



(19) Országkód

HU



MAGYAR
KÖZTÁRSASÁG

MAGYAR
SZABADALMI
HIVATAL

SZABADALMI LEÍRÁS

(11) Lajstromszám:

215 281 B

(21) A bejelentés ügyszáma: P 95 01395
(22) A bejelentés napja: 1993. 10. 30.
(30) Elsőbbségi adatok:
P 42 38 175.4 1992. 11. 12. DE
(86) Nemzetközi bejelentési szám: PCT/EP 93/03038
(87) Nemzetközi közzétételi szám: WO 94/11358

(51) Int. Cl.⁶

C 07 D 251/16
C 07 D 239/47
A 01 N 47/36

(40) A közzététel napja: 1996. 01. 29.
(45) A megadás meghirdetésének a dátuma a Szabadalmi
Közlönyben: 1998. 11. 30.

(72) Feltalálók:

dr. Gerber, Matthias, Limburgerhof (DE)
dr. Mayer, Horst, Ludwigshafen/Rhein (DE)
Recht, Gerhard, Weinheim (DE)
dr. Walter, Helmut, Obrigheim (DE)
dr. Westphalen, Karl-Otto, Speyer (DE)

(73) Szabadalmaz:

BASF AG, Ludwigshafen/Rhein (DE)

(74) Képvisező:

S. B. G. & K. Budapesti Nemzetközi Szabadalmi
Iroda, Budapest

(54) **Szulfonil-karbamidokat tartalmazó herbicid készítmények, eljárás
a szulfonil-karbamidok előállítására és gyomirtási eljárás**

KIVONAT

A találmány az (I) általános képletű szulfonil-karbamidokat és mezőgazdaságilag alkalmazható sóikat hatóanyagként tartalmazó herbicid készítményekre, az (I) általános képletű vegyületek és sóik előállítására szolgáló eljárásra, valamint a készítményekkel végzett gyomirtási eljárásra vonatkozik.

Az (I) általános képletben

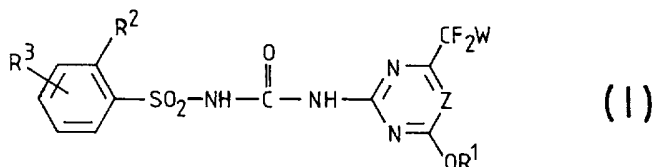
R¹ jelentése metilcsoport,

R² jelentése (1–3 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport, 1–5 fluoratomot hordozó 1–2 szénatomos alkil-csoport, metil-tio-, metil-szulfonil-, metil-szulfonil-oxi-, N,N-dimetil-szulfamoil-, trifluor-metoxi-, difluor-metoxi- vagy nitrocsoport,

R³ jelentése hirogénatom, metoxi- vagy metil-tio-csoport,

W jelentése hidrogén- vagy klóratom és

Z jelentése metincsoport vagy nitrogénatom.



A találmány az (I) általános képletű szulfonil-karbamidokat és mezőgazdaságilag alkalmazható sóikat hatóanyagként tartalmazó herbicid készítményekre, az (I) általános képletű vegyületek és sóik előállítására szolgáló eljárásra, valamint a készítményekkel végzett gyomirtási eljárásra vonatkozik.

Az (I) általános képletben

R¹ jelentése metilcsoport,

R² jelentése (1–3 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport, 1–5 fluoratomot hordozó 1–2 szénatomos alkil-csoport, metil-tio-, metil-szulfonil-, metil-szulfonil-oxi-, N,N-dimetil-szulfamoil-, trifluor-metoxi-, difluor-metoxi- vagy nitrocsoport,

R³ jelentése hirogénatom, metoxi- vagy metil-tio-csoport,

W jelentése hidrogén- vagy klóratom és

Z jelentése metincsoport vagy nitrogénatom.

Hasonló szerkezetű vegyületeként az US 4 127 405 számú szabadalmi leírásból megismerhető az (A) képletű triazinvegyület, valamint az US 4 169 719 számú szabadalmi leírásból a (B) képletű pirimidin-származék.

Az EP-A-0 044 808 számú leírás a (D) általános képletű szulfonil-karbamidokat ismerteti; a vegyületek az aromás részben szubsztituáltak és Z metincsoport vagy nitrogénatom.

Az EP-A-0 048 143 számú leírásban két (E) általános képletű N-metilezett szulfonil-karbamidot ismertettek közelebbi jellemzés nélkül. A képletben Z metincsoport (=CH-) vagy nitrogénatom.

Az EP-A 388 873 számú európai szabadalmi leírás az (F) általános képletű benzoészterekre vonatkozik. A képletben R metil- vagy etil-csoport.

A 4 310 346 számú amerikai egyesült államokbeli szabadalmi leírás a (G) általános képletű szulfonamidokat ismertette, amelyek képletében Z metincsoport (=CH-) vagy nitrogénatom.

A DE-OS 40 38 430 számú nyilvánosságra hozott német szabadalmi leírás (WO 92/09608) a (H) általános képletű trifluor-metil-csoporttal szubsztituált triazinokat ismertette. A képletben R jelentése halogénatom, trifluor-metil-csoport, alkil-szulfonil-csoport vagy metoxi-etoxi-csoport [$-O(CH_2)_2-OCH_3$].

Az EP-A 120 814 számú európai szabadalmi leírás fizikai jellemzők közlése nélkül ismertette a (J) képletű vegyületet.

A találmány feladata olyan szulfonil-karbamidokat szintetizálni, amelyek ennek a gyomirtó osztálynak ismert képviselőivel ellentétben jobb tulajdonságokkal rendelkeznek, és főképpen nagy szelektivitásukkal tűnnek ki érzékeny kultúrákban.

Ennek a feladatnak megfelelően szintetizáltuk a bevezetésben említett (I) általános képletű szulfonil-karbamidokat.

Az (I) általános képletben az (1–3 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport jelentése metoxi-karbonil-, etoxi-karbonil-, propoxi-karbonil- vagy izopropoxi-karbonil-csoport; és az 1–2 szénatomos alkilcsoport jelentése, amely 1–5 fluoratomot hordoz, metilcsoport, szubsztituálva 1–3 fluoratommal, vagy etilcsoport

szubsztituálva 1–5 fluoratommal, például trifluor-metil-, difluor-metil-, 2,2,2-trifluor-etil- vagy 1,1,2,2-tetrafluor-metil-csoport.

Kiváltképpen előnyösek azok az (I) általános képletű szulfonil-karbamidok, amelyekben R² metoxi-karbonil-, trifluor-metil-, N,N-dimetil-szulfamoil-, trifluor-metoxi-, difluor-metoxi- vagy metil-szulfonil-csoport; továbbá a triazinszubsztituenst tartalmazó szulfonil-karbamidok (Z = nitrogénatom). Különleges jelentősége van továbbá azoknak az (I) általános képletű vegyületeknek, amelyekben difluor-metil-szubsztituáció van (W = H).

A találmány szerinti (I) általános képletű szulfonil-karbamidok előállítására egy (II) általános képletű szulfonil-izocianátot önmagában ismert módon (EP-A-162 723) reagáltatunk egy (III) általános képletű 2-amino-1,3,5-triazin-, illetve 2-amino-pirimidin-származék körülbelül sztöchiometrikus mennyiségével 9–120 °C, előnyösen 10–100 °C hőmérsékleten. A reakció normál vagy magasabb nyomáson (legfeljebb 5,0 MPa), előnyösen 0,1–0,5 MPa nyomáson, folyamatosan végezhető.

A reakciókhoz célszerűen a mindenkor reakciókörmények között inert oldó- és hígítószerkeket használunk. Oldószerekként számításba vehetők például a halogénezett szénhidrogének, elsősorban a klórozott szénhidrogének, például a tetraklór-etilén, 1,1,2,2-tetraklór-etán, diklór-propán, metilén-diklorid, diklór-bután, kloroform, klór-naftalin, diklór-naftalin, széntetraklorid, 1,1,1- vagy 1,1,2-trifluor-etán, triklór-etilén, pentaklór-etán, o-, m-, p-difluor-benzol, 1,2-diklór-etán, 1,1-diklór-etán, 1,2-cisz-diklór-etilén, klór-benzol, fluor-benzol, bróm-benzol, jód-benzol, o-, m-, p-diklór-benzol, o-, m-, p-dibrom-benzol, o-, m-, p-klór-toluol, 1,2,4-trifluor-benzol; éterek, például etil-propil-éter, metil-terc-butil-éter, butil-etil-éter, dibutil-éter, diizobutil-éter, diizoamil-éter, diizopropil-éter, anizol, fenetol, ciklohexil-metil-éter, dietil-éter, etilén-glikol-dimetil-éter, tetrahydrofurán, dioxán, tioanizol, β, β'-diklór-dietil-éter; nitrocsoportot tartalmazó szénhidrogének, így nitro-metán, nitro-etán, nitro-benzol, o-, m-, p-klór-nitro-benzol, o-nitro-toluol; nitrilek, így acetónitril, butíronitril, izobutíronitril, benzonitril, m-klór-benzonitril; alifás vagy cikloalifás szénhidrogének, például heptán, pinán, nonán, o-, m-, p-cimol, 70–190 °C forráspont-tartományú benzínfrakciók, ciklohexán, metil-ciklohexán, dekalin, petroléter, hexán, ligroin, 2,2,4-trimetil-pentán, 2,2,3-trimetil-pentán, 2,3,3-trimetil-pentán, oktán; észterek, például etil-acetát, acetocetsavas-etilészter, izobutil-acetát; amidok, például formamid, metil-formamid, N,N-dimetil-formamid; ketonok, például acetón, metil-etil-keton; és a megfelelő keverékek. Az oldószert a (II) általános képletű kiindulási anyagra célszerűen 100–2000 tömeg%, előnyösen 200–700 tömeg% mennyiségben alkalmazzuk.

A reakcióhoz szükséges (II) általános képletű vegyületet általában körülbelül ekvimolekuláris mennyiségben [a mindenkor (III) általános képletű kiindulási vegyületre számítva, például 0–20% feleslegben vagy

ennyivel kisebb mennyiségben] alkalmazzuk. A (III) általános képletű kiindulási vegyületet a fent említett hígítószerke egyikében előkészítjük, és azután adjuk hozzá a (II) általános képletű kiindulási anyagot.

Az új vegyületek előállítására szolgáló eljárást azonban célszerűen úgy végezzük, hogy a (II) általános képletű kiindulási vegyületet adott esetben egy fent említett hígítószerben előkészítjük, majd hozzáadjuk a (III) általános képletű kiindulási vegyületet.

A reakció teljessé tételére a komponensek elegyítése után azokat még 20 perc–24 óra időtartamig 0–120 °C-on, előnyösen 10–100 °C-on keverjük.

A reakciót gyorsító szerként használhatunk előnyösen tercier-amint, például piridint, α,β,γ -pikolint, 2,4-, 2,6-lutidint, 2,4,6-kollidint, p-(dimetil-amino)-piridint, trimetil-amint, trietil-amint, tripropil-amint, 1,4-diaza-biciklo[2.2.2]oktánt (DABCO) vagy 1,8-diaza-biciklo[5.4.0]undec-7-ént, a (II) általános képletű kiindulási vegyületre 0,01–1 mol mennyiségben alkalmazva.

Az (I) általános képletű végterméket a reakciókeverékből szokásos módon izoláljuk, például az oldószert ledesztilláljuk vagy a terméket közvetlenül leszívátjuk. A visszamaradó anyagot vízzel, illetve hígított sósavval moshatjuk a bázisos szennyezések eltávolítása céljából. Úgy is eljárhatunk, hogy a maradékot egy vízzel nem elegyedő oldószerben feloldjuk, majd a fenti módon mossuk. Az előállítani kívánt végtermékek így tiszta formában képződnek, adott esetben a végtermékeket tisztíthatjuk átrkistályosítással, egy szerves oldószerben végzett keveréssel, amely a szennyezéseket felveszi vagy kromatográfiásan.

A fenti reakciót előnyösen acetonitrilben, metil-(terc-butil)-éterben, toluolban vagy metilén-dikloridban végezzük, 0–100 mólekivivalens, előnyösen 0–50 mólekivivalens tercier-amin, így 1,4-diaza-biciklo[2.2.2]oktán vagy trietil-amin jelenlétében.

A kiindulási anyagokként szükséges (II) általános képletű szulfonil-izocianátok önmagában ismert módon előállíthatók a megfelelő szulfonamidokból, foszfénes kezeléssel [Houben-Weyl 11/2, 1106 (1985); és a 4379 769 számú amerikai egyesült államokbeli szabadalmi leírás] vagy szulfonamidokat klór-szulfonil-izocianáttal reagáltatva [DE-A 31 32 944 számú német szabadalmi leírás].

A 2-amino-4-(klór-difluor-metil)-6-metoxi-1,3,5-triazin és a 2-amino-4-(difluor-metil)-6-metoxi-1,3,5-triazin az előállítási példa szerint szintetizálhatók. Hasonlóképpen állíthatók elő a megfelelő 6-etoxi-szubsztituált 1,3,5-triazinok is.

A (III) általános képletű megfelelő pirimidinek az [A] reakcióvázlat szerint állíthatók elő.

Hasonló reakciók a szakirodalomból jól ismertek [D. J. Brown in „The Chemistry of Heterocyclic Compounds”, Interscience Publishers, New York, London, Bd. 14.; Heterocycl. Chem. 20, 219 (1983)].

Az (I) általános képletű vegyületek lehetnek mezőgazdaságilag használható sóik alakjában, amelyeknél a só fajtája általában nem jelentős. Általában az olyan bázisokkal képezett sók alkalmazhatók, amelyek az (I)

általános képletű vegyületek gyomirtó hatását nem befolyásolják hátrányosan.

Az (I) általános képletű vegyületek sói önmagában ismert módon előállíthatók [EP-A-304 282 számú európai és 4 599 412 számú amerikai egyesült államokbeli szabadalmi leírás]. Ezek előállíthatók a megfelelő (I) általános képletű szulfonil-karbamidok protonmentesítésével, vízben vagy egy inert szerves oldószerben, –80 °C és 120 °C, előnyösen 0 °C–60° hőmérsékleten, bázis jelenlétében.

A megfelelő bázisok például az alkálifém- vagy alkáliföldfém-hidroxidok, -hidridek, -oxidok vagy -alkoholátok, így a nátrium-, kálium-, lítium-hidroxid, nátrium-metanolát, -etanolát és terc-butanolát, nátrium- és kalcium-hidrid és kalcium-oxid. Használhatók továbbá az átmenetifémek sói, előnyösen a mangán-, réz-, cink- és vassók, valamint az ammóniumsók, amelyek egy-három 1–4 szénatomos alkil-, hidroxi-(1–4 szénatomos alkil)-szubsztituenst és/vagy egy fenil- vagy benzil-szubsztituenst hordozhatnak, előnyösek a diizopropil-ammónium-, tetrametil-ammónium- tetrabutil-ammónium-, trimetil-benzil-ammónium- és trimetil-(2-hidroxi-etil)-ammóniumsók; a foszfóniumsók; szulfóniumsók, és a szulfoxóniumsók, előnyösen a tri(1–4 szénatomos alkil)-szulfoxóniumsók mint bázisos sók.

Oldószerként a víz mellett számításba vehetők az alkoholok is, így a metanol, etanol és terc-butanol; éterek, így a tetrahidrofuran és dioxán; acetonitril, N,N-dimetil-formamid; ketonok, így az acetone és a metil-etil-ke-ton; és a halogénezett szénhidrogének.

A protonmentesítést végezhetjük normál nyomáson vagy legfeljebb 5,0 MPa nyomáson, előnyösen normál nyomáson vagy legfeljebb 0,5 MPa túlnyomáson.

Az (I) általános képletű vegyületek, illetve az ezeket tartalmazó gyomirtó szerek, valamint a vegyületek alkálifémekkel és alkáliföldfémekkel képezett, a környezetre elviselhető sói különböző kultúrákban, így búza-, rizs és kukoricakultúrákban jól használhatók gyomnövények irtására a kultúrnövények károsítása nélkül, ez a hatás mindenekelőtt kis felhasználási mennyiségeknél lép fel. A vegyületek használhatók például közvetlenül permetezhető oldatok, porok, szuszpenziók, sőt nagy százaléktartalmú vizes, olajos vagy más szuszpenziók vagy diszperziók, emulziók, olajdiszperziók, paszták, porozószerke, szórószerke vagy granulátumok formájában, permetezéssel, ködképzéssel, porozással, kiszórással vagy kiöntéssel. A felhasználási formák a felhasználás céljaihoz igazodnak, ezeknek mindenkor biztosítani kell a találmány szerinti hatóanyagok lehető legfinomabb eloszlását.

Az (I) általános képletű vegyületek általában alkalmasak közvetlenül permetezhető oldatok, emulziók, paszták vagy olajdiszperziók előállításához. Inert adalékanyagokként számításba vehetők többek között a közepes-magas forráspontú ásványolaj-frakciók, így a ke-rozin vagy a dízelolaj, továbbá szénkátrányolajok, valamint növényi vagy állati eredetű olajok, alifás, ciklusos és aromás szénhidrogének, például toluol, xilol, paraffin-tetrahidronaftalin, alkilezett naftalinok vagy ezek származékai, metanol, etanol, propanol, butanol,

ciklohexanol, ciklohexanon, klór-benzol, izoforon vagy erősen poláris oldószerek, így az N,N-dimetil-formamid, dimetil-szulfoxid, N-metil-pirrolidon vagy a víz.

Vizes felhasználási formák előállíthatók emulzió-koncentrátumokból, diszperziókból, pasztákból, nedvesíthető porokból vagy vízben diszpergálható granulátumokból, víz hozzáadásával. Emulziók, paszták vagy olajdiszperziók előállításához a szubsztátumok mint olyanok vagy egy olajban vagy oldószerben oldva, nedvesítő, tapadást elősegítő, diszpergáló- vagy emulgeálószerrel vízben homogenizálhatók. A hatóanyagokból, nedvesítő, tapadást elősegítő, diszpergáló- vagy emulgeálószerrel és adott esetben oldószerből vagy olajból álló koncentrátumok is előállíthatók, amelyek vízzel hígíthatók.

Felületaktív anyagokként számításba vehetők az aromás szulfonsavak, például lignin-, fenol-, naftalin- és dibutil-naftalinszulfonsavak, valamint zsírsavak, alkil- és alkil-aril-szulfonátok, alkil-, lauril-éter- és zsíralkohol-szulfátok alkáli-, földalkáli vagy ammóniumsói, valamint a szulfatált hexa-, hepta- és oktadekanolok és zsíralkohol-glikol-éterek sói, szulfonált naftalinnak és származékainak formaldehiddel képezett kondenzációs termékei, naftalin, illetve naftalinszulfonsavak kondenzációs termékei fenollal és formaldehiddel, poli(oxi-etilén)-oktil-fenol-éter, etoxilezett izooktil-, oktil- vagy nonil-fenol, alkil-fenol- és tributil-fenol-poliglikol-éterek, alkil-aril-poliéter-alkoholok, izotridecyl-alkohol, zsíralkohol-etilén-oxid kondenzátumok, etoxilezett ricinusolaj, poli(oxi-etilén)-alkil-éter vagy poli(oxi-propilén), lauril-alkohol-poliglikol-éter-acetát, szorbit-észter, lignin-szulfid-szennylúgok vagy metil-cellulóz.

A porkészítményeket, szóró és porozószerkeket úgy állítjuk elő, hogy a hatóanyagot egy szilárd hordozóanyaggal keverjük vagy azzal együtt megőröljük.

A granulátumokat, például bevonattal ellátott, impregnált vagy homogén granulátumokat úgy állítjuk elő, hogy a hatóanyagot szilárd hordozóanyagon megkötjük. Szilárd hordozóanyagok az ásványi földek, így a kovásvégél, kovásvak, szilikátok, talkum, kaolin, mészkő, mész, kréta, bólusz, lösz, agyag, dolomit, diatómaföld, kalcium- és magnézium-szulfát, magnézium-oxid, őrlött műanyagok, műtrágyák, így ammónium-szulfát, ammónium-foszfát, ammónium-nitrát, karbamidok és növényi termékek, így gabonaliszt, fahéj- és dióhéjliszt, cellulózpor vagy más szilárd hordozóanyagok.

A készítmények általában 0,1–95 tömeg%, előnyösen 0,5–90 tömeg% hatóanyagot tartalmaznak. Ehhez a hatóanyagokat 90–100%, előnyösen 95–100% tisztaságban (MMR-spektrum szerint) alkalmazzuk.

Példák a készítményekre

- I. 20 tömegrész 1.01 számú vegyületet feloldunk egy olyan keverékben, amely 80 tömegrész alkilezett benzolból, 10 tömegrész 8–10 mol etilén-oxid/1 mol olajsav-N-monetanol-amid addíciós termékéből és 5 tömegrész 40 mol etilén-oxid/1 mol ricinusolaj addíciós termékéből áll. Az oldatot 100 000 tömegrész vízbe öntjük és abban finoman

eloszlatjuk, így vizes diszperziót kapunk, amely 0,02 tömeg% hatóanyagot tartalmaz.

- II. 20 tömegrész 1.01 számú vegyületet feloldunk egy olyan keverékben, amely 40 tömegrész ciklohexanonból, 30 tömegrész izobutanolból, 20 tömegrész 7 mol etilén-oxid/1 mol izooktil-fenol addíciós termékéből és 10 tömegrész 40 mol etilén-oxid/1 mol ricinusolaj addíciós termékéből áll. Az oldatot 100 000 tömegrész vízbe öntve és abban finoman eloszlatva vizes diszperziót kapunk, amely 0,02 tömeg% hatóanyagot tartalmaz.

- III. 20 tömegrész 1.01 számú hatóanyagot feloldunk egy olyan keverékben, amely 25 tömegrész ciklohexanonból, 65 tömegrész 210–280 °C forráspontú ásványolaj frakcióból és 10 tömegrész 40 mol etilén-oxid/1 mol ricinusolaj addíciós termékéből áll. Az oldatot 100 000 tömegrész vízbe öntve és abban finoman eloszlatva vizes diszperziót kapunk, amely 0,02 tömeg% hatóanyagot tartalmaz.

- IV. 20 tömegrész 1.01 számú hatóanyagot 3 tömegrész diizobutil-naftalin- α -szulfonsav-nátriumsóval, 17 tömegrész ligninszulfonsav-nátriumsóval (szulfid-szennylúgból) és 60 tömegrész poralakú kovásvégéllel összekeverünk, és a keveréket kalapácsmalomban megőröljük. A keveréket 20 000 tömegrész vízben finoman eloszlatjuk, így permetlét kapunk, amely 0,1 tömeg% hatóanyagot tartalmaz.

- V. 3 tömegrész 1.01 számú hatóanyagot összekeverünk 97 tömegrész finomszemcsés kaolinnal. Így porozószerkezt kapunk, amely 3 tömeg% hatóanyagot tartalmaz.

- VI. 20 tömegrész 1.01 számú hatóanyagot 2 tömegrész dodecyl-benzolszulfonsav-kalciumsóval, 8 tömegrész zsíralkohol-poliglikol-éterrel, 2 tömegrész fenol-karbamid-formaldehid-kondenzátum-nátriumsóval és 68 tömegrész paraffinos ásványolajjal bensőségesen elkeverünk. Ily módon stabil olajos diszperziót kapunk.

A gyomirtó szerek, illetve a hatóanyagok alkalmazása történhet a növény kikelése előtt vagy kikelése után. Ha a hatóanyagok bizonyos kultúrnövényekre kevésbé elviselhetők, akkor olyan kihordási módszereket alkalmazhatunk, amelyeknél a gyomirtó szereket a permetezőkészülék segítségével úgy permetezzük, hogy azok lehetőleg ne ériék az érzékeny kultúrnövények leveleit, hanem a hatóanyagok a levelek alatt növe nemkívánatos növényekre vagy a takaratlan talajfelületre jussanak (post-directed, lay-by).

A hatóanyagok felhasználási mennyiségei az irtás céljától, az évszaktól, a célnövénytől és a növekedési stádiumtól függően 0,001–1,0, előnyösen 0,01–0,5 kg hatóanyag/hektár.

Az alkalmazási módszerek sokféleségét tekintve az (I) általános képletű ciklohexanon-oximéterek, illetve az ezeket tartalmazó szerek még számos más kultúrnövényben is használható nemkívánatos növények ellen. Ilyen kultúrák például a következők:

Latin név	Magyar név
Allium cepa	vöröshagyma
Ananas comosus	ananasz
Arachis hypogaea	földimogyoró

Asparagus officinalis	spárga
Beta vulgaris spp. altissima	cukorrépa
Beta vulgaris spp. rapa	takarmányrépa
Brassica napus var. napus	repce
Brassica napus var. napobrassica	karórépa
Brassica rapa var. silvestris	réparepce
Cemellia sinensis	teacserje
Carthamus tinctorius	kerti pórsáfrány
Carya illinoensis	hikoridió
Citrus limon	citrom
Citrus sinensis	narancs
Coffea arabica	
(Coffea canephora, Coffea liberica)	kávécsereje
Cucumis sativus	uborka
Cynodon dactylon	csillagpázsit
Daucus carota	sárgarépa
Elaeis Guineensis	olajpálma
Fragaria vesca	szamóca
Glycine max.	szójabab
Gossypium hirsutum	
(Gossypium arboreum, Gossypium herbaceum, Gossypium vitifolium)	gyapotcsereje
Helianthus annuus	napraforgó
Hevea brasiliensis	kaucsukfa
Hordeum vulgare	árpa
Humulus lupulus	komló
Ipomoea batatas	édesburgonya
Juglans regia	diófa
Lens culinaris	lencse
Linum usitatissimum	rostlen
Lycopersicon lycopersicum	paradicsom
Malus spp.	alma
Manihot esculenta	manióka
Medicago sativa	lucerna
Musa spp.	banán
Nicotiana tabacum (N. rustica)	dohány
Olea europaea	olajfa
Oryza sativa	rizs
Phaseolus lunatus	holdbab
Phaseolus vulgaris	bokorbab
Picea abies	vörös lucfenyő
Pinus spp.	erdei fenyő
Pisum sativum	vetőborsó
Prunus avium	cseresznye
Prunus persica	őszibarack
Pyrus communis	körte
Ribes sylvestre	piros fibiszke
Ricinus communis	ricinus
Saccharum officinarum	cukornád
Secale cereale	rozs
Solanum tuberosum	burgonya
Sorghum bicolor (S. vulgare)	seprőcirok
Theobroma cacao	kakaócsereje
Trifolium pratense	vöröshere
Triticum aestivum	búza
Triticum durum	durumbúza
Vicia faba	lóbab

Vitis vinifera	szőlő
Zea mays	kukorica

- A hatásspektrum kiszélesítésére és hatásnövekedés elérése céljából az (I) általános képletű szubsztituált szulfonil-karbamidok más gyomirtó vagy növekedés-szabályozó hatóanyagcsoportok számos képviselőjével keverhetők és együtt kihordhatók. Ilyen bekeverhető partnerek például a diazinok, (4H)-3,1-benzoxazin-származékok, benzotiadiazinonok, 2,6-dinitro-anilinok, N-fenil-karbamátok, tiol-karbamátok, halogén-karbonsavak, triazinok, amidok, karbamidok, difenil-éterek, triazinonok, uracilok, benzofurán-származékok, ciklohexán-1,3-dion-származékok, kinolinkarbonsav-származékok, fenil-oxi- illetve heteroaril-oxi-fenil-propionsavak, valamint ezek sói, észterei, amidjai és más származékai.

- Hasznos lehet továbbá az (I) általános képletű vegyületeket magukban vagy más gyomirtókkal kombinálva, még más növényvédőszerrel keverve együtt kihordani, például olyan szerekkel, amelyekkel kártevők vagy a növényekre kórokozó gombák, illetve baktériumok irthatók. Érdeklődésre tarthat számot továbbá a bekeverhetőség ásványi sóoldatokkal, amelyek a táp- és nyomelem-hiányok megszüntetésére alkalmazhatók.
- A növényekre nem toxikus olajok és olajos koncentrátumok is bekeverhetők.

Az alábbi példák az (I) általános képletű vegyületek szintézisét szemléltetik.

- 30 *A kiindulási anyagok előállítása*
2-Amino-4-(klór-difluor-metil)-6-metoxi-1,3,5-triazin
a) 2-Amino-4-(klór-difluor-metil)-6-tio-metil-1,3,5-triazin
35 18,5 g (85 mmol) N-amidino-tiokarbamid (adduktum N-metil-2-pirrolidonnal) 90 ml metanollal készített szuszpenziójához 10,7 g (85 mmol) dimetilszulfátot adunk, és az elegyet 3 órán át 30–40 °C-on keverjük. Ehhez az oldathoz 0 °C-on 25 g (0,17 mol) klór-difluor-ecetsav-metil-észtert, majd 30,6 g 30 tömeg%-os metanolos nátrium-metanolát-oldatot (0,17 mol) csepegtetünk. A hűtőfűdőt eltávolítjuk, és az elegyet 16 órán át 25 °C-on keverjük. Az oldószert 40 °C-on eltávolítjuk, a maradékot 400 ml vízzel elkeverjük, a terméket leszívátjuk és vízsugárvákuumban 40 °C-on szárítjuk. A 118 °C olvadáspontú nyerste-terméket tisztítás nélkül alkalmazzuk a b) művelethez.
¹H-MMR spektrum (250 MHz, CDCl₃, TMS belső standard/δ/ppm): 6,74 széles (1H); 5,94 széles (1H), 2,54 s (3H).
50 b) 2-Amino-4-(klór-difluor-metil)-6-metoxi-1,3,5-triazin
19 g (84 mmol) a) művelet szerinti nyerste-termék 100 ml metanollal készített oldatához 0 °C-on 16,2 g 30 tömeg%-os metanolos nátrium-metanolát-oldatot (90 mmol) csepegtetünk. A hűtést eltávolítjuk, és az elegyet 16 órán át 25 °C-on keverjük. A pH-értékét 4 n sósav hozzáadásával 6-ra beállítjuk, az oldószert 40 °C-on vízsugárvákuumban eltávolítjuk, és a maradékot 400 ml vízzel keverjük. A terméket leszívátjuk,

vízzel mossuk és vízsugárvákuumban 40 °C-on szárítjuk.

Így 13,9 g (79%) cím szerinti vegyületet kapunk, olvadáspontja 130 °C.

¹H-MMR spektrum (250 MHz, CDCl₃, TMS belső standard/δ/ppm): 6,78 széles (1H), 6,08 széles (1H), 4,03 s (3H).

2-Amino-4-(difluor-metil)-6-metoxi-1,3,5-triazin

a) 2-Amino-4-(difluor-metil)-6-(triklór-metil)-1,3,5-triazin

70,1 g (0,4 mol) difluor-ecetsavanhidrid 200 ml dietil-éterrel készített oldatához részletekben 40,7 g (0,2 mol) N-(triklór-aceetamidino)-guanidint adunk. A reakcióelegyet 3 órán át 20–25 °C-on keverjük. Az illó részeket 40 °C-on vízsugárvákuumban eltávolítjuk, a maradékot 400 ml víz és 200 ml metilén-diklorid között megosztjuk, és a metilén-dikloridos fázist 2 tömeg%-os nátrium-hidroxid-oldattal elővigyázatosan semlegesítjük. A metilén-dikloridos fázist elválasztjuk, vízmentes nátrium-szulfáton szárítjuk, és az oldószert vízsugárvákuumban 40 °C-on ledesztilláljuk. Így 39,6 g (0,15 mol, 75%) spektroszkópiásan tiszta nyers-terméket kapunk, amit tisztítás nélkül használunk a következő reakcióban [b] művelet].

¹H-MMR spektrum (250 MHz, d₆-DMSO belső standard TMS/δ/ppm): 8,80 széles (2H), 6,78 tr (1H, J_{H-F} 162 Hz).

b) 2-Amino-4-(difluor-metil)-6-metoxi-1,3,5-triazin

Az a) művelet szerinti 22,5 g (85 mmol) nyers-termék 100 ml metanollal készített oldatához 0 °C-on 1,6 g 30 tömeg%-os metanolos nátrium-metanolát-oldatot (9 mmol) csepegtetünk. A hűtést eltávolítjuk, és az elegyet 16 órán át 25 °C-on keverjük. A reakcióelegyhez további 1,6 g 30 tömeg%-os metanolos nátrium-metanolát-oldatot (9 mmol) adunk, és az elegyet még 3 órán át 25 °C-on keverjük. A reakciókeverékhez 3 n sósavat adva a pH-értékét 7-re beállítjuk, az oldószert 40 °C-on vízsugárvákuumban eltávolítjuk, és a maradékot 400 ml vízzel erőlyesen keverjük. A terméket leszívátjuk, vízzel mossuk és vízsugárvákuumban 40 °C-on szárítjuk.

Így 10,7 g (0,61 mol; 71%) cím szerinti vegyületet kapunk.

¹H-MMR spektrum (250 MHz, d₆-DMSO belső standard TMS/δ/ppm): 8,02, 7,94 széles (2H), 6,55 tr (1H, J_{H-F} 162 Hz), 3,90 s (3H).

Az (I) általános képletű szulfonil-karbamidok előállítása

1.03 példa

{2-[[4-(Klór-difluor-metil)-6-metoxi-1,3,5-triazin-2-il]-karbamoil]-amino-szulfonil}-benzoesav-metil-észter

4,2 g (20 mmol) 2-amino-4-(klór-difluor-metil)-6-metoxi-1,3,5-triazin 20 ml metilén-dikloriddal készített oldatához 25 °C-on 5 ml metilén-dikloridban oldott 4,8 g (20 mmol) 2-(metoxi-karbonil)-benzolszulfonil-izocianátot adunk. A reakcióelegyet 16 órán át 25 °C-on keverjük, az oldószert vízsugárvákuumban 40 °C-on eltávolítjuk, és a szilárd maradékot 100 ml hexán/dietil-

éter (1:1) keverékkel elkeverjük. A kivált terméket leszívátjuk, kevés éterrel mossuk, szárítjuk és metanol/víz keverékből átkristályosítjuk. Így 3,2 g (35%) cím szerinti vegyületet kapunk, olvadáspontja 174–175 °C.

1.05 példa

N-[[4-(Klór-difluor-metil)-6-metoxi-1,3,5-triazin-2-il]-karbamoil]-2-nitro-benzolszulfonamid

4,2 g (20 mmol) 2-amino-4-(klór-difluor-metil)-6-metoxi-1,3,5-triazin 20 ml metilén-dikloriddal készített oldatához 25 °C-on 5 ml metilén-dikloridban oldott 4,6 g 2-nitro-benzolszulfonil-izocianátot adunk. A reakcióelegyet 16 órán át 25 °C-on keverjük, a kivált terméket leszívátjuk, kevés éterrel mossuk és vízsugárvákuumban 40 °C-on szárítjuk. Így 3,1 g (35%) cím szerinti vegyületet kapunk, olvadáspontja 181 °C.

1.06 példa

{N-[[4-(Klór-difluor-metil)-6-metoxi-1,3,5-triazin-2-il]-karbamoil]-2-nitro-benzolszulfonamid}-nátriumsó

1,5 g (3,4 mmol) N-[[4-(klór-difluor-metil)-6-metoxi-1,3,5-triazin-2-il]-karbamoil]-2-nitro-benzolszulfonamid 10 ml metanollal készített szuszpenziójához 25 °C-on 0,62 g 30 tömeg%-os metanolos nátrium-metanolát-oldatot adunk, ekkor oldat képződik. Az elegyet 25 °C-on 30 percig keverjük, és az illó részeket 40 °C-on vízsugárvákuumban eltávolítjuk. Így kapjuk a cím szerinti vegyületet kvantitatív kitermeléssel, olvadáspontja 169 °C.

3.01 példa

2-[[4-(Difluor-metil)-6-metoxi-1,3,5-triazin-2-il]-karbamoil]-amino-szulfonil}-benzotrifluorid

2,65 g (15 mmol) 2-amino-4-(difluor-metil)-6-metoxi-1,3,5-triazin 20 ml acetonitrillel készített oldatához 25 °C-on 3,7 g (15 mmol) 2-(trifluor-metil)-benzolszulfonil-izocianátot adunk. A reakcióelegyet 16 órán át 25 °C-on keverjük, az oldószert vízsugárvákuumban 40 °C-on eltávolítjuk, és a szilárd maradékot 100 ml dietil-éterrel erőlyesen elkeverjük. A terméket leszívátjuk, kevés éterrel mossuk és szárítjuk. Így 4,3 g (10 mmol, 67%) cím szerinti vegyületet kapunk, olvadáspontja 143–145 °C.

3.02 példa

{N-[[4-(difluor-metil)-6-metoxi-1,3,5-triazin-2-il]-karbamoil]-amino-szulfonil-benzotrifluorid}-nátriumsó

1,3 g (3 mmol) 2-[[4-(difluor-metil)-6-metoxi-1,3,5-triazin-2-il]-karbamoil]-amino-szulfonil}-benzotrifluorid 10 ml metanollal készített szuszpenziójához 25 °C-on 0,54 g 30 tömeg%-os metanolos nátrium-metanolát-oldatot (3 mmol) adunk, ekkor oldat képződik. Az elegyet 30 percig 25 °C-on keverjük, és az illó részeket 40 °C-on vízsugárvákuumban eltávolítjuk. Így kapjuk a cím szerinti vegyületet kvantitatív kitermeléssel, olvadáspontja 189–192 °C.

Az alábbi 1–4. táblázatokban felsorolt hatóanyagok a fentiekhez hasonló eljárásokkal állíthatók elő.

1. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében W = klóratom és Z = nitrogénatom és R¹, R² és R³ a táblázatban felsorolt jelentésűek.

Hatóanyag száma	R ¹	R ²	R ³	Op. (°C)
1.01	CH ₃	CF ₃	H	175–172
1.02	CH ₃	CF ₃	H	192–193 (Z)*
1.03	CH ₃	CO ₂ CH ₃	H	174–175
1.04	CH ₃	CO ₂ CH ₃	H	171 (Z)*
1.05	CH ₃	NO ₂	H	181
1.06	CH ₃	NO ₂	H	169 (Z)*
1.07	CH ₃	SO ₂ N(CH ₃) ₂	H	152–154
1.08	CH ₃	SO ₂ N(CH ₃) ₂	H	125–130 (Z)*
1.09	CH ₃	SCH ₃	6-SCH ₃	>200
1.10	CH ₃	OSO ₂ CH ₃	H	
1.11	CH ₃	OSO ₂ CH ₃	H	*
1.12	CH ₃	OCF ₃	H	
1.13	CH ₃	OCH ₃	H	*
1.14	CH ₃	OCF ₂ H	H	
1.15	CH ₃	OCH ₂ H	H	*
1.16	CH ₃	SO ₂ CH ₃	H	
1.17	CH ₃	SO ₂ CH ₃	H	*
1.18	CH ₃	CO ₂ C ₂ H ₅	H	159–167
1.19	CH ₃	CO ₂ C ₂ H ₅	H	*
1.20	CH ₃	CO ₂ iC ₃ H ₇	H	
1.21	CH ₃	CO ₂ iC ₃ H ₇	H	*
1.22	CH ₃	CO ₂ CH ₃	5-OCH ₃	155–160
1.23	CH ₃	CO ₂ CH ₃	5-OCH ₃	165–170 (Z)*

*nátriumsó

Hasonló módon állítjuk elő az olyan (I) általános képletű vegyületeket, amelyek képletében R¹ metil-csoport, R² trifluor-metoxi-csoport, W klóratom és Z nitrogénatom; vagy R¹ metilcsoport, R² trifluor-metoxi-csoport, W hidrogénatom és Z nitrogénatom; vagy ezek nátriumsóit; emellett a vegyületekben R³ jelentése a következő: 3-metil-tio-, 5-metil-tio-, 6-metil-tio-, 3-metoxi-, 4-metoxi-, 5-metoxi-, 6-metoxi-csoport;

továbbá az olyan (I) általános képletű vegyületeket, amelyek képletében R¹ metilcsoport, R² trifluor-metil-csoport, W klóratom és Z nitrogénatom; vagy R¹ metil-csoport, R² trifluor-metil-csoport, W hidrogénatom és Z nitrogénatom; vagy ezek nátriumsóit; emellett a vegyületekben R³ jelentése a következő: 3-metil-tio-, 5-metil-tio-, 6-metil-tio-, 3-metoxi-, 4-metoxi-, 5-metoxi-, 6-metoxi-csoport;

továbbá az olyan (I) általános képletű vegyületeket, amelyek képletében R¹ metilcsoport, R² metoxi-karbonil-csoport, W klóratom és Z nitrogénatom; vagy R¹ metilcsoport, R² metoxi-karbonil-csoport, W hidrogénatom és Z nitrogénatom; vagy ezek nátriumsóit; emellett a vegyületekben R³ jelentése a következő: 3-

metil-tio-, 5-metil-tio-, 6-metil-tio-, 3-metoxi-, 4-metoxi-, 5-metoxi-, 6-metoxi-csoport;

40 továbbá az olyan (I) általános képletű vegyületeket, amelyek képletében R¹ metilcsoport, R² metil-szulfonil-csoport, W klóratom és Z nitrogénatom; vagy R¹ metilcsoport, R² metil-szulfonil-csoport, W hidrogénatom és Z nitrogénatom; vagy ezek nátriumsóit; emellett a vegyületekben R³ jelentése a következő: 3-metil-tio-, 5-metil-tio-, 6-metil-tio-, 3-metoxi-, 4-metoxi-, 5-metoxi-, 6-metoxi-csoport;

50 továbbá az olyan (I) általános képletű vegyületeket, amelyek képletében R¹ metilcsoport, R² N,N-dimetil-szulfamoi-csoport, W klóratom és Z nitrogénatom; vagy R¹ metilcsoport, R² N,N-dimetil-szulfamoi-csoport, W hidrogénatom és Z nitrogénatom; vagy ezek nátriumsóit; emellett a vegyületekben R³ jelentése a következő: 3-metil-tio-, 5-metil-tio-, 6-metil-tio-, 3-metoxi-, 4-metoxi-, 5-metoxi-, 6-metoxi-csoport;

60 továbbá az olyan (I) általános képletű vegyületeket, amelyek képletében R¹ metilcsoport, R² metil-szulfonil-oxi-csoport, W klóratom és Z nitrogénatom; vagy R¹ metil- vagy etilcsoport, R² metil-szulfonil-oxi-csoport, W hidrogénatom és Z nitrogénatom; vagy ezek

nátriumsóit; emellett a vegyületekben R³ jelentése a következő: 3-metil-tio-, 5-metil-tio-, 6-metil-tio-, 3-metoxi-, 4-metoxi-, 5-metoxi-, 6-metoxi-csoport;

továbbá az olyan (I) általános képletű vegyületeket, amelyek képletében R¹ metilcsoport, R² difluor-metoxi-csoport, W klóratom és Z nitrogénatom; vagy R¹ metil-

csoport, R² difluor-metoxi-csoport, W hidrogénatom és Z nitrogénatom, vagy ezek nátriumsóit; emellett a vegyületekben R³ jelentése a következő: 3-metil-tio-, 5-metil-tio-, 6-metil-tio-, 3-metoxi-, 4-metoxi-, 5-metoxi-, 6-metoxi-csoport.

2. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében W klóratom, Z metincsoport és R¹, R² és R³ a táblázatban felsorolt jelentésűek.

Hatóanyag száma	R ¹	R ²	R ³	Op. (°C)
2.01	CH ₃	CF ₃	H	
2.02	CH ₃	CF ₃	H	*
2.03	CH ₃	CO ₂ CH ₃	H	
2.04	CH ₃	CO ₂ CH ₃	H	*
2.05	CH ₃	NO ₂	H	
2.06	CH ₃	NO ₂	H	*
2.07	CH ₃	SO ₂ N(CH ₃) ₂	H	
2.08	CH ₃	SO ₂ N(CH ₃) ₂	H	*
2.09	CH ₃	SCH ₃	6-SCH ₃ ,	
2.10	CH ₃	OSO ₂ CH ₃	H	
2.11	CH ₃	OSO ₂ CH ₃	H	*
2.12	CH ₃	OCF ₃	H	
2.13	CH ₃	OCH ₃	H	*
2.14	CH ₃	OCF ₂ H	H	
2.15	CH ₃	OCH ₂ H	H	*
2.16	CH ₃	SO ₂ CH ₃	H	
2.17	CH ₃	SO ₂ CH ₃	H	*
2.18	CH ₃	CO ₂ C ₂ H ₅	H	
2.19	CH ₃	CO ₂ C ₂ H ₅	H	*
2.20	CH ₃	CO ₂ iC ₃ H ₇	H	
2.21	CH ₃	CO ₂ iC ₃ H ₇	H	*

*nátriumsó

3. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében W hidrogénatom, Z nitrogénatom és R¹, R² és R³ a táblázatban felsorolt jelentésűek.

Hatóanyag száma	R ¹	R ²	R ³	Op. (°C)
3.01	CH ₃	CF ₃	H	143–145
3.02	CH ₃	CF ₃	H	* 189–192 (Z)
3.03	CH ₃	CO ₂ CH ₃	H	144–146
3.04	CH ₃	CO ₂ CH ₃	H	* 168 (Z)
3.05	CH ₃	NO ₂	H	
3.06	CH ₃	NO ₂	H	*
3.07	CH ₃	SO ₂ N(CH ₃) ₂	H	160–162
3.08	CH ₃	SO ₂ N(CH ₃) ₂	H	*
3.09	CH ₃	SCH ₃	6-SCH ₃ ,	
3.10	CH ₃	OSO ₂ CH ₃	H	146–148

3. táblázat (folytatás)

Hatóanyag száma	R ¹	R ²	R ³	Op. (°C)
3.11	CH ₃	OSO ₂ CH ₃	H	*
3.12	CH ₃	OCF ₃	H	158–161
3.13	CH ₃	OCH ₃	H	* 120 (Z)
3.14	CH ₃	OCF ₂ H	H	146–148
3.15	CH ₃	OCF ₂ H	H	* 161 (Z)
3.16	CH ₃	SO ₂ CH ₃	H	
3.17	CH ₃	SO ₂ CH ₃	H	*
3.18	CH ₃	CO ₂ C ₂ H ₅	H	167–169
3.19	CH ₃	CO ₂ C ₂ H ₅	H	* 158 (Z)
3.20	CH ₃	CO ₂ iC ₃ H ₇	H	
3.21	CH ₃	CO ₂ iC ₃ H ₇	H	*

*nátriumsó

4. táblázat

Olyan (I) általános képletű vegyületek, amelyek képletében W hidrogénatom, Z metincsoport és R¹, R² és R³ a táblázatban felsorolt jelentésűek.

Hatóanyag száma	R ¹	R ²	R ³	Op. (°C)
4.01	CH ₃	CF ₃	H	
4.02	CH ₃	CF ₃	H	*
4.03	CH ₃	CO ₂ CH ₃	H	
4.04	CH ₃	CO ₂ CH ₃	H	*
4.05	CH ₃	NO ₂	H	
4.06	CH ₃	NO ₂	H	*
4.07	CH ₃	SO ₂ N(CH ₃) ₂	H	
4.08	CH ₃	SO ₂ N(CH ₃) ₂	H	*
4.09	CH ₃	SCH ₃	6–SCH ₃ ,	
4.10	CH ₃	OSO ₂ CH ₃	H	
4.11	CH ₃	OSO ₂ CH ₃	H	*
4.12	CH ₃	OCF ₃	H	
4.13	CH ₃	OCH ₃	H	*
4.14	CH ₃	OCF ₂ H	H	
4.15	CH ₃	OCF ₂ H	H	*
4.16	CH ₃	SO ₂ CH ₃	H	
4.17	CH ₃	SO ₂ CH ₃	H	*
4.18	CH ₃	CO ₂ C ₂ H ₅	H	
4.19	CH ₃	CO ₂ C ₂ H ₅	H	*
4.20	CH ₃	CO ₂ iC ₃ H ₇	H	
4.21	CH ₃	CO ₂ iC ₃ H ₇	H	*

*nátriumsó

Felhasználási példák

Az (I) általános képletű szulfonil-karbamidok gyomirtó hatását a tesztnövények növekedésére az alábbi üvegházi kísérletek szemléltetik.

Tenyészto edényként műanyag virágcserepek szolgálták agyagos homokkal, szubsztrátumként körülbelül

55 3,0% humusszal. A kísérleti növények magjait fajtánként elkülönítve vetették el.

Kikelés előtti kezelésnél a vízben szuszpendált vagy emulgeált hatóanyagokat közvetlenül a magok elvetése után finomelosztású fúvókából permetezték ki. A csírázás és a növekedés elősegítésére a cserepeket kissé

megöntöztük, majd átlátszó műanyagapkákkal letakaruk, amíg a növények kikeltek. A cserepeknek ez a letakarása a kísérleti növények egyenletes csírázását segíti elő, ha csak a hatóanyag ezt nem akadályozza.

A kikelés utáni kezelésnél a kísérleti növényeket a növekedésformától függően először 4–15 cm magasságig felneveljük, és csak ez után kezeljük ezeket a vízben szuszpendált vagy emulgeált hatóanyagokkal. A kísérleti növényeket erre a célra közvetlenül elvetjük és ugyanabban az edényben felneveljük vagy a növényeket először mint csíranövényeket külön neveljük és a kezelés előtt néhány nappal a kísérleti edényekbe áttettjük. A felhasználási mennyiség a kikelés utáni kezelésnél 0,06 kg hatóanyag/hektár.

A növényeket a fajtájuktól függően 10–25 °C, illetve 20–35 °C hőmérsékleten tartjuk. A kísérletek időtartama 2–4 hét. Ez alatt az idő alatt a növényeket gondozzuk, és reakcióikat az egyes kezelésekre kiértékeljük.

A kiértékelést 0–100 skála szerint végezzük. A 100 azt jelenti, hogy a növény ki sem csírázott, illetve legalább a föld feletti részek teljesen tönkrementek, és 0 azt jelenti, hogy a növény nem károsodott vagy normálisan fejlődött.

Az üvegházi kísérletekben használt növények a következő fajták voltak:

<i>Latin név</i>	<i>Magyar név</i>
<i>Abutilon theophrasti</i>	kínai kender
<i>Sinapis alba</i>	fehér (angol) mustár
<i>Zea mays</i>	kukorica

A kikelés utáni kezelésben 0,06 kg hatóanyag/hektár alkalmazásával az 1.03 példa szerinti vegyülettel széleslevelű nemkívánatos növények igen jól irthatók, és egyidejűleg igen szelektívek a példa szerinti kukorica kultúrnövényre.

Az alábbi táblázatokban biológiai kísérletek eredményeit állítottuk össze, amelyekben az 1.03 példa találmány szerinti hatóanyagát összehasonlítottuk a 4 169 719 számú amerikai egyesült államokbeli szabadalmi leírásból ismert B vegyülettel, és a 3.01 példa találmány szerinti hatóanyagát a WO–92/09608 számú nemzetközi közzétételi iratból ismert H összehasonlító vegyülettel, amelyben R = trilfluor-metilcsoport.

I. táblázat

Az 1.03 példa szerinti vegyület és az ismert B vegyület gyomirtó hatásának összehasonlítása kikelés utáni kezelésnél, 0,0313, illetve 0,0156 kg hatóanyag/hektár mennyiségekkel, üvegházban.

Kísérleti növények	Károsodás Felhasznált mennyiség/hatóanyag kg/ha			
	1.03 példa		B	
	0,0313	0,0156	0,0313	0,0156
<i>Amaranthus retroflexus</i>	100	100	75	70
<i>Galium aparine</i>	95	75	85	40

Kísérleti növények	Károsodás Felhasznált mennyiség/hatóanyag kg/ha			
	1.03 példa		B	
	0,0313	0,0156	0,0313	0,0156
<i>Polygonum persicaria</i>	80	80	40	40
<i>Sinapis alba</i>	90	90	75	75
<i>Solanum nigrum</i>	90	90	60	60
<i>Veronica spp.</i>	85	75	50	40

II. táblázat

A 3.01 példa szerinti vegyület és az ismert H összehasonlító vegyület (R = CF₃) gyomirtó hatásának összehasonlítása kikelés utáni kezelésnél, 0,063, illetve 0,0313 kg hatóanyag/hektár mennyiségekkel, üvegházban.

Kísérleti növények	Károsodás Felhasznált mennyiség/hatóanyag kg/ha			
	3.01 példa		H	
	0,063	0,0313	0,063	0,0313
<i>Alopecurus myosuroides</i>	98	98	40	0
<i>Galium aparine</i>	95	95	95	95
<i>Ipomea spp.</i>	98	90	80	80
<i>Sinapis alba</i>	98	98	100	100
<i>Triticum aestivum</i>	0	0	0	0

SZABADALMI IGÉNYPONTOK

- Herbicide készítmény, *azzal jellemezve*, hogy hatóanyagként 0,1–95 tömeg% mennyiségben (I) általános képletű szulfonil-karbamidot – a képletben R¹ jelentése metilcsoport, R² jelentése (1–3 szénatomos alkoxi)-karbonil-csoport, 1–5 fluoratomot hordozó 1–2 szénatomos alkilcsoport, metil-tio-, metil-szulfonil-, metil-szulfonil-oxi-, N,N-dimetil-szulfamoil-, trifluor-metoxi-, difluor-metoxi- vagy nitrocsoporth, R³ jelentése hirogénatom, metoxi- vagy metil-tio-csoport, W jelentése hidrogén- vagy klóratom és Z jelentése metincsoport vagy nitrogénatom – vagy mezőgazdaságilag alkalmazható sóját tartalmazza a szokásos segédanyagokkal együtt.
- Az 1. igénypont szerinti herbicide készítmény, *azzal jellemezve*, hogy olyan (I) általános képletű hatóanyagot tartalmaz, amelynek képletében R² jelentése metoxi-karbonil-, trifluor-metil-, N,N-dimetil-szulfamoil-, trifluor-metoxi- vagy difluor-metoxi-csoport.

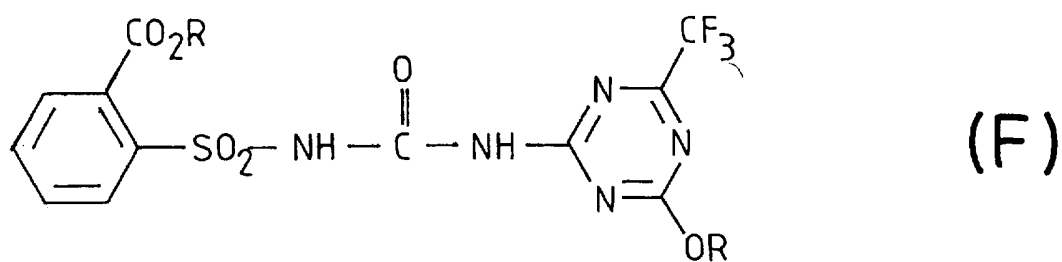
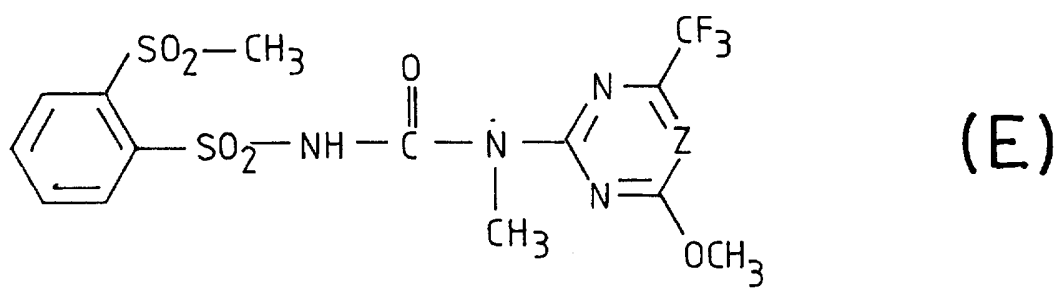
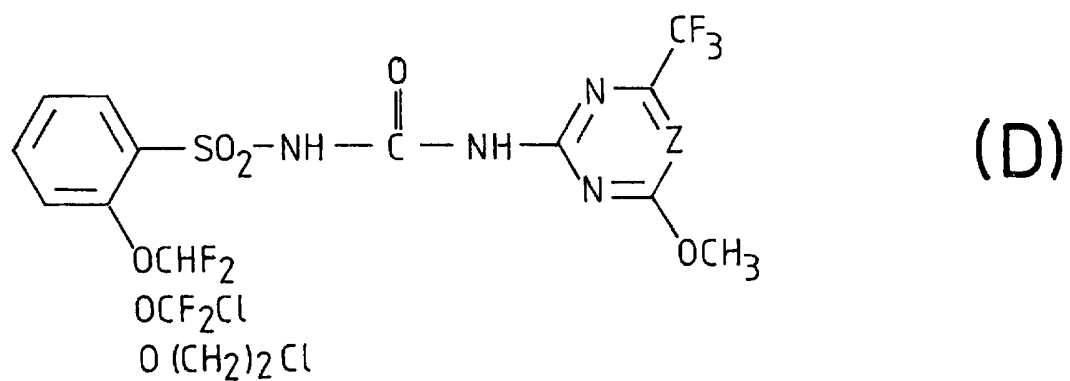
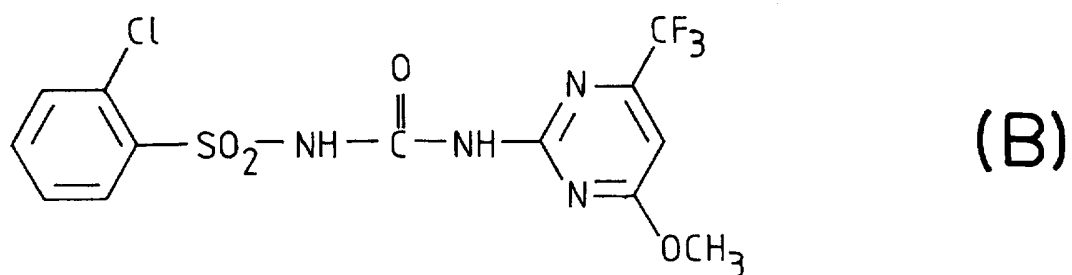
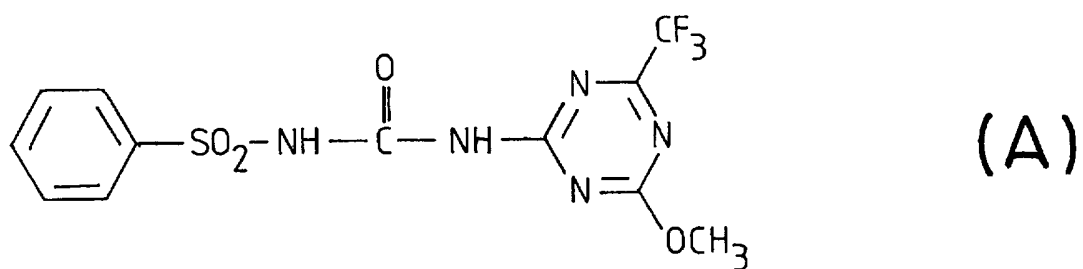
3. Az 1. vagy 2. igénypont szerinti herbicid készítmény, *azzal jellemezve*, hogy olyan (I) általános képletű hatóanyagot tartalmaz, amelynek képletében Z jelentése nitrogénatom.

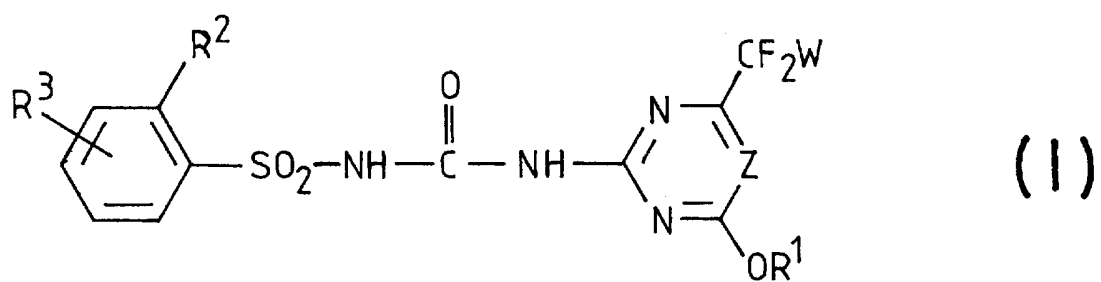
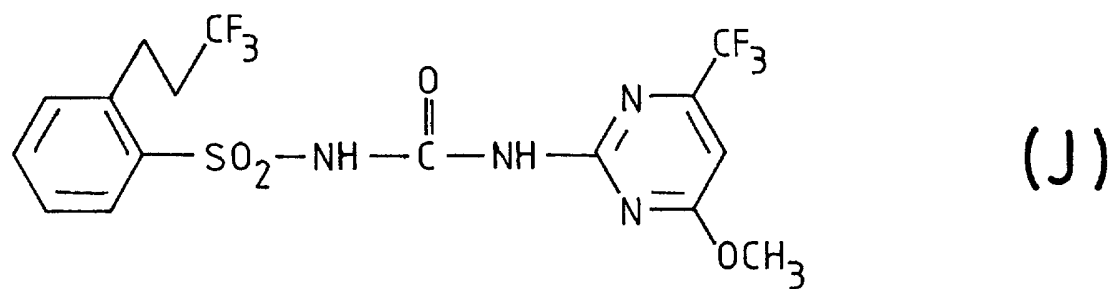
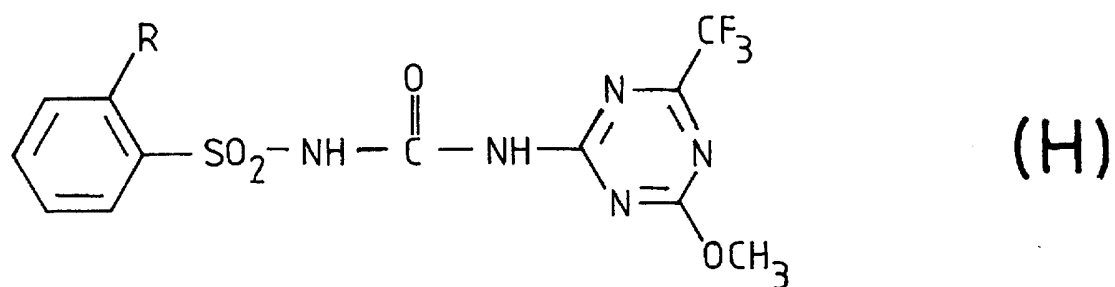
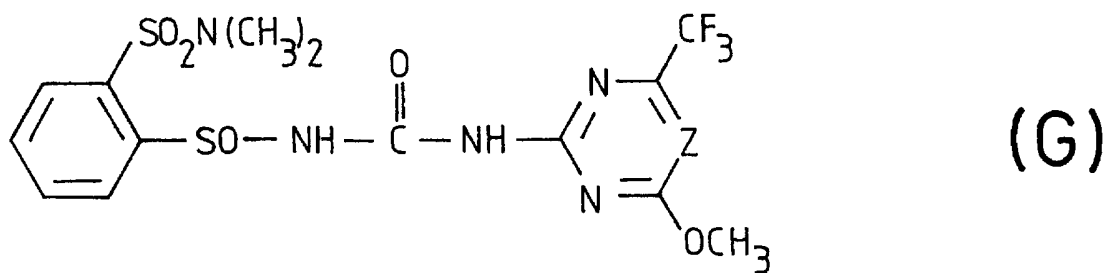
4. Az 1–3. igénypont szerinti herbicid készítmény, *azzal jellemezve*, hogy olyan (I) általános képletű hatóanyagot tartalmaz, amelynek képletében W jelentése hidrogénatom.

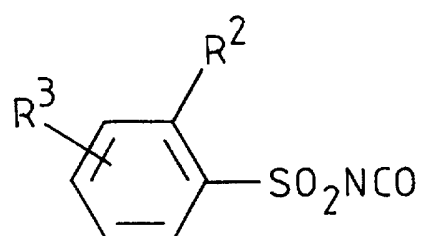
5. Eljárás (I) általános képletű szulfonil-karbamidok – a képletben R^1 , R^2 , R^3 , W és Z az 1. igénypontban megadottak – és mezőgazdaságilag alkalmazható sóik előállítására, *azzal jellemezve*, hogy egy (II) általános

képletű szulfonil-izocianátot – a képletben R^2 és R^3 a fenti jelentésűek – ismert módon, inert szerves oldószer jelenlétében egy (III) általános képletű 2-amino-1,3,5-triazin- vagy 2-amino-pirimidin-származék – a képletben R^1 , W és Z a fenti jelentésűek – sztöchiometrikus mennyiségével reagáltatunk, és kívánt esetben a kapott vegyületet mezőgazdaságilag alkalmazható sójává alakítjuk.

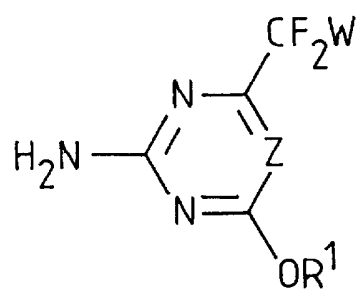
6. Eljárás gyomok irtására, *azzal jellemezve*, hogy a gyomokat vagy életterüket 0,001–1 kg/ha (I) általános képletű hatóanyagnak megfelelő mennyiségű herbicid készítménnyel kezeljük.







(II)



(III)

