil-N'-[3,5-xilil]-karbamid,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-N-fenil-N'-[3,5-xilil]-karbamid,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-N-[2-metoxi-fenil]-N'-[3-klór- (vagy -/metil-tio/- vagy -trifluor-metil/-) -fenil]-karbamid,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-N-[3-klór- (vagy -/metil-tio/- vagy -/trifluor-metil/-) -fenil]-N'-[2-metoxi-fenil]-karbamid,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-N-[3-tolil]-N'-[2-metoxi-fenil]-karbamid,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-N-[2-metoxi-fenil]-N'-[3-tolil]-karbamid,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-N-[3-klór-fenil]-N'-[3-klór- (vagy -/trifluor-metil/-) -fenil]-karbamid,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-N-[3-klór- (vagy -/trifluor-metil/-) -fenil]-N'-[3-klór-fenil]-karbamid,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-N-[3-tolil]-N'-[3-klór-fenil]-karbamid,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-N-[3-klór-fenil]-N'-[3-tolil]-karbamid,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-N-[2-metoxi-fenil]-N'-[3,4-diklór- (vagy -3,5-diklór-) -fenil]-karbamid,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-N-[3,4-diklór- (vagy -3,5-diklór-) -fenil]-N'-[2-metoxi-fenil]-karbamid,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-N-[2-tolil]-N'-[3,5-diklór-fenil]-karbamid,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-N-[3,5-diklór-fenil]-N'-[2-tolil]-karbamid,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) 1-metil- (vagy -3-metil-) -propil]-N-fenil-N'-[3-klór- (vagy -/trifluor-metil/-) -fenil]-karbamid,

N-[3-klór- (vagy -bróm- 1-metil- (vagy -3-metil-) -propil]-N-[3-klór- (vagy -/trifluor-metil/-) -fenil]-N'-fenil]-karbamid,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -1-metil- (vagy -3-metil-) -propil]-N-fenil-N'-[3,5-diklór-fenil]-karbamid és

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -1-metil- (vagy -3-metil-) -propil]-N-3,5-diklór-fenil]-N'-fenil]-karbamid.

A (III) általános képletű alkálifém-hidroxidok közül az (I) általános képletű vegyületek előállításánál célszerűen lítium-hidroxidot, nátrium-hidroxidot vagy kálium-hidroxidot használunk.

Abban az esetben, ha kiindulási anyagként a B reakcióvázlatban feltüntetett vegyületeket használjuk, az eljárás a B reakcióvázlat szerint megy végbe.

A találmány szerinti eljárást előnyösen egy oldószerben vagy hígítószerben végezzük: erre a célra bármely közömbös oldószer vagy hígítószer alkalmazható; ezek közül említjük meg elsősorban a vizet, az alifás, aliciklusos vagy aromás adott esetben klórozott szénhidrogéneket, (így például a hexánt, ciklohexánt, petrolétert, ligroint, benzolt, toluolt, xilolt, a metilén-kloridot, kloroformot, széntetrakloridot, etilén-kloridot, triklór-etilént és klórbenzolt); az étereket (így például dietil-éter, metil-éter, diizopropil-éter, dibutil-éter, dioxán és tetrahidrofuran); a ketonokat, (mint acetont, metil-éterketont, metil-izopropil-ketont, vagy metil-izobutil-ketont); a nitrileket, (így acetonitril, propionitril, akrilnitril); az alkoholokat, (így metanol, etanol, izopropanol, butanol vagy etilenglikol); az észtereket, (mint etil-acetát vagy amil-acetát); a savamidokat (így dimetil-formamid, dimetil-acetamid), a szulfonokat, vagy szulfoxidokat, (így dimetil-szulfoxid vagy szulfolán); a bázisokat, (mint piridin).

A reakció hőmérsékletét széles tartományban változtathatjuk; a reakció általában -20 és a reakcióelegy forráspontja közötti, előnyösen 0 és 100 °C közötti hőmérsékleten játszhatjuk.

A találmány szerinti eljárást általában atmoszférra nyomáson végezzük, noha a művelet ennél kisebb vagy nagyobb nyomáson is végbemegy.

A kiindulási anyagként alkalmazott (II) általános képletű N,N'-diaril-N-halogén-alkil-karbamid-származékok új vegyületek; e vegyületeket az (I) általános képletű származékok előállításához használhatjuk.

A (II) általános képletű kiindulási anyagok előállítását a C reakcióvázlat szemlélteti. (A reakcióvázlatban Ar<sup>1</sup>, Ar<sup>2</sup>, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> és X jelentése a fenti.)

A (IV) általános képletű vegyületek közül előnyösen az alábbiakat soroljuk fel:

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-anilin,  
N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-3-fluor- (vagy -klór- vagy -bróm-) -anilin,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-3-metoxi- (vagy -metil-tio-) -anilin,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-3-nitro-anilin,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-3-fenoxi-anilin,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-3-(trifluor-metil)-anilin,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-3,4-diklór-anilin,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-3,5-diklór- (vagy -dimetoxi-) -anilin,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-naftil-amin,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-2,4,5-triklór-anilin,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-2-klór-anilin,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-2-toluidin,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-2-metoxi-anilin,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-3-toluidin,

N-[3-klór- (vagy -bróm-) -1-metil- (vagy -3-metil)-propil]-anilin,  
 N-[3-klór- (vagy -bróm-) -1-metil- (vagy -3-metil)-propil]-3-klór- (vagy -/trifluor-metil/-)-anilin,  
 N-[3-klór- (vagy -bróm-) -2-metil-propil]-3,5-xilidin és  
 N-[3-klór- (vagy -bróm-) -1-metil- (vagy -3-metil)-propil]-3,5-diklór-anilin.

A kiindulási anyagként alkalmazott (V) általános képletű izocianát-származékok közül az alábbiakat említjük meg: fenil-izocianát,  
 3-fluor- (vagy -klór- vagy -bróm-) -fenil-izocianát,  
 3-metoxi- (vagy -/metil-tio/-) -fenil-izocianát,  
 3-nitro-fenil-izocianát,  
 3-fenoxi-fenil-izocianát,  
 3-(trifluor-metil)-fenil-izocianát,  
 3,4-diklór-fenil-izocianát,  
 3,5-diklór-fenil-izocianát,  
 3,5-xilil-izocianát,  
 $\alpha$ -naftil-izocianát,  
 3,5-dimetoxi-fenil-izocianát,  
 2,4,5-triklór-fenil-izocianát,  
 2-klór-fenil-izocianát,  
 2-tolil-izocianát,  
 2-metoxi-fenil-izocianát és  
 3-tolil-izocianát.

A (III) általános képletű vegyületek előállítását konkrét kiindulási anyagok esetében a D reakcióvázlattal illusztrálhatjuk.

A (II) általános képletű vegyületek előállítását előnyösen valamely oldószerben, vagy hígítószerben végezzük, erre a célra, bármely közömbös oldószer vagy hígítószer alkalmazható, amelyet az (I) általános képletű vegyületek előállításánál a fentiekben felsoroltunk.

A reakció hőmérsékletét széles tartományban változtathatjuk; általában -20 és a reakcióelegy forráspontja közötti hőmérsékleten, előnyösen 0 és 100 °C közötti hőmérsékleten dolgozunk.

A (II) általános képletű vegyületek előállítását előnyösen légköri nyomás alatt végezzük, noha a művelet annál kisebb vagy nagyobb nyomáson is elvégezhető.

A találmány szerinti (I) általános képletű tetrahidro-pirimidin-származékok magas hozammal és tisztasággal állíthatók elő. A (IV) és (V) általános képletű vegyületekből előállított (II) általános képletű közbelső termékeket e vegyületek elkülönítése nélkül reagáltathatjuk tovább (I) általános képletű vegyületté.

Az (I) általános képletű vegyületek előállítását F reakcióvázlattal szemléltethetjük. A reakcióvázlatban Ar, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> és X jelentése a fenti.

Konkrét kiindulási anyagok alkalmazásával a reakció lefutását az F reakcióvázlattal mutatjuk be.

A találmány szerinti eljárás ez esetben is oldószerként közömbös hígítószer használhatunk, (a fenti felsorolás szerint); az eljárás jó eredménnyel megy végbe, ha a katalizátorként tetrabutil-ammónium-kloridot használunk. Ezen előnyös megoldásnál alkalmazott hőmérsékletre és nyomásra a fentiekben megadottak vonatkoznak.

A találmány szerinti eljárással előállított (I) általános képletű vegyületek a melegvérű állatokkal szemben csekély toxicitást és a fentiekben említett

kiváló szelektív herbicid hatást mutatják, ezért kiválóan alkalmasak a gyomnövények leküzdésére. Különösen kedvező szelektivitást mutatnak az (I) általános képletű vegyületek a haszonnövényekben növekvő gyomnövényekkel; szemben e vegyületeket tartalmazó készítményeket a gyapot és rizs megjelenése előtt vagy ezek megjelenése után hordhatjuk fel. Az (I) általános képletű vegyületeket tartalmazó készítmények a kultúrnövényeket megkímélik, egyidejűleg kiváló herbicid hatással és széles herbicid spektrummal rendelkeznek.

Gyomnövények alatt, minden olyan növényt értünk, amelyek olyan helyen növekednek, ahol azok nem kívánatosak.

A találmány szerinti készítmények az alábbi gyomnövényekkel szemben használhatók eredményesen:

Kétszikű gyomnövények:

Sinapis, Lepidium, Gallium, Stellaria, Matricaria, Anthemis, Galinsoga, Chenopodium, Urtica, Senecio, Amaranthus, Portulaca, Xanthium, Convolvulus, Ipomoea, Polygonum, Sesbania, Ambrosia, Cirsium, Carduus, Sonchus, Rorippa, Rotala, Lindernia, Lamium, Veronica, Abutilon, Emex, Datura, Viola, Geleopsis, Papaver, Centaurea és Solanum; és

Egyszikű gyomnövények:

Echinochloa, Setaria, Panicum, Digitaria, Phleum, Poa, Festuca, Eleusine, Brachiaria, Lolium, Bromus, Avena, Cyperus, Sorghum, Agropyron, Cynodon, Monocharia, Fimbristylis, Sagittaria, Eleocharis, Scirpus, Paspalum, Ischaemum, Spenoclea, Dactyloctenium, Agrostis, Alopecurus és Apera.

A találmány szerinti készítményeket az alábbi kultúrnövényekben alkalmazhatjuk szelektív herbicid szerként:

Kétszikű gyomnövények:

Gossypium, Glycine, Beta, Daucus, Phaseolus, Pisum, Solanum, Linum, Ipomoea, Vicia, Nicotiana, Lycopersicon, Arachis, Brassica, Lactuca, Cucumis és Cucurbita; és

Egyszikű kultúrnövények:

Oryza, Zea, Triticum Hordeum, Avena, Secale, Sorghum, Panicum, Saccharum, Ananas, Asparagus és Allium.

A találmány szerinti készítmények alkalmazását azonban nem korlátozhatjuk fenti növényekre, számos más növény esetében is eredményesen alkalmazhatók.

A hatóanyag koncentrációjától függően teljes gyomirtást végezhetünk, így például ipari létesítményeken, vasutvonalak mentén, tereken, amelyeken fák nem növekednek. Alkalmazhatjuk a találmány szerinti készítményeket évelő kultúrnövényekben a gyomnövények elpusztítására, erdészetben, dísznövények között, gyümölcsösben, szőlő-ültetvényekben, ciprus-, dió-, banán-, kávé-, tea-, gumi-, olajpálma-, kakaó, komló-ültetvényekben, továbbá egyéb kultúrnövényekben.

A találmány szerinti készítményeket igen jó eredménnyel alkalmazhatjuk szelektív gyomirtásra. Példaként említjük meg a rizsföldekben növekvő gyomnövényeket, ahol az alább felsorolt gyomokat irtathatjuk ki eredményesen:

**Kétszikű gyomnövények:**

Rotola indica Koehne,  
Lindernia procumbens Philcox,  
Ludwiga prostrata Roxburgh,  
Potamogeton distinctus A. Bennett és  
Elatine triandra Schkuhr  
továbbá

**Egyszikű gyomnövények:**

Echinochloa crus-galli P. Beauvois var.,  
Monochoria vaginalis Presl,  
Eleocharis acicularis L.,  
Eleocharis kuroguwai Ohwi,  
Cyperus difformis L.,  
Cyperus serotinus Rottboell,  
Sagittaria pygmaea Miquel,  
Alisma canaliculatum A. Braun et Bouché és  
Scirpus juncoides Roxburgh var.

A találmány szerinti eljárással előállított (I) általános képletű vegyületeket tartalmazó készítményeket nemcsak a víz alatt álló rizsföldeken növekvő gyomnövényekkel szemben alkalmazhatjuk, hanem egyéb mezőgazdasági területeken is. Eredményesen alkalmazhatók ezek a készítmények az ideiglenesen megművelt területek, továbbá szittyák gyomirtására; (*Juncus effesus* Linnaeus var. *decipiens* Buchanan) növények.

A készítményeket szokásos módon állíthatjuk elő oldatok, emulziók, szuszpenziók, porok, poroszerek, habok, paszták, oldható porok, granulátum, aerosol, szuszpenzió-emulzió-koncentrátumok a vetőmag kezelésére alkalmas porok formájában. Készíthetünk természetes, szintetikus anyagokat a hatóanyaggal átitatva, továbbá polimer anyagokkal készült finom kapszulákat, a vetőmag bevonatot, éghető készítményeket, így égő patronokat, füstpatronokat, füstdózisokat, füstkígyót, hideg és meleg ködképző anyagokat, amelyeket ULV (ultra low volume) eljárásban szórnak fel.

A találmány szerinti készítményeket ismert módon állíthatjuk elő így pl. hatóanyagokat segédanyagokkal, szilárd vagy folyékony hígítószerrel, adott esetben felületaktív anyagokkal így emulgeátorokkal és/vagy diszpergálószerekkel és/vagy habképzőanyagokkal elegyítjük. Abban az esetben, ha hígítószerként vizet használunk, az oldás közvetítésére szerves oldószereket is alkalmazhatunk.

A folyékony hordozóanyagok közül elsősorban a következő oldószerek jöhetnek figyelembe; aromás szénhidrogének, így xilol, toluol, vagy alkilnaftalin, klórozott aromás vagy klórozott alifás szénhidrogének, így klór-benzol, klór-etilén vagy metilén-klorid, alifás vagy alicikus szénhidrogének, így ciklohexán, vagy paraffinok, példaként említjük meg az ásványolaj frakciókat, az alkoholoikat, mint butanol vagy glikol, ezek étereit vagy észtereit; a ketonokat, mint acetont, metil-etilketont, metil-izobutilketont, vagy ciklohexanont; az erősen poláros oldószereket, így dimetil-formamid vagy dimetil-szulfoxid továbbá vizet.

A szilárd hordozóanyagok közül alkalmasak a természetes ásványokból készült porok, így kaolin, agyag, talkum, kréta, kvarc, attapulgit, montmorillonit, vagy diatomaföld, az örölt szintetikus ásványi anyagok, a nagyszuszperitászú kovasav, alumínium-oxid vagy a szilikátok; a szilárd hordozó-

anyagok közül említjük meg a természetes kőzet-zúzalekókat, továbbá a szervesen vagy szerves porokból készült szintetikus granulátumokat, valamint a szerves anyagokból, mint fűrészpor, kókuszdióhéj, kukoricacsutka, dohánynövény szárából készült porokat és granulátumokat.

Emulgeátor és/vagy habképző anyagként alkalmazhatunk nemionos vagy anionos emulgeátorokat, mint poli(oxi-etilén)-zsírsav-észtereket, poli(oxi-etilén)-zsíralkohol-étereket, így például alkil-aryl-poliglikol-étereket, alkil-szulfonátokat, alkil-szulfátokat, aril-szulfátokat, fehérje hidrolízis termékeket stb. A diszpergálószerek közül alkalmazhatunk ligninszulfitlúgot vagy metil-cellulózt.

A tapadást elősegítő anyagként használhatunk karboxi-metil-cellulózt, természetes vagy szintetikus polimerizátumot por, granulátum vagy látexformában, így például gumiarábikumot, poli(vinil-alkohol)-t, poli(vinil-acetát)-ot.

A készítményekhez használhatunk festéket, így szerves pigmenteket, mint pl. vas-oxidot, titán-oxidot, poroszkéket, szerves színezékeket, így alizarin-színezékeket, azo-színezékeket, fém-ftalocianin-színezékeket, valamint nyomelemeket, így vas-, mangán-, bór-, réz-, kobalt-, molibdén- és cink-sókat.

A készítményeket általában 0,001–60 súly%, célszerűen 0,005–50 súly% hatóanyagot tartalmaznak.

A találmány szerinti készítményeket önmagukban vagy egyéb herbicid-anyagokkal való elegyítés után használhatjuk fel. A használatnál a kész készítményt vagy az ebből készült hígítást permetezzük fel. A találmány szerinti készítményeket a fungicid, inszekticid, akaricid, nematocid, a madarakat elűző anyagokkal, a növekedést befolyásoló anyagokkal, növényi anyagokkal, így pl. a talajstruktúrát javító anyagokkal keverhetjük.

A találmány szerinti készítményeket önmagukban vagy további hígítás formájában így pl. oldatok, szuszpenziók, emulziók, porok, paszták vagy granulátumok alakjában alkalmazhatjuk. A felhasználás szokásos módon történik, nedvesítés, permetezés, beporozás, befújás stb. révén.

A találmány szerinti készítményeket a növények megjelenése előtt vagy azután permetezzük fel. Előnyös, ha a növények megjelenése előtt kerülnek felhasználásra, pl. a vetőmaggal együtt a talajba bedolgozva.

Ezen túlmenően, a készítményeket ULV eljárásban is felpermetezhetjük.

Hektáronként 0,5–5 kg, célszerűen 1,0–4,0 kg hatóanyagot tartalmazó készítményt szórunk fel. Némely esetben a fenti mennyiségnél nagyobb mennyiséget is felhordhatunk, de lehetőség van arra is, hogy a fent megadott értékeknél kisebb mennyiséget permetezzünk ki.

A találmány szerinti vegyületeket tartalmazó készítmények adott esetben felületaktív anyagot is tartalmaznak.

A találmány szerinti vegyületek és készítmények előállítására az alábbi példák szemléltetik.

*I. példa*

15 súlyrész az 1. példa szerinti vegyületet, 80 súlyrész, poralakú diatomaföld, és agyag-por 1 : 5 arányú elegyét, 2 súlyrész nátrium-alkil-benzolszulfonátot és 3 súlyrész nátrium-alkil-naftalinszulfonát (formaldehid-kondenzátumot elegyítünk majd az egészet elporítjuk. Nedvesedő port kapunk, a kapott anyagot vízzel meghígítjuk.

*II. példa*

30 súlyrész, a 2. példa szerinti vegyületet, 55 súlyrész xilolt, 8 súlyrész poli(oxi-etilén)-alkil-fenil-étert és 7 súlyrész kalcium-alkil-benzolszulfonátot elegyítünk keverés közben; így módon egy emulgeálható koncentrátumot kapunk. A permetezés előtt a fenti koncentrátumot meghígítjuk.

*III. példa*

2 súlyrész, a 3. példa szerinti vegyületet 98 súlyrész agyagporral elkeverünk, elporítunk; így módon porzószeret kapunk.

*IV. példa*

1,5 súlyrész, a 4. példa szerinti vegyületet, 0,5 súlyrész izopropil-hidrogén-foszfáttal és 98 súlyrész agyagporral elegyítünk és elporítunk. Így módon egy porzószeret kapunk.

*V. példa*

25 súlyrész vizet, 10 súlyrész, az 5. példa szerinti vegyület, 30 súlyrész bentonit (montmorillonit), 58 súlyrész talkum és 10 súlyrész ligninszulfonát elegyéhez adunk, majd az elegyet jól elkeverjük. Extruder-granulátor segítségével 0,43–2,0 mm szemcseméretű granulátumot állítunk elő, amit 40–50 °C hőmérsékleten szárítunk; a kapott granulátumot felszórjuk.

*VI. példa*

95 súlyrész agyagport és (amelynek szemcsemérete 0,2–2 mm között van) 5 súlyrész, a 7. példa szerinti vegyülettel elegyítünk. A hatóanyagot vala-

mely szerves oldószerben oldva adjuk a szilárd hordozóanyaghoz; ezt követően az elegyet 40–50 °C hőmérsékleten szárítjuk, amikor is granulátumot kapunk. A granulátumot szórással hordjuk fel.

*VII. példa*

50 súlyrész 8. példa szerinti vegyületet 1 súlyrész dibutil-naftalinszulfonáttal, 4 súlyrész ligninszulfonáttal, 8 súlyrész nagydiszperzitású kovasavval, valamint 37 súlyrész természetes kőzetliszttel elkeverünk, majd az elegyet megőröljük. A felhasználás előtt a nedvesíthető port vízzel meghígítjuk.

A herbicid hatást az alábbi biológiai vizsgálatokkal ellenőrizzük.

Az összehasonlításhoz az ismert (A) és (B) képletű vegyületeket használjuk. Az (A) képletű vegyületet az Chem. Abstracts 57, 9860a (1962) ismerteti, a (B) képletű vegyületet ugyanez az irodalmi hely ismerteti.

*A. példa*

Herbicid hatás vizsgálata gyomnövényekkel szemben, magasabban fekvő földeken (növényházi kísérletek).

Oldószer: 5 súlyrész acetone

Emulgeátor: 1 súlyrész benzil-oxi-poliglikol-éter

1 súlyrész hatóanyagot fent megadott mennyiségű oldószerrel elegyítünk, majd a kapott elegyet vízzel meghígítjuk. (0,05, 0,1 és 0,5%-os oldatokat készítünk). Műanyag edényeket (5 dm<sup>2</sup>; 25 × 20 × 10 cm) 2,5 liter megtöltünk feliszapolt földdel, (a földet előzőleg 0,5–0,5 lyukátmérőjű szitán áttörjük); gyapotmagokat (Coker 310 fajta) 1 cm mélyre elvetünk, ugyanilyen módon előkészített talajra *Digitaria adscendens* Henr., *Echinochloa crus-galli*, *Amaranthus retroflexus* L., *Chenopodium album* Linnaeus és *Portulaca clarea* Linnaeus magokat szórunk. A vizsgálandó vegyületeket tartalmazó készítményeket kívánt dózisértékben a föld felszínére szórjuk.

20 nappal a kezelést követően ellenőrizzük a herbicidhatás mértékét; a fitotoxicitást 20, 40 és 60 nappal a kezelés után vizsgáljuk. Az eredményt 0–10 beosztású skálával fejezzük ki.

A herbicid hatást a kezeletlen kontroll növényekhez viszonyítjuk és 0–10 skálával értékeljük. Az értékelést az alábbi táblázat mutatja be; a fitotoxicitást a kezeletlen kontrollnövényekhez viszonyítva 10 értékű skálán adjuk meg.

I. táblázat

Értékelés	Gyomnövény pusztulásának mértéke (a kezeletlen kontroll növényhez viszonyítva)	
10		100%
9	legalább	90%
8	legalább	80%
7	legalább	70%
6	legalább	60%
5	legalább	50%
4	legalább	40%
3	legalább	30%
2	legalább	20%
1	legalább	10%
0	kevesebb mint	10%
		teljes pusztulás
		de kevesebb, mint
		de kevesebb, mint
		de kevesebb, mint
		de kevesebb, mint
		de kevesebb, mint
		de kevesebb, mint
		de kevesebb, mint
		de kevesebb, mint
		nincs herbicid hatás

II. táblázat

Értékelés	Fitotoxicitás mértéke (a kezeltlen kontroll növényhez viszonyítva)			
10	legalább	90%	pusztulás	
9	legalább	80%	de kevesebb, mint	90%
8	legalább	70%	de kevesebb, mint	80%
7	legalább	60%	de kevesebb, mint	70%
6	legalább	50%	de kevesebb, mint	60%
5	legalább	40%	de kevesebb, mint	50%
4	legalább	30%	de kevesebb, mint	40%
3	legalább	20%	de kevesebb, mint	30%
2	legalább	10%	de kevesebb, mint	20%
1	több mint	0%	de kevesebb, mint	10%
0	0%		nincs fitotoxicitás	

III. táblázat

Vegyület száma	Hatóanyag mennyisége kg/ha	Herbicid hatás az alábbi gyomnövényekkel szemben*					Fitotoxicitás gyapot		
		D.	E.	A.	C.	P.	20	40	60
(1)	4,0	10	10	10	10	10	0	0	0
(2)	4,0	10	10	10	10	10	0	0	0
(3)	4,0	10	10	10	10	10	0	0	0
(4)	4,0	10	10	10	10	10	0	0	0
(5)	4,0	10	10	10	10	10	0	0	0
(6)	4,0	10	10	10	10	10	0	0	0
(7)	4,0	10	10	10	10	10	0	0	0
(8)	4,0	10	10	10	10	10	0	0	0
(9)	4,0	10	10	10	10	10	0	0	0
(10)	4,0	10	10	10	10	10	0	0	0
(11)	4,0	10	10	10	10	10	0	0	0
(12)	4,0	10	10	10	10	10	0	0	0
(13)	4,0	10	10	10	10	10	0	0	0
(14)	4,0	10	10	10	10	10	0	0	0
(15)	4,0	10	10	10	10	10	0	0	0
(16)	4,0	10	10	10	10	10	0	0	0
(17)	4,0	10	10	10	10	10	0	0	0
(18)	4,0	10	10	10	10	10	0	0	0
(19)	4,0	10	10	10	10	10	0	0	0
(20)	4,0	10	10	10	10	10	0	0	0
(21)	4,0	10	10	10	10	10	0	0	0
(22)	4,0	10	10	10	10	10	0	0	0
(23)	4,0	10	10	10	10	10	0	0	0
(24)	4,0	10	10	10	10	10	0	0	0
(25)	4,0	10	10	10	10	10	0	0	0
(26)	4,0	10	10	10	10	10	0	0	0
(27)	4,0	10	10	10	10	10	0	0	0
(28)	4,0	10	10	10	10	10	0	0	0
(29)	4,0	10	10	10	10	10	0	0	0
(30)	4,0	10	10	10	10	10	0	0	0
Összehasonlító vegyületek									
(A)	4,0	1	1	0	0	1	0	0	0
(B)	4,0	0	0	0	0	0	0	0	0

\* A rövidítések jelentése:

D. *Digitaria adscendens* Henr.,

E. *Echinochloa crus-galli*,

A. *Amaranthus retroflexus* L.,

C. *Chenopodium album* Linnaeus és

P. *Portulaca oleracea* Linnaeus.

## B. példa

Talajkezeléssel és a növények szárának és levelének kezelésével végzett vizsgálat vízben növekvő rizsföldeken az ott tenyésző gyomnövényekkel szemben (növényházi vizsgálatok).

2 dm<sup>2</sup> méretű Wagner-féle edényekbe rizstermelésre alkalmas földet töltünk, majd ezekbe Kinnampu-féle rizspalántákat (2–3 levél stádiumban, növénymagasság mintegy 10 cm) ültetünk. Az alábbi széles levelű gyomnövények magjait vetjük az edényekbe: *Echinochloa crus-galli*, *Cyperus* sp., *Monochoria vaginalis* Presl és *Scirpus juncoides* Roxburgh illetőleg *Eleocharis acicularis* L. kis darabjait és *Cyperus serotinus* Rottboell és *Sagittaria pyg-*

maea Miquel gyökérrészeit ültetjük el. Az edényeket nedves körülmények között tartjuk, amikor az *Echinochloa crus-galli* palánták kétleveles stádiumot elérik (7–9 nappal a vetést követően) az edényeket vízzel 6 cm magasan elöntjük. Az A. példában leírt készítményből pipettával visszük fel a vizsgálandó hatóanyagot. A kezelést követően az edényekből a vizet 2–3 ml viz/nap sebességgel, mintegy 2 nap alatt hagyjuk lecsurogni. Ezt követően az edényekben lévő növényeket 3 cm magasságig vízzel ellepjük. 4 héttel a kezelést követően ellenőrizzük a herbicid hatást és a fitotoxicitás mértékét egy 0–10 beosztású skála segítségével az A. példában leírtak szerint. Az eredményeket a IV-es táblázat tünteti fel.

IV. táblázat

Vegyület száma	Hatóanyag mennyisége kg/ha	Herbicid hatás az alábbi gyomnövényekkel szemben*								Fitotoxicitás rizsültetvényben
		A	B	C	D	E	F	G	H	
(6)	2,0	10	10	10	10	10	10	10	10	0
(17)	2,0	10	10	10	10	10	10	10	10	0
Összehasonlító vegyületek										
(A)	4,0	1	0	1	0	1	3	0	2	0
(B)	4,0	1	0	0	0	0	0	0	0	0

\* A rövidítések jelentése:

- A: *Echinochloa crus-galli*  
 B: *Eleocharis acicularis*  
 C: *Cyperus* sp.  
 D: *Scirpus juncoides*  
 E: *Monochoria vaginalis* Presl  
 F: Széleslevelű gyomnövények (mint *Lindernia procumbens*, *Rotala indica* és *Elatine triandra*)  
 G: *Cyperus serotinus*  
 H: *Sagittaria pygmaea*.

Az alább következő 1–30 példák az (I) általános képletű vegyületek előállítását ismertetik, a 31–62 példák a (II) általános képletű közbenső termékek előállítását írják le.

## Előállítási példák

## 1. példa

(1) képletű vegyület előállítása

37 g N-(3-klór-2-metil-propil)-N-fenil-N'-[3-(trifluor-metil)-fenil]-karbamidot 150 ml etanolban oldunk, majd ehhez az oldathoz 56 g etanolos 20% kálium-hidroxid-oldatot adunk. Egzoterm reakció indul meg: a reakció teljessé tételéhez az elegyet visszafolyatósító segítségével 2 óra hosszat forraljuk. Ezután az etanolt csökkentett nyomáson le-

desztilláljuk, a maradékhoz vizet adunk. A cím szerinti vegyületet kristályos anyag formában kapjuk; a kapott anyagot metanollal átkristályosítva 27 g 5-metil-1-fenil-3-(3-/trifluor-metil/-fenil)-tetrahydro-2-pirimidinont kapunk szintelen kristályok formájában. Op.: 121–123 °C.

## 2. példa

(2) képletű vegyület előállítása

40 g N-(3-klór-2-metil-propil)-N-[2-metoxifenil]-N'-[3(trifluor-metil)-fenil]-karbamidot 150 ml izopropanolban oldunk, majd 20 g vizes 50 súly% kálium-hidroxid-oldatot hozzá 30–35 °C hőmérsékleten keverés közben. A reakcióelegyet 2 óra hosszat 65–75 °C hőmérsékleten kevertetjük, majd az izopropanolt csökkentett nyomáson ledesztilláljuk. A maradékhoz 100 ml toluolt adunk, majd az elegyet 1%-os sósavval és ezután vízzel mossuk: a toluolt vízmentesítjük és csökkentett nyomáson ledesztilláljuk, ekkor 26,6 g 1-(2-metoxi-fenil)-5-metil-3-(3/trifluor-metil/-fenil)-tetrahydro-2-pirimidinont kapunk viszkózus, halvány-sárga folyadék formájában. n<sub>D</sub><sup>20</sup> 1,5398.

A 3-as, 4-es és 5-ös sz. vegyületek az 1–2. példákban leírtak szerint állítjuk elő (3–5. példák)

V. táblázat

Példa száma	Ar <sup>1</sup>	Ar <sup>2</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	Op. (°C) törésmutató n <sub>D</sub> <sup>20</sup>
3	fenil	3-klór-fenil	H	—CH <sub>3</sub>	H	124–126
4	2-klór-fenil	3-klór-fenil	H	—CH <sub>3</sub>	H	1.5936
5	2-klór-fenil	3-(trifluor-metil)-fenil	H	—CH <sub>3</sub>	H	61–64

## 6. példa

18,4 g N-(3-klór-2-metil-propil)-anilint 120 ml toluolban oldunk, majd ehhez 16,5 g 3-metiltio-fenil-izocianátot adunk szobahőmérsékleten. Ezt követően az oldatot 1 óra hosszat 40–50 °C hőmérsékleten kevertetjük. Katalitikus mennyiségű (0,2 g) tetrabutil-ammónium-bromidot adunk ezután a reakcióelegyhez; a hőmérsékletet 30–40 °C hőmérsékleten tartjuk, majd 34 g 50 súly%-os vizes kálium-hidroxid-oldatot csepegtetünk hozzá. Az elegyet

1 óra hosszat 40–50 °C hőmérsékleten kevertetjük, majd a reakcióelegyet szobahőmérsékletre hagyjuk lehűlni. A toluolos réteget elkülönítjük, 1 súly%-os sósav-oldattal, majd vízzel mossuk. A toluolt vízmentesítjük és csökkentett nyomáson ledesztilláljuk. 20,3 g 5-metil-1-(3-/metil-tio/-fenil)-3-fenil-tetrahydro-2-pirimidinont kapunk viszkózus, halvány sárga folyadék formájában.  $n_D^{20}$  1,6194.

A 7–30. példa szerinti vegyületeket a 6-os példa szerint állíthatjuk elő:

VI. táblázat  
(I) általános képletű vegyületek jellemző adatai

Példa száma	Ar <sup>1</sup>	Ar <sup>2</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	Op. (°C) törésmutató
7	fenilcsoport	(a) képletű csoport	H	—CH <sub>3</sub>	H	99–101
8	fenilcsoport	(b) képletű csoport	H	—CH <sub>3</sub>	H	118–121
9	fenilcsoport	(c) képletű csoport	H	—CH <sub>3</sub>	H	106–108
10	fenilcsoport	(d) képletű csoport	H	—CH <sub>3</sub>	H	$n_D^{19}$ 1,6045
11	fenilcsoport	(e) képletű csoport	H	—CH <sub>3</sub>	H	116,5–118,5
12	fenilcsoport	(f) képletű csoport	H	—CH <sub>3</sub>	H	122–125
13	fenilcsoport	(g) képletű csoport	H	—CH <sub>3</sub>	H	$n_D^{20}$ 1,5849
14	fenilcsoport	(h) képletű csoport	H	—CH <sub>3</sub>	H	$n_D^{19}$ 1,5863
15	fenilcsoport	(i) képletű csoport	H	—CH <sub>3</sub>	H	$n_D^{20}$ 1,6266
16	fenilcsoport	(j) képletű csoport	H	—CH <sub>3</sub>	H	141–143
17	fenilcsoport	(k) képletű csoport	H	—CH <sub>3</sub>	H	94–97
18	(o) képletű csoport	(r) képletű csoport	H	—CH <sub>3</sub>	H	$n_D^{20}$ 1,5900
19	(o) képletű csoport	(l) képletű csoport	H	—CH <sub>3</sub>	H	$n_D^{20}$ 1,5976
20	(o) képletű csoport	(m) képletű csoport	H	—CH <sub>3</sub>	H	141,5–143
21	(p) képletű csoport	(r) képletű csoport	H	—CH <sub>3</sub>	H	91–93
22	(p) képletű csoport	(n) képletű csoport	H	—CH <sub>3</sub>	H	104–106
23	(p) képletű csoport	(l) képletű csoport	H	—CH <sub>3</sub>	H	$n_D^{20}$ 1,6125
24	(r) képletű csoport	(r) képletű csoport	H	—CH <sub>3</sub>	H	155–158
25	(o) képletű csoport	(f) képletű csoport	H	—CH <sub>3</sub>	H	141,5–143,5
26	(p) képletű csoport	(e) képletű csoport	H	—CH <sub>3</sub>	H	$n_D^{19}$ 1,5861
27	(p) képletű csoport	(f) képletű csoport	H	—CH <sub>3</sub>	H	156–157
28	fenilcsoport	(r) képletű csoport	—CH <sub>3</sub>	H	H	93–95
29	fenilcsoport	(a) képletű csoport	—CH <sub>3</sub>	H	H	98–100
30	fenilcsoport	(f) képletű csoport	—CH <sub>3</sub>	H	H	106,5–109,5
30a	fenilcsoport	fenilcsoport	H	—CH <sub>3</sub>	H	128–131

(II) általános képletű közbenső termékek előállítására.  
31. példa

18,7 g 3-(trifluor-metil)-fenil-izocianátot 18,5 g N-(3-klór-2-metil-propil)-anilinnak 100 ml kloroformmal készült oldatához adjuk szobahőmérsékleten. Az elegyet 1 óra hosszat 40 °C hőmérsékleten kevertetjük. A kloroform eltávolítása után csökkentett nyomáson 37 g N-[3-klór-2-metil-propil]-N-fenil-N'-[3-(trifluor-metil)-fenil]-karbamidot kapunk. Op.: 72–75 °C.

A 31-es példa szerint eljárva állíthatjuk elő a 32–36-os példában ismertetett vegyületeket.

A 37–62-es példában ismertetett N,N'-diaril-N'-halogén-alkil-karbamid-származékokat a fentiek szerint állítjuk elő; kiindulási anyagként a táblázatban feltüntetett vegyületeket alkalmazzuk és a 31-es példában leírtak szerint járunk el.

VII. táblázat

Példa száma	Vegyület megnevezése	Op. (°C) törésmutató $n_D^{20}$
45		
32	N-(3-klór-2-metil-propil)-N-fenil-N'-[3-klór-fenil]-karbamid	99–100
33	N-(3-klór-2-metil-propil)-N-[2-metoxi-fenil]-N'-[3-trifluor-metil]-fenil]-karbamid	1,5343
34	N-(3-klór-2-metil-propil)-N-fenil-N'-[3-(metil-tio)-fenil]-karbamid	1,5974
35	N-(3-klór-2-metil-propil)-N-[2-klór-fenil]-N'-[3-klór-fenil]-karbamid	1,5681
36	N-(3-klór-2-metil-propil)-N-[2-klór-fenil]-N'-[3-(trifluor-metil)-fenil]-karbamid	1,5331

## VIII. táblázat

Példa-száma	Kiindulási anyag	Kiindulási anyag	Termék
37	N-(3-klór-2-metil-propil)-3-fluor-anilin	fenil-izocianát	N-(3-klór-2-metil-propil)-N-[3-fluor-fenil]-N'-fenil-karbamid
38	N-(3-klór-2-metil-propil)-3-bróm-anilin	fenil-izocianát	N-(3-klór-2-metil-propil)-N-[3-bróm-fenil]-N'-fenil-karbamid
39	N-(3-bróm-2-metil-propil)-3-nitro-anilin	fenil-izocianát	N-(3-bróm-2-metil-propil)-N-[3-nitro-fenil]-N'-fenil-karbamid
40	N-(3-bróm-2-metil-propil)-anilin	3-fenoxi-fenil-izocianát	N-(3-bróm-2-metil-propil)-N-fenil-N'-[3-fenoxi-fenil]-karbamid
41	N-(3-bróm-2-metil-propil)-3,4-diklór-anilin	fenil-izocianát	N-(3-bróm-2-metil-propil)-N-[3,4-diklór-fenil]-N'-fenil-karbamid
42	N-(3-klór-2-metil-propil)-anilin	3,5-diklór-fenil-izocianát	N-(3-klór-2-metil-propil)-N-fenil-N'-[3,5-diklór-fenil]-karbamid
43	n-(3-klór-2-metil-propil)-anilin	3,5-xilil-izocianát	N-(3-klór-2-metil-propil)-N-fenil-N'-[3,5-xilil]-karbamid
44	N-(3-bróm-2-metil-propil)-anilin	3,5-dimetoxi-fenil-izocianát	N-(3-bróm-2-metil-propil)-N-fenil-N'-[3,5-dimetoxi-fenil]-karbamid
45	N-(3-klór-2-metil-propil)- $\alpha$ -naftilamin	fenil-izocianát	N-(3-klór-2-metil-propil)-N-[ $\alpha$ -naftil]-N'-fenil-karbamid
46	N-(3-bróm-2-metil-propil)-2,4,5-triklór-anilin	fenil-izocianát	N-(3-bróm-2-metil-propil)-N-[2,4,5-triklór-fenil]-N'-fenil-karbamid
47	N-(3-klór-2-metil-propil)-anilin	3-metoxi-fenil-izocianát	N-(3-klór-2-metil-propil)-N-fenil-N'-[3-metoxi-fenil]-karbamid
48	N-(3-bróm-2-metil-propil)-2-toluidin	3-klór-fenil-izocianát	N-(3-bróm-2-metil-propil)-N-[2-tolil]-N'-[3-klór-fenil]-karbamid
49	N-(3-klór-2-metil-propil)-2-toulidin	3-(metil-tio)-fenil-izocianát	N-(3-klór-2-metil-propil)-N-[2-tolil]-N'-[3-(metil-tio)-fenil]-karbamid
50	N-(3-klór-2-metil-propil)-2-toulidin	3-(trifluor-metil)-fenil-izocianát	N-(3-klór-2-metil-propil)-N-[2-tolil]-N'-[3-(trifluor-metil)-fenil]-karbamid
51	N-(3-klór-2-metil-propil)-2-metoxi-anilin	3-klór-fenil-izocianát	N-(3-klór-2-metil-propil)-N-[2-metoxi-fenil]-N'-[3-klór-fenil]-karbamid
52	N-(3-klór-2-metil-propil)-2-metoxianilin	3-tolil-izocianát	N-(3-klór-2-metil-propil)-N-[2-metoxi-fenil]-N'-[3-tolil]-karbamid
53	N-(3-bróm-2-metil-propil)-2-metoxi-anilin	3-(metil-tio)-fenil-izocianát	N-(3-bróm-2-metil-propil)-N-[2-metoxi-fenil]-N'-[3-(metil-tio)-fenil]-karbamid
54	N-(3-klór-2-metil-propil)-3-klór-anilin	3-klór-fenil-izocianát	N-(3-klór-2-metil-propil)-N,N'-bisz(3-klór-fenil)-karbamid
55	N-(3-bróm-2-metil-propil)-2-toluidin	3,5-diklór-fenil-izocianát	N-(3-bróm-2-metil-propil)-N-[2-tolil]-N'-[3,5-diklór-fenil]-karbamid
56	N-(3-bróm-2-metil-propil)-2-metoxi-anilin	3,4-diklór-fenil-izocianát	N-(3-bróm-2-metil-propil)-N-[2-metoxi-fenil]-N'-[3,4-diklór-fenil]-karbamid
57	N-(3-klór-2-metil-propil)-2-metoxi-anilin	3,5-diklór-fenil-izocianát	N-(3-klór-2-metil-propil)-N-[2-metoxi-fenil]-N'-[3,5-diklór-fenil]-karbamid
58	N-(3-klór-1-metil-propil)-anilin	3-klór-fenil-izocianát	N-(3-klór-1-metil-propil)-N-fenil-N'-[3-klór-fenil]-karbamid
59	N-(3-klór-2-metil-propil)-anilin	3-(trifluor-metil)-fenil-izocianát	N-(3-klór-2-metil-propil)-N-fenil-N'-[3-(trifluor-metil)-fenil]-karbamid
60	N-(3-klór-1-metil-propil)-anilin	3,5-diklór-fenil-izocianát	N-(3-klór-1-metil-propil)-N-fenil-N'-[3,5-diklór-fenil]-karbamid
61	N-(3-bróm-2-metil-propil)-anilin	3-(trifluor-metil)-fenil-izocianát	N-(3-bróm-2-metil-propil)-N-fenil-N'-[3-(trifluor-metil)-fenil]-karbamid
62	N-(3-bróm-2-metil-propil)-2-metoxi-anilin	3-(trifluor-metil)-fenil-izocianát	N-(3-bróm-2-metil-propil)-N-[2-metoxi-fenil]-N'-[3-(trifluor-metil)-fenil]-karbamid

## Szabadalmi igénypontok

1. Herbicid készítmény, amelyben szilárd hordozóanyagként diatomaföld, folyékony hígítóanyagként xilol és adott esetben felületaktív anyagként polioxietilén-alkil-fenil-éter van, azzal jellemezve,

60 hogy a készítmény hatóanyagként 0,1–60 súly%-ban legalább egy (I.) általános képletű metil-szubsztituált tetrahidro-2-pirimidinon-származékot tartalmaz, a képletben

Ar<sup>1</sup> jelentése adott esetben halogénatommal, 1–4 szénatomos alkil- vagy 1–4 szénatomos alkoxico-

porttal egyszeresen helyettesített fenilcsoport, Ar<sup>2</sup> jelentése naftilcsoport vagy adott esetben nitro-, fenoxi-, 1–4 szénatomos alkil-tio- vagy trifluor-metil-csoporttal egyszeresen vagy 1–4 szénatomos alkil- vagy 1–4 szénatomos alkoxi-csoporttal legfeljebb kétszeresen vagy halogénatommal legfeljebb háromszorosan helyettesített fenilcsoport, R<sup>1</sup> és R<sup>2</sup> közül az egyik jelentése metilcsoport, a másik jelentése hidrogénatom és R<sup>3</sup> jelentése hidrogénatom.

2. Eljárás az (I) általános képletű metil-szubsztituált tetrahidro-2-pirimidinon-származék előállítására, a képletben

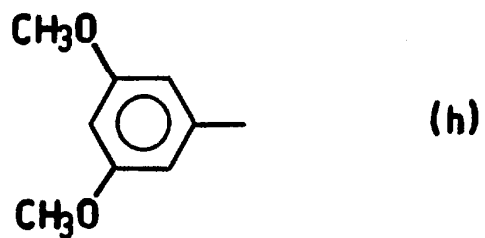
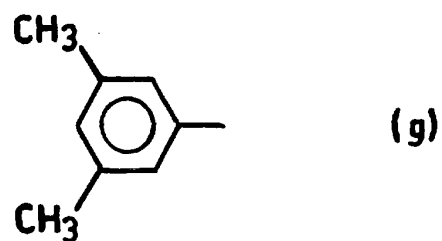
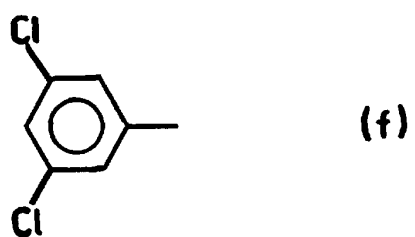
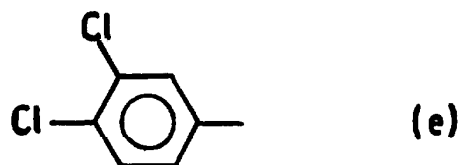
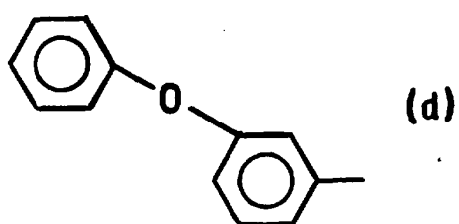
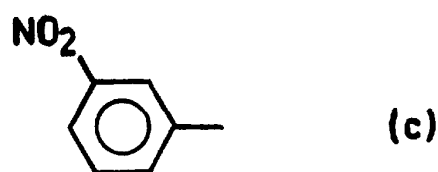
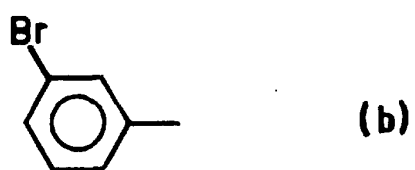
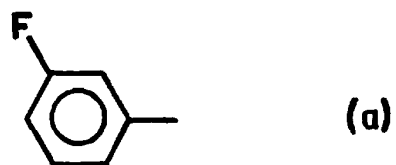
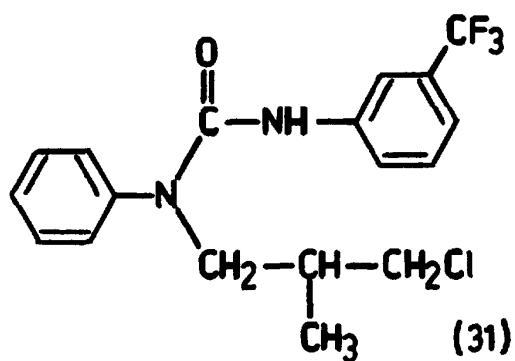
Ar<sup>1</sup> jelentése adott esetben halogénatommal, 1–4 szénatomos alkil- vagy 1–4 szénatomos alkoxicsoporttal egyszeresen helyettesített fenilcsoport, Ar<sup>2</sup>

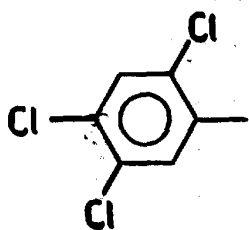
jelentése naftilcsoport vagy adott esetben nitro-, fenoxi-, 1–4 szénatomos alkil-tio- vagy trifluor-metil-csoporttal egyszeresen vagy 1–4 szénatomos alkil- vagy 1–4 szénatomos alkoxi-csoporttal legfeljebb kétszeresen vagy halogénatommal legfeljebb háromszorosan helyettesített fenilcsoport, R<sup>1</sup> és R<sup>2</sup> közül az egyik jelentése metilcsoport, a másik jelentése hidrogénatom és R<sup>3</sup> jelentése hidrogénatom *azzal jellemezve*, hogy valamely (II) általános képletű vegyület – a képletben Ar<sup>1</sup>, Ar<sup>2</sup>, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> és R<sup>3</sup> jelentése a fenti, X jelentése halogénatom – valamely (III) általános képletű alkálifém-hidroxiddal – a képletben M jelentése alkálifématom – adott esetben egy oldószer vagy hígítószer jelenlétében reagáltatunk.

---

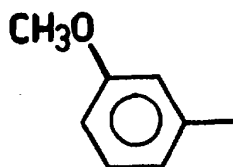
6 db ábra

---

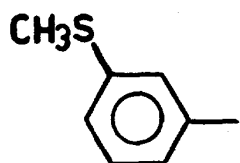




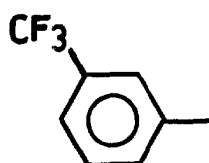
(j)



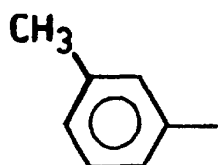
(k)



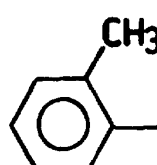
(l)



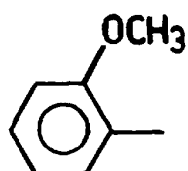
(m)



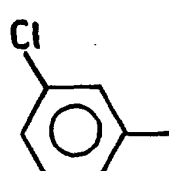
(n)



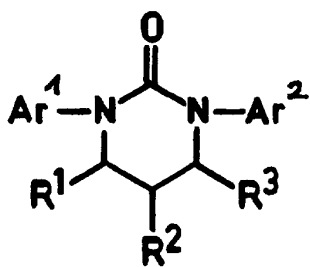
(o)



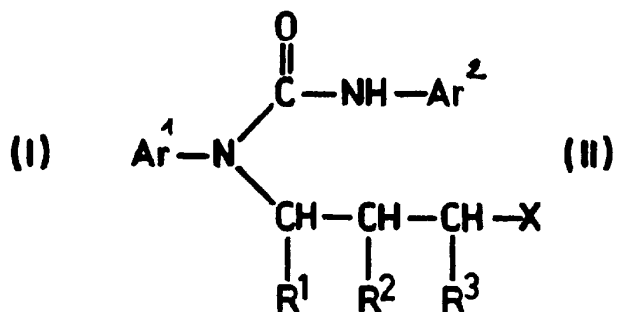
(p)



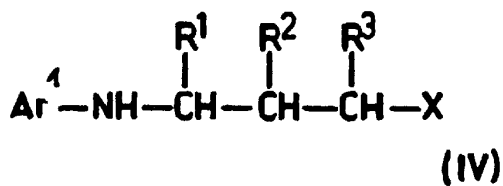
(r)

NSZO<sub>4</sub>: A 01 N 43/54  
C 07 D 239/10

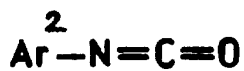
MOH



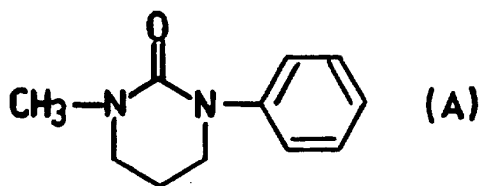
(III)



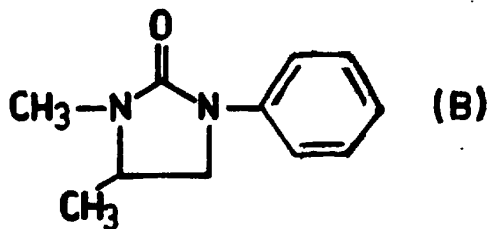
(IV)



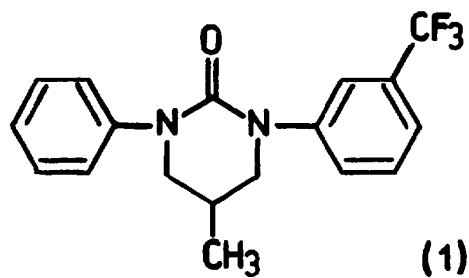
(V)



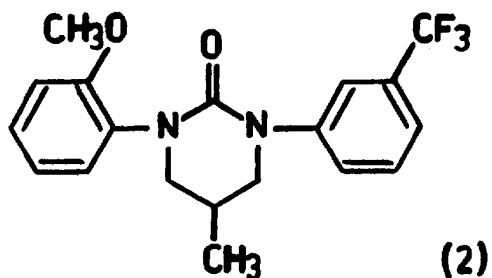
(A)



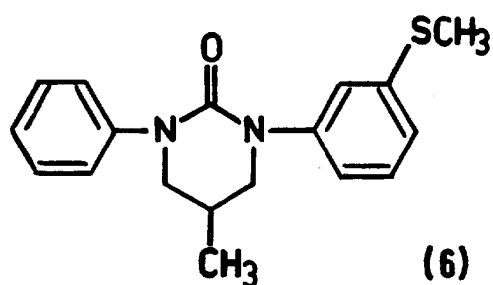
(B)



(1)

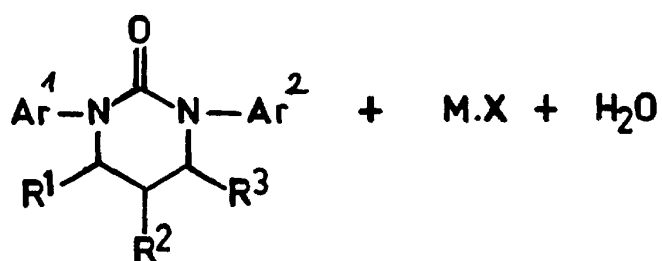
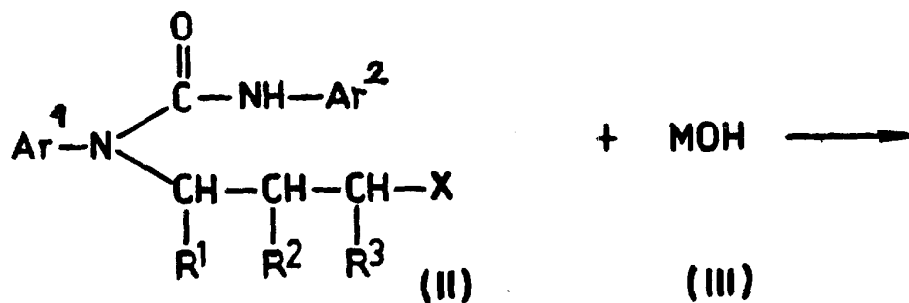


(2)

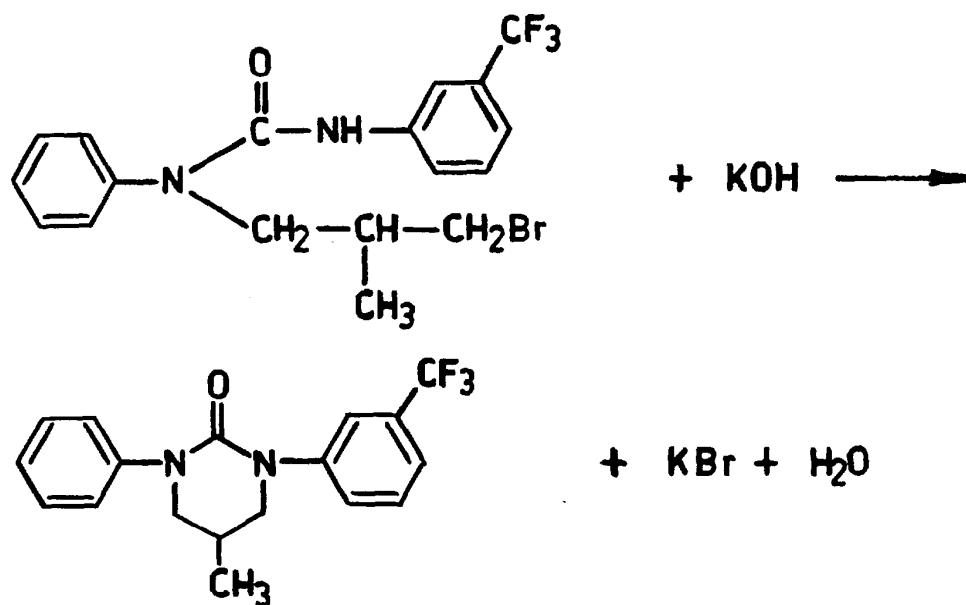


(6)

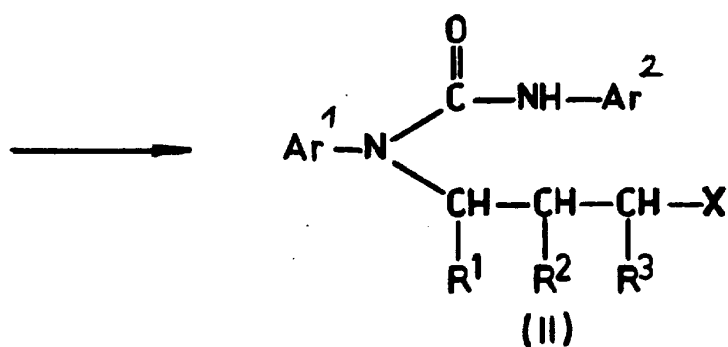
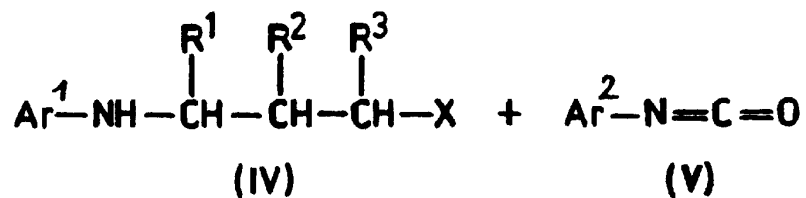
## A reakcióvázlat



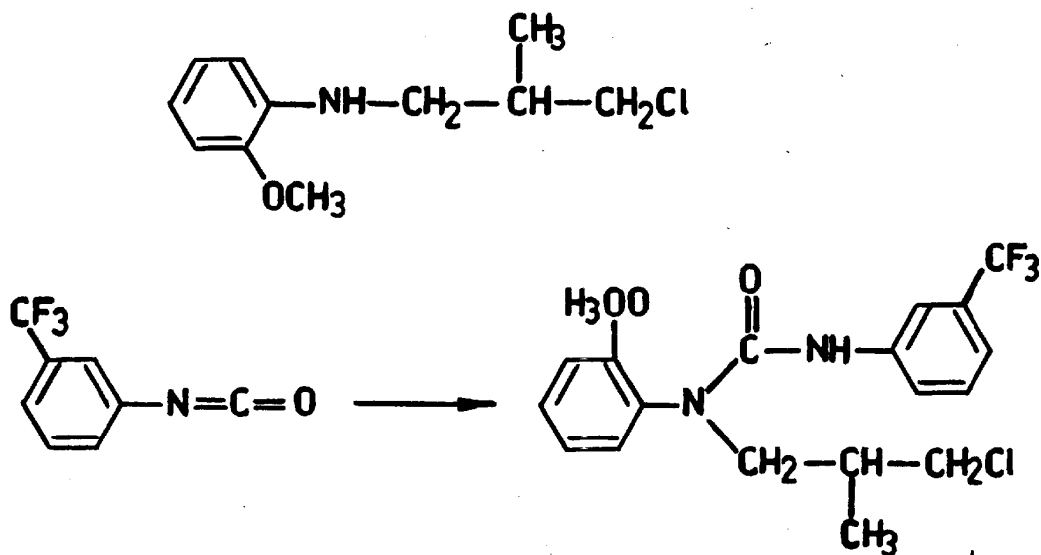
## B reakcióvázlat



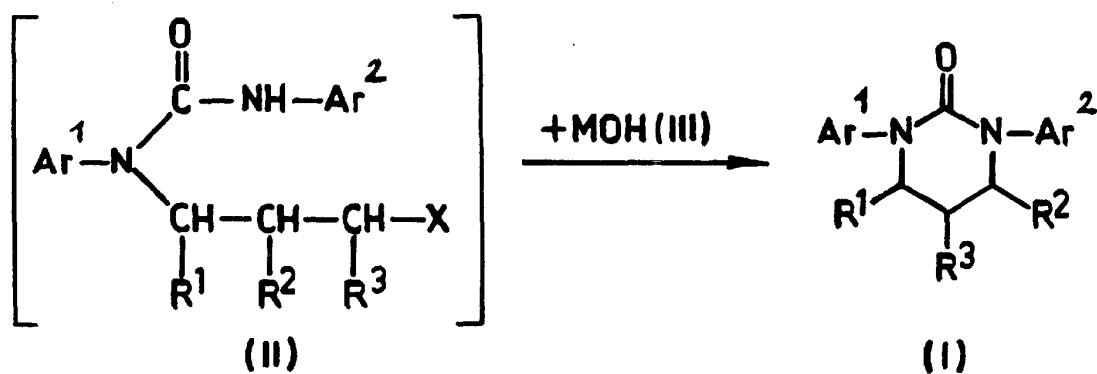
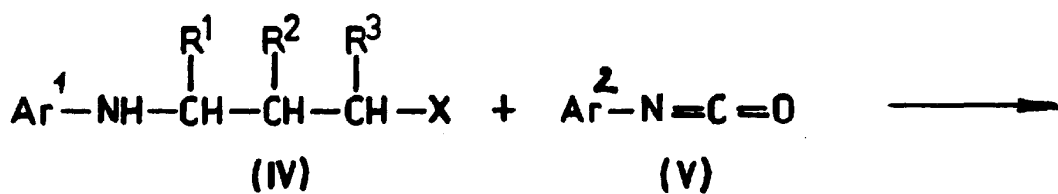
## C reakcióvázlat



## D reakcióvázlat



## E reakcióvázlat



## F reakcióvázlat

