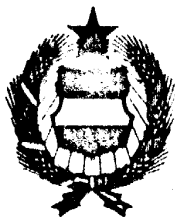


(19) Országkód:

HU



MAGYAR
KÖZTÁRSASÁG
ORSZÁGOS
TALÁLMÁNYI
HIVATAL

SZABADALMI LEÍRÁS

(11) Lajstromszám:

200170 B

(22) Bejelentés napja: 1988.05.18.

(21) 2488/88)

(33) Bejelentés elsőbbsége DE:

(32) 1987.05.19.

(31) (P 37 16 657.3)

(51) Int Cl⁵

C 07 D 239/42

C 07 D 251/12

C 07 D 251/22

C 07 C 303/36

A 01 N 47/36

A 01 N 43/66

A 01 N 43/54

(41) (42) Közzététel napja: 1989.06.28.

(45) Megjelent: 1990.04.30.

(72) Feltalálók:

Dr. Hamprecht Gerhard, Weinheim,
Dr. Hagen Helmut Frankenthal, DE,
Dr. Liese-Sauer Thomas, Sao Bernardo do Campo, BR,
Dr. Meyer Norbert Ladenburg,
Dr. Wuerzer Bruno, Otterstadt, DE

(73) Szabadalmaz:

BASF AG., Ludwigshafen/Rhein, DE

(54) Szulfonil-karbamid-származékokat tartalmazó gyomirtó és növényi növekedést szabályozó készítmények és eljárás a hatóanyagok előállítására

(57) KIVONAT

A találmány az (I) általános képletű szulfonil-karbamid-származékokat 0,01—95 tömeg% mennyiségben tartalmazó gyomirtó és növényi növekedést szabályozó készítményekre vonatkozik.

A képletben

R¹ alkil-, alkenil-, halogén-alkil-, alkoxi-alkil- vagy halogén-alkoxi-alkil-csoport,

R² hidrogénatom vagy alkilcsoport,

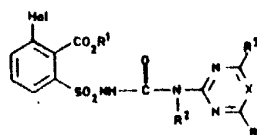
R³ halogénatom, metil- vagy metoxycsoport,

R⁴ metil- vagy metoxycsoport,

X nitrogénatom vagy -CH- csoport és

Hal fluor-, klór- vagy brómatom.

A találmány továbbá a hatóanyag előállítási eljárására is kiterjed.



(I)

HU200170B

A leírás terjedelme: 11 oldal, 6 ábra

A találmány tárgyat új szubsztituált 6 halogén-2-[(1,3,5 triazin 2-il, illetve 1,3 pirimidin 2-il)-amino karbonil] amino szulfonil] benzoésztereket (szulfonamidok, szulfonil karbamidok néven is említve) tartalmazó gyomirtó és növényi növekedést szabályozó készítmények, valamint a hatóanyagok előállítására szolgáló eljárás képezik.

Az EP-7687, számú európai szabadalmi leírás gyomirtó hatású szulfonil-karbamid-származékokat ismertet.

Azt találtuk, hogy az (I) általános képletű szubsztituált szulfonil-karbamidokat — a képletben

R^1 1—4 szénatomos alkil-, 3—4 szénatomos alkenil-, 1—4 szénatomos monohalogén alkil-, 3—6 szénatomos alkoxi-alkil- vagy 4—6 szénatomos halogén-alkoxi-alkil-csoport,

R^2 hidrogénatom vagy 1—2 szénatomos alkilcsoport,

R^3 halogénatom, metil- vagy metoxicsoport,

R^4 metil- vagy metoxicsoport,

X nitrogénatom vagy —CH—csoport és

Hal fluor-, klór- vagy brómatom — vagy fenti vegyületek alkálifém-sóit tartalmazó gyomirtó készítményeket bizonyos kultúrnövények, így a kukorica jól eltűri, továbbá a készítmények a növényi növekedést befolyásolják.

Az (I) általános képletű vegyületeket tartalmazó készítmények a kölesféléket szelektíven irtják. M. Hanf a BASF-Mitteilungen für den Landbau, 1/85: „Ackerunkräuter und Ackerungräser — ihre Verbreitung, Gefährdung und wirtschaftliche Bedeutung” című cikkében a 23. oldalon a következőket fejtí ki: „triazinokkal a kétszikű gyomnövények könnyen irthatók.

A szabadbá váló felületeket azonban a kukoricához hasonlóan ennek a szercsoportnak (triazinok) ellenálló kölesfajta foglalk el. Ezek elsősorban az Echinocchloa, Digitaria és Setaria nemekhez tartozó fajok. Ezeket a fajok azután más specifikus irtószerekkel és eljárásokkal kell ismét visszaszorítani.”

Ezt a gyakorlatban megkívánt igényt elégtí ki a jelen találmány.

Előnyös (I) általános képletű vegyületek azok, amelyek képletében R^1 mint 1—4 szénatomos alkilcsoport metil- és etilcsoport is, de előnyösen n-propil-, izopropil-, n-butil-, izobutil-, szek-butil-, terc-butil; mint 3—4 szénatomos alkenilcsoport, alil-, metallil-, krotil-, but-1-en-3-il-csoport; mint 1—4 szénatomos halogén-alkilcsoport 2-klór-etil-, 2-klór-n-propil-, 3-klór-n-propil-, 1-klór-but-2-il-, 2-klór-izobutil-, 4-klór-n-butil-, klór-terc-butil-, 3-klór-prop-2-il-csoport; mint 3—6 szénatomos alkoxi-alkilcsoport, 2-metoxi-etil-, 2-etoxi-etil-, 3-metoxi-n-propil-, 2-metoxi-n-propil-, 3-metoxi-n-butil-, 1-metoxi-but-2-il-, metoxi-terc-butil-, etoxi-terc-butil-, 2-metoxi-n-butil-, 4-metoxi-n-butil-, 2-etoxi-n-propil-, 3-metoxi-n-prop-2-il-, 2-etoxi-n-butil-1-il-, 4-etoxi-n-butilcsoport; mint 4—6 szénatomos halogén-alkoxi-alkilcsoport 2-(β -klór-etoxi)-etil-, 3-(β -klór-etoxi)-n-propil-, 3-(γ -klór-n-propoxi)-n-propilcsoport.

Az (I) általános képletű szulfonil-karbamid hatóanyagokat a találmány szerint a következőképpen állítjuk elő:

Egy (II) általános képletű vegyületet — a képletben R^1 a fenti jelentésű és Hal halogénatom — adott esetben iners szerves oldószerben, a szerves reakcióknál szokásos 0—120 °C, előnyösen 10—100 °C hőmérsékleten egy (III) általános képletű vegyülettel — a képletben R^2 , R^3 , R^4 és X a fenti jelentésűek — reagáltatunk. A reakciót végezhetjük nyomás nélkül vagy nyomás alatt, folyamatosan vagy szakaszosan.

Ha kiindulási anyagokként 6-fluor-2-izocianátoszulfonil-benzoészter-metil-észtert és 2-amino-4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazint alkalmazunk, akkor a reakció lefolyását az [A] reakcióváázat szemlélteti.

A reakcióhoz célszerűen a mindenkor reakciókörülmények mellett iners oldó- vagy hígítószeret használunk. Megfelelő oldószerek például a halogén-szénhidrogének, elsősorban a klór-szénhidrogének, így a tetraklór-etilén-, 1,1,2,2- vagy 1,1,1,2-tetraklór-etán, diklór-propán, metilén-diklorid, diklór-bután, kloroform, klór-naftalin, diklór-naftalin, széntetraklorid, 1,1,1- vagy 1,1,2-triklór-etán, triklór-etilén-, pentaklór-etán, o-, m- és p-difluor-benzol, 1,2-diklór-etán, 1,1-diklór-etán, 1,2-cisz-diklór-etilén, klór-benzol, fluor-benzol, bróm-benzol, jód-benzol, o-, m- és p-diklór-benzol, o-, m- és p-dibrom-benzol, o-, m- és p-klór-toluol, 1,2,4-triklór-benzol; éterek, például etil-propil-éter, metil-terc-butil-éter, n-butil-etil-éter, di-n-butil-éter, diizobutil-éter, diizoamil-éter, diizopropil-éter, anizol, fenetol, ciklohexil-metil-éter, dietil-éter, etilenglikol-dimetil-éter, tetrahidrofuran, dioxán, dioxán, tioanizol, β , β' -diklór-dietil-éter; nitro-szénhidrogének, így nitro-metán, nitro-etán, nitro-benzol, o-, m- és p-klór-nitro-benzol, o-nitro-toluol; nitrilek, így acetonnitril, butironitril, izobutironitril, benzonitril, m-klór-benzonitril; alifás vagy cikloalifás szénhidrogének, például heptán, pirán, nonán, o-, m- és p-cimol, a 70—190 °C közötti forráspontú benzínfrakciók, ciklohexán, metil-ciklohexán, dekalin, petroléter, hexán, ligroin, 2,2,4-trimetil-pentán, 2,2,3-trimetil-pentán, 2,3,3-trimetil-pentán, oktán; észterek, például etil-acetát, acetecet-észter, izobutil-acetát; amidok, például formamid, metil-formamid, dimetil-formamid; ketonok, például acetón, metil-etil-keton, és a fenti oldószerek megfelelő keverékei. Az oldószert a (II) általános képletű kiindulási vegyületre számítva célszerűen 100—2000 tömeg%, előnyösen 200—700 tömeg% mennyiségben alkalmazzuk.

A reakcióhoz szükséges (III) általános képletű vegyületet a (II) általános képletű kiindulási vegyületre számítva kb. ekvimoláris mennyiségben (ez alatt vagy efelett 0—20 mól%) alkalmazzuk. A (II) általános képletű kiindulási anyagot valamely fenti hígítószerben készíthetjük elő, majd egy (III) általános képletű kiindulási vegyületet hozzáadunk.

Az eljárást az új vegyületek előállítására azonban célszerűen úgy hajtjuk végre, hogy egy fenti hígítószerben előkészített (III) általános képletű kiindulási vegyülethez a (II) általános képletű kiindulási vegyületet hozzáadjuk.

A reakció tökéletes kivitelezése céljából a komponensek összekeverése után a reakcióelegyet 20 perc—24 órán át 0—120 °C, előnyösen 10—100 °C, elsősorban 20—80 °C hőmérsékleten még keverjük.

A szulfonil-karbamidok alkálifém sóit úgy állítjuk elő, hogy a szulfonil-karbamidot stöchiometrikus mennyiségű vizes bázissal vagy egy fémalkohollal reagáltatjuk, adott esetben iners szerves oldószerben.

A reakciókeverékből az (I) általános képletű végterméket a szokásos módon izoláljuk, például az oldószert ledesztilláljuk vagy a terméket közvetlenül leszivatjuk. A maradékot a bázisos szennyezések eltávolítása céljából még vízzel, illetve hígított savval moshatjuk. Úgy is eljárhatunk, hogy a maradékot vízzel nem elegyedő oldószerben oldjuk és a fenti módon mossuk. Az előállítani kívánt végterméket így tiszta formában kapjuk, adott esetben utóbbiakat átkrítályosítással vagy kromatográfiával tisztítjuk.

Példák a kiindulási vegyületek előállítására

6-Klór-2-amino-szulfonil-benzoesav-metil-észter

93 g 4-klór-1,2-benzizotiazol-3-on-1,1-dioxidot 0,8 liter metanolban szuszpendálunk, és a szuszpenziót klórgáz bevezetésével 3 órán át visszafolyatással melegítjük keverés közben. Ezután a reakciókeveréket 20 °C-ra lehűtjük, leszivatjuk és szárítjuk. Így 152—153 °C olvadásponttal 60 g cím szerinti vegyületet kapunk. A szűrletet vákuumban bepároljuk, a maradékot metil-terc-butil-éterrel eldörzsöljük, leszivatjuk és szárítjuk, így 42 g második frakciót kapunk, olvadáspontja 144—149 °C.

Hasonló módon állíthatók elő (illetve lettek előállítva, ha fizikai jellemzőket megadunk) a (VII) és (VIII) általános képletű vegyületek:

(VII) általános képletű vegyületek Op. °C	(VIII) általános képletű vegyületek Op. °C	
C ₂ H ₅	97—101	129—131
n-C ₃ H ₇	111—113	104—107
i-C ₃ H ₇	145—104	84—87
n-C ₄ H ₉		
i-C ₄ H ₉		
szek-C ₄ H ₉		
CH ₂ -CH=CH ₂	105—108	
CH ₂ -C=CH		
CH ₂ CH ₂ Cl	130—134	109—110
CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₃	102—104	135—136
CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ CH ₂ -Cl	124—126	

6-Klór-2-(izocianátoszulfonil)-benzoesav-metil-észter

100 g 6-klór-2-amino-szulfonil-benzoesav-metil-észtert 300 ml 1,2-diklór-etánban szuszpendálunk, a szuszpenzióhoz keverés közben 123 g tionil-kloridot adunk, az elegyet lassan visszafolyatással melegítjük, 5 órán át keverés közben visszafolyatással forraljuk, majd 55 °C-ra lehűtjük, 1,5 ml piridint adunk hozzá és foszgén bevezetése közben újra visszafolyatással melegítjük. Négy óra gázbevezetés után a reakciókeveréket vákuumban bepároljuk és nitrogénnel kezeljük. A 105 g visszamaradó olajat további tisztítás nélkül használjuk a következő műveletekhez.

6-Fluor-2-klór-szulfonil-benzoesav-metil-észter

108 g fluor-antranilsav-metil-észtert és 45 g nátrium-nitritet 106 ml vízben keverés közben 5 °C-on két adagolóberendezéssel úgy adagolunk 250 ml tömény sósavhoz 1 óra alatt, hogy az észterkomponens feleslegben legyen. A reakcióelegyet 5—8 °C-on 20 percig keverjük, majd 53 g kéndioxidot, 1,7 g rész(II)-kloridot (kevés vízben) tartalmazó 200 ml 1,2-diklór-etános oldathoz egyszerre hozzáadjuk és még 10 percig keverjük. Ezután a reakciókeveréket lassan 50 °C-ra felmelegítjük és 46 g kéndioxid bevezetése mellett 1 1/2 órán át keverjük, majd 20 °C-ra lehűtjük és keverés közben 20 percig keverjük, a szerves fázist elkülönítjük, vízzel mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, így 105 g cím szerinti vegyületet kapunk, mint barnás olajat.

6-Fluor-2-amino-szulfonil-benzoesav-metil-észter

252,5 g 6-fluor-2-klór-szulfonil-benzoesav-metil-észter és 700 ml vízmentes tetrahidrofuran keverékébe 20—28 °C-on keverés közben 42,5 g ammóniagázt vezetünk. Az elegyet 1 órán át 25 °C-on keverjük, majd a kivált csapadékot leszivatjuk, vízben feloldjuk és etil-acetáttal egyszer extraháljuk. A vizes fázist tömény sósavval megsavanyítva 8,8 g 4-fluor-1,2-benzizotiazol-3-on-1,1-dioxidot kapunk, amelynek olvadáspontja 210—212 °C.

A tetrahidrofuranos szűrletet bepároljuk, vízzel mossuk, etil-acetáttal felvesszük, vízzel még egyszer mossuk, leszivatjuk és szárítjuk. Így 186 g cím szerinti vegyületet kapunk, olvadáspontja 155—159 °C.

4-Fluor-1,2-benzizotiazol-3-on-1,1-dioxid

100 g 6-fluor-2-amino-szulfonil-benzoesav-metil-észtert 430 ml 1 n nátrium-hidroxidhoz adunk, 40 °C-ra felmelegítjük és még 5 percig keverjük. Ezután az elegyet tömény sósavval megsavanyítjuk és még 20 percig keverjük. A terméket leszivatjuk, vízzel mossuk és szárítjuk, így 78,4 g cím szerinti vegyületet kapunk, olvadáspontja 210—212 °C.

A találmány szerinti hatóanyagok előállítását az alábbi példák szemléltetik.

1. példa

6-Klór-2-[(4,6-dimetil-1,3-pirimidin-2-il)-amino-karbonil]-amino-szulfonil]-benzoesav-metil-észter

6,7 g 2-amino-4,6-dimetil-pirimidin 50 ml vízmentes acetonitrilrel készített szuszpenziójához 10 perc alatt, keverés közben, nitrogénatmoszférában, szobahőmérsékleten 100 ml vízmentes acetonitrilben 15 g 6-klór-2-(izocianátoszulfonil)-benzoesav-metil-észtert adunk, ekkor 6 °C hőmérsékletemelkedés következik be. Az elegyet 5 órán át 25 °C-on keverjük, a kivált csapadékot leszivatjuk, 1 n sósavval és metanollal mossuk és szárítjuk. Így 14,2 g cím szerinti vegyületet kapunk, amelynek olvadáspontja 215—217 °C.

2. példa

6-Fluor-2-[(4,6-dimetil-1,3,5-triazin-2-il)-amino-karbonil]-amino-szulfonil]-benzoesav-β-metoxi-etil-észter

4 g 2-amino-4,6-dimetoxi-1,3,5-triazin és 40 ml dimetil-formamid keverékéhez 25 °C-on, keverés

közben, nitrogénatmoszférában, 10 perc alatt 20 ml metilén-dikloridban 7,1 g 6-fluor-2-izocianátoszulfonil-benzoészter-b-metoxi-etil-észtert adunk, ekkor a hőmérséklet 32 °C-ra emelkedik. Az elegyet 14 órán át 25 °C-on keverjük, az oldszert vákuumban eltávolítjuk, és a maradékot étterrel és kétszer 3 n sósavval elkeverjük, acetonnal felvesszük, az oldhatatlan anyagokat kiszűrjük és a szűrletet szárazra pároljuk. Így 7 g cím szerinti vegyületet kapunk, amelynek olvadáspontja 179—182 °C.

3. példa

6-Klór-2-[[[4,6-dimetil-1,3,5-triazin-2-il]-amino-karbonil]-amino-szulfonil]-benzoészter-izopropil-észter-nátriumsó

4,6 g 6-klór-2-[[[4,6-dimetoxi-1,3,5-triazin-2-il]-amino-karbonil]-amino-szulfonil]-benzoészter-izopropil-észtert (133. vegyület) 100 ml metanolban szuszpendálunk, 25 °C-on 1,8 g 30%-os nátrium-metilátot adunk hozzá és 5 °C-on 5 percig melegítjük, így tiszta oldatot kapunk. Az oldatot vákuumban bepároljuk, így 4,7 g cím szerinti vegyületet kapunk, amelynek bomlási hőmérséklete 185 °C.

Az alábbi vegyületeket az előző példák szerint állítottuk elő (ebben az esetben fizikai jellemzőket is megadunk), illetve a vegyületek a fentiekhez hasonlóan állíthatók elő.

1. táblázat

Példa	R ¹	Olvadáspontja, °C
4.	C ₂ H ₅	198—200
5.	n-C ₃ H ₇	
6.	i-C ₃ H ₇	200—202
7.	n-C ₄ H ₉	
8.	i-C ₄ H ₉	
9.	szek-C ₄ H ₉	
10.	CH ₂ -CH=CH ₂	
11.	CH ₂ -CH=H	
12.	CH ₂ -CH ₂ Cl	
13.	CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₃	
14.	CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ Cl	

Megjegyzés: A fenti vegyületek a (IX) általános képletnek felelnek meg.

2. táblázat

Példa	R ¹	Olvadáspontja, °C
16.	CH ₃	212—214
17.	C ₂ H ₅	
18.	i-C ₃ H ₇	
19.	n-C ₄ H ₉	
20.	i-C ₄ H ₉	
21.	szek-C ₄ H ₉	
22.	CH ₂ -CH=CH ₂	
23.	CH ₂ -CH=XH	
24.	CH ₂ -CH ₂ Cl	
25.	CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₃	158—160
26.	CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ Cl	

3. táblázat

Példa	R ¹	Olvadáspontja, °C
5	28. CH ₃	213 (bomlás)
	29. CH ₂ H ₅	179—182
	30. n-C ₃ H ₇	181—184
	31. i-C ₃ H ₇	210—212
	32. n-C ₄ H ₉	
10	33. i-C ₄ H ₉	
	34. szek-C ₄ H ₉	
	35. CH ₂ CH=CH ₂	
	36. CH ₂ CXH	
	37. CH ₂ CH ₂ Cl	169—171
15	38. CH ₂ CH ₂ O-CH ₃	168—170
	39. CH ₂ CH ₂ -O-CH ₂ CH ₂ Cl	161—164

4. táblázat

Példa	R ¹	Olvadáspontja, °C
20	41. CH ₃	215—217
	42. CH ₂ H ₅	210—213
	43. n-C ₃ H ₇	195—198
	44. i-C ₃ H ₇	
	45. n-C ₄ H ₉	
	46. i-C ₄ H ₉	
30	47. szek-C ₄ H ₉	
	48. CH ₂ CH=CH ₂	
	49. CH ₂ C=CH	
	50. CH ₂ CH ₂ Cl	
	51. CH ₂ CH ₂ O-CH ₃	175—177
35	52. CH ₂ CH ₂ -O-CH ₂ CH ₂ Cl	

Megjegyzés: A 2. táblázat szerinti vegyületek a (X), a 3. táblázat szerinti vegyületek a (XI) és a 4. táblázat szerinti vegyületek a (XII) általános képletnek felelnek meg.

5. táblázat

Példa	R ¹	Olvadáspontja, °C
45	54. CH ₃	227—230
	55. CH ₂ H ₅	210—212
50	56. n-C ₃ H ₇	217—219
	57. i-C ₃ H	202—205
	58. n-C ₄ H ₉	
	59. i-C ₄ H ₉	
	60. szek-C ₄ H ₉	
55	61. CH ₂ CH=CH ₂	197(bomlás)
	62. CH ₂ C=CH	
	63. CH ₂ CH ₂ Cl	
	64. CH ₂ CH ₂ O-CH ₃	173—175
60	65. CH ₂ CH ₂ -O-CH ₂ CH ₂ Cl	

Megjegyzés: Az 5. táblázat szerinti vegyületek a (XIII) általános képletnek felelnek meg.

Analóg módon állítható elő az a (I) általános képletű vegyület, amelynek képletében R^1 és R^2 metilcsoport, R^3 klóratom, R^4 metoxicsoporth, Hal fluoratom és $X=CH$. Olvadáspontja 144–148 °C.

6. táblázat

Példa	R^1	Olvadáspontja, °C
67.	CH ₃	204–206
68.	CH ₂ H ₅	
69.	n-C ₃ H ₇	
70.	i-C ₃ H ₇	
71.	n-C ₄ H ₉	
72.	i-C ₄ H ₉	
73.	szek-C ₄ H ₉	
74.	CH ₂ -CH=CH ₂	
75.	CH ₂ -CH=CH	
76.	CH ₂ -CH ₂ Cl	
77.	CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₃	
78.	CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ Cl	

Megjegyzés: A 6. táblázat szerinti vegyületek a (XIV) általános képletnek felelnek meg.

7. táblázat

Példa	R^1	Olvadáspontja, °C
80.	CH ₃	210–214
81.	C ₂ H ₅	193–195
82.	n-C ₃ H ₇	178–180
83.	i-C ₃ H ₇	205–207
84.	i-C ₄ H ₉	
85.	i-C ₄ H ₉	
86.	szek-C ₄ H ₉	
87.	CH ₂ -CH=CH ₂	
88.	CH ₂ -CH=CH	
89.	CH ₂ -CH ₂ Cl	153 (bomlás)
90.	CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₃	154–151
91.	CH ₂ -CH ₂ -O-CH ₂ -CH ₂ Cl	149–151

Megjegyzés: A 7. táblázat szerinti vegyületek a (XV) általános képletnek felelnek meg.

8. táblázat

Példa	R^1	Olvadáspontja, °C
93.	CH ₃	190–192
94.	CH ₂ H ₅	
95.	n-C ₃ H ₇	
96.	i-C ₃ H ₇	
97.	n-C ₄ H ₉	
98.	i-C ₄ H ₉	
99.	szek-C ₄ H ₉	
100.	CH ₂ CH=CH ₂	
101.	CH ₂ C=CH	
102.	CH ₂ CH ₂ Cl	170–171
103.	CH ₂ CH ₂ -O-CH ₃	160–162
104.	CH ₂ CH ₂ -O-CH ₂ CH ₂ Cl	

Megjegyzés: A 8. táblázat szerinti vegyületek a (XVI) általános képletnek felelnek meg.

5

9. táblázat

Példa	R^1	Olvadáspontja, °C
106.	CH ₂ H ₅	192–194
107.	n-C ₃ H ₇	179–181
108.	i-C ₃ H ₇	197–198
109.	n-C ₄ H ₉	
110.	i-C ₄ H ₉	
111.	szek-C ₄ H ₉	
112.	CH ₂ CH=CH ₂	
113.	CH ₂ C=CH	
114.	CH ₂ CH ₂ Cl	
115.	CH ₂ CH ₂ -O-CH ₃	
116.	CH ₂ CH ₂ -O-CH ₂ CH ₂ Cl	

Megjegyzés: A 9. táblázat szerinti vegyületek a (XVII) általános képletnek felelnek meg.

25

10. táblázat

Példa	R^1	Olvadáspontja, °C
118.	CH ₃	212–213
119.	CH ₂ H ₅	196 (bomlás)
120.	n-C ₃ H ₇	196–199
121.	i-C ₃ H ₇	199–201
122.	n-C ₄ H ₉	
123.	i-C ₄ H ₉	
124.	szek-C ₄ H ₉	
125.	CH ₂ CH=CH ₂	
126.	CH ₂ C=H	
127.	CH ₂ CH ₂ Cl	
128.	CH ₂ CH ₂ -O-CH ₃	153–158
129.	CH ₂ CH ₂ -O-CH ₂ CH ₂ Cl	

Megjegyzés: A 10. táblázat szerinti vegyületek a (XVIII) általános képletnek felelnek meg.

45

11. táblázat

Példa	R^1	Olvadáspontja, °C
131.	CH ₂ H ₅	202 (bomlás)
132.	n-C ₃ H ₇	
133.	i-C ₃ H ₇	218–220
134.	n-C ₄ H ₉	
135.	i-C ₄ H ₉	
136.	szek-C ₄ H ₉	
137.	CH ₂ CH=CH ₂	
138.	CH ₂ C=CH	
139.	CH ₂ CH ₂ Cl	194–196
140.	CH ₂ CH ₂ -O-CH ₃	160–162
141.	CH ₂ CH ₂ -O-CH ₂ CH ₂ Cl	198 (bomlás)

Megjegyzés: A 11. táblázat szerinti vegyületek a (XIX) általános képletnek felelnek meg.

65

12. táblázat

Példa	R ¹	Olvadáspontja, °C
143.	CH ₃	5
144.	CH ₂ H ₅	
145.	n-C ₃ H ₇	
146.	i-C ₃ H ₇	
147.	n-C ₄ H ₉	
148.	i-C ₄ H ₉	10
149.	szek-C ₄ H ₉	
150.	CH ₂ CH=CH ₂	
151.	CH ₂ C≡CH	
152.	CH ₂ CH ₂ Cl	
153.	CH ₂ CH ₂ -O-CH ₃	15
154.	CH ₂ CH ₂ -O-CH ₂ CH ₂ Cl	

Megjegyzés: A 12. táblázat szerinti vegyületek a (XX) általános képletnek felelnek meg.

13. táblázat

Példa	R ¹	Olvadáspontja, °C
156.	CH ₃	202—205
157.	CH ₂ H ₅	
158.	n-C ₃ H ₇	
159.	i-C ₃ H ₇	
160.	n-C ₄ H ₉	
161.	i-C ₄ H ₉	197—199
162.	szek-C ₄ H ₉	
163.	CH ₂ CH=CH ₂	
164.	CH ₂ C≡CH	
165.	CH ₂ CH ₂ Cl	
166.	CH ₂ CH ₂ -O-CH ₂	167 (bomlás)
167.	CH ₂ CH ₂ -O-CH ₂ CH ₂ Cl	

Megjegyzés: A 13. táblázat szerinti vegyületek a (XXI) általános képletnek felelnek meg.

14. táblázat

Példa	R ¹	Olvadáspontja, °C
169.	CH ₃	216—218
170.	CH ₂ H ₅	
171.	n-C ₃ H ₇	
172.	i-C ₃ H ₇	
173.	n-C ₄ H ₉	
174.	i-C ₄ H ₉	201 (bomlás)
175.	szek-C ₄ H ₉	
176.	CH ₂ CH=CH ₂	
177.	CH ₂ C≡CH	
178.	CH ₂ CH ₂ Cl	
179.	CH ₂ CH ₂ -O-CH ₃	201 (bomlás)
180.	CH ₂ CH ₂ -O-CH ₂ CH ₂ Cl	

Megjegyzés: A 14. táblázat szerinti vegyületek a (XXII) általános képletnek felelnek meg.

15. táblázat

Példa	R ¹	Olvadáspontja, °C
182.	CH ₃	300
183.	CH ₂ H ₅	
184.	n-C ₃ H ₇	
185.	i-C ₃ H ₇	

16. táblázat

Példa	R ¹	Olvadáspontja, °C
186.	CH ₃	300
187.	CH ₂ H ₅	
188.	n-C ₃ H ₇	
189.	i-C ₃ H ₇	
190.	n-C ₄ H ₉	167 (bomlás)
191.	i-C ₄ H ₉	
192.	szek-C ₄ H ₉	
193.	CH ₂ -CH=CH ₂	
194.	CH ₂ CH ₂ Cl	
195.	CH ₂ CH ₂ -O-CH ₃	

Megjegyzés: A 15. táblázat szerinti vegyületek a (XXIII) és a 16. táblázat szerinti vegyületek a (XXIV) általános képletnek felelnek meg.

17. táblázat

Példa	R ¹	Olvadáspontja, °C
196.	CH ₃	154
197.	CH ₂ H ₅	
198.	n-C ₃ H ₇	
199.	CH ₂ CH ₂ -O-CH ₃	

18. táblázat

Példa	R ¹	Olvadáspontja, °C
200.	CH ₃	300
201.	CH ₂ H ₅	
202.	n-C ₃ H ₇	

19. táblázat

Példa	R ¹	Olvadáspontja, °C
203.	CH ₃	225—228
204.	CH ₂ H ₅	
205.	n-C ₃ H ₇	

Megjegyzés: A 17. táblázat szerinti vegyületek a (XXV), a 18. táblázat szerinti vegyületek a (XXVI) és a 19. táblázat szerinti vegyületek a (XXVII) általános képletnek felelnek meg.

Botanikus név	Magyar név	
<i>Brassica napus</i> var. <i>napobrassica</i>	karórépa	
<i>Brassica napus</i> var. <i>rapa</i>	fehértépa	
<i>Camellia sinensis</i>	teacserje	5
<i>Carthamus tinctorius</i>	kerti pórsáfrány	
<i>Carya illinoensis</i>	pekandiófa	
<i>Citrus limon</i>	citrom	
<i>Citrus maxima</i>	citrancs	
<i>Citrus reticulata</i>	mandarin	10
<i>Citrus sinensis</i>	narancs	
<i>Coffea arabica</i> (<i>Coffea canaphora</i> , <i>Coffea liberica</i>)	kávé	
<i>Cynodon dactylon</i>	csillagpázsit	15
<i>Elaeis guineensis</i>	olajpálma	
<i>Fragaria vesca</i>	eper	
<i>Glycine max</i>	szójabab	
<i>Gossypium hirsutum</i> (<i>Gossypium</i> <i>arabum</i> , <i>Gossypium herbaceum</i> , <i>Gossypium vitifolium</i>)	gyapot	20
<i>Helianthus annuus</i>	napraforgó	
<i>Helianthus tuberosus</i>	csicsóka	
<i>Hevea brasiliensis</i>	parakaucsukfa	
<i>Triticum vulgare</i>	árpa	25
<i>Humulus lupulus</i>	komló	
<i>Ipomoea batatas</i>	édesburgonya	
<i>Juglans regia</i>	dió	
<i>Linum usitatissimum</i>	len	
<i>Lycopersicon lycopersicum</i>	paradicsom	30
<i>Malus</i> spp.	alma	
<i>Manihot esculenta</i>	manióka	
<i>Medicago sativa</i>	ucerna	
<i>Metha piperita</i>	borsmenta	
<i>Musa</i> spp.	gyümölcs- és lisztbanán	35
<i>Nicotiana tabacum</i> (<i>N. rustica</i>)	dohány	
<i>Olea europaea</i>	olajfa	
<i>Oryza sativa</i>	rizs	
<i>Panicum miliaceum</i>	köles	40
<i>Phaseolus lunatus</i>	limabab	
<i>Phaseolus mungo</i>	földi mogoró	
<i>Phaseolus vulgaris</i>	bokorbab	
<i>Pennisetum glaucum</i>	gyékényféle	
<i>Petroselinum crispum</i> spp.		45
<i>tuberosum</i>	petrezselyem	
<i>Picea abies</i>	vöröstobozú luc- fenyő	
<i>Abies alba</i>	jegenyefenyő	
<i>Pinus</i> spp.	erdei fenyő	50
<i>Pisum sativum</i>	kerti borsó	
<i>Prunus avium</i>	cseresznye	
<i>Prunus domestica</i>	szilva	
<i>Prunus dulcis</i>	mandula	
<i>Prunus persica</i>	őszibarac	55
<i>Pyrus communis</i>	körte	
<i>Ribes sylvestre</i>	vörös ribizske	
<i>Ribes uva-crispa</i>	egres	
<i>Ricinus communis</i>	ricinus	
<i>Saccharum officinarum</i>	cukornád	60
<i>Secale cereale</i>	roz	
<i>Sesamum indicum</i>	szezám	
<i>Solanum tuberosum</i>	burgonya	
<i>Sorghum bicolor</i> (<i>s. vulgare</i>)	cirok	
<i>Sorghum dochna</i>	cukorcirok	65

Botanikus név	Magyar név
<i>Spinacia oleracea</i>	spenót
<i>Theobroma cacao</i>	kakaófa
<i>Trifolium pratense</i>	régi here
<i>Triticum aestivum</i>	búza
<i>Vaccinium corymbosum</i>	áfonya
<i>Vaccinium vitis-idaea</i>	vörös áfonya
<i>Vicia faba</i>	lóbab
<i>Vigna sinensis</i> (<i>V. unguiculata</i>)	tehenborsó
<i>Vitis vinifera</i>	szőlő
<i>Zea mays</i>	kukorica

A hatásspektrum kiszélesítése és hatásfokozás céljából az (I) általános képletű hatóanyagok egymással, valamint más gyomirtó vagy növekedést szabályozó hatóanyagcsoportok számos képviselőjével keverhetők és együtt alkalmazhatók. A keveréshez például a következő hatóanyagok vehetők partnerként számításba: diazinok, 4H-3,1-benzoxazin-származékok, benzotiadiazinonok, 2,6-dinitroanilinek, N-fenil-karbamátok, tiol-karbamátok, halogén-karbonsavak, triazinok, amidok, karbamidok, difenil-éterek, triazinonok, uracilok, benzofurán-származékok, kinolin-karbonsavak, ciklohexanon-vegyületek és más hatóanyagok.

Ezen kívül hasznos lehet az (I) általános képletű szulfonil-karbamidokat magukban vagy más gyomirtószerekkel kombinálva, még más növényvédőszerrel is keverve alkalmazni, például kártevők vagy a növényekre káros gombák, illetve baktériumok elleni szerekkel. Érdekes lehet továbbá az ásványi sóoldatokkal való keverhetőség, ami a táp- és nyomelem hiányok megszüntetésére szolgál. Bekeverhetünk továbbá a növényekre nem mérgező olajokat és olajkoncentrátumokat is.

1. táblázat

Gyomirtó hatás széleslevelű nem kívánatos növényekre és elviselhetőség egy példa szerinti kultúr-növényre a 118. példa szerinti vegyület 0,125 kg hatóanyag/ha mennyiségét kinövés után, növényházban alkalmazva.

Hatóanyag: a (XXVIII) képletű vegyület (113. sz.)
Kísérleti növények és a károsodás (%)

TRZAS	10
AMARE	95
CHEAL	98
LAMAM	100
STEME	100

2. táblázat

Nem kívánatos, példa szerinti növények irtása és elviselhetőség búzára, a 118. példa szerinti (vagyis a XXVIII. képletű) vegyületet kinövés előtt 0,06 kg hatóanyag/ha mennyiségben növényházban alkalmazva.

Kísérleti növények és károsodás (%)

TRZAS	10
ECHCG	90
STME	100

3. táblázat

Összehasonlító kísérlet nem kívánatos növények növekedésének leküzdésére kukoricában kinövés után, növényházban, a 41. példa szerinti (vagyis a XXIX általános képletű) vegyülettel (A), az US—PS

után, növényházban, a 41. példa szerinti (vagyis a XXIX általános képletű) vegyülettel (A), az US—PS

4.547.215. számú amerikai egyesült államokbeli szabadalmi leírásból ismert „chlorimuron-ethyl” hatóanyag (B) ellenében.

R ¹	Hal	kg hatóanyag/ha	ZEAMX	Kísérleti növények és károsodás (%)			
				ECHCG	LOLMU	AMARE	CHYCO
(A) CH ₃	F	0,125	10	98	98	100	100
(B) C ₂ H ₅	H	0,03	50	95	50	100	100

A 41. példa szerinti vegyület 0,125 kg hatóanyag/ha mennyiségben kinövés utáni alkalmazással megfelelő fűszerű és széleslevelű nem kívánatos növények irtására, anélkül, hogy a kukorica kultúr-növényt említésre méltóan károsítaná. Az összehasonlító vegyület, a chorimuron-ethyl megtámadja ugyan a széles növényeket, de már 0,03 kg hatóanyag/ha mennyiségnél erősen károsítja a kukoricát anélkül, hogy a fűszerű nem kívánatos növényeket kellőképpen kiirtaná. Az összehasonlító kísérlet a 41. példa szerinti vegyület jelentős előnyét mutatja.

4. táblázat

Gyomirtó hatás fűszerű és széleslevelű példa szerinti növényekre és elviselhetőség kukoricára, kinő

vés előtti alkalmazással, a 41. példa szerinti (vagyis a /XXX/ képletű) vegyület 0,04 kg hatóanyag/ha mennyiségével növényházban.

Kísérleti növények és károsodás, (%)

10

ZEAMX	0
ECHG	90
CHYCO	98
SOLNI	95

15

5. táblázat

Gyomirtó hatás kinövés előtti alkalmazással növényházban, a (XXXI) általános képletű vegyületekkel.

Példa	Hal	R ³	kg hatóanyag/ha	Kísérleti növények és károsodás, (%)		
				ECHCG	LOLMU	CHYCO
1.	Cl	CH ₃	0,03	95	98	98
80.	Cl	OCH ₃	0,03	95	100	100
93.	F	OCH ₃	0,06	95	90	100
16.	F	CH ₃	0,6	90	98	98

6. táblázat

Gyomirtó hatás fűszerű és széleslevelű növényekre kinövés utáni alkalmazással, növényházban, a (XVIII) általános képletű vegyületekkel.

Példa	Hal	R	kg hatóanyag/ha	ECHCH	Kísérletinövények és károsodás (%)			
					LOLMU	CHYCO	LAMAM	STEME
80.	Cl	OCH ₃	0,03	100	98	98	98	100
93.	F	OCH ₃	0,06	98	95	100	100	100
16.	F	CH ₃	0,06	98	95	100	100	98

7. táblázat

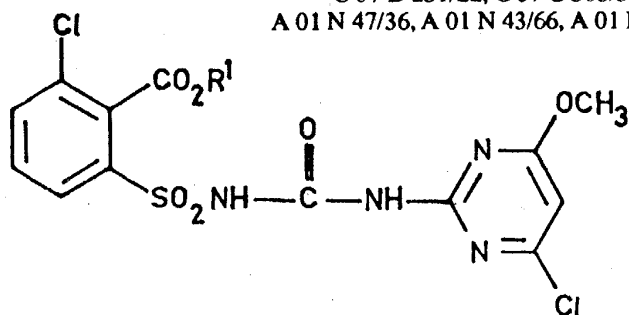
Nem kívánatos széleslevelű növények irtása kinövés utáni alkalmazással, a (XXXXII) általános képletű vegyületek 0,125 kg hatóanyag/ha mennyiségével, növényházban

Példa	Hal	Kísérleti növények és károsodás, (%)					
		AMARE	CHYCO	IPOSS	LAMAM	POLAV	CYPIR
	F	100	100	95	95	95	100
	Cl	98	98	98	95	90	100

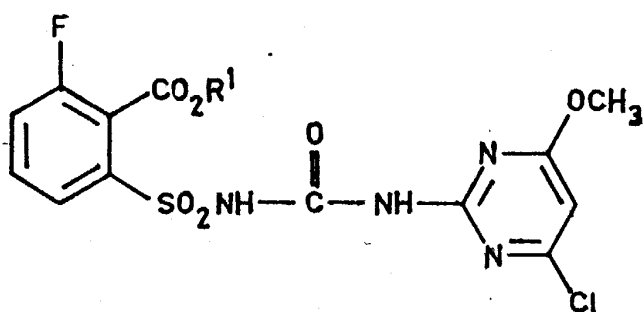
Az (I) általános képletű hatóanyagok növényi növekedést szabályozó hatásának meghatározásához a növényeket műanyag edényekben lévő (átmérő 12,5 cm, térfogat 500 ml), tápanyagokkal ellátott közegben tenyésztettük.

65

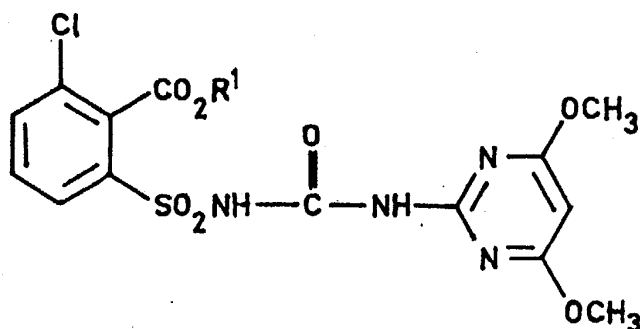
Kikelés utáni kezeléshez a II—V. példák szerint előállított készítményeket vízzel hígítva a növényekre permeteztük. A növekedést szabályozó hatást a növekedési magasság mérésével állapítottuk meg. A kapott értékeket kezeletlen növényeknél ka



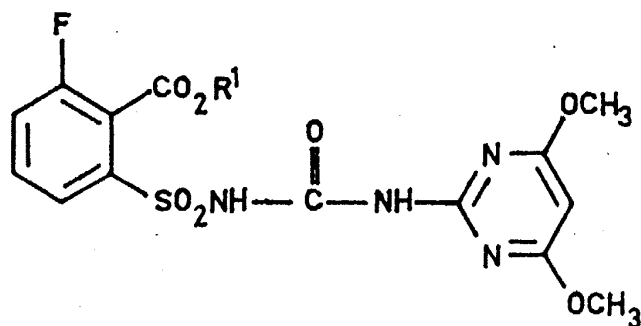
(XI)



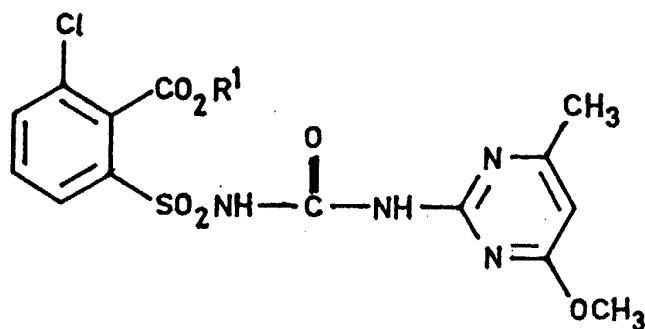
(XII)



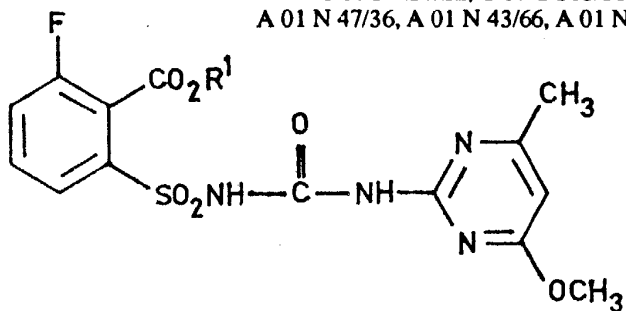
(XIII)



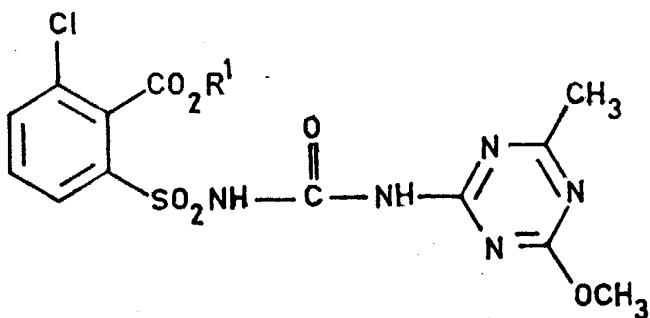
(XIV)



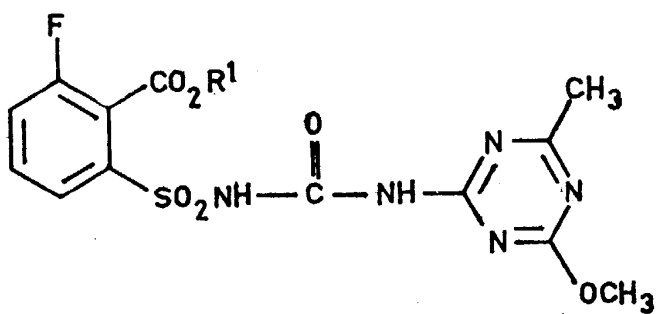
(XV)



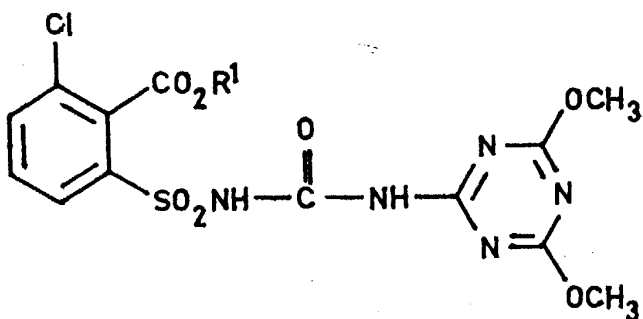
(XVI)



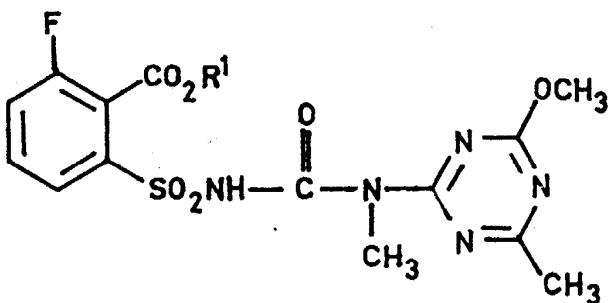
(XVII)



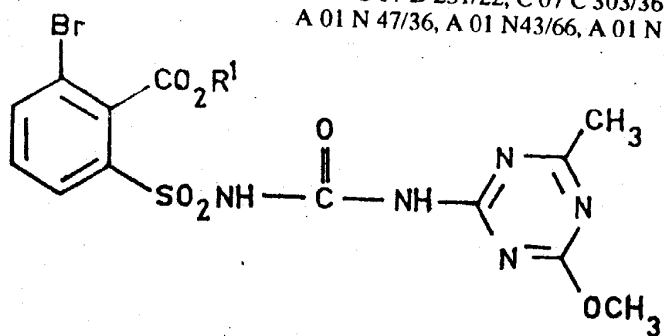
(XVIII)



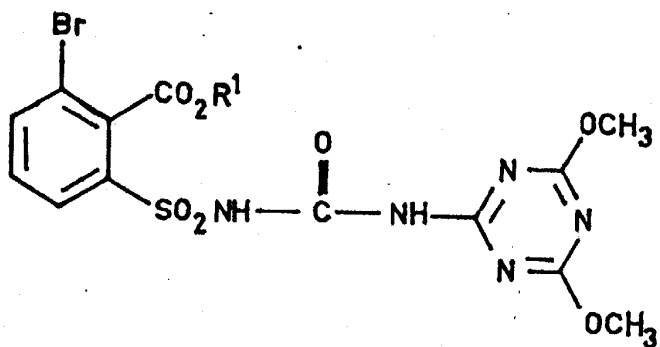
(XIX)



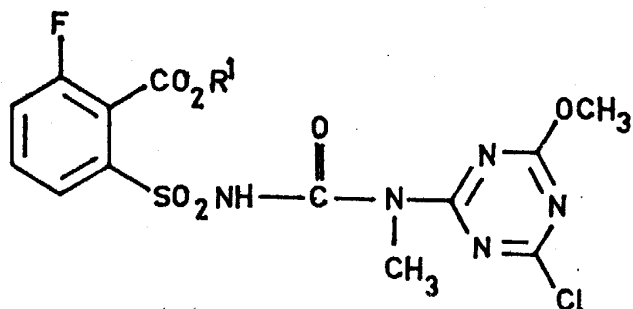
(XX)



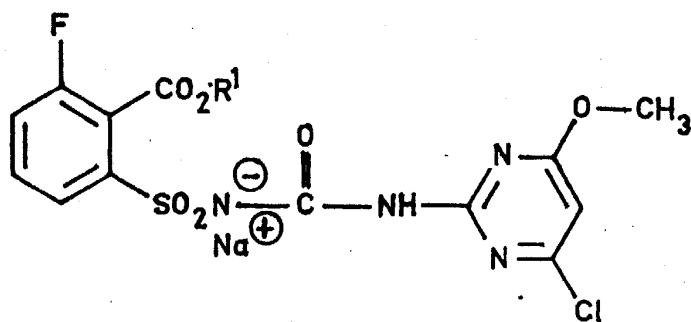
(XXI)



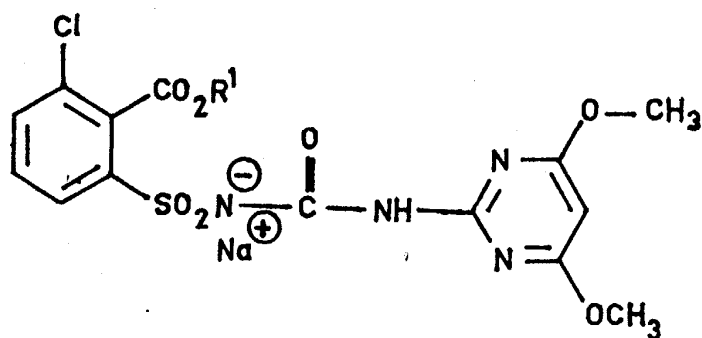
(XXII)



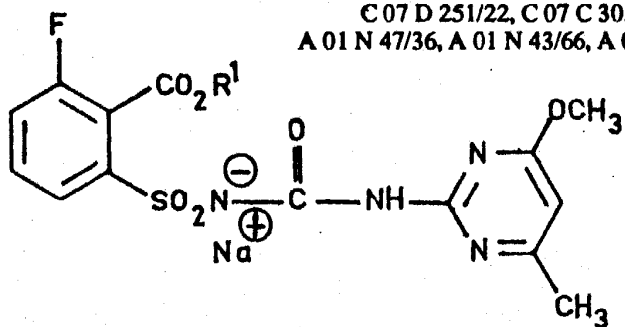
(XXIII)



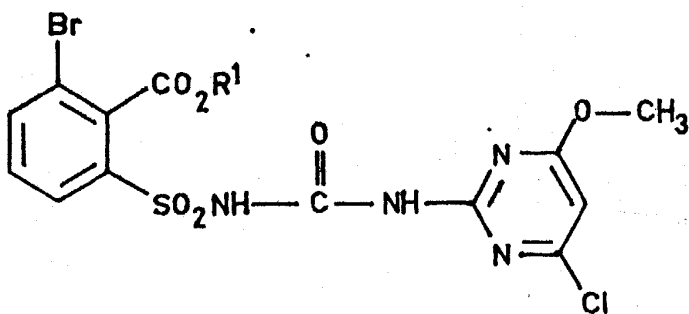
(XXIV)



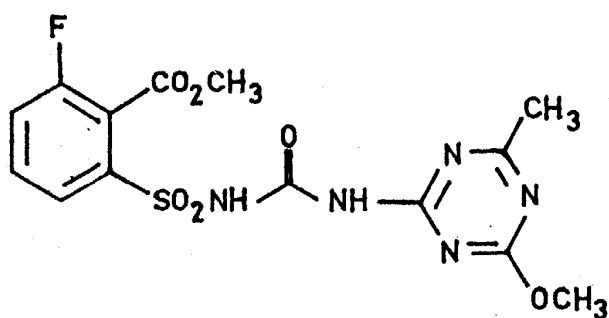
(XXV)



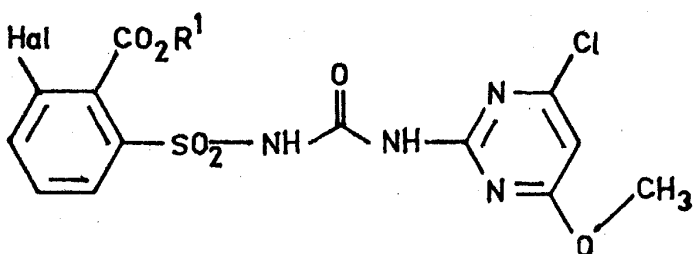
(XXVI)



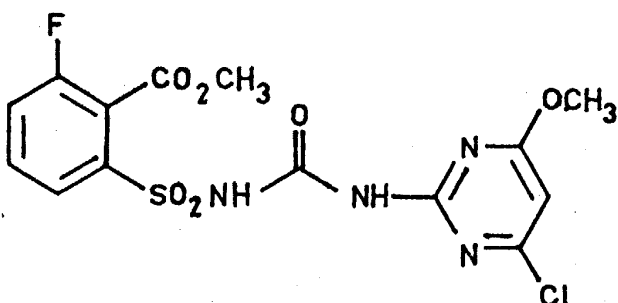
(XXVII)



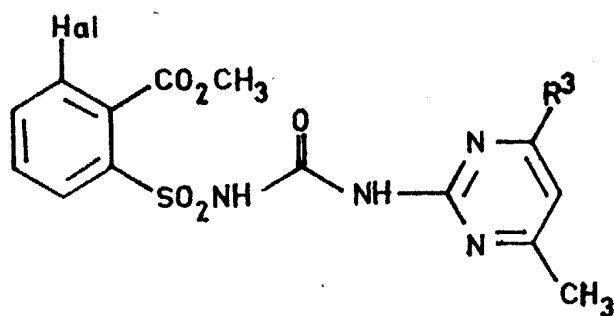
(XXVIII)



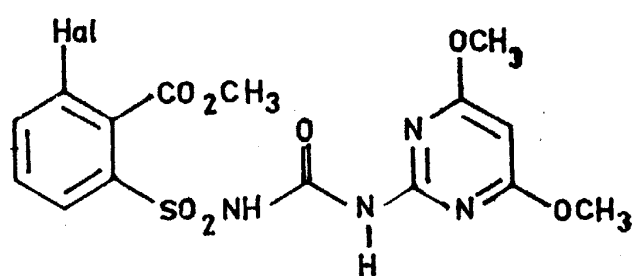
(XXIX)



(XXX)



(XXXI)



(XXXII)

