

2990/95

A  
KÖZZÉTETELI  
PÉLDÁNY

73747

KIVONAT

HERBICID HATÁSÚ (4-SZUBSZTITUÁLT 3-PIRIDIL)-KARBINOL-  
-SZÁRMAZÉKOK

ZENECA LIMITED,

London, GB

A bejelentés napja: 1994. 04. 21.

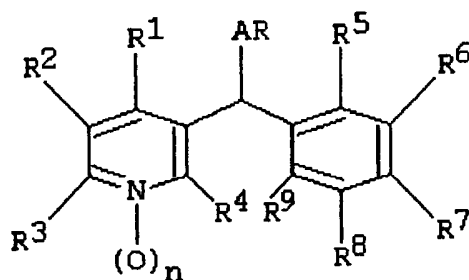
Az elsőbbség napja: 1993. 04. 22.

(08/051,490 US)

A nemzetközi bejelentés száma: PCT/GB94/00845

A nemzetközi közzététel száma: WO 94/24106

A találmány preemergens és posztemergens herbicid hatással rendelkező, (I) általános képletű



(I)

(4-szubsztituált 3-piridil)-karbonil-származékokra és mezőgazdaságilag elfogadható sóikra vonatkozik, ahol a képletben

$R^1$  és  $R^5$  halogénatom, halogén-alkil-, alkil-, alkoxi-, halogén-alkoxi-, alkoxi-alkil-,  $-S(O)_m-R^{10}$ , ciano-, hidroxil-, tiocianát-, nitro- vagy  $-N(R^{11})(R^{12})$  csoport;

$R^2$ ,  $R^3$  és  $R^4$  hidrogén-, halogénatom, alkil-, nitro-, alkoxi-, halogén-alkoxi-, halogén-alkil- vagy  $-S(O)_m-R^{10}$  csoport;

$R^6$ ,  $R^7$  és  $R^8$  hidrogén-, halogénatom, alkil-, alkenil-, alkinil-, nitro-,  $-N(R^{11})(R^{12})$ , halogén-alkil-, alkoxi-, halogén-alkoxi-, alkoxi-alkil-, halogén-alkoxi-alkil-, ciano-,  $-C(X)-R^{10}$  vagy  $-S(O)_m-R^{10}$  csoport;

$R^9$  hidrogén-, halogénatom, alkil-, halogén-alkil-, alkoxi-, halogén-alkoxi-, alkoxi-alkil-,  $-S(O)_m-R^{10}$ , ciano-, hidroxil-, tiocianát-, nitro- vagy  $-N(R^{11})(R^{12})$  csoport;

A oxigén- vagy kénatom;

n 0 vagy 1; és

R hidrogénatom, adott esetben szubsztituált hidrokartil-,  
-C(X)-R<sup>10</sup>, -C(O)-C(O)-R<sup>10</sup>, -S(O)<sub>2</sub>-R<sup>10</sup> vagy -P(X)(R<sup>15</sup>)(R<sup>16</sup>)  
csoport; ahol

X oxigén- vagy kénatom;

R<sup>10</sup> adott esetben szubsztituált hidrokartil-, hidro-  
kartil-oxi-, hidrokartil-tio- vagy -N(R<sup>11</sup>)(R<sup>12</sup>)  
csoport;

R<sup>11</sup> és R<sup>12</sup> hidrogénatom, adott esetben szubsztituált  
hidrokartil-, hidrokartil-oxi-, piridil-, fu-  
ril-, tienil-, alkoxi-karbonil-alkil-, hidroxil-  
-karbonil-alkil- vagy -N(R<sup>13</sup>)(R<sup>14</sup>) csoport; vagy

R<sup>11</sup> és R<sup>12</sup> a nitrogénatommal együtt adott esetben  
szubsztituált aziridin-, piperazin-, morfolin-,  
tiomorfolin-, tiomorfolin-szulfinil-, tiomorfo-  
lin-szulfonil-, hexametilénimin-, piperidin-  
vagy pirrolidingyűrűt képeznek;

R<sup>13</sup> és R<sup>14</sup> hidrogénatom, alkil- vagy fenilcsoport;

R<sup>15</sup> és R<sup>16</sup> alkil-, alkil-tio- vagy alkoxics csoport; és

m 0, 1 vagy 2;

azzal a megkötéssel, hogy amennyiben R<sup>1</sup> jelentése klóratom vagy  
fluoratom; R<sup>5</sup> jelentése hidrogénatom, klóratom, fluoratom vagy  
metoxics csoport; valamint R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> és R<sup>9</sup> jelentése hid-  
rogénatom; akkor R jelentése hidrogénatomtól eltérő.

A találmány kiterjed az ezeket a vegyületeket tartalmazó  
herbicide készítményekre, továbbá nemkívánatos növényeknek a ta-  
lálmány szerinti vegyületek alkalmazásával végzett szabályozási  
eljárására is.

Azok az (I) általános képletű vegyületek, amelyekben AR  
jelentése hidroxics csoport, amellet, hogy önmagukban is rendel-  
keznek herbicide hatással, jól felhasználható intermediereként  
szolgálnak a benzilcsoport metilencsoportján szubsztituált ta-  
lálmány szerinti vegyületek előállításában.

A

GÓDÖLLE, KÉKES, MÉSZÁROS & SZABÓ  
Szabadalmi és Védjegy Iroda  
1024 Budapest, Keleti Károly u. 13/b  
Mészáros Enikő  
szabadalmi ügyvivő

KÖZZÉTÉTELI  
PÉLDÁNY

16575

2990/95

HERBICID HATÁSÚ (4-SZUBSZTITUÁLT 3-PIRIDIL)-KARBINOL-  
-SZÁRMAZÉKOK

ZENECA LIMITED,

London, GB

Feltalálók:

CHIN, Hsiao-Ling, Mao,

Moraga, Kalifornia, US

WEI, Yi, Qiu,

Pinole, Kalifornia, US

NGUYEN, Nhan, Huy,

Richmond, Kalifornia, US

A bejelentés napja: 1994. 04. 21.

Az elsőbbség napja: 1993. 04. 22.

(08/051,490 US)

A nemzetközi bejelentés száma: PCT/GB94/00845

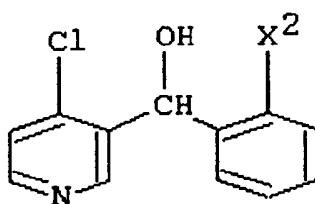
A nemzetközi közzététel száma: WO 94/24106

A találmány meglepően előnyös herbicid aktivitással rendelkező új, 4-szubsztituált 3-piridil-karbonil-származékokra vonatkozik. A találmány kiterjed az olyan herbicid készítményekre is, amelyek egy piridil-karbinolt és egy alkalmas hordozóanyagot tartalmaznak. A találmány tárgyát képezi továbbá egy eljárás nemkívánatos növényzet szabályozására, amelynek során a kontrollálandó területen herbicid szempontból hatásos mennyiségben egy piridil-karbinol-vegyületet alkalmazunk. Végül a találmány magában foglalja a 4-szubsztituált 3-piridil-karbinol-vegyületek előállításában felhasznált intermediereket is.

A hatékony herbicidek iránti igényt nem szükséges különösebben magyarázni. A gyomnövények és a nemkívánatos növényzet szabályozásának igen nagy gazdasági jelentősége van, tekintettel arra, hogy a konkurens gyomnövény gátolja a mezőgazdasági termények lombosodását, illetve gyümölcs- vagy magképződését. A gyomnövények jelenléte csökkentheti a betakarítás eredményességét, valamint a betakarított termény minőségét. A növénytermesztésbe be nem vont területeken lévő gyomnövények tűzveszélyt, nemkívánatos hó- vagy homokhordalék-képződést és/vagy allergiás panaszokat okozhatnak. Az előbbiek alapján érthető, hogy a nemkívánatos gyomnövekedés visszaszorítására igen nagy szükség van.

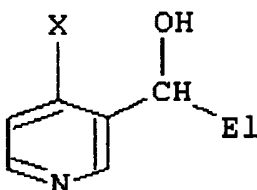
Ennek megfelelően a találmány egyrészt hatásos, új herbicid vegyületekre, másrészt új herbicid készítményekre, harmadrészt pedig új gyomnövény-szabályozási eljárásra vonatkozik. Az előbbieken kívül a találmány kiterjed az olyan köztitermékekre is, amelyek – amellett, hogy maguk is herbicid tulajdonságokat mutatnak – felhasználhatók más, herbicid aktivitással rendelkező vegyületek előállítására során.

Jóllehet bizonyos 4-szubsztituált 3-piridil-karbinol-vegyületek ismertek a szakterületen, azonban az ezeket a vegyületeket leíró publikációk utalást sem tartalmaznak a származékok esetleges alkalmazásáról. Például Radinov és munkatársai (Radinov et al., "synthesis of 4-Amino-3-pyridinyl and 4-Amino-5-pyrimidinyl Aryl Ketonos and Related Compounds via an ortho-Lithiation Reaction", *Synthesis*, pp. 886-891, November 1986) a hivatkozott közlemény 887. oldalán – egyebek mellett – olyan



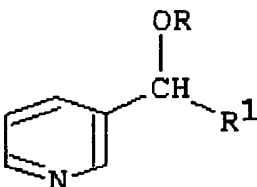
általános képletű vegyületeket ismertetnek, amelyek képletében X<sup>2</sup> jelentése klór- vagy fluoratom.

Némileg hasonló vegyületek előállítását írja le Marsais [Marsais et al., "Directed Lithiation of 4-Halopyridines: Chemoselectivity, Regioselectivity and Application to Synthesis", J. Heterocyclic Chem., Vol. 25, pp. 81-87 (1987)], ahol a vegyületek



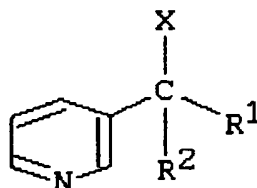
általános képletében El jelentése fenil- vagy 2-metoxi-fenil-csoport.

A 4 407 806. számú amerikai egyesült államokbeli szabadalmi leírásban (Cherpek) bizonyos



általános képletű, (szubsztituátlan 3-piridil)-karbinolokat ismertetnek (a képletben R és R<sup>1</sup> jelentése a hivatkozott szabadalmi leírásban megadott).

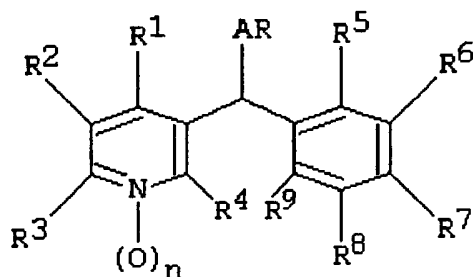
A 4 116 665. számú amerikai egyesült államokbeli szabadalmi leírásban (Krumkalns) eljárást ismertetnek vízi gyomnövények növekedésének szabályozására, amelynek során olyan



általános képletű vegyületeket alkalmaznak, amelyek képletében – egyebek mellett – R<sup>1</sup> jelentése hidrogénatom, R<sup>2</sup> jelentése

adott esetben szubsztituált fenilcsoport, és X jelentése hidrox-  
 i- vagy alkoxics csoport.

A jelen találmány egyik tárgya olyan (I) általános képletű  
 vegyületekre, valamint mezőgazdaságilag elfogadható sóikra vo-  
 natkozik,



(I)

amelyek képletében

$R^1$  és  $R^5$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül halogén-  
 atom, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-6 szénatomos  
 alkilcsoport, 1-6 szénatomos alkoxics csoport, 1-6 szénatomos  
 halogén-alkoxi-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szén-  
 atomos alkil)-csoport,  $-S(O)_m-R^{10}$  általános képletű cso-  
 port, cianocsoport, hidroxics csoport, tiocianátocsoport,  
 nitrocsoport vagy  $-N(R^{11})(R^{12})$  általános képletű csoport;

$R^2$ ,  $R^3$  és  $R^4$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hid-  
 rogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, nitrocsoport, ha-  
 logénatom, 1-6 szénatomos alkoxics csoport, 1-6 szénatomos  
 halogén-alkoxi-csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-cso-  
 port vagy  $-S(O)_m-R^{10}$  általános képletű csoport;

$R^6$ ,  $R^7$  és  $R^8$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hid-  
 rogénatom, halogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 2-6  
 szénatomos alkenilcsoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport,  
 nitrocsoport,  $-N(R^{11})(R^{12})$  általános képletű csoport, 1-6  
 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-6 szénatomos alkoxi-  
 csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, (1-6 szén-  
 atomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, halogén-  
 -(1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport,  
 cianocsoport,  $-C(X)-R^{10}$  vagy  $-S(O)_m-R^{10}$  általános képletű  
 csoport;

$R^9$  jelentése hidrogénatom, halogénatom, 1-6 szénatomos alkil-

csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-6 szénatomos alkoxics csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport,  $-S(O)_m-R^{10}$  általános képletű csoport, cianocsoport, hidroxics csoport, tiocianátocsoport, nitrocsoport vagy  $-N(R^{11})(R^{12})$  általános képletű csoport;

A jelentése oxigénatom vagy kénatom;

n értéke 0 vagy 1; és

R jelentése hidrogénatom, adott esetben egy vagy több halogénatommal vagy 1-6 szénatomos alkoxics csoporttal szubsztituált hidrokartilcsoport, vagy  $-C(X)-R^{10}$ ,  $-C(O)-C(O)-R^{10}$ ,  $-S(O)_2-R^{10}$  vagy  $-P(X)(R^{15})(R^{16})$  általános képletű csoport; ahol

X jelentése oxigénatom vagy kénatom;

$R^{10}$  jelentése adott esetben szubsztituált hidrokartilcsoport, adott esetben szubsztituált hidrokartil-oxi-csoport, adott esetben szubsztituált hidrokartil-tio-csoport vagy  $-N(R^{11})(R^{12})$  általános képletű csoport;

$R^{11}$  és  $R^{12}$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, adott esetben szubsztituált hidrokartilcsoport, adott esetben szubsztituált hidrokartil-oxi-csoport, piridilcsoport, furilcsoport, tienilcsoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, hidroxikarbonil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport vagy  $-N(R^{13})(R^{14})$  általános képletű csoport; vagy

$R^{11}$  és  $R^{12}$  azzal a nitrogénatommal együtt, amelyhez kötődnek, aziridin-, piperazin-, morfolin-, tiomorfolin-, tiomorfolin-szulfonil-, tiomorfolin-szulfonil-, hexametilénimin-, piperidin- vagy pirrolidingyűrűt képeznek, amelyek mindegyike adott esetben 1-6 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált lehet;

$R^{13}$  és  $R^{14}$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport vagy fenilcsoport;

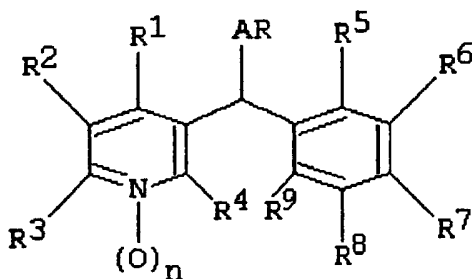
$R^{15}$  és  $R^{16}$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos alkil-tio-csoport vagy 1-6 szénatomos alkoxicssoport; és

$m$  értéke 0, 1 vagy 2;

azzal a megkötéssel, hogy amennyiben  $R^1$  jelentése klóratom vagy fluoratom;  $R^5$  jelentése hidrogénatom, klóratom, fluoratom vagy metoxicssoport; valamint  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$  és  $R^9$  jelentése hidrogénatom; akkor  $R$  jelentése hidrogénatomtól eltérő.

A találmány egy másik tárgyát egy olyan herbicid készítmény képezi, amely

(A) egy olyan (Ia) általános képletű vegyületet



(Ia)

vagy ennek egy mezőgazdaságilag elfogadható sóját tartalmazza, amelyben

$R^1$  és  $R^5$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül halogénatom, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos alkoxicssoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport,  $-S(O)_m-R^{10}$  általános képletű csoport, cianocsoport, hidroxicssoport, tiocianátocsoport, nitrocsoport vagy  $-N(R^{11})(R^{12})$  általános képletű csoport;

$R^2$ ,  $R^3$  és  $R^4$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, nitrocsoport, halogénatom, 1-6 szénatomos alkoxicssoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport vagy  $-S(O)_m-R^{10}$  általános képletű csoport;

$R^6$ ,  $R^7$  és  $R^8$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, halogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport,

- nitrocsoport,  $-N(R^{11})(R^{12})$  általános képletű csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-6 szénatomos alkoxi-csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, halogén-(1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, cianocsoport,  $-C(X)-R^{10}$  vagy  $-S(O)_m-R^{10}$  általános képletű csoport;
- $R^9$  jelentése hidrogénatom, halogénatom, 1-6 szénatomos alkil-csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-6 szénatomos alkoxicsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport,  $-S(O)_m-R^{10}$  általános képletű csoport, cianocsoport, hidroxicsoport, tiocianátocsoport, nitrocsoport vagy  $-N(R^{11})(R^{12})$  általános képletű csoport;
- A jelentése oxigénatom vagy kénatom;
- n értéke 0 vagy 1; és
- R jelentése hidrogénatom, adott esetben egy vagy több halogénatommal vagy 1-6 szénatomos alkoxicsoporttal szubsztituált hidrokartilcsoport, vagy  $-C(X)-R^{10}$ ,  $-C(O)-C(O)-R^{10}$ ,  $-S(O)_2-R^{10}$  vagy  $-P(X)(R^{15})(R^{16})$  általános képletű csoport;
- ahol
- X jelentése oxigénatom vagy kénatom;
  - $R^{10}$  jelentése adott esetben szubsztituált hidrokartilcsoport, adott esetben szubsztituált hidrokartil-oxi-csoport, adott esetben szubsztituált hidrokartil-tio-csoport vagy  $-N(R^{11})(R^{12})$  általános képletű csoport;
  - $R^{11}$  és  $R^{12}$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, adott esetben szubsztituált hidrokartilcsoport, adott esetben szubsztituált hidrokartil-oxi-csoport, piridilcsoport, furilcsoport, tienilcsoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, hidroxikarbonil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport vagy  $-N(R^{13})(R^{14})$  általános képletű csoport; vagy
  - $R^{11}$  és  $R^{12}$  azzal a nitrogénatommal együtt, amelyhez kötődnek, aziridin-, piperazin-, morfolin-, tio-

morfolin-, tiomorfolin-szulfonil-, tiomorfolin-szulfonil-, hexametilenimin-, piperidin- vagy pirrolidingyűrűt képeznek, amelyek mindegyike adott esetben 1-6 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált lehet;

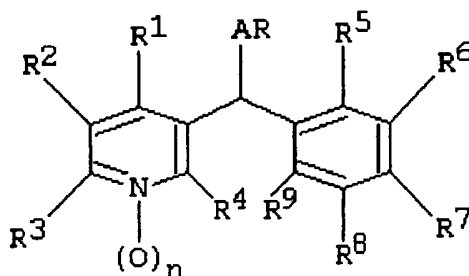
$R^{13}$  és  $R^{14}$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport vagy fenilcsoport;

$R^{15}$  és  $R^{16}$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos alkil-tio-csoport vagy 1-6 szénatomos alkoxicssoport; és

$m$  értéke 0, 1 vagy 2; és

(B) egy megfelelő hordozót tartalmaz.

A találmány egy további tárgya eljárás nemkívánatos növényzet szabályozására, amelynek során a kontrollálandó területre herbicid szempontból hatásos mennyiségben egy olyan (Ia) általános képletű vegyületet



(Ia)

vagy ennek egy mezőgazdaságilag elfogadható sóját juttatjuk ki, amelynek képletében

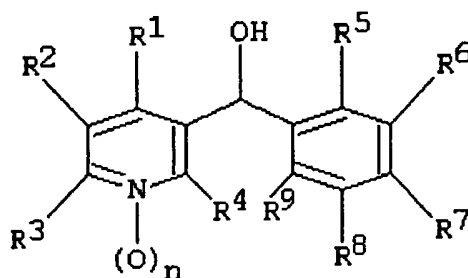
$R^1$  és  $R^5$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül halogénatom, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos alkoxicssoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport,  $-S(O)_m-R^{10}$  általános képletű csoport, cianocsoport, hidroxicssoport, tiocianátocsoport, nitrocsoport vagy  $-N(R^{11})(R^{12})$  általános képletű csoport;

$R^2$ ,  $R^3$  és  $R^4$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, nitrocsoport, ha-

- logénatom, 1-6 szénatomos alkoxicsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport vagy  $-S(O)_m-R^{10}$  általános képletű csoport;
- $R^6$ ,  $R^7$  és  $R^8$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, halogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport, nitrocsoport,  $-N(R^{11})(R^{12})$  általános képletű csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-6 szénatomos alkoxi-csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, halogén-(1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, cianocsoport,  $-C(X)-R^{10}$  vagy  $-S(O)_m-R^{10}$  általános képletű csoport;
- $R^9$  jelentése hidrogénatom, halogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-6 szénatomos alkoxicsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport,  $-S(O)_m-R^{10}$  általános képletű csoport, cianocsoport, hidroxicsoport, tiocianátocsoport, nitrocsoport vagy  $-N(R^{11})(R^{12})$  általános képletű csoport;
- A jelentése oxigénatom vagy kénatom;
- n értéke 0 vagy 1; és
- R jelentése hidrogénatom, adott esetben egy vagy több halogénatommal vagy 1-6 szénatomos alkoxicsoporttal szubsztituált hidrokabilcsoport, vagy  $-C(X)-R^{10}$ ,  $-C(O)-C(O)-R^{10}$ ,  $-S(O)_2-R^{10}$  vagy  $-P(X)(R^{15})(R^{16})$  általános képletű csoport;
- ahol
- X jelentése oxigénatom vagy kénatom;
  - $R^{10}$  jelentése adott esetben szubsztituált hidrokabilcsoport, adott esetben szubsztituált hidrokabil-oxi-csoport, adott esetben szubsztituált hidrokabil-tio-csoport vagy  $-N(R^{11})(R^{12})$  általános képletű csoport;
  - $R^{11}$  és  $R^{12}$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, adott esetben szubsztituált hidrokabilcsoport, adott esetben szubsztituált hidrokabil-oxi-csoport, piridilcsoport, furil-

csoport, tienilcsoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-  
 -karbonil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, hidro-  
 xi-karbonil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport vagy  
 $-N(R^{13})(R^{14})$  általános képletű csoport; vagy  
 $R^{11}$  és  $R^{12}$  azzal a nitrogénatommal együtt, amelyhez  
 kötődnek, aziridin-, piperazin-, morfolin-, tio-  
 morfolin-, tiomorfolin-szulfinil-, tiomorfolin-  
 -szulfonil-, hexametilénimin-, piperidin- vagy  
 pirrolidingyűrűt képeznek, amelyek mindegyike  
 adott esetben 1-6 szénatomos alkilcsoporttal  
 szubsztituált lehet;  
 $R^{13}$  és  $R^{14}$  mindegyikének jelentése egymástól függet-  
 lenül hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport  
 vagy fenilcsoport;  
 $R^{15}$  és  $R^{16}$  mindegyikének jelentése egymástól függet-  
 lenül 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénato-  
 mos alkil-tio-csoport vagy 1-6 szénatomos al-  
 koxicssoport; és  
 m értéke 0, 1 vagy 2.

Tekintettel arra, hogy az olyan találmány szerinti vegyü-  
 letek, amelyek képletében AR jelentése hidroxicssoport, interme-  
 dierekként alkalmazhatók más találmány szerinti vegyületek elő-  
 állítása során, mimellett ezek a vegyületek herbicid aktivitás-  
 sal is rendelkeznek, ugyancsak a találmány tárgyát képezik az  
 olyan (II) általános képletű vegyületek,



(II)

valamint ezek mezőgazdaságilag elfogadható sói, amelyek képle-  
 tében

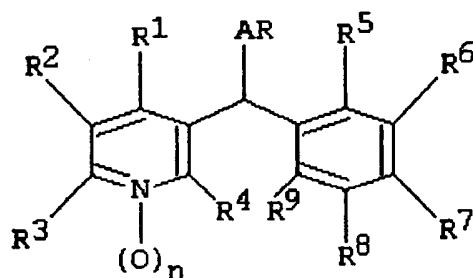
$R^1$  és  $R^5$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül halogén-  
 atom, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-6 szénatomos



csoport, tienilcsoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-  
 -karbonil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, hidro-  
 xi-karbonil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport vagy  
 $-N(R^{13})(R^{14})$  általános képletű csoport; vagy  
 $R^{11}$  és  $R^{12}$  azzal a nitrogénatommal együtt, amelyhez  
 kötődnek, aziridin-, piperazin-, morfolin-, tio-  
 morfolin-, tiomorfolin-szulfinil-, tiomorfolin-  
 -szulfonil-, hexametilénimin-, piperidin- vagy  
 pirrolidingyűrűt képeznek, amelyek mindegyike  
 adott esetben 1-6 szénatomos alkilcsoporttal  
 szubsztituált lehet;  
 $R^{13}$  és  $R^{14}$  mindegyikének jelentése egymástól függet-  
 lenül hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport  
 vagy fenilcsoport;  
 $R^{15}$  és  $R^{16}$  mindegyikének jelentése egymástól függet-  
 lenül 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénato-  
 mos alkil-tio-csoport vagy 1-6 szénatomos alko-  
 xics csoport; és  
 m értéke 0, 1 vagy 2;

azzal a megkötéssel, hogy amennyiben  $R^5$  jelentése hidrogénatom,  
 klóratom, fluoratom vagy metoxics csoport; valamint  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^6$ ,  
 $R^7$ ,  $R^8$  és  $R^9$  jelentése hidrogénatom; akkor  $R^1$  jelentése klór-  
 atomtól vagy fluoratomtól eltérő.

A találmány szerinti, herbicid hatású új vegyületek és me-  
 zőgazdaságilag elfogadható sóik olyan (I) általános képlettel



(I)

amelyben

$R^1$  és  $R^5$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül halogén-  
 atom, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-6 szénatomos  
 alkilcsoport, 1-6 szénatomos alko-xics csoport, 1-6 szénatomos

- halogén-alkoxi-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport,  $-S(O)_m-R^{10}$  általános képletű csoport, cianocsoport, hidroxics csoport, tiocianátocsoport, nitrocsoport vagy  $-N(R^{11})(R^{12})$  általános képletű csoport;
- $R^2$ ,  $R^3$  és  $R^4$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, nitrocsoport, halogénatom, 1-6 szénatomos alkoxics csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport vagy  $-S(O)_m-R^{10}$  általános képletű csoport;
- $R^6$ ,  $R^7$  és  $R^8$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, halogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport, nitrocsoport,  $-N(R^{11})(R^{12})$  általános képletű csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-6 szénatomos alkoxi-csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, halogén-(1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, cianocsoport,  $-C(X)-R^{10}$  vagy  $-S(O)_m-R^{10}$  általános képletű csoport;
- $R^9$  jelentése hidrogénatom, halogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-6 szénatomos alkoxics csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport,  $-S(O)_m-R^{10}$  általános képletű csoport, cianocsoport, hidroxics csoport, tiocianátocsoport, nitrocsoport vagy  $-N(R^{11})(R^{12})$  általános képletű csoport;
- A jelentése oxigénatom vagy kénatom;
- n értéke 0 vagy 1; és
- R jelentése hidrogénatom, adott esetben egy vagy több halogénatommal vagy 1-6 szénatomos alkoxics csoporttal szubsztituált hidrokARBILcsoport, vagy  $-C(X)-R^{10}$ ,  $-C(O)-C(O)-R^{10}$ ,  $-S(O)_2-R^{10}$  vagy  $-P(X)(R^{15})(R^{16})$  általános képletű csoport;
- ahol
- X jelentése oxigénatom vagy kénatom;
  - $R^{10}$  jelentése adott esetben szubsztituált hidrokARBILcsoport, adott esetben szubsztituált hidrokARBIL-oxi-csoport, adott esetben szubsztituált

hidrokarbil-tio-csoport vagy  $-N(R^{11})(R^{12})$  általános képletű csoport;

$R^{11}$  és  $R^{12}$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, adott esetben szubsztituált hidrokarbilcsoport, adott esetben szubsztituált hidrokarbil-oxi-csoport, piridilcsoport, furilcsoport, tienilcsoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, hidroxikarbonil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport vagy  $-N(R^{13})(R^{14})$  általános képletű csoport; vagy

$R^{11}$  és  $R^{12}$  azzal a nitrogénatommal együtt, amelyhez kötődnek, aziridin-, piperazin-, morfolin-, tiomorfolin-, tiomorfolin-szulfinil-, tiomorfolin-szulfonil-, hexametilénimin-, piperidin- vagy pirrolidingyűrűt képeznek, amelyek mindegyike adott esetben 1-6 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált lehet;

$R^{13}$  és  $R^{14}$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport vagy fenilcsoport;

$R^{15}$  és  $R^{16}$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos alkil-tio-csoport vagy 1-6 szénatomos alkoxicssoport; és

$m$  értéke 0, 1 vagy 2;

azzal a megkötéssel, hogy amennyiben  $R^1$  jelentése klóratom vagy fluoratom;  $R^5$  jelentése hidrogénatom, klóratom, fluoratom vagy metoxicssoport; valamint  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$  és  $R^9$  jelentése hidrogénatom; akkor  $R$  jelentése hidrogénatomtól eltérő.

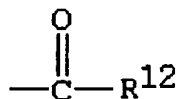
Előnyösen

$R^1$  jelentése halogénatom;

$R^2$ ,  $R^3$  és  $R^4$  jelentése hidrogénatom;

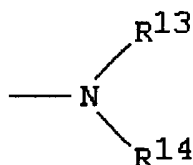
$R^5$  jelentése halogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-6 szénatomos alkoxicssoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxicssoport, nitrocsoport vagy  $-S(O)_m-(1-3 \text{ szénatomos alkil})-$  általános képletű csoport, amelyben

$m$  értéke 0, 1 vagy 2;  
 $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$  és  $R^9$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, halogénatom vagy 1-6 szénatomos alkoxicsoport; és  
 $R$  jelentése fenil-(1-3 szénatomos alkil)-csoport vagy



általános képletű csoport, amelyben

$R^{12}$  jelentése 1-12 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, fenilcsoport vagy



általános képletű csoport, amelyben

$R^{13}$  és  $R^{14}$  jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, fenilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport vagy 1-6 szénatomos alkilcsoport, vagy  
 $R^{13}$  és  $R^{14}$  együtt morfolingyűrűt képez.

Különösen előnyösek a következő vegyületek:

4-klór-3-{1-[(*N,N*-dimetil-karbamoil)-oxi]-2'-(trifluor-metil)-benzil}-piridin;

4-klór-3-{1-[(*N*-metil-karbamoil)-oxi]-2'-(trifluor-metil)-benzil}-piridin;

4-klór-3-{1-[(*N,N*-dietil-karbamoil)-oxi]-2'-(trifluor-metil)-benzil}-piridin;

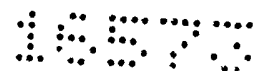
4-klór-3-{1-[(morfolino-karbonil)-oxi]-2'-(trifluor-metil)-benzil}-piridin;

4-klór-3-{1-[(*N*-fenil-*N*-metil-karbamoil)-oxi]-2'-(trifluor-metil)-benzil}-piridin;

4-klór-3-[1-(trimetil-acetoxi)-2'-(trifluor-metil)-benzil]-piridin;

4-klór-3-{1-[[*N*-(2-klór-etil)-karbamoil]-oxi]-2'-(trifluor-metil)-benzil}-piridin;

4-klór-3-{1-[(*N*-etil-karbamoil)-oxi]-2'-(trifluor-metil)-



-benzil}-piridin;  
 4-klór-3-{1-[(*N*-izopropil-karbamoil)-oxi]-2'-(trifluor-  
 -metil)-benzil}-piridin;  
 4-klór-3-{1-[(*N*-propil-karbamoil)-oxi]-2'-(trifluor-  
 -metil)-benzil}-piridin;  
 4-bróm-3-{1-[(*N,N*-dimetil-karbamoil)-oxi]-2'-(trifluor-  
 -metil)-benzil}-piridin;  
 4-klór-3-{1-[(*N,N*-dimetil-karbamoil)-oxi]-2'-klór-benzil}-  
 -piridin;  
 4-klór-3-{1-[(*N,N*-dimetil-karbamoil)-oxi]-2'-metil-  
 -benzil}-piridin;  
 4-klór-3-{1-[(*N*-metil-karbamoil)-oxi]-2'-bróm-benzil}-  
 -piridin;  
 4-klór-3-[1-(*N,N*-diallil-karbamoil)-2'-(trifluor-metil)-  
 -benzil]-piridin;  
 4-klór-3-{1-[(*N*-etil-*N*-metil-karbamoil)-oxi]-2'-(trifluor-  
 -metil)-benzil}-piridin;  
 4-klór-3-{1-[(*N*-allil-karbamoil)-oxi]-2'-(trifluor-metil)-  
 -benzil}-piridin; és  
 4-klór-3-{1-[(*terc*-butil-karbonil)-oxi]-2'-etil-benzil}-  
 -piridin.

A fentiekben megadott általános képletek magukban foglalják a szerkezetek tautomer formáit, továbbá a vegyületek fizikailag megkülönböztethető módosulatait; az utóbbiak többféleképpen alakulhatnak ki, így például a molekulák kristályrácsba rendeződnek, vagy a molekula egyes részei a molekula többi részéhez képest gátoltak a szabad rotálásban, vagy geometriai izomerek képződnek, vagy intramolekuláris, illetve intermolekuláris hidrogénhidak alakulnak ki stb.

Az ilyen általános képleteknek megfelelő vegyületek enantiomer formákban is létezhetnek. A találmány az egyedi enantiomereket és a két enantiomer tetszőleges részarányú keverékeit egyaránt magában foglalja.

A jelen leírásban a "hidrokarbilcsoport" kifejezés – amely vonatkozhat egy önmagában vett szubsztituensre, illetve egy nagyobb csoport (például egy hidrokarbil-oxi-csoport vagy egy hidrokarbil-S(O)<sub>m</sub>- általános képletű csoport stb.) részére – az

1-12 szénatomos hidrokartilcsoportokat foglalja magában. Ily módon a hidrokartilcsoport kifejezés – egyebek mellett – kiterjed a következőkre: egyenes vagy elágazó láncú izomerek (például metil-, etil-, propil- és hexilcsoport); 3-12 szénatomos cikloalkilcsoport (például ciklopropil-, ciklobutil- és ciklohexilcsoport); 2-12 szénatomos alkenilcsoport (például allil- és 2-butenilcsoport); 2-12 szénatomos alkinilcsoport (például propinilcsoport); fenilcsoport; fenil-alkil-csoport; alkil-fenil-csoport; alkenil-fenil-csoport; alkinil-fenil-csoport; alkil-benzil-csoport; alkenil-benzil-csoport; alkinil-benzil-csoport; naftilcsoport stb.

A "szubsztituált hidrokartilcsoport" kifejezés a fentiekben meghatározott hidrokartilcsoportok azon származékait foglalja magában, amelyek egy vagy több, a következőkben felsorolt szubsztituenssel rendelkeznek: halogénatom (például fluor-, klór-, bróm- és jódatom); 1-4 szénatomos alkoxicssoport; 1-4 szénatomos alkil-S(O)<sub>m</sub>- általános képletű csoport; cianocsoport; karboxicssoport és sói, amidjai és észterei; 2-4 szénatomos alkanoilcsoport; valamint adott esetben egy vagy több 1-4 szénatomos alkilcsoporttal, 1-4 szénatomos alkoxicssoporttal, 1-4 szénatomos alkil-S(O)<sub>m</sub>- általános képletű csoporttal, nitrocsoporttal, fluoratómmal, klóráatómmal, bróatómmal, cianocsoporttal vagy trifluor-metil-csoporttal szubsztituált fenilcsoport. A fenti általános képletekben m értéke 0, 1 vagy 2.

Az előbbieken a karboxicssoporttal kapcsolatban említett "sók, amidok és észterek" kifejezés magában foglalja például az alkálifémekkel (például nátriummal, káliummal és lítiummal), az alkáliföldfémekkel (például kalciummal és magnéziummal), az ammóniumionnal, valamint az olyan helyettesített ammóniumionnal alkotott sókat, amely utóbbiakban egy, kettő, három vagy négy hidrogénatom egy adott esetben szubsztituált 1-6 szénatomos hidrokartilcsoporttal van helyettesítve.

A fenti definíciókban "halogénatom" kifejezés a fluor-, klór-, bróm- és jódatomra vonatkozik. A polihalogénezett csoportokban a halogénatomok azonosak vagy egymástól eltérőek lehetnek.

Azt találtuk, hogy a találmány szerinti vegyületek herbi-

cid hatással rendelkeznek, a vegyületek preemergens vagy poszt-emergens herbicidekként alkalmazhatók, továbbá a növényfajok széles tartományával, egyebek mellett a széleslevelű és a fűszerű fajokkal szemben felhasználhatók.

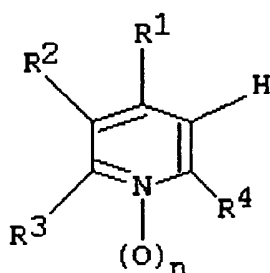
A találmány kiterjed nemkívánatos növényzet szabályozási eljárására is, amelynek során egy olyan helyen, ahol a nemkívánatos növényzetet kontrollálni kívánjuk, a nemkívánatos növényzet kikérelése előtt vagy után egy herbicidekkel történő felhasználásra alkalmas inert hígítószerrel vagy hordozóanyaggal együtt egy találmány szerinti vegyület herbicid szempontból hatásos mennyiségét alkalmazzuk.

A leírásban alkalmazott "herbicid" kifejezés a nemkívánatos növény-növekedés gátló (inhibitív) szabályozására (kontrolljára), illetve inhibitív módosítására vonatkozik. A gátló szabályozás vagy módosítás magában foglalja a természetes fejlődéstől eltérő összes eltérést, így például a teljes kipusztulást, a növekedésgátlást, a lombvesztést, a kiszáradást, a regulációt, a növekedés leállítását, a bokrosodást, a serkentést, a levélperzselődést és a törpenövekedést. A leírásban alkalmazott "herbicid szempontból hatásos mennyiség" kifejezés az olyan mennyiségre vonatkozik, amely a nemkívánatos növényekre közvetlenül feljuttatva, illetve arra a területre kijuttatva, amelyen a nemkívánatos növények növekednek, elegendő az említett szabályozó vagy módosító hatás kifejtéséhez. A "növények" kifejezés egyaránt magában foglalja a csírázó magokat, a kikérelőben lévő magoncokat, továbbá a kifejlődött növényzetet, annak gyökérszeivel és felszín feletti részeivel együtt.

A "mezőgazdaságilag elfogadható só" kifejezés az ezen területen jártas szakember számára könnyen meghatározható; az ilyen sók közé tartoznak – egyebek mellett – például a hidrogén-halogenidekkel, ecetsavval, szulfonsavakkal, foszfonsavakkal és egyéb szervetlen és szerves savakkal képezett sók.

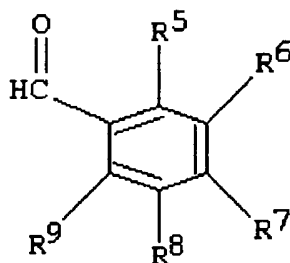
A találmány szerinti vegyületeket úgy állíthatjuk elő, hogy

(A) egy (III) általános képletű vegyületet



(III)

- amelynek képletében  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^3$  és  $R^4$  jelentése a fentiekben az (I) általános képletnél meghatározott - alkalmas bázis jelenlétében egy (IV) általános képletű szubsztituált benzaldehyddel



(IV)

- amelynek képletében  $R^5$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$  és  $R^9$  jelentése a fentiekben az (I) általános képletnél meghatározott - reagáltatunk, és így egy fenti (II) általános képletű 3-piridil-karbinolt állítunk elő (az ott megadott korlátozás nélkül); és kívánt esetben (B) az így nyert piridil-karbinolt egy megfelelő regenssel (például egy alifás vagy aromás savhalogeniddel, karbamoil-halogeniddel, alkil-halogeniddel, szulfonil-halogeniddel vagy foszforil-halogeniddel), illetve egy megfelelő izocianáttal vagy egymás után foszgénnel vagy egy foszgén ekvivalenssel, majd egy megfelelő aminnal reagáltatjuk, és így a kívánt vegyületet nyerjük.

Jellegzetesen úgy járunk el, hogy egy (III) általános képletű szubsztituált piridin oldószerrel (például etilén-glikol-dimetil-éterrel, tetrahidrofuránnal, dietil-éterrel stb.) készített oldatához körülbelül  $-100\text{ }^\circ\text{C}$  és körülbelül  $-40\text{ }^\circ\text{C}$  közötti hőmérsékleten egy alkalmas bázis (például lítium-diizopropil-amid vagy *n*-butil-lítium) körülbelül 1-2 ekvivalensnyi mennyiségét adjuk. Megfelelő kevertetést követően a (IV) álta-

lános képletű szubsztituált benzaldehyd körülbelül 1-2 ekvivalensnyi mennyiségét adjuk az előbbi keverékhez.

A reakciókeveréket általában kevertetjük és 1-24 óra alatt lassan környezeti hőmérsékletre melegítjük. A reakciót ezt követően általában telített, vizes ammónium-klorid-oldat vagy vizes sósavoldat hozzáadásával leállítjuk. A képződött piridil-karbinolt hagyományos módszerek (például extrakció, szűrés stb.) alkalmazásával nyerhetjük ki, majd ismert eljárásokkal [például gyorskromatográfiával (flash chromatography)] tisztíthatjuk.

A második lépésben a (II) általános képletű piridil-karbinol alkalmas oldószerrel (például tetrahydrofúránnal, metiléndikloriddal stb.) készített oldatához körülbelül 0 °C hőmérsékleten egy megfelelő bázis (például nátrium-hidrid vagy trietil-amin) körülbelül 1 és körülbelül 4 ekvivalens közötti mennyiségét adjuk. Ezt követően a keverékhez hozzáadjuk a megfelelő reagens (például egy karbamoil-halogenid, alkil-halogenid, szulfonil-halogenid vagy foszforil-halogenid, alifás vagy aromás savhalogenid) körülbelül 1 és körülbelül 3 ekvivalens közötti mennyiségét, majd a keveréket a reakció teljessé válásáig kevertetjük. A reakciót jeges víz hozzáadásával leállíthatjuk, majd a termékeket szokásos módszerek alkalmazásával, például extrakcióval, szűréssel stb. kinyerjük. Az így kapott vegyületeket ezt követően szokásos módszerekkel, például gyorskromatográfiával stb. tisztíthatjuk.

A második lépésben alternatív módon úgy is eljárhatunk, hogy az alkalmas oldószerben (például tetrahydrofúránnal, metiléndikloriddal stb.) lévő piridil-karbinolhoz hozzáadjuk egy megfelelő izocianát körülbelül 2 és körülbelül 3 ekvivalens közötti mennyiségét. A keverékhez körülbelül 1 mol% és körülbelül 10 mol% közötti mennyiségben hozzáadhatunk egy vagy több alkalmas katalizátort (például trietil-amint vagy dibutil-ón-dilaurátot), majd a reakciókeveréket körülbelül 0 °C és 100 °C közötti hőmérséklet-tartományban elegendő ideig (például 2-24 órán keresztül) kevertetjük. A terméket szokásos módszerek alkalmazásával, például extrakcióval, szűréssel stb. kinyerjük. Az így kapott vegyületet ezt követően szokásos módszerekkel,



például gyorskromatográfiával stb. tisztíthatjuk.

A (III) általános képletű szubsztituált piridin kiindulási anyagokat kereskedelmi forgalomból szerezhethetjük be, illetve a vegyületeket egy ezen a területen jártas szakember a következő szakirodalmi helyen ismertetett módszerek alkalmazásával egyszerűen előállíthatja: "Heterocyclic Compounds, Pyridine and its Derivatives", R. A. Abramovitch, Vol. 14, Wiley, 1973. A (IV) általános képlet aldehid kiindulási anyagok kereskedelmi termékek, illetve előállíthatók például a következő helyen ismertetett eljárások felhasználásával: "Survey of Organic Synthesis", C. A. Buehler et al., Vols. 1 and 2, Wiley-Interscience, 1970.

A találmány szerinti készítmények egy, a fentiekben ismertetett (Ia) általános képletű vegyületet és egy alkalmas hordozóanyagot tartalmaznak. Az ezen a területen jártas szakember számára az ilyen hordozóanyagok jól ismertek.

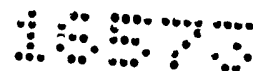
A találmány szerinti vegyületek herbicidekként alkalmazhatók. A vegyületeket különféle, a szakember számára ismert módokon és eltérő koncentrációkban használhatjuk fel. A vegyületek alkalmasak a nemkívánatos növényzet növekedésének szabályozására, amelynek során a hatóanyagokat kikelés előtt vagy kikelés után felhordjuk arra a területre, ahol a szabályozást el akarjuk végezni. A gyakorlati megvalósítás során a vegyületeket olyan készítmények formájában alkalmazzuk, amely készítmények különféle adjuvánsokat és a diszperziót elősegítő ismert hordozóanyagokat tartalmaznak. A készítmény és az alkalmazási mód megválasztásakor figyelembe kell venni az adott vegyület hatásosságát. A találmány szerinti vegyületeket például granulákká, nedvesíthető porokká, emulgeálható koncentrátumokká, porokká vagy porozószerekké, szabadon áramló készítményekké, oldatokká, szuszpenziókká vagy emulziókká, továbbá szabályozott (késleltetett) hatóanyag-felszabdulású készítményformákká, például mikrokapszulákká formálhatjuk. Ezek a készítmények körülbelül 0,5 tömeg% és körülbelül 95 tömeg% közötti mennyiségben tartalmazhatják a hatóanyagot. Egy adott vegyület esetén az optimális hatóanyag-mennyiség a kontrollálható magok vagy növények jellegétől függ. Az alkalmazási dózis általában körülbelül

11,2 gramm/hektár (0,01 font/acre) és körülbelül 11,2 kilogramm/hektár (10 font/acre), előnyösen körülbelül 22,4 gramm/hektár (0,02 font/acre) és körülbelül 4,48 kilogramm/hektár (4 font/acre) között változik.

A nedvesíthető porok olyan, finoman elosztatott részecskék formájában vannak, amelyek vízben vagy más folyékony hordozóanyagokban könnyen diszpergálhatók. A részecskék egy szilárd kötőanyagban (mátrixban) visszatartva tartalmazzák a hatóanyagot. A jellegzetes szilárd kötőanyagok közé tartoznak – egyebek mellett – például a következők: fullerföld, kaolin, kova és egyéb, könnyen nedvesíthető szerves vagy szervetlen szilárd anyagok. A nedvesíthető porok szokásosan körülbelül 5 tömeg% és körülbelül 95 tömeg% hatóanyagot, valamint kis mennyiségű nedvesítő-, diszpergáló- vagy emulgeálószeret tartalmaznak.

Az emulgeálható koncentrátumok vízben vagy más folyadékban diszpergálható homogén folyékony kompozíciók, amelyek kizárólag a hatóanyagból és egy folyékony vagy szilárd emulgeálószerből állnak, illetve tartalmazhatnak egy folyékony hordozóanyagot is, például xilolt, nehéz aromás naftákat, izoforont (3,5,5-trimetil-2-ciklohexén-1-ont) és más, nemillékony szerves oldószereket. A felhasználás során a koncentrátumokat vízben vagy más folyadékban diszpergáljuk, majd szokásosan permetezéssel felvisszük a kezelendő területre. A koncentrátum hatóanyag-tartalma körülbelül 0,5 tömeg% és körülbelül 95 tömeg% közötti értékű.

A szemcsés (granulált) készítmények az extrudátumokat és a viszonylag gömbszerű részecskéket egyaránt magukban foglalják. Ezeket a készítményeket hígítás nélkül juttatjuk ki arra a területre, amelyiken a növényzet visszaszorítását kívánjuk elérni. A szemcsés készítmények jellegzetes hordozóanyagai közé tartoznak – egyebek mellett – például a következők: homok, fullerföld, attapulgit, bentonit, montmorillonit, vermikulit, perlit és más olyan szerves vagy szervetlen anyagok, amelyek abszorbeálják a hatóanyagot, illetve amelyek a hatóanyaggal bevonhatók. Az általában körülbelül 5 tömeg% és körülbelül 25 tömeg% közötti mennyiségű hatóanyagot tartalmazó szemcsés készítmények magukban foglalhatnak továbbá felületaktív szereket,



például nehéz aromás naftákat, kerozint vagy más petróleumfrakciókat, illetve növényi olajokat; és/vagy ragasztóanyagokat, például dextrineket, enyvet vagy szintetikus gyantákat.

A porozószerke a hatóanyagnak finoman elosztatott szilárd anyagokkal, például talkummal, agyagokkal, lisztekkel és más, diszpergálószerkekként vagy hordozóanyagokként funkcionálni képes szerves vagy szervesetlen anyagokkal alkotott szabadon áramló keverékei.

A mikrokapszulák jellegzetesen a hatóanyagnak egy olyan inert, porózus héjba zárt cseppecskéi vagy szemcséi, amely héj lehetővé teszi a hatóanyagnak a környezetbe történő, szabályozott sebességű kijutását. A kapszulázott cseppecskék jellegzetesen körülbelül 1  $\mu\text{m}$  és körülbelül 50  $\mu\text{m}$  közötti átmérőjűek. A bezárt folyadék jellegzetesen a kapszula tömegének körülbelül 50-95 tömeg%-át teszi ki, és a folyadék a hatóanyag mellett oldószert is tartalmazhat. A kapszulázott szemcsék általában porózus szemcsék, amelyekben porózus membránok zárják le a szemcse pórusnyílásait, és így folyadékformában visszatartják a hatóanyagokat a szemcse pórusainak belsejében. A szemcsék átmérője jellegzetesen 1 mm és 1 cm, előnyösen 1 mm és 2 mm közötti nagyságú. A szemcsék kialakítását extrudálással, tömörítéssel (agglomerálással) vagy a szilárd anyag megolvasztásával (prilling) végezhetjük, illetve a szemcsék természetes előfordulásúak is lehetnek. Az ilyen anyagok példái közé tartoznak – egyebek mellett – a következők: vermikulit, szinterelt agyag, kaolin, attapulgit, fűrészpor vagy szemcsés szén. A héj- és membránanyagok közé tartoznak a természetes és mesterséges gumik, cellulózanyagok, sztirol-butadién kopolimerek, poliakrilnitrilek, poliakrilátok, poliészterek, poliamidok, polikarbamidok, poliuretánok és keményítő-xantátok.

A herbicidként történő alkalmazásra szolgáló egyéb készítmények magukban foglalják a hatóanyagnak olyan oldószerekkel készített egyszerű oldatait is, amely oldószerek alkalmasak a hatóanyagnak a kívánt koncentrációban történő tökéletes feloldására; ezek közé az oldószerek közé tartoznak – egyebek mellett – például a következők: aceton, alkilezett naftalinok, xilol és más szerves oldószerek. Alkalmazhatók túlnyomósos perme-

tezők is, amelyek esetén egy alacsony forráspontú diszpergáló oldószer hordozó elpárolgásának eredményeként a hatóanyag finoman elosztatott formává diszpergálódik.

A fenti készítmények közül több is tartalmaz nedvesítő-, diszpergáló- vagy emulgeálószeret. Ezek példái között megemlíthetők a következők: alkil- vagy alkil-aril-szulfonátok és -szulfátok, valamint ezek sói; polihidroxi-alkoholok; polietoxilezett alkoholok; észterek és zsíraminok. Amennyiben alkalmazásra kerülnek ezek a szerek, a készítmény 0,1 tömeg% és 15 tömeg% közötti részét alkotják.

A fentiekben említett készítmények mindegyikét előállíthatjuk olyan csomagolt formában, amely a herbicid hatóanyagot a készítmény további összetevőivel (például hígítószerekkel, felületaktív szerekkel stb.) együtt tartalmazza. Ugyanakkor a készítményeket előállíthatjuk tankkeverési eljárással is, amelynek során az egymástól elkülönített formában lévő komponenseket a termőhelynél keverjük össze.

A találmány szerinti vegyületeket más herbicidekkel és/vagy lombtalanítókkal (defoliánsokkal), deszikkánsokkal, növekedésgátlókkal stb. kombinálva is felhasználhatjuk. Ezek az egyéb anyagok a készítményekben lévő hatóanyagok körülbelül 5 tömeg% és körülbelül 95 tömeg% közötti részét alkotják. Az ilyen kombinációk a gyomok kontrollálásában gyakran nagyobb eredményességet biztosítanak, és gyakran olyan eredményeket nyújtanak, amelyek az egyedi herbicid hatóanyagok különálló készítményeivel nem érhetők el.

A következőkben felsoroljuk a találmány szerinti vegyületekkel kombinálható egyéb herbicidek, defoliánsok, deszikkánsok és növénynövekedés-gátló anyagok néhány példáját.

Az alkalmas kiegészítő herbicid hatóanyagok példái közé tartoznak:

A. benzo-2,1,3-tiadiazin-4-on-2,2-dioxidok, például bentazone;

B. hormon herbicidek, különösen a fenoxi-alkánsavak, például MCPA, MCPA-thioethyl, dichlorprop, 2,4,5-T, MCPB, 2,4-D, 2,4-DB, mecoprop, trichlopyr, fluroxypyr, clopyralid, valamint ezek származékai (például sói, észterei és amidjai);

C. 1,3-dimetil-pirazol-származékok, például pyrazoxyfen, pyrazolate és benzofenap;

D. dinitro-fenolok és származékaik (például acetátok, így DNOC, dinoterb, dinoseb és észtere, dinoseb-acetát);

E. dinitro-anilin herbicidek, például dinitramine, trifluralin, ethalfluralin, pendimethalin; és oryzalin;

F. aril-karbamid herbicidek, például diuron, flumeturon, metoxuron, neburon, isoproturon, chlorotoluron, chloroxuron, linuron, monolinuron, chlorobromuron, daimuron és methabenzthiazuron;

G. fenil-(karbamoil-oxi)-fenil-karbamátok, például phenmedipham és desmedipham;

H. 2-fenil-3-piridazinon-származékok, például chloridazon és norflurazon;

I. uracil herbicidek, például lenacil, bromacil és terbacil;

J. triazin herbicidek, például atrazine, simazine, aziprotryne, cyanazine, prometryn, dimethametryn, simetryne és terbutryne;

K. foszforotioát herbicidek, például piperophos, bensulide és butamifos;

L. merkapto-karbamát herbicidek, például cycloate, vernolate, molinate, thiobencarb, butylate\*, EPTC\*, triallate, diallate, ethyl esprocarb, tiocarbazil, pyridate és dimepiperate;

M. 1,2,4-triazin-5-on herbicidek, például metamitron és metribuzin;

N. benzoésav herbicidek, például 2,3,6-TBA, dicamba és chloramben;

O. anilid herbicidek, például pretilachlor, butachlor, a megfelelő alachlor, a megfelelő propachlor vegyület, propanil, metazachlor, metolachlor, acetochlor és dimethachlor;

P. dihalogén-benzonitril herbicidek, például dichlobenil, bromoxynil és ioxynil;

Q. halogén-alkánsav-származék herbicidek, például dalapon, TCA és sói;

R. difenil-éter herbicidek, például lactofen, fluroglycofen és sói vagy észterei, nitrofen, bifenox, acifluorfen és sói



vagy észtereim oxyfluorfen és fomesafen; chlornitrophen és chlomethoxyfen;

S. fenoxi-fenoxi-propionát herbicidek, például diclofop és észterei, így metilésztere, fluazifop és észterei, haloxyfop és észterei, quizalofop és észterei, valamint fenoxypop és észterei, így etilésztere;

T. ciklohexándion herbicidek, például alloxydim és sói, sethoxydim, cycloxydim, tralkoxydim és clethodim;

U. szulfonil-karbamid herbicidek, például chlorosulfuron, sulfometuron, metsulfuron és észterei, benzulfuron és észterei, így metilésztere, DPX-M6313, chlorimuron és észterei, így etilésztere, pirimisulfuron és észterei, így metilésztere. DPX-LS300 és pyrazosulfuron;

V. imidazolidinon herbicidek, például imazaquin, imazame-thabenz, imazapyr és izopropil-ammónium-sóik, imazethapyr;

W. aril-anilid herbicidek, például flamprop és észterei, benzoylprop-ethyl, diflufenican;

X. aminosav herbicidek, például glyphosate és glyphosinate, valamint sóik és észterei, sulphosate és bilanafos;

Y. szerves arzénvegyület herbicidek, például MSMA;

Z. amidszármazék herbicidek, például napropamide, propyzamide, carbetamide, tebutam, bromobutide, isoxaben, naproanilide, diphenamid és naptalam;

AA. vegyes herbicidek, köztük ethofumesate, cinmethylin, difenzoquat és sói, például a metil-szulfát-sója, clomazone, oxadiazon, bromofenoxim, barban, tridiphane, (3:1 arányban) flurochloridone, quinchlorac és mefanacet;

BB. a felhasználható kontakt herbicidek példái közé tartoznak a bipyridílium herbicidek, például azok, amelyeknek a hatóanyaga paraquat, valamint azok, amelyeknek diquat a hatóanyaga.

\*Ezeket a vegyületeket előnyösen egy védőanyaggal (safener), például 2,2-diklór-*N,N*-di(2-propenil)-acetamiddal (dichlormiddel) együtt alkalmazzuk.

A készítményeket szokásos módszerek alkalmazásával juttathatjuk ki azokra a területekre, amelyeken a szabályozást végre akarjuk hajtani. A por és folyadék állagú készítményeket példá-



ul motoros porozógépekkel, motoros és kézi permetezőkkal, valamint porlasztásos porozógépekkel juttathatjuk ki. A készítményeket por vagy permet formájában repülőgépekről is kijuttathatjuk. A csírázó magvak vagy a kikelés közben lévő magoncok növekedésének módosításához vagy szabályozásához a por- és folyadékkészítményeket – a talaj felszíne alatt legalább 1,5 cm mélységben – magában a talajban is szétoszlatjuk, illetve permetezéssel vagy szórással csak a talaj felszínére is kijuttathatjuk. A készítményeket az öntözővízhez adva is felhasználhatjuk. Ez lehetőséget nyújt arra, hogy a készítményeket az öntözővízzel együtt juttassuk be a talajba. A talaj felszínére kijuttatott porkészítményeket, szemcsés kompozíciókat vagy folyadékkészítményeket hagyományos eszközök alkalmazásával, például tárcsázással, boronálással vagy keverési műveletekkel oszlatjuk szét a talaj felszíne alatt.

A következőkben néhány jellegzetes készítményt ismertetünk.

- 5 tömeg%-os por:        5 tömegrész hatóanyag  
                              95 tömegrész talkum
- 2 tömeg%-os por:        2 tömegrész hatóanyag  
                              1 tömegrész finoman diszpergált kovasav  
                              97 tömegrésztalkum

Ezeket a porokat úgy formáljuk, hogy a komponenseket összekeverjük, majd a keveréket ezt követően a kívánt részecskeméretre őröljük.

- 5 tömeg%-os granulátumok: 5 tömegrész hatóanyag  
                                  0,25 tömegrész epiklórhidrin  
                                  0,25 tömegrész cetil-poliglikol-  
  -éter  
                                  3,5 tömegrész polietilén-glikol  
                                  91 tömegrész kaolin (részecskeméret:  
  0,3-0,8 mm)

A granulátumokat úgy formáljuk, hogy a hatóanyagot összekeverjük az epiklórhidrinnel, majd a keveréket feloldjuk 6 tömegrész acetonban. Ezt követően az oldathoz hozzáadjuk a polietilén-glikolt és a cetil-poliglikol-étert. Az így nyert oldatot rápermetezzük a kaolinra, majd az acetont vákuum alatt elpáro-

logtatjuk.

Nedvesíthető porok:

- |            |  |
|------------|--|
| 70 tömeg%: | 70 tömegrész hatóanyag   |
|            | 5 tömegrész nátrium-dibutil-naftil-<br>-szulfonát                                      |
|            | 3 tömegrész naftalinszulfonsav/fenol-<br>szulfonsav/formaldehyd kondenzátum<br>(3:2:1) |
|            | 10 tömegrész kaolin  |
|            | 12 tömegrész Champagne kréta   |
| 40 tömeg%: | 40 tömegrész hatóanyag   |
|            | 5 tömegrész nátrium-ligninszulfonát  |
|            | 1 tömegrész nátrium-dibutil-naftil-<br>-szulfonát                                      |
|            | 54 tömegrész kovásv  |
| 25 tömeg%: | 25 tömegrész hatóanyag   |
|            | 4,5 tömegrész kalcium-ligninszulfonát  |
|            | 1,9 tömegrész Champagne kréta/hidroxi-<br>-etil-cellulóz (1:1)                         |
|            | 1,5 tömegrész nátrium-dibutil-naftil-<br>-szulfonát                                    |
|            | 19,5 tömegrész kovásv  |
|            | 19,5 tömegrész Champagne kréta   |
|            | 28,1 tömegrész kaolin  |
| 25 tömeg%: | 25 tömegrész hatóanyag   |
|            | 2,5 tömegrész izooktil-fenoxi-polietilén-<br>-etanol                                   |
|            | 1,9 tömegrész Champagne kréta/hidroxi-<br>-etil-cellulóz (1:1)                         |
|            | 8,3 tömegrész nátrium-alumínium-szilikát   |
|            | 16,5 tömegrész Kieselguhr  |
|            | 46 tömegrész kaolin  |
| 10 tömeg%: | 10 tömegrész hatóanyag   |
|            | 3 tömegrész telített zsíralkoholszulfátok<br>nátriumsóinak keveréke                    |
|            | 5 tömegrész naftalinszulfonsav/formaldehyd<br>kondenzátum                              |



82 tömegrész kaolin

Ezeket a nedvesíthető porokat úgy állítjuk elő, hogy a hatóanyagokat megfelelő keverőkben igen alaposan összekeverjük az adalékanyagokkal, majd az így nyert keverékeket őrlőgépekben vagy hengermalmokban megőröljük.

Emulgeálható koncentrátum:

25 tömeg%:      25 tömegrész hatóanyag  
                  2,5 tömegrész epoxidált növényi olaj  
                  10 tömegrész alkil-aril- szulfonát/zsír-  
                  alkohol-poliglikol-éter keverék  
                  5 tömegrész *N,N*-dimetil-formamid  
                  57,5 tömegrész xilol

A találmány szerinti készítményeknek az a mennyisége, amely eleget tesz a herbicid szempontból hatásos mennyiség követelményének, függ a kontrollálandó magok vagy növények jellegétől. A hatóanyagok alkalmazási dózisa – a költségektől és a kívánt eredménytől függően – általában körülbelül 11,2 gramm/hektár (0,01 font/acre) és körülbelül 28 kilogramm/hektár (25 font/acre), előnyösen 11,2 gramm/hektár (0,01 font/acre) és körülbelül 11,2 kilogramm/hektár (10 font/acre) között változik. Az ezen a területen jártas szakember számára nyilvánvaló, hogy azonos mértékű szabályozás eléréséhez a kisebb herbicid aktivitással rendelkező készítményeket nagyobb dózisokban kell alkalmazni, mint az erősebb hatással rendelkező hatóanyagokat tartalmazó készítményeket.

#### PÉLDÁK

A következő példák a találmány illusztrálására szolgálnak. A példák semmilyen szempontból nem korlátozzák a találmány terjedelmét.

#### 1. PÉLDA

A 4-klór-3-(1-hidroxi-2',6'-diklór-benzil)-piridin előállítására  
(11. számú vegyület)

Mágneses keverővel ellátott 500 ml-es főzőpohárba 100 ml dietil-étert mértünk be, majd hozzáadtunk 18 g 4-klór-piridin-hidrokloridot. Az oldathoz 0 °C hőmérsékleten 6,5 g nátrium-

-hidroxid 100 ml vízzel készített oldatát adtuk, majd a keveréket 15 percen keresztül kevertettük. A dietil-éteres fázist elválasztottuk, majd vízzel mostuk, vízmentes magnézium-szulfát felett szárítottuk, szűrtük és bepároltuk. Az így nyert 4-klórpíridin 5,7 g-ját bemértük egy 50 ml etilén-glikol-dimetil-étert tartalmazó háromnyakú lombikba, majd a keveréket  $-70\text{ }^{\circ}\text{C}$  hőmérsékletre hűtöttük. 40 ml lítium-diizopropil-amidot ("LDA") adtunk körülbelül 30 perc alatt a keverékhez, miközben a hőmérsékletet  $-60\text{ }^{\circ}\text{C}$ -on tartottuk, és így egy narancssárga szuszpenziót kaptunk. A reakciókeveréket ezt követően egy órán keresztül  $-70\text{ }^{\circ}\text{C}$  hőmérsékleten kevertettük. Hozzáadtunk 9,2 g 2,6-diklór-benzaldehydet, miközben a hőmérsékletet  $-45\text{ }^{\circ}\text{C}$  és  $-60\text{ }^{\circ}\text{C}$  között tartottuk. A reakciókeveréket 2 órán keresztül szárazjégfürdőben kevertettük, majd egy éjszakán át szobahőmérsékleten állni hagytuk.

A reakciókeverékhez ezt követően 35 ml telített, vizes ammónium-klorid-oldatot adtunk, és a keveréket 15 percen keresztül szobahőmérsékleten kevertettük. A szilárd anyagot kiszűrtük, majd először kétszer vízzel, majd kétszer metilén-dikloriddal mostuk. Ennek eredményeként 13,2 g mennyiségben nyertük a 4-klór-3-(1-hidroxi-2',6'-diklór-benzil)-piridint.

## 2. PÉLDA

### A 4-klór-3-{1-[(N,N-dimetil-karbamoil)-oxi]-2',6'-diklór-benzil}-piridin előállítás

(77. számú vegyület)

Mágneses keverővel ellátott 200 ml-es gömblombikban feloldottunk 20 ml tetrahydrofuranban 1 g 4-klór-3-(1-hidroxi-2',6'-diklór-benzil)-piridint. Az oldatot jégfürdővel hűtöttük, majd 0,3 g nátrium-hidridet adtunk hozzá. A hőmérsékletet  $0\text{ }^{\circ}\text{C}$ -on tartottuk, majd 0,55 ml N,N-dimetil-karbamoil-kloridot adtunk az oldathoz. A reakciókeveréket egy éjszakán át szobahőmérsékleten kevertettük, majd jégre öntöttük és metilén-dikloriddal kétszer extraháltuk. A metilén-dikloridos fázisokat egyesítettük, majd vízzel mostuk, vízmentes magnézium-szulfát felett szárítottuk, szűrtük és bepároltuk. Ennek eredményeként sárga olaj formájában nyertük a 4-klór-3-{1-[(N,N-dimetil-karbamoil)-

-oxi]-2',6'-diklór-benzil}-piridint.

### 3. PÉLDA

A 3-[1-hidroxi-2'-(trifluor-metil)-benzil]-2-klór-4-(trifluor-  
-metil)-piridin előállítás

(13. számú vegyület)

Egy csepegtetőtölcsérrel, hőmérővel és szárítócsöves hűtővel felszerelt háromnyakú lombikba 5 g 2-klór-4-(trifluor-metil)-piridint és 5 ml etilén-glikol-dimetil-étert mértünk be. A keveréket -70 °C hőmérsékletre hűtöttük, majd lassan 22 ml lítium-diizopropil-amidot hozzá, miközben a hőmérséklet értékét -55 °C alatt tartottuk. A reakciókeveréket 1,5 órán keresztül -70 °C hőmérsékleten kevertettük, majd 3,5 ml 2-(trifluor-metil)-benzaldehydet adtunk hozzá. A reakciókeveréket szárazjég-fürdőben, majd egy éjszakán át szobahőmérsékleten kevertettük. Hozzáadtunk 15 ml telített, vizes ammónium-klorid-oldatot, az oldószerrel lepároltuk, majd a maradékként nyert olajat vízzel mostuk és metilén-dikloriddal háromszor extraháltuk. A metilén-dikloridos fázisokat egyesítettük, majd telített, vizes nátrium-klorid-oldattal mostuk, szárítottuk és betöményítettük, amelynek eredményeként egy barna olajat kaptunk. A barna olajat szilikagéloszlopra vittük, majd 1:1 térfogatarányú hexán/di-etil-éter oldószerrel eluáltuk. Ily módon 6,2 g mennyiségben nyertük a 3-[1-hidroxi-2'-(trifluor-metil)-benzil]-2-klór-4-(trifluor-metil)-piridint.

### 4. PÉLDA

A 4-klór-3-[1-[(morfolino-karbonil)-oxi]-2'-(trifluor-metil)-  
-benzil]-piridin előállítás

(87. számú vegyület)

Egy mágneses keverővel ellátott 200 ml-es gömblombikba beadtuk 1,0 g 3-[1-hidroxi-2'-(trifluor-metil)-benzil]-2-klór-4-(trifluor-metil)-piridin 20 ml tetrahydrofuránnal készített oldatát. Az oldatot jégfürdőben lehűtöttük, majd 0,3 g nátrium-hidridet adtunk hozzá. Ezt követően 0 °C hőmérsékleten 0,5 ml morfolino-karbamoil-kloridot adtunk a keverékhez, és a reakciókeveréket egy éjszakán át szobahőmérsékleten kevertettük. Narancssárga csapadék képződött. A keveréket jeges vízre öntöt-

tük, majd metilén-dikloriddal kétszer extraháltuk. A metilén-dikloridos fázisokat egyesítettük, vízzel mostuk, vízmentes magnézium-szulfát felett szárítottuk, szűrtük és bepároltuk. Ennek eredményeként narancssárga szilárd anyag formájában és 1,5 g mennyiségben nyertük a 4-klór-3-[1-[(morfolino-karbonil)-oxi]-2'-(trifluor-metil)-benzil]-piridint.

#### 5. PÉLDA

##### A 4-klór-3-[1-(N,N-diallil-karbamoil)-2'-(trifluor-metil)-benzil]-piridin előállítása

(48. számú vegyület)

Jégfürdőben lehűtöttünk egy 4 g foszgént tartalmazó 20 % toluolos foszgénoldatot, majd 5 perc alatt hozzáadtuk 2 g 3-[1-hidroxi-2'-(trifluor-metil)-benzil]-2-klór-piridin 25 ml tetrahydrofuranal készített oldatát {a 3-[1-hidroxi-2'-(trifluor-metil)-benzil]-2-klór-piridint az 1. Példa szerinti eljárásnak megfelelően állítottuk elő, amelynek során kiindulási anyagként 2-(trifluor-metil)-benzaldehydet alkalmaztunk}. A keverékhez 1 g trietil-amint adtunk, majd egy éjszakán át szobahőmérsékleten kevertettük. Ezt követően 7 ml diallil-amint adtunk a keverékhez, és így sárga szuszpenzió képződött. A szuszpenziót bepároltuk, és a maradékként nyert keveréket dietil-éter alatt eldörzsöltük. A szilárd anyagot kiszűrtük, majd dietil-éterrel átöblítettük. A szűrletet bepároltuk, a maradékot szilikagél-oszlopra vittük és 10:1 térfogatarányú hexán/etil-acetát oldószerkeleggyel eluáltuk. Ennek eredményeként 2,25 g mennyiségben nyertük a 4-klór-3-[1-(N,N-diallil-karbamoil)-2'-(trifluor-metil)-benzil]-piridint.

#### 6. PÉLDA

##### A 4-klór-3-[1-[[N-(2-klór-etil)-karbamoil]-oxi]-2'-(trifluor-metil)-benzil]-piridin előállítása

(41. számú vegyület)

1,2 g 3-[1-hidroxi-2'-(trifluor-metil)-benzil]-4-klór-piridin 10 ml tetrahydrofuranal készített oldatához 2 ekvivalens 2-klór-etil-izocianátot, valamint 3 csepp trietil-amint és 2 csepp dibutil-ón-dilaurátot adtunk. A keveréket egy éjszakán át



szobahőmérsékleten kevertettük, majd 20 ml metilén-dikloridban további 2 ekvivalens 2-klór-etil-izocianátot, 3 csepp trietil-amint és 2 csepp dibutil-ón-dilaurátot adtunk hozzá. A keveréket ismét egy éjszakán át kevertettük, ezt követően jeges vízre öntöttük, metilén-dikloriddal kétszer extraháltuk, szárítottuk és bepároltuk. A maradékot szilikagéloszlopra vittük, majd 4:1 térfogatarányú hexán/dietyl-éter oldószerkeleggyel eluáltuk. Ennek eredményeként 0,9 g mennyiségben nyertük a 4-klór-3-{1-[[N-(2-klór-etil)-karbamoil]-oxi]-2'-(trifluor-metil)-benzil}-piridint.

#### 7. PÉLDA

##### A 4-klór-3-{1-[(N,N-dimetil-karbamoil)-oxi]-2'-(trifluor-metil)-benzil}-piridin előállítás

(27. számú vegyület)

1,5 g 3-[1-hidroxi-2'-(trifluor-metil)-benzil]-4-klór-piridint feloldottunk 25 ml tetrahydrofuranban, majd az oldatot 0 °C hőmérsékletre hűtöttük. Hozzáadtunk 0,5 g nátrium-hidridet, majd az így nyert keveréket 15 percen keresztül kevertettük. Ezt követően 0,75 ml N,N-dimetil-karbamoil-kloridot adtunk hozzá, és a reakciókeveréket egy éjszakán át szobahőmérsékleten kevertettük. A keveréket jeges vízre öntöttük, majd metilén-dikloriddal extraháltuk. A metilén-dikloridos fázist vízzel mostuk, vízmentes magnézium-szulfát felett szárítottuk, szűrtük és bepároltuk, amelynek eredményeként narancssárga színű szilárd anyagot kaptunk. A szilárd anyagot hexánnal öblítettük, és így 1,53 g mennyiségben nyertük a 4-klór-3-{1-[(N,N-dimetil-karbamoil)-oxi]-2'-(trifluor-metil)-benzil}-piridint.

#### 8. PÉLDA

##### A 4-klór-3-[1-(trimetil-acetoxi)-2'-(trifluor-metil)-benzil]-piridin előállítás

(39. számú vegyület)

2,0 g 3-[1-hidroxi-2'-(trifluor-metil)-benzil]-4-klór-piridint feloldottunk 40 ml tetrahydrofuranban, majd az oldatot 0 °C hőmérsékletre hűtöttük. Hozzáadtunk 0,7 g nátrium-hidridet, majd az így nyert keveréket 15 percen keresztül kevertettük.

Ezt követően 1,30 ml trimetil-acetil-kloridot adtunk hozzá, és a reakciókeveréket egy éjszakán át szobahőmérsékleten kevertettük. A keveréket jeges vízre öntöttük, majd metilén-dikloriddal kétszer extraháltuk. A metilén-dikloridos fázisokat egyesítettük, majd vízzel mostuk, vízmentes magnézium-szulfát felett szárítottuk, szűrtük és bepároltuk, amelynek eredményeként sárga olaj formájában nyertük a 4-klór-3-[1-(trimetil-acetoxi)-2'-(trifluor-metil)-benzil]-piridint.

#### 9. PÉLDA

#### A 3-[1-(benzil-oxi)-2'-(trifluor-metil)-benzil]-4-klór-piridin előállítása

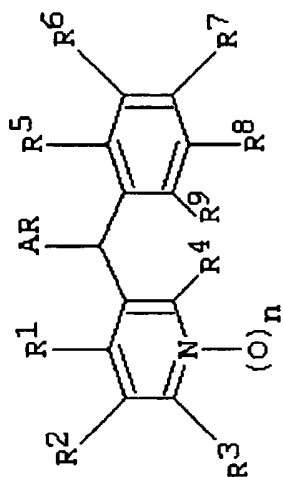
(57. számú vegyület)

0,9 g 80 % paraffinolajos nátrium-hidrid-diszperziót négyszer 2 ml tetrahydrofuránnal mostunk. Két perc alatt 2,9 g 3-[1-hidroxil-2'-(trifluor-metil)-benzil]-4-klór-piridint adtunk hozzá, majd a keveréket 5 percen keresztül visszafolytatás mellett forraltuk, ezt követően pedig egy órán át szobahőmérsékleten kevertettük. 1,7 ml benzil-bromidot adtunk hozzá, a reakciókeveréket egy órán keresztül kevertettük, majd 30 percen át visszafolytatás mellett forraltuk. Hozzáadtunk 0,1 g nátrium-jodidot, és a keveréket további 30 percen keresztül kevertettük, majd bepároltuk. A maradékot feloldottuk víz és metilén-diklorid keverékében. A szerves fázist telített, vizes nátrium-klorid-oldattal mostuk és vízmentes magnézium-szulfát felett szárítottuk. Az oldatot szűrtük és bepároltuk. A maradékot szilikagéloszlopra vittük és 1:2 térfogatarányú hexán/etil-acetát oldószerkeleggyel eluáltuk. Ennek eredményeként 3,2 g mennyiségben nyertük a 3-[1-(benzil-oxi)-2'-(trifluor-metil)-benzil]-4-klór-piridint.

#### 10. PÉLDA

A fentiekben ismertetett eljárásokhoz hasonló módon állítottuk elő az alábbi I. Táblázatban felsorolt további vegyületeket:

I. Táblázat

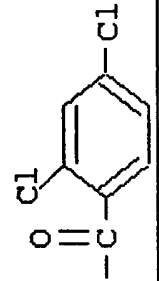
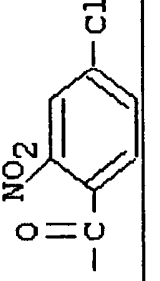
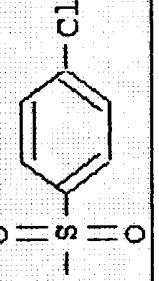
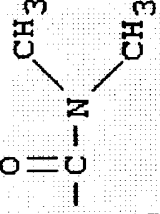
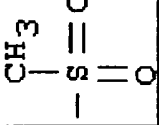
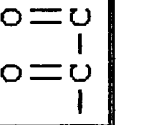


(I)

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében A jelentése oxigénatom

Vegy.	n	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R
1.	0	Cl	H	H	H	-CH <sub>3</sub>	H	Cl	H	H	H
2.	0	Cl	H	H	H	-CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	H
3.	0	Cl	H	H	H	-OCH <sub>3</sub>	H	-OCH <sub>3</sub>	H	H	H
4.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H
5.	0	Cl	H	H	H	-NO <sub>2</sub>	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H
6.	0	Cl	H	H	H	Cl	-OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Br	H	H	H
7.	0	Br	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H
8.	0	-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H
9.	0	Cl	H	H	H	Cl	H	H	H	H	H
10.	0	Cl	H	H	H	Br	H	H	H	H	H
11.	0	Cl	H	H	H	Cl	H	H	H	Cl	H

Vegy.	n	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R
12.	1	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H
13.	0	-CF <sub>3</sub>	H	H	Cl	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H
14.	0	Cl	H	H	H	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	H	H
15.	0	Cl	H	H	H	-CH <sub>3</sub>	H	H	H	-CH <sub>3</sub>	H
16.	0	Cl	H	H	H	-OCH <sub>3</sub>	H	H	H	H	H
17.	0	Cl	H	H	H	-OCF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H
18.	0	Cl	H	H	H	F	H	H	H	H	H
19.	0	-SCH <sub>3</sub>	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	H
20.	0	Cl	H	H	H	-SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	H	H
21.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{CH}_3 \end{array}$
22.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{CHCl}_2 \end{array}$
23.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{CH}_2\text{Cl} \end{array}$

Vegy.	n	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R
24.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	
25	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	
26.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	
27.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	
28.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	
29.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	

vegy.	n	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R
30.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{OC}_2\text{H}_5 \end{array}$
31.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{N} \begin{array}{l} \text{H} \\ \text{CH}_3 \end{array} \end{array}$
32.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{N} \begin{array}{l} \text{C}_2\text{H}_5 \\ \text{C}_2\text{H}_5 \end{array} \end{array}$
33.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{S} \\    \\ -\text{C}-\text{N} \begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \end{array}$
34.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{NH} \begin{array}{c} \text{---} \text{C}_6\text{H}_4 \text{---} \\   \\ \text{Cl} \end{array} \end{array}$
35.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{CH} \begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \end{array}$



Vegy.	n	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R
42.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{C}-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{CH}_3 \end{array}$
43.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{C}-\text{OCH}_3 \end{array}$
44.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{C}-\text{O}-\text{C}_6\text{H}_5 \end{array}$
45.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{C}-\text{NH}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2 \end{array}$
46.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{C}-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3 \end{array}$
47.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{C}-\text{CCl}_3 \end{array}$
48.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{C}-\text{N}(\text{CH}_2-\text{CH}=\text{CH}_2)_2 \end{array}$

Vegy.	n	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R
49.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \text{ O} \\   \quad    \\ -\text{C}-\text{C}-\text{OCH}_3 \\   \\ \text{CH}_3 \end{array}$
A 49. SZÁMÚ VEGYÜLET DIASZTEREOMERE											
51.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{NH}- \\   \\ \text{C}_6\text{H}_4\text{N} \end{array}$
52.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{N}- \\   \\ \text{C}_2\text{H}_4\text{CH}_3 \end{array}$
53.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{N}- \\   \\ \text{C}_6\text{H}_{10}\text{S} \end{array}$
54.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{CH}_2-\text{CH}_2-\text{CH}_3 \end{array}$
55.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{C}-\text{OCH}_3 \\    \\ \text{O} \end{array}$
56.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{C}-\text{OH} \\    \\ \text{O} \end{array}$

Vegy.	n	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R
57.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	
58.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	
59.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	
60.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	
61.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	
62.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	
63.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	

Vegy.	n	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R
64.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{NH}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{N} \end{array}$
65.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{NH}-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3 \end{array}$
66.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{N} \begin{array}{l} \text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3 \\ \text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3 \end{array} \end{array}$
67.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{NH}-\text{N} \begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \end{array}$
68.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{S}-\text{N} \begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \\    \\ \text{O} \end{array}$
69.	0	Cl	H	H	H	Cl	-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Br	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{N} \begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \end{array}$

Vegy.	n	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R
70.	0	Cl	H	H	H	-CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{---C---} \\   \quad \backslash \\ \text{CH}_3 \quad \text{CH}_3 \end{array}$
71.	0	Br	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{---C---} \\   \quad \backslash \\ \text{CH}_3 \quad \text{CH}_3 \end{array}$
72.	0	Cl	H	H	H	-NO <sub>2</sub>	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{---C---} \\   \quad \backslash \\ \text{CH}_3 \quad \text{CH}_3 \end{array}$
73.	0	Cl	H	H	H	Cl	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{---C---} \\   \quad \backslash \\ \text{CH}_3 \quad \text{CH}_3 \end{array}$
74.	0	Cl	H	H	H	-CH <sub>3</sub>	H	Cl	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{---C---} \\   \quad \backslash \\ \text{CH}_3 \quad \text{CH}_3 \end{array}$



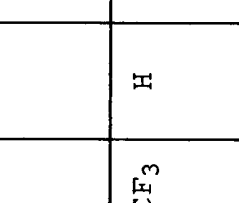
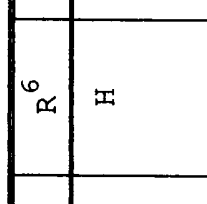
Vegy.	n	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R
75.	1	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{-C-N} \\ \quad \diagup \quad \diagdown \\ \text{CH}_3 \quad \text{CH}_3 \end{array}$
76.	0	Cl	H	H	H	Br	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{-C-N} \\ \quad \diagup \quad \diagdown \\ \text{CH}_3 \quad \text{CH}_3 \end{array}$
77.	0	Cl	H	H	H	Cl	H	H	H	Cl	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{-C-N} \\ \quad \diagup \quad \diagdown \\ \text{CH}_3 \quad \text{CH}_3 \end{array}$
78.	0	Cl	H	H	H	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{-C-N} \\ \quad \diagup \quad \diagdown \\ \text{CH}_3 \quad \text{CH}_3 \end{array}$
79.	0	Cl	H	H	H	-NO <sub>2</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{-C-N} \\ \quad \diagup \quad \diagdown \\ \text{CH}_3 \quad \text{CH}_3 \end{array}$

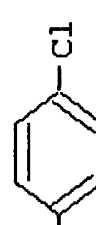
Vegy.	n	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R
80.	0	Cl	H	H	H	-OCH <sub>3</sub>	H	H	H	H	
81.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	
82.	0	Cl	H	H	H	F	H	H	H	H	
83.	0	Cl	H	H	H	-SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	H	
84.	0	Cl	H	H	H	-CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	
85.	0	Cl	H	H	H	Br	H	H	H	H	

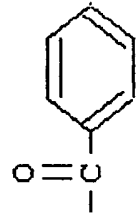
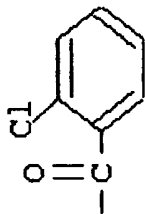
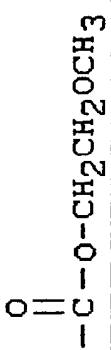
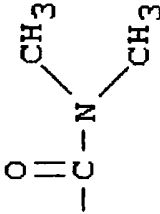
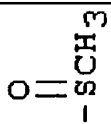
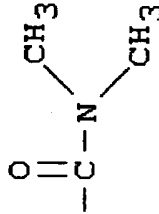
Vegy.	n	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R
86.	0	Cl	H	H	H	Cl	H	H	H	Cl	
87.	0	-CF <sub>3</sub>	H	H	Cl	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	
88.	0	Cl	H	H	H	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	H	
89.	0	Cl	H	H	H	-OCH <sub>3</sub>	H	H	H	H	
90.	0	Cl	H	H	H	-SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	H	
91.	0	Cl	H	H	H	-CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	
92.	0	Cl	H	H	H	Br	H	H	H	H	

Vegy.	n	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R
93.	0	Cl	H	H	H	Cl	H	H	H	Cl	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{NH}-\text{CH}_3 \end{array}$
94.	0	-CF <sub>3</sub>	H	H	Cl	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{NH}-\text{CH}_3 \end{array}$
95.	0	Cl	H	H	H	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{NH}-\text{CH}_3 \end{array}$
96.	0	Cl	H	H	H	-OCH <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{NH}-\text{CH}_3 \end{array}$
97.	0	Cl	H	H	H	-CH <sub>3</sub>	H	H	H	-CH <sub>3</sub>	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{NH}-\text{CH}_3 \end{array}$
98.	0	Cl	H	H	H	-OCH <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{NH}-\text{C}_2\text{H}_5 \end{array}$
99.	0	Cl	H	H	H	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{NH}-\text{C}_2\text{H}_5 \end{array}$
100.	0	Cl	H	H	H	-SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{NH}-\text{C}_2\text{H}_5 \end{array}$

Vegy.	n	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R
101.	0	Cl	H	H	H	-OCH <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{C}(\text{CH}_3)_3 \end{array}$
102.	0	Cl	H	H	H	-NO <sub>2</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{C}(\text{CH}_3)_3 \end{array}$
103.	0	Cl	H	H	H	-OCF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{C}(\text{CH}_3)_3 \end{array}$
104.	0	Cl	H	H	H	-OCH <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2\text{Cl} \end{array}$
105.	0	Cl	H	H	H	-NO <sub>2</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2\text{Cl} \end{array}$
106.	0	Cl	H	H	H	-OCF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2\text{Cl} \end{array}$
107.	0	Cl	H	H	H	F	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2\text{Cl} \end{array}$
108.	0	Cl	H	H	H	-CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{CH} \\ \quad \quad \quad \diagup \quad \diagdown \\ \quad \quad \quad \text{CH}_3 \quad \text{CH}_3 \end{array}$

Vegy.	n	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R
109.	0	Cl	H	H	H	Br	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{CH}_3 \\   \\ \text{O} \\    \\ \text{---C---CH} \\   \\ \text{CH}_3 \end{array}$
110.	0	Cl	H	H	H	Cl	-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Br	H	H	$\begin{array}{c} \text{Cl} \\   \\ \text{O} \\    \\ \text{---C---} \\   \\ \text{---} \end{array}$ 
111.	0	Cl	H	H	H	-NO <sub>2</sub>	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	$\begin{array}{c} \text{Cl} \\   \\ \text{O} \\    \\ \text{---C---} \\   \\ \text{---} \end{array}$ 
112.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ \text{---C---NH---CH}_2\text{---CH=CH}_2 \end{array}$
113.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	-CH <sub>3</sub>
114.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ \text{---C---NH---CH}_2\text{---C}\equiv\text{CH} \end{array}$
115.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ \text{---C---NH---CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3 \end{array}$

Vegy.	n	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R
116.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{NH}-\text{C}(\text{CH}_3)_2-\text{C}\equiv\text{CH} \end{array}$
117.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{C}(\text{CH}_3)_2-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3 \end{array}$
118.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
119.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -C(Cl)=CH <sub>2</sub>
120.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{NH}-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_3 \end{array}$
121.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{NH}-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_3 \\ \text{O} \\    \\ \text{O} \end{array}$
122.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{NH}-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_3 \\ \text{O} \\    \\ \text{O} \end{array}$
123.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{NH}-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_3 \\ \text{O} \\    \\ \text{O} \end{array}$ 

Vegy.	n	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R
124.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	
125.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	
126.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -C(Cl)-C≡CH
127.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	-CH <sub>2</sub> -C(Cl)(Br)-CH <sub>2</sub>
128.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	
129.	0	-SCH <sub>3</sub>	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	
130.	0		H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	



Vegy.	n	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R
131.	0	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{SCH}_3 \\    \\ \text{O} \end{array}$	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{N}(\text{CH}_3)_2 \end{array}$
132.	0	Cl	H	H	H	Cl	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{NH}-\text{CH}_3 \end{array}$
133.	0	Cl	H	H	H	Cl	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{NH}-\text{C}_2\text{H}_5 \end{array}$
134.	0	Cl	H	H	H	-OCF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{NH}-\text{C}_2\text{H}_5 \end{array}$
135.	0	Cl	H	H	H	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{C}(\text{CH}_3)_3 \end{array}$
136.	0	Cl	H	H	H	Cl	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{C}(\text{CH}_3)_3 \end{array}$
137.	0	Cl	H	H	H	Br	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{C}(\text{CH}_3)_3 \end{array}$

Vegy.	n	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R
138.	0	Cl	H	H	H	-CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{C}(\text{CH}_3)_3 \end{array}$
139.	0	Cl	H	H	H	Br	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2\text{Cl} \end{array}$
140.	0	Cl	H	H	H	-CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{NH}-\text{CH}_2-\text{CH}_2\text{Cl} \end{array}$
141.	0	Cl	H	H	H	-CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\    \\ -\text{C}-\text{N} \begin{array}{l} \diagup \text{CH}_2\text{CH}_3 \\ \diagdown \text{CH}_2\text{CH}_3 \end{array} \end{array}$

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében A jelentése kénatom

Vegy.	n	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R
142.	0	Cl	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	$\begin{array}{c} \text{S} \\    \\ -\text{C}-\text{N} \begin{array}{l} \diagup \text{CH}_2\text{CH}_3 \\ \diagdown \text{CH}_2\text{CH}_3 \end{array} \end{array}$
143.	0	-OH	H	H	H	-CF <sub>3</sub>	H	H	H	H	-CH <sub>3</sub>

### A HERBICID HATÁS SZŰRŐVIZSGÁLATA

Az előbbi táblázatban felsorolt vegyületek herbicid aktivitását különféle módszerekkel és adagolási mennyiségek (dózisok) mellett teszteltük. Néhány vizsgálat eredményét az alábbiakban ismertetjük. Az ezen a területen jártas szakember számára ismert, hogy a herbicid szűrővizsgálatokban nyert eredményeket számos olyan tényező befolyásolhatja, amelyeket nem lehet egyszerűen szabályozni. Az ilyen tényezők példái között megemlíthető a napfény és a víz mennyisége, a talaj típusa, a talaj pH-értéke, a hőmérséklet és a páratartalom. Az eredményeket befolyásoló további tényezők közé tartozik az ültetés mélysége, a herbicid adagolási mennyisége, valamint a vizsgálandó haszonnövény jellege. Az eredmények növényenként, sőt növényfajtánként is változhatnak.

### PREEMERGENS HERBICID SZŰRŐVIZSGÁLAT

Az előkészítés napján többféle gyomnövényfajta magjait 1,3 cm (0,5 inch) mélységben homokos agyagtalajban oly módon ültettük el, hogy vizsgálati területet keresztező sorokban soronként egy-egy fajtát ültettünk. A talajt 17-17-17 műtrágyával (N-P<sub>2</sub>O<sub>5</sub>-K<sub>2</sub>O) kezeltük és pasztörizáltuk. A következő gyomokat ültettük el: hélazab (*Avena fatua*) (AVEFA), közönséges kakaslábfű (*Echinochloa crus-galli*) (ECHCG), zöld muhar (*Setaria viridis*) (SETVI), selyemmályva (*Abutilon theophrasti*), hajnalkafajok (*Ipomoea spp.*) (IPOSS), valamint vadrepce (*Sinapis arvensis*) (SINAR). A növények sűrűségét – a növények méretétől függően – soronként 3 és 25 között választottuk meg.

A tesztvegyületek oldatait úgy állítottuk elő, hogy a tesztvegyület 74,7 vagy 18,8 milligrammnyi mennyiségét egy 60 ml-es széles szájú lombikba helyeztük, majd az anyagot feloldottuk 7,0 ml olyan acetonban, amely 1 % Tween 20<sup>®</sup> [poli(oxi-etilén)-szorbitán-monolaurát] emulgeálószeret tartalmazott, és ezt követően a 14 ml-es végtérfogat eléréséhez 7 ml ionmentes vizet adtunk az oldathoz. A végső permetmennyiségben 0,5 térfogat% volt a Tween 20 koncentrációja. Amennyiben szükséges volt, a vegyület feloldásához további oldószereket alkalmaztunk (legfeljebb 2 milliliternyi mennyiségben).

A talajfelületeket zárt, szabályos négyszögalakú földterületeken permeteztük. A területeket 748 liter/hektár mennyiségnek megfelelő permetoldat-mennyiségekkel permeteztük. Ennek megfelelően a hatóanyag dózisa (alkalmazási mennyisége) 4,0 vagy 1,0 kilogramm/hektár értékű volt.

Az egyes földterületeket 21-29 °C hőmérsékletű üvegházba helyeztük, majd esőzttéssel naponta vízzel locsoltuk. A gyomnövény-szabályozás mértékét vizuálisan becsültük meg és a kezelés után 17--21 nappal rögzítettük az eredményeket. Ennek során a kontroll százalékos értékét úgy állapítottuk meg, hogy összehasonlítottuk a kezelt növények növekedésének mértékét a kontrollcsoportéval, amely utóbbiban ugyanolyan korú azonos fajtaakat kezeletlen földterületeken neveltünk.

A preemergens tesztek eredményeit az alábbi II. Táblázatban összegezzük.

#### POSZTEMERGENS HERBICID ÉRTÉKELÉS

A talajt ugyanúgy készítettük elő és az ültetést ugyanazokkal a magokkal ugyanúgy végeztük, ahogyan azt a preemergens teszt során ismertettük. A zárt földterületeket 21-29 °C hőmérsékletű üvegházba helyeztük, majd vízzel öntöztük. A gyomfajták magvait a kezelés előtt 10-12 nappal vetettük el. A fűféléket általában a 3-4. levélállapotban, míg a széles levelűket általában az 1-2. levélállapotban permeteztük. A kezelt földterületek öntözését úgy végeztük, hogy a víz csak a talajfelületre jutott, a csírázó növények levélzetét nem érintette. A gyomnövény-szabályozás mértékét vizuálisan becsültük meg és a kezelés után 17--21 nappal rögzítettük az eredményeket. Ennek során a kontroll százalékos értékét úgy állapítottuk meg, hogy összehasonlítottuk a kezelt növények növekedésének mértékét a kontrollcsoportéval, amely utóbbiban ugyanolyan korú azonos fajtaakat kezeletlen földterületeken neveltünk.

A százalékos kontroll magában foglalja a növények minden károsodását, azaz az összes olyan károsodást, amilyen például a gátolt csírázás, a növényi szövetek kikelés utáni elhalása, a törpenövés, a deformáltság, a klorózis, valamint az egyéb típusú károsodások. A szabályozás értéke 0 és 100 százalék között

változott, ahol a 0 % azt jelentette, hogy a növekedés azonos volt a kezeletlen kontrolléval, azaz semmilyen hatás nem történt, míg a 100 % a teljes pusztulást jelölte. A II. Táblázatban a szaggatott vonal (--) arra utal, hogy az adott esetben nem végeztünk vizsgálatot.

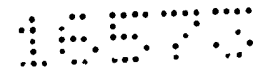
Az eredményeket az alábbi II. Táblázatban foglaljuk össze.

II. TÁBLÁZAT  
Preemergens vizsgálat (4,0 kg/ha)

VEGYÜLET	AVEFA	ECHCG	SETVI	ABUTH	IPOSS	SINAR
1.	0	0	--*	0	0	0
2.	0	0	--*	0	0	0
3.	0	0	0	0	0	0
4.	10	98	10	30	30	10
5.	0	0	0	0	0	0
6.	0	0	0	0	0	0
7.	0	98	15	70	20	25
8.	0	0	0	0	0	0
9.	0	0	0	0	0	0
10.	5	50	10	5	10	0
11.	0	0	0	0	10	0
12.	0	10	10	0	10	0
13.	0	10	10	0	10	0
14.	5	100	20	40	40	25
15.	40	95	15	60	20	30
16.	30	5	100	0	0	0
17.	10	98	10	60	60	15
18.	0	0	0	0	0	0
19.	15	90	90	0	0	0
20.	0	98	0	10	10	20
21.	20	100	10	40	10	20
22.	50	98	40	60	10	40
23.	5	0	70	10	0	0
24.	10	98	100	90	80	50
25.	0	25	95	70	10	60

VEGYÜLET	AVEFA	ECHCG	SETVI	ABUTH	IPOSS	SINAR
26.	5	98	20	70	50	0
27.	20	100	100	98	95	75
28.	5	98	10	60	0	10
29.	5	98	80	70	5	15
30.	5	100	20	70	20	20
31.	95	100	100	98	95	90
32.	95	100	100	100	98	85
33.	5	100	100	85	90	20
34.	10	25	100	75	50	10
35.	60	100	80	85	95	25
36.	25	100	95	30	60	20
37.	98	100	100	98	95	80
38.	60	100	100	90	95	70
39.	98	100	100	95	95	90
40.	0	90	95	60	80	5
41.	98	100	100	98	95	60
42.	98	100	100	100	95	90
43.	50	100	30	--*	15	30
44.	5	100	20	60	20	10
45.	98	100	100	100	95	70
46.	98	100	100	100	95	85
47.	75	100	100	70	85	75
48.	15	100	100	60	90	50
49.	0	10	100	40	10	15
50.	0	0	10	5	5	10
51.	0	10	100	0	0	10
52.	98	100	100	98	95	80
53.	98	100	100	70	90	40
54.	20	100	30	50	20	60
55.	0	0	0	0	5	0
56.	0	0	0	5	5	10
57.	60	100	100	95	100	85
58.	40	100	100	70	100	40
59.	10	100	100	70	50	10
60.	95	100	100	100	95	75

VEGYÜLET	AVEFA	ECHCG	SETVI	ABUTH	IPOSS	SINAR
61.	40	100	100	5	10	0
62.	95	100	100	70	95	40
63.	90	100	100	60	95	60
64.	0	0	0	0	0	0
65.	98	100	100	98	95	75
66.	10	100	100	60	90	30
67.	98	100	100	90	90	75
68.	60	100	60	80	30	70
69.	5	70	25	5	10	30
70.	85	100	100	90	95	60
71.	0	0	0	0	0	0
72.	0	10	10	5	0	0
73.	70	100	100	90	90	40
74.	5	95	90	10	10	0
75.	80	100	100	60	80	10
76.	25	100	100	100	95	30
77.	5	100	100	60	50	15
78.	95	100	100	90	100	85
79.	25	100	100	100	0	25
80.	25	100	100	50	90	5
81.	90	100	100	95	95	60
82.	40	100	100	70	85	5
83.	0	100	98	60	90	20
84.	70	100	100	90	98	60
85.	60	100	100	100	95	90
86.	20	100	100	100	95	25
87.	0	5	0	5	10	0
88.	98	100	100	100	95	60
89.	90	100	100	90	100	60
90.	30	100	98	70	90	10
91.	98	100	100	70	90	50
92.	98	100	100	100	98	75
93.	70	100	100	15	90	15
94.	0	10	0	0	0	0
95.	100	100	100	100	98	100



VEGYÜLET	AVEFA	ECHCG	SETVI	ABUTH	IPOSS	SINAR
96.	98	100	100	75	95	50
97.	95	100	100	30	98	15
98.	85	100	100	80	95	50
99.	98	100	100	90	95	85
100.	40	100	98	50	40	20
101.	15	100	100	0	15	5
102.	0	100	100	0	0	0
103.	75	100	100	60	90	20
104.	85	100	100	60	95	20
105.	85	100	100	30	30	30
106.	100	100	100	100	95	70
107.	50	100	100	25	85	10
108.	5	15	20	5	5	10
109.	10	10	20	0	5	40
110.	0	0	40	0	0	0
111.	0	0	0	0	0	0
112.	95	100	100	90	95	85
113.	10	85	100	10	5	10
114.	75	100	100	90	90	50
115.	80	100	100	90	90	60
116.	5	100	100	85	90	60
117.	50	100	100	95	90	80
118.	20	100	100	10	15	5
119.	10	100	100	75	90	60
120.	10	100	95	10	0	20
121.	0	60	100	20	10	10
122.	0	70	98	10	0	20
123.	5	100	100	50	10	30
124.	30	100	100	70	50	60
125.	20	100	100	85	90	80
126.	5	10	60	0	0	10
127.	20	100	100	60	5	90
128.	15	100	100	75	80	60
129.	10	30	98	0	5	30
130.	25	70	98	30	30	10



VEGYÜLET	AVEFA	ECHCG	SETVI	ABUTH	IPOSS	SINAR
131.	10	95	98	50	75	20
132.	90	100	100	70	95	60
133.	95	100	100	85	95	50
134.	90	100	100	90	90	90
135.	70	100	100	90	95	80
136.	25	100	100	50	90	50
137.	30	100	100	70	90	50
138.	30	100	100	90	90	90
139.	80	100	100	80	90	30
140.	90	100	100	50	80	75
141.	25	100	100	90	98	90
142.	0	10	60	0	40	10
143.	15	20	80	15	0	10

\* --: nem történt vizsgálat

### III. TÁBLÁZAT

Posztemergens vizsgálat (4,0 kg/ha)

VEGYÜLET	AVEFA	ECHCG	SETVI	ABUTH	IPOSS	SINAR
1.	0	0	0	0	0	0
2.	0	0	0	0	0	0
3.	0	0	0	0	0	0
4.	0	70	20	0	10	0
5.	0	0	0	0	0	0
6.	0	0	0	0	0	0
7.	0	95	20	5	30	5
8.	0	0	0	0	5	15
9.	0	0	0	0	5	0
10.	0	0	0	0	20	10
11.	5	10	10	0	0	0
12.	0	0	10	0	5	0
13.	0	0	10	0	5	0
14.	10	70	30	5	80	10
15.	0	0	0	5	15	0

VEGYÜLET	AVEFA	ECHCG	SETVI	ABUTH	IPOSS	SINAR
16.	0	0	0	0	5	0
17.	5	5	15	10	15	10
18.	0	0	0	0	0	0
19.	0	0	0	0	10	0
20.	0	0	0	0	15	5
21.	0	25	5	15	10	0
22.	10	90	15	5	90	5
23.	5	0	70	10	0	0
24.	5	0	25	100	85	75
25.	0	0	0	85	85	20
26.	10	95	5	10	60	0
27.	85	98	85	100	95	85
28.	10	95	5	0	20	0
29.	10	98	10	5	30	0
30.	0	98	5	90	90	0
31.	90	98	90	95	90	80
32.	15	95	85	90	90	80
33.	5	80	85	95	90	60
34.	15	10	25	85	60	15
35.	10	98	60	98	90	40
36.	10	70	50	80	90	75
37.	95	98	90	98	90	85
38.	5	98	40	98	90	75
39.	90	98	85	100	90	85
40.	25	30	30	95	90	60
41.	90	98	90	98	90	90
42.	90	95	90	90	90	90
43.	20	95	20	30	30	5
44.	0	50	20	60	60	10
45.	90	100	90	95	90	85
46.	90	98	90	95	90	75
47.	5	98	60	10	20	70
48.	15	100	80	88	85	80
49.	5	10	15	60	60	30
50.	0	0	20	10	15	0

VEGYÜLET	AVEFA	ECHCG	SETVI	ABUTH	IPOSS	SINAR
51.	0	0	20	60	80	15
52.	95	100	98	95	90	75
53.	60	100	90	95	90	60
54.	75	100	30	75	85	10
55.	0	10	0	20	20	70
56.	0	0	0	5	25	15
57.	20	98	95	95	95	95
58.	60	100	98	98	90	80
59.	5	98	20	10	15	5
60.	75	100	98	100	90	80
61.	15	40	30	30	85	15
62.	70	95	95	98	90	50
63.	85	98	95	50	85	60
64.	0	0	0	0	5	5
65.	95	100	95	50	85	60
66.	0	0	0	0	5	5
67.	95	100	95	98	95	60
68.	10	98	15	30	10	20
69.	0	0	0	75	90	75
70.	70	98	90	95	90	70
71.	0	0	0	0	0	0
72.	0	5	15	30	10	10
73.	5	95	90	95	90	40
74.	5	25	10	75	20	20
75.	10	40	60	98	90	70
76.	90	98	90	95	90	90
77.	10	50	70	80	75	80
78.	90	100	95	95	85	75
79.	15	100	85	80	85	30
80.	30	95	85	85	90	25
81.	95	98	90	100	90	40
82.	5	95	90	60	90	75
83.	5	70	85	95	90	60
84.	85	95	75	80	90	60
85.	50	95	75	50	80	30

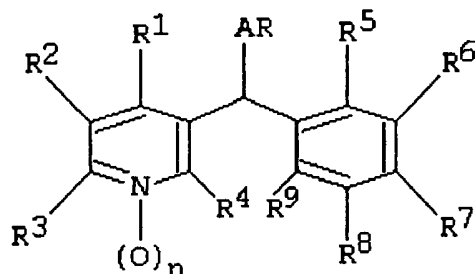
VEGYÜLET	AVEFA	ECHCG	SETVI	ABUTH	IPOSS	SINAR
86.	30	100	70	60	85	30
87.	0	0	0	0	5	0
88.	90	98	90	95	90	80
89.	90	98	90	90	85	50
90.	15	95	60	95	90	25
91.	90	95	80	90	90	60
92.	95	100	90	95	90	75
93.	40	40	15	30	60	50
94.	0	0	0	0	0	0
95.	90	98	90	98	90	70
96.	95	98	98	98	85	40
97.	90	98	95	60	85	15
98.	100	100	100	98	85	60
99.	98	100	100	98	90	95
100.	25	95	75	90	90	20
101.	60	75	30	75	85	75
102.	10	100	85	70	90	20
103.	50	100	95	90	95	60
104.	98	100	98	90	80	50
105.	60	100	85	50	20	10
106.	90	98	95	100	90	60
107.	40	85	90	30	95	20
108.	20	20	30	60	60	40
109.	5	25	15	60	75	80
110.	0	0	0	25	25	15
111.	0	0	0	10	10	0
112.	90	95	90	98	90	80
113.	0	0	10	15	20	0
114.	80	98	90	98	90	70
115.	85	98	90	90	90	60
116.	70	98	85	70	90	30
117.	5	95	90	98	95	85
118.	10	10	20	20	80	15
119.	5	98	85	90	90	80
120.	0	10	50	50	90	85

VEGYÜLET	AVEFA	ECHCG	SETVI	ABUTH	IPOSS	SINAR
121.	0	0	30	70	85	15
122.	0	5	20	80	90	60
123.	0	5	10	95	75	75
124.	20	98	30	90	70	80
125.	10	50	80	95	90	25
126.	5	20	60	90	90	85
127.	15	25	60	70	95	80
128.	25	90	60	75	95	80
129.	0	10	20	60	85	30
130.	10	40	85	98	90	10
131.	5	60	85	90	90	10
132.	95	100	95	85	90	80
133.	90	98	90	85	85	80
134.	90	98	90	98	90	90
135.	50	95	90	95	90	90
136.	20	98	85	75	90	50
137.	15	95	90	90	90	70
138.	20	98	90	90	95	70
139.	90	98	90	95	90	70
140.	75	98	90	75	85	60
141.	10	60	60	60	60	80
142.	0	0	10	60	90	50
143.	0	5	10	30	60	5

A fenti eredmények jól szemléltetik a találmány szerinti vegyületek különféle fű- és széles levelű fajtákkal szembeni preemergens és posztemergens hatékonyságát.

## SZABADALMI IGÉNYPONTOK

1. Egy (I) általános képletű vegyület



(I)

– amelynek képletében

$R^1$  és  $R^5$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül halogénatom, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos alkoxicsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport,  $-S(O)_m-R^{10}$  általános képletű csoport, cianocsoport, hidroxics csoport, tiocianátocsoport, nitrocsoport vagy  $-N(R^{11})(R^{12})$  általános képletű csoport;

$R^2$ ,  $R^3$  és  $R^4$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, nitrocsoport, halogénatom, 1-6 szénatomos alkoxicsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport vagy  $-S(O)_m-R^{10}$  általános képletű csoport;

$R^6$ ,  $R^7$  és  $R^8$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, halogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport, nitrocsoport,  $-N(R^{11})(R^{12})$  általános képletű csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-6 szénatomos alkoxi-csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, halogén-(1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, cianocsoport,  $-C(X)-R^{10}$  vagy  $-S(O)_m-R^{10}$  általános képletű csoport;

$R^9$  jelentése hidrogénatom, halogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-6 szénatomos alkoxicsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-cso-

port, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport,  $-S(O)_m-R^{10}$  általános képletű csoport, cianocsoport, hidroxicssoport, tiocianátocsoport, nitrocsoport vagy  $-N(R^{11})(R^{12})$  általános képletű csoport;

A jelentése oxigénatom vagy kénatom;

n értéke 0 vagy 1; és

R jelentése hidrogénatom, adott esetben egy vagy több halogénatommal vagy 1-6 szénatomos alkoxicssoporttal szubsztituált hidrokARBILcsoport, vagy  $-C(X)-R^{10}$ ,  $-C(O)-C(O)-R^{10}$ ,  $-S(O)_2-R^{10}$  vagy  $-P(X)(R^{15})(R^{16})$  általános képletű csoport; ahol

X jelentése oxigénatom vagy kénatom;

$R^{10}$  jelentése adott esetben szubsztituált hidrokARBILcsoport, adott esetben szubsztituált hidrokARBIL-oxi-csoport, adott esetben szubsztituált hidrokARBIL-tio-csoport vagy  $-N(R^{11})(R^{12})$  általános képletű csoport;

$R^{11}$  és  $R^{12}$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, adott esetben szubsztituált hidrokARBILcsoport, adott esetben szubsztituált hidrokARBIL-oxi-csoport, piridilcsoport, furilcsoport, tienilcsoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, hidroxikARBONIL-(1-6 szénatomos alkil)-csoport vagy  $-N(R^{13})(R^{14})$  általános képletű csoport; vagy

$R^{11}$  és  $R^{12}$  azzal a nitrogénatommal együtt, amelyhez kötődnek, aziridin-, piperazin-, morfolin-, tiomorfolin-, tiomorfolin-szulfinil-, tiomorfolin-szulfonil-, hexametilénimin-, piperidin- vagy pirrolidingyűrűt képeznek, amelyek mindegyike adott esetben 1-6 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált lehet;

$R^{13}$  és  $R^{14}$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport vagy fenilcsoport;

$R^{15}$  és  $R^{16}$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénato-

mos alkil-tio-csoport vagy 1-6 szénatomos al-  
koxicssoport; és

m értéke 0, 1 vagy 2;

azzal a megkötéssel, hogy amennyiben R<sup>1</sup> jelentése klóratom vagy  
fluoratom; R<sup>5</sup> jelentése hidrogénatom, klóratom, fluoratom vagy  
metoxicssoport; valamint R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> és R<sup>9</sup> jelentése hid-  
rogénatom; akkor R jelentése hidrogénatomtól eltérő –  
és mezőgazdaságilag elfogadható sói.

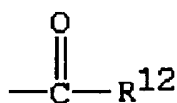
2. Egy 1. igénypont szerinti vegyület, amelynek képletében  
R<sup>1</sup> jelentése halogénatom.

3. Egy 2. igénypont szerinti vegyület, amelynek képletében  
R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> és R<sup>4</sup> jelentése hidrogénatom.

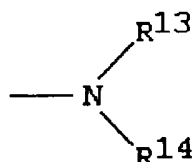
4. Egy 1. igénypont szerinti vegyület, amelynek képletében  
R<sup>5</sup> jelentése halogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6  
szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-6 szénatomos halogén-alko-  
xi-csoport, 1-6 szénatomos alkokicssoport, nitrocsoport vagy  
(1-3 szénatomos alkil)-S(O)<sub>m</sub>- általános képletű csoport, amely-  
ben m értéke 0, 1 vagy 2.

5. Egy 4. igénypont szerinti vegyület, amelynek képletében  
R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> és R<sup>9</sup> mindegyikének jelentése egymástól függetlenül  
hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, halogénatom vagy 1-6  
szénatomos alkokicssoport.

6. Egy 1. igénypont szerinti vegyület, amelynek képletében  
R jelentése fenil-(1-3 szénatomos alkil)-csoport vagy



általános képletű csoport, amelyben R<sup>12</sup> jelentése 1-12 szénato-  
mos alkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, fenil-  
csoport vagy



általános képletű csoport, amelyben R<sup>13</sup> és R<sup>14</sup> jelentése egy-  
mástól függetlenül hidrogénatom, 1-12 szénatomos alkilcsoport,  
2-12 szénatomos alkenilcsoport, 2-12 szénatomos alkinilcsoport,  
fenilcsoport, 1-12 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-6 szén-

atomos alkoxicsoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, vagy  $R^{13}$  és  $R^{14}$  azzal nitrogénatommal együtt, amelyhez kötődik, morfolin-, piperidin- vagy pirrolidingyűrűt képez.

7. Egy 1. igénypont szerinti vegyület, amelynek képletében  $R^1$  jelentése halogénatom;

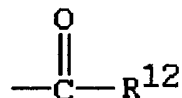
$R^2$ ,  $R^3$  és  $R^4$  jelentése hidrogénatom;

$R^5$  jelentése halogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-6 szénatomos alkoxi-csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, nitrocsoport vagy  $-S(O)_m$ -(1-3 szénatomos alkil)- általános képletű csoport, amelyben

$m$  értéke 0, 1 vagy 2;

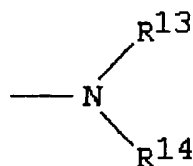
$R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$  és  $R^9$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, halogénatom vagy 1-6 szénatomos alkoxicsoport; és

$R$  jelentése fenil-(1-3 szénatomos alkil)-csoport vagy



általános képletű csoport, amelyben

$R^{12}$  jelentése 1-12 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, fenilcsoport vagy

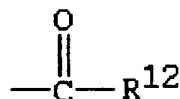


általános képletű csoport, amelyben

$R^{13}$  és  $R^{14}$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-12 szénatomos alkilcsoport, 2-12 szénatomos alkenilcsoport, 2-12 szénatomos alkinilcsoport, fenilcsoport, 1-12 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-6 szénatomos alkoxicsoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, vagy  $R^{13}$  és  $R^{14}$  azzal nitro-

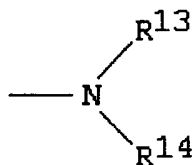
génatommal együtt, amelyhez kötődik, morfolin-, piperidin- vagy pirrolidin-gyűrűt képez.

8. Egy 1. igénypont szerinti vegyület, amelynek képletében
- R<sup>1</sup> jelentése klóratom vagy brómatom;
  - R<sup>5</sup> jelentése trifluor-metil-, trifluor-metoxi-csoport, klór-, brómatom, metoxi-, metil- vagy etilcsoport;
  - R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>7</sup> és R<sup>8</sup> jelentése hidrogénatom;
  - R<sup>6</sup> és R<sup>9</sup> mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, klóratom vagy metilcsoport; és
  - R jelentése benzilcsoport vagy



általános képletű csoport, amelyben

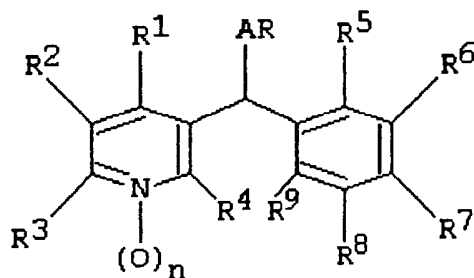
R<sup>12</sup> jelentése 1-16 szénatomos alkilcsoport vagy



általános képletű csoport, amelyben

R<sup>13</sup> és R<sup>14</sup> jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, fenilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport vagy 1-6 szénatomos alkilcsoport, vagy R<sup>13</sup> és R<sup>14</sup> együtt morfolingyűrűt képez.

9. Herbicid készítmény, **azzal jellemezve**, hogy (A) egy olyan (Ia) általános képletű vegyületet



(Ia)

vagy ennek egy mezőgazdaságilag elfogadható sóját tartalmazza, amelyben

- $R^1$  és  $R^5$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül halogénatom, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos alkoxicssoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport,  $-S(O)_m-R^{10}$  általános képletű csoport, cianocsoport, hidroxicssoport, tiocianátocsoport, nitrocsoport vagy  $-N(R^{11})(R^{12})$  általános képletű csoport;
- $R^2$ ,  $R^3$  és  $R^4$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, nitrocsoport, halogénatom, 1-6 szénatomos alkoxicssoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport vagy  $-S(O)_m-R^{10}$  általános képletű csoport;
- $R^6$ ,  $R^7$  és  $R^8$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, halogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport, nitrocsoport,  $-N(R^{11})(R^{12})$  általános képletű csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-6 szénatomos alkoxi-csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, halogén-(1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, cianocsoport,  $-C(X)-R^{10}$  vagy  $-S(O)_m-R^{10}$  általános képletű csoport;
- $R^9$  jelentése hidrogénatom, halogénatom, 1-6 szénatomos alkil-csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-6 szénatomos alkoxicssoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport,  $-S(O)_m-R^{10}$  általános képletű csoport, cianocsoport, hidroxicssoport, tiocianátocsoport, nitrocsoport vagy  $-N(R^{11})(R^{12})$  általános képletű csoport;
- A jelentése oxigénatom vagy kénatom;
- n értéke 0 vagy 1; és
- R jelentése hidrogénatom, adott esetben egy vagy több halogénatommal vagy 1-6 szénatomos alkoxicssoporttal szubsztituált hidrokarboncsoport, vagy  $-C(X)-R^{10}$ ,  $-C(O)-C(O)-R^{10}$ ,  $-S(O)_2-R^{10}$  vagy  $-P(X)(R^{15})(R^{16})$  általános képletű csoport;
- ahol
- X jelentése oxigénatom vagy kénatom;

$R^{10}$  jelentése adott esetben szubsztituált hidrokARBILCSOPORT, adott esetben szubsztituált hidrokARBIL-oxi-csoport, adott esetben szubsztituált hidrokARBIL-tio-csoport vagy  $-N(R^{11})(R^{12})$  általános képletű csoport;

$R^{11}$  és  $R^{12}$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, adott esetben szubsztituált hidrokARBILCSOPORT, adott esetben szubsztituált hidrokARBIL-oxi-csoport, piridilcsoport, furilcsoport, tienilcsoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, hidroxikarbonil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport vagy  $-N(R^{13})(R^{14})$  általános képletű csoport; vagy

$R^{11}$  és  $R^{12}$  azzal a nitrogénatommal együtt, amelyhez kötődnek, aziridin-, piperazin-, morfolin-, tiomorfolin-, tiomorfolin-szulfonil-, tiomorfolin-szulfonil-, hexametilénimin-, piperidin- vagy pirrolidingyűrűt képeznek, amelyek mindegyike adott esetben 1-6 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált lehet;

$R^{13}$  és  $R^{14}$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport vagy fenilcsoport;

$R^{15}$  és  $R^{16}$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos alkil-tio-csoport vagy 1-6 szénatomos alkoxicssoport; és

$m$  értéke 0, 1 vagy 2; és

(B) egy megfelelő hordozót tartalmaz.

10. A 9. igénypont szerinti készítmény, **azzal jellemezve**, hogy  $R^1$  jelentése halogénatom.

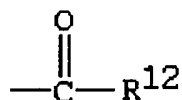
11. A 10. igénypont szerinti készítmény, **azzal jellemezve**, hogy  $R^2$ ,  $R^3$  és  $R^4$  jelentése hidrogénatom.

12. A 9. igénypont szerinti készítmény, **azzal jellemezve**, hogy  $R^5$  jelentése halogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, 1-6 szénatomos alkoxicssoport, nitrocso-

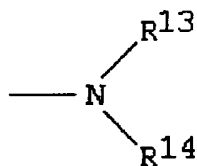
port vagy (1-3 szénatomos alkil)-S(O)<sub>m</sub>- általános képletű csoport, amelyben m értéke 0, 1 vagy 2.

13. A 12. igénypont szerinti készítmény, **azzal jellemelve**, hogy R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> és R<sup>9</sup> mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, halogénatom vagy 1-6 szénatomos alkoxicsoport.

14. A 9. igénypont szerinti készítmény, **azzal jellemezve**, hogy R jelentése fenil-(1-3 szénatomos alkil)-csoport vagy



általános képletű csoport, amelyben R<sup>12</sup> jelentése 1-12 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, fenil-csoport vagy



általános képletű csoport, amelyben R<sup>13</sup> és R<sup>14</sup> jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-12 szénatomos alkilcsoport, 2-12 szénatomos alkenilcsoport, 2-12 szénatomos alkinilcsoport, fenilcsoport, 1-12 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-6 szénatomos alkoxicsoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, vagy R<sup>13</sup> és R<sup>14</sup> azzal nitrogénatommal együtt, amelyhez kötődik, morfolin-, piperidin- vagy pirrolidingyűrű képez.

15. A 9. igénypont szerinti készítmény, **azzal jellemezve**, hogy

R<sup>1</sup> jelentése halogénatom;

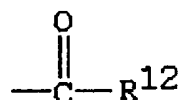
R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> és R<sup>4</sup> jelentése hidrogénatom;

R<sup>5</sup> jelentése halogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-6 szénatomos alkoxicsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, nitrocsoport vagy -S(O)<sub>m</sub>-(1-3 szénatomos alkil)- általános képletű csoport, amelyben

m értéke 0, 1 vagy 2;

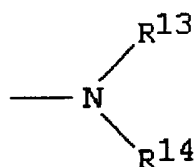
R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> és R<sup>9</sup> mindegyikének jelentése egymástól függetlenül

hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, halogénatom vagy 1-6 szénatomos alkokicsoport; és  
 R jelentése fenil-(1-3 szénatomos alkil)-csoport vagy



általános képletű csoport, amelyben

$R^{12}$  jelentése 1-12 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, fenilcsoport vagy



általános képletű csoport, amelyben

$R^{13}$  és  $R^{14}$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-12 szénatomos alkilcsoport, 2-12 szénatomos alkenilcsoport, 2-12 szénatomos alkinilcsoport, fenilcsoport, 1-12 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-6 szénatomos alkokicsoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, vagy  $R^{13}$  és  $R^{14}$  azzal nitrogénatommal együtt, amelyhez kötődik, morfolin-, piperidin- vagy pirrolidin-gyűrűt képez.

16. A 9. igénypont szerinti készítmény, **azzal jellemezve**, hogy

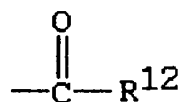
$R^1$  jelentése klóratom vagy brómatom;

$R^5$  jelentése trifluor-metil-, trifluor-metoxi-csoport, klór-, brómatom, metoxi-, metil- vagy etilcsoport;

$R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^4$ ,  $R^7$  és  $R^8$  jelentése hidrogénatom;

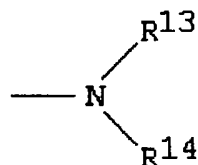
$R^6$  és  $R^9$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, klóratom vagy metilcsoport; és

R jelentése benzilcsoport vagy



általános képletű csoport, amelyben

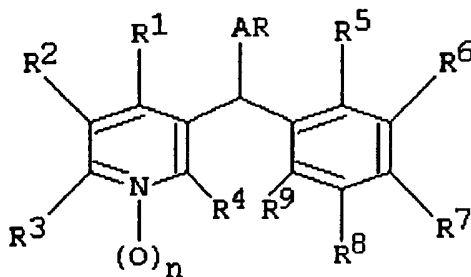
$R^{12}$  jelentése 1-16 szénatomos alkilcsoport vagy



általános képletű csoport, amelyben

$R^{13}$  és  $R^{14}$  jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, fenilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport vagy 1-6 szénatomos alkilcsoport, vagy  $R^{13}$  és  $R^{14}$  együtt morfolingyűrűt képez.

17. Eljárás nemkívánatos növényzet szabályozására, **azzal jellemezve**, hogy a kontrollálandó területre herbicid szempontból hatásos mennyiségben egy olyan (Ia) általános képletű vegyületet



(Ia)

vagy ennek egy mezőgazdaságilag elfogadható sóját juttatjuk ki, amelynek képletében

$R^1$  és  $R^5$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül halogénatom, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos alkoxicssoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport,  $-S(O)_m-R^{10}$  általános képletű csoport, cianocsoport, hidroxicssoport, tiocianátocsoport, nitrocsoport vagy  $-N(R^{11})(R^{12})$  általános képletű csoport;  $R^2$ ,  $R^3$  és  $R^4$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, nitrocsoport, ha-

logénatom, 1-6 szénatomos alkoxicsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport vagy  $-S(O)_m-R^{10}$  általános képletű csoport;

$R^6$ ,  $R^7$  és  $R^8$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, halogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport, nitrocsoport,  $-N(R^{11})(R^{12})$  általános képletű csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-6 szénatomos alkoxi-csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, halogén-(1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, cianocsoport,  $-C(X)-R^{10}$  vagy  $-S(O)_m-R^{10}$  általános képletű csoport;

$R^9$  jelentése hidrogénatom, halogénatom, 1-6 szénatomos alkil-csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-6 szénatomos alkoxicsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport,  $-S(O)_m-R^{10}$  általános képletű csoport, cianocsoport, hidroxicsoport, tiocianátocsoport, nitrocsoport vagy  $-N(R^{11})(R^{12})$  általános képletű csoport;

A jelentése oxigénatom vagy kénatom;

n értéke 0 vagy 1; és

R jelentése hidrogénatom, adott esetben egy vagy több halogénatommal vagy 1-6 szénatomos alkoxicsoporttal szubsztituált hidrokabilcsoport, vagy  $-C(X)-R^{10}$ ,  $-C(O)-C(O)-R^{10}$ ,  $-S(O)_2-R^{10}$  vagy  $-P(X)(R^{15})(R^{16})$  általános képletű csoport; ahol

X jelentése oxigénatom vagy kénatom;

$R^{10}$  jelentése adott esetben szubsztituált hidrokabilcsoport, adott esetben szubsztituált hidrokabil-oxi-csoport, adott esetben szubsztituált hidrokabil-tio-csoport vagy  $-N(R^{11})(R^{12})$  általános képletű csoport;

$R^{11}$  és  $R^{12}$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, adott esetben szubsztituált hidrokabilcsoport, adott esetben szubsztituált hidrokabil-oxi-csoport, piridilcsoport, furil-

csoport, tienilcsoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-  
-karbonil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, hidro-  
xi-karbonil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport vagy  
-N(R<sup>13</sup>)(R<sup>14</sup>) általános képletű csoport; vagy  
R<sup>11</sup> és R<sup>12</sup> azzal a nitrogénatommal együtt, amelyhez  
kötődnek, aziridin-, piperazin-, morfolin-, tio-  
morfolin-, tiomorfolin-szulfinil-, tiomorfolin-  
-szulfonil-, hexametilénimin-, piperidin- vagy  
pirrolidingyűrűt képeznek, amelyek mindegyike  
adott esetben 1-6 szénatomos alkilcsoporttal  
szubsztituált lehet;  
R<sup>13</sup> és R<sup>14</sup> mindegyikének jelentése egymástól függet-  
lenül hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport  
vagy fenilcsoport;  
R<sup>15</sup> és R<sup>16</sup> mindegyikének jelentése egymástól függet-  
lenül 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénato-  
mos alkil-tio-csoport vagy 1-6 szénatomos al-  
koxicssoport; és  
m értéke 0, 1 vagy 2.

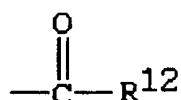
18. A 17. igénypont szerinti eljárás, **azzal jelle-  
mezve**, hogy R<sup>1</sup> jelentése halogénatom.

19. A 18. igénypont szerinti eljárás, **azzal jelle-  
mezve**, hogy R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> és R<sup>4</sup> jelentése hidrogénatom.

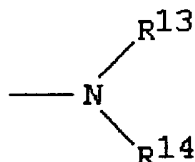
20. A 17. igénypont szerinti eljárás, **azzal jelle-  
mezve**, hogy R<sup>5</sup> jelentése halogénatom, 1-6 szénatomos alkil-  
csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-6 szénatomos  
halogén-alkoxi-csoport, 1-6 szénatomos alkoxicssoport, nitrocso-  
port vagy (1-3 szénatomos alkil)-S(O)<sub>m</sub>- általános képletű cso-  
port, amelyben m értéke 0, 1 vagy 2.

21. A 20. igénypont szerinti eljárás, **azzal jelle-  
mezve**, hogy R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> és R<sup>9</sup> mindegyikének jelentése egymás-  
tól függetlenül hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, ha-  
logénatom vagy 1-6 szénatomos alkoxicssoport.

22. A 17. igénypont szerinti eljárás, **azzal jelle-  
mezve**, hogy R jelentése fenil-(1-3 szénatomos alkil)-csoport  
vagy



általános képletű csoport, amelyben  $R^{12}$  jelentése 1-12 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, fenilcsoport vagy



általános képletű csoport, amelyben  $R^{13}$  és  $R^{14}$  jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-12 szénatomos alkilcsoport, 2-12 szénatomos alkenilcsoport, 2-12 szénatomos alkinilcsoport, fenilcsoport, 1-12 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-6 szénatomos alkoxics csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, vagy  $R^{13}$  és  $R^{14}$  azzal nitrogénatommal együtt, amelyhez kötődik, morfolin-, piperidin- vagy pirrolidingyűrűt képez.

23. A 17. igénypont szerinti eljárás, **azzal jellemezve**, hogy

$R^1$  jelentése halogénatom;

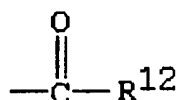
$R^2$ ,  $R^3$  és  $R^4$  jelentése hidrogénatom;

$R^5$  jelentése halogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-6 szénatomos alkoxics csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, nitrocsoport vagy  $-S(O)_m-$ (1-3 szénatomos alkil)- általános képletű csoport, amelyben

$m$  értéke 0, 1 vagy 2;

$R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$  és  $R^9$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, halogénatom vagy 1-6 szénatomos alkoxics csoport; és

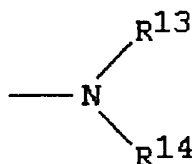
$R$  jelentése fenil-(1-3 szénatomos alkil)-csoport vagy



általános képletű csoport, amelyben

$R^{12}$  jelentése 1-12 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, fenilcsoport

vagy

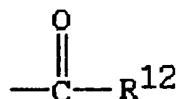


általános képletű csoport, amelyben

$R^{13}$  és  $R^{14}$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-12 szénatomos alkilcsoport, 2-12 szénatomos alkenilcsoport, 2-12 szénatomos alkinilcsoport, fenilcsoport, 1-12 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-6 szénatomos alkoxicssoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, vagy  $R^{13}$  és  $R^{14}$  azzal nitrogénatommal együtt, amelyhez kötődik, morfolin-, piperidin- vagy pirrolidinyűrűt képez.

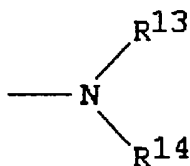
24. A 17. igénypont szerinti eljárás, **azzal jellemezve**, hogy

- $R^1$  jelentése klóratom vagy brómatom;
- $R^5$  jelentése trifluor-metil-, trifluor-metoxi-csoport, klór-, brómatom, metoxi-, metil- vagy etilcsoport;
- $R^2, R^3, R^4, R^7$  és  $R^8$  jelentése hidrogénatom;
- $R^6$  és  $R^9$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogén-, klóratom vagy metilcsoport; és
- R jelentése benzilcsoport vagy



általános képletű csoport, amelyben

$R^{12}$  jelentése 1-16 szénatomos alkilcsoport vagy



általános képletű csoport, amelyben

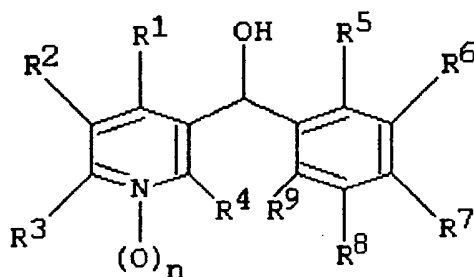
$R^{13}$  és  $R^{14}$  jelentése egymástól függetlenül

hidrogénatom, fenilcsoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport vagy 1-6 szénatomos alkilcsoport, vagy  $R^{13}$  és  $R^{14}$  együtt morfolingyűrűt képez.

25. A 17. igénypont szerinti eljárás, **azzal jellemezve**, hogy a vegyületet kikelés előtt alkalmazzuk.

26. A 17. igénypont szerinti eljárás, **azzal jellemezve**, hogy a vegyületeet kikelés után alkalmazzuk.

27. Egy (II) általános képletű vegyület



(II)

– amelynek képletében

$R^1$  és  $R^5$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül halogénatom, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos alkoxics csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport,  $-S(O)_m-R^{10}$  általános képletű csoport, cianocsoport, hidroxics csoport, tiocianátocsoport, nitrocsoport vagy  $-N(R^{11})(R^{12})$  általános képletű csoport;

$R^2$ ,  $R^3$  és  $R^4$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, nitrocsoport, halogénatom, 1-6 szénatomos alkoxics csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport vagy  $-S(O)_m-R^{10}$  általános képletű csoport;

$R^6$ ,  $R^7$  és  $R^8$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, halogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport, 2-6 szénatomos alkenilcsoport, 2-6 szénatomos alkinilcsoport, nitrocsoport,  $-N(R^{11})(R^{12})$  általános képletű csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-6 szénatomos alkoxi-csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, halogén-



-(1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, cianocsoport,  $-C(X)-R^{10}$  vagy  $-S(O)_m-R^{10}$  általános képletű csoport;

$R^9$  jelentése hidrogénatom, halogénatom, 1-6 szénatomos alkil-csoport, 1-6 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1-6 szénatomos alkoxicssoport, 1-6 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-(1-6 szénatomos alkil)-csoport,  $-S(O)_m-R^{10}$  általános képletű csoport, cianocsoport, hidroxicssoport, tiocianátocsoport, nitrocsoport vagy  $-N(R^{11})(R^{12})$  általános képletű csoport;

$n$  értéke 0 vagy 1;

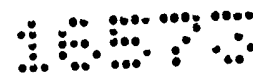
$R^{10}$  jelentése adott esetben szubsztituált hidrokARBILcsoport, adott esetben szubsztituált hidrokARBIL-oxi-csoport, adott esetben szubsztituált hidrokARBIL-tio-csoport vagy  $-N(R^{11})(R^{12})$  általános képletű csoport;

$R^{11}$  és  $R^{12}$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, adott esetben szubsztituált hidrokARBILcsoport, adott esetben szubsztituált hidrokARBIL-oxi-csoport, piridilcsoport, furilcsoport, tienilcsoport, (1-6 szénatomos alkoxi)-karbonil-(1-6 szénatomos alkil)-csoport, hidroxikARBONIL-(1-6 szénatomos alkil)-csoport vagy  $-N(R^{13})(R^{14})$  általános képletű csoport; vagy

$R^{11}$  és  $R^{12}$  azzal a nitrogénatommal együtt, amelyhez kötődnek, aziridin-, piperazin-, morfolin-, tiomorfolin-, tiomorfolin-szulfinil-, tiomorfolin-szulfonil-, hexametilénimin-, piperidin- vagy pirrolidingyűrűt képeznek, amelyek mindegyike adott esetben 1-6 szénatomos alkilcsoporttal szubsztituált lehet;

$R^{13}$  és  $R^{14}$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, 1-6 szénatomos alkilcsoport vagy fenilcsoport;

$R^{15}$  és  $R^{16}$  mindegyikének jelentése egymástól függetlenül 1-6 szénatomos alkilcsoport, 1-6 szénatomos alkil-tio-csoport vagy 1-6 szénatomos alko-



•  
•  
•

xicsoport; és

m értéke 0, 1 vagy 2;

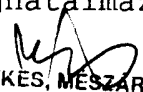
azzal a megkötéssel, hogy amennyiben  $R^5$  jelentése hidrogénatom, klóratom, fluoratom vagy metoxicsoport; valamint  $R^2$ ,  $R^3$ ,  $R^6$ ,  $R^7$ ,  $R^8$  és  $R^9$  jelentése hidrogénatom; akkor  $R^1$  jelentése klóratomtól vagy fluoratomtól eltérő – és mezőgazdaságilag elfogadható sói.

rajz nélkül

1996. 06. 05

JK.

A meghatalmazott:

  
GÖDÖLLE, KÉKES, MÉSZÁROS & SZABÓ  
Szabadalmi és Védjegy Iroda  
1024 Budapest, Keleti Károly u. 13/b  
Mészáros Enikő  
szabadalmi ügyvivő