HU 0 0 0 2 2 2 9 1 2 B 1

(19) Országkód

HU

MAGYAR KÖZTÁRSASÁG

MAGYAR SZABADALMI HIVATAL

SZABADALMI LEÍRÁS

(11) Lajstromszám:

222 912 B1

(21) A bejelentés ügyszáma: P 96 00661
(22) A bejelentés napja: 1994. 09. 08.
(30) Elsőbbségi adatok:
P 43 31 448.1 1993. 09. 16. DE
(86) Nemzetközi bejelentési szám: PCT/EP 94/03008
(87) Nemzetközi közzétételi szám: WO 95/07897

(51) Int. Cl.[7]

C 07 D 261/04
C 07 D 413/04
A 01 N 25/32

(40) A közzététel napja: 1996. 11. 28.
(45) A megadás meghirdetésének dátuma a Szabadalmi Közlönyben: 2003. 12. 29.

(72) Feltalálók:
Bauer, Klaus, Hanau (DE)
Bieringer, Hermann, Eppstein/Taunus (DE)
Willms, Lothar, Hofheim/Taunus (DE)

(73) Szabadalmas:
HOECHST Schering AgrEvo GmbH, Berlin (DE)

(74) Képviselő:
DANUBIA Szabadalmi és Védjegy Iroda Kft., Budapest

(54) **Szubsztituált izoxazolinok, eljárás a vegyületek előállítására, a vegyületeket tartalmazó készítmények és antidotumként történő alkalmazásuk**

KIVONAT

A találmány szerinti (I) általános képletű szubsztituált izoxazolinok és sói – ahol

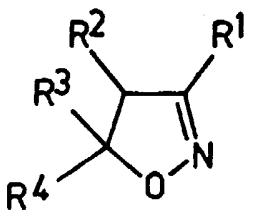
R^1 jelentése $-CO-OR$, $-CS-OR$, $-CONH_2$, $-CONHCH_3$, $-CON(CH_3)_2$ vagy $-CONH$-fenil képletű karboxilszármazék-csoport, ahol az utóbbi a fenilrészben szubsztituálatlan vagy halogénatommal szubsztituált;

R jelentése hidrogénatom, kation, 1–8 szénatomos alkil-, 3–6 szénatomos cikloalkil-, 2–6 szénatomos alkenil-, 2–6 szénatomos alkinil- vagy fenilcsoport, ahol az utolsó öt említett csoport adott esetben egy vagy több alábbi csoporttal lehet szubsztituálva: halogénatommal, hidroxil-, 1–4 szénatomos alkilcsoporttal, utóbbi csak ciklusos csoportok esetén, 1–4 szénatomos alkoxi-, 1–4 szénatomos alkil-tio- és (1–4 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoporttal vagy adott esetben egy vagy több halogénatommal szubsztituált benzilcsoport, vagy tetrahidrofurfurilcsoport;

R^2 jelentése hidrogénatom, 1–6 szénatomos alkil- vagy 2–6 szénatomos alkenilcsoport;

R^3 jelentése 1–4 szénatomos alkil-, 3–8 szénatomos cikloalkil- vagy fenilcsoport, amely adott esetben egy vagy több halogénatommal, 1–6 szénatomos alkil-, 1–6 szénatomos halogén-alkil-, 1–6 szénatomos alkoxi-, mono- vagy di(1–4 szénatomos alkil)-amino- vagy (1–4 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoporttal szubsztituált;

R^4 jelentése adott esetben egy vagy több halogénatommal, 1–6 szénatomos alkil-, 1–6 szénatomos halogén-alkil-, 1–6 szénatomos alkoxi-, mono- vagy di(1–4 szénatomos alkil)-amino vagy (1–4 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoporttal szubsztituált fenilcsoport vagy piridil- vagy tienilcsoport.



(I)

HU 222 912 B1

A leírás terjedelme 22 oldal (ezen belül 1 lap ábra)

A találmány tárgya új szubsztituált izoxazolinok, hatóanyag-antidotum kombinációt tartalmazó növényvédő szer, amely kiemelkedően hasznos haszonnövény-kultúrákban a konkuráló gyomnövények irtására.

A növényvédő szerek alkalmazásánál különösen herbicidek használatánál károk keletkezhetnek a kezelt kultúrnövényeken. Sok herbicid nem teljesen szelektív a fontosabb kultúrnövények viszonylatában, és ez szűk határokat szab alkalmazásuknak. Ezért néha egyáltalán nem alkalmazhatók, vagy csak igen alacsony felhasználási mennyiségben, és ezzel a kívánt széles herbicid hatás a gyomok ellen nem érvényesül. Így például sok herbicidet nem lehet az alább megnevezett (A)-tól (K)-ig terjedő anyagosztályok esetében kielégítő szelektivitással alkalmazni kukoricában, rizsben vagy gabonában. Ezen herbicidek posztemergens alkalmazásánál különösen felléphetnek fitotoxikus mellékhatások a kultúrnövényeken, és ezért kívánatos ezt a fitotoxicitást csökkenteni vagy elkerülni.

Ismeretes már herbicidek alkalmazása olyan vegyületekkel kombinálva, amelyek csökkentik a herbicidek fitotoxicitását a kultúrnövényeken anélkül, hogy ennek megfelelően csökkenne a vegyületek herbicid hatása. Ilyen kombinációs partnerek a „safenerek" vagy „antidotumok".

Az EP–A–509 433 számú európai szabadalmi bejelentésből (CA–A–2065983) ismeretes az 5-fenil-izoxazolin vagy 5-fenil-izotiazolin-3-karboxil-származékok safenerként történő alkalmazása olyan herbicidek esetében, mint a karbamátok, tiokarbamátok, halogén-acetanilidek, fenoxi-fenoxi-alkánkarbonsav-származékok vagy szulfonil-karbamidok.

Az EP–A–520371 (CA–A–2072229) szabadalmi bejelentésből többek között ismeretesek az 5-alkil-izoxazolin- és -izotiazolin-3-karboxil-származékok mint különböző herbicideknél használatos safenerek.

A 92/03053 számú nemzetközi közzétételi iratból (CA–A–2089651) ismeretes a szubsztituált 3-aril-izoxazolin- és -izotiazolin-5-karboxil-származékok alkalmazása mint safenerek ezen herbicideknél. A 91/18907 számú nemzetközi közzétételi iratban (US–A–5 332 715) szililszubsztituált izoxazolinokat és izoxazolokat, izotiazolinokat és izotiazolokat írnak le mint növényeket védő szereket.

A 91/08202 számú nemzetközi közzétételi iratban (US–5 314 863) végül növényeket védő tulajdonságú 5-benzil-szubsztituált izoxazolilszármazékokról írnak.

Azt találtuk, hogy meglepő módon az (I) általános képletű 5,5-diszubsztituált izoxazolinszármazékok kiemelkedően alkalmasak arra, hogy az agresszív agrárvegyszerektől, különösen herbicidektől megvédjék a kultúrnövényeket. Ezek az izoxazolinok, melyek az agresszív vegyszerek növénykárosító hatásától védik meg a kultúrnövényeket, tehát az (I) általános képlettel jellemezhetők, ahol

R^1 jelentése $-CO-OR$, $-CS-OR$, $CONH_2$, $CONHCH_3$, $CON(CH_3)_2$ vagy CONH-fenil képletű karboxilszármazék-csoport, ahol az utóbbi a fenilrészben szubsztituálatlan vagy halogénatommal szubsztituált;

R jelentése hidrogénatom, kation, 1–8 szénatomos alkil-, 3–6 szénatomos cikloalkil-, 2–6 szénatomos alkenil-, 2–6 szénatomos alkinil- vagy fenilcsoport, ahol az utolsó öt említett csoport adott esetben egy vagy több alábbi csoporttal lehet szubsztituálva: halogénatommal, hidroxil-, 1–4 szénatomos alkilcsoporttal, utóbbi csak ciklusos csoportok esetén, 1–4 szénatomos alkoxi-, 1–4 szénatomos alkil-tio- és (1–4 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoporttal, vagy adott esetben egy vagy több halogénatommal szubsztituált benzilcsoport vagy tetrahidrofurfurilcsoport;

R^2 jelentése hidrogénatom, 1–6 szénatomos alkil- vagy 2–6 szénatomos alkenilcsoport;

R^3 jelentése 1–4 szénatomos alkil-, 3–8 szénatomos cikloalkil- vagy fenilcsoport, amely adott esetben egy vagy több halogénatommal, 1–6 szénatomos alkil-, 1–6 szénatomos halogén-alkil-, 1–6 szénatomos alkoxi-, mono- vagy di(1–4 szénatomos alkil)-amino- vagy (1–4 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoporttal szubsztituált;

R^4 jelentése adott esetben egy vagy több halogénatommal, 1–6 szénatomos alkil-, 1–6 szénatomos halogén-alkil-, 1–6 szénatomos alkoxi-, mono- vagy di(1–4 szénatomos alkil)-amino- vagy (1–4 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoporttal szubsztituált fenilcsoport vagy piridil- vagy tienilcsoport.

Az (I) általános képletben és az alábbiakban az alkil-, alkoxi-, halogén-alkil-, halogén-alkoxi-, alkil-amino- és alkil-tio-csoport és a megfelelő telítetlen és/vagy szubsztituált csoportok a szénhidrogénvázban mindig egyenes vagy elágazó láncúak lehetnek. Ha nincs külön megadva, akkor ezek a szénatomvázak 1–4 szénatomosak, illetve telítetlen csoportok esetén 2–4 szénatomosak előnyösen. Az alkilcsoportok az összetételekben is, például az alkoxi- vagy halogén-alkil-csoportban lehetnek például metil-, etil-, n- vagy izopropil-, n-, izo-, t- vagy 2-butil-, pentil-, hexil-, például n-hexil-, i-hexil- és 1,3-dimetil-butil-, heptil-, például n-heptil-, 1-metil-hexil- vagy 1,4-dimetil-pentil-csoport; az alkenil- és alkinilcsoportok megfelelnek az alkilcsoportoknak, csak telítetlen csoportok, az alkenilcsoport lehet például allil-, 1-metil-prop-2-én-1-il-, 2-metil-prop-2-én-1-il-, but-2-én-1-il-, but-3-én-1-il-, 1-metil-but-3-én-1-il és 1-metil-but-2-én-1-il-csoport; az alkinilcsoport lehet például propargil-, but-2-in-1-il-, but-3-in-1-il-, metil-but-3-in-1-il-csoport. A halogén lehet fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, előnyösen fluor-, klór- vagy brómatom, különösen fluor- vagy klóratom. A halogén-alkil-, -alkenil- és -alkinil-csoport lehet halogénnel részben vagy teljesen szubsztituált alkil-, alkenil-, illetve alkinilcsoport, például $-CF_3$, $-CHF_2$, $-CH_2F$, $-CF_2CF_3$, $-CHClCH_2F$, $-CCl_3$, $-CHCl_2$, $-CH_2CH_2Cl$.

A szubsztituált fenil-, illetve benzilcsoportok lehetnek például egy szubsztituálatlan alapvázból levezethető szubsztituenscsoportok, ahol a szubsztituens egy vagy több, előnyösen 1, 2 vagy 3 lehet, mégpedig halogénatom, alkil-, halogén-alkil-, alkoxi-, hidroxi-, alkoxikarbonil-, mono- és dialkil-amino-csoport, és a szénatomot tartalmazó csoportok 1–4, különösen 1 vagy 2 szén-

atomosak lehetnek. Előnyös rendszerint a halogénatom, például fluor- és klóratom, 1–4 szénatomos alkil-, előnyösen metil- vagy etilcsoport, 1–4 szénatomos halogén-alkil-, előnyösen trifluor-metil-, 1–4 szénatomos alkoxi-, előnyösen metoxi- vagy etoxi-, 1–4 szénatomos halogén-alkoxi-, nitro- vagy cianocsoport. Különösen előnyös a metil-, metoxicsoport és a klóratom.

Adott esetben szubsztituált fenilcsoport lehet például szubsztituálatlan vagy egyszer vagy többször, előnyösen legfeljebb három azonos vagy különböző módon szubsztituált fenilcsoport, ahol a szubsztituens lehet halogénatom, 1–4 szénatomos alkil-, 1–4 szénatomos alkoxi-, 1–4 szénatomos halogén-alkil-csoport, például o-, m- és p-tolil-, dimetil-fenil-, 2-, 3 és 4-klórfenil-, 2-, 3- és 4-trifluor- és -triklór-fenil-, 2,4-, 3,5-, 2,5- és 2,3-diklór-fenil-, o-, m- és p-metoxi-fenilcsoport.

Az (I) általános képletű vegyületek közül néhány egy vagy több aszimmetrikus csoportot vagy kettős kötést tartalmaz, melyeket külön nem adunk meg az (I) általános képletben. A speciális térformával definiált lehetséges sztereoizomerek, például enantiomerek, diasztereomerek, E- és Z-izomerek, valamint ezek elegyei is az (I) általános képlethez tartoznak.

Az (I) általános képletű vegyületek, melyeket karbonsavakból vezetünk le, sókat képezhetnek, amelyekben az R csoport helyettesítve van egy mezőgazdaságilag elfogadható kation ekvivalenssel. Ezek a sók lehetnek például fém, különösen alkáli-, nátrium-, kálium- vagy alkáliföldfémsók, de szóba jöhetnek az ammóniumsók vagy a szerves aminokkal képezett sók is, valamint olyan sók, amelyek kationként szulfónium- vagy foszfóniumiont tartalmaznak.

Sóképzőként különösen jók a fémek és szerves nitrogénbázisok, mindenekelőtt a kvaterner ammóniumbázisok. Idetartoznak a sóképzéshez megfelelő fémek, alkáliföldfémek, például magnézium, kalcium, vagy főleg az alkálifémek, mint például lítium és különösen nátrium és kálium.

A sóképzéshez megfelelő nitrogénbázisok a primer, szekunder vagy tercier, alifás és aromás, adott esetben a szénhidrogéncsoporton hidroxilezett aminok, például metil-amin, etil-amin, propil-amin, izopropil-amin, a négy izomer butil-amin, dimetil-amin, dietil-amin, dipropil-amin, diizopropil-amin, di-n-butil-amin, pirrolidin, piperidin, morfolin, trimetil-amin, trietil-amin, tripropil-amin, kinuklidin, piridin, kinolin, izokinolin, valamint metanol-amin, etanol-amin, propanol-amin, dimetanol-amin, dietanol-amin vagy trietanol-amin.

A kvaterner ammóniumbázisra példaként említhetők a tetraalkil-ammónium-kationok, amelyekben az alkilcsoportok egymástól függetlenül egyenes vagy elágazó láncú 1–6 szénatomos alkilcsoportok, például tetrametil-ammónium-kation, tetraetil-ammónium-kation vagy trimetil-etil-ammónium-kation és a trimetil-benzil-ammónium-kation, a trietil-benzil-ammónium-kation és a trimetil-(2-hidroxi-etil)-ammónium-kation.

Sóképzőként különösen előnyösek az ammóniumkation és a di-, valamint trialkil-ammónium-kationok, amelyekben az alkilcsoportok egymástól függetlenül egyenes vagy elágazó láncú, adott esetben hidroxilcsoporttal szubsztituált 1–6 szénatomos alkilcsoportot jelentenek, például dimetil-ammónium-kation, trimetil-ammónium-kation, trietil-ammónium-kation, di(2-hidroxi-etil)-ammónium-kation és tri(2-hidroxi-etil)-ammónium-kation.

Különösen fontosak azok az (I) általános képletű vegyületek és sóik, ahol

R^2 jelentése hidrogénatom, 1–4 szénatomos alkilcsoport,

R^4 jelentése piridil- vagy tienilcsoport.

Különösen jelentősek azok az (I) általános képletű vegyületek és sóik, ahol

R jelentése hidrogénatom, 1–8 szénatomos alkil-, 4–7 szénatomos cikloalkil-, 2–8 szénatomos alkenil- vagy 2–8 szénatomos alkinil-, fenil- vagy tetrahidrofurfurilcsoport, ahol az utóbbi 5 csoport egymástól függetlenül szubsztituálatlan vagy egy vagy több alábbi csoporttal szubsztituált: halogénatom, hidroxi-, 1–4 szénatomos alkilcsoport, ahol utóbbi csak a ciklusos csoportok esetében áll, 1–4 szénatomos alkil-tio-, (1–6 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport,

R jelentése előnyösen hidrogénatom, 1–8 szénatomos alkil-, 5–6 szénatomos cikloalkil-, 2–8 szénatomos alkenil- vagy 2–8 szénatomos alkinilcsoport, ahol az utóbbi négy csoport egymástól függetlenül szubsztituálatlan, vagy egy vagy több csoporttal lehet szubsztituálva, amely lehet halogénatom.

A találmány kiterjed a kultúrnövények, előnyösen gabona-, rizs-, kukorica-, szójabab- vagy cukorrépanövények megvédésére a növényvédő szerek, például herbicidek, inszekticidek és fungicidek fitotoxikus mellékhatásától oly módon, hogy legalább egy (I) általános képletű vegyület vagy sójának hatásos mennyiségét a hatóanyaggal egyidejűleg vagy az után felvisszük a növényre, a növények magvaira vagy a termesztőfelületre.

A találmány kiterjed továbbá az (I) általános képletű vegyületek vagy sóinak alkalmazására is, hogy megvédje a kultúrnövényeket a növényvédő szerek, például herbicidek, inszekticidek és fungicidek fitotoxikus mellékhatásaitól.

A találmány tárgya továbbá eljárás (I) általános képletű vegyületek és sói előállítására, oly módon, hogy egy (II) általános képletű vegyületet – ahol R^2, R^3, R^4 jelentése a fenti, (III) általános képletű nitril-oxiddal, ahol R^1 jelentése a fenti, reagáltatunk.

A reakciót például szerves oldószerben végezzük, oldószerként használhatunk előnyösen apolárostól kevéssé poláros szerves oldószerig terjedő oldószereket, például étert, például dietil-étert vagy tetrahidrofuránt.

A kiindulási anyagok, amelyeket a (II) és (III) képlettel jellemzünk, ismertek az irodalomból [J. Org. Chem. *25,* 1160 (1960); J. Am. Chem. Soc. *46,* 791 (1924) és az ottani idézetek], vagy az ismert vegyületek analógiájára állíthatók elő. A (III) képletű nitril-oxidokat rendszerint in situ állítjuk elő 2-halogén-2-hidroximino-ecetsav-származékokból, illetve etanalszármazékokból, illetve ketonokból bázis hatására, például szerves aminbázisokkal, és közvetlenül reagáltatjuk a már a reakciórész-

ben lévő (II) általános képletű vegyülettel. A reakciót előnyösen –15 °C-tól az oldószer forráspontjáig, különösen szobahőmérsékleten hajtjuk végre.

Az alábbiakban az (I) általános képletű vegyületekhez értjük a sóikat is, ha nincsen pontosabb definíció megadva.

Az (I) általános képletű hatóanyagok csökkentik vagy elnyomják a növényvédő szerek, például herbicidek, inszekticidek és fungicidek mellékhatásait, amelyek ezen hatóanyagok alkalmazásánál fellépnek a haszonnövény-kultúrákban, és ezért a szokott módon antidotumként vagy safenerként nevezzük ezeket.

A találmány szerinti (I) általános képletű hatóanyagokat a növényvédő szer hatóanyagokkal egyidejűleg vagy tetszőleges sorrendben alkalmazhatjuk a hatóanyagokkal, és ekkor megvédjük a kultúrnövényeket ezen hatóanyagok káros mellékhatásától, vagy oly módon, hogy ezen hatást csökkentjük vagy teljesen megszüntetjük, anélkül, hogy ezen hatóanyagok kártevő rovarok, gombák vagy gyomnövények elleni hatását befolyásolnánk. Eközben a többféle növényvédő szer alkalmazásával keletkező károsodások is kivédhetők, például ha több herbicidet használunk, vagy hogyha a herbicideket inszekticidekkel vagy fungicidekkel kombináljuk. Ezáltal tehát a szokásos növényvédő szerek alkalmazási területét jelentősen bővíthetjük.

Az önmagukban vagy herbicidekkel együtt növényi károsodást potenciálisan okozó inszekticidek például a következők: inszekticid készítmények, például organofoszfátok, például terbufosz (®Counter), fonofosz (®Dyfonate), forát (®Thimet), klór-pirifosz (®Reldan) és további rokon vegyületek; inszekticid karbamátok, például karbofurán (®Furadan) és továbbiak; valamint piretroidinszekticidek, például Tefluthrin (®Force), deltametrin (®Decis) és tralometrin (®Scout) és mások; valamint más, egyéb hatásmechanizmusú inszekticid szerek.

A kultúrnövényeknél fitotoxikus mellékhatású herbicidek, amelyek hatása az (I) általános képletű vegyületekkel csökkenthető, a következők: például karbamát, tiokarbamát, halogén-acetanilid, szubsztituált fenoxi-, naftoxi- és fenoxi-fenoxi-karbonsav-származékok, például heteroaril-oxi-fenoxi-alkánkarbonsav-származékok, például kinolil-oxi-, kinoxalil-oxi, piridil-oxi-, benzoxazil-oxi- és benztiazolil-oxi-fenoxi-alkán-karbonsav-észterek, ciklohexán-dion-származékok, imidazolinonok, pirimidil-oxi-piridin-karbonsav-származékok, pirimidil-oxi-benzoesav-származékok, szulfonil-karbamidok, triazolo-pirimidil-szulfonamid-származékok és S-(N-aril-N-alkil-karbamoil-metil)-ditiofoszforsav-észter típusú herbicidek. Előnyösek a fenoxi-fenoxi- és heteroaril-oxi-fenoxi-karbonsav-észterek és sók, szulfonil-karbamidok, imidazolinonok, valamint herbicidek, amelyek ALS-gátló anyagokkal együtt (acetolaktát-szintáz-gátló anyagok) a hatásspektrum bővítéséhez használhatók, ilyenek például a bentazon, cianazin, atrazin, bromoxinil, dikamba és más levélherbicidek.

A találmány szerinti safenerekkel kombinálható megfelelő herbicidek például a következők:

A) fenoxi-fenoxi- és heteroaril-oxi-fenoxi-karbonsav-(1–4 szénatomos alkil)-, (2–4 szénatomos alkenil)- és (3–4 szénatomos alkinil)-észter típusú herbicidek, például

A1) fenoxi-fenoxi- és benzil-oxi-fenoxi-karbonsav-származékok, például

2-(4-(2,4-diklór-fenoxi)-fenoxi)-propionsav-metil-észter (diklofop-metil),

2-(4-(4-bróm-2-klór-fenoxi)-fenoxi)-propionsav-metil-észter (lásd DE–A–2 601 548),

2-(4-(4-bróm-2-fluor-fenoxi)-fenoxi)-propionsav-metil-észter (lásd US–A–4 808 750),

2-(4-(2-klór-4-/trifluor-metil/-fenoxi)-fenoxi)-propionsav-metil-észter (lásd DE–A–2 433 067),

2-(4-(2-fluor-4-/trifluor-metil/-fenoxi)-fenoxi)-propionsav-metil-észter (lásd US–A–4 808 750),

2-(4-(2,4-diklór-benzil)-fenoxi)-propionsav-metil-észter (lásd DE–A–2 417 487),

4-(4-(4-/trifluor-metil/-fenoxi)-fenoxi)-pent-2-én-sav-etil-észter,

2-(4-(4-/trifluor-metil/-fenoxi)-fenoxi)-propionsav-metil-észter (lásd DE–A– 2433 067),

A2) „egymagú" heteroaril-fenoxi-alkánkarbonsav- származékok, például

2-(4-(3,5-diklór-piridil-2-oxi)-fenoxi)-propionsav-etil-észter (lásd EP–A–2925),

2-(4-(3,5-diklór-piridil-2-oxi)-fenoxi)-propionsav-propargil-észter (EP–A–3114),

2-(4-(3-klór-5-/trifluor-metil/-2-piridil-oxi)-fenoxi-propionsav-metil-észter, (lásd EP–A–3890),

2-(4-(3-klór-5-/trifluor-metil/-2-piridil-oxi)-fenoxi-propionsav-etil-észter, (lásd EP–A–3890),

2-(4-(5-klór-3-fluor-2-piridil-oxi)-fenoxi)-propionsav-propargil-észter (EP–A–191736),

2-(4-(5-/trifluor-metil/-2-piridil-oxi)-fenoxi)-propionsav-butil-észter (fluazifop-butil),

A3) „kétmagú" heteroaril-oxi-fenoxi-alkánkarbonsav-származékok, például

2-(4-(6-klór-2-kinoxalil-oxi)-fenoxi)-propionsav-metil-észter és -etil-észter (kvizalofop-metil és -etil),

2-(4-(6-fluor-2-kinoxalil-oxi)-fenoxi)-propionsav-metil-észter [(lásd J. Pest. Sci. Vol. 10, 61 (1985)],

2-(4-(6-klór-2-kinoxalil-oxi)-fenoxi)-propionsav és –2-izopropilidén-amino-oxi-etil-észter (propakvizofop és észter),

2-(4-(6-klór-benzoxazol-2-il-oxi)-fenoxi)-propionsav-etil-észter (fenoxaprop-etil), és D(+) izomerje (fenoxaprop-P-etil) és

2-(4-(6-klór-benztiazol-2-il-oxi)-fenoxi-propionsav-etil-észter (lásd DE–A–2 640 730),

2-(4-(6-klór-kinoxalil-oxi)-fenoxi)-propionsav-tetrahidrofur-2-il-metil-észter (lásd EP–A 323 727).

B) Szulfonil-karbamid típusú herbicidek, például pirimidin vagy triazinil-amino-karbonil-[benzol-, piridin-, pirazol-, tiofén és (alkilszulfonil)-alkil-amino-]-szulfamidok. Előnyösek szubsztituensként a pirimidin- vagy triazingyűrűn a következők: alkoxi-, alkil-, halogén-alkoxi-, halogén-alkil-csoport, halogénatom vagy dimetil-amino-csoport, ahol az összes szubsztituens egymástól függetlenül egymással kombinálható. Előnyös szubsztituensek a benzol-, piridin-, pirazol-, tiofén- vagy (alkil-szulfonil)-alkil-amino-részben a következők: alkil-, alkoxi-, halo-

gén-, nitro-, alkoxi-karbonil-, amino-karbonil-, alkil-amino-karbonil-, dialkil-amino-karbonil-, alkil-, alkil-szulfonil-, halogén-alkoxi-, halogén-alkil-, alkil-karbonil-, alkoxi-alkil-, (alkánszulfonil)-alkil-amino-csoport. Megfelelő szulfonil-karbamidok például a következők:

B1) fenil- és benzolszulfonil-karbamidok és rokon vegyületek, például

1-(2-klór-fenil-szulfonil)-3-(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il-karbamid (klórszulfuron),

1-(2-etoxi-karbonil-fenil-szulfonil)-3-(4-klór-6-metoxi-pirimidin-2-il)-karbamid (klorimuron-etil),

1-(2-/metoxi-fenil/-szulfonil)-3-(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)-karbamid (metszulfuron-metil),

1-(2-klór-etoxi-fenil-szulfonil)-3-(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)-karbamid) (triaszulfuron),

1-(2-/metoxi-karbonil/-fenil-szulfonil)-3-(4,6-dimetil-pirimidin-2-il)-karbamid (szulfometuron-metil),

1-(2-/metoxi-karbonil/-fenil-szulfonil)-3-(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)-3-metil-karbamid (tribenuron-metil),

1-(2-/metoxi-karbonil/-benzil-szulfonil)-3-(4,6-dimetoxi-pirimidin-2-il)-karbamid (benszulfuron-metil),

1-(2-/metoxi-karbonil/-fenil-szulfonil)-3-(4,6-bisz(difluor-metoxi)-pirimidin-2-il)-karbamid (primiszulfuron-metil),

3-(4-etil-6-metoxi-1,3,5-triazin-2-il)-1-(2,3-dihidro-1,1-dioxo-2-metil-benzo[b]tiofén-7-szulfonil)-karbamid (lásd EP–A–79683),

3-(4-etoxi-6-etil-1,3,5-triazin-2-il)-1-(2,3-dihidro-1,1-dioxo-2-metil-benzo[b]tiofén-7-szulfonil)-karbamid (lásd EP–A–79683),

3-(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)-1-(2-/metoxi-karbonil/-5-jód-fenil-szulfonil)-karbamid (lásd WO 92/13845),

B2) tienil-szulfonil-karbamidok, például 1-(2-/metoxi-karbonil/-tiofén-3-il)-3-(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)-karbamid (tifenszulfuron-metil),

B3) pirazolil-szulfonil-karbamidok, például

1-/4-etoxi-karbonil/-1-metil-pirazol-5-il-szulfonil)-3-(4,6-dimetoxi-pirimidin-2-il)-karbamid (pirazoszulfuron-metil),

3-klór-5-(4,6-dimetoxi-pirimidin-2-il-karbamoil-szulfamoil)-1-metil-pirazol-4-karbonsav-metil-észter (lásd EP 282613),

5-(4,6-dimetil-pirimidin-2-il-karbamoil-szulfamoil)-1-(2-piridil)-pirazol-4-karbonsav-metil-észter (NC–330, lásd Brighton Crop. Prot. Conference – Weeds – 1991, 1. kötet, 45. oldal),

B4) szulfondiamidszármazékok, például

3-(4,6-dimetoxi-pirimidin-2-il)-1-(N-metil-N-/metil-szulfonil/-amino-szulfonil)-karbamid (amidszulfuron) és szerkezeti analógok (lásd EP–A–0 131 258 és Z. Pfl. Krankh. Pfl. Schutz 1990, Sonderheft XII, 489–497),

B5) piridil-szulfonil-karbamidok, például

1-(3-/N,N-dimetil-amino-karbonil/-piridin-2-il-szulfonil)-3-(4,6-dimetoxi-pirimidin-2-il)-karbamid (nikoszulfuron),

1-(3-/etil-szulfonil/-piridin-2-il-szulfonil)-3-(4,6-dimetoxi-pirimidin-2-il)-karbamid (DPX–E 9636, s. Brighton Crop. Prot. Conf. – Weeds – 1989, S. 23 ff),

piridilszulfon-karbamidok, például lásd a DE–A–4000503 és DE–A–4030577,

előnyösen az (A) általános képletű vegyületek, ahol

E CH vagy N, előnyösen CH,

R^{11} jód vagy $NR^{16}R^{17}$,

R^{12} hidrogén- vagy halogénatom, ciano-, 1–3 szénatomos alkil-, 1–3 szénatomos alkoxi-, 1–3 szénatomos halogén-alkil-, 1–3 szénatomos halogén-alkoxi-, 1–3 szénatomos alkil-tio-, 1–3 szénatomos alkoxi-(1–3 szénatomos alkil)-csoport, 1–3 szénatomos alkoxi-karbonil-, mono- vagy di-(1–3 szénatomos alkil)-amino-, 1–3 szénatomos alkil-szulfinil- vagy -szulfonil-, $SO_2–NR^aR^b$ vagy $–CO–NR^aR^b$ képletű csoport, különösen hidrogénatom,

R^a, R^b egymástól függetlenül hidrogénatom, 1–3 szénatomos alkil-, 1–3 szénatomos alkenil-, 1–3 szénatomos alkinil- vagy együtt $–(CH_2)_4–$, $–(CH_2)_5–$ vagy $–(CH_2)_2–O–(CH_2)_2–$,

R^{13} jelentése hidrogénatom vagy metilcsoport,

R^{14} jelentése halogénatom, 1–2 szénatomos alkil-, 1–2 szénatomos alkoxi- vagy 1–2 szénatomos halogén-alkil-csoport, előnyösen trifluor-metil-, 1–2 szénatomos halogén-alkoxi-, előnyösen $–OCHF_2$ vagy $–OCH_2CF_3$,

R^{15} jelentése 1–2 szénatomos alkil-, 1–2 szénatomos halogén-alkoxi-, előnyösen $–OCHF_2$ vagy 1–2 szénatomos alkoxicsoport, és

R^{16} jelentése 1–4 szénatomos alkilcsoport,

R^{17} 1–4 szénatomos alkil-szulfonil-csoport vagy

R^{16} és R^{17} együtt $–(CH_2)_3SO_2–$ vagy $–(CH_2)_4SO_2–$ csoportot képeznek,

például 3-(4,6-dimetoxi-pirimidin-2-il)-1-(3-/N-(metil-szulfonil)-N-metil-amino/-piridin-2-il)-szulfonil-karbamid vagy ennek sói,

B6) alkoxi-fenoxi-szulfonil-karbamidok, mint az EP–A–0342569 számú bejelentésben leírt vegyületek, előnyösen (B) általános képletű vegyületek, ahol

E jelentése CH vagy N, előnyösen CH,

R^{18} jelentése etoxi-, propoxi- vagy izopropoxicsoport,

R^{19} jelentése hidrogén- vagy halogénatom, nitro-, trifluor-metil-, ciano-, 1–4 szénatomos alkil-, 1–4 szénatomos alkoxi-, 1–4 szénatomos alkil-tio- vagy /1–3 szénatomos alkoxi/-karbonil-csoport, előnyösen a fenilgyűrű 6-os helyzetében,

n értéke 1, 2 vagy 3, előnyösen 1,

R^{20} jelentése hidrogénatom, 1–4 szénatomos alkil- vagy 3–4 szénatomos alkenilcsoport,

R^{21} és R^{22} egymástól függetlenül lehet halogénatom, 1–2 szénatomos alkil-, 1–2 szénatomos alkoxi-, 1–2 szénatomos halogén-alkil-, 1–2 szénatomos halogén-alkoxi- vagy (1–2 szénatomos alkoxi)-(1–2 szénatomos alkil)-, előnyösen $–OCH_3$ vagy $–CH_3$ csoport, például 3-(4,6-dimetoxi-pirimidin-2-il)-1-(2-etoxi-fenoxi)-szulfonil-karbamid vagy ezek sói,

és további rokon szulfonil-karbamid-származékok vagy ezek elegyei,

C) klór-acetanilid-herbicidek, például
N-/metoxi-metil/-2,6-dietil-klór-acetanilid (alaklór),
N-(3'-metoxi-prop-2'-il)-2-metil-6-etil-klór-acetanilid (metolaklór),
N-(3-metil-1,2,4-oxadiazol-5-il-metil)-klór-ecetsav-2,6-dimetil-anilid,
N-(2,6-dimetil-fenil)-N-(1-pirazolil-metil)-klór-ecetsavamid (metazaklór),
D) tiokarbamátok, például
S-etil-N,N-dipropil-tiokarbamát (EPTC) vagy
S-etil-N,N-diizobutil-tiokarbamát (butilát),
E) ciklohexán-dion-származékok, például
3-(1-/allil-oxi-imino/-butil)-4-hidroxi-6,6-dimetil-2-oxo-ciklohex-3-en-karbonsav-metil-észter (alloxidim),
2-(1-etoximino-butil)-5-(2-/etil-tio/-propil)-3-hidroxi-ciklohex-2-en-1-on (szetoxidim),
2-(1-etoximino-butil)-5-(2-/fenil-tio/-propil)-3-hidroxi-ciklohex-2-en-1-on (kloproxidim),
2-(1-/3-klór-allil-oxi)-imino/butil)-5-[2-(etil-tio)-propil]-3-hidroxi-ciklohex-2-én-1-on,
2-(1-/3-klór-allil-oxi)-imino/propil)-5-[2-(etil-tio)-propil]-3-hidroxi-ciklohex-2-en-1-on (kletodim),
2-(1-etoximino)-butil)-3-hidroxi-5-(tian-3-il)-ciklohex-2-enon (cikloxidim),
vagy
2-(1-etoximino-propil)-5-(2,4,6-trimetil-fenil)-3-hidroxi-ciklohex-2-en-1-on (tralkoxidim),
F) 2-(4-alkil-5-oxo-2-imidazolin-2-il)-benzoesav-származékok vagy 2-(4-alkil-5-oxo-2-imidazolin-2-il)-heteroaril-karbonsav-származékok, például
2-(4-izopropil-4-metil-5-oxo-2-imidazolin-2-il)-5-metil-benzoesav-metil-észter és
2-(4-izopropil-4-metil-5-oxo-2-imidazolin-2-il)-4-metil-benzoesav (imazametabenz),
5-etil-2-(4-izopropil-4-metil-5-oxo-2-imidazolin-2-il)-piridin-3-karbonsav (imazetapir),
2-(4-izopropil-4-metil-5-oxo-2-imidazolin-2-il)-kinolin-3-karbonsav (imazakvin),
2-(4-izopropil-4-metil-5-oxo-2-imidazolin-2-il)-piridin-3-karbonsav (imazapir),
5-metil-2-(4-izopropil-4-metil-5-oxo-2-imidazolin-2-il)-piridin-3-karbonsav (imazetametapir),
G) triazolo-pirimidin-szulfonamid-származékok, például
N-(2,6-difluor-fenil)-7-metil-1,2,4-triazolo[1,5-c]pirimidin-2-szulfonamid (flumetszulam),
N-(2,6-diklór-3-metil-fenil)-5,7-dimetoxi-1,2,4-triazolo[1,5-c]pirimidin-2-szulfonamid,
N-(2,6-difluor-fenil)-7-fluor-5-metoxi-1,2,4-triazolo[1,5-c]pirimidin-2-szulfonamid,
N-(2,6-diklór-3-metil-fenil)-7-klór-5-metoxi-1,2,4-triazolo[1,5-c]pirimidin-2-szulfonamid,
N-(2-klór-6-metoxi-karbonil)-5,7-dimetil-1,2,4-triazolo[1,5-c]pirimidin-2-szulfonamid,
(lásd például az EP-A-343 752, US-4 988 812 szakirodalmi helyen),
H) benzoil-ciklohexán-dion-származékok, például
2-(2-klór-4-/metil-szulfonil/-benzoil)-ciklohexán-1,3-dion (SC-0051, lásd EP-A-137 963),
2-(2-nitro-benzoil)-4,4-dimetil-ciklohexán-1,3-dion (lásd EP-A-274 634),
2-(2-nitro-3-/metil-szulfonil/-benzoil)-4,4-dimetil-ciklohexán-1,3-dion (lásd WO-91/13548),
J) pirimidinil-oxi-pirimidin-karbonsav-, illetve pirimidinil-oxi-benzoesav-származékok, például
3-(4,6-dimetoxi-pirimidin-2-il)-oxi-piridin-2-karbonsav-benzil-észter (EP-A-249 707),
3-(4,6-dimetoxi-pirimidin-2-il)-oxi-piridin-2-karbonsav-metil-észter (EP-A-249 707),
2,6-bisz[(4,6-dimetoxi-pirimidin-2-il)-oxi]-benzoesav (EP-A-321 846),
2,6-bisz[(4,6-dimetoxi-pirimidin-2-il)-oxi]-benzoesav-(1-etoxi-karbonil-oxi-etil)-észter (EP-A-472 113) és
K) S-(N-aril-N-alkil-karbamoil-metil)-ditiofoszforsav-észter, így például S-[N-(4-klór-fenil)-N-izopropil-karbamoil-metil]-O,O-dimetil-ditiofoszfát (Anilofos).

Az A-K csoportokhoz tartozó fent megadott herbicidek ismeretesek a szakember számára, és rendszerint megtalálhatók a „The Pesticide Manual", British Crop Protection Council, 9. kiadás, 1991 vagy 8. kiadás 1987 vagy az „Agricultural Chemicals Book II, Herbicides", W. T. Thompson, Thompson Publications, Fresno CA, USA 1990, vagy a Tarm Chemicals Handbook '90", Mesiter Publishing Company, Willoughby OH USA 1990 szakirodalmi helyeken. Az imazetametapir ismeretes a Weed Techn. 1991, 5. kötet, 430-438. oldaláról.

A herbicid hatóanyagok és az említett safenerek együtt kész formált készítmény vagy tankkeverési eljárás keretében, vagy tetszőleges sorrendben vihetők ki egymás után. A safener és herbicid egymáshoz viszonyított tömegaránya tág határokon belül változik, és előnyösen (1:10)-(10:1), különösen (1:10)-(5:1). A herbicid és safener mindenkori optimális mennyisége függ az alkalmazott herbicid típusától és az alkalmazott safenertől, valamint a kezelendő növényi állomány fajtájától, és esetről esetre előkísérlettel kell meghatározni. A megfelelő mennyiségű viszonyok a safener és más növényvédő szer hatóanyagok, például inszekticid vagy inszekticid-herbicid kombinációknál értelemszerűek.

A safenerek fő alkalmazási területe elsősorban a gabonakultúrák (búza, rozs, árpa, komló), rizs, kukorica, Sorghum, továbbá gyapot, szójabab, előnyösen gabona, rizs és kukorica.

A találmány szerinti (I) általános képletű safener különös előnye a szulfonil-karbamidok és/vagy imidazolinonok, valamint fenoxi-fenoxi- és heteroaril-fenoxi-alkánkarbonsav-származékok típusú herbicidek kombinációjánál látható.

Ezen osztályokhoz tartozó herbicidek közül néhányat speciálisan a gabonakultúrákban és/vagy kukoricában, valamint rizsben nem lehet, vagy nem eléggé lehet szelektíven alkalmazni.

A találmány szerinti safenerekkel kombinálva ezeknél a herbicideknél is kiemelkedő szelektivitást lehet elérni gabonában, kukoricában vagy rizsnél.

Az (I) általános képletű antidotumokat tulajdonságaik szerint a kultúrnövény vetőmagjának előkezelésére, azaz csávázására lehet használni, vagy vetés előtt a barázdákba lehet bevinni, vagy a herbiciddel együtt vagy a növény kikelése előtt vagy után lehet alkalmaz-

ni. A kikelés előtti kezelés, azaz a preemergens kezelés magában foglalja mind a termőfelület kezelését a vetés előtt, mind pedig a már bevetett, de még nem benőtt termőfelület kezelését is. Előnyös, hogyha a herbiciddel együtt alkalmazzuk, különösen posztemergens eljárás során. Ehhez tankelegyeket vagy kész formált készítményeket is alkalmazhatunk.

A safenerek szükséges felhasználási mennyiségét a használt herbicid indikációs területe és mennyisége szerint határozhatjuk meg rendszerint 0,001–5 kg, előnyösen 0,005–0,5 kg hatóanyag/ha tartományon belül.

A találmány tárgya tehát eljárás kultúrnövények megvédésére peszticidek, előnyösen herbicidek fitotoxikus mellékhatásaitól oly módon, hogy egy hatékony mennyiségű (I) általános képletű vegyületet a peszticiddel, illetve herbiciddel történő kezelés előtt, után vagy egyidejűleg felvisszük a növényre, a növény magvaira vagy a termőfelületre.

A találmány tárgya továbbá növényvédő készítmény is, amely egy (I) általános képletű hatóanyagot és a szokásos formálási segédanyagokat tartalmazza, valamint peszticid, előnyösen herbicid szereket, amelyek egy (I) általános képletű hatóanyagot és egy peszticidet, illetve herbicidet, valamint a növényvédelem területén szokásos segédanyagokat tartalmazza.

Az (I) általános képletű vegyületek és ezek kombinációi egy vagy több megadott herbiciddel különböző módon lehetnek formálva aszerint, hogy milyen biológiai és/vagy kémiai-fizikai paraméterek állnak fönn. Formálási lehetőségként szóba jönnek például a permetporok (WP), emulgeálható koncentrátumok (EC), vízoldékony porok (SP), vízoldékony koncentrátumok (SL), koncentrált emulziók (EW), például „olaj a vízben" és „víz az olajban" típusú emulziók, permetezhető oldatok vagy emulziók, kapszulaszuszpenziók (CS), olaj- vagy vízbázisú diszperziók (SC), szuszpoemulziók, szuszpenziókoncentrátumok, porozószerek (DP), olajjal elegyedő oldatok (OL), csávázószerek, granulátumok (GR), mikro-, permet-, bevonó- és abszorpciós granulátumok formájában, granulátumok talajra, illetve szóróalkalmazásra, vízoldékony granulátumok (SG), vízzel diszpergálható granulátumok (WG), ULV-készítmények, mikrokapszulák és viaszok.

Ezek a formálási típusok elvben ismertek, és leírásuk megtalálható például a következő irodalmi helyeken: Winnacker–Küchler, „Chemische Technologie" 7. kötet, C. Hauser Verlag München, 4. kiadás, 1986; Wade van Valkenburg, „Pesticide Formulations", Marcel Dekker N. Y., 1973; K. Martens, „Spray Drying Handbook", 3. kiadás, 1979, G. Goodwin Ltd. London.

A szükséges formálási segédanyagok, például inert anyagok, tenzidek, oldószerek és további adalékok is ismertek, és leírásuk például a következő irodalomban található: Watkins, „Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2. kiadás, Darland Books, Caldwell N. J.; H. v. Olphen, „Introduction to Clay Colloid Chemistry", 2. kiadás, J. Wiley & Sons, N. Y.; Marsden, „Solvents Guide", 2. kiadás, Interscience, N. Y. 1963; McCutcheon's „Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N. J.; Sisley and Wood, „Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc, N. Y. 1964; Schönfeldt, „Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte", Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976; Winnacker–Küchler „Chemische Technologie", 7. kötet, C. Hauser Verlag München, 4. kiadás 1986.

A formálások alapján előállíthatók más peszticid hatású hatóanyagokkal, trágyákkal és/vagy növekedésszabályozókkal képezett kombinációk is, például kész formált készítmény vagy tankelegy formájában.

A permetporok vízben egyenletesen diszpergálható készítmények, amelyek a hatóanyagon kívül és hígító- vagy inert anyagon kívül még nedvesítőszert, például poli(oxi-etil)-ezett alkil-fenolokat, poli(oxi-etil)-ezett zsíralkoholokat és zsíraminokat, zsíralkohol poliglikol-éterszulfátokat, alkánszulfonátokat vagy alkil-aril-szulfonátokat és diszpergálószert, például nátrium-ligninszulfonátot, 2,2'-dinaftil-metán-6,6'-diszulfonsav-nátriumsót, dibutil-naftalinszulfonsav-nátriumsót vagy oleoil-metil-taurinsav-nátriumsót tartalmaznak.

Az emulgeálható koncentrátumok úgy állíthatók elő, hogy a hatóanyagot szerves oldószerben, például butanolban, ciklohexanonban, dimetil-formamidban, xilolban vagy magas forráspontú aromás anyagokban, vagy szénhidrogénekben egy vagy több emulgeátor hozzáadása révén feloldjuk. Emulgeátorként például használhatunk alkil-arilszulfonsav-kalcium-sókat, például kalcium-dodecil-benzolszulfonátot vagy nemionos emulgeátorokat, például zsírsav-poliglikol-észtert, alkil-aril-poliglikol-étert, zsíralkohol-poliglikol-étert, propilén-oxid–etilén-oxid-kondenzációs termékeket (például blokkpolimereket), alkil-poliétert, szorbitán-zsírsav-észtert, poli(oxi-etilén)-szorbitán-zsírsav-észtert vagy poli(oxi-etilén)-szorbit-észtert.

A porozószereket úgy állítjuk elő, hogy a hatóanyagot finom eloszlású szilárd anyagokkal, például talkummal, természetes agyagokkal, például kaolinnal, bentonittal és pirofillittel vagy diatómaföldde megőröljük.

A granulátumokat úgy állítjuk elő, hogy a hatóanyagot abszorpcióképes granulált inert anyagra porlasztjuk, vagy a hatóanyag-koncentrátumot ragasztószer, például poli(vinil-alkohol), poliakrilsav-nátrium vagy ásványi olajok segítségével felvisszük a hordozóanyag felületére, például homokra, kaolinitra vagy granulált inert anyagra. A megfelelő hatóanyagokat a trágyagranulátumok előállításánál szokott módon kívánt esetben a trágyákkal összekeverve granulálhatjuk.

Az agrokémiai készítmények rendszerint 0,1–99 tömeg%, különösen 0,1–95 tömeg% (I) általános képletű antidotum hatóanyagot tartalmaznak, vagy az antidotum herbicid hatóanyagelegy koncentrációja ugyanennyi, és tartalmaznak még 1–99,9 tömeg%, különösen 5–99,8 tömeg% szilárd vagy folyékony adalékot és 0–25 tömeg%, különösen 0,1–25 tömeg% tenzidet.

A permetporokban a hatóanyag-koncentráció például 10–90 tömeg%, és a maradék a szokásos formálási komponens. Az emulgeálható koncentrátumoknál a hatóanyag-koncentráció körülbelül 1–80 tömeg% hatóanyag, a por formájú készítmények 1–20 tömeg% hatóanyagot, a permetezhető oldatok 0–20 tömeg% hatóanyagot tartalmaznak. A granulátumoknál, például víz-

zel diszpergálható granulátumoknál a hatóanyag-tartalom részben attól függ, hogy a hatékony vegyület folyékony vagy szilárd formában van jelen. Rendszerint a vízzel diszpergálható granulátumok hatóanyag-tartalma 10–90 tömeg% között van.

Emellett a megadott hatóanyag-készítmények adott esetben a szokásos tapadószert, nedvesítőszert, diszpergáló-, emulgeáló-, penetrálószert, oldószert, töltőanyagot vagy hordozóanyagot tartalmaznak.

A kereskedelmi forgalomban lévő forma alkalmazásához előállított készítményeket adott esetben szokott módon hígítani kell, például a permetporokat, emulgeálható koncentrátumokat, diszperziókat és vízzel diszpergálható granulátumokat vízzel hígítjuk. A por formájú készítményeket, granulátumokat, valamint a permetezhető oldatokat alkalmazás előtt rendszerint nem hígítjuk tovább további inert anyagokkal. A külső körülmények függvényében, például hőmérséklet, nedvességtartalom, alkalmazott peszticid-, illetve herbicidfajta, változik a szükséges antidotumfelhasználási mennyiség.

A találmány további részleteit a következő példákkal világítjuk meg.

A) Formálási példák

a) Porozószert kapunk, ha 10 tömegrész (I) általános képletű vegyületet vagy egy herbicidből és (I) általános képletű vegyületből álló hatóanyagelegyet és 90 tömegrész talkumot inert anyagként összekeverünk és kalapácsmalomban megőrlünk.

b) Egy vízzel könnyen diszpergálható nedvesíthető port kapunk, ha 25 tömegrész (I) általános képletű vegyületet vagy egy herbicidből és (I) általános képletű antidotumból álló hatóanyagelegyet, valamint 64 tömegrész kaolintartalmú kvarcot, mint inert anyagot, 10 tömegrész kálium-ligninszulfonátot, 1 tömegrész oleoil-metil-taurinsav-nátriumsót nedvesítő- és diszpergálószerként összekeverünk és megőrlünk.

c) Egy vízben könnyen diszpergálható diszperziós koncentrátumot kapunk, ha 20 tömegrész (I) általános képletű vegyületet egy herbicid és (I) általános képletű safener hatóanyag elegyét 6 tömegrész ®Triton X 207 alkil-fenol-poliglikol-étert, 3 tömegrész izotridekanol-poliglikol-étert (8 EO) és 71 tömegrész paraffin ásványolajat (forrástartomány: például 255–277 °C felett) összekeverünk, és egy golyósmalomban 5 mikrométer alattira megőrlünk.

d) Emulgeálható koncentrátumot kapunk 15 tömegrész (I) általános képletű vegyületből vagy egy herbicid és (I) általános képletű antidotum hatóanyag elegyéből, 75 tömegrész ciklohexanon oldószerből és 10 tömegrész oxetilezett nonil-fenol-emulgeátorból.

e) Vízben diszpergálható granulátumot kapunk, ha
75 tömegrész (I) általános képletű vegyületet vagy egy herbicid és (I) általános képletű safener hatóanyagelegyet,
10 tömegrész kalcium-lignin-szulfonátot,
5 tömegrész nátrium-lauril-szulfátot,
3 tömegrész poli(vinil-alkohol)-t és
7 tömegrész kaolint
összekeverünk, malomban megőrlünk, és a port egy forgóágyon a víz felfújásával mint granulálófolyadékkal granuláljuk.

f) Vízzel diszpergálható granulátumot állítunk elő, ha
25 tömegrész (I) általános képletű vegyületet vagy egy herbicid és (I) általános képletű antidotum hatóanyag elegyét,
5 tömegrész nátrium-2,2'-dinaftil-metán-6,6'-diszulfonátot,
2 tömegrész nátrium-oleoil-metil-taurinátot,
1 tömegrész poli(vinil-alkohol)-t,
17 tömegrész kalcium-karbonátot és
50 tömegrész vizet
kolloidmalomban homogenizálunk, előőrlünk, majd egy gyöngymalomban megőrlünk, és az így kapott szuszpenziót egy szórótoronyban porlasztóval szétporlasztunk és megszárítunk.

B) Előállítási példák

1. példa

5,5-Difenil-2-izoxazolin-3-karbonsav-etil-észter

13,52 g (0,075 mol) 1,1-difenil-etént és 5,06 g (0,05 mol) trietil-amint 0 °C-on feloldunk 200 ml éterben, majd körülbelül 2 óra hosszat hozzácsepegtetünk 100 ml éterben feloldott 7,58 g (0,05 mol) 2-klór-2-(hidroxi-imino)-ecetsav-etil-észtert. 1 órás keverés után szobahőmérsékleten hozzáadunk 100 ml vizet, majd ezt követően az elegyet éterrel extraháljuk. Magnézium-szulfát felett szárítjuk, ezután az étert ledesztilláljuk és a maradékot kovasavgél oszlopon kromatografáljuk. Futtatószerként n-heptán és etil-acetát 8:2 arányú elegyét használjuk. 12,7 g, 86% terméket kapunk, amely 78–81 °C-on olvad.

Az 1. táblázatban felsorolt vegyületeket az 1. példa analógiájára, illetve a további fent leírt módszerrel kapjuk.

A rövidítések az 1. táblázatban a következők:
Me=metil
Be=butil
i-, s-, t-, c-alkil=izo-, szekunder-, tercier-, illetve cikloalkil,
Op.=olvadáspont (°C)

1. táblázat

(I) általános képletű vegyületek

Példaszám	R^1	R^2	R^3	R^4	Op.
2.	$-COOCH_3$	H	C_6H_5	C_6H_5	122–124 °C
3.	$-COO-n-C_3H_7$	H	C_6H_5	C_6H_5	64–66 °C

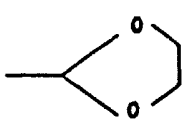
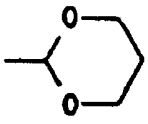
1. táblázat (folytatás)

Példaszám	R^1	R^2	R^3	R^4	Op.
4.	$-COO-n-C_4H_9$	H	C_6H_5	C_6H_5	olaj
5.	$-COO-n-C_5H_{11}$	H	C_6H_5	C_6H_5	olaj
6.	$-COO^-Na^+$	H	C_6H_5	C_6H_5	210–212 °C (Z)
7.	$-COO^-N(CH_3)_4^+$	H	C_6H_5	C_6H_5	116 °C (Z)
8.	$-COOCH_2CH_2Cl$	H	C_6H_5	C_6H_5	70 °C
9.	$-COOCH_2CH_2OCH_3$	H	C_6H_5	C_6H_5	olaj
10.	$-COO-i-C_3H_7$	H	C_6H_5	C_6H_5	
11.	$-COO-i-C_4H_9$	H	C_6H_5	C_6H_5	olaj
12.	$-COO-s-C_4H_9$	H	C_6H_5	C_6H_5	olaj
13.	$-COO-C(CH_3)_3$	H	C_6H_5	C_6H_5	olaj
14.	$-COO-n-C_6H_{13}$	H	C_6H_5	C_6H_5	olaj
15.	$-COO-n-C_8H_{17}$	H	C_6H_5	C_6H_5	olaj
16.	$-COOCH_2SCH_3$	H	C_6H_5	C_6H_5	olaj
17.	$-COOCH_2-CH=CH_2$	H	C_6H_5	C_6H_5	55–57 °C
18.	$-COOH$	H	C_6H_5	C_6H_5	85–90 °C
19.	$-COOC_2H_5$	CH_3	C_6H_5	C_6H_5	
20.	$-COOC_2H_5$	$-C_2H_5$	C_6H_5	C_6H_5	
21.	$-COO-n-C_4H_9$	Ciklo-C_3H_4	C_6H_5	C_6H_5	
22.	$-COOCH_3$	Ciklo-C_6H_{11}	C_6H_5	C_6H_5	
23.	$-COOC_2H_5$	$-CH_2-CH=CH_2$	C_6H_5	C_6H_5	82 °C
24.	$-COOC_2H_5$	$-CH_2CH_2CN$	C_6H_5	C_6H_5	
25.	$-COO-C_2H_5$	$-COOC_2H_5$	C_6H_5	C_6H_5	
26.	$-COOC_2H_5$	$-OC_2H_5$	C_6H_5	C_6H_5	
27.	$-COOC_2H_5$	$-S-CH_3$	C_6H_5	C_6H_5	
28.	$-COOCH_3$	$-CH_2COOCH_3$	C_6H_5	C_6H_5	
29.	$-COOCH_2C_6H_5$	H	C_6H_5	C_6H_5	olaj
30.	$-COOC_6H_5$	H	C_6H_5	C_6H_5	olaj
31.	$-COOCH_2CH_2C_6H_5$	H	C_6H_5	C_6H_5	
32.	$-COOC_2H_5$	H	$2-Cl-C_6H_4$	C_6H_5	
33.	$-COOC_2H_5$	H	$3-Cl-C_6H_4$	C_6H_5	olaj
34.	$-COOC_2H_5$	H	$4-Cl-C_6H_4$	C_6H_5	olaj
35.	$-COOC_2H_5$	H	$2-F-C_6H_4$	C_6H_5	
36.	$-COOC_2H_5$	H	$3-F-C_6H_4$	C_6H_5	
37.	$-COOC_2H_5$	H	$4-F-C_6H_4$	C_6H_5	olaj
38.	$-COOC_2H_5$	H	$4-Cl-C_6H_4$	$4-Cl-C_6H_4$	olaj
39.	$-COOC_2H_5$	H	$4-Cl-C_6H_4$	$2-Cl-C_6H_4$	

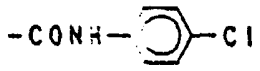
1. táblázat (folytatás)

Példaszám	R^1	R^2	R^3	R^4	Op.
40.	$-COOC_2H_5$	H	$4-Cl-C_6H_4$	$3-Cl-C_6H_4$	
41.	$-COOC_2H_5$	H	$4-Br-C_6H_4$	C_6H_5	
42.	$-COOC_2H_5$	H	$4-Br-C_6H_4$	$4-Cl-C_6H_4$	olaj
43.	$-COOC_2H_5$	H	$4-CF_3-C_6H_4$	C_6H_5	olaj
44.	$-COOC_2H_5$	H	$4-CH_3-C_6H_4$	C_6H_5	
45.	$-COOC_2H_5$	H	$4-CH_3-C_6H_4$	$4-Cl-C_6H_4$	olaj
46.	$-COOC_2H_5$	H	$2,4-Di-Cl-C_6H_3$	C_6H_5	olaj
47.	$-COOC_2H_5$	H	$3,4-Di-Cl-C_6H_3$	C_6H_5	olaj
48.	$-COOC_2H_5$	H	$2,5-Di-Cl-C_6H_3$	C_6H_5	
49.	$-COOC_2H_5$	H	$3,5-Di-Cl-C_6H_3$	C_6H_5	
50.	$-COOC_2H_5$	H	$2,6-Di-Cl-C_6H_3$	C_6H_5	
51.	$COOC_2H_5$	H	$4-NO_2-C_6H_4$	C_6H_5	
52.	$COOC_2H_5$	H	$4-CN-C_6H_4$	C_6H_5	
53.	$COOC_2H_5$	H	$4-COOCH_3-C_6H_4$	C_6H_5	
54.	$COOC_2H_5$	H	$4-OCH_3-C_6H_4$	C_6H_5	120 °C
55.	$COO-n-C_3H_7$	H	$4-F-C_6H_4$	C_6H_5	olaj
56.	$COO-n-C_3H_7$	H	$4-Cl-C_6H_4$	C_6H_5	olaj
57.	$COO-n-C_4H_9$	H	$4-F-C_6H_4$	C_6H_5	olaj
58.	$COO-n-C_4H_9$	H	$4-Cl-C_6H_4$	C_6H_5	olaj
59.	$COO-n-C_5H_{11}$	H	$4-F-C_6H_4$	C_6H_5	olaj
60.	$COO-n-C_5H_{11}$	H	$4-Cl-C_6H_4$	C_6H_5	olaj
61.	$COO-n-C_6H_{13}$	H	$4-Cl-C_6H_4$	C_6H_5	olaj
62.	$COO-CH_2CH_2Cl$	H	$4-Cl-C_6H_4$	C_6H_5	olaj
63.	$COO-CH_2CH_2OCH_3$	H	$4-Cl-C_6H_4$	C_6H_5	
64.	$COOCH(CH_3)-CH_2(CH_2)_3CH_3$	H	$4-Cl-C_6H_4$	C_6H_5	
65.	$COO-CH_2C_6H_5$	H	$4-Cl-C_6H_4$	C_6H_5	
66.	COOH	H	$4-Cl-C_6H_4$	C_6H_5	86–87 °C
67.	COO^-Na^+	H	$4-Cl-C_6H_4$	C_6H_5	
68.	COO^-K^+	H	$4-F-C_6H_4$	C_6H_5	
69.	$COOC_2H_5$	H	C_6H_5	CH_3	olaj
70.	$COOCH_3$	H	C_6H_5	CH_3	
71.	$COOC_2H_5$	H	C_6H_5	$CH(CH_3)_2$	
72.	$COOC_2H_5$	H	C_6H_5	$C(CH_3)_3$	olaj
73.	$COOC_2H_5$	H	$4-Cl-C_6H_4$	$C(CH_3)_3$	
74.	$COO-n-C_3H_7$	H	C_6H_5	$C(CH_3)_3$	
75.	$COO-n-C_4H_9$	H	C_6H_5	$C(CH_3)_3$	
76.	$COO-n-C_5H_{11}$	H	C_6H_5	$C(CH_3)_3$	

1. táblázat (folytatás)

Példaszám	R^1	R^2	R^3	R^4	Op.
77.	$COO-n-C_6H_{13}$	H	C_6H_5	$C(CH_3)_3$	
78.	$COO-CH_2CH_2OCH_3$	H	C_6H_5	$C(CH_3)_3$	
79.	$COO-C_2H_5$	H	C_6H_5	$CH_2C(CH_3)_3$	
80.	$COO-C_2H_5$	H	C_6H_5	$CH_2Si(CH_3)_3$	
81.	$COOC_2H_5$	H	C_6H_5	Ciklo-C_5H_9	olaj
82.	$COOC_2H_s$	H	C_6H_5	Ciklo-C_6H_{11}	olaj
83.	$COOC_2H_5$	H	C_6H_5	Ciklo-C_3H_4	olaj
84.	$COO-n-C_3H_7$	H	C_6H_5	Ciklo-C_6H_{11}	
85.	$COO-n-C_4H_9$	H	C_6H_5	Ciklo-C_6H_{11}	
86.	$COO-n-C_5H_{11}$	H	C_6H_5	Ciklo-C_6H_{11}	
87.	$-COOC_2H_5$	H	Ciklo-C_6H_{11}	CH_3	
88.	$-COOC_2H_5$	H	Ciklo-C_6H_{11}	$C(CH_3)_3$	
89.	$-COOC_2H_5$	H	Ciklo-C_6H_{11}	Ciklo-C_6H_{11}	
90.	$-COOC_2H_5$	H	C_6H_5	2-piridil	
91.	$-COOC_2H_5$	H	C_6H_5	3-piridil	olaj
92.	$-COOC_2H_5$	H	C_6H_5	4-piridil	olaj
93.	$-COOC_2H_5$	H	C_6H_5	2-tienil	olaj
94.	$-COOC_2H_5$	H	C_6H_5	3-tienil	olaj
95.	$-COOC_2H_5$	H	C_6H_5	2-Cl-3-piridil	olaj
96.	$-COOC_2H_5$	H	C_6H_5	6-Cl-3-piridil	
97.	$-COOC_2H_5$	H	4-Cl-C_6H_4	3-piridil	
98.	$-COOC_2H_5$	H	3-Cl-C_6H_4	3-piridil	
99.	$-COOC_2H_5$	H	2-Cl-C_6H_4	3-piridil	
100.	-COOH	H	C_6H_5	3-piridil	
101.	$-COCH_3$	H	C_6H_5	C_6H_5	
102.	$-COCH_3$	H	C_6H_5	Ciklo-C_6H_{11}	
103.	-CHO	H	C_6H_5	C_6H_5	
104.	-CHO	H	C_6H_5	Ciklo-C_6H_{11}	
105.	-CHO	H	C_6H_5	$C(CH_3)_3$	
106.	$-CH(OCH_3)_2$	H	C_6H_5	C_6H_5	
107.	$-CH(OC_2H_5)_2$	H	C_6H_5	C_6H_5	
108.		H	C_6H_5	C_6H_5	
109.		H	C_6H_5	C_6H_5	

1. táblázat (folytatás)

Példaszám	R^1	R^2	R^3	R^4	Op.
110.	$-C(OCH_3)_2CH_3$	H	C_6H_5	C_6H_5	
111.	$-COCF_3$	H	C_6H_5	C_6H_5	
112.	$-COCF_3$	H	C_6H_5	$C(CH_3)_3$	
113.	$-COCF_3$	H	C_6H_5	Ciklo-C_6H_{11}	
114.	$-COCCl_3$	H	C_6H_5	C_6H_5	
115.	$-COCHCl_2$	H	C_6H_5	C_6H_5	
116.	$-COCHCl_2$	H	C_6H_5	$C(CH_3)_3$	
117.	$-COCHCl_2$	H	C_6H_5	Ciklo-C_6H_{11}	
118.	$-COCHF_2$	H	C_6H_5	C_6H_5	
119.	$-COCHF_2$	H	C_6H_5	3-piridil	
120.	$-COO-CH(CH_3)CH_2OCH_3$	H	C_6H_5	C_6H_5	olaj
121.	$-COOH$	H	$4-F-C_6H_4$	$4-F-C_6H_4$	130–134 °C
122.	$-COOH$	H	$4-F-C_6H_4$	C_6H_5	135–140 °C
123.	$-COOC_2H_5$	H	$-COOCH(CH_3)-C_2H_5$	C_6H_5	olaj
124.		H	$-C_6H_5$	C_6H_5	212–215 °C
125.	$-COOC_2H_5$	H	$-COOC_2H_5$	C_6H_5	olaj
126.	$-COOCH_2COOC_2H_5$	H	$-C_6H_5$	C_6H_5	olaj
127.	$-CO-O-CH_2C\equiv CH$	H	$-C_6H_5$		
128.	$-CO-O-CH_2-(2-7-C_6H_4)$	H	$-C_6H_5$	C_6H_5	
129.	$-CO-O-CH(C_2H_5)_2$	H	$-C_6H_5$	C_6H_5	
130.	$-CO-O-CH(CH_3)C_2H_5$	H	$4-F-C_6H_5$	C_6H_5	
131.	$-CO-O-CH_2-$tetrahidrofurfuril	H	C_6H_5	C_6H_5	
132.	$-COOC_4H_9$ (n)	H	$-C_6H_5$	$-2-CH_3-C_6H_4$	olaj
133.	$-COOCH_2-CH_2OC_2H_5$	H	$-C_6H_5$	C_6H_5	olaj
134.	$-COOC_2H_5$	H	$-4-F-C_6H_4$	$4-F-C_6H_4$	olaj
135.	$-COOC_4H_9$ (n)	H	$4-F-C_6H_4$	$4-F-C_6H_4$	olaj
136.	$-CON(CH_3)_2$	H	$-C_6H_5$	$-C_6H_5$	105–107 °C
137.	$-CONHCH_3$	H	$-C_6H_5$	$-C_5H_5$	110–112 °C
138.	$-CONH_2$	H	$-C_6H_5$	$-C_6H_5$	185–187 °C
139.	$-COOCH_2CH_2OH$	H	$-C_6H_5$	$-C_6H_5$	102–103 °C
140.	$-COOC_2H_5$	H	$-4-(OCH_3)-C_6H_4$	$-4-F-C_6H_4$	135–140 °C
141.	CO_2Et	H	$4-(NMe_2)-C_6H_4$	C_6H_4	olaj
142.	CO_2Et	H	$4-F-C_6H_4$	$2-F-C_6H_4$	olaj
143.	CO_2Et	H	$4-Cl-C_6H_4$	$4-t-Bu-C_6H_4$	86 °C
144.	CO_2Et	H	$4-F-C_6H_4$	$2-Cl-C_6H_4$	olaj

1. táblázat (folytatás)

Példaszám	R^1	R^2	R^3	R^4	Op.
145.	CO_2Et	H	4-F-C_6H_4	2,3,4-Cl_3-C_6H_2	88 °C
146.	CO_2Et	H	4-F-C_6H_4	3,4-Cl_2-C_6H_3	olaj
147.	CO_2Et	H	2,4-F_2-C_6H_3	C_6H_5	olaj
148.	CO_2Et	H	4-F-C_6H_4	2-CH_3-C_6H_4	olaj
149.	CO_2Et	H	4-F-2-Cl-C_6H_3	C_6H_5	olaj
150.	CO_2Et	H	4-Cl-2-F-C_6H_4	C_6H_5	olaj

Törésmutató a 146. és 148. példákhoz:
[1] $n_D^{30}=1,5493$ [2] $n_D^{30}=1,5530$.

Törésmutató az alábbi példák szerinti vegyületekhez

Példaszám	Törésmutató n_D^{25}	Példaszám	Törésmutató n_D^{25}
4.	1,5639	72.	1,5610
5.	1,5690	81.	1,5565
9.	1,5543	82.	1,5620
11.	1,5781	83.	1,5655
12.	1,5894	91.	1,5825
13.	1,5725	92.	1,5730
14.	1,5730	93.	1,5695
15.	1,5790	94.	1,5800
16.	1,5635	95.	1,5725
29.	1,5826	120.	1,5640
30.	1,5853	123.	1,5815
33.	1,5717	125.	1,5645
34.	1,5682	126.	1,5738
37.	1,5592	127.	1,5883
38.	1,5737	128.	1,5710
42.	1,5650	129.	1,5685
43.	1,5715	130.	1,5480
45.	1,5756	131.	1,5500
46.	1,5828	132.	1,5635
47.	1,5535	133.	1,5700
55.	1,5688	134.	1,5590
56.	1,5675	135.	1,5614
57.	1,5552	141.	1,5480
58.	1,5710	142.	1,5538
59.	1,5675	144.	1,5582
60.	1,5730	147.	1,5662
61.	1,5690	149.	1,5540
62.	1,5635	150.	1,5488
69.	1,5642		

C) Biológiai példák

Búza-, árpa- vagy rizsmagvakat homokos agyagtalajba ültetünk műanyag cserepekbe, melyeket melegházban tárolunk, és a növényeket a 3-4 leveles állapotig neveljük, majd egymást követően a találmány szerinti vegyületekkel és a herbicidekkel kezeljük poszt-emergens eljárással. A herbicideket és az (I) általános képletű vegyületeket vizes szuszpenzió, illetve emulzió formájában alkalmazzuk. A felhasznált vízmennyiség átszámítva 300 liter/ha-nak felel meg. A kezelés után 3-4 héttel kiértékeljük a növényeket a felvitt herbicidek által okozott mindenfajta károsodás szempontjából, miközben különösen figyelembe vesszük a folyamatos növekedésgátlást. A kiértékelést a kezeletlen kontrollal összevetve százalékosan adjuk meg.

Néhány kísérleti eredmény a 2., 3. és 4. táblázatban szerepel.

2. táblázat

Safenerhatás árpában

Termék herbicid/safener	Dózis (kg hatóanyag/ha)	Herbicid hatás (%) HOVU
	0,2	80
H_1+1. számú	0,2+1,25	60
H_1+2. számú	0,2+1,25	60
H_1+6. számú	0,2+1,25	20
H_1+17. számú	0,2+1,25	20
H_1+4. számú	0,2+1,25	20
H_1+3. számú	0,2+1,25	30
H_1+7. számú	0,2+1,25	37

H_1=fenoxaprop-P-etil

HOVU=Hordeum vulgare (árpa)

Nr.=a példaszámú safener... a B) fejezetből (kémiai példák)

3. táblázat

Safenerhatás rizsben

Termék herbicid/safener	Dózis (kg hatóanyag/ha)	Herbicid hatás (%) ORSA
H_1	0,3	75
H_1+1. számú	0,3+1,25	60
H_1+2. számú	0,3+1,25	70
H_1+6. számú	0,3+1,25	70
H_1+17. számú	0,3+1,25	70
H_1+4. számú	0,3+1,25	65
H_1+3. számú	0,3+1,25	20
H_1+7. számú	0,3+1,25	70

H_2=fenoxaprop-P-etil

ORSA=Oryza sativa (rizs)

4. táblázat

Safenerhatás kukoricában

Termék herbicid/safener	Dózis (kg hatóanyag/ha)	Herbicid hatás (%) ZEMV
H_2	0,075	70
H_2+1. számú	0,075+1,25	20
H_2+2. számú	0,075+1,25	30
H_2+6. számú	0,075+1,25	50
H_2+17. számú	0,075+1,25	70
H_2+4. számú	0,075+1,25	30
H_2+3. számú	0,075+1,25	40
H_2+7. számú	0,075+1,25	30

H_2=3-(4,6-dimetoxi-pirimidin-2-il)-1-(3-/N-(metil-szulfonil)-N-metil-amino/piridin-2-il)-szulfonil-karbamid

ZEMV=Zea mays (kukorica)

2. példa

Kukoricanövényeket műanyag cserepekben 4 leveles, illetve 6 leveles stádiumig nevelünk üvegházban, és egy herbicidből és (I) általános képletű vegyületekből képezett tankeleggyel kezelünk. A készítményeket a növekvő növényekre permetezzük 300 l/ha víz felhasználási mennyiséggel. A kezelés után 4 héttel a növényeket a fitotoxicitás szempontjából kiértékeljük, és meghatározzuk a károsodás mértékét a kezeletlen kontrollal összevetve.

A kísérleti eredményeket az 5. és 6. táblázat mutatja. Ebből kitűnik, hogy a találmány szerinti vegyületek hatékonyan gátolják a növények károsodását.

5. táblázat

Találmány szerinti vegyületek hatása a kukoricanövényeken

Anyag	Dózis	Herbicid hatás kukoricánál (%)	
Herbicid/safener	kg hatóanyag/ha	4 leveles stádium	6 leveles stádium
H_2	0,200	77	83
	0,100	70	73
	0,050	63	60
	0,025	33	40

5. táblázat (folytatás)

Anyag	Dózis		Herbicid hatás kukoricánál (%)	
Herbicid/safener	kg hatóanyag/ha		4 leveles stádium	6 leveles stádium
H_2+1. számú	0,200	0,200	5	10
	0,100	0,100	0	0
	0,050	0,050	0	0
	0,025	0,025	0	0
H_2+3. számú	0,200	0,200	40	0
	0,100	0,100	20	0
	0,050	0,050	0	0
	0,025	0,025	0	0
H_2 +17. számú	0,200	0200	20	10
	0,100	0,100	10	0
	0,050	0,050	0	0
	0,025	0,025	0	0
H_2+6. számú	0,200	0,200	27	30
	0,100	0,100	7	20
	0,050	0,050	0	10
	0,025	0,025	0	0
H_2+7. számú	0,200	0,200	20	33
	0,100	0,100	0	20
	0,050	0,050	0	0
	0,025	0,025	0	0
H_2+4. számú	0,200	0,200	20	0
	0,100	0,100	0	0
	0,050	0,050	0	0
	0,025	0,025	0	0

H_2=3-(4,6-dimctoxi-pirimidin-2-il)-1-(3-/N-(metil-szulfonil)-N-metil-amino/-piridin-2-il)-szulfonil-karbamid

6. táblázat

A találmány szerinti vegyületek hatása kukoricanövényeken

Anyag	Dózis		Herbicid hatás kukoricánál (%)	
Herbicid/safener	kg hatóanyag/ha		4 leveles stádium	6 leveles stádium
H_3	0,200		90	88
	0,100		80	80
	0,050		75	80
	0,025		60	65
H_3+3. számú	0,200	0,200	5	10
	0,100	0,100	0	0
	0,050	0,050	0	0
	0,025	0,025	0	0
H_3+4. számú	0,200	0,200	10	15
	0,100	0,100	0	10
	0,050	0,050	0	0
	0,025	0,025	0	0

6. táblázat (folytatás)

Anyag	Dózis		Herbicid hatás kukoricánál (%)	
Herbicid/safener	kg hatóanyag/ha		4 leveles stádium	6 leveles stádium
H_3+7. számú	0,200	0,200	20	25
	0,100	0,100	0	10
	0,050	0,050	0	0
	0,025	0,025	0	0

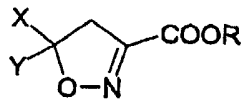
H_3=3-(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)-1-(2-/metoxi-karbonil/-5-jód-fenil-szulfonil)-karbamid

Kísérleti eredmények

A biológiai példák analógiájára vizsgáltuk a 7. táblázatban definiált antidotumokat herbicidekkel kombinálva árpában (Hordeum vulgare, HOVU), rizsben (Oryza sativa, ORYSA) és kukoricában (Zea mays, ZEAMA). Az eredményeket a 8–10. táblázatokban foglaltuk össze.

7. táblázat

(1) képletű tesztvegyületek



(1)

Antidotum	R	X	Y	Referencia
E1	C_2H_5	C_6H_5	C_6H_5	1. példa, találmány
E2	n–C_3H_7	C_6H_5	C_6H_5	2. példa, találmány
E3	Na	C_6H_5	C_6H_5	6. példa, találmány
E4	$CH_2CH=CH_2$	C_6H_5	C_6H_5	17. példa, találmány
E5	n–C_4H_9	C_6H_5	C_6H_5	3. példa, találmány
E6	C_2H_5	4–F–C_6H_4	C_6H_5	37. példa, találmány
E7	C_2H_5	4–Cl–C_6H_4	C_6H_5	34. példa, találmány
E8	2–C_4H_9	C_6H_5	C_6H_5	12. példa, találmány
E9	i–C_4H_9	C_6H_5	C_6H_5	11. példa, találmány
E10	n–C_6H_{13}	C_6H_5	C_6H_5	14. példa, találmány
E11	n–C_3H_7	4–Cl–C_6H_4	C_6H_5	56. példa, találmány
E12	CH_2CH_2OH	C_6H_5	C_6H_5	139. példa, találmány
E13	H	C_6H_5	C_6H_5	18. példa, találmány
E14	$C_2H_4OC_2H_5$	C_6H_5	C_6H_5	133. példa, találmány
E15	2–C_4H_9	4–F–C_6H_4	C_6H_5	130. példa, találmány
E16	$CH_2C_6H_5$	C_6H_5	C_6H_5	29. példa, találmány
E17	$CH_2COOC_2H_5$	C_6H_5	C_6H_5	126. példa, találmány
E18	C_2H_5	2,4–F_2–C_6H_3	C_6H_5	147. példa, találmány
E19	C_2H_5	4–F–C_6H_4	2–CH_3–C_6H_5	148. példa, találmány
E20	C_2H_5	3,4–F_2–C_6H_3	C_6H_5	a 47. példa analógiájára, találmány
E21	C_2H_5	C_6H_5	c–C_3H_5	1. ip., találmány
E22	C_2H_5	CH_3	C_6H_5	69. példa, találmány
E23	C_2H_5	$C(CH_3)_3$	C_6H_5	72. példa, találmány
E24	C_2H_5	ciklopentil	C_6H_5	81. példa, találmány
E25	C_2H_5	ciklohexil	C_6H_5	82. példa, találmány

7. táblázat (folytatás)

Antidotum	R	X	Y	Referencia
E26	$n-C_4H_9$	ciklohexil	C_6H_5	85. példa, találmány
E27	$n-C_3H_7$	ciklohexil	C_6H_5	84. példa, találmány
E28	C_2H_5	pirid-3-il	C_6H_5	91. példa, találmány
E29	C_2H_5	tien-2-il	C_6H_5	a 93. példa analógiájára, találmány
E30	$n-C_3H_7$	tien-2-il	C_6H_5	a 93. példa analógiájára, találmány
E31	$C_2H_4-OCH_3$	tien-2-il	C_6H_5	a 93. példa analógiájára, találmány
D5-a	C_2H_5	$2,4-Cl_2-C_6H_3$	H	41. példa, EP-A-509433
D5-b	CH_3	$2,4-Cl_2-C_6H_3$	H	40. példa, EP-A-509433
D5-c	C_2H_5	$4-CH_3-C_6H_5$	H	151. példa, EP-A-509433
D5-c	H	$4-Cl-C_6H_5$	H	27. példa, EP-A-509433
D5-e	H	$4-F-C_6H_5$	H	igénypont szerint, EP-A-509433
D5-f	CH_3	$3-Cl-C_6H_5$	H	137. példa, EP-A-509433
D5-g	CH_3	$2,4-F_2-C_6H_3$	H	124. példa, EP-A-509433
D5-h	CH_3	C_6H_5	H	2. példa, EP-A-509433
D5-i	C_2H_5	$2,4-F_2-C_6H_3$	H	125. példa, EP-A-509433
D5-j	CH_3	$4-Cl-C_6H_4$	H	28. példa, EP-A-509433
D5-k	C_2H_5	$4-Cl-C_6H_4$	H	29. példa, EP-A-509433
D5-l	$2-C_7H_{15}$	C_6H_5	H	igénypont szerint, EP-A-509433
D5-m	$n-C_4H_9$	C_6H_5	H	6. példa, EP-A-509433
D6-n	CH_3	C_6H_5	H	1. példa, EP-A-509433
D5-o	C_2H_5	C_6H_5	H	138. példa, EP-A-509433
D6-a	H	$C_6H_5CH_2$	H	4. példa, WO91/08202
D6-b	C_2H_5	$4-Cl-C_6H_4CH_2$	H	47. példa, WO91/08202
D6-c	C_2H_5	$4-F-C_6H_4CH_2$	H	24. példa, WO91/08202
D6-d	H	$4-Cl-C_6H_4CH_2$	H	49. példa, WO91/08202
D6-e	C_2H_5	$2-Cl-C_6H_4CH_2$	H	70. példa, WO91/08202
D6-f	C_2H_5	$2,4-Cl_2-C_6H_3CH_2$	H	93. példa, WO91/08202
D6-g	CH_3	$C_6H_5CH_2$	H	2. példa, WO91/08202
D6-h	C_2H_5	$C_6H_5CH_2$	H	1. példa, WO91/08202

Tesztfeltételek és eredmények

1. összehasonlító példa: Antidotumteszt kukoricában (Zea mays, ZEAMA)

Kukoricanövényeket neveltünk melegházban homokos agyagtalajon 4 leveles állapotig. Ezután néhány tesztnövényt kezeltünk H-herbiciddel és más tesztnövényeket H herbicidből és a 7. táblázat szerinti egyik antidotumból álló 8. táblázatban megadott mennyiségű tankeleggyel. A herbicidet, illetve a tankelegyet 300 l/ha vízmennyiséggel vittük fel. A kezelés után jó növekedési körülmények között tartottuk melegházban a tesztnövényeket, és a kezelés után 4 héttel vizuálisan értékeltük ki az eredményeket százalékosan az alábbi skála szerint a kontrollnövényekkel összevetve: 0% a kontrollhoz képest semmi károsodás, 100% a növény elhal.

Az eredményeket a 8. táblázat foglalja össze.

8. táblázat

Antidotumhatás kukoricában

Hatóanyag	Dózis	Károsodás (%)
Herbicid/ Antidotum	Hatóanyag kg/ha	ZEAMA
H	0,200	77
	0,100	70
	0,050	63
	0,025	33
H+E1	0,200+0,200	5
	0,100+0,100	0
	0,050+0,050	0
	0,025+0,025	0

8. táblázat (folytatás)

Hatóanyag	Dózis	Károsodás (%)
Herbicid/ Antidotum	Hatóanyag kg/ha	ZEAMA
H+E2	0,200+0,200	40
	0,100+0,100	20
	0,050+0,050	0
	0,025+0,025	0
H+E3	0,200+0,200	27
	0,100+0,100	7
	0,050+0,050	0
	0,025+0,025	0
H+E4	0,200+0,200	20
	0,100+0,100	0
	0,050+0,050	0
	0,025+0,025	0
H+E5	0,200+0,200	20
	0,100+0,100	0
	0,050+0,050	0
	0,025+0,025	0
H+E6	0,200+0,200	5
	0,100+0,100	0
	0,050+0,050	0
	0,025+0,025	0
H+E7	0,200+0,200	15
	0,100+0,100	0
	0,050+0,050	0
	0,025+0,025	0
H+E8	0,200+0,200	20
	0,100+0,100	5
	0,050+0,050	0
	0,025+0,025	0
H+E9	0,200+0,200	10
	0,100+0,100	5
	0,050+0,050	0
	0,025+0,025	0
H+E10	0,200+0,200	25
	0,100+0,100	10
	0,050+0,050	0
	0,025+0,025	0
H+E11	0,200+0,200	25
	0,100+0,100	15
	0,050+0,050	0
	0,025+0,025	0
H+E12	0,200+0,200	30
	0,100+0,100	10
	0,050+0,050	0
	0,025+0,025	0
H+E13	0,200+0,200	15
	0,100+0,100	5
	0,050+0,050	0
	0,025+0,025	0
H+E14	0,200+0,200	30
	0,100+0,100	15
	0,050+0,050	0
	0,025+0,025	0
H+E15	0,200+0,200	10
	0,100+0,100	5
	0,050+0,050	0
	0,025+0,025	0
H+E16	0,200+0,200	40
	0,100+0,100	15
	0,050+0,050	0
	0,025+0,025	0
H+E17	0,200+0,200	30
	0,100+0,100	10
	0,050+0,050	0
	0,025+0,025	0
H+D5-a	0,200+0,200	80
	0,100+0,100	70
	0,050+0,050	60
	0,025+0,025	35
H+D5-b	0,200+0,200	85
	0,100+0,100	75
	0,050+0,050	60
	0,025+0,025	40
H+D5-e	0,200+0,200	80
	0,100+0,100	75
	0,050+0,050	60
	0,025+0,025	30
H+D5-d	0,200+0,200	75
	0,100+0,100	70
	0,050+0,050	60
	0,025+0,025	35
H+D5-e	0,200+0,200	80
	0,100+0,100	70
	0,050+0,050	63
	0,025+0,025	30

2. összehasonlító példa: Antidotumteszt kukoricában (Zea mays, ZEAMA) (2. teszt)

Kukoricanövényeket neveltünk melegházban homokos agyagtalajon 3 leveles állapotig. Ezután a tesztnövényeket az 1. példa analógiájára kezeltük és értékeltük.

A felhasználási mennyiségeket és az eredményeket a 9. táblázatban foglaljuk össze:

9. táblázat
Antidotumhatás kukoricában

Herbicid/ Antidotum	Dózis (hatóanyag kg/ha)	Károsodás (%) kukoricában (ZEAMA)
H	0,1	80
H+E1	0,1+1,25	15
H+E2	0,1+1,25	30
H+E6	0,1+1,25	15
H+E18	0,1+1,25	20
H+E19	0,1+1,25	25
H+E20	0,1+1,25	20
H+E21	0,1+1,25	20
H+D5-b	0,1+1,25	65
H+D5-f	0,1+1,25	70
H+D5-g	0,1+1,25	70
H+D5-h	0,1+1,25	55
H+D5-n	0,1+1,25	50
H+D5-o	0,1+1,25	70
H+D6-f	0,1+1,25	60
H+D6-g	0,1+1,25	60
H+D6-h	0,1+1,25	60

Rövidítések az 8. és 9. táblázatban:
H=3-(4,6-dimetoxi-pirimidin-2-il)-1-/3-(N-metil-szulfonil-N-metil-amino)-piridin-2-il-szulfonil)-karbamid
Antidotum száma=l. 7. táblázat
Hatóanyag=10% hatóanyagra vonatkoztatva

3. összehasonlító példa: Antidotumhatás rizsben (Oryza sativa, RYSA)

Rizsnövényeket vízzel fedett földben (a föld felett 2 cm-re) neveltünk melegházban homokos agyagtalajon 3 leveles állapotig. Ezután néhány tesztnövényt kezeltünk H'-herbiciddel és más tesztnövényeket H' herbicidből és a 7. táblázat szerinti egyik antidotumból álló 10. táblázatban megadott mennyiségű tankeleggyel. A herbicidet, illetve a tankelegyet 300 l/ha vízmennyiséggel vittük fel. A kezelés után jó növekedési körülmények között tartottuk melegházban a tesztnövényeket, és a kezelés után 4 héttel vizuálisan értékeltük ki az eredményeket százalékosan az alábbi skála szerint a kontrollnövényekkel összevetve: 0% a kontrollhoz képest semmi károsodás, 100% a növény elhal.

Az eredményeket a 10. táblázat foglalja össze.

10. táblázat
Antidotumhatás rizsben

Herbicid/ Antidotum	Dózis (hatóanyag kg/ha)	Károsodás (%) rizsben (ORYSA)
H'	0,3	80
H'+E1	0,3+1,25	20
H'+E2	0,3+1,25	20
H'+E6	0,3+1,25	25
H'+E18	0,3+1,25	20
H'+E19	0,3+1,25	30
H'+E20	0,3+1,25	30
H'+E21	0,3+1,25	20
H'+E22	0,3+1,25	25
H'+E23	0,3+1,25	20
H'+E24	0,3+1,25	20
H'+D5-a	0,3+1,25	80
H'+D5-b	0,3+1,25	75
H'+D5-c	0,3+1,25	80
H'+D5-d	0,3+1,25	85
H'+D5-e	0,3+1,25	80
H'+D5-f	0,3+1,25	85
H'+D5-g	0,3+1,25	80
H'+D5-h	0,3+1,25	70
H'+D5-i	0,3+1,25	85
H'+D5-j	0,3+1,25	75
H'+D5-k	0,3+1,25	80
H'+D5-l	0,3+1,25	70
H'+D5-m	0,3+1,25	75
H'+D5-n	0,3+1,25	75
H'+D5-o	0,3+1,25	75
H'+D6-a	0,3+1,25	80
H'+D6-b	0,3+1,25	65
H'+D6-c	0,3+1,25	80
H'+D6-d	0,3+1,25	75
H'+D6-e	0,3+1,25	70
H'+D6-f	0,3+1,25	85
H'+D6-g	0,3+1,25	85
H'+D6-h	0,3+1,25	80

Rövidítések a 3. táblázatban: H'=fenoxaprop-etil

4. összehasonlító példa: Antidotumhatás árpában (=Hordeum vulgare=HOVU)

Árpanövényeket neveltünk melegházban homokos agyagtalajon 3–4 leveles állapotig. Ezután néhány tesztnövényt kezeltünk H'-herbiciddel=(fenoxaprop-etil) és más tesztnövényeket H' herbicidből és a 7. táblázat szerinti egyik antidotumból álló, 11. táblázatban megadott mennyiségű tankeleggyel a tiszta hatóanyagra vonatkoztatva.

A felhasználási mennyiségeket és az eredményeket a 11. táblázat foglalja össze.

11. táblázat
Antidotumhatás árpában

Herbicid/ Antidotum	Dózis (hatóanyag kg/ha)	Károsodás (%) árpában (HOVU)
H'	0,2	80%
H'+E22	0,2+1,25	20–30%
H'+E23	0,2+1,25	20–30%
H'+E24	0,2+1,25	20–30%
H'+E25	0,2+1,25	10–20%
H'+E26	0,2+1,25	10–20%
H'+E27	0,2+1,25	10–20%
H'+E28	0,2+1,25	10–20%
H'+E29	0,2+1,25	10–20%
H'+E30	0,2+1,25	20–30%
H'+E31	0,2+1,25	10–20%

Rövidítések a 11. táblázatban: H' = fenoxaprop-etil

5. összehasonlító példa: Antidotumteszt kukoricában (Zea mays, ZEAMA)

Kukoricanövényeket neveltünk melegházban homokos agyagtalajon 4 leveles állapotig. Ezután néhány tesztnövényt kezeltünk H-herbiciddel, azaz 3-(4,6-dimetoxi-pirimidin-2-il)-1-/3-(N-metil-szulfonil-N-metil-amino)-piridin-2-il-szulfonil/-karbamid szulfonil-karbamid típusú herbiciddel és más tesztnövényeket H herbicidből és a 7. táblázat szerinti egyik antidotumból 12. táblázatban megadott mennyiségű tankeleggyel az 1. példa analógiájára.

Az eredményeket a 12. táblázat foglalja össze.

12. táblázat
Antidotumhatás kukoricában

Herbicid/ Antidotum	Dózis (hatóanyag kg/ha)	Károsodás (%) kukoricában (ZEAMA)
H	0,08	80%
H+E22	0,08+1,25	20–30%
H+E23	0,08+1,25	30–40%
H+E25	0,08+1,25	30–40%
H+E27	0,08+1,25	30–40%
H+E28	0,08+1,25	10–20%
H+E29	0,08+1,25	30–40%
H+E30	0,08+1,25	30–40%
H+E31	0,08+1,25	30–40%

SZABADALMI IGÉNYPONTOK

1. (I) általános képletű vegyületek vagy sói, ahol

R^1 jelentése –CO–OR, –CS–OR, $-CONH_2$, $-CONHCH_3$, $-CON(CH_3)_2$ vagy –CONH-fenil képletű karboxilszármazék-csoport, ahol az utóbbi a fenilrészben szubsztituálatlan vagy halogénatommal szubsztituált;

R jelentése hidrogénatom, kation, 1–8 szénatomos alkil-, 3–6 szénatomos cikloalkil-, 2–6 szénatomos alkenil-, 2–6 szénatomos alkinil- vagy fenilcsoport, ahol az utolsó öt említett csoport adott esetben egy vagy több alábbi csoporttal van szubsztituálva: halogénatommal, hidroxil-, 1–4 szénatomos alkilcsoporttal, utóbbi csak ciklusos csoportok esetén, 1–4 szénatomos alkoxi-, 1–4 szénatomos alkil-tio- és (1–4 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoporttal vagy adott esetben egy vagy több halogénatommal szubsztituált benzilcsoport vagy tetrahidrofurfurilcsoport;

R^2 jelentése hidrogénatom, 1–6 szénatomos alkil- vagy 2–6 szénatomos alkenilcsoport;

R^3 jelentése 1–4 szénatomos alkil-, 3–8 szénatomos cikloalkil- vagy fenilcsoport, amely adott esetben egy vagy több halogénatommal, 1–6 szénatomos alkil-, 1–6 szénatomos halogén-alkil-, 1–6 szénatomos alkoxi-, mono- vagy di(1–4 szénatomos alkil)-amino- vagy (1–4 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoporttal szubsztituált;

R^4 jelentése adott esetben egy vagy több halogénatommal, 1–6 szénatomos alkil-, 1–6 szénatomos halogén-alkil-, 1–6 szénatomos alkoxi-, mono- vagy di(1–4 szénatomos alkil)-amino- vagy (1–4 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoporttal szubsztituált fenilcsoport vagy piridil- vagy tienilcsoport.

2. Az 1. igénypont szerinti vegyületek, ahol

R^1 jelentése –CO–OR általános képletű karboxilszármazék-csoport;

R jelentése hidrogénatom, kation, 1–4 szénatomos alkil-, 2–4 szénatomos alkenil-, 2–4 szénatomos alkinil-, 1–4 szénatomos halogén-alkil-, hidroxi-(1–4 szénatomos alkil)-, (1–4 szénatomos alkoxi)-(1–4 szénatomos alkil)-, (1–4 szénatomos alkil-tio)-(1–4 szénatomos alkil)-csoport vagy adott esetben egy vagy több halogénatommal, hidroxil-, 1–4 szénatomos alkil-, 1–4 szénatomos alkoxi-, 1–4 szénatomos alkil-tio- vagy (1–4 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoporttal szubsztituált fenilcsoport, vagy adott esetben egy vagy több halogénatommal szubsztituált benzilcsoport, vagy tetrahidrofurfurilcsoport;

R^2 jelentése hidrogénatom;

R^3 jelentése adott esetben egy vagy több halogénatommal, 1–4 szénatomos alkil-, 1–4 szénatomos halogén-alkil-, 1–4 szénatomos alkoxi-, di(1–4 szénatomos alkil)-amino- vagy (1–4 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoporttal szubsztituált fenilcsoport;

R^4 jelentése adott esetben egy vagy több halogénatommal, 1–4 szénatomos alkil-, 1–4 szénatomos halogén-alkil- vagy 1–4 szénatomos alkoxicsoporttal szubsztituált fenilcsoport.

3. Az 1. igénypont szerinti vegyületek, ahol
R^1 jelentése –CO–OR képletű csoport;
R jelentése hidrogénatom, kation, 1–4 szénatomos alkil-, 1–4 szénatomos halogén-alkil-, hidroxi-(1–4 szénatomos alkil)-, (1–4 szénatomos alkoxi)-(1–4 szénatomos alkil)-, (1–4 szénatomos alkiltio)-(1–4 szénatomos alkil)- vagy adott esetben halogénatommal szubsztituált fenilcsoport;
R^2 jelentése hidrogénatom;
R^3 jelentése adott esetben egy vagy több halogénatommal, 1–4 szénatomos alkil-, 1–4 szénatomos halogén-alkil-, 1–4 szénatomos alkoxi- vagy (1–4 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoporttal szubsztituált fenilcsoport;
R^4 jelentése adott esetben egy vagy több halogénatommal, 1–4 szénatomos alkil-, 1–4 szénatomos halogén-alkil- vagy 1–4 szénatomos alkoxicsoporttal szubsztituált fenilcsoport.

4. Az 1. igénypont szerinti vegyületek, ahol
R^1 jelentése –CO–OR képletű csoport;
R jelentése hidrogénatom, kation vagy 1–4 szénatomos alkilcsoport;
R^2 jelentése hidrogénatom;
R^3 jelentése fenilcsoport;
R^4 jelentése fenilcsoport.

5. A 4. igénypont szerinti vegyület, ahol R jelentése metil-, etil-, n-propil- vagy izopropilcsoport.

6. Eljárás az 1. igénypont szerinti (I) általános képletű vegyületek vagy sói előállítására, *azzal jellemezve,* hogy egy (II) általános képletű vegyületet, ahol R^2, R^3 és R^4 jelentése a fenti, (III) általános képletű nitril-oxiddal, ahol R^1 jelentése a fenti, reagáltatunk.

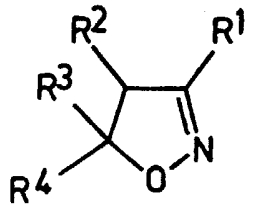
7. Haszonnövényt védő készítmény, amely egy 1–5. igénypontok bármelyike szerinti (I) általános képletű vegyületet vagy mezőgazdaságilag alkalmazható sóját tartalmazza haszonnövényt herbicid hatóanyagok fitotoxikus mellékhatásaitól védő komponensként a szokásos formálási segédanyagok mellett.

8. Haszonnövényt védő készítmény, amely egy 1–5. igénypontok bármelyike szerinti (I) általános képletű vegyületet vagy mezőgazdaságilag alkalmazható sóját tartalmazza haszonnövényt védő komponensként egy vagy több peszticiddel és formálási segédanyagokkal együtt.

9. A 8. igénypont szerinti peszticid készítmény, ahol a peszticid egy herbicid.

10. Eljárás kultúrnövények megvédésére herbicid hatóanyagok fitotoxikus mellékhatásaitól, *azzal jellemezve,* hogy legalább egy, az 1–5. igénypontok bármelyike szerinti (I) általános képletű vegyületet vagy mezőgazdaságilag alkalmazható sóját tartalmazó készítményt alkalmazunk hatékony mennyiségben safenerként a herbicid után, előtt vagy azzal egyidejűleg a növényekre, a növények magvaira vagy a termőfelületre.

11. Az 1–5. igénypontok bármelyike szerinti (I) általános képletű vegyületek vagy mezőgazdaságilag alkalmazható sói alkalmazása safenerként kultúrnövények herbicid hatóanyagok fitotoxikus mellékhatásaitól való megvédésére.



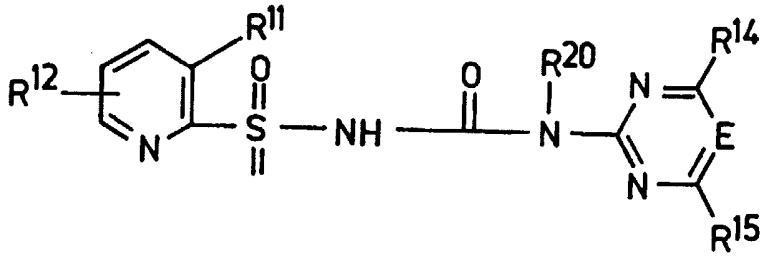
(I)

$R^3R^4C = CHR^2$

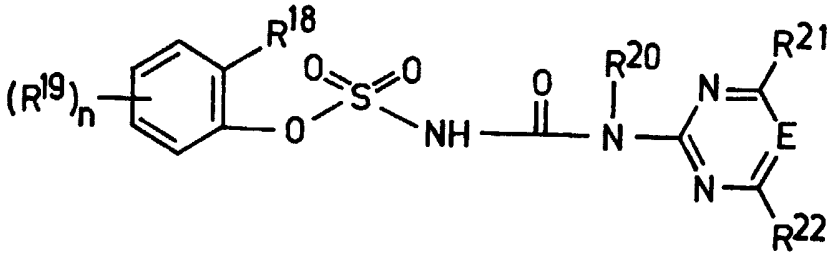
(II)

$(-)_O - N = (+)_C - R^1$

(III)



(A)



(B)

Kiadja a Magyar Szabadalmi Hivatal, Budapest
A kiadásért felel: Törőcsik Zsuzsanna főosztályvezető-helyettes
Windor Bt., Budapest