

(19) Országkód:

HU



**MAGYAR
KÖZTÁRSASÁG
ORSZÁGOS
TALÁLMÁNYI
HIVATAL**

SZABADALMI LEÍRÁS

(11) Lajstromszám:

206 705 B

(21) A bejelentés száma: 5898/90
(22) A bejelentés napja: 1990. 09. 13.
(30) Elsőbbségi adatok:
P 39 31 060 1989. 09. 14. DE

(51) Int. Cl.⁵

C 07 D 403/04

A 01 N 43/653

A 01 N 43/54

(40) A közzététel napja: 1991. 03. 28.
(45) A megadás meghirdetésének dátuma a Szabadalmi
Közlönyben: 1992. 12. 28. SZKV 92/12

(72) Feltalálók:

dr. Tarara, Gerhard, Berlin (DE)
dr. Krüger, Gabriele, Berlin (DE)
dr. Wegner, Peter, Berlin (DE)
dr. Johann, Gerhard, Berlin (DE)
dr. Rees, Richard, Berlin (DE)

(73) Szabadalmaz:

Schering Ag., Berlin-Bergkamen (DE)

(54)

**Eljárás 1-(metoxi-pirimidinil)-1H-1,2,4-triazol-
3-szulfonsav-nitro-anilid-származékok előállítására, a vegyületeket
hatóanyagként tartalmazó herbicid készítmények és eljárás herbicidként történő
alkalmazásra**

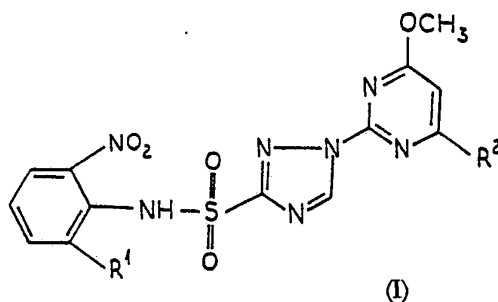
(57) KIVONAT

A találmány tárgya eljárás az (I) általános képletű
1-metoxi-pirimidinil-1H-1,2,4-triazol-3-szulfonsav-
nitro-anilidek előállítására, a képletben

R¹ jelentése metilcsoport, metoxicsoport, allil-oxi-
csoport vagy propargil-oxi-csoport és

R² jelentése metilcsoport vagy metoxicsoport, azzal a
megkötéssel, hogy R¹ jelentése metilcsoporttól el-
térő, amennyiben R² metoxicsoportot képvisel.

Az említett vegyületeket tartalmazó szerek külö-
nösen rizskultúrákban alkalmazhatók előnyösen.



A találmány új 1-(metoxi-pirimidinil)-1H-1,2,4-triazol-3-szulfonsav-nitro-anilid-származékok előállításának eljárására, e vegyületeket tartalmazó herbicid szerekre, valamint alkalmazásukra vonatkozik.

A 0246 749 sz. európai szabadalmi bejelentésben (A) általános képletű, herbicid hatású triazol-szulfonamid származékokat és ezek sóit igénylik, a képletben R^1 jelentése hidrogénatom, egy szubsztituált vagy szubsztituálatlan alkilcsoport, alkenilcsoport, alkinilcsoport, cikloalkilcsoport, arilcsoport, aralkilcsoport, acilcsoport, alkoxi-karbonil-csoport, amino-karbonil-csoport, szulfonilcsoport vagy egy heterociklusos csoport,

R^2 jelentése hidrogénatom, halogénatom, cianocsoport, hidroxilcsoport, merkaptocsoport, egy szubsztituált vagy szubsztituálatlan alkilcsoport, alkenilcsoport, alkinilcsoport, alkoxycsoport, alkil-tio-csoport, alkil-szulfonil-csoport, alkil-szulfonil-csoport, acilcsoport, alkoxi-karbonil-csoport, amino-karbonil-csoport vagy aminocsoport vagy egy heterociklusos csoport,

R^3 jelentése szubsztituált vagy szubsztituálatlan heterociklusos, benzoheterociklusos, arilcsoport vagy aralkilcsoport, és

R^4 jelentése hidrogénatom, egy szubsztituált vagy szubsztituálatlan alkilcsoport, alkenilcsoport, alkinilcsoport, acilcsoport, alkil-szulfonil-csoport, alkoxi-karbonil-csoport, amino-karbonil-csoport vagy aralkilcsoport vagy egy (B) képletű csoport, ahol R^1 és R^2 jelentése a fenti.

Kísérleteink során azt tapasztaltuk, hogy ezen széles szabadalmi igény keretén belül vegyületek speciális csoportja különösen értékes tulajdonságokkal rendelkezik. Ezen csoport kiválasztása sem a korábbi publikációból nem következett, sem más szempontokból nem volt előre látható, hogy a vegyületek ezen csoportja különös előnyöket mutatna.

A találmány szerint (I) általános képletű 1-(metoxi-pirimidinil)-1H-1,2,4-triazol-3-szulfonsav-nitro-anilideket részesítünk előnyben, a képletben

R^1 jelentése metilcsoport, metoxycsoport, allil-oxi-csoport vagy propargil-oxi-csoport és

R^2 jelentése metilcsoport vagy metoxycsoport, azzal a megkötéssel, hogy R^1 jelentése metilcsoporttól eltérő, amennyiben R^2 metoxycsoportot képvisel.

Így tehát a találmány szerinti eljárással előállított vegyületek olyan 1H-1,2,4-triazol-3-szulfonsavamid-származékok, amelyek a szulfonsavamid-kötésen (meghatározott szubsztituenseket hordozó) fenilcsoportot tartalmaznak, és amelyeknél a triazolgyűrű 1-helyzetben 4,6-dimetoxi-pirimidin-2-il-csoporttal vagy 4-metoxi-6-metil-pirimidin-2-il-csoporttal szubsztituált.

Az (I) általános képletű vegyületek előállítását az EP 246 749 sz. európai szabadalmi leírás írja le.

A találmány szerinti eljárással előállított vegyületeket jó herbicid hatás jellemzi, különösen nagy a hatékonyságuk a rizs fő gyomai ellen, ugyanakkor jó a szelektivitásuk tuskakora rizsben. A rizs fontos gyomaival szembeni jó hatékonyságnak a tuskakora rizs-

szel szemben tanúsított jó szelektivitással való kombinációja nem mutatkozik meg azoknál a vegyületeknél, amelyeket a 0246 749 számú európai szabadalmi bejelentés ismertet.

A találmányunk szerinti növényvédő szerek hatóanyagainak hatását a legközelebbi, az EP 246 749, valamint a 4959 094 számú amerikai (Wegner et. al.) szabadalmi leírásokból ismertekével hasonlítottuk össze.

Az összehasonlító biológiai vizsgálati adatok igazolják a találmányunk szerinti 1., 2., 3. és 4. jelölésű vegyületeket tartalmazó herbicid szereknek a rizs gyomaival – így Cyperus-szal, Sagittariával és Eleocharisszal – szembeni hatásosságát, a haszonnövénnel szembeni egyidejű szelektivitás mellett. Az EP 246 749 számú európai szabadalmi leírásból ismert vegyületek (122. és 141. sz. vegyület), valamint az US 4959 094 számú szabadalmi leírásból ismert vegyületek (19., 20. és 21. számú vegyületek) nem rendelkeznek ugyanolyan jó szelektivitással.

Az (I) általános képletű vegyületeket például úgy állítjuk elő, hogy egy (IV) általános képletű vegyületet – a képletben R^1 jelentése a fentiekben megadottakkal megegyező – valamely (V) általános képletű vegyülettel – a képletben (Z) jelentése klór- vagy brómatom vagy egy alkil- vagy aril-szulfonil-csoport és R^2 jelentése a fentiekben megadottakkal megegyező – reagáltatjuk valamilyen megfelelő oldószerben, savmegkötő-szer jelenlétében.

Az említett eljárást előnyösen valamilyen hígító-szer jelenlétében hajtjuk végre. Erre a célra valamilyen, az alkalmazott reagensekkel szemben inert oldószer alkalmazható.

Ilyen oldószerekre, illetve hígítószerekre példaképpen a következők említhetők meg: víz, alifás, aliciklusos és aromás szénhidrogének, amelyek adott esetben klórozottak lehetnek, így pl. a hexán, ciklohexán, petroléter, ligroin, benzol, toluol, xilol, metilén-klorid, kloroform, szén-tetraklorid, etilén-klorid, és a triklór-etilén, éterek, így például a diizopropil-éter, dibutil-éter, propilén-oxid, dioxán és tetrahidrofurán, ketonok, így pl. az acetón, metil-etil-keton, metil-izopropil-keton és a metil-izobutil-keton, nitrilek, így például az acetonitril és a propionitril, alkoholok, így pl. a metanol, etanol, izopropanol, butanol és az etilén-glikol, észterek, így például az etil-acetát és az amid-acetát, savamidok, így például a dimetil-formamid és a dimetil-acetamid, szulfonok és szulfoxidok, így pl. a dimetil-szulfoxid és a szulfolán, valamint bázisok, így például a piridin.

A reakciókat előnyösen szobahőmérsékleten és a mindenkori reakcióelegy forráspontja közötti hőmérsékleten hajtjuk végre. A reakciókat környezeti nyomáson végezhetjük, illetve kisebb nyomáson is végrehajtjuk azokat.

Az előállítási eljárást előnyösen inert oldószerekben, így dioxánban, tetrahidrofuránban, dimetil-formamidban vagy N-metil-pirrolidinonban, adott esetben katalizátor jelenlétében hajtjuk végre. Savmegkötőszere példaképpen fém-hidridek, terci-

etil-amin és szervesetlen bázisok, így pl. alkálifém- vagy alkáliföldfém-hidroxidok vagy -karbonátok említhetők meg.

A fentiekben említett eljárás szerint előállított (I) általános képletű vegyületek szokásos eljárásokkal különíthetők el a reakcióelegyből, például az alkalmazott oldószernek normál vagy csökkentett nyomáson végzett ledesztillálásával, vízzel való kicsapással vagy extrahálással.

Nagyobb tisztasági fok rendszerint oszlopkromatográfiás tisztítással, valamint frakcionált desztillálással vagy kristályosítással érhető el.

A találmány szerinti eljárással előállított vegyületek rendszerint színtelen és szagtalan kristályokat képeznek, amelyek vízben és alifás szénhidrogénekben, így petroléterben, hexánban, pentánban és ciklohexánban kevésbé oldódnak, jól oldódnak viszont halogénezett szénhidrogénekben, így kloroformban, metilén-kloridban és szén-tetrakloridban, aromás szénhidrogénekben, így benzolban, toluolban és xilolban, éterekben, így dietil-éterben, tetrahydrofuránban és dioxánban, karbonsav-nitrilekben, így acetonitrilben, alkoholokban, így metanolban és etanolban, karbonsav-amidokban, így dimetil-formamidban és szulfoxidokban, így dimetil-szulfoxidban.

A (IV) és (V) általános képletű vegyületek az irodalomban leírt, különösen a 0246 749 sz. európai szabadalmi bejelentésben ismertetett eljárásokkal állíthatók elő.

Mint azt a fentiekben kifejtettük, az (I) általános képletű vegyületek jó herbicid hatással rendelkeznek. Ez a hatás egyszikű és kétszikű gyomokra terjed ki, ugyanakkor jó a szelektivitás a különböző haszonnövényekben, így pl. tuszkaróra rizsben.

Az említett vegyületek, valamint az ezeket tartalmazó szerek például a következő növényfajtáknál alkalmazhatók:

A következő nemzetségekbe tartozó kétszikű gyomok ellen: *Sinapis*, *Lepidium*, *Galium*, *Stellaria*, *Matricaria*, *Anthemis*, *Galinsoga*, *Chenopodium*, *Brassica*, *Urtica*, *Senecio*, *Amaranthus*, *Portulaca*, *Xanthium*, *Convolvulus*, *Ipomoea*, *Polygonum*, *Sesbania*, *Ambrosia*, *Cirsium*, *Carduus*, *Sonchus*, *Solanum*, *Rorippa*, *Lamium*, *Veronica*, *Abutilon*, *Datura*, *Viola*, *Galeopsis*, *Papaver*, *Centaurea* és *Chrysanthemum*.

A következő nemzetségekbe tartozó egyszikű gyomok ellen: *Avena*, *Alopecurus*, *Echinochloa*, *Setaria*, *Panicum*, *Digitaria*, *Poa*, *Eleusine*, *Brachiaria*, *Lolium*, *Bromus*, *Cyperus*, *Agropyron*, *Sagittaria*, *Monochoria*, *Fimbristylis*, *Eleocharis*, *Ischaemum* és *Apera*.

A felhasználási mennyiség a kikelés előtti és kikelés utáni alkalmazás jellegétől függően 0,01 és 1 kg/hektár közötti.

Az (I) általános képletű vegyületek egyedül, egymással vagy egyéb hatóanyagokkal alkotott keverékek alakjában alkalmazhatók. Adott esetben egyéb növényvédő vagy kártevőirtó szerekkel kombinálhatók, a kívánt céltól függően. Amennyiben a hatásspektrum szélesítése a cél, úgy egyéb herbicidekkel is kombinálhatók. Herbicid hatású keverési partnerekként például

azok a hatóanyagok alkalmasak, amelyeket a *Weed Abstracts*-ben, Vol, 38, 3. sz., 1989, a „List of common names and abbreviations employed for currently used herbicides and plant growth regulators in *Weed Abstracts*” cím alatt felsorolnak.

A hatás intenzitását és a hatás sebességét például hatásfokozó adalékokkal, így szerves oldószerek, nedvesítőszeres és olajok hozzáadásával érhetjük el. Ennélfogva ilyen adalékok adott esetben a hatóanyag adagolásának a csökkentését teszik lehetővé.

A definiált hatóanyagokat vagy ezek keverékeit célszerűen készítmények – így porok, szórható szerek, granulátumok, oldatok, emulziók vagy szuszpenziók alakjában, folyékony és/vagy szilárd hordozóanyagok, illetve hígítószeres és adott esetben tapadást elősegítő, nedvesítő-, emulgeáló és/vagy diszpergáló segédanyagok hozzáadásával alkalmazzuk.

Megfelelő folyékony hordozóanyagok például alifás és aromás szénhidrogének, például a benzol, toluol, xilol, ciklohexanon, izoforon, dimetil-szulfoxid, dimetil-formamid, továbbá ásványolaj-frakciók és növényi olajok.

Szilárd hordozóanyagokként ásványi anyagok, például bentonit, szilikagél, talkum, kaolin, attapulgit, mészkő, valamint növényi termékek, például lisztek alkalmazhatók.

Felületaktív anyagokra példaképpen a következők említhetők meg: kalcium-ligninszulfonát, polietilén-alkil-fenil-éter, naftalinszulfonosavak és ezek sói, fenol-szulfonosavak és ezek sói, formaldehid-kondenzátumok, zsíralkohol-szulfátok, valamint szubsztituált benzolszulfonosavak és ezek sói.

A hatóanyag, illetve hatóanyagok hányada a különböző készítményekben széles határok között változhat. A találmány szerinti szerek például mintegy 10–90 tömegszázalék hatóanyagot, mintegy 90–10 tömegszázalék folyékony vagy szilárd hordozóanyagot, valamint adott esetben 20 tömegszázalékig terjedő mennyiségű felületaktív anyagot tartalmaznak.

A szereket szokásos módon alkalmazhatjuk például vízzel mint hordozóval mintegy 100–1000 liter/hektár permetlé mennyiséget használva. A találmány szerinti szereket alkalmazhatjuk mind az ún. Low-Volume-, mind az Ultra-Low-Volume-eljárásban és használhatjuk az ún. mikrogranulátumos alakban is.

A találmány szerinti készítményeket ismert módon állíthatjuk elő, például őrlési és keverési eljárással. Kívánt esetben az egyes komponenseket csak röviddel a készítmény alkalmazása előtt keverjük össze, mint azt például az ún. tankkeverős eljárásban a gyakorlatban végzik.

A különböző készítmények előállítására például a következő komponenseket alkalmazzuk:

A) *Permetezőpor*

1. 25 tömegszázalék hatóanyag

60 tömegszázalék kaolin

10 tömegszázalék kovács

5 tömegszázalék, a ligninszulfonosav kalcium-sójából és az N-metil-N-oleil-taurin nátriumsójából álló keverék

2. 40 tömegszázalék hatóanyag
 25 tömegszázalék agyagásványok
 25 tömegszázalék kovasav
 10 tömegszázalék, a ligninszulfonsav kalcium-sójából és alkil-fenil-poliglikol-éterekből álló keverék

B) *Paszt*

- 45 tömegszázalék hatóanyag
 5 tömegszázalék nátrium-alumínium-szilikát
 15 tömegszázalék cetil-poliglikol-éter (8 mól etilén-oxiddal)
 2 tömegszázalék orsóolaj
 10 tömegszázalék polietilenglikol
 23 tömegszázalék víz

C) *Emulziós koncentrátum*

- 25 tömegszázalék hatóanyag
 15 tömegszázalék ciklohexanon
 55 tömegszázalék xilol
 5 tömegszázalék, a dodecil-benzolszulfonsav kalciumsójából és nonil-fenil-polioxietilénből álló keverék.

Az alábbi példák kapcsán közelebbről is megvilágítjuk a találmány szerinti vegyületek előállítását:

1. *példa*

1-(4,6-Dimetoxi-pirimidin-2-il)-1H-1,2,4-triazol-3-szulfonsav-(6-nitro-2-propargil-oxi-anilid)
 3,23 g (10 mmól) 1H-1,2,4-triazol-3-szulfonsav-6-nitro-2-propargil-oxi-anilidet és 2,76 g (20 mmól) kálium-karbonátot 25 ml dimetil-formamidban, védőgáz atmoszférában, 10 percig 50 °C-ra melegítünk. 0 °C-ra való lehűlés és 2,18 g (10 mmól) 4,6-dimetoxi-2-(metil-szulfonil)-pirimidin hozzáadása után a reakcióelegyet szobahőmérsékletre hagyjuk melegedni és 20 órán át utánkeverjük. A reakcióoldatot 300 ml jégheg, telített nátrium-klorid-oldatba keverjük és 2 n hidrogén-klorid-olattal pH = 4-re megsavanyítjuk. A kristályokat leszívjuk és kovasavgélén hexán és etilén-acetát-elegyekkel (0–100 tf% etil-acetát) kromatográfián tisztítjuk.

Kitermelés: 2,77 g (az elméleti érték 60%-a)

Olvadáspont: 177–181 °C.

Analóg módon állítjuk elő a következő találmány szerinti vegyületeket is:

Példa	A vegyület neve	Fizikai állandó
2.	1-(4-metoxi-6-metil-pirimidin-2-il)-1H-1,2,4-triazol-3-szulfonsav-(2-metil-6-nitro-anilid)	Op.: 203–204 °C
3.	1-(4,6-dimetoxi-pirimidin-2-il)-1H-1,2,4-triazol-3-szulfonsav-(2-metoxi-6-nitroanilid)	Op.: 226–229 °C
4.	1-(4,6-dimetoxi-pirimidin-2-il)-1H-1,2,4-triazol-3-szulfonsav-(2-allyl-oxi-6-nitro-anilid)	Op.: 134–137 °C

Példa	A vegyület neve	Fizikai állandó
5.	1-(4-metoxi-6-metil-pirimidin-2-il)-1H-1,2,4-triazol-3-szulfonsav-(2-metoxi-6-nitro-anilid)	Op.: 193–196 °C
6.	1-(4-metoxi-6-metil-pirimidin-2-il)-1H-1,2,4-triazol-3-szulfonsav-(2-allyl-6-nitro-anilid)	Op.: 179–184 °C
7.	1-(4-metoxi-6-metil-pirimidin-2-il)-1H-1,2,4-triazol-3-szulfonsav-(6-nitro-2-propargil-oxi-anilid)	Op.: 187–191 °C

A következő példák kapcsán megvilágítjuk a találmány szerinti eljárással előállított vegyületek, illetve az ezeket tartalmazó szerek alkalmazási lehetőségeit.

„A” *példa*

A táblázatban felsorolt vegyületeket növényházban az ugyancsak megadott felhasználási mennyiségben alkalmazzuk. Erre a célra a hatóanyagokat készítmények alakjában a vízfelületre pipettázzuk 1500 ml vizet tartalmazó edényekbe. A vizsgált növényfajtákat kikelés előtt és 1–5 leveles stádiumban alkalmazzuk. Az alkalmazás után 3 héttel értékeljük a növények károsodását. A találmány szerinti eljárással előállított vegyületek erős hatást mutatnak *Cyperus difformis* és *Eleocharis acicularis* ellen, ugyanakkor szelektívek tuzskarora rizzsel szemben.

A következő táblázatban az egyes számok, illetve rövidítések jelentése:

0	= nincs károsodás
1	= gyenge károsodás
2	= közepes károsodás
3	= erős károsodás
4	= teljes pusztulás
ORYSA	= <i>Oryza sativa</i>
CYPDI	= <i>Cyperus difformis</i>
ELOAC	= <i>Eleocharis acicularis</i>

(1) általános képletű vegyületek	Vizes alkalmazás hatóanyag kg/ha	O R Y S A	C Y P D I	E L O A C
1. példa	0,1	0	4	4
2. példa	0,1	0	4	4
3. példa	0,1	0	4	4
6. példa	0,1	0	4	4
7. példa	0,1	0	4	4
kezeletlen	–	0	0	0

„B” *példa*

A táblázatban felsorolt vegyületeket növényházban az ugyancsak megadott felhasználási mennyiség-

ben alkalmazzuk. Erre a célra a hatóanyagokat készítmények alakjában 1500 ml vizet tartalmazó edények vízfelületére pipettázzuk. A vizsgált növényfajtákat kikelés előtt és 1–5 leveles stádiumban alkalmazzuk. Az alkalmazás után 3 héttel értékeljük a növények károsodását. A találmány szerinti eljárással előállított vegyület erős hatású mutat Monochoria vaginalis ellen, ugyanakkor szelektív tuszkarora rizsszel szemben. Az összehasonlító szer gyengébb hatású.

A következő táblázatban az egyes számok, illetve rövidítések jelentése:

- 0 = nincs károsodás
1 = gyenge károsodás
2 = közepes károsodás
3 = erős károsodás
4 = teljes pusztulás
ORYSA = Oryza sativa
MOOVA = Monochoria vaginalis

(I) általános képletű vegyületek	Vizes alkalmazás hatóanyag kg/ha	O R Y S A	M O O V A
3. példa	0,05	0	4
kezeletlen	–	0	0
Összehasonlító szer:			
Benzulfuron-metil	0,05	0	3

„C” példa

A táblázatban felsorolt vegyületeket növényházban az ugyancsak megadott felhasználási mennyiségben alkalmazzuk. Erre a célra a hatóanyagokat készítmények alakjában 1500 ml vizet tartalmazó edények vízfelületére pipettázzuk. A vizsgált növényfajtákat kikelés előtt és 1–5 leveles stádiumban alkalmazzuk. Az alkalmazás után 3 héttel értékeljük a növények károsodását. A találmány szerinti eljárással előállított vegyület erős hatást mutat Scirpus juncoides ellen, ugyanakkor szelektív tuszkarora rizsben. Az összehasonlító szer gyengébb hatású.

A következő táblázatban az egyes számok, illetve rövidítések jelentése:

- 0 = nincs károsodás
1 = gyenge károsodás
2 = közepes károsodás
3 = erős károsodás
4 = teljes pusztulás
ORYSA = Oryza sativa
SCPJU = Scirpus juncoides

(I) általános képletű vegyületek	Vizes alkalmazás hatóanyag kg/ha	O R Y S A	S C P J U
4. példa	0,05	0	4

(I) általános képletű vegyületek	Vizes alkalmazás hatóanyag kg/ha	O R Y S A	S C P J U
kezeletlen	–	0	0
Összehasonlító szer:			
Benzulfuron-metil	0,05	0	3

„D” példa

A táblázatban felsorolt vegyületeket növényházban az ugyancsak megadott felhasználási mennyiségben alkalmazzuk. Erre a célra a hatóanyagokat készítmények alakjában 1500 ml vizet tartalmazó edények vízfelületére pipettázzuk. A vizsgált növényfajtákat kikelés előtt és 1–5 leveles stádiumban alkalmazzuk. Az alkalmazás után 3 héttel értékeljük a növények károsodását. A találmány szerinti eljárással előállított vegyület erős hatást mutat Cyperus serotinus ellen, ugyanakkor szelektív tuszkarora rizsszel szemben. Az összehasonlító szer gyengébb hatású.

A következő táblázatban az egyes számok, illetve rövidítések jelentése:

- 0 = nincs károsodás
1 = gyengébb károsodás
2 = közepes károsodás
3 = erős károsodás
4 = teljes pusztulás
ORYSA = Oryza sativa
CYPSE = Cyperus serotinus

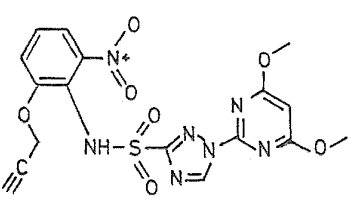
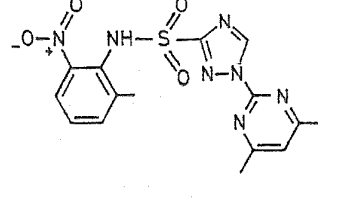
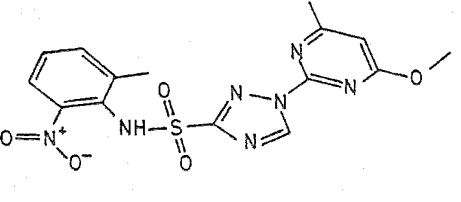
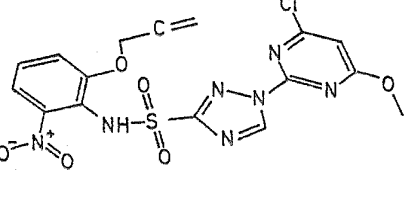
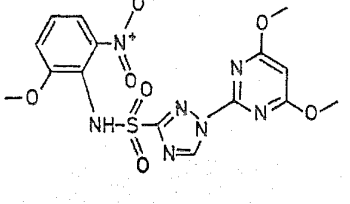
(I) általános képletű vegyületek	Vizes alkalmazás hatóanyag kg/ha	O R Y S A	C Y P S E
1. példa	0,05	0	4
kezeletlen	–	0	0
Összehasonlító szer:			
Benzulfuron-metil	0,05	0	0

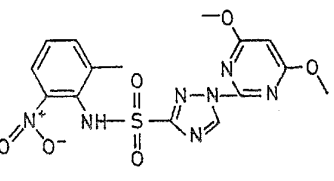
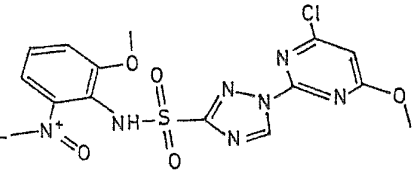
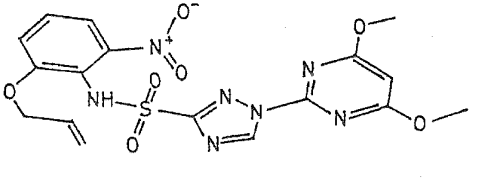
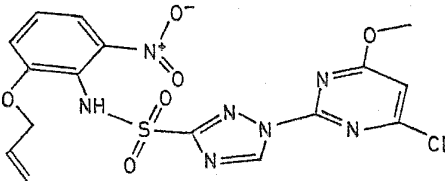
Összehasonlító kísérletek

Az alábbi táblázatban felsorolt vegyületeket a megadott koncentrációban növényházi kísérlet során rizsmodellrendszer talajának felületére vittük. A táblázatban felsorolt, vizsgált fajokat kikelés előtti és kikelés utáni eljárásban kezeltük.

Jelölések jelentése:

- 0 = nincs hatás
1 > 24%-os fitotoxicitás
2 = 25–74%-os fitotoxicitás
3 = 75–89%-os fitotoxicitás
4 = 90–100%-os fitotoxicitás
ORYSA = Oryza sativa (transzplantált)
CYPSE = Cyperus serotinus
SAGPY = Sagittaria pygmaea
ELOAC = Eleocharis acicularis

A vegyület	Dózis [ppm]	O R Y S A	C Y P S E	S A G P Y	E L O A C
1. sz. vegy.	1,0	0	2	3	4
					
EP 246 749 122. sz. vegy.	1,0	1	-	2	3
					
2. sz. vegy.	1,0	0	2	3	3
					
Wegner et al., U.S. 4959 094 21. sz. vegy.	1,0	2	2	3	3
					
3. sz. vegy.	0,3	0	3	3	4
					

EP 246 749 141. sz. vegy.	3,0	1	-	2	4
					
Wegner et al., U.S. 4959 094 20. sz. vegy.	1,0	2	2	3	3
					
4. sz. vegy.	1,0	0	2	3	4
					
Wegner et al., U.S. 4959 094 19. sz. vegy.	1,0	2	2	1	3
					

SZABADALMI IGÉNYPONTOK

1. Eljárás az (I) általános képletű 1-metoxi-pirimi-
dinil-1H-1,2,4-tiazol-3-szulfonsav-nitro-anilidek előál-
lítására, a képletben

R¹ jelentése metilcsoport, metoxicsoport, allil-oxi-cso-
port vagy propargil-oxi-csoport és

R² jelentése metilcsoport vagy metoxicsoport, azzal a
megkötéssel, hogy R¹ jelentése metilcsoporttól el-
térő, amennyiben R² metoxicsoportot képvisel,

azzal jellemezve, hogy egy (IV) általános képletű vegyületet – a képletben R^1 jelentése a fentiekben megadott – valamely (V) általános képletű vegyülettel – a képletben Z jelentése klór- vagy brómatom vagy egy alkid- vagy aril-szulfonil-csoport és R^2 jelentése a fentiekben megadottakkal megegyező – reagáltatjuk valamilyen megfelelő oldószerben, savmegkötőszer jelenlétében.

2. Herbicid hatású szer, *azzal jellemezve*, hogy 10–

90 tömeg%-ban legalább egy (I) általános képletű vegyületet – ahol R^1 és R^2 jelentése az 1. igénypontban megadottakkal megegyező – tartalmaz, egy vagy több adalékanyaggal együtt.

5 3. Eljárás egyszikű és kétszikű gyomfajták irtására rizskultúrákban, *azzal jellemezve*, hogy hektáronként 0,01–1 kg hatóanyagot tartalmazó, 2. igénypont szerinti szert alkalmazunk.

