

2054/92

A

KÖZZÉTÉTELI
PÉLDÁNY

3 3 7 6 5

62180

N-(FOSZFONO-METIL)-GLICINT TARTALMAZÓ HERBICID KÉSZÍTMÉNYEK

CHEMINOVA AGRO A/S, Lemvig, Dánia

Bejelentés napja: 1990. 12. 17.

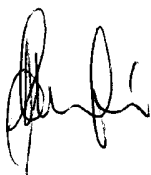
Elsőbbsége: 1989. 12. 20. (6490/89) Dánia

Nemzetközi bejelentés száma: PCT/DK90/00329

~~Nemzetközi közzététel száma: WO 91/08666~~

K I V O N A T

A találmány szerinti herbicid készítmény vízzeloldható por vagy granulátum formájú, szabadon folyó készítmény, amely herbicid szempontból hatásos mennyiségben N-(foszfono-metil)-glicint (glifozátsavat) és egy poralakú vagy granulált, nem ^{ionos} felületaktív szert tartalmaz, amely egy egyenes szénláncú, telített, nagy móltömegű (16-18 szénatom átlagos lánchosszúságú, 1 mól zsíralkoholra vonatkoztatva mintegy 25 egység etilén-oxidot tartalmazó, mintegy 16 HLB értékű) zsíralkohol poliglikol-étere, és a glifozátsav felületaktív szerhez viszonyított aránya 6:1 - 1:6, előnyösen 2:1 - 1:2.



2059/12

A

**KÖZZÉTÉTELI
PÉLDÁNY**

2059/12
62180
A/N 25/2
A/N 25/30
A/N 57/20

Képviselő:

DANUBIA SZABADALMI ÉS VÉDJEGY IRODA KFT.

Budapest

N-(FOSZFONO-METIL)-GLICINT TARTALMAZÓ HERBICID KÉSZITMÉNYEK

CHEMINOVA AGRO A/S, Lemvig, Dánia

Feltaláló:

MØLLER, Jens Christian, Lemvig, Dánia

Bejelentés napja: 1990. 12. 17.

Elsőbbsége: 1989. 12. 20. (6490/89) Dánia

Nemzetközi bejelentés száma: PCT/DK90/00329

Nemzetközi közzététel száma: WO 91/08666

75021-1573-SI

A találmány új, vízben oldható, nagy töménységű és hatékony, por vagy granulátum formájú herbicid készítményre vonatkozik, amely hatóanyagként u.n. glifozátot tartalmaz szabad sav formájában.

A glifozátsav - amelyet N-(foszfono-metil)-glicinnek is neveznek ($\text{HOOCCH}_2\text{NHCH}_2\text{PO}(\text{OH})_2$) - és különösen a fenti sav sói mint hatékony, teljesen poszt-emergens hatású herbicidek ismertek [lásd például a "The Herbicide Glyphosate" (E. Grossbard és D. Atkinson, Butterworth & Co. Ltd., (1985) ISBN 0-408-11153-4].

A glifozát előállítására számos eljárás ismert a szakirodalomból, például a 3 977 860 és 4 486 358 számú amerikai egyesült államokbeli szabadalmi leírásokból. A glifozátot rendszerint szabad sav formájában izolálják, ez a legegyszerűbb módja a tiszta termék izolálásának.

A következőkben határozott különbséget kell tenni a glifozát, mint szabad sav és a glifozátsók között, mivel a találmány tárgya a szabad savat tartalmazó készítmény, míg az egyéb találmányok többsége a glifozátsókat tartalmazó készítményekre vonatkozik.

A piaci forgalomban lévő készítmények a glifozát ammóniumsóját vagy még gyakrabban izopropil-amin-sóját tartalmazzák. Az egyik ismert készítményt Roundup néven forgalmazzák. A szakirodalomból ismert egyéb sók közé tartoznak a nátrium- és káliumsók.

A fenti készítményekre vonatkozó szabadalmi leírások az alábbiak 4 405 531 és 3 799 758 számú amerikai egyesült államokbeli szabadalmi leírások, 274 369 számon publikált

európai szabadalmi leírás, a 2348/88 számon bejelentett dán szabadalmi leírás és a 2 098 481 számon publikált nagy-britanniai szabadalmi leírás.

A fenti típusú készítményeket nem ismertetjük részletesebben, mivel ezek a találmány oltalmi körén kívül esnek.

Glifozátsavat tartalmazó készítményt ismertet D.J. Turner és P.M. Tabbush [BCPC Monogram 28 (1985)]. A fenti szakirodalmat tanulmányozva azonban megállapítható, hogy ez nem savkészítményre vonatkozik, mivel a savat 100 °C-on 1 órán keresztül melegítve vizes közegben az reakcióba lép a feleslegben lévő zsíraminnal, és ezáltal a glifozátsav sóvá alakul.

A 206 537 számú európai szabadalmi leírásban glifozátszármazékokat tartalmazó szilárd, így poralakú vagy granulátum formájú készítményeket ismertetnek. A fenti készítményeket úgy állítják elő, hogy a felületaktív szert megolvasztják, és oldószer segítségével a glikozátszármazékot koncentrált oldat formájában hozzáadják. Ezek után az oldószert eltávolítják. Azonban a fenti szabadalmi leírásban nem közölnek olyan példát, amelyben a glifozátot szabad sav formájában alkalmaznák, és ez érthető, mivel a szabad sav oldhatósága olyan csekély, hogy a 206 537 számú európai szabadalmi leírásban ismertetett eljárás nem alkalmazható szabad savat tartalmazó készítmények előállítására.

A Research Disclosure-ben (1986. november 27161) glifozátsavból készített nedvesíthető por készítményt ismertetnek, azonban a leírásból világosan kitűnik, hogy ez a készítmény nem vízzoldható, így a találmány oltalmi körén kívül esik.

A találmány azon a meglepő felismerésen alapul, hogy

szabadalmi leírás és a 2 098 481 számon publikált nagy-britanniai szabadalmi leírás.

A fenti típusú készítményeket nem ismertetjük részletebben, mivel ezek a találmány oltalmi körén kívül esnek.

Glifozátsavat tartalmazó készítményt ismertet D.J. Turner és P.M. Tabbush [BCPC Monogram 28 (1985)]. A fenti szakirodalmat tanulmányozva azonban megállapítható, hogy ez nem savkészítményre vonatkozik, mivel a savat 100 °C-on 1 órán keresztül melegítve vizes közegben az reakcióba lép a feleslegben lévő zsíraminnal, és ezáltal a glifozátsav sóvá alakul.

A 206 537 számú európai szabadalmi leírásban glifozátszármazékokat tartalmazó szilárd, így poralakú vagy granulátum formájú készítményeket ismertetnek. A fenti készítményeket úgy állítják elő, hogy a felületaktív szert megolvasztják, és oldószer segítségével a glikozátszármazékot koncentrált oldat formájában hozzáadják. Ezek után az oldószert eltávolítják. Azonban a fenti szabadalmi leírásban nem közölnek olyan példát, amelyben a glifozátot szabad sav formájában alkalmaznák, és ez érthető, mivel a szabad sav oldhatósága olyan csekély, hogy a 206 537 számú európai szabadalmi leírásban ismertetett eljárás nem alkalmazható szabad savat tartalmazó készítmények előállítására.

A Research Disclosure-ben (1986. november 27161) glifozátsavból készített nedvesíthető por készítményt ismertetnek, azonban a leírásból világosan kitűnik, hogy ez a készítmény nem vízzoldható, így a találmány oltalmi körén kívül esik.

A találmány azon a meglepő felismerésen alapul, hogy egy bizonyos poralakú felületaktív anyag és a glifozátsav egy-

szerű kombinációja olyan vízben oldható, szabadon folyó készítményt eredményez, amelynek herbicid aktivitása jobb, vagy legalább is olyan jó, mint a Roundup aktivitása, és költség/hatékonyság aránya lényegesen jobb.

Számos vizsgálatot végeztünk olyan glifozáttartalmú készítmények kifejlesztésére, amelyek a glifozátsavat szabad formában tartalmazzák, és amelyek hosszú időn keresztül változatlan kémiai és fizikai tulajdonságokkal rendelkeznek, továbbá képesek a hagyományos készítményekhez hasonló, vagy annál jobb herbicid aktivitás kifejtésére, de amelyek a szokásos készítményektől eltérően a glifozátsavat nem só formában tartalmazzák és nem tartalmazzak nagy mennyiségű vizet. A fenti vizsgálatok eredményeképpen azt tapasztaltuk, hogy ha a szabad sav formában lévő glifozátot egy zsíralkohol, poliglikol-étere típusú nem-ionos felületaktív szerrel, és kívánt esetben komplexáló és penetrációt fokozó szerekkel, vagy hasonló adalékanyagokkal keverjük, az így kapott igen hatékony készítmény a kívánt tulajdonságokkal rendelkezik.

Fentieknek megfelelően a találmány fő célja a glifozát szabad sav formáját tartalmazó, herbicid hatású, poralakú vagy granulátum formájú készítmény előállítása, amely hosszabb időn keresztül is megtartja kémiai és fizikai tulajdonságait.

Pontosabban a találmány célja olyan herbicid hatású készítmény előállítása, amely mentes a glifozát sókat tartalmazó készítmények szokásos előállításával és kezelésével járó hátrányoktól.

A találmány további tárgya olyan herbicid hatású készítmény előállítása, amelyben a glifozátsav szabadon folyó,

vízben oldható készítmény formájában van.

A fenti kívánalmaknak megfelelő készítményt gazdaságosan állíthatjuk elő egyszerű eljárással, amelynek lényege, hogy a szabad sav formájú glifozát finom részecskéit, a felületaktív szert és kívánt esetben komplexáló és penetráló szereket vagy hasonló adalékanyagokat mechanikus eszközökkel összekeverjük.

A találmány szerinti készítményt röviden az alábbiakban ismertetjük. A találmány szerinti készítmény alapvetően az alábbi komponenseket tartalmazza:

N-(foszfono-metil)-glicin

por vagy granulátum formájú felületaktív szer.

Nagyon fontos a felületaktív szer megválasztása. A felületaktív szernek szobahőmérsékleten vízben oldható, szilárd anyagnak kell lennie, ami azt jelenti, hogy olvadáspontjának magasnak kell lennie. Ezen kívül nem szabad viaszosnak lennie, hanem száraz, szabadon folyó por vagy granulátum formájúnak kell lennie.

A találmány szerinti készítményben alkalmazott speciális nem-ionos, felületaktív szer egyenes szénláncú telített, nagy móltömegű etoxilezett zsíralkohol poliglikol-étere, amely zsíralkohol átlagos lánchosszúsága 16 - 18 szénatom, mintegy 25 egység etilén-oxidot tartalmaz egy mól zsíralkoholra számítva, és HLB értéke mintegy 16. A fenti felületaktív szerre példaként említhetjük a Genapol T 250 néven forgalmazott anyagot.

Szakember számára nyilvánvaló, hogy a találmány tárgykörébe eső egyéb felületaktív szerek is megfelelőek lehetnek.

Ezenkívül különféle vízben oldható adalékanyagokat is adhatunk a készítményhez por vagy granulátum formájában, anélkül, hogy a találmány jellegét megváltoztatnánk.

Kis mennyiségben folyadék formában lévő egyéb adalékanyagokat is alkalmazhatunk, amennyiben nem befolyásolják a készítmény szabadon folyó fizikai jellegét.

Adalékanyagként például komplexáló szereket, penetrációt fokozó szereket, felületi tenziót és kontakt szöveget csökkentő szereket, nedvesítő szereket és habzásgátló szereket alkalmazhatunk.

A találmány szerinti készítményben alkalmazható komplexáló szerek kereskedelmi forgalomban hozzáférhető termékek. Megfelelő komplexáló szerként említhetjük az ammónium-szulfátot, nátrium-szulfátot, trinátrium-foszfátot, nitrilotriecetsav-trinatriumsót, etilén-diamin-tetraecetsavat, citromsavat, almasavat, ammónium-foszfátot és diamónium-hidrogén-ortofoszfátot.

A találmány szerinti készítményben alkalmazható penetrációt fokozó szerek kereskedelmi forgalomban kapható termékek. Megfelelő penetrációt fokozó szerek azok, amelyek a növény sejttaktivitásának felgyorsításával elősegítik a növény érrendszerébe való bejutást, ezek közé tartozik az ammónium-szulfát, ammónium-foszfát, ammónium-trimetilén-foszfonsav, diammónium-hidrogén-foszfát, ammónium-karbonát, ammónium-acetát, triammónium-foszfát, ammónium-hidrogén-karbonát, karbamid, ammónium-hidrogén-szulfát és ammónium-dihidrogén-foszfát.

A találmány szerinti készítményben alkalmazható felü-

leti tenziót és kontakt szöget csökkentő szerek szintén kereskedelmi forgalomban lévő termékek. Megfelelő felületi tenziót és kontakt szöget csökkentő szerek például a szerves szilikonok, a polioxi-etanol-észterek és a különféle felületaktív szerek.

A találmány szerinti készítményben alkalmazható nedvesítő szerek kereskedelmi forgalomban lévő termékek. Megfelelő nedvesítő szerek például a hexilén-glikol, glicerín, nátrium-karboxi-metil-cellulóz, polivinil-pirrolidon, természetes gumik, alginátok és poli(akril-amid).

A találmány szerinti készítményben alkalmazható habzágátló szerek kereskedelmi forgalomban lévő termékek. Habzágátló szerként alkalmazhatunk például dimetil-polisziloxánokat.

A fenti termékek említésével természetesen nem kívánjuk kizárni a hasonló hatású egyéb termékek alkalmazását a találmány szerinti készítményben. A herbicid hatást tekintve ki-mutathatóan meglepő javuláson kívül egyéb jelentős előnyökkel is rendelkezik a találmány szerinti készítmény.

Azokkal a készítményekkel összehasonlítva, amelyek vízben oldott sókon alapulnak, a találmány szerinti sav-készítmények különleges előnye, hogy a komponensek egyszerű, száraz keverési eljárásával előállíthatók, szemben a szokásos készítményekben szükséges oldási eljárással. Ezenkívül a víz elhagyása a készítményekből hozzájárul a tárolás és raktározási költségek csökkenéséhez. Ezzel szemben az ismert, vízben oldott só-készítmények, mint például a Roundup mintegy 50% vizet tartalmaznak.

A szakirodalomból ismert, hatóanyagként szabad savat tartalmazó készítményekkel összehasonlítva a találmány szerinti készítmények nem tartalmaznak vízben oldhatatlan komponenseket. Ennek következtében az alkalmazás során nem dugulnak el az alkalmazásra használt készülékek, ezenkívül a felhasználó könnyen meg tudja állapítani, hogy mikor oldódik fel a por permetezőtankban és a permetező elegy mikor kész a felhasználásra.

A szuszpenziós koncentrátumok szintén jelentős mennyiségű vizet tartalmaznak, és ezért nem fagyállóak. A találmány szerinti por formájú vagy granulátum készítmények természetük-nél fogva fagyállóak.

Ezenkívül a találmány szerinti por vagy granulátum készítményeket igen könnyű összegyűjteni abban az esetben, hogyha a koncentrátum véletlenül kiömlik, és így környezet-védelmi szempontból sokkal biztonságosabban használható.

A találmány szerinti glifozátsav készítmény tehát mind előállítás, mind kezelése, mind alkalmazása szempontjából óriási előnyökkel jár.

A találmány szerinti készítményben a glifozátsav és a felületaktív szer aránya tág határok között változhat. A felületaktív szer mennyisége jelentős befolyással bírhat a glifozátsav hatékonyságára, és a glifozátsav felületaktív szerhez viszonyított aránya a kívánalomnak megfelelően választható. A glifozátsav és felületaktív szer aránya rendszerint közelítőleg 6:1 és közelítőleg 1:6 között változhat. Az arány előnyösen mintegy 2:1 - 1:2 lehet.

A találmány szerinti készítmény előnyösen poralakú

vagy granulált ammónium-szulfátot is tartalmaz, a glifozátsav aránya az ammónium-szulfáthoz mintegy 4:1 - 1:500, és előnyösen mintegy 1:1 - 1:8 lehet.

A találmány szerinti készítmény egy másik előnyös kiviteli alakja komplexáló szert is tartalmaz, a glifozátsav aránya a komplexáló szerhez viszonyítva mintegy 100:1 - 2:1, és előnyösen mintegy 20:1 - 5:1 lehet.

A találmány szerinti készítményeket közelebbről az alábbi példákban ismertetjük, a példákban a százalékok tömegszázalékot jelentenek.

1. példa

Glifozátsav	35%
<u>Genapol T 250</u>	<u>65%</u>
Összesen	100%

2. példa

Glifozátsav	65%
<u>Genapol T 250</u>	<u>35%</u>
Összesen	100%

Az 1. és 2. tesztrendszerekben vizsgált készítményeket az alábbiak szerint állítjuk elő és alkalmazzuk.

Az 1. és 2. tesztrendszerben vizsgált összes készítményt úgy állítjuk elő, hogy az egyes komponenseket egyenként vagy együtt egy egyszerű mechanikus keverőberendezésbe helyezzük, és addig keverjük, amíg az elegy homogén lesz.

A termékeket vízben oldva alkalmazzuk, és a szokásos, vizes hígításos készítmények alkalmazására használt permetező berendezéssel szórjuk ki.

Az alkalmazandó készítmény mennyisége hektáranként a

növény fajtájától, a mikroklímától és a kívánt hatékonysági foktól függ. Rendszerint a dózis 0,1 és 10 kg/ha között változhat.

A találmány szerinti készítmények hatékonyságát az alábbi példák bizonyítják. A hatékonyságot a Roundup-éval hasonlítjuk össze, és a teszteket két különböző tesztrendszerben hajtjuk végre az alábbiak szerint:

1. Tesztrendszer

Készítmény		Dózis (g hatóanyag/terület-egység)	Hatékonyság Hordeum vulgare ellen (%-os pusztulás)
Roundup		20	4
		60	10
		180	60
		540	100

Glifozátsav	40 tömeg%	20	11
Genapol T 250	60 tömeg%	60	26
		180	80
		540	100

Glifozátsav	16 tömeg%	20	24
Genapol T 250	12 tömeg%	60	54
Ammónium-szulfát	70 tömeg%	180	84
		540	100

1. tesztrendszer folytatása

Készítmény		Dózis (g ható- anyag/terület- egység)	Hatékonyság Hordeum vulgare ellen (%-os pusztulás)
Glifozátsav	16 tömeg%	20	20
Genapol T 250	12 tömeg%	60	61
Ammónium-szulfát	65 tömeg%	180	94
Komplexáló szer	7 tömeg%	540	100
(NaNTA)			

Glifozátsav	16 tömeg%	20	24
Genapol T 250	12 tömeg%	60	52
Ammónium-szulfát	58 tömeg%	180	86
Felületi ten- ziót csökkentő szer	4 tömeg%	540	100
Inert hordozó- anyag	10 tömeg%		

Glifozátsav	16 tömeg%	20	24
Genapol T 250	12 tömeg%	60	48
Ammónium-szulfát	58 tömeg%	180	88
Komplexáló szer	7 tömeg%	540	100
Felületi ten- ziót csökkentő szer	4 tömeg%		
Habzástgátló szer	1 tömeg%		
Inert hordozó- anyag	2 tömeg%		

2. Tesztrendszer

Készítmény	Dózis (g ható- anyag/terület- egység)	Elymus repens száraz tömeg aratóskor (g/terület)	% újra- növés
Roundup	25	6,0	39,0
	50	4,5	15,1
	100	3,6	4,7
Glifozátsav	16 tömeg% 25	4,4	13,3
Genapol T 250	12 tömeg% 50	2,9	6,2
Ammónium-szulfát	65 tömeg% 100	1,7	1,7
Komplexáló szer	7 tömeg%		
(NaNTA)			

Roundup a kereskedelmi neve a Monsanto cég által gyártott glifozátsó készítménynek.

Noha a találmányt specifikus kiviteli alakokkal kapcsolatban ismertettük, a közölt adatokkal a találmány ol-
talmi körét nem kívánjuk korlátozni, és magától értetődő, hogy
az ekvivalens megoldások, változtatások és módosítások szintén
a találmány tárgykörébe esnek.

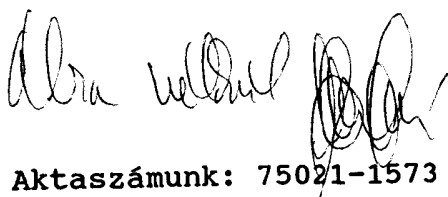
Szabadalmi igénypontok

1. Herbicid készítmény a z z a l j e l l e -
m e z v e , hogy az vízoldható por vagy granulátum
formájú, szabadon folyó készítmény, amely herbicid szempontból
hatásos mennyiségben N-(foszfono-metil)-glicint (glifozátsa-
vat) és egy poralakú vagy granulált, nem-ionos felületaktív
szert tartalmaz, amely egy egyenes szénláncú, telített, nagy
móltömegű (16-18 szénatom átlagos lánchosszúságú, 1 mól zsír-
alkoholra vonatkoztatva mintegy 25 egység etilén-oxidot tartal-
mazó, mintegy 16 HLB értékű) zsíralkohol poliglikol-étere, és
a glifozátsav felületaktív szerhez viszonyított aránya
6:1 - 1:6, előnyösen 2:1 - 1:2.

2. Az 1. igénypont szerinti készítmény, a z z a l
j e l l e m e z v e , hogy poralakú vagy granulált
ammónium-szulfátot is tartalmaz, a glifozátsav aránya az
ammónium-szulfáthoz viszonyítva 4 : 1 - 1 : 500, előnyösen
1 : 1 - 1 : 8.

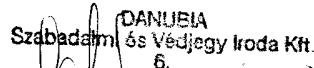
3. Az 1. igénypont szerinti készítmény, a z z a l
j e l l e m e z v e , hogy komplexáló szert is tartalmaz,
a glifozátsav aránya a komplexáló szerhez viszonyítva
100 : 1 - 2 : 1, előnyösen 20 : 1 - 5 : 1.

A meghatalmazott:



Aktaszámunk: 75021-1573 SI

Ügyintézőnk: dr.Kiss Ildikó


DANUBIA
Szabadalmi és Védjegy Iroda Kft.
6.