

(19) Országkód:

HU



**MAGYAR
KÖZTÁRSASÁG**

**MAGYAR
SZABADALMI
HIVATAL**

SZABADALMI LEÍRÁS

(11) Lajstromszám:

212 433 B

(21) A bejelentés ügyszáma: P 92 02531

(22) A bejelentés napja: 1992. 08. 04.

(30) Elsőbbségi adatok:

91/16833.6 1991. 08. 05. GB

850 424 1992. 03. 12. US

(51) Int. Cl.⁶

C 07 D 261/08

A 01 N 43/80

(40) A közzététel napja: 1993. 03. 01.

(45) A megadás meghirdetésének dátuma a Szabadalmi
Közlönyben: 1996. 06. 28.

(72) Feltalálók:

Cain, Paul Alfred, Ongar, Essex (GB)
Cramp, Susan Mary, Ongar, Essex (GB)

(73) Szabadalmas:

Rhone-Poulenc Agriculture Ltd., Ongar, Essex
(GB)

(54) **4-benzoil-izoxazol-származékokat tartalmazó herbicid készítmények,
eljárás a hatóanyagok előállítására és alkalmazásuk**

(57) KIVONAT

A találmány (I) általános képletű 4-benzoil-izoxazol-származékokat hatóanyagként tartalmazó herbicid készítményekre és a 4-benzoil-izoxazol-származékok előállítási eljárására vonatkozik. A 4-benzoil-izoxazol-származékokat az (I) általános képlettel írjuk le, amely képletben –

R¹ jelentése ciklopropil- vagy 1-metil-ciklopropil-csoport,

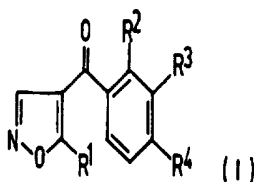
R² jelentése egyenes vagy elágazó láncú 1–4 szénatomos alkil- vagy alkoxicsoport,

R³ jelentése hidrogénatom, egyenes vagy elágazó láncú 1–4 szénatomos alkilcsoport vagy egyenes vagy elágazó láncú 1–4 szénatomos alkoxicsoport,

R⁴ jelentése –S(O)_nR általános képletű csoport, amely képletben

R jelentése 1–4 szénatomos alkilcsoport és

n jelentése 0, 1 vagy 2.



(1)

A találmány hatóanyagként új 4-benzoil-izoxazol-származékokat tartalmazó herbicid készítményekre, valamint az új 4-benzoil-izoxazol-származékok előállítási eljárására vonatkozik.

Az EP-A 0 418 175 számú szabadalmi leírásban bizonyos 4-benzoil-izoxazol-származékokat ismertetnek, ezek herbicid hatása azonban nem teljesen kielégítő. Ily módon szükség van további, az ismert vegyületek hatását felülmúló, nagy hatású herbicidek kifejlesztésére.

Az új 4-benzoil-izoxazol-származékokat az (I) általános képlettel írjuk le, amely képletben

R¹ jelentése ciklopropil- vagy 1-metil-ciklopropil-csoport,

R² jelentése egyenes vagy elágazó láncú 1-4 szénatomos alkil- vagy alkoxics csoport,

R³ jelentése hidrogénatom, halogénatom, egyenes vagy elágazó láncú 1-4 szénatomos alkilcsoport vagy egyenes vagy elágazó láncú 1-4 szénatomos alkoxics csoport,

R⁴ jelentése -S(O)_nR általános képletű csoport, amely képletben

R jelentése 1-4 szénatomos alkilcsoport és

n jelentése 0, 1 vagy 2.

A fenti (I) általános képletű vegyületek értékes herbicid tulajdonsággal rendelkeznek.

Az (I) általános képletű vegyületek sok tekintetben előnyösebb herbicid tulajdonságokkal rendelkeznek, mint több ismert vegyület.

Az (I) általános képletű vegyületek közül előnyösek herbicid tulajdonságaik alapján azok a vegyületek, amelyek képletében

a) R¹ jelentése ciklopropil- vagy 1-metil-ciklopropil-csoport, és/vagy

b) R² jelentése metil-, etil- vagy etoxics csoport, és/vagy

c) R³ jelentése hidrogén-, klór-, bróm- vagy fluoratom vagy metil-, metoxi- vagy etoxics csoport.

Előnyösek továbbá még azok az (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében

R¹ jelentése ciklopropil- vagy 1-metil-ciklopropil-csoport,

R² jelentése metil-, etil-, metoxi- vagy etoxics csoport, és

R³ jelentése hidrogén-, fluor-, klór- vagy brómatom, vagy metil-, metoxi-metilcsoport.

Előnyösek még továbbá azok az (I) általános képletű vegyületek is, amelyek képletében R¹ jelentése 1-metil-ciklopropil- vagy ciklopropilcsoport,

R² jelentése metil-, etil-, metoxi- vagy etoxics csoport, és

R³ hidrogén-, fluor-, klór- vagy brómatom, vagy metil- vagy metoxics csoport, és

R jelentése metilcsoport.

Előnyösek még azok az (I) általános képletű vegyületek is, amelyek képletében

R¹ jelentése ciklopropilcsoport,

R² jelentése metil- vagy metoxics csoport, és

R³ hidrogénatom vagy metoxics csoport azzal a megkövetéléssel, hogy R² és R³ egyidejűleg nem jelentenek metoxics csoportot, és

R jelentése metilcsoport.

Igen jó herbicid tulajdonságuk alapján példaképpen említjük a következő konkrét vegyületeket:

A) 5-ciklopropil-4-(2-metoxi-4-/metil-szulfenil/-benzoil)-izoxazol

B) 5-ciklopropil-4-(2-metoxi-4-/metil-szulfonil/-benzoil)-izoxazol

C) 5-ciklopropil-4-(2-metoxi-4-/metil-szulfenil/-benzoil)-izoxazol

5 D) 5-ciklopropil-4-(2-metil-4-/metil-szulfenil/-benzoil)-izoxazol

E) 5-ciklopropil-4-(2-metil-4-/metil-szulfonil/-benzoil)-izoxazol

10 F) 5-ciklopropil-4-(2-metil-4-/metil-szulfenil/-benzoil)-izoxazol

G) 5-(1-metil-ciklopropil)-4-(2-metil-4-/metil-szulfonil/-benzoil)-izoxazol

H) 4-(2-etil-4-/metil-szulfenil/-benzoil)-5-ciklopropil-izoxazol

15 I) 4-(2-etil-4-/metil-szulfenil/-benzoil)-5-ciklopropil-izoxazol

J) 4-(2-etil-4-/metil-szulfonil/-benzoil)-5-ciklopropil-izoxazol

20 K) 4-(2-etoxi-4-/metil-szulfenil/-benzoil)-5-ciklopropil-izoxazol

L) 4-(3-klór-2-metil-4-/metil-szulfenil/-benzoil)-5-ciklopropil-izoxazol

M) 4-(2-etil-4-/metil-szulfenil/-benzoil)-5-ciklopropil-izoxazol

25 N) 4-(3-klór-2-metil-4-/metil-szulfenil/-benzoil)-5-ciklopropil-izoxazol

O) 4-(3-klór-2-metil-4-/metil-szulfonil/-benzoil)-5-ciklopropil-izoxazol

30 P) 4-(2-metil-3-metoxi-4-/metil-szulfenil/-benzoil)-5-ciklopropil-izoxazol

Q) 4-(2-metil-3-metoxi-4-/metil-szulfonil/-benzoil)-5-ciklopropil-izoxazol

R) 4-(2,3-dimetil-4-/metil-szulfenil/-benzoil)-5-ciklopropil-izoxazol

35 S) 4-(2,3-dimetil-4-/metil-szulfenil/-benzoil)-5-ciklopropil-izoxazol

T) 4-(2,3-dimetil-4-/metil-szulfonil/-benzoil)-5-ciklopropil-izoxazol.

Az (I) általános képletű vegyületeket a találmány szerinti eljárással, például a következőkben leírtak szerint állítjuk elő.

Megjegyezzük, hogy a következőkben ismertetett eljárásokban az egyes lépéseket tetszés szerinti sorrendben végezhetjük, valamint szükség esetén alkalmas védőcsoportokat is alkalmazhatunk.

A találmány szerinti eljárással az (I) általános képletű vegyületeket például úgy állítjuk elő, hogy egy (II) általános képletű vegyületet – a képletben L jelentése lehasadócs csoport – egy hidroxil-amin-sóval reagáltatjuk.

50 Előnyösen hidroxil-amin-hidrokloridot alkalmazunk, L jelentése általában O-alkil-, így például etoxics csoport, vagy N,N-dialkil-amino-csoport, így például dimetil-amino-csoport. A reakciót általában oldószerben, így például etanolban vagy acetonitrilben végezzük, adott esetben bázis vagy savmegkötőszert, így például trietil-amin vagy nátrium-acetát jelenlétében.

Az (I) általános képletű vegyületek előállításánál felhasználásra kerülő kiindulási vegyületeket ismert módszerek szerint állítjuk elő.

A (II) általános képletű vegyületeket például előállíthatjuk egy (VI) általános képletű vegyület, valamint egy trialkil-orto-hangyasav-észter vagy egy dimetil-formamid vagy dialkil-acetál reagáltatásával. Általában trietil-orto-hangyasav-észtert vagy dimetil-formamid-dimetil-acetált alkalmazunk. A trialkil-orto-hangyasav-észterrel a reakciót általában ecetsavanhidrid jelenlétében a keverék visszafolytatási hőmérsékletén, a dimetil-formamid-dialkil-acetállal a reakciót adott esetben inert oldószer jelenlétében szobahőmérséklet és a visszafolytatási hőmérséklet közötti hőmérsékleten végezzük.

A (VI) általános képletű vegyületek előállítását az irodalom részletesen ismerteti.

Bizonyos (I) általános képletű vegyületeket úgy is előállíthatunk, hogy egy másik (I) általános képletű vegyület megfelelő csoportját alakítjuk át, ezek az utólagos lépések is a találmány oltalmi körébe tartoznak. Ilyen utólagos lépéseket ismertetünk a következőkben.

Az olyan (I) általános képletű vegyületet, amelynek képletében n értéke 1 vagy 2, úgy állítjuk elő, hogy egy olyan vegyületet, amelynek képletében n értéke 0, oxidálunk. A kénatom oxidációját általában például 3-klór-per-

oxi-benzoessavval végezhetjük inert oldószerben, így például diklór-metánban -40°C és szobahőmérséklet, például -40°C és 0°C közötti hőmérsékleten.

A következő példákban az (I) általános képletű vegyületek előállítását, a referencia példákban pedig a kiindulási vegyületek előállítását ismertetjük.

1. példa

A, E, F, G, H, K, M, P és R jelű vegyületek

7,87 g nátrium-acetátot elkeverünk 30,6 g 3 ciklopropil-2-(etoxi-metilén)-1-(2-metoxi-4-/metil-szulfenil/-fenil)-propán-1,3-diol-lal és 8 g hidroxil-amin-hidrokloriddal etanolban, majd a keveréket szobahőmérsékleten 1 éjszakán át keverjük. Ezután szárazra pároljuk, a visszamaradó anyagot etil-acetátban oldjuk, vízzel mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, szűrjük. A szűrletet ezután szárazra pároljuk, a maradékot éterrel elkeverjük, amikor 5-ciklopropil-4-(2-metoxi-4-/metil-szulfenil/-benzoi)-izoxazolt nyerünk fehér, szilárd anyag formájában, op. $107,5-108,5^{\circ}\text{C}$.

A fentiekkel azonos módon eljárva a megfelelően szubsztituált kiindulási anyagokból a következő (I) általános képletű vegyületeket állítjuk elő:

Vegy. jele	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	op./NMR
E	Cp	CH ₃	H	SO ₂ Me	86–87 °C
F	Cp	CH ₃	H	SMe	65–66 °C
G	1-Me-Cp	CH ₃	H	SO ₂ Me	87,5–88,5 °C
H	Cp	CH ₂ CH ₃	H	SMe	NMR (a)
K	Cp	OCH ₂ CH ₃	H	SMe	108,8–110,6 °C
M	Cp	CH ₃	Cl	SMe	157,4–158,2 °C
P	Cp	CH ₃	OCH ₃	SMe	106–107 °C
R	Cp	CH ₃	CH ₃	SMe	101,7–103,9 °C

Cp jelentése ciklopropilcsoport.

(a) ¹H-NMR (CDCl₃): d = 1,0 (m, 2H), 1,1, (t, 3H), 1,4 (m, 1H), 2,5 (s, 3H), 2,6 (m, 1H), 2,8 (q, 2H), 7,0 (dd, 1H), 7,1 (d, 1H), 7,3 (d, 1H), 8,3 (s, 1H).

2. példa

B, C, D, I, J, L, N, O, Q, S és T jelű vegyületek

3,4 g 3-klór-peroxi-benzoessavat elkeverünk diklór-metánban oldott 3,5 g 5-ciklopropil-4-(2-metoxi-4-/metil-szulfenil/-benzoi)-izoxazol-lal -15°C hőmérsékleten, majd a kapott keveréket ezen a hőmérsékleten még 1 órán át, majd szobahőmérsékleten 1 éjszakán át keverjük. A keveréket ezután -15°C -ra visszahűtjük, további 3,4 g 3-klór-peroxi-benzoessavat adagolunk, a keveréket szűrjük, a szűrletet vizes nátrium-metabiszulfát oldattal, majd vízzel mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk

és szűrjük. A szűrletet ezután szárazra pároljuk, a visszamaradó anyagot oszlop-kromatográfiával szilikagélén etil-acetáttal és hexánnal eluálva tisztítjuk, amikor 5-ciklopropil-4-(2-metoxi-4-/metil-szulfonil/-benzoi)-izoxazol-t (op. $133-113,5^{\circ}\text{C}$) és szürkésfehér, szilárd anyag formájában 0,85 g 5-ciklopropil-4-(2-metoxi-4-/metil-szulfenil/-benzoi)-izoxazol-t nyerünk, op. $100-102^{\circ}\text{C}$.

A fentiekkel azonos módon eljárva a megfelelő kiindulási anyagokból az alábbi (I) általános képletű vegyületeket állítjuk még elő:

Vegy. jele	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	op./NMR
D	Cp	CH ₃	H	S(O)Me	135–136,5 °C
I	Cp	CH ₂ CH ₃	H	S(O)Me	139,9–140,6 °C
J	Cp	CH ₂ CH ₃	H	SO ₂ Me	85,8–86,8 °C

Vegy. jele	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	op./NMR
L	Cp	OCH ₂ CH ₃	H	SO ₂ Me	101–103 °C
N	Cp	CH ₃	Cl	S(O)Me	78–79 °C
O	Cp	CH ₃	Cl	SO ₂ Me	137,6–138,2 °C
Q	Cp	CH ₃	OCH ₃	SO ₂ Me	147–148,7 °C
S	Cp	CH ₃	CH ₃	S(O)Me	114,3–117,9 °C
T	Cp	CH ₃	CH ₃	SO ₂ Me	139,9–140,2 °C

Cp jelentése ciklopropil.

1. referencia példa

25,4 g 3-ciklopropil-1-(2-metoxi-4-/metil-szulfenil/-fenil)-propán-1,3-dion-t elkeverünk 39 g trietil-or-
tohangyasav-észterrel ecetsavanhidridben és visszafolyatás közben melegítve 3 órán át keverjük. Ezután a keveréket lehűtjük, szárazra pároljuk, a visszamaradó anyagot toluolban oldjuk, majd ismételtén szárazra pároljuk, amikoris 30,6 g 3-ciklopropil-2-(etoxi-metilén)-1-(2-metoxi-4-/metil-szulfenil/-fenil)-propán-1,3-diol-t nyerünk, vöröses gumyszerű anyag formájában, amelyet tovább már nem tisztítunk.

A fentiekkel azonos módon eljárva a megfelelő szubsztituált kiindulási anyagokból a következő vegyületeket állítjuk még elő:

(IIa) általános képletű vegyületek

R ¹	R ²	R ³	R ⁴
ciklopropil	CH ₃	H	SO ₂ Me
ciklopropil	CH ₃	H	SMe
1-metil-ciklopropil	CH ₃	H	SO ₂ Me
ciklopropil	CH ₂ CH ₃	H	SMe

(IIb) általános képletű vegyületek

R ¹	R ²	R ³	R ⁴	¹ H-NMR
Cp	CH ₃	H	SO ₂ Me	(CDCl ₃); 0,8–1,3 (m, 4H), 1,5–1,9 (m, 1H), 1,5 (s, 3H), 3,0 (s, 3H), 5,8 (s, 1H), 7,5–8,1 (m, 3H).
Cp	CH ₃	H	SMe	(CDCl ₃); 0,8–1,2 (m, 4H), 1,4–1,8 (m, 1H), 2,45 (s, 6H), 5,8 (s, 1H), 6,7–7,5 (m, 3H).
1-Me-Cp	CH ₃	H	SO ₂ Me	(CDCl ₃); 0,7–1,1 (m, 2H), 1,2–1,5 (m, 5H), 2,4 (s, 3H), 3,0 (s, 3H), 5,75 (s, 1H), 7,4–7,8 (m, 3H).
Cp	CH ₂ CH ₃	H	SMe	–
Cp	OCH ₂ CH ₃	H	SMe	(CDCl ₃); 0,9 (m, 2H), 1,1 (m, 2H), 1,4 (t, 3H), 1,7 (m, 1H), 2,5 (s, 3H), 4,0 (q, 2H), 6,6 (s, 1H), 6,8 (m, 2H), 7,9 (m, 1H).
Cp	CH ₃	CH ₃	SMe	Op.: 79,1–80,2 °C

Cp jelentése ciklopropil.

3. referencia példa

2 ml szén-tetrakloridot elkeverünk metanolban szuszpendált 2,67 g magnéziummal, majd a kapott keveréket visszafolyatás közben 0,5 órán át keverjük. Ezután lehűtjük, majd hozzáadunk 18,8 g terc-butil-3-ciklopropil-3-oxo-propionátot és a kapott keveréket 0,5 órán át visszafolyatás közben keverjük. A keveréket ezután szárazra pároljuk, toluolt adunk a maradékhoz, majd ismételtén elpárologtatjuk és a visszamaradó anyagot acetonitrilben szuszpendáljuk. Ez-

R ¹	R ²	R ³	R ⁴
ciklopropil	OCH ₂ CH ₃	H	SMe
ciklopropil	CH ₃	Cl	SMe
ciklopropil	CH ₃	OCH ₃	SMe
°C	CH ₃	CH ₃	SMe

2. referencia példa

35,1 g t-butil-3-ciklopropil-2-(2-metoxi-4-/metil-szulfenil/-benzoi)-3-oxo-propionát-ot és 1,2 g 4-toluolszulfonsavat feloldunk toluolban, és 8 órán át visszafolyatás közben melegítjük. Ezután a keveréket lehűtjük, vízzel mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, szűrjük és a szűrletet szárazra pároljuk. Ily módon 25,8 g 3-ciklopropil-1-(2-metoxi-4-/metil-szulfenil/-fenil)-propán-1,3-dion-t nyerünk vörösszínű szilárd anyag formájában. ¹H-NMR (CDCl₃): 0,7–1,2 (m, 4H), 1,4–2,0 (m, 1H), 2,4 (s, 3H), 3,75 (s, 3H), 6,4 (s, 1H), 6,6 (s, 1H), 6,65 (d, 1H), és 7,65 (d, 1H).

A fentiekkel azonos módon eljárva a megfelelően szubsztituált kiindulási vegyületekből a következő vegyületeket állítottuk még elő:

után acetonitrilben oldott 21,8 g 2-metoxi-4-/metil-szulfenil/-benzoi-kloridot adunk hozzá és a kapott keveréket 4 órán át keverjük. Ezután szárazra pároljuk, a maradékot etil-acetátban oldjuk, vizes, 2 mólós sósavval, majd vízzel mossuk, vízmentes magnézium-szulfáton szárítjuk, szűrjük és a szűrletet betöményítjük. Ily módon 36 g t-butil-3-ciklopropil-2-(2-metoxi-4-/metil-szulfenil/-benzoi)-3-oxopropionát-ot nyerünk barna olaj formájában, amelyet tovább már nem tisztítunk.

A fentiekhez hasonló módon eljárva a megfelelően szubsztituált kiindulási vegyületekből a következő vegyületeket állíthatjuk még elő:

(IIc) általános képletű vegyületek

R ¹	R ²	R ³	R ⁴
ciklopropil	CH ₃	H	SO ₂ Me
ciklopropil	CH ₃	H	SMe
1-metil-ciklopropil	CH ₃	H	SO ₂ Me
ciklopropil	CH ₂ CH ₃	H	SMe
ciklopropil	OCH ₂ CH ₃	H	SMe
ciklopropil	CH ₃	CH ₃	SMe

4. referencia példa

6,5 g ciklopropil-metil-ketont elkeverünk 2,48 g tetrahydrofuránban szuszpendált nátrium-hidriddel inert atmoszférában, majd a keveréket 3,5 órán át keverjük. Ezután tetrahydrofuránban oldva 8,5 g etil-3-klór-2-metil-4-(metil-szulfenil)-benzoát-ot adagolunk és a kapott keveréket még 1 éjszakán át szobahőmérsékleten keverjük. Ezután a keveréket éterral hígítjuk, 2 mólos sósavat adunk hozzá, a rétegeket elválasztjuk, a szerves fázist vízzel mossuk, magnézium-szulfáton szárítjuk, majd szűrjük. A szűrletet szárazra pároljuk, a kapott nyers sárgaszínű szilárd anyagot oszlopkromatográfiával szilikagélén etil-acetát és petróleum (fp = 60–80 °C) elegyével eluálva tisztítjuk, amikor is 5,25 g 3-ciklopropil-1-(3-klór-2-metil-4-/metil-szulfenil/-fenil)-propán-1,3-diont nyerünk, sárga szilárd anyag formájában, op. 113–116 °C.

A fentiekkel azonos módon eljárva a következő vegyületet állítottuk még elő:

3-ciklopropil-1-(2-metil-3-metoxi-4-/etil-szulfenil/-fenil)-propán-1,3-dion;

¹H-NMR (CDCl₃): 0,1–1,2 (m, 4H), 1,6 (m, 1H), 2,3 (s, 3H), 2,4 (s, 3H), 3,7 (s, 3H), 5,8 (s, 1H), 7,2 (d, 1H), 16,0 (bs, 1H).

A benzoi-klorid-vegyületeket a megfelelően szubsztituált benzoésavakból állítjuk elő tionil-kloriddal 3 órán át a visszafolytatás hőmérsékletén való melegítéssel. A felesleges tionil-kloridot ezután elpárologtatjuk és a kapott benzoi-klorid-vegyületeket közvetlenül, további tisztítás nélkül alkalmazzuk.

A találmány oltalmi körébe tartozik a nemkívánatos növények irtása a növekedés helyén, amelynek során legalább egy (I) általános képletű izoxazol-származékot hatásos mennyiségben adagoljuk. Erre a célra az izoxazol-származékokat általában herbicid készítményeik formájában (azaz kompatibilis hígító vagy hordozó és/vagy felületaktív anyagokkal elkeverve) alkalmazzuk. Ezek a készítmények is a találmány oltalmi körébe tartoznak.

Az (I) általános képletű vegyületek herbicid hatásúak kétszikű (azaz széleslevelű) és egyszikű (azaz fűféle) gyomokkal szemben pre- és/vagy posztemergens felhasználás esetén.

A preemergens alkalmazása alatt azt értjük, hogy azt a talajt, ahol a gyomnövény magja vagy palántája

jelen van a kikelés előtt, a felületen kezeljük. A posztemergens felhasználás alatt azt értjük, hogy a kezelést a területre vagy a károsodott részre a gyomnövény kikelése után vesszük fel. Így például az (I) általános képletű vegyületek alkalmasak a következő gyomnövények elpusztítására:

- széleslevelű gyomnövények, így például a következők: Abutilon theophrasti, Amaranthus retroflexus, Bidens pilosa, Chenopodium album, Galium aparine, Ipomoea spp, pl. Ipomoea purpurea, Sesbania exaltata, Sinapis arvensis, Solanum nigrum, és Xanthium strumarium, és
- fűféle gyomnövények, így például a következők: Alopecurus myosuroides, Avena fatua, Digitaria sanguinalis, Echinochola crus-galli, Sorghum bicolor, Eleusine indica és Setaria spp, pl. Setaria faberii vagy Setaria viridis, és
- nádféle gyomok, így például a következő: Cyperus esculentus.

- 20 Az (I) általános képletű vegyületek mennyisége függ a gyom fajtájától, a felvitelre kerülő készítménytől, az alkalmazás idejétől, a klimatikus, valamint földrajzi viszonyoktól és amennyiben a gyomirtást termőterületen végezzük, a termény természetétől is. Ha a
- 25 gyomirtást termőterületen végezzük, az alkalmazott mennyiség elegendő kell, hogy legyen a gyom kiirtására anélkül azonban, hogy a terményen észrevehető károsodást okozzon. Figyelembe véve ezeket a faktorokat, általában a hatóanyagot 0,01 kg–5 kg/ha mennyiségben alkalmazzuk. Természetesen azonban adott körülmények figyelembevételével ennél magasabb vagy
- 30 alacsonyabb mennyiség is elegendő lehet.

Az (I) általános képletű vegyületeket tartalmazó készítmények alkalmazhatók gyomok szelektív irtására, így például az előzőekben megemlített fajták esetében pre- vagy posztemergens adagolás esetén nem direkt felvitellel egyaránt, például direkt vagy nem-direkt permetezéssel, a gyom előfordulási helyén vagy a termőterületen, így például a következő termények esetében: gabonafélék, így például búza, árpa, rozs, kukorica vagy rizs, továbbá szójabab, lóbab, cukorbab, borsó, lucerna, gyapot, mogyoró, len hagyma, sárgarépa, káposzta, olajbogyó, napraforgó, cukorrépa esetén, továbbá természetes és ültetett pázsitok kikelése előtt és

45 után egyaránt. Szelektív gyomirtásra termőterületeken például a fentiekben említett termények esetében a felhasználás mértéke 0,01–4 kg, előnyösen 0,01 kg–2 kg hatóanyag hektáronként.

- 50 Az (I) általános képletű vegyületeket tartalmazó készítmények alkalmazhatók továbbá gyomirtásra pre- vagy posztemergens módon egyaránt gyümölcsösökben vagy más egyéb faültvényekben, például erdőkben, parkokban, faiskolákban, így például cukornád, pálma, valamint gumiültvényekben. Erre a célra a hatóanyagot direkt vagy nem-direkt módon alkalmazzuk (például direkt vagy nem-direkt permetezéssel) közvetlen a gyomra vagy a talajra, ahol a gyom várhatóan megjelenik, a fák ültetése előtt vagy után, a használt dózis általában 0,25 kg–5 kg, előnyösen
- 60 0,5 kg–4 kg hatóanyag hektáronként.

Az (I) általános képletű vegyületeket tartalmazó készítmények használhatók továbbá gyomirtásra a fentiekben említett területeken kívül olyan helyeken is, amelyek nem termőterületek, de ahol a gyomok növekedése nem lenne kívánatos.

Ilyen nem-termő területként említjük például a következőket: repülőterek, ipari létesítmények, vasutak, műutak, valamint folyók szélei, csatornák és más öntözési területek, továbbá bozótosok és parlagon lévő vagy műveletlen földek, különösen azok, amelyeknél a gyomok növekedésének szabályozása különösen kívánatos, hogy a tűzveszélyt csökkentsük. Amennyiben a cél a totális gyomirtás, a hatóanyagot általában a fentiekben a termőterületekre megadott dózisoknál magasabb mennyiségben alkalmazzuk. A pontos dózis függ általában a kezelni kívánt vegetáció természetétől, valamint a kívánt hatástól.

Erre a célra általában pre- vagy posztemergens felhasználás esetén, előnyösen preemergens felhasználásnál direkt vagy nem-direkt felvitellel (például direkt vagy nem-direkt permetezéssel) 1 kg–20 kg, előnyösen 5 kg–10 kg hatóanyagot viszünk fel hektáronként.

Preemergens módon végzett gyomirtásnál az (I) általános képletű vegyületeket közvetlenül a talajba is bedolgozhatjuk, amelyben a gyomok várhatóan megjelennek. Természetesen azonban, hogy amennyiben az (I) általános képletű vegyületeket posztemergens módon alkalmazzuk, azaz a hatóanyagot a kikelt gyomokra vagy a kikelt gyomokat tartalmazó területre viszük fel, az (I) általános képletű vegyületek érintkezésbe kerülnek a talajjal és ily módon a később kikelt gyomnövények esetében ez preemergens kezelést jelent.

Amennyiben különösen hosszantartó gyomirtás szükséges, az (I) általános képletű vegyületekkel végzett kezelést kívánt esetben megismételhetjük.

A találmány oltalmi körébe tartoznak a hatóanyagként egy vagy több (I) általános képletű izoxazol-származékokat tartalmazó készítmények is, amelyeknél a hatóanyag egy vagy több kompatibilis, növények számára elfogadható hígítóanyaggal vagy hordozóanyaggal és/vagy felületaktív anyaggal, van elkeverve. Az említett hígítóanyagok, hordozóanyagok és/vagy felületaktív anyagok általában olyan típusúak, amelyeket a herbicid készítmények esetében széles körben alkalmaznak és amelyek az (I) általános képletű vegyülettel kompatibilisek. A készítmények homogén diszperziók, de ezek körébe tartoznak természetesen azok a készítmények is, amelyekben az (I) általános képletű vegyület valamely komponensben oldott formában van jelen. A találmány szerinti herbicid készítményeket tág formában kell értelmezni, tehát ezek a készítmények nemcsak a felhasználásra kész herbicideket foglalják magukba, hanem azon koncentrátumokat is, amelyeket felhasználás előtt hígítani kell. A találmány szerinti készítmények általában 0,05–90 tömeg% egy vagy több (I) általános képletű hatóanyagot tartalmaznak.

A találmány szerinti herbicid készítmények tartalmazhatnak hígítóanyagot vagy hordozóanyagot és felületaktív anyagot, így például nedvesítő, diszpergáló

vagy emulgeáló szert. A felületaktív anyag lehet ionos vagy nemionos típusú, így például szulforicin-oleátok, kvaterner ammónium-származékok, etilén-oxid és alkil- és poliaril-fenol vegyületek kondenzátumai, így például nonil- vagy oktil-fenollokkal nyert kondenzátumok, továbbá anhidroszorbitolok karbonsavészterei, amelyeket a szabad hidroxicsoportok éterezésével oldhatóvá tettünk, továbbá lehetnek kénsav-észterek, valamint szulfonsavak, alkálifém- vagy alkáliföldfém-sói, így például dinonil- és dioktil-nátrium-szulfoszukcinátok, valamint nagy molekulatömegű szulfonsav-származékok alkálifém- és alkáliföldfém-sói, így például nátrium- és kalcium-lignoszulfonátok, valamint nátrium- és kalcium-alkil-benzolszulfonátok.

A találmány szerinti herbicid készítmények előnyösen legfeljebb 10 tömeg%, így például 0,05–10 tömeg% felületaktív anyagot tartalmaznak, de kívánt esetben természetesen ezek mennyisége több is lehet, így például folyékony emulgeálható szuszpenzió koncentrátumok esetében 15 tömeg% vagy folyékony vízoldható koncentrátumok esetén 25 tömeg%.

A találmány szerinti készítményeknél szilárd hígító- vagy hordozóanyagként például a következőket alkalmazhatjuk: alumínium-szilikátok, talkum, kalcinált magnézium-oxid, szilikagél, trikálcium-foszfát, porított parafa, aktív szén, továbbá agyagok, például kaolin vagy bentonit. A szilárd készítmények, így például a porok, granulátumok vagy nedvesíthető porok előállítását általában úgy végezzük, hogy az (I) általános képletű vegyületeket szilárd hígítóanyaggal együtt őrljük vagy a szilárd hordozó- vagy hígítóanyagot az illékony oldószerttel képzett hatóanyag oldattal impregnáljuk, majd az oldószert elpárologtatjuk és szükség esetén a kapott terméket még porítjuk. A granulátum készítményeket úgy állítjuk elő, hogy az (I) általános képletű vegyületet kívánt esetben illékony oldószerttel készült oldata formájában a szilárd hígító- vagy hordozóanyagon adszorbeáltatjuk, majd az oldószert eltávolítjuk ha szükséges. Előállíthatjuk ezeket a granulátum készítményeket a fentiek szerinti por készítményekből is. A szilárd herbicid készítmények, különösen a nedvesíthető porok és granulátumok tartalmazhatnak nedvesítő vagy diszpergáló szereket, amelyek szintén lehetnek szilárdak is és szolgálhatnak hordozóként vagy hígítóanyagként egyaránt.

A találmány szerinti folyékony készítmények lehetnek vizes, szerves vagy vizes-szerves oldószeres oldatok, szuszpenziók és emulziók, amelyek felületaktív anyagot tartalmazhatnak. Folyékony hígítóként például a következőket alkalmazhatjuk: víz, glikolok, tetrahidrofurfuril-alkohol, acetofenon, ciklohexanon, izoforon, toluol, xilol, ásványi-, állati- és növényi eredetű olajok, valamint petróleum könnyű aromás és naftén frakciói, valamint ezek keverékei. Felületaktív anyagként ionos vagy nemionos, például valamely fentiekben említett, anyagot alkalmazhatunk, amely folyadékok hígító vagy hordozóanyagként is szolgálhatnak.

A porokat diszpergálható granulátumokat vagy folyékony koncentrátumokat vízzel vagy más hígító-

anyaggal, így például ásványi vagy növényi olajokkal hígíthatjuk, különösen azokat, amelyekben hígítóként vagy hordozóként olajat alkalmaztunk. Ily módon felhasználásra kész készítményeket nyerünk.

Kívánt esetben a folyékony készítmények lehetnek ön-emulgeáló koncentrátumok is, amelyek a hatóanyagot emulgeálószerben vagy emulgeálószer tartalmazó oldószerben oldják, majd az így kapott koncentrátumot vízzel való egyszerű elkeveréssel felhasználásra kész készítménnyé alakítjuk.

Hígítóanyagként vagy hordozóanyagként olajat tartalmazó folyékony koncentrátumokat további hígítás nélkül is alkalmazhatunk például elektrosztatikus permetezési eljárás alkalmazásával.

A találmány szerinti herbicid készítmények kívánt esetben még további adalékokat is tartalmazhatnak, így például tapadást elősegítő anyagokat, védőkolloidokat, sűrítőanyagokat, penetrációt elősegítő szereket, stabilizátorokat, különböző semlegesítő anyagokat, tapadást gátló szereket, továbbá színezőanyagokat és korróziógátló anyagokat is. Ezek az adalékanyagok szintén szolgálhatnak hordozóanyagként vagy hígítóanyagként.

A következő készítmény előállítási példákban a megadott %-os értékek minden esetben tömeg%-ot jelentenek.

Előnyös találmány szerinti készítmények a következők:

- vizes szuszpenzió koncentrátum, amely 10–70% egy vagy több (I) általános képletű vegyületet, 2–10% felületaktív anyagot, 0,1–5% sűrítőanyagot, és 15–87,9% vizet tartalmaz,
- nedvesíthető porkészítmény, amely 1–90% egy vagy több (I) általános képletű hatóanyagot, 2–10% felületaktív anyagot, 8–88% szilárd hígító- vagy hordozóanyagot tartalmaz,
- oldható porkészítmény, amely 10–90% egy vagy több (I) általános képletű vegyületet, 2–40 tömeg% nátrium-karbonátot és 0–88 tömeg% szilárd hígítóanyagot tartalmaz,
- folyékony vízzeloldható koncentrátum, amely 5–50%, előnyösen 10–30% egy vagy több (I) általános képletű vegyületet, 5–25% felületaktív anyagot és 25–90%, előnyösen 45–85% vízzel elkeverhető oldószert, így például dimetilformamidot vagy vízzel elkeverhető oldószer és víz elegyét tartalmazza,
- folyékony emulgeálható szuszpenzió koncentrátum, amely 10–70% egy vagy több (I) általános képletű vegyületet, 5–15% felületaktív anyagot, 0,1–5% sűrítőanyagot és 10–84,9% szerves oldószert tartalmaz,
- granulátum készítmény, amely 1–90%, előnyösen 2–10% egy vagy több (I) általános képletű hatóanyagot, 0,5–7%, előnyösen 0,5–2% felületaktív anyagot és 3–98,5%, előnyösen 88–97,5% granulált hordozóanyagot tartalmaz, és
- emulgeálható koncentrátum, amely 0,05–90%, előnyösen 1–60% egy vagy több (I) általános képletű vegyületet 0,01–10%, előnyösen 1–10%

felületaktív anyagot és 9,99–99,94%, előnyösen 39–98,99% szerves oldószert tartalmaz.

A találmány szerinti herbicid készítmények összekeverhetők egy vagy több más peszticid hatású vegyülettel is, valamint tartalmaznak egy vagy több hígító- vagy hordozóanyagot, felületaktív anyagot, vagy egyéb fentiek szerinti ismert adalékanyagot. Példaképpen peszticid vegyületként megemlíjtük a következő vegyületeket: herbicid anyagok, így például alaclór [2-klór-2,6'-dietil-N-(metoxi-metil)-acetanilid], atrazin [2-klór-4-(etil-amino)-6-(izopropil-amino)-1,3,5-triazin], bromoxinil [3,5-dibrom-4-hidroxibenzonitril], klóratom [N'-(3-klór-4-metil-fenil)-N,N-dimetil-karbamid], cianazin [2-klór-4-(1-ciano-1-metil-etil-amino)-amino-1,3,5-triazin], 2,4-D [2,4-diklór-fenoxi-ecetsav], dikamba [3,6-diklór-2-metoxibenzoesav], difenzokvat [1,2-dimetil-3,5-difenilpirazólium-só], flamprop-metil [metil-N-2-(N-benzil-3-klór-4-fluoro-anilino)-propionát], fluometuron [N'-(3-trifluor-metil-fenil)-N,N-dimetil-karbamid], izoproturon [N'-(4-izopropil-fenil)-N,N-dimetil-karbamid]; inszekticidok, így például szintetikus piretroidok, például permetrin és cipermetrin, továbbá fungicidok, például karbamátok, így például metil-N-(1-butil-karbamoil)-benzimidazol-2-il)-karbamát, triazolok, például 1-(4-klór-fenoxi)-3,3-dimetil-1-(1,2,4-triazol-1-il)-bután-2-on.

A találmány szerinti készítményekhez keverhető különböző egyéb peszticid hatású anyagokat vagy más biológiailag aktív anyagokat, így például a fentiekben felsorolt konkrét vegyületeket ismert származékaik, így például alkálifém-sóik, aminosók vagy észterek formájában is alkalmazhatjuk.

A találmány oltalmi körébe tartoznak továbbá azon termékek is, amelyek legalább egy (I) általános képletű izoxazol-származékot tartalmaznak és amely nevezett termékek legalább egy (I) általános képletű vegyületet vagy legalább egy (I) általános képletű vegyületet tartalmazó fentiekben részletezett herbicid készítményt tartalmaznak egy tartályban. Ezek a tartályok általában a kémiai anyagok tárolására szokásosan ismert tartályok, amelyek normál környezeti hőmérsékleten szilárdak, így például lehetnek a következők: fémből vagy műanyagból készült kannák és hordók, műanyagból vagy üvegből készült edények, továbbá kartonpapírból, műanyagból vagy fémből készült dobozok vagy zsákok. Ezen tartályok térfogata általában akkora, hogy kb. 0,4 ha (1 acre) nagyságú terület gyomirtása legyen elvégezhető a benne lévő anyaggal, de a mérete előnyösen olyan kell, hogy legyen, hogy a kezelése még egyszerűen történhessen. A kezelési utasítás rajta kell, hogy legyen a tartályon, így például nyomtatott formában közvetlenül ráragasztva vagy hozzárögzített táblán. Ezek az utasítások általában jelzik a tartály tartalmát, és szükség esetén hígítás után felvihetők a kívánt területre általában 0,01 kg és 20 kg hatóanyag/hektár mennyiségben az előírt módon.

A következő példában néhány konkrét találmány szerinti herbicid készítményt mutatunk be.

*C1 példa**Oldható koncentrátum*

Összetétel:

A jelű hatóanyag	10 ttf%
Kálium-hidroxid oldat, 33 t/tf%	10 t%
Tetrahidrofurfuril-alkohol (THFA)	10 t%
Víz	100%-ig

A készítményt úgy állítjuk elő, hogy a THFA-t a hatóanyagokat és a víz 90%-át elkeverjük, majd lassan hozzáadagoljuk a kálium-hidroxidot, amíg a pH a 7-8 közötti értéket eléri, majd a keveréket a maradék vízzel kiegészítjük.

Hasonló oldható készítményt állítunk elő, ha az A jelű vegyületet valamely más (I) általános képletű vegyülettel helyettesítjük.

*C2 példa**Nedvesíthető porkészítmény*

Összetétel:

A jelű vegyület	50 t%
Nátrium-dodecil-benzolszulfonát	3 t%
Nátrium-lignoszulfát	5 t%
Nátrium-formaldehid-alkil-naftalin-szulfonát	2 t%
Nagyfinomságú szilícium-dioxid	3 t%
Agyag	37 t%

A készítményt a fenti alkotók összekeverésével, majd légbefúvásos malomban való őrlésével állítjuk elő.

Hasonló nedvesíthető porkészítményt állítunk elő, ha az A jelű vegyület helyett más (I) általános képletű vegyületet alkalmazunk.

*C3 példa**Vízben oldható porkészítmény*

Összetétel:

A jelű vegyület	50 t%
Nátrium-dodecil-benzolszulfonát	1 t%
Nagyfinomságú szilícium-dioxid	2 t%
Nátrium-hidrogén-karbonát	47 t%

A készítményt a fenti alkotók elkeverésével, majd kalapácsos malomban való őrlésével nyerjük.

Hasonló oldható porkészítményt állítunk elő, ha az A jelű vegyületet valamely más, (I) általános képletű vegyülettel helyettesítünk.

*Herbicid hatás vizsgálata**a) A vizsgálatok kivitelezése*

A vizsgálandó vegyületek megfelelő mennyiségét acetonnal oldottuk, amikor olyan oldatot nyerünk, amellyel 4000 g hatóanyagot viszünk ki 1 ha területre. Az így kapott oldatokat standard laboratóriumi permetező segítségével visszük fel, 290 l permetlét 1 ha-ra.

b) Preemergens gyomirtás

A magokat 70 mm² területre 75 mm mélységben műanyag cserepekbe ültettük nem-steril talajba. A cserepenként felhasznált magok mennyisége a következő volt:

Gyomnövény fajtája	Magok kb. száma/cserép
1. Széleslevelű gyomok	
Abutilon theophrasti	10
Amaranthus retroflexus	20
Galium aparine	10
Ipomoea purpurea	10
Sinapis arvensis	15
Xanthium-strumarium	2
2. Fűszerű gyomok	
Alopecurus myosurides	15
Avena fatua	10
Echinochloa crus-galli	15
Setaria viridis	20
3. Sászerű gyomok	
Cyperus esculentus	3
Termények	Magok kb. száma/cserép
1. Széleslevelű	
Gyapot	3
Szója	3
2. Fűszerűek	
Kukorica	2
Rizs	6
Búza	6

A találmány szerinti hatóanyagokat a talaj felületére visszük, az előző a) pontban leírtak szerint. Minden terményt és gyomnövényt tartalmazó edényhez egy nem kezelt kontrollt rendelünk, amelynél a permetezést csak acetonnal végeztük.

A kezelésnek elvégzése után az edényeket kapilláris, rostos anyagra helyeztük üvegházban és felülről öntöztük. A termények károsodását 20-24 nappal a permetezés után vizuálisan értékeltük ki. A kapott eredményeket a növekedés csökkenésének százalékában, vagy a növény vagy mag károsodásának százalékában fejeztük ki, összehasonlítva a kontroll edénnyel.

c) Posztemergens gyomirtás

A gommagokat és a terménymagokat közvetlenül John Innes ültetőkomposztba ültettük 75 mm mélységben 70 mm² felületű edénybe, kivéve az Amaranthus-t, amelyet a palánta állapotban kivettünk és ültetőedénybe helyeztünk 1 hétre a permetezés előtt. A növényeket ezután üvegházban tartottuk addig, amíg megfelelő stádiumot értek el a kezeléshez. A növények száma edényenként a következő volt:

Gyomnövény fajtája	Növények száma	Növekedési állapot
1. Széles levelű gyomok		
Abutilon theophrasti	3	1-2 leveles
Amaranthus retroflexus	4	1-2 leveles

Gyomnövény fajtája	Növények száma	Növekedési állapot
1. Széles levelű gyomok		
Galium aparine	3	1-ső örvös
Ipomoea purpurea	3	1-2 leveles
Sinapis arvensis	4	2 leveles
Xanthium strumarium	1	2-3 leveles
2. Fűszerű gyomok		
Alopecurus myosuroides	8-12	1-2 leveles
Avena fatua	12-18	1-2 leveles
Echinochloa crus-galli	4	2-3 leveles
Setaria viridis	15-25	1-2 leveles
3. Sászerű gyomok		
Cyperus esculentus	3	3 leveles

Termények	Növények száma	Növekedési állapot
1. Széleslevelű		
Gyapot	2	1 leveles
Szója	2	2 leveles
2. Fűszerűek		
Kukorica	2	2-3 leveles
Rizs	4	2-3 leveles
Búza	5	2-3 leveles

A növények kezeléséhez a hatóanyagokat az előző a) pontban leírtak szerint visszük fel. Minden egyes terményt és gyomnövényt tartalmazó edényhez kezelten kontrollt rendeltünk, amelynél a permetezéshez csak acetont alkalmaztunk.

A kezelés után az edényeket kapilláris hatású rostos anyagra helyeztük üvegházban és 24 óra elteltével egyszer felülről megöntöztük, majd utána szabályozott módon alulról végeztük az öntözést. A termények károsodását és a gyomnövények pusztulását 20-24 órával a permetezés után vizuálisan értékeltük. Az eredményeket a növekedés százalékos csökkenésében, vagy a termények és gyomnövények károsodásának százalékában fejeztük ki a kontrollhoz viszonyítva.

A találmány szerinti vegyületek 4 kg/ha vagy ennél kisebb dózissal kiváló herbicid hatást mutatnak, a terményekkel szembeni elviselhetőségük nagyon jó.

Pre- és posztemergens alkalmazásánál az A-T jelű vegyületek <1000 g/ha hatóanyag mennyiség esetén legalább 90%-os mértékben gátolják egy vagy többfajta gyomnövény növekedését.

A következő 1-2. táblázatokban összefoglaljuk az A-T valamint az A1-A27 jelű találmány szerinti vegyületek ED₉₀ értékeit Echinochloa crus-galli (ECHCG) gyomnövényt szemben összehasonlítva az EP-A 0 418 175 számú szabadalmi leírásból ismert P61-P64-P65 jelű vegyületekkel.

1. táblázat

A találmány szerinti vegyületek ED₉₀ értékeinek összehasonlítása ismert vegyületekével

	Vegy. jele	R ¹	R ²	R ³	S(O) _n R ⁴	ECHCG
5	A	cPr	OMe	H	SMe	16
	B	cPr	OMe	H	SO ₂ Me	<16
	C	cPr	OMe	H	SOMe	156
10	D	cPr	Me	H	SOMe	62
	E	cPr	Me	H	SO ₂ Me	<16
	F	cPr	Me	H	SMe	39
15	G	1-Me-cPr	Me	H	SO ₂ Me	16
	H	cPr	Et	H	SMe	156
	I	cPr	Et	H	SOMe	34
20	J	cPr	Et	H	SO ₂ Me	39
	K	cPr	OEt	H	SMe	238
	L	cPr	OEt	H	SO ₂ Me	702
	M	cPr	Me	Cl	SMe	278
25	N	cPr	Me	Cl	SOMe	250
	O	cPr	Me	Cl	SO ₂ Me	97
	P	cPr	Me	OMe	SMe	62
	Q	cPr	Me	OMe	SO ₂ Me	106
30	R	cPr	Me	Me	SMe	62
	S	cPr	Me	Me	SOMe	24
	T	cPr	Me	Me	SO ₂ Me	16
	P61	Me	Me	CO ₂ Me	SO ₂ Me	>1000
35	P64	Me	Me	CO ₂ iPr	SO ₂ Mc	1000
	P65	cPr	Me	CO ₂ iPr	SO ₂ Me	625

P61 4-(3-/Metoxi-karbonil/-2-metil-4-/metil-szulfonil/-benzoi)-5-metil-izoxazol

40 P64 5-Metil-4-[2-metil-3-(1-metil-etoxi-karbonil)-4-(metil-szulfonil)-benzoi]-izoxazol

P65 5-Ciklopropil-4-[2-metil-3-(1-metil-etoxi-karbonil)-4-(metil-szulfonil)-benzoi]-izoxazol

2. táblázat

A találmány szerinti vegyületek ED₉₀ értékeinek összehasonlítása ismert vegyületekével

	Vegy. jele	R ¹	R ²	R ³	S(O) _n R ⁴	ECHCG
50	A1	cPr	Me	F	SMe	<16
	A2	cPr	Me	F	SOMe	213
	A3	cPr	Me	F	SO ₂ Me	250
	A4	cPr	Me	H	SEt	136
55	A5	cPr	Me	Me	SEt	16
	A6	cPr	Et	H	SEt	69
	A7	cPr	Et	F	SMe	35
	A8	cPr	Et	F	SOMe	54
60	A9	cPr	Et	F	SO ₂ Me	31

Vegy. jele	R ¹	R ²	R ³	S(O) _n R ⁴	ECHCG
A10	cPr	izoPr	H	SMe	<16
A11	cPr	izoPr	H	SEt	31
A12	cPr	Me	H	SO ₂ Et	34
A13	cPr	Me	H	SOEt	<16
A14	cPr	Me	Me	SO ₂ Et	16
A15	cPr	Et	H	SOEt	54
A16	cPr	Et	H	SO ₂ Et	31
A17	cPr	Et	Me	SMe	16
A18	Cpr	Et	Me	SEt	63
A19	cPr	Et	Me	SOEt	249
A20	cPr	Et	Me	SOMe	63
A21	cPr	izoPr	H	SO ₂ Me	<16
A22	cPr	izoPr	H	SOMe	16
A23	cPr	Et	Me	SO ₂ Et	<16
A24	cPr	Et	Me	SO ₂ Me	249
A25	cPr	izoPr	H	SO ₂ Et	85
A26	cPr	izoPr	H	SOEt	16
A27	cPr	izoBu	H	SME	<16
P61	Me	Me	CO ₂ Me	SO ₂ Me	>1000
P64	Me	Me	CO ₂ iPr	SO ₂ Me	1000
P65	cPr	Me	CO ₂ iPr	SO ₂ Me	625

SZABADALMI IGÉNYPONTOK

1. Eljárás (I) általános képletű vegyületek – a képletben

R¹ jelentés ciklopropil- vagy 1-metil-ciklopropil-csoport,

R² jelentése egyenes vagy elágazó láncú 1–4 szénatomos alkil- vagy alkoxicsoport,

R³ jelentése hidrogénatom, halogénatom, egyenes vagy elágazó láncú 1–4 szénatomos alkilcsoport vagy egyenes vagy elágazó láncú 1–4 szénatomos alkoxicsoport,

R⁴ jelentése –S(O)_nR általános képletű csoport, amely képletben

R jelentése 1–4 szénatomos alkilcsoport és n jelentése 0, 1 vagy 2, –

előállítására, *azzal jellemezve, hogy*

a) egy (II) általános képletű vegyületet – a képletben R¹, R², R³ és R⁴ jelentése a fenti és L jelentése lehasadócsoport – egy hidroxil-amin-sóval reagáltatunk, vagy

b) olyan (I) általános képletű vegyületek előállítására, amelyek képletében R⁴ jelentésénél n értéke 1 vagy 2, egy olyan (I) általános képletű vegyületet, amelynél ezen n értéke 0, oxidálunk. (Elsőbbsége: 1991. 08. 05.)

2. Az 1. igénypont szerinti eljárás a következő vegyületek előállítására:

5-ciklopropil-4-(2-metoxi-4-/metil-szulfenil/-benzoi)-izoxazol

5-ciklopropil-4-(2-metoxi-4-/metil-szulfonil/-benzoi)-izoxazol

5-ciklopropil-4-(2-metoxi-4-/metil-szulfenil/-benzoi)-izoxazol

5 5-ciklopropil-4-(2-metil-4-/metil-szulfenil/-benzoi)-izoxazol

5-ciklopropil-4-(2-metil-4-/metil-szulfonil/-benzoi)-izoxazol

10 5-ciklopropil-4-(2-metil-4-/metil-szulfenil/-benzoi)-izoxazol

5-(metil-ciklopropil)-4-(2-metil-4-/metil-szulfonil/-benzoi)-izoxazol

4-(3-klór-2-metil-4-/metil-szulfenil/-benzoi)-5-ciklopropil-izoxazol

15 4-(2-etil-4-/metil-szulfenil/-benzoi)-5-ciklopropil-izoxazol

4-(3-klór-2-metil-4-/metil-szulfenil/-benzoi)-5-ciklopropil-izoxazol

20 4-(3-klór-2-metil-4-/metil-szulfonil/-benzoi)-5-ciklopropil-izoxazol

4-(2-metil-2-metoxi-4-/metil-szulfenil/-benzoi)-5-ciklopropil-izoxazol

4-(2-metil-2-metoxi-4-/metil-szulfonil/-benzoi)-5-ciklopropil-izoxazol

25 4-(2,3-dimetil-4-/metil-szulfenil/-benzoi)-5-ciklopropil-izoxazol

4-(2,3-dimetil-4-/metil-szulfenil/-benzoi)-5-ciklopropil-izoxazol

30 4-(2,3-dimetil-4-/metil-szulfonil/-benzoi)-5-ciklopropil-izoxazol

azzal jellemezve, hogy a megfelelő kiindulási anyagokat alkalmazzuk. (Elsőbbsége: 1991. 08. 05.)

3. Az 1. igénypont szerinti eljárás a következő vegyületek előállítására:

35 4-(2-etil-4-/metil-szulfenil/-benzoi)-5-ciklopropil-izoxazol

4-(2-etil-4-/metil-szulfenil/-benzoi)-5-ciklopropil-izoxazol

40 4-(2-etil-4-/metil-szulfonil/-benzoi)-5-ciklopropil-izoxazol

4-(2-etoxi-4-/metil-szulfenil/-benzoi)-5-ciklopropil-izoxazol.

(Elsőbbsége: 1992. 03. 12.)

4. Herbicid készítmény, *azzal jellemezve, hogy* 0,05–90 tömeg% mennyiségben legalább egy (I) általános képletű vegyületet tartalmaz – a képletben

R¹ jelentése ciklopropil- vagy 1-metil-ciklopropil-csoport, R² jelentése egyenes vagy elágazó láncú 1–4 szénatomos alkil- vagy alkoxicsoport,

50 R³ jelentése hidrogénatom, halogénatom, egyenes vagy elágazó láncú 1–4 szénatomos alkilcsoport vagy egyenes vagy elágazó láncú 1–4 szénatomos alkoxicsoport,

R⁴ jelentése –S(O)_nR általános képletű csoport, amely képletben

R jelentése 1–4 szénatomos alkilcsoport és n jelentése 0, 1 vagy 2 –

mezőgazdaságilag elfogadható hígító- vagy hordozó- és/vagy felületaktív anyagokkal elkeverve. (Elsőbbsége: 1991. 08. 05.)

5. A 4. igénypont szerinti herbicid készítmény, *azzal jellemezve*, hogy folyadékformájú és 0,05–25 t% felületaktív anyagot tartalmaz. (Elsőbbsége 1991. 08. 05.)

6. A 4. igénypont szerinti herbicid készítmény, *azzal jellemezve*, hogy vizes szuszpenzió koncentrátum, nedvesíthető por, vízben oldható vagy vízben diszpergálható por, folyékony, vízben oldható koncentrátum, folyékony, emulgeálható szuszpenzió koncentrátum, granulátum vagy emulgeálható koncentrátum készítmény. (Elsőbbsége: 1991. 08. 05.)

7. Eljárás gyomnövények növekedésének gátlására a növekedés helyén, *azzal jellemezve*, hogy a kívánt helyen, ha termények termesztése történik, az (I) általános képletű vegyületet tartalmazó, 4. igénypont szerinti készítményt alkalmazzuk 0,01–5 kg hatóanyag/ha mennyiségben. (Elsőbbsége: 1991. 08. 05.)

8. A 7. igénypont szerinti eljárás, *azzal jellemezve*, hogy ha a kívánt helyen termény termesztés nincs a készítményt 1–20 kg hatóanyag/ha mennyiségben alkalmazzuk. (Elsőbbsége: 1991. 08. 05.)

