

(19) HU

# SZABADALMI LEÍRÁS

(11) 188 546

MAGYAR  
KÖZTÁRSASÁGORSZÁGOS  
TALÁLMÁNYI  
HIVATAL

B

A bejelentés napja: (22) 81. 03. 18.

(21) (690/81)

A bejelentés elsőbbsége:

(33)  
US(32)  
80. 03. 25(31)  
(133 763)

A közzététel napja: (41) (42) 84. 03. 28.

Megjelent: (45) 88. 05. 20.

Nemzetközi  
osztályjelzet:  
(51) NSZO<sub>4</sub>A 01 N 37/18;  
A 01 N 43/74;  
A 01 N 43/48;  
C 07 C 103/127;  
C 07 D 263/58;  
C 07 D 277/68;  
C 07 D 235/26

Találók: (72)

Gupp John Paul, vegyész, Kirkwood, Missouri, US

Szabadalmaz: (73)

Monsanto Company, St. Louis, Missouri, US

4)

## HERBICID KÉSZÍTMÉNY ÉS ELJÁRÁS A HATÓANYAGKÉNT ALKALMAZOTT 2-HALOGEN-ACETAMID- ÉS 2-HALOGEN-ACETANILID-SZÁRMAZÉKOK ELŐÁLLÍTÁSÁRA

### (57) KIVONAT

A találmány szerinti készítmények hatóanyagainak

(I) általános képletében:

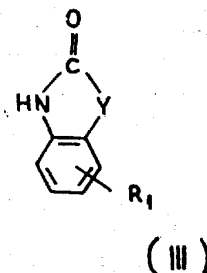
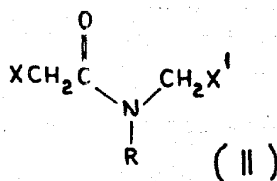
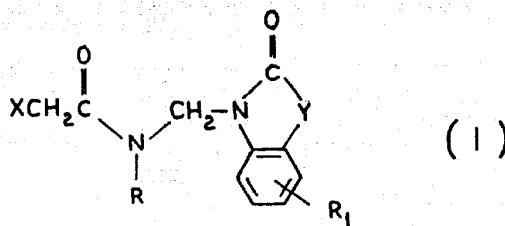
X jelentése klóratom;

R jelentése 5-7 szénatomos cikloalkenil- vagy fenilcsoport, amely csoportok adott esetben egymástól függetlenül egy vagy két 1-6 szénatomos alkilcsoporttal vagy 1-4 szénatomos alkoxicsoporthal lehetnek szubsztituálva;

Y jelentése oxigén- vagy kénatom;

R<sub>1</sub> jelentése hidrogénatom, halogénatom vagy 1-4 szénatomos alkoxicsoporthal.

A (I) általános képletű hatóanyagokat (II) általános képletű acetamid-származékokból és (III) általános képletű benzotiazolin-származékokból állítják elő.



A találmány herbicid készítményre és a hatóanyagként használható 2-halogén-acetamid- és 2-halogén-acetanilid-származékok előállítására alkalmas eljárásra vonatkozik.

Ismereteseek különböző 2-halogén-acetamid-származékok, amelyek — akár egymagukban, akár más vegyületekkel együtt — herbicid készítmények hatóanyagaiként kerülnek alkalmazásra.

Ezek az ismert acetamid-származékok változó elrendezésben alkil-, cikloalkil-, alkenil-, cikloalkenil- és alkoxi-csoportokat, halogénatomokat, arilcsoportokat tartalmaznak szubsztituensként. Ezek a csoportok maguk is helyettesítve lehetnek más csoportokkal.

Az ismert és a találmány szerinti herbicid készítmények hatóanyagaiként alkalmazható 2-halogén-acetamid-származékokkal rokon 2-halogén-acetamid-származékok a 3 495 967., a 3 574 746., a 3 586 496., a 3 901 917., a 3 819 661., a 3 946 045., a 4 012 222., a 4 097 262., a 4 055 410. és a 4 155 744. számú USA-beli szabadalmi leírásokban vannak leírva. A 3 495 967. számú szabadalmi leírásban ismertetett 2-halogén-acetamid-származékokat az jellemzi, hogy a nitrogénatomon helyettesítők vannak, ideszámítva a benzotiofenil-csoportot is, amely szintén hordozhat szubsztituenseket. A 3 574 746. és a 3 586 496. számú szabadalmi leírások olyan 2-halogén-acetamid-származékokra vonatkoznak, amelyek 5–7 szénatomos cikloalken-1-il-csoportot és más szubsztituenseket hordoznak a nitrogénatomon. A 3 901 917. számú szabadalmi leírásban olyan 2-halogén-acetanilid-származékokat írnak le, amelyekben olyan tienil-metilén-csoport van, amely a nitrogénatomon rövidszénláncú alkilcsoporttal lehet helyettesítve, míg a 3 819 661. számú szabadalmi leírás olyan 2-halogén-acetanilid-származékokat ismertet, amelyek a nitrogénatomon furfuryl- vagy tetrahidrofurfuryl-csoporttal vannak helyettesítve. A 3 946 045. és a 4 012 222. számú szabadalmi leírások olyan 2-halogén-acetanilid-származékokra vonatkoznak, amelyek dioxolanil-rövidszénláncú-alkil-csoportot tartalmaznak az anilin nitrogénatomján. A 4 055 410. számú szabadalmi leírás pedig olyan 2-halogén-acetanilid-származékokra vonatkozik, amelyek a nitrogénatomon 2,4-dioxo-tiazolidinil-metil- vagy 2,4-dioxo-imidazolidinil-metil-csoporttal vannak helyettesítve. A 4 155 744. számú szabadalmi leírás pedig olyan 2-halogén-acetamid-származékokat ismertet, amelyek a nitrogénatomon cikloalkenil- és heterociklusos csoportokkal vannak helyettesítve. A 4 097 262. számú szabadalom végül N-(0-helyettesített-fenil)-N-[(2-oxo-oxazolidin-3-il)-metil]-2-halogén-acetamid-származékokra vonatkozik.

Az ismert eljárások különböző 2-halogén-acetamid-származékok előállítására magukba foglalják a megfelelő anilin vagy ciklohexilidénimin halogén-acetilézését is.

Ahogy az elmondottakból látható, a legfontosabb ismert 2-halogén-acetamid-származékok egy heterociklusos és egy cikloalkenil- vagy fenilcsoportot (amely helyettesítve lehet) tartalmaznak a nitrogénatomon. A technika állásához tartozó irodalmi helyek egyike sem tesz említést a találmány szerinti herbicid készítmények hatóanyagaként alkalmazható új 2-halogén-acetamid-származékokról és az előállításukra szolgáló találmány szerinti eljárásról. Mindezeket a későbbiekben részletesen ismertetjük.

A találmány szerinti herbicid készítmények hatóanyagaiként alkalmazható 2-halogén-acetamid-származékok és -acetanilid-származékok (I) általános képletében:

- X jelentése klóratom,  
R jelentése 5–7 szénatomos cikloalkenil- vagy fenil-csoport, amely csoportok adott esetben egymástól függetlenül egy vagy két 1–6 szénatomos alkilcsoporttal vagy 1–4 szénatomos alkoxicsopottal lehetnek szubsztituálva,  
5 Y jelentése oxigén- vagy kénatom,  
R<sub>1</sub> jelentése hidrogénatom, halogénatom vagy 1–4 szénatomos alkoxicsopott.  
10 Különösen értékesek azok a származékok, amelyeknek (I) általános képletében R jelentése rövidszénláncú alkilcsoporttal és/vagy alkoxicsopottal helyettesített fenilcsoport vagy rövidszénláncú alkilcsoporttal helyettesített cikloalken-1-il-csoport és Y jelentése kénatom.  
15 A találmány szerinti eljárással előállítható hatóanyagok közül különösen értékes származékok az N-(2,6-dimetil-1-ciklohexen-1-il)-N-[(2-oxo-3-(2H)-benzotiazolil)-metil]-2-klór-acetanilid.  
A (I) általános képletű vegyületek előállítására alkalmas új eljárásra az jellemző, hogy (II) általános képletű acetamid- vagy acetanilid-származékot — a képletben X<sub>1</sub> jelentése halogénatom, X jelentése klóratom, R jelentése a (I) általános képletnél megadottal azonos — bázis és adott esetben fázis-transzfer katalizátor jelenlétében  
20 olyan benzotiazolin vagy benzoxazolin-származékkal reagáltatunk, amelynek képletében Y, R<sub>1</sub> és n jelentése a (I) általános képletnél megadottal azonos.  
A reakciót 0 °C és 120 °C közötti hőmérsékleten — előnyösen 10–60 °C hőmérséklet-tartományban —  
30 játszadjuk le.

Az eljárás során előnyösen használható bázisok az alkálifém-hidroxidok, vagy egyéb bázisok, így elemi fémek, fém-hidridek, -oxidok, -karbonátok vagy -alkoxidok.

Előnyös fázis-átvivő katalizátorok a kvaterner ammónium-halogenidsók, például az aril- vagy aralkil-trialkil-ammónium-halogenidsók, így a benzil-trietil-ammónium-bromid vagy -klorid. Más fázis-átvivő katalizátorok az aciklusos és a ciklusos poliéterek, például a „18-korona 6” ciklusos éterek kombinációban alkálifém-hidroxiddal, mint bázissal.

A (I) általános képletű vegyületek herbicid készítmények hatóanyagaiként használhatók.

A (I) általános képletű vegyületeket két eljárásváltozat szerint állíthatjuk elő. Az 1. példa N-alkilezéssel végzett eljárást ismertet; ezt a módszert egy korábbi találmányi bejelentésben írtuk le. Ezen eljárásváltozat szerint szek-2-halogén-acetamidból aniont képzünk bázikus körülmények között, azután az aniont alkilezőszerrel reagáltatjuk, előnyösen fázis-átvivő katalizátor jelenlétében.

50

### 1. példa

4 g (0.02 mól) 2-klór-N-(2,6-dimetil-1-ciklohexen-1-il)-  
55 acetamidot, 5,5 g (0.0275 mól) 3-klór-metil-2-benzotiazolinont, 2 g benzil-trietil-ammónium-bromidot és 75 ml metilén-kloridot bemérünk egy 500 ml-es gömblombikba. Az elegyhez keverés közben egyszerre hozzáadunk 15 g nátrium-hidroxidot és 50 s/tf%-os, vizes oldat alakjában.  
60 Az elegyet egy óra hosszat keverjük és hozzáadunk 150 ml vizet. A metilén-kloridos réteget elkülönítjük, vízmentes magnézium-szulfát felett szárítjuk, szűrjük, és a szűrletet vákuumban betöményítjük. Maradékként borostyánsárga színű habzó anyagot kapunk, amelyet  
65 még izopropanollal felveszünk. Az elegyet ezután le-

hűtjük, szűrjük, és így 4,4 g fehér színű kristályos anyagot különítünk el, amelynek olvadáspontja 133–136 °C (kis mennyiségű, magasabb olvadáspontú anyagot is kapunk). További átkristályosítással nem kapunk magasabb olvadáspontú anyagot. A szilárd anyagot szilikagélen kromatografáljuk, eluálásra kloroformot használunk. Az eluátum 10. és 11. frakciója tartalmazza a terméket. Az oldószer lepárlása után 2,6 g fehérszínű, kristályos terméket kapunk.

Op.: 141–143 °C.

Analízis a  $C_{18}H_{21}ClN_2O_2S$  összegképletre:  
számított: C: 59,25, H: 5,80, N: 7,68 t%;  
talált: C: 59,11, H: 5,82, N: 7,69 t%.

A terméket mint N-(2,6-dimetil-1-ciklohexen-1-il)-N-[(2-oxo-3(2H)-benzotiazolil-metil]-2-klór-acetamidot azonosítottuk.

A találmány szerinti eljárás során használt kiindulási anyagok jól ismertek. Az 1. példánál felhasznált szek-amid-származékok a 3 574 746. számú USA-beli szabadalmi leírásban vannak ismertetve. A benzotiazolinon-származékot a 3 050 526. számú USA-beli szabadalmi leírás ismerteti.

## 2. példa

Ez a példa egy további eljárást mutat be az (I) általános képletű vegyületek előállítására.

3,6 g (0,0137 mól) N-(klór-metil)-2'-metoxi-6'-metil-2-klór-acetanilidet 100 ml metilén-kloridban oldunk, majd az oldathoz 2,2 g (0,0145 mól) benzotiazolin-2-ont és 1,0 g trietil-ammónium-bromidot adunk. Ehhez az elegyhez keverés közben hozzáadunk 30 ml 50 t%-os nátrium-karbonát-oldatot, majd az elegyet körülbelül

három óra hosszat reagálni hagyjuk, ezután feldolgozzuk. Ily módon 5,8 g nyers terméket kapunk, amelyet elkülönítés után izopropanolból átkristályosítunk, így drappszínű szilárd anyagot kapunk.

Op.: 120–121 °C.

Analízis a  $C_{18}H_{17}ClN_2O_2S$  összegképletre:

számított: C: 57,37, H: 4,55, N: 7,43 s%;

talált: C: 56,89, H: 4,51, N: 7,34 s%.

A terméket mint N-(2'-metoxi-6'-metil)-N-[(2-oxo-3(2H)-benzotiazolil-metil]-2-klór-acetanilidet azonosítottuk.

A benzotiazolin-2-on egy kereskedelmi forgalomban levő termék; az N-(klór-metil)-2-klór-acetanilid-származék a megfelelően helyettesített fenil-azometin hagyományos módon történő klóracetilezésével állítható elő, ahogy az a 3 637 847. és a 3 547 620. számú USA-beli szabadalmi leírásban van leírva.

## 3–11. példa

Az 1. és a 2. példákban leírt általános módszereket követjük, de a megfelelő kiindulási anyagokkal helyettesítjük, a fent megadott kiindulási anyagokat és a reakciókörülményeket is megfelelően változtatjuk. Ily módon további, (I) általános képletű 2-halogén-acetamid- és acetanilid-származékokat állítunk elő. Ugyanolyan vagy egyenértékű oldószereket, bázisokat és katalizátorokat használunk, továbbá megfelelő hőmérsékleten és ideig dolgozunk a reakció kivitelezésénél. A fenti módszerekkel előállítható jellegzetes (I) általános képletű hatóanyagok közül néhányat az I. táblázatban mutatunk be, ahol megadjuk e vegyületek fizikai jellemzőjét is.

I. táblázat  
(I) általános képletű vegyületek fizikai jellemzői és analízis adatai

| A példa sorszáma | Vegyület                                                                                                                                                                                                | Tapasztalati képlet       | Op. °C  | Elem | Számított | Talált | t% |
|------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------|---------|------|-----------|--------|----|
| 3                | N-[(2-oxo-3(2H)-benzotiazolil(-metil)-2',6'-dietil-2-klór-acetanilid                                                                                                                                    | $C_{18}H_{17}ClN_2O_2S$   | 152–153 | C    | 51,91     | 51,95  |    |
|                  |                                                                                                                                                                                                         |                           |         | H    | 4,75      | 4,77   |    |
|                  |                                                                                                                                                                                                         |                           |         | N    | 7,76      | 7,77   |    |
| 4                | N-[(2-oxo-3(2H)-benzotiazolil(-metil)-N-(2-etil-6-metil-1-ciklohexen-1-il)-2-klór-acetamid és N-[(2-oxo-3(2H)-benzotiazolil(-metil)-N-(2-metil-6-etil-1-ciklohexen-1-il)-2-klór-acetamid (1:1) keveréke | $C_{19}H_{23}ClN_2O_2S$   | 135–160 | C    | 60,23     | 60,29  |    |
|                  |                                                                                                                                                                                                         |                           |         | H    | 6,12      | 6,15   |    |
|                  |                                                                                                                                                                                                         |                           |         | N    | 7,39      | 7,37   |    |
| 5                | N-[(2-oxo-3(2H)-benzotiazolil(-metil)-N-(2,6-dietyl-1-ciklohexen-1-il)-2-klór-acetamid                                                                                                                  | $C_{20}H_{25}ClN_2O_2S$   | 147–148 | C    | 61,13     | 60,87  |    |
|                  |                                                                                                                                                                                                         |                           |         | H    | 6,41      | 6,40   |    |
|                  |                                                                                                                                                                                                         |                           |         | N    | 7,13      | 7,05   |    |
| 6                | N-[(5-klór-2-oxo-3(2H)-benzotiazolil(-metil)-N-(2,6-dimetil-1-ciklohexen-1-il)-2-klór-acetamid                                                                                                          | $C_{18}H_{20}Cl_2N_2O_2S$ | 183–187 | C    | 54,12     | 53,98  |    |
|                  |                                                                                                                                                                                                         |                           |         | H    | 5,05      | 5,11   |    |
|                  |                                                                                                                                                                                                         |                           |         | N    | 7,02      | 6,98   |    |
| 7                | N-[(6-bróm-2-oxo-3(2H)-benzotiazolil(-metil)-N-(2,6-dimetil-1-ciklohexen-1-il)-2-klór-acetamid                                                                                                          | $C_{18}H_{20}BrCN_2O_2S$  | 125–127 | C    | 48,72     | 48,83  |    |
|                  |                                                                                                                                                                                                         |                           |         | H    | 4,54      | 4,58   |    |
|                  |                                                                                                                                                                                                         |                           |         | N    | 6,31      | 6,29   |    |
| 8                | N-[(6-etoxi-2-oxo-3(2H)-benzotiazolil(-metil)-N-(2,3-dimetil-1-ciklohexen-1-il)-2-klór-acetamid                                                                                                         | $C_{20}H_{25}ClN_2O_2S$   | 135–137 | C    | 58,74     | 58,82  |    |
|                  |                                                                                                                                                                                                         |                           |         | H    | 6,16      | 6,19   |    |
|                  |                                                                                                                                                                                                         |                           |         | N    | 6,85      | 6,82   |    |

## Az I. táblázat folytatása

| A példa sorszáma | Vegyület                                                                                | Tapasztalati képlet     | Op. °C  | Elem        | Számított             | Talált                | t% |
|------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------|---------|-------------|-----------------------|-----------------------|----|
| 9                | N-[(2-oxo-3(2H)-benzotiazolil)-metil]-N-2,6-dimetil-1-ciklohexen-1-il)-2-klór-acetamid  | $C_{18}H_{25}ClN_2O_2S$ | 95–99   | C<br>H<br>N | 58,60<br>6,83<br>7,59 | 58,65<br>6,83<br>7,58 |    |
| 10               | N-[(2-oxo-3(2H)-benzotiazolil)-metil]-N-(2-metil-1-ciklohexen-1-il)-2-klór-acetamid     | $C_{17}H_{19}ClN_2O_2S$ | 134–139 | C<br>H<br>N | 58,19<br>5,46<br>7,98 | 58,15<br>5,50<br>7,96 |    |
| 11               | N-[(2-oxo-3(2H)-benzotiazolil)-metil]-N-(2,6-dimetil-1-ciklohexen-1-il)-2-klór-acetamid | $C_{18}H_{21}ClN_2O_3$  | 140–142 | C<br>H<br>N | 61,98<br>6,07<br>8,03 | 61,99<br>6,10<br>8,03 |    |

Ahogy az előzőekben említettük, a (I) általános képletű vegyületek herbicid készítmények hatóanyagaiként alkalmazhatók, különösen kikelés előtti herbicid készítmények hatóanyagai lehetnek, bár kikelés utáni készítményekben is alkalmazhatók. A II. és III. táblázatokban összefoglaljuk azokat a kísérleti eredményeket, amelyeket a találmány szerinti herbicid készítményekkel végzett kikelés előtti alkalmazásnál kaptunk.

A kikelés előtti herbicid hatás megállapítására vonatkozó kísérleteket a következő módon végeztük:

Jóminőségű kertiföldet a vizsgált vegyületek acetonos oldatával vagy szuszpenziójával elegyítettük. A kertiföldet alumíniumedényekbe töltöttük és a földet úgy tömörítettük, hogy a föld az edényeket felülről számítva 9–12 mm magasságig megtöltötte. A talajra ezután különböző növényfajták meghatározott számú magját vagy vegetatív szaporító szervét helyeztük. Ezután földdel teljesen feltöltöttük az edényeket és megmértük azt a talajmennyiséget, amelyet felhasználtunk a magok és a vegetatív szaporító szervek elvetése után az edények színültig töltéséhez. Kezelés után az edényeket melegházba vittük, és alulról megfelelő nedvességet biztosítottunk a csírázáshoz és a fejlődéshez.

2 és 3 héttel a vetés és kezelés után a növényeket megvizsgáltuk, és az eredményeket feljegyeztük. A II. táblázat foglalja össze a kapott eredményeket. A herbicid hatás értékelésénél olyan skálát alkalmaztunk, amely az egyes növényfajták %-os pusztulására utal. Az értékelésnél a következő megjelöléseket alkalmazzuk:

| %-os irtás | skála |
|------------|-------|
| 0–24 %     | 0     |
| 25–49 %    | 1     |
| 50–74 %    | 2     |
| 75–100 %   | 3     |

Az egyes kísérletsorozatoknál alkalmazott növényfajtaikat a következő nagybetűkkel jelöljük:

|                 |                   |               |
|-----------------|-------------------|---------------|
| A mezei bogáncs | E libatop         | I fenyércirok |
| B szerbtövis    | F borsos keserűfű | J rozsok      |
| C selyemperje   | G sárga iszapsás  | K kakaslábű   |
| D hajnalka      | H tarackbúza      |               |

Az eredményeket a II. táblázatban foglaljuk össze:

II. táblázat  
Kikelés előtt

| A példa sorszáma | kg/ha       | A      | B      | C      | D      | E      | F      | G      | H      | I      | J      | K      |
|------------------|-------------|--------|--------|--------|--------|--------|--------|--------|--------|--------|--------|--------|
| 1                | 11,0<br>5,6 | 0<br>0 | 0<br>1 | 0<br>0 | 2<br>2 | 0<br>1 | 3<br>1 | 2<br>0 | 2<br>2 | 3<br>0 | 2<br>2 | 3<br>3 |
| 2                | 11,2<br>5,6 | 0<br>0 | 0<br>0 | 0<br>0 | 0<br>0 | 1<br>1 | 0<br>0 | 3<br>3 | 1<br>2 | 0<br>0 | 2<br>1 | 3<br>3 |
| 3                | 11,2<br>5,6 | 0<br>0 | 0<br>0 | 0<br>0 | 0<br>0 | 0<br>0 | 0<br>0 | 1<br>1 | 1<br>0 | 0<br>0 | 1<br>1 | 3<br>3 |
| 4                | 11,2<br>5,6 | 2<br>1 | 0<br>0 | 0<br>0 | 0<br>0 | 3<br>1 | 0<br>0 | 0<br>0 | 0<br>0 | 3<br>0 | 1<br>1 | 3<br>3 |

## A 2. táblázat folytatása

| A példa<br>sorszáma | kg/ha | Növényfajták |   |   |   |   |   |   |   |   |   |   |
|---------------------|-------|--------------|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
|                     |       | A            | B | C | D | E | F | G | H | I | J | K |
| 5                   | 11,2  | 0            | 0 | 0 | 0 | 1 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 1 |
|                     | 5,6   | 0            | 0 | 0 | 0 | 1 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 1 |
| 6                   | 11,2  | 1            | 0 | 0 | 0 | 3 | 0 | 0 | 1 | 0 | 0 | 3 |
|                     | 5,6   | 0            | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 1 |
| 7                   | 11,2  | 0            | 0 | 0 | 0 | 1 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 1 |
|                     | 5,6   | 0            | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 1 |
| 8                   | 11,2  | 0            | — | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
|                     | 5,6   | 0            | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 1 |
| 9                   | 11,2  | 0            | 0 | 0 | 0 | 1 | 3 | 0 | 1 | 0 | 2 | 3 |
|                     | 5,6   | 0            | 0 | 0 | 0 | 1 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 3 |
| 10                  | 11,2  | 0            | 0 | 0 | 1 | 0 | 0 | 1 | 0 | 0 | 3 | 3 |
|                     | 5,6   | 0            | 0 | 0 | 3 | 0 | 0 | 1 | 3 | 0 | 3 | 3 |
| 11                  | 11,2  | 0            | 0 | 0 | 0 | 1 | 0 | 1 | 3 | 0 | 3 | 3 |
|                     | 5,6   | 0            | 0 | 0 | 0 | 2 | 0 | 3 | 1 | 0 | 3 | 3 |

Megvizsgáltuk továbbá a találmány szerinti készítményeknek a következő növényfajtákra kifejtett hatását.

L szójabab  
M cukorrépa  
N búza  
O rizs  
P cirok

R pillangófü  
E libatop  
F borsos keserűfü  
C selyemperje  
J rózsok

B szerbtövis  
Q szecsenbúza  
M hajnalka

P köles  
K kakaslábű  
T muhar

A vizsgálatokat a fentiekben leírtak szerint végeztük.  
A kapott eredményeket a III. táblázatban foglaljuk össze.

III. táblázat  
Kikeelés előtt

| A példa<br>sorszáma | kg/ha  | Növényfajták |   |   |   |   |   |   |   |   |   |   |   |   |   |   |   |
|---------------------|--------|--------------|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
|                     |        | L            | M | N | O | P | B | Q | D | R | E | F | C | J | S | K | T |
| 1                   | 5,6    | 1            | 1 | 0 | 2 | 1 | — | 0 | 0 | — | 1 | 0 | 0 | 0 | 2 | 3 | 3 |
|                     | 1,12   | 0            | 1 | 1 | 2 | 3 | — | 0 | 0 | — | 2 | 0 | 0 | 3 | 3 | 3 | 3 |
|                     | 0,28   | 0            | 1 | 0 | 2 | 0 | — | 0 | 0 | — | 2 | 1 | 0 | 0 | 3 | 3 | 3 |
|                     | 0,056  | 1            | 1 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 1 | 0 | 1 | 1 | 0 | 0 | 3 | 3 | 3 |
|                     | 0,0112 | 0            | 0 | 0 | 1 | 1 | 0 | 0 | 3 | 1 | 1 | 1 | 0 | 1 | 3 | 3 | 2 |
|                     | 0,0056 | 0            | 0 | 0 | 1 | 0 | — | 0 | 3 | — | 1 | 1 | 0 | 0 | 3 | 3 | 3 |
| 2                   | 5,6    | 0            | 0 | 2 | 3 | 1 | 0 | 0 | 0 | 2 | 1 | 2 | 0 | 3 | 3 | 3 | 3 |
|                     | 1,12   | 0            | 0 | 0 | 3 | 1 | 0 | 0 | 0 | 0 | 3 | 2 | 0 | 3 | 3 | 3 | 3 |
|                     | 0,28   | 0            | 0 | 0 | 1 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 2 | 1 | 0 | 1 | 1 | 3 | 1 |
|                     | 0,056  | 0            | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 2 | 2 | 0 |
|                     | 0,0112 | 0            | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
|                     | 0,0056 | 0            | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 |
| 3                   | 5,6    | 0            | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 2 | 3 | 3 | 3 |
|                     | 1,12   | 0            | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 1 | 0 | 1 | 1 | 3 | 2 |
|                     | 0,28   | 0            | 0 | 0 | 1 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 3 | 1 |
| 4                   | 5,6    | 0            | 1 | 0 | 1 | 0 | 3 | 0 | 1 | 3 | 3 | 3 | 0 | 0 | 2 | 3 | 3 |
|                     | 1,12   | 0            | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 2 | 3 | 0 | 0 | 0 | 3 | 3 |
|                     | 0,28   | 0            | 1 | 0 | 0 | 0 | — | 0 | 1 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 2 |

## A 3. táblázat folytatása

| A példa<br>sorszáma | kg/ha | Növényfajták |   |   |   |   |   |   |   |   |   |   |   |   |   |   |   |
|---------------------|-------|--------------|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|---|
|                     |       | L            | M | N | O | P | B | Q | D | R | E | F | C | J | S | K | T |
| 6                   | 5,6   | 0            | 1 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 3 | 1 | 1 | 0 | 0 | 0 | 1 | 3 |
|                     | 1,12  | 0            | 1 | 0 | 1 | 0 | 0 | 0 | 0 | 3 | 3 | 2 | 0 | 0 | 0 | 0 | 2 |
| 9                   | 5,6   | 0            | 1 | 2 | 2 | 2 | — | 0 | 0 | 0 | 1 | 1 | 0 | 2 | 3 | 3 | 3 |
|                     | 1,12  | 0            | 0 | 0 | 2 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 3 | 2 |
|                     | 0,28  | 0            | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | — | — | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 2 | 1 |
| 10                  | 5,6   | 0            | 0 | 1 | 3 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 3 | 2 | 0 | 2 | 2 | 3 | 3 |
|                     | 1,12  | 0            | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 1 | 1 | 0 | 0 | 0 | 2 | 3 |
|                     | 0,28  | 0            | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 3 | 3 |
|                     | 0,056 | 0            | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 1 | 0 | 0 | 0 | 0 | 3 | 3 |

## 12–45. példa

20

A következő példákban ismertett vegyületeket az 1. és 2. példában leírt eljárásváltozatok szerint állítjuk elő.

A IV. táblázatban az (I) általános képletű vegyületek körébe tartozó (IA) általános képletű vegyületeket sorol-

tuk fel; R jelentése helyettesített vagy helyettesítetlen 1-cikloalken-1-il-csoport. Az V. táblázatban az (IB) általános képletnek megfelelő származékokat soroltuk fel; R helyettesített vagy helyettesítetlen fenilcsoportot jelent.

25

IV. táblázat  
(IA) általános képletű vegyületek

| A példa<br>sorszáma | X  | Y                               | n | R <sub>1</sub>     | R                                                    |
|---------------------|----|---------------------------------|---|--------------------|------------------------------------------------------|
| 12                  | Cl | O                               | 0 | —                  | 2-metil-6-metoxi-1-ciklopenten-1-il-                 |
| 13                  | Br | S                               | 1 | 4-CH <sub>3</sub>  | 2-etil-1-ciklohexen-1-il-                            |
| 14                  | Cl | N-CH <sub>3</sub>               | 0 | —                  | 2-(metoxi-metil)-6-metil-1-ciklohexen-1-il-          |
| 15                  | Cl | N-H                             | 1 | 5-OCH <sub>3</sub> | 1-ciklohepten-1-il-                                  |
| 16                  | Br | S                               | 2 | 4,5,6-trimetil     | 2,6-dimetil-1-ciklohexen-1-il-                       |
| 17                  | Cl | S                               | 1 | 4-SCH <sub>3</sub> | 2,6-dietyl-1-ciklopenten-1-il-                       |
| 18                  | Cl | S                               | 0 | —                  | 2-allil-1-ciklohepten-1-il-                          |
| 19                  | Br | S                               | 0 | —                  | 2-propargil-6-metil-1-ciklohexen-1-il-               |
| 20                  | Cl | O                               | 0 | —                  | 2-CF <sub>3</sub> -6-metil-1-ciklohexen-1-il-        |
| 21                  | Br | S                               | 3 | 4,5,6-trimetil     | 2-klór-6-metil-1-ciklopenten-1-il-                   |
| 22                  | Cl | N-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> | 0 | —                  | 2-NO <sub>2</sub> -6-metil-1-ciklohepten-1-il-       |
| 23                  | Cl | S                               | 1 | 4-furfuril         | 2,6-dimetil-1-ciklohexen-1-il-                       |
| 24                  | Cl | S                               | 0 | —                  | 2-furfuril-6-etyl-1-ciklohexen-1-il-                 |
| 25                  | Cl | S                               | 1 | 5-allil            | 3-tetrahidrofurfuril-6-(n-propil)-1-ciklohexen-1-il- |
| 26                  | Cl | S                               | 0 | —                  | 2,5-dimetil-1-ciklopenten-1-il-                      |
| 27                  | Cl | S                               | 0 | —                  | 2-met-1-1-ciklopenten-1-il-                          |

V. táblázat

| A példa sorszáma | X  | Y                                    | n | (IB) általános képletű vegyületek |                                    |
|------------------|----|--------------------------------------|---|-----------------------------------|------------------------------------|
|                  |    |                                      |   | R <sub>1</sub>                    | R                                  |
| 28               | Cl | S                                    | 0 | —                                 | 2,6-dimetil-fenil                  |
| 29               | Br | S                                    | 1 | 6-Cl                              | 2-metil-6-etil-fenil-              |
| 30               | Br | S                                    | 2 | 5,6-diCl                          | 2-terc-butil-6-klór-fenil-         |
| 31               | Cl | O                                    | 0 | —                                 | 2-(metil-tio)-6-metil-fenil-       |
| 32               | Cl | O                                    | 1 | 4-fenil                           | 2-nitro-fenil-                     |
| 33               | Br | NH                                   | 0 | —                                 | 2-benzil-6-metil-fenil-            |
| 34               | Cl | NCH <sub>3</sub>                     | 1 | 5-furfuril                        | fenil-                             |
| 35               | Cl | N-(n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> ) | 0 | —                                 | 2-CF <sub>3</sub> -6-etil-fenil-   |
| 36               | Cl | S                                    | 3 | 4,5,6-trimetil                    | 2,3-dimetil-fenil-                 |
| 37               | Cl | S                                    | 0 | —                                 | 2-propargil-6-etil-fenil-          |
| 38               | Cl | O                                    | 1 | 4-NO <sub>2</sub>                 | 2-(metoxi-metil)-6-metil-fenil-    |
| 39               | Cl | S                                    | 0 | —                                 | 2-(2-metoxi-etoxi)-6-metil-fenil-  |
| 40               | Cl | S                                    | 1 | 4-Br                              | 2-allil-6-metoxi-fenil-            |
| 41               | Cl | S                                    | 0 | —                                 | 2-terc-butil-6-klór-fenil-         |
| 42               | Cl | S                                    | 1 | 4-etoxi                           | 2-tetrahydrofurfuril-6-etil-fenil- |
| 43               | Cl | S                                    | 0 | —                                 | 2-furfuril-6-(n-propil)-fenil-     |
| 44               | Cl | S                                    | 0 | —                                 | 2-metil-6-izobutoxi-fenil-         |
| 45               | Cl | S                                    | 0 | —                                 | 2-(trifluor-metil)-6-metil-fenil-  |

Azt tapasztaltuk, hogy a találmány szerinti herbicid készítmények különösen hatásosak rizs között tenyésző gyomnövények ellen. A VI. táblázatban bemutatjuk a találmány szerinti herbicid készítmények ázsiai rizsfajták között élő gyomnövények elleni hatását. A gyomnövények a következők:

Echinochloa crusgalli (EC)

Monochoria vaginalis (MV)

Cyperus serotius (CS)

Eleocharis kuroguwai (EK)

Sagittaria trifolia (ST)

A találmány szerinti herbicid szereket 0,28–2,24 kg/ha hatóanyag-tartományban alkalmaztuk és a kiértékelést a kezelés után 18 nappal végeztük.

VI. táblázat

| A példa sorszáma | Menny. (kg/ha) | Irtási százalék |     |     |     |     |    |
|------------------|----------------|-----------------|-----|-----|-----|-----|----|
|                  |                | rizs            | EC  | MV  | CS  | EK  | ST |
| 1                | 2,24           | 10              | 100 | 100 | 100 | 100 | 5  |
|                  | 1,12           | 0               | 100 | 100 | 100 | 100 | 5  |
|                  | 0,56           | 0               | 100 | 100 | 90  | 100 | 5  |
|                  | 0,28           | 0               | 100 | 100 | 80  | 100 | 0  |

Láthatjuk, hogy az 1. példa szerinti vegyületet hatóanyagként tartalmazó herbicid készítmények szelektív módon irtják az összes vizsgált gyomnövényt a Sagittaria trifolia kivételével még 0,28 kg/ha hatóanyag-mennyiség alkalmazása esetén is, ugyanakkor a rizst gyakorlatilag nem károsítják (vagyis 15 %-nál kisebb mértékű a károsítás) még 2,24 kg/ha hatóanyag-felhasználás esetén sem.

A találmány szerinti herbicid készítmények — ide számítva a koncentrátumokat is, amelyeket alkalmazás előtt hígítani kell — legalább egy hatóanyagot és folyékony vagy szilárd segédanyagot tartalmaznak. A készítményt úgy állítjuk elő, hogy a hatóanyagot segédanyaggal, hígítószerrel, töltőanyaggal, vívőanyaggal vagy kondicionálószerrel összekeverjük. Ily módon finom eloszlású szilárdanyagokat, granulátumokat, pelleteket, oldatokat, diszperziókat vagy emulziókat kapunk. A hatóanyagot használhatjuk más segédanyagokkal is, így finom eloszlású szilárdanyaggal, szerves eredetű folyadékkal, vízzel, nedvesítőszerrel, diszpergálószerrel, emulgeálószerrel vagy ezek kombinációjával keverve.

A találmány szerinti készítmények — különösen a folyadékok és a nedvesíthető porok — előnyösen felületaktív anyagokat is tartalmaznak olyan mennyiségben, amely elegendő ahhoz, hogy a szerek könnyen diszpergálhatók legyenek vízben vagy olajban. Felületaktív anyagoknak a készítményekbe való bevitelére nagy mértékben növeli a készítmények hatásosságát. A „felületaktív anyag” megjelölésen nedvesítőszeret, diszpergálószeret, szuszpendáló szeret és emulgeálószeret értünk. Anionos, kationos és nemionos szerek egyaránt használhatók.

Előnyösen alkalmazható nedvesítőszeret az alkil-benzol- és az alkil-naftalinszulfonátok, a szulfatált zsíralkoholok, aminok vagy savamidok, a nátrium-izotiocianát hosszú láncú savészterei, a nátrium-szulfoszukcinát-észterek, a szulfatált vagy szulfonált zsírsavészterek, a petróleumszulfonát, a szulfonált növényi olajok, az etilén-glikol, az alkil-fenolok (különösen az izooktil-fenol és a nonil-fenol) poli(oxi-etilén)-származékai, valamint a hexitolanhidridek (például a szorbitán), a zsírsavészterek polietoxilezett származékai. Előnyösen alkalmazható diszpergáló szerek a metil-cellulóz, a poli(vinil-

-alkohol), a nátrium-ligninszulfonátok, az alkil- és naptalinszulfonátok, a nátrium-naftalinszulfonát és a polimetilén-bisznaptalinszulfonát.

A nedvesíthető porok vízben diszpergálható készítmények, amelyek egy vagy több hatóanyagot, szilárd, közömbös töltőanyagot és egy vagy több nedvesítő és diszpergálószer tartalmaznak. A szilárd vivőanyagok általában ásványi eredetűek – így természetes kréták, diatomaföld – vagy szintetikusak lehetnek. Ilyen töltőanyag a kaolinit, az attapulgit-kérta és a szintetikus magnézium-szilikát. A találmány szerinti nedvesíthető por-készítmények szokásosan 0,5–60 tömegrész (előnyösen 5–20 tömegrész) hatóanyagot, 0,25–25 tömegrész (előnyösen 1–15 tömegrész) nedvesítőszert, 0,25–25 tömegrész (előnyösen 1,0–15 tömegrész) diszpergálószer és 5–95 tömegrész (előnyösen 5–50 tömegrész) közömbös szilárd töltőanyagot tartalmaznak. Kívánt esetben 0,1–2,0 tömegrész szilárd anyagot korróziógátló anyaggal vagy habzágátló anyaggal vagy mindkettővel helyettesíthetünk.

A porkoncentrátumok 0,1–60 tömeg% hatóanyagot tartalmaznak valamely alkalmas töltőanyag mellett. Ezeket a porokat felhasználás előtt 0,1–10 tömeg% töménységre hígíthatjuk.

Vizes szuszpenziókat vagy emulziókat úgy készíthetünk, hogy vízben nem oldódó hatóanyag és emulgálószer elegyét vízzel addig keverjük, ameddig homogén, nagyon finomeloszlású, stabil emulziót nem kapunk. A keletkező tömény, vizes szuszpenzióra jellemző a rendkívül kis részecskeméret, így hígítás után szórható és nagyon jó fedést biztosít. A 0,1–60 tömeg%-os, méginkább az 5–50 tömeg%-os készítmények stabilak. A felső határt a hatóanyagnak az oldószerben való oldhatósága határozza meg.

A vízzel nem elegyedő herbicid hatóanyagot vizes szuszpenziók készítésével kapszulákba zárjuk és a mikrokapszulákat vízben diszpergáljuk. Mikrokapszulákat készíthetünk oly módon is, hogy ligninszulfonát emulgálószerrel, és a vízzel nem elegyedő hatóanyagot, valamint poli(metilén-fenil-izocianát)-ot tartalmazó vizes fázist képezünk, majd a vízzel nem elegyedő fázist diszpergáljuk a vizes fázisban; ezután polifunkciós amint adunk a diszperzióhoz. Az izocianát és az aminvegyület egymással reagál és szilárd burkot alkot a vízzel nem elegyedő hatóanyag körül. Ez a burok szilárd karbamid-származékból áll és mikrokapszulát képez. A mikrokapszulába zárt hatóanyag koncentrációja általában 480–700 g/l, előnyösen 480–600 g/l, a készítmény összmenyiségére vonatkoztatva.

A koncentrátumok általában a hatóanyag vízzel nem elegyedő vagy részben elegyedő oldószerekkel alkotott oldatait, amelyek felületaktív anyagot tartalmaznak. A koncentrátumokban a hatóanyag oldására alkalmas oldószerek a dimetil-formamid, dimetil-szulfoxid, N-metil-pirrolidon, szénhidrogének és vízzel nem elegyedő éterek, észterek vagy ketonok. Nagy töménységű folyékony koncentrátumokat úgy is készíthetünk, hogy a hatóanyagot oldószerben oldjuk és az oldatot utána hígítjuk, például kerozinnal, így permetezhető anyagot kapunk.

A tömény kompozíciók általában 0,1–95 tömegrész (előnyösen 5–60 tömegrész) hatóanyagot, körülbelül (0,25–50 tömegrész) hatóanyagot, körülbelül 0,25–50 tömegrész (előnyösen 1–25 tömegrész) felületaktív

anyagot és szükség esetén 4–94 tömegrész oldószert tartalmaznak.

A granulátumok fizikailag stabilis részecskékből álló készítmények, amelyek a hatóanyagot valamely finom eloszlású, közömbös töltőanyagra felvive tartalmazzák. A hatóanyag leoldódásának, illetőleg felszívódásának biztosítására felületaktív anyagot is adunk a készítményhez. Természetes kréták, pirofillit, illit és vermikulit például jól használhatók szemcsézett ásványi töltőanyagként. Az előnyösen alkalmazható töltőanyagok abszorbeálni képesek, előformált pórusos részecskék. Ilyenek az előformált és szitált attapulgit-szemcsék vagy a hő hatására expandált vermikulit-részecskék és a finomeloszlású kréták, így a kaolinkréták, hidratált attapulgit vagy a bentonitkréták. Ezeket a töltőanyagokat a hatóanyaggal együtt szórjuk vagy keverjük be a granuláló dobba és így alakítjuk ki a herbicid hatású granulátumokat.

A találmány szerinti szemcsézett készítmények 0,1–30 tömegrész hatóanyagot tartalmaznak 100 tömegrész krétára számítva és 0–5 tömegrész felületaktív anyagot foglalnak magukban 100 tömegrész szemcsézett krétára vonatkoztatva.

#### 25 Heterociklusos nitrogén/kén-származékok

2-klór-4-etil-amino-6-izopropil-amino-s-triazin,  
2-klór-4,6-bis(izopropil-amino)-s-triazin,  
2-klór-4,6-bis(etil-amino)-s-triazin,  
30 3-izopropil-1H-2,1,3-benzotriadiazin-4-(3H)-on-2,2-dioxid,  
3-amino-1,2,4-triazol,  
6,7-dihidrodipirido(1,2-a:2',1'-c)-pirazidinium-só,  
5-t-rom-3-izopropil-6-metil-uracil,  
1,1'-dimetil-4,4'-bipiridinium.

35

#### Karbamidok

N'-(4-klór-fenoxi)fenil-N,N-dimetil-karbamid,  
40 N,N-dimetil-N'-(3-klór-4-metil-fenil)-karbamid,  
3-(3,4-diklór-fenil)-1,1-dimetil-karbamid,  
1,3-dimetil-3-(2-benzotiazolil)-karbamid,  
3-(p-klór-fenil)-1,1-dimetil-karbamid,  
1-butyl-3-(3,4-diklór-fenil)-1-metil-karbamid.

45

#### Karbamátok/tiokarbamátok

2-klór-allil-dietil-ditiokarbamát,  
50 S-(4-klór-benzil)-N,N-dietil-ditiokarbamát,  
izopropil-N-(3-klór-fenil)karbamát,  
S-2,3-diklór-allil-N,N-diizopropil-tiokarbamát,  
etil-N,N-dipropil-tiokarbamát,  
S-propil-dipropil-tiokarbamát.

55

#### Acetamidok/acetanilidek/anilinek/amidok

2-klór-N,N-diallil-acetamid,  
60 N,N-dimetil-2,2-difenil-acetamid,  
N-(2,4-dimetil-5-[(trifluor-metil)-szulfonil]-amino)-fenil-acetamid,  
N-izopropil-2-klór-acetanilid,  
2',6'-diethyl-N-metoxi-metil-2-klór-acetanilid,  
65 2'-metil-6'-etil-N-(2-metoxi-prop-2-il)-2-klór-acetanilid,



$\alpha,\alpha,\alpha$ -trifluor-2,6-dinitro-N,N-dipropil-p-toluidin,  
N-(1,1-dimetil-propinil)-3,5-diklór-benzamid.

*Savak(észterek)alkoholok*

2,2-diklór-propionsav,  
2-metil-4-klór-fenoxi-ecetsav,  
2,4-diklór-fenoxi-ecetsav,  
metil-2-[4-(2,4-diklór-fenoxi)fenoxi]-propionát,  
3-amino-2,5-diklór-benzoesav,  
2-metoxi-3,6-diklór-benzoesav,  
2,3,6-triklór-fenilecetsav,  
N-1-naftil-ftalamsav,  
nátrium-5-[2-klór-4-(trifluor-metil)fenoxi]-2-nitro-ben-  
zoát,  
4,6-dinitro-o-szek-butyl-fenol,  
N-(foszfonometil)glicin és 1–6 szénatomos monoalkil-  
aminja, alkálifémsója, valamint ezek kombinációja.

*Éterek*

2,4-diklór-fenil-4-nitro-fenil-éter,  
2-klór- $\alpha,\alpha,\alpha$ -trifluor-p-tolil-3-etoxi-4-nitro-difenil-éter.

*Különbözők*

2,6-diklór-benzonitril,  
mononátriumsó-metánarzonát,  
dinátrium-metánarzonát.

A találmány szerinti készítményekkel kombináció-  
ban használható műtrágyák például az ammónium-nit-  
rát, karbamid, kálisó és a szuperfoszfát. Kombinálhatók  
a készítmények kompozttal, természetes trágyával, hu-  
musszal, homokkal is.

Az előzőekben leírt herbicid készítmények néhány  
kiviteli alakját az alábbiakban mutatjuk be.

| I. Emulgálható koncentrátumok                                                                                                                                                                                                                                                             | tömeg%                                                 |
|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------|
| A. Az 1. példa szerinti vegyület GAFAC<br>RE-610 (GAF Corp. által előállított<br>kereskedelmi termék, amely szerves foszfát<br>komplexet tartalmaz<br>Tergitol XH<br>(kereskedelmi termék, amely<br>poli(oxi-etilén)/poli(oxi-propilén)<br>polimert tartalmaz<br>fenol<br>monoklór-benzol | 1,0<br>5,59<br><br>1,11<br><br>5,34<br>77,16<br>100,00 |
| B. A 4. példa szerinti vegyület<br>GAFAC RE-610<br>Tergitol XH<br>fenol<br>monoklór-benzol                                                                                                                                                                                                | 25,00<br>5,00<br>1,60<br>4,75<br>63,65<br>100,00       |

| II. Folyadékok                                                                                                                            | tömeg%                                              |
|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------|
| A. Az 1. példa szerinti vegyület<br>metil-cellulóz<br>szilika-aerogél<br>nátrium-ligninszulfonát<br>nátrium-N-metil-N-oleil-taurát<br>víz | 25,00<br>0,3<br>1,5<br>3,5<br>2,0<br>66,7<br>100,00 |
| B. A 4. példa szerinti vegyület<br>metil-cellulóz<br>szilika-aerogél<br>nátrium-ligninszulfonát<br>nátrium-N-metil-N-oleil-taurát<br>víz  | 45,0<br>0,3<br>1,5<br>3,5<br>2,0<br>47,3<br>100,00  |
| III. Nedvesíthető porok                                                                                                                   | tömeg%                                              |
| A. A 2. példa szerinti vegyület<br>nátrium-ligninszulfonát<br>nátrium-N-metil-N-oleil-taurát<br>amorf szilícium-dioxid (szintetikus)      | 25,0<br>3,0<br>1,0<br>71,0<br>100,00                |
| B. A 3. példa szerinti vegyület<br>nátrium-dioktil-szulfoszukcinát<br>kalcium-ligninszulfonát<br>amorf szilícium-dioxid (szintetikus)     | 80,0<br>1,25<br>2,75<br>16,00<br>100,00             |
| C. A 6. példa szerinti vegyület<br>nátrium-liginiszulfonát<br>nátrium-N-metil-N-oleil-taurát<br>kaolinit-kréta                            | 10,0<br>3,0<br>1,0<br>86,0<br>100,0                 |
| IV. Vízoldható porok                                                                                                                      | tömeg%                                              |
| A. Az 1. példa szerinti vegyület<br>nátrium-dioktil-szulfoszukcinát<br>szilika-aerogél<br>metilénkék<br>nátrium-nhidrogén-karbonát        | 10,0<br>2,0<br>5,0<br>0,1<br>82,9<br>100,00         |
| B. A 4. példa szerinti vegyület<br>ammónium-foszfát                                                                                       | 90,0<br>10,0<br>100,0                               |
| V. Porok                                                                                                                                  | tömeg%                                              |
| A. A 2. példa szerinti vegyület<br>attapulgit                                                                                             | 2,0<br>98,0<br>100,00                               |
| B. A 3. példa szerinti vegyület<br>montmorillonit                                                                                         | 60,0<br>40,0<br>100,0                               |

|                                  |        |
|----------------------------------|--------|
| C. A 6. példa szerinti vegyület  | 30,0   |
| etilénglikol                     | 1,0    |
| bentonit                         | 69,0   |
|                                  | 100,0  |
| D. 10. példa szerinti vegyület   | 1,0    |
| diatomaföld                      | 99,0   |
|                                  | 100,0  |
| VI. Granulátumok                 | tömeg% |
| A. Az 1. példa szerinti vegyület | 15,0   |
| granulált attapulgit             | 85,0   |
|                                  | 100,0  |
| B. A 4. példa szerinti vegyület  | 30,0   |
| diatomaföld                      | 70,0   |
|                                  | 100,0  |
| C. A 6. példa szerinti vegyület  | 1,0    |
| etilén-glikol                    | 5,0    |
| metilénkék                       | 0,1    |
| pirofillit                       | 93,9   |
|                                  | 100,0  |
| D. A 10. példa szerinti vegyület | 5,0    |
| pirofillit                       | 95,0   |
|                                  | 100,0  |

A találmány szerinti készítmények alkalmazása során a (I) általános képletű acetanilid-származékokat tartalmazó készítményeket por formájában vagy vizes közegben rávisszük a növénynek benőtt talajra. A folyékony és különösen a szilárd készítményeket hagyományos módszerekkel és eszközökkel, például porszórókkal, gépi és kézi permetezőkkal és porlasztókkal visszük rá a talajra. A készítményeket alkalmazhatjuk repülőgépekről kiszórva is por vagy permet alakjában. A találmány szerinti készítményeket vízben élő növények esetében úgy használjuk, hogy a készítményeket a vizes közegbe visszük azon a részen, ahol a vízinövényeket akarjuk irtani.

A felhasználandó hatóanyagmennyiség számos tényező függvénye, így függ a növényfajtától, azok fejlődési állapotától, a talaj típusától és állapotától, az eső mennyiségétől és az alkalmazott acetamid-származék hatóanyagától. Szelektív, kikelés előtti alkalmazásnál a talajra felvitt mennyiség 0,02–11,2 kg/ha, előnyösen 0,04–5,60 kg/ha, általában 1,12–5,6 kg/ha.

A „talaj” megjelölést a legszélesebb értelemben használjuk, ideszámítva a Webster's New International Dictionary, második kiadásában, [(Unabridged (1961))] ismertett hagyományos „talaj”-okat. A talaj megjelölés érvényes minden olyan anyagra és közegre, amelyekben vegetáció létezhet, gyökér fejlődhet, így nem csupán a „föld”-re vonatkozik, hanem magában foglalja a komposztot, természetes trágyát, iszapos üledéket, humuszt, homokot és hasonlókat, amelyek alkalmasak arra, hogy a növények bennük fejlődjenek.

A találmány nem korlátozódik csupán a példák szerinti konkrét készítményekre.

## Szabadalmi igénypontok

- Herbicide készítmények, *azzal jellemezve*, hogy hatóanyagként 0,1–85 tömeg% mennyiségben olyan 2-halogén-acetamid- vagy 2-halogén-acetanilid-származékokat tartalmaznak, amelyeknek (I) általános képletében X jelentése klóratom; R jelentése 5–7 szénatomos cikloalkenil- vagy fenilcsoport, amely csoportok adott esetben egymástól függetlenül egy vagy két 1–6 szénatomos alkilcsoporttal vagy 1–4 szénatomos alkoxycsoporttal lehetnek szubsztituálva; Y jelentése oxigén- vagy kénatom; R<sub>1</sub> jelentése hidrogénatom, halogénatom vagy 1–4 szénatomos alkoxycsoport, szilárd vagy folyékony vivőanyagok – célszerűen diatomaföld és monoklór-benzol – és felületaktív anyag, célszerűen polioxietilén-polioxipropilén polimer – mellett.
- Az 1. igénypont szerinti készítmények, *azzal jellemezve*, hogy hatóanyagként olyan 2-halogén-acetamid-származékokat tartalmaznak, amelyeknek (I) általános képletében R jelentése 1–6 szénatomos alkilcsoporttal helyettesített 1-cikloalken-1-il-csoport, R<sub>1</sub> hidrogénatom, X jelentése klóratom és Y jelentése kénatom.
- A 2. igénypont szerinti készítmény, *azzal jellemezve*, hogy hatóanyagként N-(2,6-dimetil-ciklohexen-1-il)-N-[(2-oxo-3(2H)benzotiazolil)-metil]-2-klór-acetamidot tartalmaz.
- Az 1. igénypont szerinti készítmények, *azzal jellemezve*, hogy hatóanyagként olyan 2-halogén-acetanilid-származékokat tartalmaznak, amelyeknek (I) általános képletében R jelentése 1–6 szénatomos alkil- vagy alkoxycsoporttal helyettesített fenilcsoport, R<sub>1</sub> hidrogénatom, X klóratom és Y kénatom.
- A 4. igénypont szerinti készítmény, *azzal jellemezve*, hogy hatóanyagként N-[2-oxo-3(2H)benzotiazolil)-metil]-2'-metoxi-6'-metil-2-klór-acetanilidet tartalmaz.
- A 4. igénypont szerinti készítmény, *azzal jellemezve*, hogy hatóanyagként N-[(2-oxo-3(2H)benzotiazolil)-metil]-2',6'-dietyl-2-klór-acetanilidet tartalmaz.
- Eljárás olyan 2-halogén-acetamid és 2-halogén-acetanilid-származékok előállítására, amelyeknek (I) általános képletében X jelentése klóratom; R jelentése 5–7 szénatomos cikloalkenil- vagy fenilcsoport, amely csoportok adott esetben egymástól függetlenül egy vagy két 1–6 szénatomos alkilcsoporttal vagy 1–4 szénatomos alkoxycsoporttal lehetnek szubsztituálva; Y jelentése oxigén- vagy kénatom; R<sub>1</sub> jelentése hidrogénatom, halogénatom vagy 1–4 szénatomos alkoxycsoport; *azzal jellemezve*, hogy (II) általános képletű acetamid- vagy acetanilidszármazékot – a képletben X<sub>1</sub> jelentése halogénatom, X és R jelentése a fenti – (III) általános képletű benzotiazolin- vagy benzoxazolin-származékkal – a képletben Y és R<sub>1</sub> jelentése a tárgyi körben megadottal azonos – bázis és adott esetben fázis-transzfer katalizátor jelenlétében reagáltatunk.
- A 7. igénypont szerinti eljárás, *azzal jellemezve*, hogy bázisként alkálifém-hidroxidot használunk.
- A 8. igénypont szerinti eljárás, *azzal jellemezve*, hogy alkálifém-hidroxidként nátrium-hidroxidot alkalmazunk.

10. A 7. igénypont szerinti eljárás, *azzal jellemezve*, hogy fázis-transzfer katalizátort használunk.

11. A 10. igénypont szerinti eljárás, *azzal jellemezve*, hogy fázis-transzfer katalizátorként valamely kvaterner ammóniumsót alkalmazunk.

12. A 11. igénypont szerinti eljárás, *azzal jellemezve*, hogy kvaterner sóként benzil-trietil-ammonium-kloridot vagy -bromidot használunk.

13. A 8–12. igénypontok bármelyike szerinti eljárás, olyan 2-halogén-acetamid-származékok előállítására, amelyeknek (I) általános képletében X jelentése klóratom, R 1–6 szénatomos alkilcsoporttal helyettesített 1-cikloalken-1-il-csoport, R<sub>1</sub> hidrogénatom és Y kénatom, *azzal jellemezve*, hogy kiindulási anyagként olyan acetamid- és benzotiazolin-származékot használunk, amelyeknek (II) és (III) általános képletében X, X<sup>1</sup>, R és Y jelentése a fentiekben megadottal azonos.

14. A 13. igénypont szerinti eljárás N-(2,6-dimetil-1-ciklohexen-1-il)-N-[(2-oxo-3(2H)benzotiazolil)-metil]-2-klór-acetamid előállítására, *azzal jellemezve*, hogy kiindulási anyagként 2-klór-N-(2,6-dimetil-1-ciklohexen-1-

-il)-acetamidot és 3-(klór-metil)-2-benzotiazolinont alkalmazunk.

15. A 8–11. igénypontok bármelyike szerinti eljárás, olyan 2-halogén-acetanilid-származékok előállítására, amelyeknek (I) általános képletében X jelentése klóratom, R jelentése 1–6 szénatomos alkil- vagy 1–4 szénatomos alkoxicsoporthal helyettesített fenilcsoport, R<sub>1</sub> az 1. igénypontban megadott és Y kénatom, *azzal jellemezve*, hogy olyan acetanilid- és benzotiazolin-származékokat alkalmaznak, amelyeknek (II) és (III) általános képletében X, X<sup>1</sup>, R és Y jelentése a fenti.

16. A 15. igénypont szerinti eljárás [(2-oxo-3(2H)-benzotiazolil)-metil]-2'-metoxi-6'-metil-2-klór-acetanilid előállítására, *azzal jellemezve*, hogy kiindulási anyagként N-(klór-metil)-2'-metoxi-6'-metil-2-klór-acetanilidet és benzotiazolin-2-ont használunk.

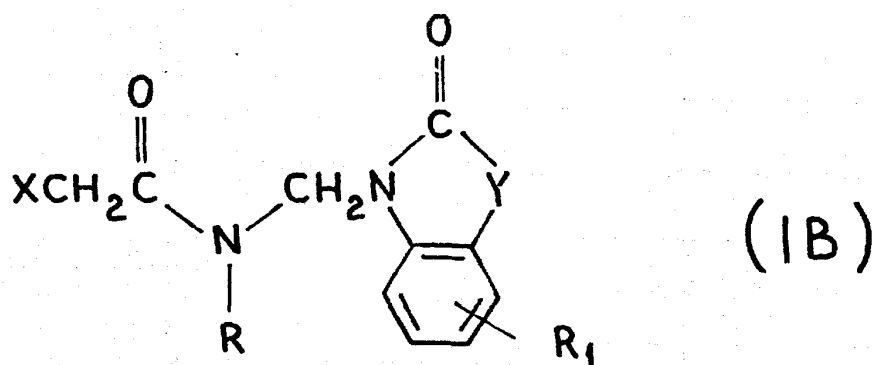
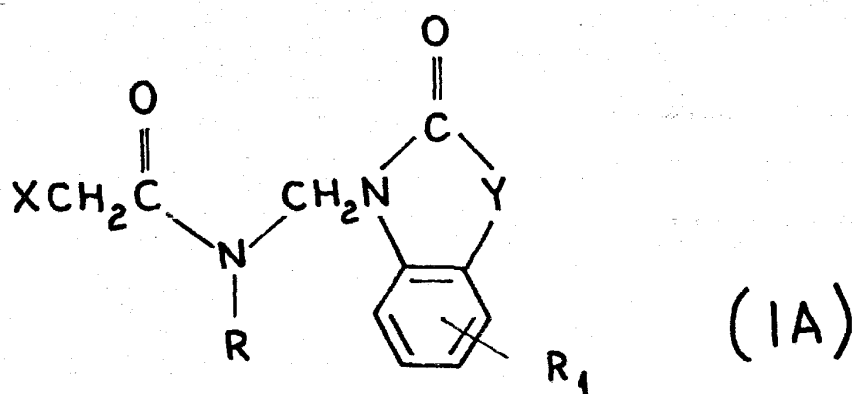
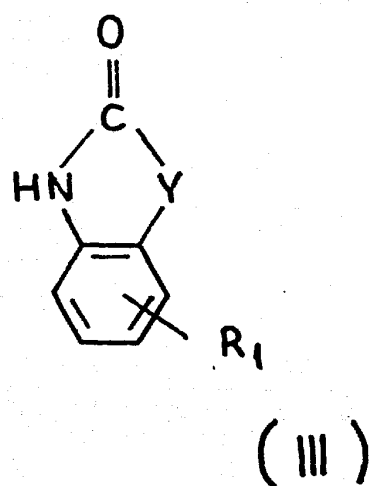
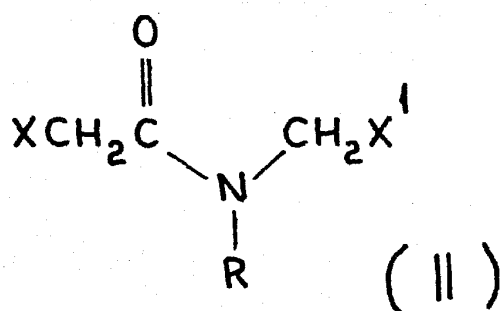
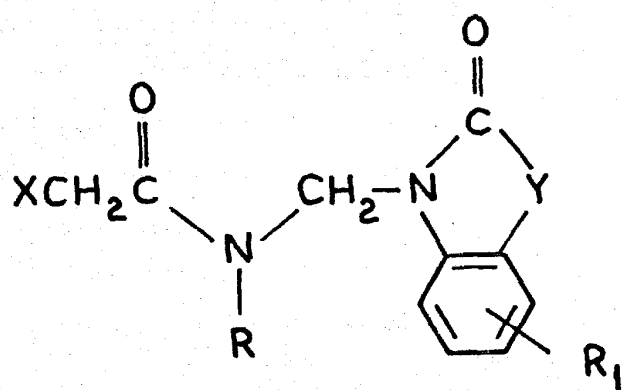
17. A 15. igénypont szerinti eljárás, N-[(2-oxo-3(2H)-benzotiazolil)-metil]-2',6'-dietyl-2-klór-acetanilid előállítására, *azzal jellemezve*, hogy kiindulási anyagként N-(klór-metil)-2',6'-dietyl-2-klór-acetanilidet és benzotiazolin-2-ont használunk.

---

1 db ábra

---

NSZO<sub>4</sub>: A 01 N 37/18;  
 A 01 N 43/74;  
 A 01 N 43/48;  
 C 07 C 103/127;  
 C 07 D 263/58;  
 C 07 D 277/68;  
 C 07 D 235/26



Kiadja az Országos Találmányi Hivatal  
 A kiadásért felel: Himer Zoltán osztályvezető  
 Megjelent a Műszaki Könyvkiadó gondozásában

COPYLUX Nyomdaipari és Sokszorosító Kiszövetkezet