

(19)



SUOMI - FINLAND

(FI)

PATENTTI- JA REKISTERIHALLITUS
PATENT- OCH REGISTERSTYRELSEN
FINNISH PATENT AND REGISTRATION OFFICE

(10) **FI 940483 A7**

(12) **JULKISEKSI TULLUT PATENTTIHAKEMUS
PATENTANSÖKAN SOM BLIVIT OFFENTLIG
PATENT APPLICATION MADE AVAILABLE TO THE
PUBLIC**

(21) Patentihakemus - Patentansökan - Patent application **940483**

(51) Kansainvälinen patenttiluokitus - Internationell patentklassifikation -
International patent classification
**C07D261/08
A01N 43/80**

(22) Tekemispäivä - Ingivningsdag - Filing date **02.02.1994**

(23) Saapumispäivä - Ankomstdag - Reception date **02.02.1994**

(41) Tullut julkiseksi - Blivit offentlig - Available to the public **04.08.1994**

(43) Julkaisupäivä - Publiceringsdag - Publication date **13.06.2019**

(32) (33) (31) Etuokeus - Prioritet - Priority

03.02.1993 GB 9302072

(71) Hakija - Sökande - Applicant

1 •Rhone- Poulenc Agriculture Limited, Fyfield Road, Ongar, Essex CM5 OHW, ISO-BRITANNIA, (GB)

(72) Keksijä - Uppfinnare - Inventor

1 •Cramp, Susan Mary, Ongar, Essex CM5 OHW, ISO-BRITANNIA, (GB)

2 •Musil, Tibor, United Kingdom, ISO-BRITANNIA, (GB)

3 •Pettit, Simon Neil, United Kingdom, ISO-BRITANNIA, (GB)

4 •Smith, Philip Henry G., Essex CM5 OHW, ISO-BRITANNIA, (GB)

(74) Asiamies - Ombud - Agent

Berggren Oy Ab, Antinkatu 3 C, 00100 Helsinki

(54) Keksinnön nimitys - Uppfinningens benämning - Title of the invention

Uudet herbisidit

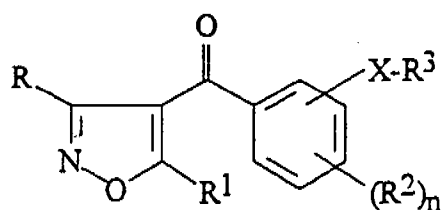
Nya herbicider

Uudet herbisidit - Nya herbicider

Tämä keksintö kohdistuu uusiin 4-bentsoyyli-isoksatsolijohdannaissiin, niitä sisältäviin koostumuksiin, menetelmiin niiden valmistamiseksi ja niiden käyttöön herbisideinä.

Herbisidisiä 4-bentsoyyli-isoksatsoleita on kuvattu EP-patenttijulkaisussa numero 0418175.

Esillä oleva keksintö saa aikaan kaavan (I) mukaisia 4-bentsoyyli-isoksatsolijohdannaisia:



(I)

jossa:

R on vetyatomi tai ryhmä -CO₂R⁴,

R¹ on

korkeintaan kuusi hiiliatomia sisältävä suora- tai haaraketjuinen alkyyliryhmä, joka on substituoitu optionaalisesti yhdellä tai useammalla halogeeniatomilla, tai

3-6 hiiliatomia sisältävä sykloalkyyliryhmä, joka on substituoitu optionaalisesti yhdellä tai useammalla ryhmällä R⁵ tai yhdellä tai useammalla halogeeniatomilla,

R² on

halogeeniatomi,

35

korkeintaan 6 hiiliatomia sisältävä suora- tai haaraketjuinen alkyyliryhmä, joka on substituoitu optionaalisesti yhdellä tai useammalla halogeeniatomilla,

korkeintaan 6 hiiliatomia sisältävä suora- tai haaraketjuinen alkyyliryhmä, joka on substituoitu yhdellä tai useammalla ryhmällä $-OR^5$, tai

- 5 ryhmä, joka on valittu nitrosta, syanosta, $-CO_2R^5$:stä, $-S(O)_pR^6$:sta, $-O(CH_2)_mOR^5$:stä, $-COR^5$:stä, OR^5 :stä ja $-N(R^8)SO_2R^7$:stä,

R^3 on $-SO_2R^7$,

10

X on happiatomi,

n on 0 tai kokonaisluku 1-4; kun n on suurempi kuin 1, ryhmät R^2 voivat olla samanlaiset tai erilaiset,

15

R^4 on korkeintaan kuusi hiiliatomia sisältävä suora- tai haaraketjuinen alkyyliryhmä, joka on substituoitu optionaalisesti yhdellä tai useammalla halogeeniatomilla,

- 20 R^5 ja R^6 , jotka voivat olla samanlaiset tai erilaiset, ovat kumpikin

korkeintaan 6 hiiliatomia sisältävä suora- tai haaraketjuinen alkyyliryhmä, joka on substituoitu optionaalisesti yhdellä tai useammalla halogeeniatomilla,

25

fenyyli, joka on substituoitu optionaalisesti 1-5 ryhmällä R^2 , jotka voivat olla samanlaiset tai erilaiset,

- 30 R^7 on

korkeintaan 6 hiiliatomia sisältävä suora- tai haaraketjuinen alkyyliryhmä, joka on substituoitu optionaalisesti yhdellä tai useammalla halogeeniatomilla,

- 35 fenyyli, joka on substituoitu optionaalisesti 1-5 ryhmällä R^2 , jotka voivat olla samanlaiset tai erilaiset, tai

ryhmä $-NR^5R^6$,

R⁸ on
vetyatomi,

korkeintaan kuusi hiiliatomia sisältävä suora- tai haara-
5 ketjuinen alkyyli-, alkenyyli- tai alkynyyli-ryhmä, joka on
substituoitu optionaalisesti yhdellä tai useammalla halo-
geeniatomilla,

3-6 hiiliatomia sisältävä sykloalkyyli-ryhmä,
10- fenyyli, joka on substituoitu optionaalisesti 1-5 ryhmällä,
jotka voivat olla samanlaiset tai erilaiset ja valittu
halogeenistä, nitrosta, syanosta, R⁵:stä, S(O)_pR⁵:stä ja
-OR⁵:stä, tai

15 ryhmä, joka on valittu -SO₂R⁶:sta ja -OR⁵:stä,

p on 0, 1 tai 2,

20 m on kokonaisluku 1-3,

ja joissa on arvokkaita herbisidisiä ominaisuuksia.

Lisäksi joissakin tapauksissa ryhmät, R, R¹, R², R³, R⁴,
25 R⁵, R⁶ ja R⁸ voivat tuottaa optisia isomeerejä. Kaikki täl-
laiset muodot kuuluvat esillä olevan keksinnön piiriin.

On ymmärrettävä, että edellä olevassa määrittelyssä R² ei
sisällä substituentteja, jotka sisältävät kaksi tai useam-
30 pia fenyyli- tai alkyyliryhmää kytkettynä silloitusryhmän kautta.

Keksinnön mukaisilla yhdisteillä on etua verrattuna tunnet-
tuihin yhdisteisiin joissakin aktivisuuskohdissaan es-
tettäessä joistakin viljakasveista löydettyjä tärkeitä rik-
35 karuohoja, kuten esimerkiksi Galium aparine, Amaranthus
retroflexus, Setaria faberii ja Xanthium strumarium.

Kaavan (I) mukaisia edullisia yhdisteitä ovat ne, joissa
R⁸ on

vetyatomi,

korkeintaan kuusi hiiliatomia sisältävä suora- tai haaraketjuinen alkyyli-, alkenyyli- tai alkynyyli-ryhmä, joka on
5 substituoitu optionaalisesti yhdellä tai useammalla halogeeniatomilla, tai

ryhmä $-\text{SO}_2\text{R}^6$.

10 Edelleen edullinen kaavan (I) mukaisten yhdisteiden luokka on se, jossa

R^1 on

korkeintaan kolme hiiliatomia sisältävä suora- tai haaraketjuinen alkyyliryhmä, syklopropyyli tai 1-metyylisyklopropyyli,
15

R^2 on

halogeeniatomi,

20

korkeintaan neljä hiiliatomia sisältävä suora- tai haaraketjuinen alkyyliryhmä, joka on substituoitu optionaalisesti yhdellä tai useammalla halogeeniatomilla,

25 korkeintaan neljä hiiliatomia sisältävä suora- tai haaraketjuinen alkyyliryhmä, joka on substituoitu yhdellä tai useammalla ryhmällä $-\text{OR}^5$, tai

ryhmä, joka on valittu nitrosta, syanosta, $-\text{CO}_2\text{R}^5$:stä,
30 $-\text{S}(\text{O})_p\text{R}^6$:sta, $-\text{O}(\text{CH}_2)_m\text{OR}^5$:stä, $-\text{OR}^5$:stä ja $-\text{N}(\text{R}^8)\text{SO}_2\text{R}^7$:stä,

R^4 on korkeintaan kuusi hiiliatomia sisältävä suora- tai haaraketjuinen alkyyliryhmä,

35

R^5 ja R^6 , jotka voivat olla samanlaiset tai erilaiset, ovat kumpikin korkeintaan neljä hiiliatomia sisältävä suora- tai haaraketjuinen alkyyliryhmä, joka on substituoitu optionaalisesti yhdellä tai useammalla halogeeniatomilla,

R^7 on korkeintaan 4 hiiliatomia sisältävä suora- tai haaraketjuinen alkyyliryhmä, joka on substituoitu optionaalisesti yhdellä tai useammalla halogeeniatomilla,

5 R^8 on korkeintaan kolme hiiliatomia sisältävä suora- tai haaraketjuinen alkyyliryhmä,

n on 0, 1 tai 2, ja

10 m on kokonaisluku 2 tai 3.

Edelleen edullinen kaavan (I) mukaisten yhdisteiden luokka on se, jossa

15 R^1 on korkeintaan kolme hiiliatomia sisältävä suora- tai haaraketjuinen alkyyliryhmä, syklopropyyli tai 1-metyylisyklopropyyli,

R^2 on

20 halogeeniatomi,

korkeintaan neljä hiiliatomia sisältävä suora- tai haaraketjuinen alkyyliryhmä, joka on substituoitu optionaalisesti yhdellä tai useammalla halogeeniatomilla,

25

korkeintaan neljä hiiliatomia sisältävä suora- tai haaraketjuinen alkyyliryhmä, joka on substituoitu yhdellä tai useammalla ryhmällä $-OR^5$, tai

30 ryhmä, joka on valittu $-S(O)_pR^6$:sta, $-O(CH_2)_mOR^5$:stä ja $-OR^5$:stä,

R^4 on korkeintaan kuusi hiiliatomia sisältävä suora- tai haaraketjuinen alkyyliryhmä,

35

R^5 on 1 tai 2 hiiliatomia sisältävä alkyyliryhmä, joka on substituoitu optionaalisesti yhdellä tai useammalla hiiliatomilla,

R^6 on metyyli- tai etyyyliryhmä,

R^7 on korkeintaan 4 hiiliatomia sisältävä suora- tai haaraketjuinen alkyyliryhmä,

5

R^8 on korkeintaan kolme hiiliatomia sisältävä suora- tai haaraketjuinen alkyyliryhmä,

3 on 0, 1 tai 2, ja

10

m on kokonaisluku 2 tai 3.

Edelleen edullinen kaavan (I) mukaisten yhdisteiden luokka on se, jossa

15

R^2 on
halogeeniatomi,

1 tai 2 hiiliatomia sisältävä alkyyliryhmä, joka on substituoitu optionaalisesti yhdellä tai useammalla halogeeniatomilla,

20

$-S(O)_pR^6$:sta tai $-OR^5$,

25 R^4 on metyyli- tai etyyyliryhmä,

R^5 on 1 tai 2 hiiliatomia sisältävä alkyyliryhmä, joka on substituoitu optionaalisesti yhdellä tai useammalla halogeeniatomilla,

30

R^6 on metyyli- tai etyyyliryhmä,

R^7 on metyyli- tai etyyyliryhmä,

35 R^8 on korkeintaan kolme hiiliatomia sisältävä suora- tai haaraketjuinen alkyyliryhmä,

n on 0, 1 tai 2, ja

m on 2.

Edelleen edullinen kaavan (I) mukaisten yhdisteiden luokka on se, jossa

5

R vetyatomi

R¹ on on etyyli tai syklopropyyli,

10 R³ on -SO₂R⁷,

X on happiatomi,

n on 0 tai 1, ja

15

R⁷ on metyyli, etyyli tai -NMe₂.

Kaavan (I) mukaiset erityisen tärkeät yhdisteet käsittävät seuraavat:

- 20 1. 4-[2-kloori-4-(metyyliisulfonyylioksi)bentsoyyli]-5-syklopropyyli-isoksatsolin,
2. 5-syklopropyyli-4-[2-(metyyliisulfonyylioksi)bentsoyyli]-isoksatsolin,
3. 4-[4-kloori-2-(metyyliisulfonyylioksi)bentsoyyli]-5-syklopropyyli-isoksatsolin,
- 25 4. 5-syklopropyyli-4-[2-etyyliisulfonyylioksi)bentsoyyli]-isoksatsolin,
5. 5-syklopropyyli-4-[2-(N,N-dimetyyliaminosulfonyylioksi)bentsoyyli]-isoksatsolin,
- 30 6. 5-etyyli-4-[2-(metyyliisulfonyylioksi)bentsoyyli]-isoksatsolin,
7. 4-[5-kloori-2-(metyyliisulfonyylioksi)bentsoyyli]-5-syklopropyyli-isoksatsolin.

35 Tämän jälkeen yhdisteisiin viitataan ja ne identifioidaan numeroilla 1-7.

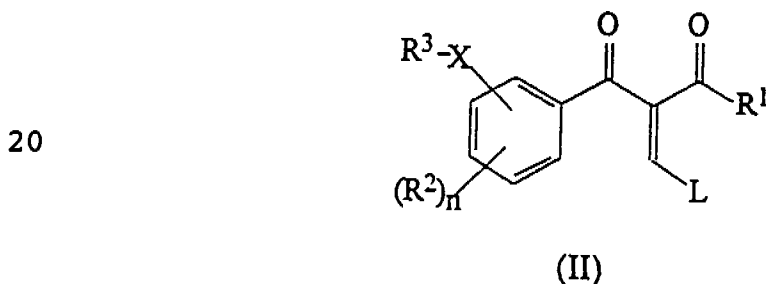
Kaavan (I) mukaiset yhdisteet voidaan valmistaa käyttämällä tai soveltamalla tunnettuja menetelmiä (so. kirjallisuudes-

sa tähän käytetyt tai kuvatut menetelmät), esimerkiksi jäljempänä kuvattuja.

Seuraavassa kuvauksessa, joissa kaavoissa esiintyvät symbolit eivät ole erityisesti määriteltäviä, on ymmärrettävä, että ne ovat "edellä määritettyjä" selityksessä olevan kunkin symbolin ensimmäisen määrittelyn mukaisesti.

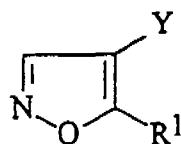
On ymmärrettävä, että seuraavien menetelmien kuvauksissa sekvenssit voidaan suorittaa eri järjestyksessä ja että etsityn yhdisteen saavuttamiseen voidaan tarvita sopivia suojaryhmiä.

Esillä olevan keksinnön piirteen mukaisesti kaavan (I) mukaiset yhdisteet, joissa R on vety, voidaan valmistaa reagoittamalla kaavan (II) mukainen yhdiste:



jossa L on poistuva ryhmä ja R¹, R², R³, n ja X ovat edellä määritetyt, hydroksyyliamiinin tai hydroksyyliamiinin suolan kanssa. Hydroksyyliamiinihydrokloridi on tavallisesti edullinen. L on tavallisesti alkoksi, esimerkiksi etoksi, tai N,N-dialkyyliamino, esimerkiksi dimetyyliamino. Reaktio suoritetaan tavallisesti orgaanisessa liuottimessa, kuten etanolissa tai asetonitriilissä, tai veteen sekoittuvan orgaanisen liuottimen ja veden seoksessa, edullisesti suhteessa orgaaninen liuotin:vesi 1:99-99:1, optionaalisesti emäs- tai happoreseptorin, kuten trietyyliamiinin tai natriumasetaatin, läsnäollessa lämpötilassa 0-100 °C.

Esillä olevan keksinnön toisen piirteen mukaisesti kaavan (I) mukaiset yhdisteet, joissa R on vety, voidaan valmistaa reagoittamalla kaavan (III) mukainen yhdiste:



(III)

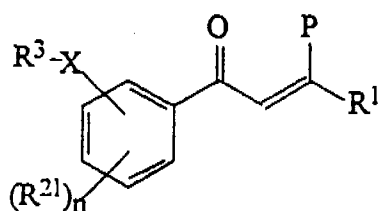
5

jossa R^1 on edellä määritetty ja Y on karboksiryhmä tai sen reaktiivinen johdannainen (kuten karboksyylihappokloridi tai karboksyyliesteri) tai syanoryhmä, sopivan metalliorganaisen reagenssin, kuten Grignardin reagenssin, tai litiumorganaisen reagenssin kanssa. Reaktio suoritetaan tavallisesti inertissä liuottimessa, kuten eetterissä tai tetrahydrofuraanissa, lämpötilassa $0\text{ }^{\circ}\text{C}$:sta seoksen refluksointilämpötilaan.

15

Esillä olevan keksinnön toisen piirteen mukaisesti kaavan (I) mukaiset yhdisteet, joissa R on ryhmä $-\text{CO}_2\text{R}^4$ ja R^2 on ryhmä R^{21} , joka on määritelty edellä R^2 osalta, edellyttäen että p on 0 tai 2, voidaan valmistaa reagoittamalla kaavan (IV) mukainen yhdiste:

20



25

(IV)

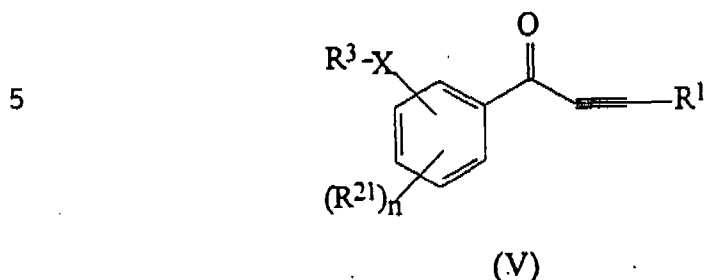
jossa R^1 , R^{21} , R^3 , X ja n ovat edellä määritetyt ja P on poistuva ryhmä, kuten N,N-dialkyyliamino, kaavan $\text{R}^4\text{O}_2\text{CC}(\text{Z})-\text{NOH}$, jossa R^4 on edellä määritetty ja Z on halogeeniatomi, mukaisen yhdisteen kanssa. Z on tavallisesti kloori tai bromi. Reaktio suoritetaan tavallisesti inertissä liuottimessa, kuten tolueenissa tai dikloorimetaanissa, joko emäksen, kuten trietyyliamiinin, tai katalyytin, kuten 4 Ångströmin molekyylliseulan tai fluoridi-ionin läsnäollessa.

30

35

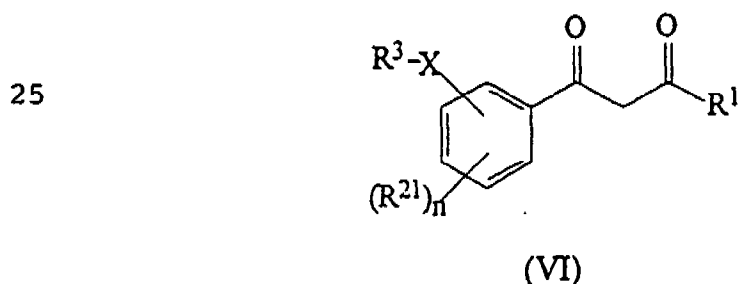
Esillä olevan keksinnön toisen piirteen mukaisesti kaavan (I) mukaiset yhdisteet, joissa R on ryhmä $-\text{CO}_2\text{R}^4$ ja R^2 on

edellä määritelty ryhmä R^{21} , voidaan valmistaa reagoittamalla kaavan (V) mukainen yhdiste:



- 10 jossa R^1 , R^{21} , R^3 , X ja n ovat edellä määritetyt, kaavan $R^4O_2CC(Z)=NOH$, jossa Z ja R^4 ovat edellä määritetyt, mukaisen yhdisteen kanssa. Reaktio suoritetaan inertissä liuottimessa, kuten tolueenissa tai dikloorimetaanissa, optionaalisesti emäksen, kuten trietyyliamiinin, tai katalyytin, 15 kuten 4 Ångströmin molekyylliseulan tai fluoridi-ionin läsnäollessa. Reaktio voidaan suorittaa lämpötilassa huoneenlämpötilasta seoksen refluksointilämpötilaan.

- Esillä olevan keksinnön toisen piirteen mukaisesti kaavan 20 (I) mukaiset yhdisteet, joissa R on ryhmä $-CO_2R^4$ ja R^2 on edellä määritelty ryhmä R^{21} , voidaan valmistaa reagoittamalla kaavan (VI) mukaisen yhdisteen suola:



- 30 jossa kaavassa R^1 , R^{21} , R^3 , X ja n ovat edellä määritetyt, kaavan $R^4O_2CC(Z)=NOH$, jossa Z ja R^4 ovat edellä määritetyt, mukaisen yhdisteen kanssa. Edulliset suolat käsittävät natrium- tai magnesiumsuolat. Reaktio voidaan suorittaa tavallisesti inertissä liuottimessa, kuten dikloorimetaanissa 35 tai asetonitriilissä, lämpötilassa huoneenlämpötilasta seoksen refluksointilämpötilaan.

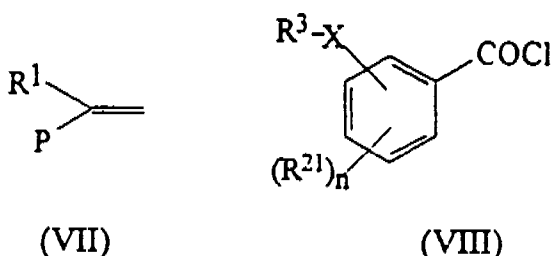
Kaavan (I) mukaisten yhdisteiden valmistuksessa voidaan

käyttää välituotteita käyttämällä tai soveltamalla tunnettuja menetelmiä.

Kaavan (II) mukaiset yhdisteet voidaan valmistaa reagoittamalla kaavan (VI) mukaiset yhdisteet joko trialkyyliortoformaatin, kuten trietyyliortoformaatin, tai dimetyyliformamidialkyyliasetaalin, kuten dimetyyliformamidi-dimetyyliasetaaalin, kanssa.

Reagoittaminen trietyyliortoformaatin kanssa voidaan suorittaa etikka-anhydridin läsnäollessa seoksen refluksointilämpötilassa ja reagoittaminen dimetyyliformamidi-dialkyyliasetaalin kanssa suoritetaan optionaalisesti inertin liuottimen läsnäollessa lämpötilassa ympäristön lämpötilasta seoksen refluksointilämpötilaan.

Kaavan (IV) mukaiset yhdisteet voidaan valmistaa reagoittamalla kaavan (VII) mukainen yhdiste kaavan (VIII) mukaisen bentsoyylikloridin kanssa



jossa R^1 , R^{21} , R^3 , X , n ja P ovat edellä määritetyt. Reaktio suoritetaan tavallisesti orgaanisen emäksen, kuten trietyyliamiinin, läsnäollessa inertissä liuottimessa, kuten tolueenissa tai dikloorimetaanissa, lämpötilassa $-20\text{ }^{\circ}\text{C}$:sta huoneenlämpötilaan.

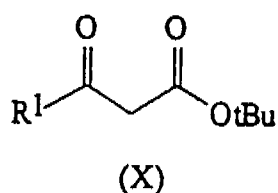
Kaavan (V) mukaiset yhdisteet voidaan valmistaa metalloimalla kaavan (IX):



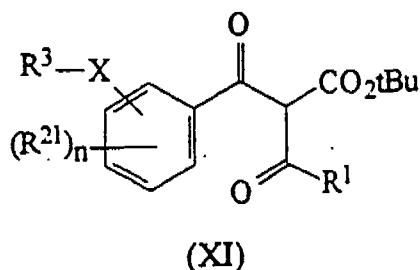
mukainen sopiva asetyleeni, mitä seuraa täten saadun metallisuolan reagoittaminen kaavan (VIII) mukaisen bentsoyyli-

kloridin kanssa. Metallointi suoritetaan tavallisesti käyt-
 tämällä n-butyylilitiumia inertissä liuottimessa, kuten
 eetterissä tai tetrahydrofuraanissa, lämpötilassa -78
 $^{\circ}\text{C} - 0^{\circ}\text{C}$. Sitä seuraava reagoittaminen bentsoyylidikloridin
 5 kanssa suoritetaan samassa liuottimessa lämpötilassa -78
 $^{\circ}\text{C}$:sta huoneenlämpötilaan.

Kaavan (VI) mukaiset yhdisteet voidaan valmistaa reagoit-
 tamalla kaavan (VIII) mukainen happokloridi kaavan (X) mu-
 10 kaisen yhdisteen metallisuolan kanssa:



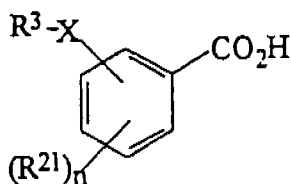
jossa R^1 on edellä määritetty, kaavan (XI) mukaisen yhdis-
 teen saamiseksi:



jossa R^1 , R^{21} , R^3 , X ja n ovat edellä määritetyt, joka de-
 karboksyloidaan seuraavaksi kaavan (VI) mukaisen yhdisteen
 saamiseksi. Reaktio kaavan (X) mukaisen yhdisteen metalli-
 suolan tuottamiseksi suoritetaan liuottimessa, kuten alem-
 30 massa alkoholissa, edullisesti metanolissa. Metallin on
 edullisesti magnesium. Kaavan (X) mukaisen yhdisteen metal-
 lisuola reagoitetaan seuraavaksi kaavan (VIII) mukaisen
 happokloridin kanssa inertissä liuottimessa, kuten toluee-
 nissa tai asetonitriilissä. Dekarboksylointi suoritetaan
 35 tavallisesti refluksaamalla kaavan (XI) mukainen yhdiste
 katalyytin, kuten paratolueenisulfonihapon, kanssa inertis-
 sä liuottimessa, esim. tolueenissa.

Kaavan (VIII) mukaiset happokloridit voidaan valmistaa reagoittamalla kaavan (XII) mukainen bentsoehappo:

5



(XII)

10 jossa R^{21} , R^3 , X ja n ovat edellä määritetyt, kloorausaineen, esimerkiksi tionyylikloridin, kanssa seoksen refluksointilämpötilassa.

15 Kaavojen (III), (VII), (IX), (X) ja (XII) mukaiset välituotteet ovat tunnettuja tai ne voidaan valmistaa käyttämällä tai soveltamalla tunnettuja menetelmiä.

Alan ammattimies pitää arvossa sitä, että jotkin kaavan (I) mukaiset yhdisteet voidaan valmistaa konversoimalla keskenään kaavan (I) mukaiset yhdisteet ja tällaiset interkonversiot muodostavat vielä muita esillä olevan keksinnön piirteitä. Tällaisten interkonversioiden esimerkkejä on kuvattu jäljempänä.

25 Esillä olevan keksinnön toisen piirteen mukaisesti yhdisteet, joissa p on 1 tai 2, voidaan valmistaa hapettamalla vastavien yhdisteiden, joissa p on 0 tai 1, rikkiatomi. Rikkiatomin hapettaminen suoritetaan tavallisesti käyttämällä esimerkiksi 3-klooriperoksibentsoehappoa inertissä
30 liuottimessa, kuten dikloorimetaanissa, lämpötilassa -40°C :sta huoneenlämpötilaan, tai vetyperoksidia etikkahapossa etikka-anhydridin tai konsentroidun rikkihapon läsnäollessa.

35 Seuraavat esimerkit valaisevat kaavan (I) mukaisten yhdisteiden valmistamista ja seuraavat viite-esimerkit valaisevat keksinnön mukaisten välituotteiden valmistamista. Tässä selityksessä kp. tarkoittaa kiehumispistettä, sp. sulamispistettä, cPr tarkoittaa syklopropyyliä.

Esimerkki 1

Natriumasetaattia (1,52 g) lisättiin 1-[2-kloori-4-(metyylisulfonyylioksi)fenyyli]-3-syklopropyyli-2-etoksimetyleenipropaani-1,3-dionin (5,6 g) ja hydroksyyliamiinihydrokloridin (1,3 g) sekoitettuun seokseen etanolissa. Seosta sekoitettiin 0,75 tuntia. Vettä lisättiin ja seos uutettiin dikloorimetaanilla. Orgaaninen kerros pestiin vedellä, kuivatettiin (MgSO₄:llä) ja suodatettiin. Suodos haihdutettiin kuivaksi ja jäännös puhdistettiin kromatografialla eluoiden etyyliasetaatin ja dikloorimetaanin seoksella 4-[2-kloori-4-(metyylisulfonyylioksi)bentsoyyli]-5-sykloisopropyyli-isoksatsolin (yhdiste 1, 4,60 g) saamiseksi ruskeana öljynä, NMR (CDCl₃) 1,25-1,35(m,2H), 1,4-1,5(m,2H), 2,6-2,7(m,1H), 7,3 (d,1H), 7,4(s,1H), 7,45 (d,1H), 8,15(s,1H).

Seuraavat kaavan I mukaiset yhdisteet valmistettiin menetelmällä samalla tavalla sopivasti substituoiduista lähtömateriaaleista.

20	Yhdiste nro	R	R ¹	(R ²) _n	XR ³	sp./NMR
	2	H	cPr	-	2-OSO ₂ Me	a
	3	H	cPr	4-Cl	2-OSO ₂ Me	71-73 °C
	4	H	cPr	-	2-OSO ₂ Et	b
25	5	H	cPr	-	2-OSO ₂ NMe ₂	c
	6	H	Et	-	2-OSO ₂ Me	57-61 °C
	7	H	cPr	5-Cl	2-OSO ₂ Me	110-113 °C

Huomaa:

30 a NMR (CDCl₃) 1,1-1,2(m,2H), 1,25-1,35(m,2H), 2,5-2,6(m,1H), 7,3-7,6(m,4H), 8,2(s,1H).

b NMR (CDCl₃) 1,15-1,3(m,2H), 1,3-1,4(m,2H), 1,45(t,3H), 2,55-2,7(m,1H) 3,3 (q,2H), 7,35-7,7(m,4H), 8,25(s,1H).

35 c NMR (CDCl₃) 1,15-1,25(m,2H), 1,25-1,35(m,2H), 2,55-2,7(m,1H), 2,35(s,6H), 7,35-7,6(m,4H), 8,25(s,1H).

Viite-esimerkki 1

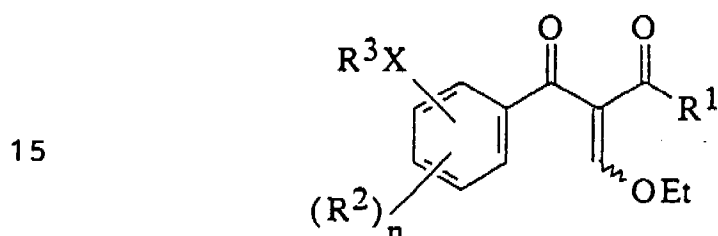
Seosta, jossa on 1-[2-kloori-4-(metyylisulfonyylioksi)fenyyli]-3-syklopropyylipropaani-1,3-dionia (4,75 g) ja tri-

etyyliortoformaattia (4,5 g) etikka-anhydridissä, sekoitettiin ja sitä kuumennettiin refluksoiden 3 tuntia. Seos jäähdytettiin ja haihdutettiin kuivaksi. Tolueneia lisättiin ja seos uudelleenhaihdutettiin 1-[2-kloori-4-(metyyli-

5 sulfonyylioksi)fenyyli]-3-syklopropyyli-2-etoksimetyyleeni-propaani-1,3-dionin (5,7 g) saamiseksi ruskeana öljynä, jota ei enää puhdistettu.

Menetelmällä samalla tavalla valmistettiin seuraavat yh-

10 disteet sopivasti substituoiduista lähtömateriaaleista.



	R ¹	(R ²) _n	XR ³
20	cPr	-	2-OSO ₂ Me
	cPr	4-Cl	2-OSO ₂ Me
	cPr	-	2-OSO ₂ Et
	cPr	-	2-OSO ₂ NMe ₂
	Et	-	2-OSO ₂ Me
25	cPr	5-Cl	2-OSO ₂ Me

Viite-esimerkki 2

Suspensiota, jossa on magnesiumia (0,47 g) metanolissa, sekoitettiin ja sitä kuumennettiin refluksoiden 0,5 tuntia.

30 t-butyyl-3-syklopropyyli-3-oksopropionaattia lisättiin ja seosta kuumennettiin refluksoiden 0,5 tuntia. Seos jäähdytettiin ja haihdutettiin. Tolueneia lisättiin ja seos uudelleenhaihdutettiin. Jäännös uudelleenliuotettiin tolueeniin ja liuosta, jossa on 2-kloori-4-(metyyli-

35 si)bentsoyylikloridia (5,1 g) tolueenissa, lisättiin. Seosta sekoitettiin huoneenlämpötilassa yön ajan. Kloorivetyhappoa (2 M) lisättiin ja seosta sekoitettiin puoli tuntia. Kerrokset erotettiin ja orgaaninen kerros pestiin vedellä ja kuivattiin atseotrooppisesti. p-tolueenisulfonihappoa

(0,5 g) lisättiin ja seosta kuumennettiin refluksoiden 2,5 tuntia. Se jäädytettiin, pestiin vedellä, kuivattiin (MgSO_4) ja suodatettiin. Suodos haihdutettiin kuivaksi 1-[2-kloori-4-(metyyliisulfonyylioksi)fenyyli]-3-syklopropaani-1,3-dionin (6,05 g) saamiseksi ruskeana kiintoaineena, sp. 74-77 °C.

Menetтелеmällä samalla tavalla valmistettiin seuraavat edellä olevan kaavan (VI) mukaiset yhdisteet sopivasti substituoiduista lähtömateriaaleista.

	R^1	$(\text{R}^2)_n$	XR^3	sp-/NMR
	cPr	-	2-OSO ₂ Me	a
	cPr	4-Cl	2-OSO ₂ Me	b
15	cPr	-	2-OSO ₂ Et	c
	cPr	-	2-OSO ₂ NMe ₂	57-59 °C
	Et	-	2-OSO ₂ Me	d
	cPr	5-Cl	2-OSO ₂ Me	e

20 Huomaa:

a NMR (CDCl_3) 0,9-1,05(m,2H), 1,1-1,2(m,2H), 1,7-1,8(m,1H), 3,1(s,3H), 6,15(s,1H), 7,25-7,5(m,3H), 7,65(d,1H), 15,85-16,3(bs,1H).

b NMR (CDCl_3) 0,8-0,9(m,2H), 1,0-1,15(m,2H), 1,6-1,7(m,1H), 3,05(s,3H) 6,1 (s,1H), 7,25(d,1H), 7,35(s,1H), 7,55(d,1H).

c NMR (CDCl_3) 0,9-1,1(m,2H), 1,2-1,3(m,2H), 1,5(t,3H), 1,7-1,85(m,1H), 3,3(q,2H), 6,2(s,1H), 7,3-7,55(m,3H), 7,75(d,1H), 15,9-16,2(bs,1H).

d NMR (CDCl_3) 1,25(t,3H), 2,45(q,2H), 3,15(s,1H), 6,1(s,1H), 7,3-7,65(m,3H), 7,75(d,1H), 15,6-15,95(bs,1H).

e NMR (CDCl_3) 0,9-1,15(m,2H), 1,2-1,3(m,2H), 1,7-1,85(m,1H), 3,15(s,3H), 6,2(s,1H), 7,3-7,55(m,2H), 7,75(s,1H), 15,85-16,25(bs,1H).

35 Bentsoyylikloridit valmistettiin kuumentamalla sopivaa bentsoehappoa tionyylikloridissa refluksoiden 2 tuntia. Jäädyttämisen jälkeen ylimääräinen tionyylikloridi poistettiin haihduttamalla. Tolueenia lisättiin ja seos uudel-

leenhaihdutettiin raakojen bentsoyylikloridien saamiseksi, joita käytettiin edelleen puhdistamatta.

Viite-esimerkki 3

- 5 Seosta, jossa on 2-(metyyliisulfonyylioksi)bentsoaattia kloorivetyhapossa (6 M), kuumennettiin refluksoiden 0,75 tuntia. Jäähdytetty seos laimennettiin eetterillä ja uutettiin etyyliasetaatilla. Orgaaninen kerros pestiin natriumkloridin vesiliuoksella, kuivattiin (MgSO_4) ja suodatettiin.
- 10 tiin. Suodos haihdutettiin kuivaksi 2-(metyyliisulfonyylioksi)bentsoehapon (6,1 g) saamiseksi valkeana kiintoaineena, sp. 125-126 °C.

- Menettelemällä samalla tavalla valmistettiin seuraavat yhdisteet sopivasti substituoiduista lähtömateriaaleista.
- 15

4-kloori-2-(metyyliisulfonyylioksi)bentsoehappo, sp. 167-170 °C.

2-(etyyliisulfonyylioksi)bentsoehappo, sp. 101,7-103,2 °C.

- 20 2-(N,N-dimetyyliaminosulfonyylioksi)bentsoehappo, sp. 108,5-111,5 °C.

5-kloori-2-(metyyliisulfonyylioksi)bentsoehappo, sp. 148-156 °C.

25 Viite-esimerkki 4

- Metaanisulfonyyliikloridia (7,0 g) lisättiin sekoitettuun, jäähdytettyyn seokseen, jossa on 4-kloorisalisylaattia (10,0 g) ja trietyyliamiinia (8,0 g) dikloorimetaanissa, pitäen samalla lämpötila 0 °C:ssa. Sitten seosta sekoitettiin huoneenlämpötilassa puoli tuntia ja sen annettiin seisoa yön ajan. Seos pestiin kloorivetyhapolla (2 M) kyllästetyllä natriumbikarbonaatin vesiliuoksella, vedellä, kuivattiin (Na_2SO_4) ja suodatettiin. Suodos haihdutettiin kuivaksi metyyli-4-kloori-2-(metyyliisulfonyylioksi)bentsoaatin
- 30 (11,7 g) saamiseksi oranssina kiintoaineena, sp. 82,5-84,5 °C.
- 35

Menettelemällä samalla tavalla valmistettiin seuraavat yhdisteet sopivasti substituoiduista lähtömateriaaleista.

Metyyli-2-(etyylisulfonyylioksi)bentsoaatti, NMR (CDCl_3) 1,5(t,3H), 3,4(q,2H), 3,85(s,3H), 7,25-7,4(m,2H), 7,5(m,1H), 7,9(d,1H).

- 5 Metyyli-5-kloori-2-(metyylisulfonyylioksi)bentsoaatti, NMR (CDCl_3) 3,3(s,3H), 3,95(s,3H), 7,35(d,1H), 7,55(d,1H), 7,95(s,1H).

Viite-esimerkki 5

- 10 Dimetyyliaminosulfonyylikloridia (17,2 g) lisättiin seokseen, jossa on metyyლისალისლაattia (15,2 g) ja kaliumkarbonaattia (27,6 g) asetonitriilissä. Seosta sekoitettiin huoneenlämpötilassa 1 tunti. TDA-1:ä (2,0 g) lisättiin ja seosta sekoitettiin 24 tuntia. Seos suodatettiin ja suodos
- 15 haihdutettiin kuivaksi. Jäännös liuotettiin dikloorimetaniin, pestiin vedellä, kuivattiin (MgSO_4) ja suodatettiin. Suodos haihdutettiin kuivaksi ja jäännös trituroitiin etherillä. Kiintoaine suodatettiin pois ja puhdistettiin kromatografialla eluoiden dikloorimetaanilla metyyli-2-(di-
- 20 metyyliaminosulfonyylioksi)bentsoaatin (17,4 g) saamiseksi valkeana kiintoaineena, sp. 75,5-76,5 °C.

- Esillä olevan keksinnön piirteen mukaan saadaan aikaan menetelmä rikkaruohojen (so. ei-toivottu kasvisto) kasvun
- 25 torjumiseksi paikassa, joka menetelmä käsittää herbisidisesti tehokkaan määrän vähintään yhtä kaavan (I) mukaista isoksatsolijohdannaisista levittämisen paikkaan. Tähän tarkoitukseen isoksatsolijohdannaisia käytetään tavallisesti herbisidikoostumusten muodossa (so. yhdistettynä yhteenso-
- 30 piviin laimentimiin tai kantoaineisiin ja/tai pinta-aktiivisiin aineisiin, jotka sopivat käytettäväksi herbidikoostumuksissa), esimerkiksi jäljempänä kuvatusti.

- Kaavan (I) mukaisilla yhdisteillä on herbisidistä aktiivisuutta kaksisirkkaisia (so. leveälehtiset) ja yksisirkkaisia (so. ruohot) rikkaruohoja vastaan annettaessa ennen ja
- 35 jälkeen kasvun.

Termillä "antaminen ennen kasvua" tarkoitetaan käyttöä maaperään, jossa on rikkakasvin siemeniä tai ituja ennen rikkakasvien kasvamista maanperän pinnalle. Termillä "antaminen kasvun jälkeen" tarkoitetaan käyttämistä kasvien ilmassa tai pinnassa oleviin osiin, jotka ovat kasvaneet maanpinnan yläpuolelle. Kaavan (I) mukaisia yhdisteitä voidaan käyttää esimerkiksi seuraavien kasvun torjumiseen:

- 10 leveälehtiset rikkaruohot, esimerkiksi, *Abutilon theophrasti*, *Amaranthus retroflexus*, *Bidens pilosa*, *Chenopodium album*, *Galium aparine*, *Ipomoea* spp., esim. *Ipomoea purpurea*, *Sesbania exaltata*, *Sinapis arvensis*, *Solanum nigrum* ja *Xanthium strumarium*, ja
- 15 ruohorikkakasvit, esimerkiksi *Alopecurus myosuroides*, *Avena fatua*, *Digitaria sanguinalis*, *Echinochloa crus-galli*, *Sorghum bicolor*, *Eleusine indica* ja *Setaria* spp, esimerkiksi *Setaria faberii* tai *Setaria viridis*, ja
- 20 sarat, esimerkiksi *Cyperus esculentus*.

Kaavan (I) mukaisten yhdisteiden määrät vaihtelevat riippuen rikkaruohojen luonteesta, käytetystä koostumuksesta, käytön ajasta, ilmastollisista ja maaperästä johtuvista olosuhteista ja (kun niitä käytetään rikkaruohojen torjumiseen viljaa kasvavilla alueella) viljakasvien luonteesta.

Levitettäessä viljaa kasvavalle alueelle levittämismäärän tulee olla riittävä estämään rikkaruohojen kasvu aiheuttamatta oleellista pysyvää vauriota viljalle. Yleensä ottaen huomioon nämä tekijät levitysmäärät 0,01 kg - 5 kg aktiivista materiaalia hehtaaria kohti antavat hyvät tulokset. Kuitenkin on ymmärrettävä, että voidaan käyttää suurempia tai pienempiä levittämismääriä riippuen kyseisen rikkaruohon torjunnan erityisestä ongelmasta.

Kaavan (I) mukaisia yhdisteitä voidaan käyttää torjumaan selektiivisesti rikkaruohojen kasvua, esimerkiksi torjumaan edellä mainittujen lajien kasvua levittämällä ennen tai

jälkeen kasvun suoralla tai epäsuoralla tavalla, esim. sumuttamalla suoraan tai epäsuorasti, paikkaan, joka on rikkaruohon saastuttama, jota aluetta käytetään tai tullaan käyttämään viljakasvien viljelyyn, esimerkiksi viljakasvien, esim. vehnän, ohran, kaurojen, maissin ja riisin, soijapapujen, pelto- ja kääpiöpapujen, herneiden, sinimailaisen, puuvillan, pähkinöiden, pellavan, sipuleiden, porkkanoiden, kaalin, rapsin, auringonkukan, sokerijuurikkaan viljelyyn, ja sekä kesto- tai kylvönurmeen ennen tai jälkeen viljakasvin kylvämisen tai viljakasvin kasvamisen jälkeen. Rikkaruohojen torjumiseksi selektiivisesti rikkaruohosaastunnan paikkassa, joka on alue, jota käytetään tai tullaan käyttämään edellä mainittujen viljakasvien kasvatamiseen, levitysarvot ovat 0,01 kg - 4,0 kg ja edullisesti 0,01 kg - 2,0 kg aktiivista materiaalia hehtaaria kohti ovat erityisen sopivia.

Kaavan (I) mukaisia yhdisteitä voidaan käyttää torjumaan rikkaruohojen, erityisesti edellä mainittujen rikkaruohojen kasvua, levittämällä ennen tai jälkeen kasvun perustetuihin hedelmätarhoihin ja muille puita kasvaville alueille, esimerkiksi metsiin, metsiköihin ja puistoihin, ja viljelmille, esim. sokeriruoko-, öljypalmu- ja kumiplantaaseille. Tähän tarkoitukseen niitä voidaan levittää suoralla tai epäsuoralla tavalla (esim. sumuttamalla suoraan tai epäsuorasti) rikkaruohoille tai maaperään, joissa niiden odotetaan esiintyvän ennen tai jälkeen puiden istuttamista tai istutuksille levitysarvoina 0,5 kg - 4,0 kg aktiivista materiaalia hehtaaria kohti.

Kaavan (I) mukaisia yhdisteitä voidaan käyttää torjumaan erityisesti edellä mainittujen rikkaruohojen kasvua, paikassa, jotka eivät ole viljaa kasvavia alueita, mutta joilla rikkaruohojen torjuminen on kuitenkin toivottavaa.

Esimerkit tällaisista ei-viljaa kasvavista alueista käsittävät lentokentät, teollisuusalueet, rautatiet, tienreunat, jokien rannat, kastelukanavat ja muut vesitiet, pensasmaat ja kesanto- tai viljelemättömät maat, erityisesti siellä,

missä on toivottavaa torjua rikkaruohojen kasvu tulipalovaaran vähentämiseksi. Käytettäessä tällaisiin tarkoituksiin, joissa halutaan totaalista herbisidistä vaikutusta, aktiivisia yhdisteitä levitetään normaalisti annosmäärinä, jotka ovat suurempia kuin ne, joita käytetään edellä kuvatuille viljaa kasvaville alueille. Tarkka annostus riippuu käsiteltävän kasvuston luonteesta ja halutusta vaikutuksesta.

- 10 Ennen tai jälkeen kasvun levittäminen ja edullisesti ennen kasvua levittäminen suoralla tai epäsuoralla tavalla (esim sumuttamalla suoraan tai epäsuorasti) levitysarvoina 1,0 kg - 20,0 kg ja edullisesti 5,0 kg - 10,0 kg aktiivista materiaalia hehtaaria kohti ovat erityisen sopivia tähän tarkoitukseen. Käytettäessä rikkaruohojen kasvun estämiseen levittämällä ennen kasvua yleisen kaavan (I) mukaiset yhdisteet voidaan sisällyttää maaperään, jossa rikkaruohojen odotetaan kasvavan. On huomattava, että kun kaavan (I) mukaisissa yhdisteitä käytetään rikkaruohojen kasvun estämiseen levittämällä kasvamisen jälkeen, so. levittämällä kasvaneiden rikkaruohojen ilmassa olevaan tai esillä oleville osille, kaavan (I) mukaiset yhdisteet tulevat normaalisti kosketuksiin maaperän kanssa ja ne voivat torjua myös ennen kasvua myöhemmin maaperässä itäviä rikkaruohoja.

25

Kun tarvitaan erityisesti pidentynyttä torjuntaa, kaavan (I) mukaisten yhdisteiden levittäminen voidaan toistaa tarvittaessa.

- 30 Esillä olevan keksinnön muun kohteen mukaisesti saadaan aikaan koostumuksia, jotka sopivat herbisidiseen käyttöön ja jotka käsittävät yhden tai useamman kaavan (I) mukaisen isoksatsolijohdannaisen yhdistettynä ja edullisesti dispergoituna yhteen tai useampaan yhteensopivaan maanviljelyksellisesti hyväksyttävään laimentimeen tai kantoaineeseen ja/tai aktiiviseen aineeseen [so. laimentimet tai kantoaineet ja/tai aktiiviset aineet, jotka ovat tyypiltään yleisesti alalla hyväksyttyjä ollen sopivia käytettäväksi herbisidisissä koostumuksissa ja jotka ovat yhteensopivia kaa-
- 35

van (I) mukaisten yhdisteiden kanssa]. Termiä "homogeenisesti dispergoitu" käytetään laajassa mielessä kattamaan koostumusten, jotka ovat valmiita herbisideinä käytettäväksi, lisäksi myös konsentraatit, jotka täytyy laimentaa ennen käyttöä. Koostumukset sisältävät edullisesti 0,05-90 paino-% yhtä tai useampaa kaavan (I) mukaista yhdistettä.

Herbisidikoostumukset voivat sisältää sekä laimenninta tai kantoainetta että pinta-aktiivista (kostuttavaa, dispergoivaa tai emulgoivaa) ainetta. Pinta-aktiiviset aineet, joita voi olla läsnä esillä olevan keksinnön mukaisissa koostumuksissa, voivat olla ionista tai ei-ionista tyyppiä, esimerkiksi sulforisiiniioleaatteja, kvaternaarisia ammoniumjohdannaisia, tuotteita, jotka perustuvat etyleenioksidin ja alkyyli- ja polyalkyyliifenolien, esim. nonyyli- tai oktyyliifenolien, kondensaatteihin, tai anhydrosorbitolien karboksyylihappestereitä, jotka on tehty liukeneviksi eetteröimällä vapaat hydroksiryhmät kondensoimalla etyleenioksidin, rikkihappesterien ja sulfonihappojen maa-alkalimetallisuolojen, kuten dinonyyli- ja dioktyylimatriumsulfonosukkinaattien ja suurimolekyyli-painoisten sulfonihappojohdannaisten alkali- ja maa-alkalimetallisuolojen, kuten natrium- ja kalsiumlignosulfaattien ja natrium- ja kalsiumalkyylibentseenisulfonaattien kanssa.

Esillä olevan keksinnön mukaiset herbisidiset koostumukset voivat käsittää korkeintaan 10 paino-%, esim. 0,05-10 paino-%, pinta-aktiivista ainetta mutta haluttaessa esillä olevan keksinnön mukaiset herbisidikoostumukset voivat käsittää suurempia osuuksia pinta-aktiivista ainetta, esimerkiksi korkeintaan 15 paino-% nestemäisissä emulgoituissa suspensiokonsentraateissa ja korkeintaan 25 paino-% nestemäisissä veteen liukenevissa konsentraateissa.

Esimerkit sopivista kiinteistä laimentimista tai kantoaineista ovat alumiinisilikaatti, talkki, kalsinoitu magnesiumoksidi, piimaa, trikalsiumfosfaatti, jauhettu korkki, absorboiva hiilimusta ja savet, kuten kaoliini ja bentoniitti. Kiinteät koostumukset (jotka voivat olla pölyjen,

granuloiden tai kostutettavien jauheiden muodossa) valmistetaan edullisesti jauhamalla kaavan (I) mukaiset yhdisteet kiinteiden laimentimien kanssa tai impregnoimalla kiinteät laimentimet tai kantoaineet kaavan (I) mukaisten yhdisteiden liuoksilla haihtuvissa liuottimissa, haihduttamalla liuottimet ja tarvittaessa jauhamalla siten saadut tuotteet jauheiksi. Granulaformuloinnit voidaan valmistaa absorboimalla kaavan (I) mukaiset yhdisteet (liuotettuna sopiviin liuottimiin, jotka voivat olla haluttaessa haihtuvia) kiinteisiin laimentimiin tai kantoaineisiin granula-

5 muodossa ja haihduttamalla haluttaessa liuottimet tai granuloidimalla edellä kuvatusti saadut jauhemuodossa olevat koostumukset. Kiinteät herbisidikoostumukset, erityisesti kostutettavat jauheet ja granulat, voivat sisältää kostu-

10 tus- tai dispergointiaineita (esimerkiksi edellä kuvatun tyyppisiä), jotka voivat toimia kiinteinä ollessaan myös laimentimina tai kantoaineina.

Keksinnön mukaiset nestemäiset koostumukset voivat olla vesipitoisten, orgaanisten tai vesipitois-orgaanisten liuosten, suspensioiden ja emulsioiden muodossa, jotka voivat sisältää pinta-aktiivista ainetta. Nestemäisiin koostumuk-

20 siin sisällytettäväksi sopivat nestemäiset laimentimet käsittävät veden, glykolit, tetrahydrofurfuryylialkoholin, asetofenonin, sykloheksanonin, isoforonin, tolueenin, ksyleenin, mineraali-, eläin ja kasviöljyt ja petrolin nafteenifraktiot (ja näiden laimentimien seokset). Pinta-aktiiviset aineet, joita voi olla läsnä nestemäisissä koostumuksissa, voivat olla ionisia tai ei-ionisia (esimerkiksi

25 edellä kuvattua tyyppiä) ja ne voivat toimia ollessaan nestemäisiä myös laimentimina ja kantoaineina.

Jauheet, dispergoituvat granulat ja nestemäiset koostumukset konsentraattien muodossa voidaan laimentaa vedellä tai

35 muilla sopivilla laimentimilla, esimerkiksi mineraali- tai kasviöljyillä, erityisesti nestemäisten konsentraattien tapauksessa, jolloin laimennin tai kantoaine on öljy, käyttövalmiiden koostumusten saamiseksi.

Haluttaessa kaavan (I) mukaisen yhdisteen nestemäisiä koostumuksia voidaan käyttää itse-emulgoituvien konsentraattien muodossa, jotka sisältävät aktiivisia substansseja liuotetuna emulgointiaineisiin tai liuottimiin, jotka sisältävät
 5 emulgointiaineita, jotka ovat yhteensopivia aktiivisten substanssien kanssa, veden yksinkertainen lisääminen tällaisiin konsentraatteihin tuottaa käyttövalmiita koostumuksia.

10 Nestemäisiä konsentraatteja, joissa laimennin tai kantoaine on öljy, voidaan käyttää ilman lisälaimennusta käyttäen sähköstaattista sumutustekniikkaa.

Esillä olevan keksinnön mukaiset herbisidikoostumukset voivat sisältää haluttaessa myös konventionaalisia apuaineita, kuten liima-aineita, suojakolloideja, paksunnosaineita, tunkeutumista edistäviä aineita, stabilointiaineita, sekvestrausaineita, paakkuuntumisten estoaineita, väriaineita ja korroosionestoaineita. Nämä apuaineet voivat toimia myös
 20 kantoaineina tai laimentimina.

Jollei muuta ole määritelty, seuraavat prosentit ovat painoprosentteja. Edullisia esillä olevan keksinnön mukaisia herbisidikoostumuksia ovat

25 vesipitoiset suspensiokonsentraatit, jotka käsittävät 10-70 % yhtä tai useampaa kaavan (I) mukaista yhdistettä, 2-10 % pinta-aktiivista ainetta, 0,1-5 % paksunnosainetta ja 15-87,9 % vettä,

30 kostutettavat jauheet, jotka käsittävät 10-90 % yhtä tai useampaa kaavan (I) mukaista yhdistettä, 2-10 % pinta-aktiivista ainetta ja 8-88 % kiinteää laimenninta tai kantoainetta,

35 veteen liukenevat tai veteen dispergoituvat jauheet, jotka käsittävät 10-90 % yhtä tai useampaa kaavan (I) mukaista yhdistettä, 2-40 % natriumkarbonaattia ja 0-88 % kiinteää laimenninta,

nestemäiset veteen liukenevat konsentraatit, jotka käsittävät 5-50 %, esim. 10-30 %, yhtä tai useampaa kaavan (I) mukaista yhdistettä, 5-25 % pinta-aktiivista ainetta ja 25-90 %, esim. 45-85 %, veteen liukenevaa liuotinta, esim.
 5 dimetyyliformamidia, tai veteen liukenevan liuottimen ja veden seosta,

nestemäiset emulgoituvat suspensiot, jotka käsittävät 10-70 %, yhtä tai useampaa kaavan (I) mukaista yhdistettä, 5-10 15 % pinta-aktiivista ainetta, 0,1-5 % paksunnosainetta ja 10-84,9 % orgaanista liuotinta,

granulat, jotka käsittävät 1-90 %, esim. 2-10 %, yhtä tai useampaa kaavan (I) mukaista yhdistettä, 0,5-7 %, esim.
 15 0,5-2 %, pinta-aktiivista ainetta ja 3-98,5 %, esim. 88-97,5 %, granulasta kantoainetta ja

emulgoituvat konsentraatit, jotka käsittävät 0,05-90 % ja edullisesti 1-60 % yhtä tai useampaa kaavan (I) mukaista
 20 yhdistettä, 0,01-10 % ja edullisesti 1-10 % pinta-aktiivista ainetta ja 9,99-99,94 % ja edullisesti 39-98,99 % orgaanista liuotinta.

Esillä olevan keksinnön mukaiset herbisikoostumukset voivat
 25 käsittää myös kaavan (I) mukaisia yhdisteitä yhdistettynä ja edullisesti dispergoituina yhteen tai useampaan muuhun pestisidisesti aktiiviseen yhdisteeseen ja haluttaessa yhteen tai useampaan yhteensopivaan pestisidisesti hyväksyttävään laimentimeen tai kantoaineeseen, pinta-aktiivisiin
 30 aineisiin ja edellä kuvattuihin konventionaalisiin apuaineisiin. Esimerkit muista pestisidisesti aktiivisista yhdisteistä, joita voidaan sisällyttää esillä olevan keksinnön mukaisiin herbisidisiin koostumuksiin tai joita voidaan käyttää yhdessä niiden kanssa, käsittävät herbisidit, esi-
 35 merkiksi lisäämään torjuttavien rikkaruoholajien aluetta, esimerkiksi alakloori [2-kloori-2,6'-dietyyli-N-(metoksimetyyli)-asetanilidi], atratsiini [2-kloori-4-etyyliamino-6-isopropyliamino-1,3,5-triatsiini], bromoksyniili [3,5-dibromi-4-hydroksibentsonitriili], klortoluroni [N'-(3-

kloori-4-metyyli-fenyyli)-N,N-dimetyyliurea], syanatsiini [2-kloori-4-(1-syano-1-metyyliamino)-6-etyyliamino-1,3,5-triatziini], 2,4-D [2,4-dikloorifenoksi-etikkahappo], dikamba [3,6-dikloori-2-metoksibentsoehappo], difenzoquat
 5 [1,2-dimetyyli-3,5-difenyyli-pyratsoliumsuolat], flamprop-metyyli [metyyli-N-2-(N-bentsoyyli-3-kloori-4-fluorianilino)-propionaatti], fluometuron [N'-(3-trifluorimetyyli-fenyyli)-N,N-dimetyyliurea], isoproturoni [N'-(4-isopropyyli-fenyyli)-N,N-dimetyyliurea], insektisidit, esim. synteet-
 10 tiset pyretroidit, esim. permetriini ja sypermetriini, ja fungisidit, esim. karbamaatit, esim. metyyli-N-(1-butyli-karbamoyyli-bentsimidatsol-2-yyli)karbamaatti, ja triatso-
 lit, esim. 1-(4-kloori-fenoksi)-3,3-dimetyyli-1-(1,2,4-triat-
 sol-1-yyli)-butan-2-oni.

15

Pestisidistä aktiivisia yhdisteitä ja muita biologisesti aktiivisia materiaaleja, joita voidaan sisällyttää esillä olevan keksinnön mukaisiin herbisidikoostumuksiin tai käyttää yhdessä niiden kanssa, esimerkiksi niitä, jotka mainit-
 20 tiin edellä ja jotka ovat happoja, voidaan haluttaessa käyttää konventionaalisten johdannaisten muodossa, esimerkiksi alkalimetalli- ja amiinisuoloina ja estereinä.

Esillä olevan keksinnön muun piirteen mukaisesti saadaan
 25 aikaan valmistusartikkeli, joka käsittää vähintään yhtä yleisen kaavan (I) mukaista isoksatsolijohdannaista tai jos on edullista edellä kuvattua herbisidikoostumusta ja edullisesti herbisidikonsentraattia, joka on laimennettava ennen käyttöä ja joka käsittää vähintään yhden kaavan (I)
 30 mukaisen isoksatsolijohdannaisen säiliössä, joka on tarkoitettu edellä mainitulle kaavan (I) mukaiselle johdannaiselle tai mukaisille johdannaisille, tai mainitun herbisidikoostumuksen ja edellä mainittuun säiliöön fyysisesti liitetyt ohjeet tavasta, jolla sen sisältämä edellä mainittu
 35 kaavan (I) mukainen johdannainen tai mukaiset johdannaiset on käytettävä rikkaruohojen torjuntaan. Säiliöt ovat tavallisesti tyypiltään sellaisia, joita käytetään varastoitaessa kemiallisia substansseja, jotka ovat kiinteitä normaaleissa ympäristön lämpötiloissa, ja herbisidisten konsent-

raattien muodossa olevia koostumuksia, esimerkiksi metallikannuja ja tynnyreitä, jotka voivat olla sisältä lakattuja, ja muovimateriaaleja, -pulloja tai lasi- ja muovimateriaaleja ja kun säiliön sisältö on kiinteä, esimerkiksi rakeinen herbidisin koostumus, laatikoita, esimerkiksi pahvia, muovimateriaaleja ja metallia, tai säkkejä. Säiliöiden tulee olla tavallisesti riittäviä kapasiteetiltaan sisältämään isoksatsolijohdannaisen tai herbisidikoostumusten määriä, jotka ovat riittäviä käsittelemään vähintään 0,405 hehtaaria maata rikkaruohojen kasvun torjumiseksi mutta joka ei ylitä kokoa, joka on tarkoituksenmukainen konventionaalisiin käsittelymenetelmiin. Ohjeet on liitetty fyysisesti säiliöön esimerkiksi painettuna siihen suoraan tai siihen kiinnitetyllä nimilapulla tai nimikelipulla. Ohjeet osoittavat tavallisesti, että säiliön sisältö on levitettävä laimentamisen jälkeen, jos se on tarpeellista, rikkaruohojen kasvun torjumiseksi käyttömäärinä 0,01 kg - 20 kg aktiivista materiaalia hehtaaria kohti edellä kuvatulla tavalla ja edellä kuvattuihin tarkoituksiin.

20

Seuraavat esimerkit selventävät esillä olevan keksinnön mukaisia herbisidikoostumuksia:

Esimerkki C1

25 Liukeneva konsentraatti muodostetaan seuraavista:

Aktiivinen aineosa (yhdiste 1)	20 % paino/til.
Kaliumhydroksidiliuos 33 % paino/til.	10 % til./til.
Tetrahydrofurfuryylialkoholi (THFA)	10 % til./til.
30 Vesi	tilavuuteen 100

sekoittamalla THFA, aktiivinen aineosa (yhdiste 1) ja 90 tilavuus-% vettä ja lisäämällä hitaasti kaliumhydroksidiliuos kunnes saadaan vakaa pH 7-8 ja tekemällä sitten tilavuuteen vedellä.

35

Samanlaisia konsentraatteja kuin edellä kuvatut voidaan valmistaa korvaamalla isoksatsoli (yhdiste 1) muilla kaavan (I) mukaisilla yhdisteillä.

Esimerkki C2

Kostutettava jauhe muodostetaan seuraavista:

	Aktiivinen aineosa (yhdiste 1)	50 % paino/paino
5	Natriumdodekyylibentseenisulfonaatti	3 % paino/paino
	Natriumlignosulfaatti	5 % paino./paino
	Natriumformaldehydialkyli- naftaleenisulfonaatti	2 % paino/paino
	Mikrohieno piidioksidi	3 % paino/paino
10	Kiinan savi	37 % paino/paino

sekoittamalla edellä mainitut aineosat yhteen ja jauhamalla seos ilmasuihkumyllyssä.

- 15 Samanlaisia kostutettavia jauheita voidaan valmistaa, kuten edellä kuvataan, korvaamalla isoksatsoli (yhdiste 1) muilla kaavan (I) mukaisilla yhdisteillä.

Esimerkki C3

- 20 Veteen liukeneva jauhe muodostetaan seuraavista:

	Aktiivinen aineosa (yhdiste 1)	50 % paino/paino
	Natriumdodekyylibentseenisulfonaatti	13 % paino/paino
	Mikrohieno piidioksidi	2 % paino/paino
25	Natriumbikarbonaatti	47 % paino/paino

sekoittamalla edellä mainitut aineosat yhteen ja jauhamalla seos vasaramyllyssä.

- 30 Samanlaisia veteen liukenevia jauheita voidaan valmistaa, kuten edellä kuvataan, korvaamalla isoksatsoli (yhdiste 1) muilla kaavan (I) mukaisilla yhdisteillä.

- 35 Keksinnön mukaisia yhdisteitä on käytetty herbisidisissä käytöissä seuraavien menetelmien mukaisesti.

Herbisidisten yhdisteiden käyttömenetelmäa) Yleinen

Sopiiva määrä kasvien käsittelyyn käytettyjä yhdisteitä liuotettiin asetoniin liuosten saamiseksi, jotka ovat ekvivalenttisia käyttömäärien korkeintaan 4000 g testiyhdistettä hehtaaria kohti (g/ha) kanssa. Nämä liuokset levitettiin standardista laboratorierbisidisumuttimesta, joka välittää 290 litran ekvivalentin sumutusnestettä hehtaaria kohti.

b) Rikkaruohojen torjunta: Ennen kasvamista

10 Siemeniä kylvettiin 70 mm²:n 75 mm syvään muoviruukkuun eisteriiliin multa. Siementen määrä ruukkua kohti oli seuraava.

		<u>Siementen keskimääräinen määrä/ruukku</u>
15	<u>Rikkaruoholaji</u>	
	<u>1) Leveälehtiset rikkaruohot</u>	
	Abutilon theophrasti	10
	Amaranthus retroflexus	20
	Galium aparine	10
20	Ipomoea purpurea	10
	Sinapis arvensis	15
	Xanthium strumarium	2
	<u>2) Ruohorikkaruohot</u>	
25	Alopecurus myosuroides	15
	Avena fatua	10
	Echinochloa crus-galli	15
	Setaria viridis	20
30	<u>3) Sarat</u>	
	Cyperus esculentus	3
	<u>Viljelykasvit</u>	
	<u>1) Leveälehtiset</u>	
35	Puuvilla	3
	Soija	3
	<u>2) Ruohot</u>	
	Maissi	2

Riisi	6
Vehnä	6

Keksinnön mukaiset yhdisteet levitetään siemeniä sisältävän
 5 maan pintaan kuten (a):ssa kuvataan. Kunkin viljelykasvin
 ja rikkaruohon yksittäinen ruukku varattiin jokaiseen kä-
 sittelyyn sumuttamattomina verrokkeineen ja verrokkeineen,
 joihin oli sumutettu pelkästään asetonia.

- 10 Käsittelyn jälkeen ruukut sijoitettiin kapillaarimatolle
 lasikoteloon ja niitä kasteltiin päältä. Viljelykasvin va-
 hingoittumisen visuaalinen arviointi tehtiin 20-24 päivää
 sumuttamisen jälkeen. Tulokset on esitetty viljakasvin tai
 rikkaruohojen kasvun tai vahingoittumisen vähenemisprosent-
 15 tina verrattuna verrokkiruukuissa oleviin kasveihin.

c) Rikkaruohojen torjunta: Kasvun jälkeen

Rikkaruohot ja viljelykasvit kylvettiin suoraan John Inne-
 sin ruukkukompostiin 75 mm syvälle, 70 mm²:n ruukkuihin
 20 paitsi Amaranthus, joka otettiin siemennysvaiheessa ja
 siirrettiin ruukkuihin viikko ennen sumuttamista. Sitten
 kasveja viljeltiin kasvihuoneessa kunnes ne olivat valmiita
 sumutukselle kasvien käsittelyyn käytetyillä yhdisteillä.
 Kasvien lukumäärä ruukkaa kohti oli seuraava:

25

1) Leveälehtiset rikkaruohot

<u>Rikkaruoholaji</u>	<u>Kasvimäärä/ ruukku</u>	<u>Kasvuvaihe</u>
Abutilon theophrasti	3	1-2 lehteä
30 Amaranthus retroflexus	4	1-2 lehteä
Galium aparine	3	1. kiehkura
Ipomoea purpurea	3	1-2 lehteä
Sinapis arvensis	4	2 lehteä
Xanthium strumarium	1	2-3 lehteä

35

2) Ruohorikkaruohot

<u>Rikkaruoholaji</u>	<u>Kasvimäärä/ ruukku</u>	<u>Kasvuvaihe</u>
Alopecurus myosuroides	8-12	1-2 lehteä

Avena fatua	12-18	1-2 lehteä
Echinochloa crus-galli	4	2-3 lehteä
Setaria viridis	15-25	1-2 lehteä

5 3) Sarat

<u>Rikkaruoholaji</u>	<u>Kasvimäärä/ ruukku</u>	<u>Kasvuvaihe</u>
Cyperus esculentus	3	3 lehteä

10 1) Leveälehtiset

<u>Viljelykasvit</u>	<u>Kasvimäärä/ ruukku</u>	<u>Kasvuvaihe</u>
Puuvilla	2	1 lehti
Soija	2	2 lehteä

15

2) Ruohot

<u>Viljelykasvit</u>	<u>Kasvimäärä/ ruukku</u>	<u>Kasvuvaihe</u>
Maissi	2	2-3 lehteä
20 Riisi	4	2-3 lehteä
Vehnä	5	2-3 lehteä

25 Kasvien käsittelyyn käytetyt yhdisteet levitettiin kasveille, kuten (a):ssa kuvataan. Kunkin viljelykasvin ja rikkaruoholajin yksittäinen ruukku varattiin jokaiseen käsittelyyn sumuttamattomine verrokkeineen ja verrokkeineen, joihin oli sumutettu pelkästään asetonia.

30 Käsittelyn jälkeen ruukut sijoitettiin kapillaarimatolle lasikoteloon ja niitä kasteltiin päältä kerran kahdessa tunnissa ja sitten kontrolloidulla pohjakastelulla. Viljelykasvin vahingoittumisen ja rikkaruohotorjunnan visuaalinen arviointi tehtiin 20-24 päivää sumuttamisen jälkeen. Tulokset on esitetty viljakasvin tai rikkaruohojen kasvun 35 tai vahingoittumisen vähenemisprosenttina verrattuna verrokkiruukuissa oleviin kasveihin.

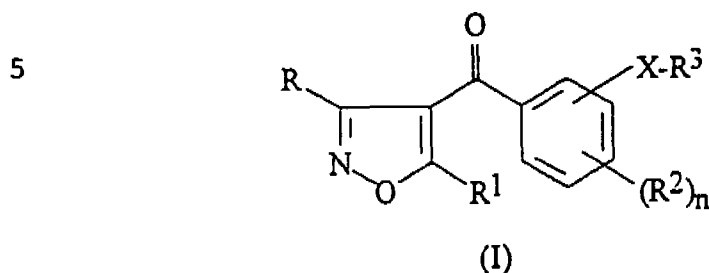
Keksinnön mukaisilla yhdisteillä on käytettynä 4 kg/ha tai vähemmän rikkaruohoissa erinomainen herbisidisen aktiivi-

suuden taso yhdistettynä viljan toleranssiin, kun niitä käytettiin edellisissä kokeissa.

Käytettynä ennen tai jälkeen kasvun 1000 g/ha yhdisteet 1-
5 7 tuottivat vähintään 90 % vähenemisen yhden tai useamman rikkaruoholajin kasvussa.

Patenttivaatimukset

1. Kaavan (I) mukainen 4-bentsoyyli-isoksatsolijohdannainen:



10 tunnettu siitä, että

R on vetyatomi tai ryhmä $-\text{CO}_2\text{R}^4$,

15 R^1 on

korkeintaan kuusi hiiliatomia sisältävä suora- tai haaraketjuinen alkyyliryhmä, joka on substituoitu optionaalisesti yhdellä tai useammalla halogeeniatomilla, tai

20 3-6 hiiliatomia sisältävä sykloalkyyliiryhmä, joka on substituoitu optionaalisesti yhdellä tai useammalla ryhmällä R^5 tai yhdellä tai useammalla halogeeniatomilla,

R^2 on

25 halogeeniatomi,

korkeintaan 6 hiiliatomia sisältävä suora- tai haaraketjuinen alkyyliryhmä, joka on substituoitu optionaalisesti yhdellä tai useammalla halogeeniatomilla,

30

korkeintaan 6 hiiliatomia sisältävä suora- tai haaraketjuinen alkyyliryhmä, joka on substituoitu yhdellä tai useammalla ryhmällä $-\text{OR}^5$, tai

35 ryhmä, joka on valittu nitrosta, syanosta, $-\text{CO}_2\text{R}^5$:stä, $-\text{S}(\text{O})_p\text{R}^6$:sta, $-\text{O}(\text{CH}_2)_m\text{OR}^5$:stä, $-\text{COR}^5$:stä, OR^5 :stä ja $-\text{N}(\text{R}^8)\text{SO}_2\text{R}^7$:stä,

R^3 on $-\text{SO}_2\text{R}^7$,

X on happiatomi,

n on 0 tai kokonaisluku 1-4; kun n on suurempi kuin 1, ryhmät R^2 voivat olla samanlaiset tai erilaiset,

5

R^4 on korkeintaan kuusi hiiliatomia sisältävä suora- tai haaraketjuinen alkyyliryhmä, joka on substituoitu optionaalisesti yhdellä tai useammalla halogeeniatomilla,

10 R^5 ja R^6 , jotka voivat olla samanlaiset tai erilaiset, ovat kumpikin

korkeintaan 6 hiiliatomia sisältävä suora- tai haaraketjuinen alkyyliryhmä, joka on substituoitu optionaalisesti yhdellä tai useammalla halogeeniatomilla,

15

fenyyli, joka on substituoitu optionaalisesti 1-5 ryhmällä R^2 , jotka voivat olla samanlaiset tai erilaiset,

20 R^7 on

korkeintaan 6 hiiliatomia sisältävä suora- tai haaraketjuinen alkyyliryhmä, joka on substituoitu optionaalisesti yhdellä tai useammalla halogeeniatomilla,

25 fenyyli, joka on substituoitu optionaalisesti 1-5 ryhmällä R^2 , jotka voivat olla samanlaiset tai erilaiset, tai

ryhmä $-NR^5R^6$,

30 R^8 on

vetyatomi,

korkeintaan kuusi hiiliatomia sisältävä suora- tai haaraketjuinen alkyyli-, alkenyyli- tai alkynyyli-ryhmä, joka on substituoitu optionaalisesti yhdellä tai useammalla halogeeniatomilla,

35

3-6 hiiliatomia sisältävä sykloalkyyliryhmä,

fenyyli, joka on substituoitu optionaalisesti 1-5 ryhmällä, jotka voivat olla samanlaiset tai erilaiset ja valittu halogeenistä, nitrosta, syanosta, R^5 :stä, $S(O)_pR^5$:stä ja $-OR^5$:stä, tai

5

ryhmä, joka on valittu $-SO^2R^6$:sta ja $-OR^5$:stä,

p on 0, 1 tai 2, ja

10 m on kokonaisluku 1-3.

2. Patenttivaatimuksen 1 mukainen yhdiste, t u n n e t t u siitä, että

15 R^8 on

vetyatomi,

korkeintaan kuusi hiiliatomia sisältävä suora- tai haaraketjuinen alkyyli-, alkenyyli- tai alkynyyliryhmä, joka on
20 substituoitu optionaalisesti yhdellä tai useammalla halogeeniatomilla,

ryhmä $-SO^2R^6$, jossa R^6 on patenttivaatimuksessa 1 määritetty.

25

3. Patenttivaatimuksen 1 tai 2 mukainen yhdiste, t u n n e t t u siitä, että

R^1 on korkeintaan kolme hiiliatomia sisältävä suora- tai
30 haaraketjuinen alkyyliryhmä, syklopropyyli tai 1-metyyli-syklopropyyli,

R^2 on

halogeeniatomi,

35

korkeintaan 4 hiiliatomia sisältävä suora- tai haaraketjuinen alkyyliryhmä, joka on substituoitu optionaalisesti yhdellä tai useammalla halogeeniatomilla,

korkeintaan 4 hiiliatomia sisältävä suora- tai haaraketjuinen alkyyliryhmä, joka on substituoitu yhdellä tai useammalla ryhmällä $-OR^5$, tai

- 5 ryhmä, joka on valittu nitrosta, syanosta, $-CO_2R^5$:stä, $-S(O)_pR^6$:sta, $-O(CH_2)_mOR^5$:stä, OR^5 :stä ja $-N(R^8)SO_2R^7$:stä,

R^4 on korkeintaan kuusi hiiliatomia sisältävä suora- tai haaraketjuinen alkyyliryhmä,

10

R^5 ja R^6 , jotka voivat olla samanlaiset tai erilaiset, ovat kumpikin korkeintaan 4 hiiliatomia sisältävä suora- tai haaraketjuinen alkyyliryhmä, joka on substituoitu optionaalisesti yhdellä tai useammalla halogeeniatomilla,

15

R^7 on korkeintaan 4 hiiliatomia sisältävä suora- tai haaraketjuinen alkyyliryhmä, joka on substituoitu optionaalisesti yhdellä tai useammalla halogeeniatomilla,

- 20 R^8 on korkeintaan kolme hiiliatomia sisältävä suora- tai haaraketjuinen alkyyliryhmä,

n on 0, 1 tai 2, ja

- 25 m on 2 tai 3.

4. Patenttivaatimuksen 1, 2 tai 3 mukainen yhdiste, tunnettu siitä, että

- 30 R^1 on korkeintaan kolme hiiliatomia sisältävä suora- tai haaraketjuinen alkyyliryhmä, syklopropyyli tai 1-metyylisyklopropyyli,

R^2 on

- 35 halogeeniatomi,

korkeintaan 4 hiiliatomia sisältävä suora- tai haaraketjuinen alkyyliryhmä, joka on substituoitu optionaalisesti yhdellä tai useammalla halogeeniatomilla,

korkeintaan 4 hiiliatomia sisältävä suora- tai haaraketjuinen alkyyliryhmä, joka on substituoitu yhdellä tai useammalla ryhmällä $-OR^5$, tai

- 5 ryhmä, joka on valittu $-S(O)_pR^6$:sta, $-O(CH_2)_mOR^5$:stä ja OR^5 :stä,

R^4 on korkeintaan kuusi hiiliatomia sisältävä suora- tai haaraketjuinen alkyyliryhmä,

10

R^5 on 1 tai 2 hiiliatomia sisältävä alkyyliryhmä, joka on substituoitu optionaalisesti yhdellä tai useammalla halogeeniatomilla,

- 15 R^6 on metyyli- tai etyyli-ryhmä,

R^7 on korkeintaan 4 hiiliatomia sisältävä suora- tai haaraketjuinen alkyyliryhmä,

- 20 R^8 on korkeintaan kolme hiiliatomia sisältävä suora- tai haaraketjuinen alkyyliryhmä,

n on 0, 1 tai 2, ja

- 25 m on 2 tai 3.

5. Jonkin edellisen patenttivaatimuksen mukainen yhdiste, tunnettu siitä, että

- 30 R^2 on
halogeeniatomi,

korkeintaan 1 tai 2 hiiliatomia sisältävä alkyyliryhmä, joka on substituoitu optionaalisesti yhdellä tai useammalla
35 halogeeniatomilla,

$-S(O)_pR^6$:sta tai OR^5 ,

R^4 on metyyli- tai etyyli-ryhmä,

R⁵ on 1 tai 2 hiiliatomia sisältävä alkyyliryhmä, joka on substituoitu optionaalisesti yhdellä tai useammalla halogeeniatomilla,

5 R⁶ on metyyli- tai etyyli-ryhmä,

R⁷ on metyyli- tai etyyli-ryhmä,

10 R⁸ on korkeintaan kolme hiiliatomia sisältävä suora- tai haaraketjuinen alkyyliryhmä,

n on 0, 1 tai 2, ja

m on 2.

15

6. Patenttivaatimuksen 1 tai 2 mukainen yhdiste, t u n n e t t u siitä, että

R on vetyatomi,

20

R¹ on etyyli tai syklopropyyli,

R² on halogeeni,

25 R³ on -SO₂R⁷,

X on happiatomi,

n on 0 tai 1, ja

30

R⁷ on metyyli, etyyli tai -NMe₂.

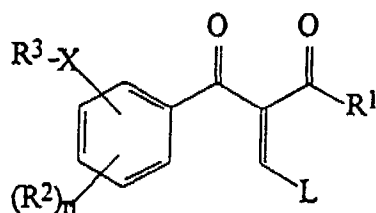
7. Patenttivaatimuksen 1 tai 2 mukainen yhdiste, t u n n e t t u siitä, että se on

35 4-[2-kloori-4-(metyyli-sulfonyylioksi)bentsoyyli]-5-syklopropyyli-isoksatsoli,
5-syklopropyyli-4-[2-(metyyli-sulfonyylioksi)bentsoyyli]-isoksatsoli,

- 4-[4-kloori-2-(metyylisulfonyylioksi)bentsoyyli]-5-syklopropyyli-isoksatsoli,
 5-syklopropyyli-4-[2-etyylisulfonyylioksi)bentsoyyli]-isoksatsoli,
 5 5-syklopropyyli-4-[2-(N,N-dimetyyliamino)sulfonyylioksi)-bentsoyyli]-isoksatsoli,
 5-etyyli-4-[2-(metyylisulfonyylioksi)bentsoyyli]-isoksatsoli,
 4-[5-kloori-2-(metyylisulfonyylioksi)bentsoyyli]-5-syklopropyyli-isoksatsoli.
 10

8. Menetelmä patenttivaatimuksessa 1 tai 2 määritetyn yhdisteen valmistamiseksi, t u n n e t t u siitä, että se käsittää:

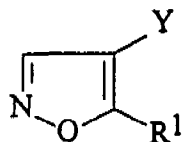
- 15 a) silloin kun R on vety, kaavan (II) mukaisen yhdisteen:



(II)

jossa L on poistuva ryhmä ja R^1 , R^2 , R^3 , n ja X ovat patenttivaatimuksessa 1 tai 2 määritetyt, reagoittamisen hydroksyyliamiinin tai sen suolan kanssa,
 25

- b) silloin kun R on vety, kaavan (III) mukaisen yhdisteen:

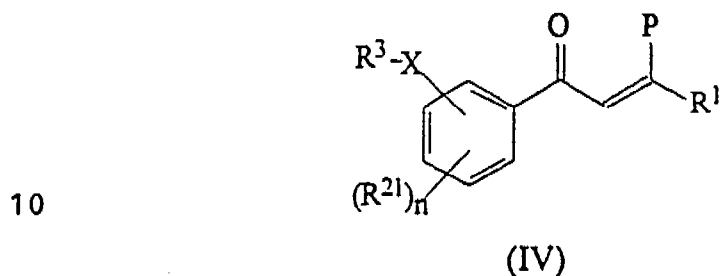


(III)

35 jossa R^1 on patenttivaatimuksessa 1 tai 2 määritetty ja Y on karboksiryhmä tai sen reaktiivinen johdannainen tai syanoryhmä, reagoittamisen sopivan metalliorgaanisen reagenssin kanssa,

c) silloin kun R on ryhmä $-\text{CO}_2\text{R}^4$ ja R^2 on ryhmä R^{21} , joka on määritetty patenttivaatimuksessa 1 tai 2 R^2 osalta, edellyttäen että p on 0 tai 2, kaavan (IV) mukaisen yhdis-

5 teen:

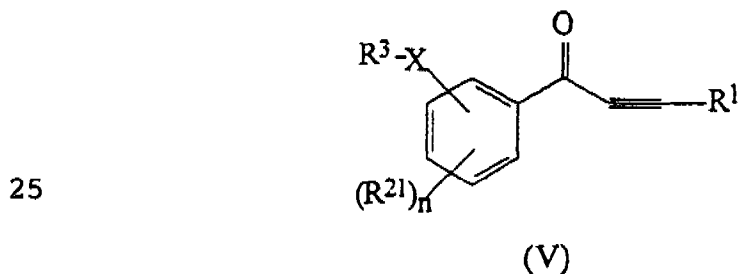


jossa R^1 , R^3 , X ja n ovat patenttivaatimuksessa 1 tai 2 määritetyt, P on poistuva ryhmä ja R^{21} on edellä määritet-

15 ty, reagoittamisen kaavan $\text{R}^4\text{O}_2\text{CC}(\text{Z})=\text{NOH}$, jossa R^4 on patenttivaatimuksessa 1 tai 2 määritetty ja Z on halogeeniatomi, mukaisen yhdisteen kanssa,

d) silloin kun R on ryhmä $-\text{CO}_2\text{R}^4$ ja R^2 on edellä määritelty

20 ryhmä R^{21} , kaavan (V) mukaisen yhdisteen:

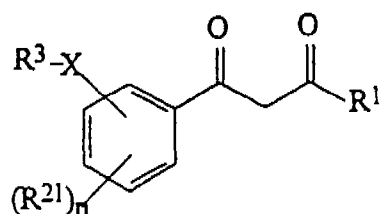


jossa R^1 , R^3 , X ja n ovat patenttivaatimuksessa 1 tai 2 määritetyt ja R^{21} on edellä määritetty, reagoittamisen kaa-

30 van $\text{R}^4\text{O}_2\text{CC}(\text{Z})=\text{NOH}$, jossa R^4 on patenttivaatimuksessa 1 tai 2 määritetty ja Z on halogeeniatomi, mukaisen yhdisteen kanssa,

e) silloin kun R on ryhmä $-\text{CO}_2\text{R}^4$ ja R^2 on edellä määritelty

35 ryhmä R^{21} , kaavan (VI) mukaisen yhdisteen suolan:



(VI)

5 jossa kaavassa R^1 , R^3 , X ja n ovat patenttivaatimuksessa 1 tai 2 määritetyt ja R^{21} on edellä määritetty, reagoittamisen kaavan $R^4O_2CC(Z)-NOH$, jossa R^4 on patenttivaatimuksessa 10 1 tai 2 määritetty ja Z on halogeeniatomi, mukaisen yhdisteen kanssa,

f) silloin kun p on 1 tai 2, kaavan (I) mukaisen vastaavan 15 yhdisteen, jossa p on 0 tai 1, rikkiatomin hapettamisen.

9. Herbisidikoostumus, t u n n e t t u siitä, että se käsittää aktiivisena aineosana herbisidisesti tehokkaan määrän missä tahansa patenttivaatimuksista 1-7 määriteltyä 20 kaavan (I) mukaista 4-bentsoyyli-isoksatsoli johdannaista yhdistettynä maanviljelyksellisesti hyväksyttävään laimentimeen tai kantoaineeseen ja/tai pinta-aktiiviseen aineeseen.

25 10. Patenttivaatimuksen 9 mukainen herbisidikoostumus, t u n n e t t u siitä, että se on vesipitoisen suspensiokonsentraatin, kostutettavan jauheen, veteen liukenevan tai veteen dispergoituvan jauheen, nestemäisen veteen liukenevan konsentraatin, nestemäisen emulgoituvan suspensiokonsentraatin, rakeisen tai emulgoituvan konsentraatin muodossa. 30

11. Menetelmä rikkaruohojen kasvun torjumiseksi paikassa, t u n n e t t u siitä, että se käsittää herbisidisesti 35 tehokkaan määrän missä tahansa patenttivaatimuksessa 1-7 määritettyä kaavan (I) mukaista 4-bentsoyyli-isoksatsolia levittämisen paikkaan.

12. Patenttivaatimuksen 11 mukainen menetelmä, t u n-
n e t t u siitä, että paikka on alue, jota käytetään tai
tullaan käyttämään viljelykasvien viljelyyn ja yhdistettä
levitetään levitysmääränä 0,01 kg - 4,0 kg hehtaaria koh-

5 ti.