

ORSZÁGOS
TALÁL MÁNYI
HIVATALSZABADALMI
LEÍRÁS

B

(11) 194 546

A bejelentés napja: (22) 85. 04. 11.

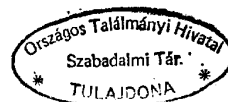
(21) (1347/85)

A bejelentés elsőbbsége:

(33)
DE(32)
84. 04. 12.(31)
(P 34 13 755.6)

A közzététel napja: (41) (42) 86. 02. 28.

Megjelent: (45) 88. 08. 22.

Nemzetközi
osztályjelzet:
(51) NSZO₄C 07 D 277/48;
A 01 N 47/36

Feltaláló(k): (72)

dr. Lange Arno, dr. Parg Adolf, Bad Duerkheim, dr. Wuerzer
Bruno, Otterstadt, DE

Szabadalmaz: (73)

BASF AG., Ludwigshafen am Rhein, DE

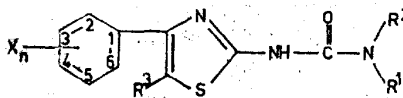
(54)

HATÓANYAGKÉNT TIAZOLIL-KARBAMID-SZÁRMAZÉKOKAT TARTALMAZÓ GYOMIRTÓSZER
ÉS ELJÁRÁS TIAZOLIL-KARBAMID-SZÁRMAZÉKOK ELŐÁLLÍTÁSÁRA

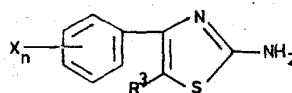
(57) KIVONAT

A találmány az (I) általános képletű tiazolil-karbamid-származékokat 0,1–95 tömeg% mennyiségben tartalmazó gyomirtószerekre, valamint az (I) általános képletű vegyületek előállítására vonatkozik. A képletben

- R¹ hidrogénatomot vagy 1–4 szénatomos alkil-csoportot jelent,
 R² 1–4 szénatomos alkil- vagy 1–4 szénatomos alkoxycsoportot jelent,
 R³ hidrogénatomot vagy 1–4 szénatomos alkilcsoportot jelent,
 X hidrogén-, halogénatomot, 1–4. szénatomos alkoxi-, 1–4 szénatomos halogén-alkoxi-, 1–4 szénatomos alkil-, 1–4 szénatomos halogén-alkil-, 3–6 szénatomos cikloalkil-, 1–4 szénatomos alkil-tiocsoportot, nitro-, benzil-oxycsoportot vagy adott esetben halogénatommal és/vagy halogén-metilcsoporttal szubsztituált fenoxycsoportot jelent, és
 n értéke 1 vagy 2 lehet.



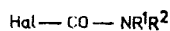
(I)



(II)



(III)



(IV)

A találmány tárgya eljárás új tiazolil-karbamid-származékok előállítására, valamint az ezeket a vegyületeket hatóanyagként tartalmazó gyomirtószerkészítmények.

Ismert, hogy azok a tiazolil-karbamid-származékok, amelyeknek a heteroatomos gyűrű 4-es helyzetében, adott esetben egy vagy több halogénatommal, egy vagy több alkil-, alkoxi-, halogén-alkil- vagy halogén-alkoxi-csoporttal szubsztituált arilcsoportja van, gyomirtó hatásúak. Ezeknek a vegyületeknek néhány képviselőjeként azonban csak a 4-(4-klór-fenil)-, illetve a 4-(4-metoxi-fenil)-tiazol-2-ilcsoportot tartalmazó karbamid-származékok az ismertek. Ezek a vegyületek különböző gyomnövények, így például füvek, bokrok és nemkívánt bozótok megsemmisítésére vagy növekedésük gátlására használhatók. (lásd 1 131 207 számú nagy-britanniai szabadalmi leírást).

Azt találtuk, hogy azoknak a gyomirtószerkészítményeknek, amelyek hatóanyagként az új tiazolil-karbamid-származékokat tartalmazzák, egy sor széles levelű és fűféle növényvel szemben lényegesen erősebb gyomirtó hatása van, mint a technika jelenlegi állása szerint ismert hatóanyagoknak, és ugyanakkor egy sor haszonnövényvel szemben szelektív hatásúak, és ezek a haszonnövények jól tűrik.

Az új tiazolil-karbamid-származékok (I) általános képletük, a képletben

- R^1 hidrogénatomot vagy 1–4 szénatomos alkilcsoportot jelent,
 R^2 1–4 szénatomos alkil- vagy 1–4 szénatomos alkoxicsoprotot,
 R^3 hidrogénatomot vagy 1–4 szénatomos alkilcsoportot jelent,
 X hidrogén-, halogénatomot, 1–4 szénatomos alkoxi-, 1–4 szénatomos halogén-alkoxi-, 1–4 szénatomos alkil-, 1–4 szénatomos halogén-alkil-, 3–6 szénatomos cikloalkil-, 1–4 szénatomos alkil-tiocsoportot, nitro-, benzil-oxicsoprotot, vagy adott esetben halogénatommal és/vagy halogén-metilcsoporttal szubsztituált fenoxicsoprotot jelent, és
 n értéke 1 vagy 2 lehet,

azzal a megszorítással, hogy ha R^1 jelentése metilcsoport, R^3 jelentése hidrogénatom, úgy X nem jelenthet hidrogénatomot, klóratomot vagy metoxicsoprotot a 4-es helyzetben vagy klóratomot a 3-as és 4-es helyzetben.

Az (I) általános képletben R^1 jelentése hidrogénatom vagy 1–4 szénatomos alkilcsoport, így metil-, etil-, n-propil-, izobutylcsoport, előnyösen a metil- vagy az etilcsoport. Az (I) általános képletben R^2 jelentése 1–4 szénatomos alkil- vagy 1–4 szénatomos alkoxicsoprot, például metil-, etil-, n-propil-, izopropil-, tercbutil-, metoxi-, etoxicsoprot, előnyösen a metil- és a metoxicsoprot.

Az (I) általános képletben X jelentése hidrogén-, halogénatom, 1–4 szénatomos alkoxicsoprot, 1–4 szénatomos halogén-alkoxicsoprot, amely csoportban a halogénatom főleg fluor- és/vagy klóratom, 1–4 szénatomos alkilcsoport, 1–4 szénatomos halogén-alkilcsoport, amely csoportban a halogénatom főleg fluor- és/vagy klóratom, 3–6 szénatomos cikloalkilcsoport, 1–4 szénatomos alkil-tiocsoport, nitro-, benzil-oxicsoprot, vagy adott esetben halogénatommal, így klóratommal és/vagy halogén-metilcsoporttal, így trifluor-metilcsoporttal

szubsztituált fenoxicsoprot, például fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, előnyösen fluor-, klór- vagy brómatom, metoxi-, etoxi-, difluor-metoxi-, 3,3,3,2,1,1-hexafluor-n-propoxi-, 2,1,1-trifluor-2-klór-etoxi-, metil-, etil-, tercbutil-, trifluor-metil-, ciklohexil-, metil-tio-, etil-tio-, nitro-, benzil-oxi-, 2-klór-4-trifluor-metil-fenoxi-, fenoxi-, 4-klór-fenoxicsoprot.

Előnyösek azok az (I) általános képletű tiazolil-karbamid-származékok, amelyek képletében R^1 1–4 szénatomos alkilcsoportot, főleg metilcsoportot jelent, és R^2 1–4 szénatomos alkilcsoportot, főleg metilcsoportot, vagy 1–4 szénatomos alkoxicsoprotot, főleg metoxicsoprotot jelent. Továbbá előnyösek azok az (I) általános képletű tiazolil-karbamid-származékok, amelyek képletében X 1–6 szénatomos halogén-alkoxicsoprotot, főleg fluor- és/vagy klóratommal szubsztituált alkoxicsoprotot, vagy halogénatomot, főleg fluor-, klór- vagy brómatomot jelent.

Az (I) általános képletű tiazolil-karbamid-származékokat úgy kapjuk meg, hogy (II) általános képletű – a képletben R^3 , X jelentése és n értéke a fenti – szubsztituált amint

a) foszgénnel, oxalil-kloriddal vagy difoszgénnel, majd (III) általános képletű – a képletben R^1 és R^2 jelentése a fenti – aminnal, vagy

b) (IV) általános képletű karbaminsav-halogeniddel reagáltatunk, a képletben R^1 és R^2 jelentése a fenti és Hal halogénatomot jelent.

Olyan (I) általános képletű tiazolil-karbamid-származékokat, amelyek képletében R^2 1–4 szénatomos alkilcsoportot jelent, és az R^3 , X jelentése és az n értéke a fenti, a (II) általános képletű szubsztituált aminnak (V) általános képletű izocianáttal – a képletben R^2 1–4 szénatomos alkilcsoportot jelent – való reakciójával is nyerhetünk.

A fenti reakciókat előnyösen a megfelelő oldó- vagy hígítószer jelenlétében hajtjuk végre. Erre a célra gyakorlatilag minden közömbös szerves oldószer alkalmas.

Ide tartoznak főleg az aromás és alifás szénhidrogének, így a ligroin, benzin, toluol, pentán, hexán, ciklohexán, petroléter, a halogénezett aromás és alifás szénhidrogének, így a diklór-metán, kloroform, széntetrazol, 1,1- és 1,2-diklór-etán, 1,1,1- és 1,1,2-triklór-etán, klór-benzol, o-, m-, p-diklór-benzol, o-, m-, p-klór-toluol, a nitrált aromás és alifás szénhidrogének, így a nitro-benzol, nitro-etán, o-, m-, p-nitro-toluol, a nitrilek, így az acetónitril, butíronitril, izobutíronitril, az éterek, így a dietil-éter, di-n-propil-éter, tetrahydro-furán, dioxán, az észterek, így az acetecetészter, etil-acetát, izobutyl-acetát, továbbá a ketonok, így az aceton, metil-etilketon, metil-izopropilketon, metil-izobutylketon, valamint az amidok, így a metil-formamid és a dimetil-formamid. Ezeknek az oldószereknek az elegyeit is használhatjuk.

A (II) általános képletű aminnak (III) általános képletű aminnal való reakciója úgy megy jól végbe, hogy a (II) általános képletű szubsztituált amint foszgén, difoszgén vagy oxalil-klorid feleslegével először a megfelelő izocianáttá alakítjuk át (Houben-Weyl: Methoden der org. Chemie, Bd 8., 122–123. oldal, 1952; Methodicum Chemicum, Bd 6, 780. oldal, 1974) és ezt legalább ekvivalensnyi mennyiségű (III) általános képletű aminnal reagáltatjuk, adott esetben oldószer jelenlétében, -10°C -

tól +150 °C-ig, előnyösen +20 °C-tól +120 °C-ig terjedő hőmérsékleten, szakaszosan vagy folyamatosan.

A (II) általános képletű szubsztituált aminnak karbamidsav-halogeniddel való reakciójánál, a (IV) általános képletű karbamidsav-halogenidet 50 mól- vagy tömegszázalékig terjedő feleslegben alkalmazzuk, adott esetben oldószer és adott esetben savmegkötőszert jelenlétében, -10 °C-tól +150 °C-ig, előnyösen +20 °C-tól +120 °C-ig terjedő hőmérsékleten, folyamatosan vagy szakaszosan (Houben-Weyl: Methoden der org. Chemie, Bd 8., 160–161. oldal, 1951).

Savmegkötőszereknek minden szokásos savmegkötőszert használhatunk, előnyösen alkálifém-hidroxidokat, -karbonátokat, -alkoholátokat és tercier szerves bázisokat. Különösen előnyösek például a nátrium-hidroxid, nátrium-hidrogén-karbonát, nátrium-metilát, trietil-amin, piridin, trimetil-amin, α -, β -pikolin, lutidin, N,N-dimetil-anilin, N,N-dimetil-ciklohexil-amin, kinolin, tri-n-propil-amin, tri-n-butil-amin, akridin, N,N-dimetil- és N,N-di-etil-piperazin, N-metil- és N-etil-piperidin, valamint az N-metil- és N-etil-pirrolidin.

Az aminnak az izocianáttal való reakcióján alapuló eljárásnál a (II) általános képletű szubsztituált amin az (V) általános képletű izocianátnak 50 mól- vagy tömegszázalékig terjedő feleslegével, -10 °C-tól +150 °C-ig, előnyösen 20 °C-tól 120 °C-ig terjedő hőmérsékleten, adott esetben oldószer jelenlétében, folyamatosan vagy szakaszosan reagáltatjuk (Houben-Weyl, Methoden der org. Chemie Bd. 8, 157–159. old., 1952).

A végtermék elkülönítése mindegyik eljárásnál vagy a reakcióelegyből kivált anyagok leszívásával, majd az ezt követő átkristályosítás, illetve kromatográfiás tisztításával vagy a reakcióelegynek vákuumban való szárazra párlásával, és a bepárlási maradéknak átkristályosítás, illetve kromatográfiás tisztításával történik.

A kiindulási vegyületekként használt (II) általános képletű szubsztituált aminok részben új vegyületek. Ezeket azonban ismert eljárásokkal állíthatjuk elő [J. Am. Chem. Soc. 67, 2242 (1945)].

A következő példák az (I) általános képletű tiazolil-karbamidok előállítását szemléltetik:

1. példa

N-Metil-N'-[4-(4-metoxi-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid

30 g 4-Metoxi-acetofenonhoz 33,5 g tiokarbamidot, majd 56 g jódot adunk, és a reakcióelegyet 5 óra hosszat 100 °C-on tartjuk. A reakcióelegyet vízre öntjük, elporítjuk, éterrel többször, majd ammóniaoldattal és vízzel mossuk és szárítjuk. Így 37,8 g 4-(4-metoxi-fenil)-2-amino-tiazolt kapunk. Olvadáspontja: 194–205 °C.

Ezután 6,2 g 4-(4-metoxi-fenil)-2-amino-tiazolt, 80 ml toluolt és 2 csepp dibutil-ón-diacetátot elegyítünk. 50 °C-on lassan a reakcióelegyhez csepegtetünk 2,9 g metil-izocianátot, és a reakcióelegyet összesen 12 óra hosszat 50 °C-on tartjuk. A szilárd anyagot leszívjuk, toluollal mossuk és szárítjuk. Így 5,5 g cím szerinti vegyületet kapunk. Olvadáspontja: 200–208 °C.

Az anyalúgból további 2,5 g cím szerinti vegyületet nyerhetünk ki (73. sz. vegyület).

2. példa

N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(4-metoxi-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid

10 g 4-(4-Metoxi-fenil)-2-amino-tiazolt, 100 ml acetont és 7 g N-metil-piperidint elegyítünk. A reakcióelegyet 3 óra alatt, 30 °C-on becsepegtetünk 6,9 g metoxi-metil-karbamoil-kloridot, és a reakcióelegyet 4 óra hosszat 30 °C-on tartjuk. A szilárd anyagot leszívjuk és szárítjuk. Így 12,9 g cím szerinti vegyületet kapunk. Olvadáspontja: 125–128 °C, ami hígított acetonnal való mosás után 133–134 °C-ra emelkedik. (10. számú vegyület).

3. példa

N,N-Dimetil-N'-[4-(4-metil-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid

26,8 g 4-Metil-acetofenon és 33,5 g tiokarbamid elegyéhez egyszerre hozzáadunk 56 g jódot. A reakcióelegyet 3 óra hosszat 100 °C-on tartjuk, és melegen 500 ml jeges vízbe öntjük. A szilárd terméket leszívjuk, éterrel, hígított ammóniaoldattal és vízzel jól ki-mossuk, és megszáritjuk. Így 32,2 g 4-(4-metil-fenil)-2-amino-tiazolt kapunk. Olvadáspontja: 131–135 °C.

11,6 g 4-(4-Metil-fenil)-2-amino-tiazolhoz 100 ml klórbenzolban 23 g oxalil-kloridot adunk, és az elegyet viszfafolyatósító hűtő alatt lassan forrásig melegítjük, és a gázfejlődés befejeződéséig forraljuk. Az oldatot hidegen 60 ml dimetil-amin oldatba csepegtetjük, és az elegyet 2 óra hosszat keverjük. A csapadékot leszívjuk, vízzel és petroléterrel mossuk és szárítjuk. Így 7,2 g cím szerinti vegyületet kapunk. Olvadáspontja: 145–151 °C (51. számú vegyület).

4. példa

N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(4-metil-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid

5,7 g 4-(4-Metil-fenil)-2-amino-tiazol, 50 ml toluol és 7 ml piridin elegyében becsepegtetünk 4 g N-metil-N-metoxi-karbamoil-kloridot, és a reakcióelegyet 8 óra hosszat 50 °C-on tartjuk. A csapadékot leszívjuk és eldobjuk. Az anyalúgot vízzel, hígított sósavval és újból vízzel kirázzuk, szárítjuk és bepároljuk. Így 4,3 g cím szerinti vegyületet kapunk.

Törésmutatója: $n_D^{25} = 1,6072$ (12. számú vegyület).

Analóg módon nyerjük a következő (I) általános képletű tiazolil-karbamid-származékokat:

1. N-Metil-N'-[4-(4-trifluor-metil-fenil)-tiazolil-2-il]-karbamid

Olvadáspontja: 254–258 °C.

2. N-Metil-N'-[4-[4-(4-trifluor-metil-2-klór-fenoxi)-fenil]-tiazol-2-il]-karbamid

Olvadáspontja: 200–206 °C

3. N-Metil-N'-(4-fenil-5-metil-tiazol-2-il)-karbamid
Olvadáspontja: 256–260 °C
4. N,N-Dimetil-N'-[4-(4-metoxi-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
Olvadáspontja: 95–104 °C
5. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(4-trifluor-metil-2-klór-fenoxi)-fenil]-tiazol-2-il]-karbamid
Viszkózus olaj.
¹H-NMR spektruma: 3,2 ppm (3 prot.) 3,75 ppm (3 prot.) 7 ppm (1 prot., dubl.) 7,1 ppm (2 prot., dubl.) 7,5 ppm (1 prot., dubl.) 7,75 ppm (1 prot., sing.) 7,85 ppm (2 prot., dubl.) 9,25 ppm (1 prot., széles).
6. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(4-nitro-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
Olvadáspontja: 190–195 °C.
7. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(4-trifluor-metil-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
Olvadáspontja: 145–148 °C.
8. N-Metil-N'-[4-(4-metil-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
Olvadáspontja: 175–180 °C.
9. N-Metil-N-[but(1)in-3-il]-N'-[4-(4-metoxi-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
10. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(4-metoxi-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
Olvadáspontja: 128–132 °C.
11. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-fenil-5-metil-tiazol-2-il]-karbamid
Törésmutatója: $n_D^{25} = 1,6094$
12. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(4-metil-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
Törésmutatója: $n_D^{25} = 1,6072$
13. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(4-klór-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
Olvadáspontja: 119–121 °C.
14. N,N-Dimetil-N'-[4-(4-klór-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
Olvadáspontja: 139–142 °C.
15. N-Metil-N'-[4-(3-klór-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
16. N,N-Dimetil-N'-[4-(3,4-diklór-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
17. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(3,4-diklór-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
Olvadáspontja: 105–108 °C.
18. N-Metil-N'-[4-(4-fluor-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
19. N,N-Dimetil-N'-[4-(4-fluor-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
20. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(4-fluor-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
Olvadáspontja: 123–125 °C.
21. N-Metil-N'-[4-(3-bróm-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
Olvadáspontja: 258–261 °C.
22. N,N-Dimetil-N'-[4-(3-bróm-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
Olvadáspontja: 137–141 °C.
23. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(3-bróm-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
IR spektruma: $\nu_{CO} = 1685 \text{ cm}^{-1}$.
24. N-Metil-N'-[4-fenil-5-metil-tiazol-2-il]-karbamid

25. N,N-Dimetil-N'-[4-fenil-tiazol-2-il]-karbamid
Olvadáspontja: 50–74 °C.
26. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-fenil-tiazol-2-il]-karbamid
IR spektruma: $\nu_{CO} = 1685 \text{ cm}^{-1}$.
27. N-Metil-N'-[4-(3-metoxi-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
28. N,N-Dimetil-N'-[4-(3-metoxi-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
29. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(3-metoxi-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
IR spektruma: $\nu_{CO} = 1691 \text{ cm}^{-1}$.
30. N-Metil-N'-[4-(4-etoxi-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
31. N,N-Dimetil-N'-[4-(4-etoxi-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
32. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(4-etoxi-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
Olvadáspontja: 153–156 °C.
33. N-Metil-N'-[4-(4-metoxi-fenil)-5-metil-tiazol-2-il]-karbamid
34. N,N-Dimetil-N'-[4-(4-metoxi-fenil)-5-metil-tiazol-2-il]-karbamid
35. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(4-metoxi-fenil)-5-metil-tiazol-2-il]-karbamid
Törésmutatója: $n_D^{25} = 1,6008$
36. N-Metil-N'-[4-(4-fenoxi-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
37. N,N-Dimetil-N'-[4-(4-fenoxi-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
38. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(4-fenoxi-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
Törésmutatója: $n_D^{25} = 1,4934$
39. N-Metil-N'-[4-(4-benzil-oxi-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
Olvadáspontja: 145–151 °C.
40. N,N-Dimetil-N'-[4-(4-benzil-oxi-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
41. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(4-benzil-oxi-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
Olvadáspontja: 165–170 °C.
42. N-Metil-N'-[4-(2-klór-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
43. N,N-Dimetil-N'-[4-(2-klór-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
44. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(2-klór-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
Törésmutatója: $n_D^{25} = 1,5988$
45. N-Metil-N'-[4-(4-difluor-metoxi-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
46. N,N-Dimetil-N'-[4-(4-difluor-metoxi-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
47. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(4-difluor-metoxi-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
Olvadáspontja: 84–88 °C.
48. N-Metil-N'-[4-(4-klór-fenoxi)-fenil]-tiazol-2-il]-karbamid
49. N,N-Dimetil-N'-[4-(4-klór-fenoxi)-fenil]-tiazol-2-il]-karbamid
50. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(4-klór-fenoxi)-fenil]-tiazol-2-il]-karbamid

51. N,N-Dimetil-N'-[4-(4-metil-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
52. N-Metil-N'-[4-(4-metil-tio-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
53. N,N-Dimetil-N'-[4-(4-metil-tio-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid 5
54. N,N-Dimetil-N'-[4-(4-metil-tio-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
- Olvadáspontja: 159–162 °C.
55. N-Metil-N'-[4-(3-klór-4-metoxi-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid 10
56. N,N-Dimetil-N'-[4-(3-klór-4-metoxi-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
57. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(3-klór-4-metoxi-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid 15
- Olvadáspontja: 119–127 °C.
58. N-Metil-N'-[4-(4-ciklohexil-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
59. N,N-Dimetil-N'-[4-(4-ciklohexil-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid 20
60. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(4-ciklohexil-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
- Olvadáspontja: 119–127 °C.
61. N-Metil-N'-[4-(1,1,2,3,3,3-hexafluor-n-propoxi)-fenil]-tiazol-2-il]-karbamid 25
- Olvadáspontja: 106–110 °C.
62. N,N-Dimetil-N'-[4-(1,1,2,3,3,3-hexafluor-n-propoxi)-fenil]-tiazol-2-il]-karbamid 30
63. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(1,1,2,3,3,3-hexafluor-n-propoxi)-fenil]-tiazol-2-il]-karbamid
- Olvadáspontja: 88–93 °C.
64. N-Metil-N'-[4-(1,1,2-trifluor-2-klór-etoxi)-fenil]-tiazol-2-il]-karbamid 35
65. N,N-Dimetil-N'-[4-(1,1,2-trifluor-2-klór-etoxi)-fenil]-tiazol-2-il]-karbamid
66. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(1,1,2-trifluor-2-klór-etoxi)-fenil]-tiazol-2-il]-karbamid 40
67. N-Metil-N'-[4-(4-metoxi-2-klór-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
68. N,N-Dimetil-N'-[4-(4-metoxi-2-klór-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
69. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(4-metoxi-2-klór-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid 45
- Olvadáspontja: 115–118 °C.
70. N-Metil-N'-[4-(2-metoxi-4-klór-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid 50
71. N,N-Dimetil-N'-[4-(2-metoxi-4-klór-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
72. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(2-metoxi-4-klór-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
- IR spektruma: $\nu_{\text{CO}} = 1684 \text{ cm}^{-1}$.
73. N-Metil-N'-[4-(4-metoxi-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
- Olvadáspontja: 200–208 °C.
74. N,N-Dimetil-N'-[4-(4-trifluor-metil-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
- Olvadáspontja: 202–210 °C.

75. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(2,4-diklór-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid

Olvadáspontja: 91–93 °C.

76. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(2,5-diklór-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
77. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(2,3,4-triklór-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
78. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(2-fluor-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
79. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(4-bróm-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
80. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(2,4-di(di-fluor-metoxi)-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
81. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(2-trifluor-metil-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
82. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(3-trifluor-metil-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
83. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(4-tercbutil-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
84. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(2,4,6-trimetil-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
85. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(4-trifluor-metoxi-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
86. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(3-klór-4-(4-klór-fenoxi)-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
- Olvadáspontja: 120–125 °C.
87. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(2,4-difluor-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
88. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(2,3,5-triklór-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
89. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(2-metoxi-3,5-diklór-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
90. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(2-metoxi-4-metil-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
91. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(2-metil-4-metoxi-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
92. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(2-metil-4-difluor-metoxi-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
93. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(2-difluor-metoxi-4-metil-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
94. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(2-klór-4-difluor-metoxi-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
95. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(2-difluor-metoxi-4-klór-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
96. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(3,5-diklór-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid
97. N-Metil-N-metoxi-N'-[4-(2,6-diklór-fenil)-tiazol-2-il]-karbamid

Az (I) általános képletű tiazolil-karbamid-származékokat hatóanyagként tartalmazó gyomirtószereket felhasználhatjuk például közvetlenül permetezhető oldatok, porok, szuszpenziók, magas százalékos tartalmú vizes, olajos vagy más szuszpenziók vagy diszperziók, emulziók, olajdiszperziók, paszták, porozószerkezetek, szórószerkezetek vagy granulátumok alakjában, permetezéssel, porlasztással, porozással, szórással vagy locsolással. Az alkalmazási formák teljes mértékben a felhasználási célhoz igazodnak; minden esetben a hatóanyagok lehető legegyszerűbb eloszlása a cél.

A közvetlenül permetezhető oldatok, emulziók, paszták vagy olajdiszperziók előállítására ásványolajfrakció-

kat vagy metanolt, etanolt, propanolt, butanolt, kloroformot, széntetrakloridot, ciklohexanolt, ciklohexanont, klór-benzolt, izoforont, erősen poláros oldószereket, így például dimetil-formamidot, dimetil-szulfoxidot, N-metil-pirrolidont, vizet használhatunk.

Vizes készítményeket emulziókoncentrátumokból, pasztákból vagy nedvesíthető porokból (permetporokból), olajdiszperziókból víz hozzáadásával készíthetünk. Emulziók, paszták vagy olajdiszperziók előállítására a hatóanyagokat magukban vagy olajban vagy oldószerben oldva nedvesítő-, tapadást elősegítő-, diszpergáló- vagy emulgeálószerrel vízben homogenizálhatjuk. A hatóanyagokból, nedvesítő-, tapadást elősegítő-, diszpergáló- vagy emulgeálószerrel és adott esetben oldószerből vagy olajból álló koncentrátumok készíthetők, amelyek vízzel hígíthatók.

A felületaktív adalékok között megemlíthetjük a ligninszulfonsav, naftalinszulfonsav, fenolszulfonsav alkálifém-, alkáliföldfém- és ammóniumsóit, alkil-aril-szulfonátokat, alkil-szulfátokat, alkil-szulfonátokat, a di-butil-naftalinszulfonsav alkálifém- és alkáliföldfém sóit, lauril-éter-szulfátot, zsíralkohol-szulfátokat, zsírsavak alkálifém- és alkáliföldfém sóit, szulfatozott hexadekanolok, -heptadekanolok, -oktadekanolok sóit, szulfatozott zsíralkohol-glikoléterek sóit, szulfonált naftalinnak és naftalin származékoknak formaldehiddel képzett kondenzációs termékeit, naftalinnak, illetve naftalinszulfonsavaknak fenollal és formaldehiddel alkotott kondenzációs termékeit, polioxi-etilén-oktil-fenolétert, etoxilezett izooktil-fenolt, -oktil-fenolt, -nonil-fenolt, alkil-fenol-poliglikolétereket, tributil-fenil-poliglikolétert, alkil-aril-politéteralkoholokat, izotridecalkoholt, zsíralkohol-etilénoxid kondenzátumokat, etoxilezett ricinusolajat, polioxi-tilén-alkilétert, etoxilezett polioxipropilént, lauril-alkohol-poliglikoléter-acetált, szorbitesztet, lignint, szulfitszenylyugokat és metil-cellulózt.

Porokat, porozó- és szórószerkeket a hatóanyagoknak szilárd hordozóanyaggal való összekeverésével vagy összeőrlésével készíthetünk.

Granulátumokat, például bevont-, impregnált- és homogén granulátumokat a hatóanyagoknak szilárd hordozóanyagokon való megkötésével készíthetünk. Szilárd hordozóanyagok lehetnek például az ásványi termékek, így a szilikagél, kovasavak, kovasavgél, szilikátok, talcum, kaolin, attapulgit, mészkő, mészs, kréta, bólus, lösz, agyag, dolomit, kovaföld, kalcium- és magnézium-szulfát, magnézium-oxid, őrölt műanyagok, műtrágyák, így például ammónium-szulfát, ammónium-foszfát, ammónium-nitrát, karbamid és növényi termékek, így gabonaliszt, fahéj-, fa- és csonthéj őrlemények, cellulózpor és egyéb szilárd hordozóanyagok.

A készítmények 0,1–95 tömegszázalékos, előnyösen 0,5–90 tömegszázalékos hatóanyagtartalmúak.

Példák a gyomirtószerkészítményekre:

I. példa

90 tömegrész 2. számú hatóanyagot elkeverünk 10 tömegrész N-metil- α -pirrolidonnal, és így olyan oldatot kapunk, ami a legfinomabb cseppekre eloszlatva alkalmazható.

II. példa

20 tömegrész 8. számú hatóanyagot feloldunk 80 tömegrész xiloból, 8–10 mól etilénoxidnak és 1 mól olajsav-N-monoetanolamidnak 10 tömegrésznyi reakciótermékéből, 5 tömegrész dodecil-benzolszulfonsav kalcium sóból és 40 mól etilénoxidnak és 1 mól ricinusolajnak 5 tömegrésznyi reakciótermékéből álló elegyben. A kapott oldatot 100 000 tömegrész vízbe öntve, és finoman eloszlatva 0,02 tömegszázalékos hatóanyagtartalmú vizes diszperziót kapunk.

III. példa

20 tömegrész 1. számú hatóanyagot feloldunk 40 tömegrész ciklohexanonból, 30 tömegrész izobutanolból, 7 mól etilénoxidnak és 1 mól izooktil-fenolnak 20 tömegrésznyi reakciótermékéből és 40 mól etilénoxidnak és 1 mól ricinusolajnak 10 tömegrésznyi reakciótermékéből álló elegyben. A kapott oldatot 100 000 tömegrész vízbe öntve, és finoman eloszlatva 0,02 tömegszázalékos hatóanyagtartalmú vizes diszperziót kapunk.

IV. példa

20 tömegrész 1. számú hatóanyagot feloldunk 25 tömegrész ciklohexanolból, 65 tömegrész 210–280 °C forráspont-intervallumú ásványolajfrakcióból és 40 mól etilénoxidnak és 1 mól ricinusolajnak 10 tömegrésznyi reakciótermékéből álló elegyben. A kapott oldatot 100 000 tömegrész vízbe öntve, és finoman eloszlatva 0,02 tömegszázalékos hatóanyagtartalmú vizes diszperziót kapunk.

V. példa

20 tömegrész 2. számú hatóanyagot 3 tömegrész diizobutil-naftalin- α -szulfonsav nátrium sóval, 17 tömegrész szulfitszenylyugból származó ligninszulfonsav nátrium sóval és 60 tömegrész porított kovasavgéllel jól elkeverünk, és kalapácsos malomban összeőrölünk. Az elegyet 20 000 tömegrész vízben finoman eloszlatva 0,1 tömegszázalékos hatóanyagtartalmú permetlevet kapunk.

VI. példa

3 tömegrész 9. számú hatóanyagot 97 tömegrész finomszemcsés kaolinnal elkeverünk. Így 3 tömegszázalékos hatóanyagtartalmú porozószeret kapunk.

VII. példa

30 tömegrész 9. számú hatóanyagot 92 tömegrész porított kovasavgél és 8 tömegrész paraffinolaj elegyével – a paraffinolajat a kovasavgél felületére porlasztjuk – alaposan elkeverünk. Így jó tapadóképességű szert kapunk.

VIII. példa

20 tömegrész 6. számú hatóanyagot 2 tömegrész decil-benzolszulfonsav kalcium sóval, 8 tömegrész zsíralkohol-poliglikoléterrel, 2 tömegrész fenol-karbamid-formaldehid kondenzátum nátrium sóval és 68 tömegrész paraffinos jellegű ásványolajjal alaposan elkeverünk. Így stabil olajos diszperziót kapunk.

A szerek alkalmazása történhet kikelés előtt vagy kikelés után. Ha a kikelés utáni alkalmazásnál bizonyos haszonnövények a hatóanyagokat kevésbé tűrik, úgy olyan kijuttatási technikát alkalmazhatunk, amelynél a gyomirtószert permetezőkészülékkel úgy juttatjuk ki, hogy az lehetőség szerint az érzékeny haszonnövények leveleit ne érje, miközben a hatóanyagok az alul növekedő gyomnövények leveleire vagy a pusztá talajra jutnak (post-directed, lay-by).

A felhasznált hatóanyagok mennyisége évszaktól, gyomnövénytől és a növekedési stádiumtól függően 0,1–5 kg/ha, előnyösen 0,125–1,5 kg/ha.

A találmány szerinti gyomirtószereknek a növények növekedésére kifejtett hatását az üvegházi kísérletek – I–VII. táblázatok – mutatják:

A növények tenyészvényeként 300 cm³-es műanyag virágserepek szolgáltak. A vizsgált növények magjait fajtánként elválasztva sekélyen elvetettük. Ezután a vizsgált növényeket jellegüktől függően 3–15 cm-es növekedési magasságig termesztettük, majd a gyomirtószerkészítménnyel (II–V. példák szerinti összetételű készítmények) kezeltük. A szójánál és a rizsnél tőzegkorpával dúsított szubsztrátumot alkalmaztunk. Vagy a direkt elvetett és ugyanabban a tenyészvényben felnevelt növényeket használtuk, vagy pedig olyanokat, amiket először csiranövényekként elválasztva külön felneveltünk, és néhány nappal a kezelés előtt a kísérleti tenyészvénybe átültettünk. A kikelés utáni alkalmazásnál a felhasznált mennyiség 0,25 és 3,0 kg hatóanyag/ha között változott.

A kísérleti tenyészvényeket üvegházba állítottuk, ahol a melegkedvelő fajoknak 20–35 °C-ot, a mérsékelt klímájúaknak pedig 10–25 °C-ot biztosítottunk. A kísérlet időtartama 2–4 hét volt. Ezalatt az idő alatt a növényeket gondoztuk, és az egyedi kezelésekre adott reakcióikat kiértékeltek. A kiértékelés 0–100 fok beosztású skála alapján történt, ahol a 100 azt jelenti, hogy a növény nem kelt ki, illetve, hogy a növénynek legalább a talaj fölötti részei teljesen elpusztultak.

Az üvegházi kísérletekhez a következő növényfajtákat használtuk:

Abutilon theophrasti (selyemmályva), Amaranthus retroflexus (szőrös disznóparéj), Cassia tora, Chenopodium album (fehér libatop), Echinochloa crus-galli (közönséges kakaslábű), Euphorbia geniculata, Glycine max (szója), Gossypium hirsutum (gyapot), Ipomoea spp. (hajnalkák), Lolium multiflorum (olaszperje), Mercurialis annua (egynyári szélű), Oryza sativa (rizs), Sesbania exaltata, Sida spinosa, Sorghum bicolor (tarka cirok), Triticum aestivum (búza).

Összehasonlító gyomirtószerként az 1 131 207 számú nagy-britanniai szabadalmi leírásból ismert N-[4-(4-klór-fenil)-tiazol-2-il]-N'-metil-karbamidot hatóanyagként tartalmazó gyomirtószerkészítményt használtuk (a továbbiakban „A”-val jelöljük).

A kikelés után 3,0 kg hatóanyag/ha mennyiségben való alkalmazásnál például az 5., 7., 13. és 14. számú hatóanyagot tartalmazó gyomirtószereknek jelentékeny gyomirtó hatásuk van a széles levelű és a fűféle gyomokkal szemben.

A 7. és a 13. számú hatóanyagot tartalmazó gyomirtószerek 0,25 kg hatóanyag/ha mennyiségben lényegesen jobban leküzdik a gyomokat, mint az „A” hatóanyagot tartalmazó összehasonlító gyomirtószert. Ugyanaz a helyzet a 47. számú hatóanyagot tartalmazó gyomirtószerekkel 1,00 kg hatóanyag/ha mennyiségben való alkalmazásnál. A 12. és 14. számú hatóanyagot tartalmazó gyomirtószerek 0,5 kg hatóanyag/ha mennyiségben speciális széles levelű gyomokat küzdenek le, ilyen például a Sesbania exaltata.

Miként az „A” hatóanyagú összehasonlító gyomirtószert, ugyanúgy a 20. számú hatóanyagot tartalmazó találmány szerinti gyomirtószert is a gyapot jól tűri. A gyapotültetvényekben azonban a találmány szerinti gyomirtószert az „A” hatóanyagú gyomirtószert a széles levelű gyomokkal szembeni gyomirtó hatásban lényegesen felülmúlja.

A 75. számú hatóanyagot tartalmazó gyomirtószert a szójaültetvényekben 0,25 kg hatóanyag/ha mennyiségben sikeresen leküzdí az ismert gyomnövényeket anélkül azonban, hogy a szóját károsítaná. Az „A” hatóanyagot tartalmazó összehasonlítószerekkel azonban az eredmény nem kielégítő.

Tekintettel a haszonnövények jó tűrőképességére, az alkalmazási módok sokféleségére a találmány szerinti gyomirtószereket még nagy számú haszonnövényenél fel lehet használni a nem kívánt vadfűvekkel szemben, vagy akár a fűféle haszonnövényekkel szemben is, amennyiben azok ott nem kívántak.

A hatásspektrum szélesítése céljából az (I) általános képletű tiazolil-karbamid-származékokat számos más gyomirtó vagy növekedésszabályzó hatóanyaggal össze lehet keverni, és együtt kijuttatni. Keverékpartnerként szerepelhetnek például a diazinok, 4H-3,1-benzoxazin-származékok, benzo-tiadiazinonok, 2,6-dinitro-anilinszármazékok, N-fenil-karbamátok, tiolkarbamátok, halogén-karbonsavak, triazinok, amidok, más szerkezetű karbamidszármazékok, difenil-éterszármazékok, triazinonok, uracilszármazékok, benzofuránszármazékok, ciklohexán 1,3-dionszármazékok és még más gyomirtó hatóanyagok.

Ezenkívül hasznos a találmány szerinti gyomirtószereket magukban vagy más gyomirtószerekkel való kombinációban, még sok más gyomirtó- és növényvédőszerrel keverve együtt kijuttatni, például a kártevők vagy fitopatogén gombák, illetve baktériumok leküzdésére szolgáló szerekkel. Érdekes továbbá az ásványi sóoldatokkal való keverhetőség, amiket a táp- és nyomelemek hiányának leküzdésére lehet bevetni.

I. táblázat

Gyomirtó hatás kikelés utáni kezelés esetén 3,0 kg/ha hatóanyaggal növényházban

Hatóanyag száma	Növények károsodása, %			
	Echinochloa cruss-galli	Lolium multiflorum	Ipomoea spp.	Mercurialis annua
14.	90	95	100	100
13.	95	98	98	100
7.	100	98	100	100
5.	85	80	95	100

II. táblázat

Sesbania exaltata elleni hatás kikelés utáni kezelés esetén növényházban

Hatóanyag száma	Adag kg/ha	Növények károsodása, %			
		Glycine max	Gossypium hirsutum	Oryza sativa	Sesbania exaltata
12.	0,5	13	1	0	100
14.	0,5	12	2	5	94

III. táblázat

Széleslevelű gyomokat irtó szelektív hatás fűszerű haszonnövényekben
kikelés utáni kezelés esetén növényházban

Hatóanyag száma	Adag kg/ha	Növények károsodása, %			
		Sorghum bicolor	Triticum aestivum	Chenopodium album	Mercurialis annua
13.	0,25	15	12	90	98
A (ismert)	0,25	10	2	50	20

IV. táblázat

Széleslevelű gyomokat irtó hatás gyapotban kikelés utáni kezelés esetén növényházban

Hatóanyag száma	Adag kg/ha	Növények károsodása, %			
		Gossypium hirsutum	Abutilon theophr.	Euphorbia geniculata	Sesbania exaltata
7.	0,25	14	90	100	100
A (ismert)	0,25	2	0	13	60

V. táblázat

Széleslevelű gyomokat irtó hatás gyapokban kikelés utáni kezelés esetén növényházban

Hatóanyag száma	Adag kg/ha	Növények károsodása, %				
		Gossypium hirsutum	Amaranthus retrofl.	Cassia tora	Ipomoea spp.	Sida spinosa
47.	1,0	10	100	95	90	90
A (ismert)	1,0	5	13	33	29	22

VI. táblázat

Széleslevelű gyomokat irtó hatás gyapokban 1,0 kg/ha adaggal kikelés utáni kezelés esetén növényházban

Hatóanyag száma	Növények károsodása, %			
	Gossypium hirsutum	Amaranthus retroflexus	Cassia tora	Solanum nigrum
20.	5	95	100	100
A (ismert)	5	13	33	73

VII. táblázat

Szelektív gyomirtó hatás szójában kikelés után 0,25 kg/ha adaggal növényházi kezelés esetén

Hatóanyag száma	Növények károsodása, %					
	Glycine max.	Abutilon theophr.	Euphorbia heterophy.	Solanum nigrum	Amaranthus retroflexus	Ipomoea spp.
75.	0	100	100	100	100	100
A (ismert)	5	0	13	34	13	6

Szabadalmi igénypontok

1. Gyomirtószerkészítmény azzal jellemezve, hogy hatóanyagként 0,1–95 tömeg% (I) általános képletű ti-azolil-karbamid-származékot tartalmaz – a képletben

R¹ hidrogénatomot vagy 1–4 szénatomos alkilcsoportot jelent,

R² 1–4 szénatomos alkil- vagy 1–4 szénatomos alkoxycsoportot jelent,

R³ hidrogénatomot jelent,

55 X halogénatomot, 1–4 szénatomos halogén-alkoxi-, 1–4 szénatomos alkil-, 1–4 szénatomos halogén-alkil-csoportot, vagy adott esetben halogénatommal és/vagy halogén-metilcsoporttal szubsztituált fenoxycsoportot jelent, és

60 n értéke 1 vagy 2 lehet, azzal a megszorítással, hogy ha R¹ jelentése metilcsoport, akkor X nem jelenthet klóratomot a 4-es helyzetben, vagy klóratomot a 3-as és 4-es helyzetben – szilárd és folyékony hordozó-, illetve hígítóanyag – előnyösen

65

természetes és mesterséges ásványi örlemény, alifás, aro-
más és ciklusos szénhidrogén, víz, ásványolaj-frakció- és
felületaktív adalék – előnyösen ionos és nemionos disz-
pergáló-, emulgeáló- és nedvesítőszer – legalább egyiké-
vel együtt.

2. Az 1. igénypont szerinti gyomirtószerkészítmény
azzal jellemezve, hogy hatóanyagként olyan (I) általános
képletű tiazolil-karbamid-származékot tartalmaz, amely-
nek képletében R^1 metilcsoportot és R^2 metil- vagy
metoxycsoportot jelent.

3. Az 1. igénypont szerinti gyomirtószerkészítmény
azzal jellemezve, hogy hatóanyagként olyan (I) általános
képletű tiazolil-karbamid-származékot tartalmaz, amely-
nek képletében X 1–4 szénatomos halogén-alkoxycso-
portot jelent.

4. Az 1. igénypont szerinti gyomirtószerkészítmény
azzal jellemezve, hogy hatóanyagként olyan (I) általános
képletű tiazolil-karbamid-származékot tartalmaz, amely-
nek képletében X halogénatomot jelent.

5. Eljárás az 1. igénypont szerinti (I) általános képletű
tiazolil-karbamid-származékok előállítására – a képlet-
ben

R^1 hidrogénatomot vagy 1–4 szénatomos alkil-cso-
portot jelent,

R^2 1–4 szénatomos alkil- vagy 1–4 szénatomos alk-
oxycsoportot jelent,

R^3 hidrogénatomot vagy 1–4 szénatomos alkilcso-
portot jelent,

X hidrogén-, halogénatomot, 1–4 szénatomos alk-
oxi-, 1–4 szénatomos halogén-alkoxi-, 1–4 szén-
atomos alkil-, 1–4 szénatomos halogén-alkil-, 3–6
szénatomos cikloalkil-, 1–4 szénatomos alkil-tio-
csoportot, nitro-, benzil-oxycsoportot vagy adott
esetben halogénatommal és/vagy halogén-metil-
csoporttal szubsztituált fenoxycsoportot jelent, és
n értéke 1 vagy 2 lehet,

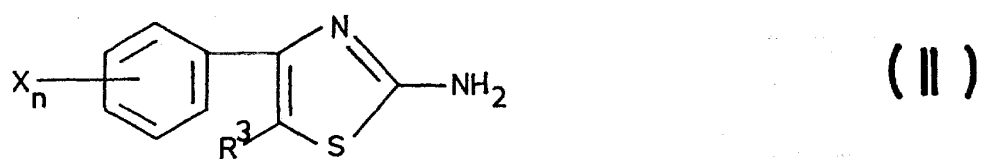
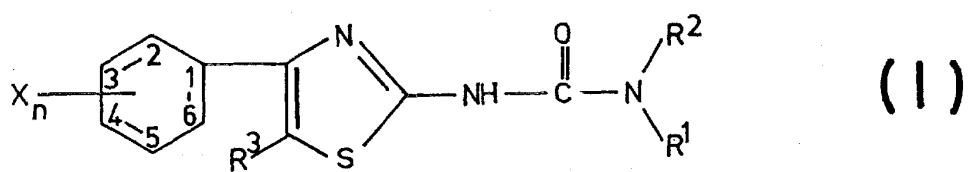
10 azzal a megszorítással, hogy ha R^1 jelentése metilcso-
port, R^3 jelentése hidrogénatom, úgy X nem jelenthet
hidrogénatomot, klóratomot vagy metoxycsoportot a
4-es helyzetben vagy klóratomot a 3-as és 4-es helyzet-
ben, *azzal jellemezve*, hogy (II) általános képletű szubsz-
tituált amint – a képletben R^3 , X jelentése és n értéke
15 a fent megadott –

a) foszgénnel, oxalil-kloriddal vagy difoszgénnel,
majd (III) általános képletű aminnal – a képletben R^1
és R^2 jelentése a fent megadott – reagáltatunk, vagy

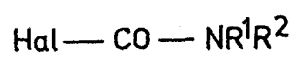
20 b) (IV) általános képletű karbamidsav-halogeniddel
– a képletben R^1 és R^2 jelentése a fent megadott és
Hal halogénatomot jelent – reagáltatunk, vagy

c) olyan (I) általános képletű tiazolil-karbamid-szár-
mazékok előállítására, amelyek képletében R^2 1–4 szén-
atomos alkilcsoportot jelent, (V) általános képletű izo-
cianáttal reagáltatunk – a képletben R^2 1–4 szénatomos
25 alkilcsoportot jelent.

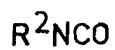
1 db ábra



(III)



(IV)



(V)

Kiadja az Országos Találmányi Hivatal
A kiadásért felel: Himer Zoltán osztályvezető
Megjelent a Műszaki Könyvkiadó gondozásában

COPYLUX Nyomdaipari és Sokszorosító, Kiszövetkező