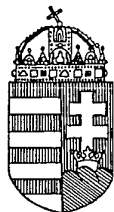


(19) Országkód:

HU



**MAGYAR
KÖZTÁRSASÁG**

**ORSZÁGOS
TALÁLMÁNYI
HIVATAL**

SZABADALMI LEÍRÁS

(11) Lajstromszám:

208 610 B

(21) A bejelentés száma: 3273/89
(22) A bejelentés napja: 1989. 05. 17.
(30) Elsőbbségi adatok:
212 668 1988. 06. 28. US
(86) Nemzetközi bejelentési szám: PCT/US 89/02072
(87) Nemzetközi közzétételi szám: WO 90/00007

(51) Int. Cl.⁵

A 01 N 25/34
A 01 N 25/08

(40) A közzététel napja: 1991. 10. 28.
(45) A megadás meghirdetésének dátuma a Szabadalmi
Közlönyben: 1993. 12. 28. SZKV 93/12

(72) Feltaláló:

Moore, Earl Phillip, Anderson, South Carolina (US)

(73) Szabadalmas:

E. I. Du Pont de Nemours and Co.,
Wilmington, Delaware (US)

(74) Képvisező:

Danubia Szabadalmi és Védjegy Iroda Kft.,
Budapest

(54) **Tabletta formájú peszticid vagy növekedésszabályozó készítmény**

(57) KIVONAT

A találmány tárgya tablettá formájú készítmény, amelynek összetétele:

- i) 20–75 tömeg% peszticid vagy növekedésszabályozó hatóanyag, amelynek olvadáspontja legalább 100 °C, és vízdékonysága 20 °C hőmérsékleten legfeljebb 5 tömeg%,
- ii) 25–80 tömeg%, a hatóanyaggal komplementer hordozóanyag-rendszer, amelynek összetétele:
 - a) 5–20 tömeg% dibázisos vagy tribázisos szerves karbonsav vagy ilyenek elegye,
 - b) 7–50 tömeg% ammónium- vagy alkálifém-karbonát vagy -hidrogén-karbonát vagy ilyenek elegye,

- c) 0,5–20 tömeg% diszpergálószer,
- d) 0,1–5 tömeg% vízben oldhatatlan, keresztkötéses poli(vinil-pirrolidon),
- e) 0,1–5 tömeg% anionos vagy nemionos nedvesítőszert,
- iii) a 100 tömeg%-hoz szükséges mennyiségű hordozóanyag és adott esetben adalékanyag, ahol a készítmény vízben diszpergálva 0,30 mm-es szitán áthaladó diszperziót képez, és sűrűsége nagyobb mint 1,00.

A találmány tárgya speciális peszticid vagy növekedésszabályozó készítmény, amely tablettá formájú.

Különböző tablettá formájú készítmények ismertek (például 2 139 893, 2 184 946 számú nagy-britanniai szabadalmi leírás, 4 182 620 számú USA-beli szabadalmi leírás és 5 1088 641 számú japán közrebecsátási irat).

A GB 2 139 893 sz. irat 1–20 t% hatóanyagot tartalmazó peszticid készítményt ismertet. A felsorolt hatóanyagok vagy alacsony (100 °C alatti) olvadáspontú szilárd anyagok vagy folyadékok, ahol egyedüli kivétel a deltametrin. Az ismert készítmények hátránya, hogy különösen hideg vízben lassan esnek szét és lassan diszpergálódnak, és így a hatóanyag nem hozzáférhető. A találmány feladata, hogy vízben oldhatatlan vagy nagyon rosszul oldódó hatóanyagokból olyan tablettá formájú készítményt dolgozzunk ki, amely hideg vízben is gyorsan szétesik, és jól diszpergálódik.

A találmány tárgya tehát tablettá formájú peszticid készítmény, amely

i) 20–75 tömeg% mennyiségben legalább 100 °C olvadáspontú, és 20 °C hőmérsékletű semleges, vízben legfeljebb 5 tömeg% mennyiségben oldódó peszticid hatóanyagot,

ii) 25–80 tömeg% mennyiségben a peszticid hatóanyaggal komplementer hordozóanyagot és

iii) a 100 tömeg%-hoz szükséges mennyiségben hordozóanyagot és adott esetben adalékanyagot tartalmaz.

A fenti ii) alatt említett hordozóanyag rendszer a készítmény össztömegére vonatkoztatva a következő komponensekből áll:

a) 5–20 tömeg% dibázisos vagy tribázisos szerves karbonsav vagy ilyenek elegye,

b) 7–50 tömeg% ammónium- vagy alkálifém-karbonát vagy -hidrogén-karbonát vagy ilyenek elegye,

c) 0,5–20 tömeg% diszpergálószer,

d) 0,1–5 tömeg% vízben oldhatatlan, keresztkötéses poli(vinil-pirrolidon), és

e) 0,1–5 tömeg% anionos vagy nemionos nedvesítőszert.

A hordozóanyag rendszer jellegzetessége, hogy az alkalmazott a)–e) komponensek között a megadott mennyiségi határokon olyan kölcsönhatás alakul ki, amely biztosítja a peszticid hatóanyag gyors felszabadulását és finom eloszlását.

A „tablettá készítmény” kifejezés kiterjed a fenti

összetételű tablettára, valamint az azonos összetételű, de nem tablettá formájú készítményekre is.

Peszticid hatóanyagként alkalmazhatók herbicidok, fungicidok, baktericidok, inszekticidok, nematocidok, akaricidok, növekedésszabályozók és ezek elegyei.

Dibázisos és tribázisos szerves karbonsavként előnyösen alkalmazható a citromsav, fumársav, ftálsav, maleinsav, almasav, oxálsav, adipinsav, glutársav, 2-metil-glutársav, borostyánkősav és borkősav, valamint ezek elegyei. Karbonátként vagy hidrogén-karbonátként előnyösen alkalmazható a lítium-, nátrium- vagy kálium-karbonát vagy -hidrogén-karbonát, valamint ezek elegyei.

Diszpergálószerként alkalmazható például naftalin-formaldehid kondenzátum nátriumsó, naftalinszulfonsav kondenzátum nátrium-, kálium- vagy kalciumsó, lignin-szulfonát lítium-, nátrium-, kálium-, kalcium- vagy ammóniumsó, előnyösen Polyfon H és Lignosol TSF, nátrium-, kálium- és ammónium-poliakrilát és -karboxilát, például Tamol 731 SD, maleinsavanhidrid izobutilén kopolimer nátriumsója, továbbá vízben oldható, nemionos polimerek, így poli(vinil-pirrolidon), poli(etilén-oxid) és cellulózszármazékok. Diszpergálószerként előnyösen alkalmazható a naftalin-szulfonsav kondenzátum nátrium-, kálium-, ammónium- vagy kalciumsója, ezenkívül elsősorban az ammóniumsója, például Lomar PWA.

Vízben oldhatatlan, keresztkötéses poli(vinil-pirrolidon)-ként általában valamely kroszpozidon-származékot alkalmazunk, példaként említhető a Polyplasdone XL 10.

Anionos nedvesítőszerként alkalmazható például alkil-benzolszulfonát, alkil- és dialkil-naftalinszulfonát, alkil- és alkohol-szulfát, szulfoalkil-amid, karboxilát, α -olefin-szulfonát és dialkil-szulfoszukcinát. Nemionos nedvesítőszerként alkalmazható például acetilénos diol, etilén-oxid/propilén-oxid kopolimer, alkil-fenol-etoxilát, zsírsav-etoxilát, alkohol-etoxilát, szorbitán-zsírsav-észter-etoxilát és kasztorolaj-etoxilát. Nedvesítőszerként előnyösen alkalmazható a nátrium-dialkil-szulfoszukcinát, így nátrium-diizobutil-szulfoszukcinát (Monawet MB-100), nátrium-diamil-szulfoszukcinát és nátrium-diciklohexil-szulfoszukcinát.

Az előnyösen alkalmazható peszticid hatóanyagokat az I. táblázatban soroljuk fel. A megnevezett hatóanyagok vízzoldékonysága 20 °C hőmérsékleten nem haladja meg az 5 tömeg%-ot.

I. táblázat

Vegyület száma	Kereskedelmi név	Op. (°C)	Kémiai név
<i>Herbicidok</i>			
1.	acifluorfen	142–160	5-[2-klór-4-(trifluor-metil)-fenoxi]-2-nitrobenzoesav
2.	azulam	142–144	metil-[(4-amino-fenil)-szulfonil]-karbamát
3.	atrazin	175–177	6-klór-N-etil-N'-(1-metil-etil)-1,3,5-triazin-2,4-diamin
4.	benszulfuron-metil	185–188	2-[[[(4,6-dimetoxi-2-pirimidinil)-amino]-karbonil]-amino]-szulfonil]-metil]-benzoesav-metil-észter

Vegyület száma	Kereskedelmi név	Op. (°C)	Kémiai név
5.	bentazon	137–139	3-(1-metil-etil)-(1H)-2,1,3-benzotiadiazin-4(3H)-on-2,2-dioxid
6.	bromacil	158–159	5-bróm-6-metil-3-(1-metil-propil)-2,4(1H,3H)-pirimidin-dion
7.	bromoxinil	194–195	3,5-dibróm-4-hidroxi-benzonitril
8.	klóramben	200–201	3-amino-2,5-diklór-benzoészter
9.	klórimuron-etil	>100	2-[[[(4-klór-6-metoxi-2-pirimidinil)-amino]-karbonil]-amino]-szulfonil]-benzoészter
10.	klóroxuron	151–152	N'-[4-(4-klór-fenoxi)-fenil]-N,N-dimetil-karbamid
11.	klórszulfuron	174–178	2-klór-N-[[[(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)-amino]-karbonil]-benzol-szulfonamid
12.	klórtoluron	147–148	N'-(3-klór-4-metil-fenil)-N,N-dimetil-karbamid
13.	klomazon	151–152	2-[(2-klór-fenil)-metil]-4,4-dimetil-3-izoxazolidinon
14.	cianazin	166–167	2-[[[4-klór-6-(etil-amino)-1,3,5-triazin-2-il]-amino]-2-metil-propán-nitril
15.	dazomet	104–105	tetrahidro-3,5-dimetil-2H-1,3,5-tiadiazin-2-tion
16.	desmedifan	120	etil-[3-[[[(fenil-amino)-karbonil]-oxi]-fenil]-karbamát
17.	dicamba	114–116	3,6-diklór-2-metoxi-benzoészter
18.	diklobenil	139–145	2,6-diklór-benzonitril
19.	diklórprop	117–118	(±)-2-(2,4-diklór-fenoxi)-propánsav
20.	difenamid	134–135	N,N-dimetil- α -fenil-benzol-acetamid
21.	dipropetrin	104–106	6-(etil-tio)-N,N'-bis(1-metil-etil)-1,3,5-triazin-2,4-diamin
22.	diuron	158–159	N'-(3,4-diklór-fenil)-N,N-dimetil-karbamid
23.	tiameturon	>100	3-[[[(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)-amino]-karbonil]-amino]-szulfonil]-2-tiofén-karbonsav-metil-észter
24.		>100	2-[[[[N-(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)-N-metil-amino]-karbonil]-amino]-szulfonil]-benzoészter
25.	fenac	156	2,3,6-triklór-benzol-ecetsav
26.	fenuron	133–134	N,N-dimetil-N'-fenil-karbamid
27.	fluometuron	163–164	N,N-dimetil-N'-[3-(trifluor-metil)-fenil]-karbamid
28.	fluridon	151–154	1-metil-3-fenil-5-[3-(trifluor-metil)-fenil]-4(1H)-piridinon
29.	fomesafen	220–221	5-[2-klór-4-(trifluor-metil)-fenoxi]-N-(metil-szulfonil)-2-nitrobenzamid
30.	glifozát	200	N-(foszfonometil)-glicin
31.	hexazinon	115–117	3-ciklohexil-6-(dimetil-amino)-1-metil-1,3,5-triazin-1,4(1H,3H)-dion
32.	imazametabenz	>100	6-(4-izopropil-4-metil-5-oxo-2-imidazolin-2-il)-m-toluolsav-metil-észter és 6-(4-izopropil-4-metil-5-oxo-2-imidazolin-2-il)-p-toluolsav-metil-észter
33.	imazakvin	219–222	2-[4,5-dihidro-4-metil-4-(1-metil-etil)-5-oxo-1H-imidazol-2-il]-3-kinolin-karbonsav

Vegyület száma	Kereskedelmi név	Op. (°C)	Kémiai név
34.	imazetapir	172–175	(±)-2-[4,5-dihidro-4-metil-4-(1-metil-etil)-5-oxo-1H-imidazol-2-il]-5-etil-3-piridin-karbonsav
35.	ioxinil	209	4-hidroxi-3,5-dijódbenzonitril
36.	izoproturon	155–156	N-(4-izopropil-fenil)-N',N'-dimetil-karbamid
37.	izouron	119–120	N'-[5-(1,1-dimetil-etil)-3-izoxazolil]-N,N-dimetil-karbamid
38.	izoxaben	176–179	N-[3-(1-etil-1-metil-propil)-5-izoxazolil]-2,6-dimetoxi-benzamid
39.	karbutilát	176–178	3-[[[(dimetil-amino)-karbonil]-amino]-fenil-(1,1-dimetil-etil)-karbamát
40.	lenacil	316–317	3-ciklohexil-6,7-dihidro-1H-ciklopentapirimidin-2,4(3H,5H)dion
41.	MGPA	100–115	(4-klór-2-metil-fenoxi)-ecetsav
42.	MGPB	100	4-(4-klór-2-metil-fenoxi)-butánsav
43.	mefluidid	183–185	N-[2,4-dimetil-5-[[trifluor-metil]-szulfonil]-amino]-fenil]-acetamid
44.	metabenz-tiazuron	119–120	1,3-dimetil-3-(2-benzotiazolil)-karbamid
45.	metazol	123–124	2-(3,4-diklór-fenil)-4-metil-1,2,4-oxadiazolidin-3,5-dion
46.	metribuzin	125–126	4-amino-6-(1,1-dimetil-etil)-3-(metil-tio)-1,2,4-triazin-5(4H)-on
47.	metszulfuron-metil	163–166	2-[[[[[4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il]-amino]-karbonil]-amino]-szulfonil]-benzoesav-metil-észter
48.	monuron	174–175	N'-(4-klór-fenil)-N,N-dimetil-karbamid
49.	naphtalam	185	2-[[1-naftalenil-amino]-karbonil]-benzoesav,
50.	neburon	102–103	1-butyl-3-(3,4-diklór-fenil)-1-metil-karbamid
51.	nitralin	151–152	4-(metil-szulfonil)-2,6-dinitro-N,N-dipropil-anilin
52.	norflurazon	174–180	4-klór-5-(metil-amino)-2-[3-(trifluor-metil)-fenil]-3(2H)-piridazinon
53.	orizalin	141–142	4-(dipropil-amino)-3,5-dinitro-benzol-szulfonamid
54.	perfluidon	142–144	1,1,1-trifluor-N-[2-metil-4(fenil-szulfonil)-fenil]-metán-szulfonamid
55.	fenmedifam	143–144	3-[(metoxi-karbonil)-amino]-fenil-(3-metil-fenil)-karbamát
56.	pikloram	>215 (bomlik)	4-amino-3,5,6-triklór-2-piridin-karbonsav
57.	prometrin	118–120	N,N'-bisz(1-metil-etil)-6-(metiltio)-1,3,5-triazin-2,4-diamin
58.	pronamid	155–156	3,5-diklór-N-(1,1-dimetil-2-propinil)-benzamid
59.	propazin	212–214	6-klór-N,N'-bisz(1-metil-etil)-1,3,5-triazin-2,4-diamin
60.	pirazon	205–206	5-amino-4-klór-2-fenil-3(2H)-piridazinon
61.	sziduron	133–138	N-(2-metil-ciklohexil)-N'-fenil-karbamid
62.	szimazin	225–227	6-klór-N,N'-dietyl-1,3,5-triazin-1,4-diamin
63.	szulfometuron-metil	182–189	2-[[[[[4,6-dimetil-2-pirimidinil]-amino]-karbonil]-amino]-szulfonil]-benzoesav-metil-észter
64.	tebutiuron	161–164	N-[5-(1,1-dimetil-etil)-1,3,4-tiadiazol-2-il]-N,N'-dimetil-karbamid

Vegyület száma	Kereskedelmi név	Op. (°C)	Kémiai név
65.	terbacil	175–177	5-klór-3-(1,1-dimetil-etil)-6-metil-2,4(1H,3H)-pirimidindion
66.	terbutilazin	177–179	2-(terc-butil-amino)-4-klór-6-(etil-amino)-s-triazin
67.	terbutrin	104–105	N-(1,1-dimetil-etil)-N'-etil-6-(metil-tio)-1,3,5-triazin-2,4-diamin
68.	triklopir	148–150	[(3,5,6-triklór-2-piridinil)-oxi]-ecetsav
69.	2,4-D	140	(2,4-diklór-fenoxi)-ecetsav
70.	2,4-DB	119–120	4-(2,4-diklór-fenoxi)-butánsav
71.	triaszulfuron	>100	3-(6-metoxi-4-metil-1,3,5-triazin-2-il)-1-[2-(2-klór-etoxi)-fenil-szulfonil]-karbamid
72.	pirimisulfuron	>100	[2-/3-(4,6-bisz(difluor-metoxi)-pirimidin-2-il)-ureido-szulfonil]-benzoesav-metil-észter]
73.	–	>100	[2-/3-(4,6-bisz(difluor-metoxi)-pirimidin-2-il)-ureido-szulfonil]-benzoesav-metil-észter]
74.	NC-311	170–172	[5-pirazol-szulfonamid-N-[(4-metoxi-6-metil-pirimidin-2-il)-amino-karbonil]-4-metoxi-karbonil-1-metil]
75.	–	160–162	N-[[[(4,6-dimetoxi-2-pirimidinil)-amino]-karbonil]-3-(etil-szulfonil)-2-piridin-szulfonamid
76.	–	152–159	2-[[[[[(4,6-dimetoxi-2-pirimidinil)-amino]-karbonil]-amino]-szulfonil]-N,N-dimetil-3-piridin-karboxamid
77.	–	204–206	metil-2-[[[[[4-etoxi-6-(metil-amino)-1,3,5-triazin-2-il]-amino]-karbonil]-amino]-szulfonil]-benzoát
<i>Fungicidek</i>			
78.	karbendazim	302–307	metil-2-benzimidazol-karbamát
79.	tiuram	146	tetrametil-tiuram-diszulfid
80.	dodin	136	n-dodecil-guanidin-acetát
81.	kloroneb	133–135	1,4-diklór-2,5-dimetoxi-benzol
82.	cimoxanil	160–161	2-ciano-N-etil-karbamoil-2-metoxi-imino-acetamid
83.	kaptán	178	N-triklór-metil-tio-tetrahydro-ftálamid
84.	folpet	177	N-triklór-metil-tio-ftálimid
85.	tiofanát-metil	195	dimetil-4,4'-(o-fenilén)-bis(3-tioallofanát)
86.	tiabendazol	304–305	2-(tiazol-4-il)-benzimidazol
87.	klórtalonil	240–241	tetraklór-izoftalonitril
88.	diklorán	195	2,6-diklór-4-nitroanilin
89.	kaptafol	160–161	cisz-N-[1,1,2,2-tetraklór-etil-tio]-ciklohex-4-én-1,2-dikarboximid
90.	iprodion	133–136	3-(3,5-diklór-fenil)-N-(1-metil-etil)-2,4-dioxo-1-imidazolidin-karboxamid
91.	vinklozolin	108	3-(3,5-diklór-fenil)-5-etenil-5-metil-2,4-oxazolidin-dion
92.	kazugamicin	202–204 (bomlik)	kazugamicin
93.	triadimenol	121–127	β-(4-klór-fenoxi)-α-(1,1-dimetil-etil)-1H-1,2,4-triazol-1-etanol
94.	flutriafol	130	+α-(2-fluor-fenil)-α-(4-fluor-fenil)-1H-1,2,4-triazol-1-etanol

Vegyület száma	Kereskedelmi név	Op. (°C)	Kémiai név
95.	fluzilazol	52–53 HCl 201–203	1-[[bisz(4-fluor-fenil)-metil-szilil]-metil]-1H-1,2,4-triazol
96.	hexakonazol	111	(+/-)- α -butil- α -(2,4-diklór-fenil)-1H-1,2,4-triazol-1-etanol
97.	fenarimol	117–119	α -(2-klór-fenil)- α -(4-klór-fenil)-5-piridin-metanol
<i>Baktericidok</i>			
98.	oxitetraciklin-dihidrát	181–182 (bomlik)	oxitetraciklin-dihidrát
<i>Akaricidok</i>			
99.	hexatiazox	108–109	transz-5-(4-klór-fenil)-N-ciklohexil-4-metil-2-oxo-3-tiazolidin-karboxamid
100.	oxitiokinox	169–170	6-metil-1,3-ditiolo-[2,3-B]kinonolin-2-on
101.	dienoklór	122–123	bisz(pentaklór-2,4-ciklopentadién-1-il)
102.	cihexatin	245	triciklohexil-ón-hidroxid
<i>Inszekticidok</i>			
103.	karbofurán	150–152	metil-karbaminsav-észter 2,3-dihidro-2,2-dimetil-7-benzofuránnal
104.	karbaril	142	metil-karbaminsav-észter a-naftollal
105.	tiodikarb	173–174	dimetil-N,N'-[tiobisz(N-metil-immo)-karbonil-oxi]]-bisz(etán-imido-tioát)
106.	deltametrin	98–101	α -ciano-3-fenoxi-benzil-cisz-3-(2,2-dibróm-vinil)-2,2-dimetil-ciklopropán-karboxilát

A vízben oldhatatlan peszticid hatóanyagokat általában finoman elosztott vizes diszperzió formájában alkalmazzák, és megfelelő hajtógázzal vagy levegővel töltött pumpás spray-vel az alkalmazás helyszínére permetezik. A találmány szerinti tabletták készítmény egyesíti a magas szintű fizikai beépülés és a hideg, kemény vízben mutatott gyors szétesés előnyeit, amelynek során legfeljebb minimális keveréssel finom hatóanyag-diszperziót kapunk. Mivel a permetező fűvókákat általában mintegy 0,3 mm-es szitával védik, a hatóanyag-diszperzióknak elég finomnak kell lennie ahhoz, hogy dugulás nélkül átjusson ezen a szitán. Ezt a feltételt az ii) hordozóanyag rendszert tartalmazó találmány szerinti készítmények kielégítik.

A tabletták magas fizikai integritása azt jelenti, hogy a komponensek ellenállnak a tablettázó folyamatnak, és károsodás nélkül elviselik a csomagolási és szállítási folyamatokat. Ebből a célból általában mintegy 2,0 kp axiális törésszilárdságú tablettákat állítanak elő.

A hideg és kemény vízben (több mint 300 ppm kalcium-karbonát tartalom) történő gyors szétesés a felhasználó szempontjából előnyös, aki gyorsan előállítható készítményt igényel. A találmány szerinti tabletták általában 10 percen belül, a legtöbb esetben 5 percen belül szétesnek a kora tavaszi időjárásnak megfelelő hőmérsékletű hideg, természetes vizekben is.

A fenti előnyös tulajdonságokkal rendelkező találmány szerinti tabletták előállításához a hatóanyagot öt inert hordozóanyaggal keverjük: sav, bázis, diszpergálószert, szétesést javító szert és nedvesítőszert.

Vízben lényegében oldhatatlan hatóanyagot tartalmazó tablettánál vizes közegben pezsgtetés nélkül

30 gyakorlatilag lehetetlen gyors szétesést elérni. A szerves sav és a karbonát vagy hidrogén-karbonát bázis reakciójával szén-dioxid keletkezik, amely biztosítja a pezsgést.

35 A diszpergálószert feladata, hogy a hatóanyagcsomókat a szétesés során egymástól távol tartsa a hideg, kemény vízben.

40 A szétesést javító szer elősegíti a víz behatolását a tabletták belsejébe. A szokásos keményítő vagy cellulóz alapú szétesést javító szerek a mezőgazdaságban nem alkalmazhatók, mivel általában gélt képeznek a fűvóka 0,3 mm-es védőszitáján. Ebből a célból a találmány értelmében vízben oldhatatlan, keresztkötéses poli(vinil-pirrolidon)-t alkalmazunk.

45 A nedvesítőszert feladata, hogy szabályozza a sav és bázis reakciójából keletkező szén-dioxid buborék méretét. A nedvesítőszert csökkenti a felületi feszültséget a buborékok és a szilárd halmazállapotú tabletták között, és így kisebb méretű buborékok keletkeznek, amelyek könnyen elszakadnak a tabletták felületéről. Ennek következtében a tabletták hosszú időn keresztül a víz alatt marad, és így javul a tabletták teljes felszíne és a víz közötti kontaktus.

50 Ha a tabletták közvetlenül a vízbe történő beejtés után felemelkedik a víz felszínére, akkor gyorsan kiszárad, és az eloszlási folyamat lelassul. Ez a folyamat feleslegesen megnöveli a hatóanyag teljes diszpergálódásához szükséges időt. Ha a tabletták lesüllyed, a víz a tabletták teljes belső felületét nedvesíti. Ennek következtében, amikor a tabletták a felszínre felemelkedik (a hozzá kapcsolódó szén-dioxid buborékok felhajtó erejének hatására, amikor a tabletták már részben szétesnek

és ezért könnyebbé válik), a tablettá teteje továbbra is nedves marad, és a megfelelő kölcsönhatás folytatódik. Az ily módon formált hatóanyag szétesési ideje sokkal rövidebb, mint a lebegő tablettá szétesési ideje. Annak érdekében, hogy a tablettá azonnal lesüllyedjen, olyan inert hordozóanyagokat alkalmazunk, amelynek sűrűsége nagyobb a víz sűrűségénél (a sűrűség nagyobb, mint 1,00).

Az inert hordozóanyagokat a készítmény teljes tömegére vonatkoztatva legfeljebb 55 tömeg% mennyiségben alkalmazzuk. Inert töltőanyagok, így cukor vagy agyag is alkalmazható, amennyiben nem károsítják a hatóanyag kémiai stabilitását. További adalékanyagként alkalmazhatók csúsztatószeres és tapadást csökkentő anyagok, amelyek elősegítik a tablettá préselési folyamatot. Az ilyen típusú segédanyagok mennyiségének és fajtájának meghatározása szakember feladata.

A készítmény előállításához komponensként (valamennyi szilárd) az összekeverés, őrlés és préselés előtt csak szilárd anyagok alkalmazhatók. Ezért az előkeverék nedvességtartalmát 45–60 °C hőmérsékleten, 16 órán keresztül vákuumban végzett szárítással, 0,5 tömeg% alá csökkentjük. Az alacsony nedvességtartalom abból a szempontból is fontos, hogy az a tárolás során ne váltsa ki a szén-dioxid-fejlődéssel járó reakciókat. A komponenseket általában megfelelő malomban, így levegős vagy kalapácsos malomban megőröljük és összekeverjük. A megőrölt premixet 0,30–0,15 mm-es szitán átszitáljuk.

Az őrlött premix átlagos szemcsemérete 5–15 µm. Ha a szemcseméret ennél sokkal kisebb, a tablettá szilárd lesz, de nem esik szét elég gyorsan. Ha a szemcseméret ennél sokkal nagyobb, a diszperzió nem elég finom ahhoz, hogy dugulás nélkül átjusson a fent említett fűvókavédő szitán.

A tablettá a szokásos tablettázó berendezésekkel előállítható. Átmérője általában 1,2–7,5 cm, a kívánt tablettátömegtől függően. Általában lapos, lekerekített szélű, éllel rendelkező vagy él nélküli tablettát állítunk elő. Annak megelőzésére, hogy a tablettá a berendezéshez tapadjon, kenőanyagot, így magnézium-sztearátot vagy bórsavat alkalmazunk. A kenőanyag a berendezésre permetezhető vagy a készítménybe beépíthető.

A tablettákat 180 000 kg nyomóerőt teljesítő hidraulikus présrel állítjuk elő, amely 3,5–7,0×10⁷ Pa nyomással erős és könnyen széteső tablettát termel. A szétesési idő meghatározásához a tablettát általában 7–14 g méretben 800–1000 ml vízbe ejtjük. A diszpergálódási folyamat végét könnyű meghatározni, mivel a tablettá a víz felszínére emelkedik, amikor a végső szétesés előtt elveszíti tömege túlnyomó részét.

A kapott diszperziót 0,30/0,15/0,07 mm-es szitason vizsgáljuk, és mérjük az egyes szitákon visszamaradó anyag tömegét. A megfelelő tablettá csak nyomnyi mennyiségű anyagot hagy vissza a 0,07 mm-es szitán, míg a nagyobb szemcseméretű szitán maradékanyag nem mérhető.

A tablettá szilárdságát megfelelő mérőberendezéssel, így Erweka Model TBH 28 készüléken mérjük. A

tablettát a mérőhelyre helyezzük, és a berendezés csúcsát tengelyirányú mozgatással a tablettához közelítjük. Azt az erőt, amely a tablettát két részre töri, általában kp-ban fejezzük ki. A megfelelő tablettá szilárdsága általában 2–10 kp.

A találmányt közelebbről az alábbi példákkal mutatjuk be anélkül, hogy az oltalmi kör a példákra korlátozódna.

1. példa

Az alább felsorolt komponenseket 1 percen keresztül Tekmar A 10 típusú analitikai laboratóriumi malomban őrljük. Az előkeveréket 0,30 mm-es szitán átszitáljuk, és jól elkeverjük. 7 g tömegű, 3,49 cm átmérőjű tablettát állítunk elő kézi működtetésű precíziós hidraulikus présrel.

Komponens	Mennyiség (tömeg%)
transz-5-(4-klór-fenil)-N-ciklohexil-4-metil-2-oxotiazolidin-3-karboxamid (inszekticid)	50
citromsav	12
nátrium-hidrogén-karbonát	25
Lomar PWA	10
Polypladone XL-10	2
Monawet MB-100	1

Ez a tablettá 25 °C hőmérsékletű kemény vízben (420 ppm CaCO₃) 4 perc és 11 másodperc alatt teljesen szétesik. A nedves szitálás során a 0,30/0,15/0,07 mm-es szitákon csak nyomnyi mennyiségű maradék mérhető.

2. példa

Az 1. példában leírt módon az alábbi összetételű tablettát állítjuk elő:

Komponens	Mennyiség (tömeg%)
MBC (fungicid)	52,1
citromsav	10,0
nátrium-hidrogén-karbonát	25,6
Lomar PWA	5,0
Polypladone XL-10	1,0
Monawet MB-100	1,0
bórsav	5,0
magnézium-sztearát	0,3

A tablettá 25 °C hőmérsékletű vezetéki vízben 3 perc és 23 másodperc alatt teljesen szétesik. A nedves szitálás során a 0,30 mm méretű szitán nincs maradék, a 0,15 és 0,07 mm-es szitán csak nyomnyi mennyiségű maradék mérhető. A tablettá sűrűsége 1,25 g/cm³.

3. példa

Az alább megadott komponenseket összekeverjük, és 0,8 mm nyílású kerek lyukú szűrőn kalapácsmalommal egyszer áthajtjuk. 7 g tömegű és 3,49 cm átmérőjű tablettákat préselünk kézzel működtetett hidraulikus présrel.

Komponens	Mennyiség (tömeg%)
3-[[[(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)-amino]-karbonil]-amino]-szulfonil]-2-tiofén-karbonsav-metil-észter	52,1
citromsav	10,0

Komponens	Mennyiség (tömeg%)
nátrium-hidrogén-karbonát	25,6
Lomar PWA	5,0
Polypladone XL-10	1,0
Monawet MP-100	1,0
bórsav	5,0
magnézium-sztearát	0,3

A tableta 25 °C hőmérsékletű vezetéki vízben 2 perc és 24 másodperc alatt teljesen szétesik. A nedves szítálásnál a 0,30 mm-es szítán nem mérhető maradék, a 0,15 és 0,07 mm-es szítán csak nyomnyi mennyiségű maradék mérhető. A tableta 16 másodpercen keresztül a víz felszíne alatt marad.

4-11. példák

Az alább megadott összetételű készítményeket 1 percen keresztül Tekmar A-10 típusú analitikai laboratóriumi malomban őrljük, majd 7 g tömegű és 3,49 cm átmérőjű tablettákat préselünk kézi működtetésű hidraulikus présrel.

Komponens	Mennyiség (tömeg%)
hatóanyag	52,1
citromsav	10,0
nátrium-hidrogén-karbonát	25,6
Lomar PWA	5,0
Polypladone XL-10	1,0
Monawet MP-100	1,0
bórsav	5,0
magnézium-sztearát	0,3

A tableta sűrűségét, szilárdságát, víz alatt eltöltött idejét és szétesési idejét a 2. táblázatban adjuk meg nyolc különböző hatóanyagra. A hatóanyag jelölésére az 1. táblázatban megadott sorszámot használjuk. Az időadatokat perc : másodperc mértékegységgel adjuk meg.

2. táblázat

Pld. sz.	Hatóanyag száma	Sűrűség (g/cm ³)	Szilárdság (kp)	Merülési idő	Szétesési idő
4.	23	1,29	3,56	: 34	2 : 32
5.	75	1,28	3,26	: 30	2 : 17
6.	76	1,23	3,16	: 27	3 : 31
7.	24	1,27	4,58	: 52	2 : 17
8.	4	1,30	3,97	1 : 10	3 : 09
9.	11	1,28	3,16	: 26	2 : 13
10.	77	1,31	4,68	1 : 32	3 : 20
11.	63	1,28	3,56	: 38	2 : 23

12. példa

A megadott komponenseket 1 percen keresztül őrljük, majd az 1. példában megadott módon 7 g tömegű és 3,49 cm átmérőjű tablettává préseljük.

Komponens	Mennyiség (tömeg%)
metil-2-[[[(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)-amino]-karbonil]-amino]-szulfonil]-benzoát	50
citromsav	11

Komponens	Mennyiség (tömeg%)
nátrium-hidrogén-karbonát	32
Lomar PWA	5
Polypladone XL-10	1
5 Monawet MB-100	1

A tableta a 0 °C hőmérsékletű kemény vízben (420 ppm CaCO₃) 3 perc és 15 másodperc alatt teljesen szétesik. A kapott diszperzió 0,30 mm átmérőjű szítán maradék nélkül áthajtható.

13. példa

A 12. példában leírt módon tablettát állítunk elő a következő anyagokból:

Komponens	Mennyiség (tömeg%)
15 metil-2-[[[(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)-amino]-karbonil]-amino]-szulfonil]-benzoát	50
ftálsav	14
nátrium-hidrogén-karbonát	22
20 Lomar PWA	10
Polypladone XL-10	2
Monawet MB-100	2

A tableta 25 °C hőmérsékletű vezetéki vízben 2 perc és 35 másodperc alatt teljesen szétesik. Szilárdsága 5,70 kp, a 0,30 mm-es szítán csak nyomnyi mennyiségű maradékot hagy vissza.

14. példa

A 12. példában leírt módon tablettát állítunk elő a következő komponensekből:

Komponens	Mennyiség (tömeg%)
30 metil-2-[[[(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)-amino]-karbonil]-amino]-szulfonil]-benzoát	50
35 szukcinsav	12
nátrium-hidrogén-karbonát	24
Lomar PWA	10
Polypladone XL-10	2
Monawet MB-100	2

A 7 g tömegű tableta 25 °C hőmérsékletű vezetéki vízben 1 perc és 26 másodperc alatt teljesen szétesik. A 0,30 mm-es szítán maradékot nem hagy vissza.

15. példa

Az alább megadott komponenseket összekeverjük, és 0,8 mm nyílású kerek lyukú szítán kalapácsos malommal kétszer áthajtuk. 7,2 g és 3,49 cm átmérőjű tablettákat préselünk kézi működtetésű Preco hidraulikus présrel.

Komponens	Mennyiség (tömeg%)
50 etil-2-[[[(4-klór-6-metoxi-2-pirimidinil)-amino]-karbonil]-amino]-szulfonil]-benzoát	51,0
fumársav	7,0
nátrium-hidrogén-karbonát	12,5
55 Polyfon H	7,5
Polypladone XL-10	2,0
Monawet MB-100	1,75
Spiernat 50-S (kicsapott SiO ₂)	1,25
Diluex FG (attapulgit agyag)	12,0
60 Avicel PH 101 (mikrokristályos cellulóz)	5,0

A tablettá szobahőmérsékleten vízben 50 másodperc alatt óvatos kevertetés közben szétesik. 0,25 mm-es szitán maradékot nem hagy vissza, a 0,07 mm-es szitán csak nyomnyi mennyiségű maradék mérhető.

16-33. példák

Az 1. példában leírt módon tablettát állítunk elő a később részletezett peszticid hatóanyagok felhasználásával. A példákban alkalmazott peszticid hatóanyagok olvadáspontja legalább 100 °C, oldékonysága semleges vízben, 20 °C hőmérsékleten legfeljebb 5 tömeg%. A tablettában a következő hordozóanyag rendszert használjuk:

- mintegy 5–20 tömeg% dibázisos vagy tribázisos szerves karbonsav vagy ilyenek elegye,
- mintegy 7–50 tömeg% ammónium vagy alkálifém-karbonát vagy -hidrogén-karbonát vagy ilyenek elegye,
- mintegy 0,5–20 tömeg% diszpergálószer,
- mintegy 0,1–5 tömeg% vízben oldhatatlan, kereszt-kötéses poli(vinil-pirrolidon), és
- mintegy 0,1–5 tömeg% anionos vagy nemionos nedvesítőszer.

16. példa

(I) általános képletű hatóanyag (4 127 405 számú USA-beli szabadalmi leírás), a képletben

R_1 jelentése (Ia), (Ib), (Ic) általános képletű csoport vagy (Id) képletű csoport,

R_3 és R_6 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, fluor-, klór-, bróm- vagy jódatom, 1–4 szénatomos alkilcsoport, 1–4 szénatomos alkoxycsoport, nitrocsoport, trifluor-metil-csoport, cianocsoport, $CH_3S(O)_n$ vagy $CH_3CH_2S(O)_n$ képletű csoport,

R_4 jelentése hidrogénatom, fluor-, klór-, brómatom vagy metilcsoport,

R_5 jelentése hidrogénatom, fluor-, klór- vagy brómatom, metil- vagy metoxycsoport,

R_7 jelentése hidrogénatom, fluor-, klór- vagy brómatom, 1–2 szénatomos alkilcsoport vagy 1–3 szénatomos alkoxycsoport,

R_8 jelentése hidrogénatom, metilcsoport, klóratom vagy brómatom,

R_9 és R_{10} jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, metilcsoport, klóratom vagy brómatom,

W és Q jelentése egymástól függetlenül oxigénatom vagy kénatom,

n értéke 0, 1 vagy 2,

X jelentése hidrogénatom, klóratom, brómatom, metilcsoport, etilcsoport, 1–3 szénatomos alkoxycsoport, trifluor-metil-csoport, metil-tio-csoport vagy metoxi-metil-csoport,

Z jelentése metilcsoport vagy metoxycsoport, valamint ezek mezőgazdaságilag alkalmazható sói.

17. példa

Peszticid hatóanyag (4 394 506 számú USA-beli szabadalmi leírás):

N-(heterociklusos amino-karbonil)-aril-szulfon-

amid, amelyben az arilcsoport 2-es helyzetben karboxilcsoporttal szubsztituálva van, valamint ezek észtere, tioésztere vagy amidja, például N-[(4,6-dimetilpirimidin-2-il)-amino-karbonil]-metoxi-karbonil-benzol-szulfonamid vagy N-[(4,6-dimetoxi-1,3,5-triazin-2-il)-amino-karbonil]-2-metoxi-karbonil-benzol-szulfonamid.

18. példa

(II), (II') vagy (II'') általános képletű peszticid hatóanyag (4 481 029 számú USA-beli szabadalmi leírás), a képletben

W^I jelentése oxigénatom vagy kénatom,

A^I jelentése hidrogénatom, klóratom, brómatom, 1–4 szénatomos alkilcsoport, metoxycsoport, nitrocsoport vagy trifluor-metil-csoport,

A jelentése $-CO-Q-R^I$ vagy $-CT-R^{II}$ általános képletű csoport, ahol

Q jelentése oxigénatom, kénatom vagy $-N(R_4)-$ képletű csoport,

T jelentése oxigénatom vagy $-N(OR^{III})-$ általános képletű csoport, ahol

R^{III} jelentése hidrogénatom, 1–4 szénatomos alkilcsoport vagy 3–4 szénatomos alkenilcsoport, ha Q jelentése oxigénatom vagy kénatom,

R^I jelentése 1–6 szénatomos alkilcsoport, 3–6 szénatomos alkenilcsoport, 3–6 szénatomos alkinilcsoport, egy-három klór-, fluor- vagy brómatommal vagy egy cianocsoporttal vagy metoxycsoporttal szubsztituált 2–6 szénatomos alkilcsoport, egy-három klóratommal szubsztituált 3–6 szénatomos alkenilcsoport, klóratommal szubsztituált 3–6 szénatomos alkinilcsoport, 5–6 szénatomos cikloalkilcsoport, egy-három metilcsoporttal szubsztituált ciklohexilcsoport, ciklohexenilcsoport, 4–7 szénatomos cikloalkil-alkil-csoport vagy (IIa) általános képletű csoport, ahol

R_7 és R_8 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, klóratom, metilcsoport vagy metoxycsoport,

n értéke 0 vagy 1,

R_9 jelentése hidrogénatom vagy metilcsoport,

R_1 jelentése (IIb), (IIc), (II'd), (IIe), (II'f) általános képletű csoport, ahol

Z jelentése $=N-$, $=CH-$ vagy $=CF-$ képletű csoport,

X jelentése hidrogénatom, klóratom, metilcsoport, metoxycsoport vagy etoxycsoport,

Y jelentése hidrogénatom, klóratom, 1–4 szénatomos szubsztituált alkilcsoport,

azzal a megszorítással, hogy X és Y jelentése hidrogénatom, akkor R^I és R^{II} legfeljebb 5 szénatomot tartalmazó csoportot jelent,

X_1 jelentése hidrogénatom, klóratom, metoxycsoport, etoxycsoport vagy metilcsoport,

Y_1 jelentése hidrogénatom, metoxycsoport vagy metilcsoport,

X_{II} jelentése oxigénatom vagy $-CH_2-$ csoport,

azzal a megszorítással, hogy Y jelentése legfeljebb 4 szénatomos csoport, ha A jelentése több mint 5 szénatomos csoport, valamint ezek mezőgazdaságilag alkalmazható sói, ahol a további szubsztituens a 4 481 029 számú USA-beli szabadalmi leírásban megadott jelentésű.

19. példa

(III) általános képletű peszticid hatóanyag (4 435 205 számú USA-beli szabadalmi leírás), a kép-

letben

W jelentése oxigénatom vagy kénatom,

Q jelentése oxigénatom vagy $-NR_5-$ képletű csoport,

R_1 jelentése 1–4 szénatomos alkilcsoport, amely adott esetben egy-három fluor-, klór- vagy brómatommal szubsztituálva lehet, $-CH_2CH_2OCH_3$, $-CH_2CH_2CH_2OCH_3$ képletű csoport, vagy (IIIa) általános képletű csoport,

R_2 jelentése hidrogénatom, fluor-, klór- vagy brómatom, metoxicsoport, nitrocsoport, trifluor-metil-csoport vagy 1–2 szénatomos alkilcsoport,

R_3 jelentése hidrogénatom, fluor-, klór- vagy brómatom vagy metilcsoport,

R_4 jelentése hidrogénatom, metilcsoport vagy metoxicsoport,

R_5 jelentése 1–4 szénatomos alkilcsoport,

R_6 és R_7 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, fluor-, klór- vagy brómatom, metilcsoport, trifluor-metil-csoport, nitrocsoport vagy metoxicsoport,

A jelentése (IIIb), (IIIc), (III d) vagy (IIIe) általános képletű csoport,

X jelentése aminocsoport, dimetil-amino-csoport, metil-amino-csoport, 1–4 szénatomos alkilcsoport, amely adott esetben egy-három fluor-, klór- vagy brómatommal szubsztituálva lehet, $-CH_2OCH_3$, $-CH_2OCH_2CH_3$ képletű csoport, 1–4 szénatomos alkoxicsoport, 1–2 szénatomos alkiltio-csoport, 3–4 szénatomos alkeniloxicsoport, 3–4 szénatomos alkiniloxicsoport, $-OCH_2CH_2OCH_3$ képletű csoport vagy 2–4 szénatomos alkoicsoport, amely egy-három fluor-, klór- vagy brómatommal szubsztituálva lehet,

n értéke 1 vagy 2,

Y jelentése hidrogénatom, metilcsoport, metoxicsoport vagy klóratom,

X_1 jelentése oxigénatom vagy $-CH_2-$ képletű csoport,

Y_1 jelentése hidrogénatom, metilcsoport, metoxicsoport vagy klóratom,

X_2 és Y_2 jelentése egymástól függetlenül metilcsoport vagy metoxicsoport,

Z jelentése $=CH-$, $=N-$, $=CCH_3-$, $=CBr-$, $=CCl-$, $=CF-$, $=Cl-$, $=CC_2H_5-$, $=CCH_2CH_2Cl-$ vagy $=C(CH_2CH=CH_2)-$ képletű csoport.

20. példa

(IV) általános képletű peszticid hatóanyag (4 420 325 számú USA-beli szabadalmi leírás), a kép-

letben

R_1 jelentése fluor-, klór- vagy brómatom, trifluor-me-

til-csoport, 1–3 szénatomos alkoicsoport, 1–3 szénatomos alkilcsoport, nitrocsoport, $-CO_2R_4$, $-SO_2R_5$, $-SO_2NR_6R_7$, $-SO_2N(OCH_3)CH_3$, $-SO_2OCH_2CF_3$, $-OSO_2R_5$ vagy $-CH_2L$ általános képletű csoport,

L jelentése $-SO_2NR_6R_7$ általános képletű csoport, metoxicsoport, etoxicsoport, $-CO_2CH_3$ vagy $-CO_2C_2H_5$ képletű csoport,

R_2 jelentése hidrogénatom, klór-, bróm- vagy fluoratom, trifluor-metil-csoport vagy metoxicsoport,

R_4 jelentése 1–3 szénatomos alkilcsoport, $-CH_2CH=CH_2$, $-CH_2CH_2Cl$ vagy $-CH_2CH_2OCH_3$ képletű csoport,

R_5 jelentése 1–3 szénatomos alkilcsoport vagy trifluor-metil-csoport,

R_6 és R_7 jelentése egymástól függetlenül 1–3 szénatomos alkilcsoport,

R_8 jelentése hidrogénatom vagy metilcsoport,

R_9 jelentése hidrogénatom vagy 1–3 szénatomos alkilcsoport,

R_3 jelentése (IVa), (IVb), (IVc), (IVd), (IVe), (IVf) vagy (IVg) általános képletű csoport,

W jelentése oxigénatom vagy kénatom,

X jelentése metilcsoport, metoxicsoport vagy klóratom,

Y jelentése metilcsoport, etilcsoport, metoxicsoport, etoxicsoport, metoxi-metil-csoport, aminocsoport, metil-amino-csoport vagy dimetil-amino-csoport,

Z jelentése $=CH-$ vagy $=N-$ csoport,

X_1 jelentése hidrogénatom, klóratom, metilcsoport, metoxicsoport vagy etoxicsoport,

X_2 jelentése metilcsoport, etilcsoport, metoxicsoport vagy etoxicsoport,

X_3 jelentése metilcsoport vagy metoxicsoport,

Y_1 jelentése metilcsoport vagy metoxicsoport, valamint ezek mezőgazdaságilag alkalmazható sói.

21. példa

(V), (V'), (V'') vagy (V''') általános képletű vegyület (4 514 211 számú USA-beli szabadalmi leírás), a kép-

letben

Q jelentése oxigénatom, kénatom, SO vagy SO_2 ,

Q_1 jelentése oxigénatom, kénatom vagy SO_2 ,

L jelentése $-SO_2-NH-CW-NAR_{12}$ általános képletű csoport,

R_1 jelentése hidrogénatom vagy 1–4 szénatomos alkilcsoport,

R_2 jelentése hidrogénatom vagy 1–4 szénatomos alkilcsoport,

R_3 jelentése hidrogénatom vagy metilcsoport,

R_4 jelentése hidrogénatom, klóratom, metilcsoport, trifluor-metil-csoport, metoxicsoport, brómatom, fluoratom, metil-tio-csoport vagy difluor-metoxi-csoport,

R_5 jelentése hidrogénatom, metilcsoport, metoxicsoport, klóratom, brómatom, nitrocsoport, $-CO_2R_7$, $-SO_2R_8$, $-OSO_2R_9$ vagy $-SO_2NR_{10}R_{11}$ általános képletű csoport, fluoratom, trifluor-metil-csoport, metil-tio-csoport, difluor-metoxi-csoport vagy $-SO_2N(OCH_3)CH_3$ képletű csoport,

- R₆ jelentése hidrogénatom, klóratom, brómatom vagy 1–4 szénatomos alkilcsoport,
 R'₆ jelentése hidrogénatom, metilcsoport, klóratom vagy brómatom,
 R₇ jelentése 1–3 szénatomos alkilcsoport, –CH₂CH=CH₂, –CH₂CH₂OCH₃ vagy –CH₂CH₂Cl képletű csoport,
 R₈ jelentése 1–3 szénatomos alkilcsoport,
 R₉ jelentése 1–3 szénatomos alkilcsoport vagy trifluor-metil-csoport,
 R₁₀ és R₁₁ jelentése egymástól függetlenül 1–2 szénatomos alkilcsoport,
 R₁₂ jelentése hidrogénatom vagy metilcsoport,
 W jelentése oxigénatom vagy kénatom,
 A jelentése (Va), (Vb), (Vc), (Vd), (Ve) vagy (Vf) általános képletű csoport,
 X jelentése hidrogénatom, metilcsoport, metoxics csoport, klóratom, fluoratom, difluor-metoxics csoport vagy difluor-metil-tio-csoport,
 Y jelentése metilcsoport, metoxics csoport, etoxics csoport, metoxi-metil-csoport, aminocsoport, metil-amino-csoport, dimetil-amino-csoport, dimetoxi-metil-csoport, dietoxi-metil-csoport, etilcsoport, trifluor-metil-csoport, –OCH₂CH=CH₂, –OCH₂C=CH, –OCH₂CF₃, –OCH₂CH₂Cl, –OCH₂CH₂Br vagy –OCH₂CH₂F képletű csoport, cianocsoport, metoxi-metil-csoport, metoxi-etoxi-csoport vagy –GCF₂T általános képletű csoport, ahol
 G jelentése oxigénatom vagy kénatom és
 T jelentése hidrogénatom, klór-fluor-metil-csoport, bróm-fluor-metil-csoport, difluor-metil-csoport vagy –CHF₂CF₃ képletű csoport,
 Z jelentése =CH–, =N–, =CCH₃–, =CC₂H₅–, =CCl– vagy =CBr– képletű csoport,
 Y₁ jelentése oxigénatom vagy –CH₂– képletű csoport,
 X₁ jelentése metilcsoport, metoxics csoport, etoxics csoport vagy difluor-metoxi-csoport,
 X₂ jelentése metilcsoport, etilcsoport vagy –CH₂CF₃ képletű csoport,
 Y₂ jelentése etilcsoport, metilcsoport, metoxics csoport, etoxics csoport, metil-tio-csoport vagy etil-tio-csoport,
 X₃ jelentése metilcsoport vagy metoxics csoport.

22. példa

(VI) általános képletű peszticid hatóanyag (4547215 számú USA-beli szabadalmi leírás), a képletben

R jelentése etilcsoport vagy izopropilcsoport, valamint mezőgazdaságilag alkalmazható sói.

23. példa

(VII) általános képletű peszticid hatóanyag (4548638 számú USA-beli szabadalmi leírás), a képletben

R jelentése –CO₂CH₃, –CO₂CH₂CH₃, –CO₂CH₂CH₂CH₃, –CO₂CH₂CH=CH₂, –CO₂CH(CH₃)₂, –CO₂CH₂CH₂Cl, –SO₂N(CH₃)₂ vagy –OSO₂CH₃ képletű csoport.

24. példa

(VIII) általános képletű peszticid hatóanyag (4479821 számú USA-beli szabadalmi leírás), a képletben

- 5 A jelentése 1–6 szénatomos alkilcsoport, amely 1–4 szénatomos alkoxics csoporttal, 1–4 szénatomos alkil-tio-csoporttal, 1–4 szénatomos alkil-szulfonil-csoporttal vagy 1–4 szénatomos alkil-szulfonil-csoporttal szubsztituálva van,
 10 X jelentése oxigénatom, kénatom, szulfonilcsoport vagy szulfonilcsoport,
 Z jelentése oxigénatom vagy kénatom,
 m értéke 1 vagy 2,
 R₂ jelentése hidrogénatom, halogénatom, 1–4 szénatomos alkilcsoport, 2–5 szénatomos alkenilcsoport, 1–4 szénatomos halogén-alkil-csoport, –YR₅, –COOR₆ általános képletű csoport, nitrocsoport vagy –CO–NR₇R₈ általános képletű csoport,
 R₃ és R₄ jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, 1–4 szénatomos alkilcsoport, 1–4 szénatomos alkoxics csoport, 1–4 szénatomos alkil-tio-csoport, 1–4 szénatomos halogénalkilcsoport, halogénatom vagy legfeljebb 4 szénatomos alkoxi-alkil-csoport,
 25 R₅ és R₆ jelentése egymástól függetlenül 1–4 szénatomos alkilcsoport, 2–5 szénatomos alkenilcsoport vagy 2–6 szénatomos alkenilcsoport,
 R₇ és R₈ jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, 1–5 szénatomos alkilcsoport, 2–5 szénatomos alkenilcsoport vagy 2–6 szénatomos alkenilcsoport,
 Y jelentése oxigénatom, kénatom, szulfonilhíd vagy szulfonilhíd, valamint ezek sói.

25. példa

(IX) képletű peszticid hatóanyag (4566898 számú USA-beli szabadalmi leírás).

26. példa

(X) általános képletű peszticid hatóanyag (4435206 számú USA-beli szabadalmi leírás), a képletben

- R jelentése (Xa), (Xb), (Xc) általános képletű csoport,
 45 R₁ jelentése hidrogénatom, klór-, bróm- vagy fluoratom, 1–4 szénatomos alkilcsoport, 1–4 szénatomos alkoxics csoport, 1–4 szénatomos alkil-tio-csoport, nitrocsoport, trifluor-metil-csoport, –COOR₅ vagy –SO₂NR₆R₇ általános képletű csoport,
 50 R₂ jelentése hidrogénatom, klóratom, brómatom vagy metilcsoport,
 R₃ és R₄ jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom vagy metilcsoport,
 R₅ jelentése 1–6 szénatomos alkilcsoport, 3–6 szénatomos alkenilcsoport, metoxi-etil-csoport, etoxi-etil-csoport, metoxi-propil-csoport vagy klór-etil-csoport,
 55 R₆ és R₇ jelentése egymástól függetlenül metilcsoport vagy etilcsoport,
 60 W jelentése oxigénatom vagy kénatom,

- X jelentése metilcsoport, metoxicsoport vagy etoxicsoport,
- Y jelentése hidrogénatom, klóratom, metilcsoport, trifluor-metil-csoport, metil-amino-csoport, dimetil-amino-csoport, $-\text{CH}_2\text{OR}_8$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OR}_8$ általános képletű csoport, $-\text{OCH}_2\text{CF}_3$ képletű csoport vagy VR_6 általános képletű csoport,
- Z jelentése $=\text{CH}-$ vagy $=\text{N}-$,
- V jelentése oxigénatom vagy kénatom,
- R_8 jelentése metilcsoport, etilcsoport, $-\text{CH}_2\text{CO}_2\text{R}_8$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OR}_6$, $-\text{C}(\text{CH}_3)\text{HCO}_2\text{R}_8$ vagy $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CO}_2\text{R}_8$ általános képletű csoport,
- Y_1 jelentése hidrogénatom, metilcsoport vagy metoxicsoport és
- X_1 jelentése hidrogénatom, klóratom, metoxicsoport, etoxicsoport vagy metilcsoport,
- valamint mezőgazdaságilag alkalmazható sói.

27. példa

- (XI) általános képletű peszticid hatóanyag (4514212 számú USA-beli szabadalmi leírás), valamint aminokkal, alkálifém vagy alkáliföldfém bázissal vagy kvaterner ammóniumbázissal képzett sói, a képletben
- Q jelentése fluoratom, fluor-metil-csoport, klór-metil-csoport, triklór-metil-csoport, 1,2-diklór-etil-csoport, 1,2-dibróm-etil-csoport, 1,2-diklór-propil-csoport, 1,2-dibróm-propil-csoport, 1,2-dibróm-izobutil-csoport, 1,2-diklór-1-metil-etil-csoport vagy 1,2-dibróm-1-metil-etil-csoport,
- X jelentése oxigénatom, kénatom, szulfonilhid vagy szulfonilhid,
- Z jelentése oxigénatom vagy kénatom,
- R_2 jelentése hidrogénatom, halogénatom, 1–5 szénatomos alkilcsoport, 2–5 szénatomos alkenilcsoport, 1–4 szénatomos halogén-alkil-csoport, $-\text{YR}_5$, $-\text{COOR}_6$ általános képletű csoport, nitrocsoport vagy $-\text{CONR}_7\text{R}_8$ általános képletű csoport,
- R_3 és R_4 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, 1–4 szénatomos alkilcsoport, 1–4 szénatomos alkoxicsoport, 1–4 szénatomos alkil-tio-csoport, 1–4 szénatomos halogén-alkil-csoport, halogénatom vagy legfeljebb 4 szénatomos alkoxi-alkil-csoport,
- R_5 és R_6 jelentése egymástól függetlenül 1–5 szénatomos alkilcsoport, 2–5 szénatomos alkenilcsoport vagy 2–6 szénatomos alkinilcsoport,
- R_7 és R_8 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, 1–5 szénatomos alkilcsoport, 2–5 szénatomos alkenilcsoport vagy 2–6 szénatomos alkinil-csoport, és
- Y jelentése oxigénatom, kénatom, szulfonilhid vagy szulfonilhid.

28. példa

- (XII) általános képletű peszticid hatóanyag (4478635 számú USA-beli szabadalmi leírás), a képletben
- X jelentése (XIIa) vagy (XIIb) általános képletű csoport,

- Y jelentése 1–3 szénatomos alkilcsoport, 1–3 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1–3 szénatomos alkoxicsoport, 1–3 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, 2–3 szénatomos alkoxi-alkil-csoport, 1–3 szénatomos alkil-tio-csoport, halogénatom vagy $-\text{NR}_{16}\text{R}_{17}$ általános képletű csoport,
- Z jelentése oxigénatom vagy kénatom,
- R_1 jelentése hidrogénatom, halogénatom, cianocsoport, nitrocsoport, 1–4 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1–4 szénatomos alkilcsoport, 1–4 szénatomos alkoxicsoport, $-\text{COR}_6$, $-\text{NR}_7\text{R}_8$, $-\text{S}(\text{O})_m$ -1–4 szénatomos alkil- vagy $-\text{SO}_2\text{R}_9$ általános képletű csoport,
- R_2 jelentése hidrogénatom, fluoratom, klóratom, brómatom, nitrocsoport, trifluor-metil-csoport, $-\text{NR}_{20}\text{R}_{21}$ általános képletű csoport, metilcsoport, etilcsoport, metoxicsoport, etoxicsoport, vagy alkil-résében 1–4 szénatomos $-\text{S}(\text{O})_m$ -alkil-csoport,
- R_3 jelentése hidrogénatom, fluor-, klór- vagy brómatom, aminocsoport, nitrocsoport vagy metoxicsoport,
- R_6 jelentése hidrogénatom, 1–4 szénatomos alkilcsoport, 1–3 szénatomos alkenil-oxi-csoport, 3–5 szénatomos alkinil-oxi-csoport, 1–4 szénatomos halogén-alkil-csoport, 1–5 szénatomos alkil-tio-csoport, fenoxicsoport, benzil-oxi-csoport, $-\text{NR}_{10}\text{R}_{11}$ általános képletű csoport, vagy 1–5 szénatomos alkoxicsoport, amely adott esetben egy-három halogénatommal vagy 1–3 szénatomos alkoxicsoporttal szubsztituálva lehet,
- R_7 jelentése hidrogénatom, metoxicsoport, etoxicsoport, 1–4 szénatomos alkilcsoport, vagy $-\text{COR}_{12}$ általános képletű csoport,
- R_8 jelentése hidrogénatom, vagy $-\text{COR}_{12}$ általános képletű csoport,
- R_9 jelentése $-\text{OR}_{13}$ vagy $-\text{NR}_{14}\text{R}_{15}$ általános képletű csoport,
- R_{11} jelentése 1–4 szénatomos alkilcsoport, amely adott esetben egy-három halogénatommal szubsztituálva lehet, fenilcsoport vagy benzilcsoport,
- R_{12} jelentése hidrogénatom, 1–4 szénatomos alkilcsoport vagy 1–4 szénatomos alkoxicsoport,
- m értéke 0, 1 vagy 2,
- R_4 jelentése valamely R_2 jelentésében megadott csoport,
- R_5 jelentése valamely R_1 jelentésében megadott csoport,
- R_{10} , R_{11} , R_{14} és R_{20} jelentése valamely R_7 jelentésében megadott csoport,
- R_{12} , R_{15} , R_{16} , R_{17} és R_{21} jelentése valamely R_8 jelentésében megadott csoport.

29. példa

- (XIII) általános képletű peszticid hatóanyag (4634465 számú USA-beli szabadalmi leírás), a képletben
- X jelentése oxigénatom vagy kénatom,
- E jelentése nitrogénatom vagy $=\text{C}-$,
- R_1 jelentése hidrogénatom, halogénatom, nitrocsoport, 1–4 szénatomos alkilcsoport, 1–4 szénatomos halo-

- gén-alkil-csoport, 1–4 szénatomos alkoxicsoport, 1–4 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, 1–4 szénatomos alkoxi-karbonil-csoport, 1–4 szénatomos alkil-tio-csoport, 1–4 szénatomos alkil-szulfonil-csoport, 1–4 szénatomos alkil-szulfonil-csoport, 1–4 szénatomos alkoxi-alkoxi-csoport, vagy 2–5 szénatomos alkoxi-alkoxi-csoport,
- 5 R_2 jelentése hidrogénatom, 1–4 szénatomos alkilcsoport vagy 1–3 szénatomos alkoxicsoport,
- 10 R_3 és R_4 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, 1–4 szénatomos alkilcsoport, 1–4 szénatomos alkoxicsoport, 1–4 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, 1–4 szénatomos halogén-alkil-tio-csoport, 1–4 szénatomos alkil-tio-csoport, halogénatom, 2–5 szénatomos alkoxi-alkil-csoport, 2–5 szénatomos alkoxi-alkoxi-csoport vagy $-NR_5R_6$ általános képletű csoport, ahol
- 15 R_5 és R_6 jelentése hidrogénatom vagy 1–4 szénatomos alkilcsoport,
- 20 A jelentése 3–4 atomos szubsztituátlan vagy szubsztituált híd, amely egy vagy két oxigénatomot, kénatomot vagy nitrogénatomot tartalmaz, és a kapcsolódó szénatomokkal együtt nemaromás, 5- vagy 6-tagú heterociklusos gyűrűrendszert képez, azzal a megkötéssel, hogy két oxigénatomot legalább egy szénatom választ el, és oxigén- és kénatom csak akkor kapcsolódik egymáshoz, ha a kénatom $-SO-$ vagy $-SO_2-$ csoportot képez.
30. példa
A peszticid hatóanyag (202 830 számú európai szabadalmi leírás): 2-[[N-(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)-N-metil-amino-karbonil]-amino-szulfonil]-benzoesav-metil-észter.
31. példa
(XIV) általános képletű peszticid hatóanyag (237 292 számú európai szabadalmi leírás), a képletben
- 35 J jelentése (J-1), (J-2), (J-3) vagy (J-4) általános képletű csoport,
- 40 R jelentése hidrogénatom vagy metilcsoport,
- R_1 jelentése hidrogénatom vagy 1–3 szénatomos alkilcsoport,
- R_2 jelentése 1–3 szénatomos alkilcsoport vagy 1–2 szénatomos alkoxicsoport vagy
- 45 R_1 és R_2 együtt $-(CH_2)_n-$ képletű csoportot képez, ahol n értéke 2, 3 vagy 4,
- R_3 jelentése hidrogénatom, klóratom, fluoratom vagy brómatom, metilcsoport, trifluor-metil-csoport, metoxicsoport vagy difluor-metoxi-csoport,
- 50 X jelentése metilcsoport, fluor-metil-csoport, etil-csoport, metoxicsoport, etoxicsoport, klóratom, difluor-metoxi-csoport vagy metoxi-metil-csoport.
32. példa
(XV) általános képletű peszticid hatóanyag (87 780 számú európai szabadalmi leírás), a képletben
- 55 A jelentése hidrogénatom, 1–8 szénatomos alkilcsoport, vagy fenilcsoport, amely adott esetben 1–8 szénatomos alkilcsoporttal, halogénatommal vagy nitrocsoporttal szubsztituálva lehet,
- 60 B és C jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, halogénatom, nitrocsoport, 1–8 szénatomos alkilcsoport, aril-alkil-csoport, 1–8 szénatomos alkoxicsoport, halogén-alkil-csoport, $-CO_2R$ általános képletű csoport (ahol R jelentése hidrogénatom, 1–8 szénatomos alkilcsoport, allilcsoport vagy propargilcsoport), $-CONR_1R_2$ általános képletű csoport [ahol R_1 jelentése hidrogénatom, 1–8 szénatomos alkilcsoport vagy fenilcsoport, R_2 jelentése hidrogénatom vagy 1–8 szénatomos alkilcsoport vagy R_1 és R_2 együtt $-(CH_2)_m-$ általános képletű csoportot (ahol m értéke 4, 5 vagy 6), $-CH_2CH_2OCH_2CH_2-$ vagy $-CH_2CH_2N(CH_3)CH_2CH_2-$ képletű csoportot képez], $-S(O)_nR_3$ általános képletű csoport (ahol R_3 jelentése 1–8 szénatomos alkilcsoport, fenilcsoport vagy aril-alkil-csoport és n értéke 0, 1 vagy 2), $-SO_2NR_4R_5$ általános képletű csoport [ahol R_4 jelentése 1–8 szénatomos alkilcsoport, R_5 jelentése hidrogénatom vagy 1–8 szénatomos alkilcsoport vagy R_4 és R_5 együtt $-(CH_2)_p$ általános képletű csoportot (ahol p értéke 5, 6 vagy 6), $-CH_2CH_2OCH_2CH_2-$ vagy $-CH_2CH_2N(CH_3)CH_2CH_2-$ képletű csoportot képez], valamint fenilcsoport, amely adott esetben 1–8 szénatomos alkilcsoporttal, halogénatommal vagy nitrocsoporttal szubsztituálva lehet,
- D jelentése hidrogénatom vagy 1–8 szénatomos alkilcsoport,
- 30 X és Y jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom, halogénatom, 1–8 szénatomos alkilcsoport, 1–8 szénatomos alkoxicsoport, 1–8 szénatomos alkoxi-alkil-csoport, trifluor-metil-csoport, 1–8 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, alkil-amino-csoport, dialkil-amino-csoport, $-OCHR_6CO_2R_7$ általános képletű csoport (ahol R_6 és R_7 jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom vagy 1–8 szénatomos alkilcsoport) vagy X vagy Y 5-tagú gyűrűt képez, amely oxigénatomot tartalmaz, és X jelentése nitrogénatom vagy $-CR_8$ általános képletű csoport (ahol R_8 jelentése hidrogénatom, halogén-alkil-csoport vagy X vagy Y-nal együtt 5-tagú és oxigénatomot tartalmazó gyűrűt képez).
33. példa
(XVI) általános képletű peszticid hatóanyag (4710 221 számú USA-beli szabadalmi leírás), a képletben
- R jelentése hidrogénatom vagy metilcsoport,
- 50 R_1 jelentése 1–3 szénatomos alkilcsoport, 3–4 szénatomos alkoxi-alkil-csoport, 2–4 szénatomos halogén-alkil-csoport, 3–4 szénatomos alkenilcsoport vagy 3–4 szénatomos alkinilcsoport,
- R_2 jelentése 2–6 szénatomos alkoxicsoport, 3–6 szénatomos cikloalkoxicsoport, 4–6 szénatomos cikloalkil-alkoxi-csoport, 1–6 szénatomos halogén-alkoxi-csoport, 2–6 szénatomos alkenil-oxi-csoport, 2–6 szénatomos halogén-alkenil-oxi-csoport, 3–6 szénatomos alkinil-oxi-csoport, 3–6 szénatomos halogén-alkinil-oxi-csoport, 2–4 szénatomos alk-

oxi-alkoxi-csoport, 2–4 szénatomos halogén-alkoxi-alkoxi-csoport, 2–4 szénatomos alkil-tio-alkoxi-csoport, 2–4 szénatomos halogén-alkil-tio-alkoxi-csoport, 2–4 szénatomos alkil-szulfonil-alkoxi-csoport, 2–4 szénatomos halogén-alkil-szulfonil-alkoxi-csoport, 2–4 szénatomos alkil-szulfonil-alkoxi-csoport, 2–4 szénatomos halogén-alkil-szulfonil-alkoxi-csoport, 2–4 szénatomos ciano-alkoxi-csoport, $-\text{OCH}_2\text{CO}-\text{CH}_3$, vagy $-\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{CO}-\text{CH}_3$ képletű csoport, 2–4 szénatomos amino-alkoxi-csoport, 1–8 szénatomos alkil-tio-csoport, 3–6 szénatomos cikloalkil-tio-csoport, 4–6 szénatomos cikloalkil-alkil-tio-csoport, 1–8 szénatomos halogén-alkil-tio-csoport, 2–6 szénatomos alkenil-tio-csoport, 2–6 szénatomos halogén-alkenil-tio-csoport, 3–6 szénatomos alkinil-tio-csoport, 3–6 szénatomos halogén-alkinil-tio-csoport, 2–4 szénatomos alkoxi-alkil-tio-csoport, 2–4 szénatomos halogén-alkoxi-alkil-tio-csoport, 2–4 szénatomos alkil-tio-alkil-tio-csoport, 2–4 szénatomos halogén-alkil-tio-alkil-tio-csoport, 2–4 szénatomos ciano-alkil-tio-csoport, $-\text{SCH}_2\text{CO}-\text{CH}_3$ vagy $-\text{SCH}_2\text{CH}_2\text{CO}-\text{CH}_3$ képletű csoport, 2–4 szénatomos amino-alkil-tio-csoport, $-\text{SC}_6\text{H}_5$, $-\text{SCH}_2\text{C}_6\text{H}_5$ képletű csoport, 1–8 szénatomos alkil-szulfonil-csoport, 3–6 szénatomos cikloalkil-szulfonil-csoport, 4–6 szénatomos cikloalkil-alkil-szulfonil-csoport, 1–8 szénatomos halogén-alkil-szulfonil-csoport, 2–6 szénatomos alkenil-szulfonil-csoport, 2–6 szénatomos halogén-alkenil-szulfonil-csoport, 3–6 szénatomos alkinil-szulfonil-csoport, 3–6 szénatomos halogén-alkinil-szulfonil-csoport, 2–4 szénatomos alkoxi-alkil-szulfonil-csoport, 2–4 szénatomos halogén-alkoxi-alkil-szulfonil-csoport, 2–4 szénatomos ciano-alkil-szulfonil-csoport, $-\text{SO}-\text{CH}_2\text{CO}-\text{CH}_3$ vagy $-\text{SOCH}_2\text{CH}_2\text{CO}-\text{CH}_3$ képletű csoport, 2–4 szénatomos amino-alkil-szulfonil-csoport, 2–8 szénatomos alkil-szulfonil-csoport, 3–6 szénatomos cikloalkil-szulfonil-csoport, 4–6 szénatomos cikloalkil-alkil-szulfonil-csoport, 1–8 szénatomos halogén-alkil-szulfonil-csoport, 2–6 szénatomos alkenil-szulfonil-csoport, 2–6 szénatomos halogén-alkenil-szulfonil-csoport, 3–6 szénatomos alkinil-szulfonil-csoport, 3–6 szénatomos halogén-alkinil-szulfonil-csoport, 2–4 szénatomos alkoxi-alkil-szulfonil-csoport, 2–4 szénatomos halogén-alkoxi-alkil-szulfonil-csoport, 2–4 szénatomos ciano-alkil-szulfonil-csoport, $-\text{SO}_2\text{CH}_2\text{CO}-\text{CH}_3$ vagy $-\text{SO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CO}-\text{CH}_3$ képletű csoport, 2–4 szénatomos amino-alkil-szulfonil-csoport, fluor-metil-csoport, difluor-metil-csoport, klór-metil-csoport, diklór-metil-csoport, bróm-metil-csoport, dibrómmetil-csoport, 2–6 szénatomos alkilcsoport, amely egy-három fluor-, klór- vagy brómatomot hordoz, 2–6 szénatomos alkenilcsoport, 2–6 szénatomos halogén-alkenil-csoport, $-\text{C}=\text{CH}_3$ képletű csoport, 2–6 szénatomos halogén-alkinil-csoport, alkilrészében 1–4 szénatomos $-\text{O}-\text{CO}$ -alkil képletű csoport, $-\text{CH}_3\text{CO}-\text{NR}_a\text{R}_b$ általános képletű csoport, metil-amino-csoport, $-\text{NR}_b$ R_c általános képletű csoport

vagy 1–4 szénatomos alkilcsoport, amely 1–4 szénatomos alkoxicsoporttal, 3–4 szénatomos cikloalkoxicsoporttal, ciklopropil-metoxi-csoporttal, 1–4 szénatomos halogén-alkoxi-csoporttal, 2–4 szénatomos alkenil-oxi-csoporttal, 2–4 szénatomos halogén-alkenil-oxi-csoporttal, 3–4 szénatomos alkinil-oxi-csoporttal, 3–4 szénatomos halogén-alkinil-oxi-csoporttal, 2–4 szénatomos alkoxi-alkoxi-csoporttal, 2–4 szénatomos amino-alkoxi-csoporttal, 1–4 szénatomos alkil-karbonil-oxi-csoporttal, 1–4 szénatomos halogén-alkil-karbonil-oxi-csoporttal, 1–4 szénatomos karbamoil-oxi-csoporttal, 1–4 szénatomos alkoxi-karbonil-oxi-csoporttal, hidroxilcsoporttal, alkilrészében 1–2 szénatomos $-\text{OPO}(\text{O-alkil})_2$ képletű csoporttal, 1–4 szénatomos alkil-szulfonil-oxi-csoporttal, 1–2 szénatomos halogén-alkil-szulfonil-oxi-csoporttal, $-\text{OSi}(\text{CH}_3)_3$ vagy $-\text{OSi}(\text{CH}_3)_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$ képletű csoporttal, 1–4 szénatomos alkil-tio-csoporttal, 3–4 szénatomos cikloalkil-tio-csoporttal, ciklopropil-metil-tio-csoporttal, 1–4 szénatomos halogén-alkil-tio-csoporttal, 2–4 szénatomos alkenil-tio-csoporttal, 2–4 szénatomos halogén-alkenil-tio-csoporttal, 3–4 szénatomos alkinil-tio-csoporttal, 3–4 szénatomos halogén-alkinil-tio-csoporttal, 2–4 szénatomos alkoxi-alkil-tio-csoporttal, 2–4 szénatomos amino-alkil-tio-csoporttal, $-\text{SH}$ csoporttal, alkilrészében 1–2 szénatomos $-\text{SPO}(\text{O-alkil})_2$ képletű csoporttal, 1–4 szénatomos alkil-szulfonil-csoporttal, 3–4 szénatomos cikloalkil-szulfonil-csoporttal, ciklopropil-metil-szulfonil-csoporttal, 1–4 szénatomos halogén-alkil-szulfonil-csoporttal, 2–4 szénatomos alkenil-szulfonil-csoporttal, 2–4 szénatomos halogén-alkenil-szulfonil-csoporttal, 3–4 szénatomos alkinil-szulfonil-csoporttal, 3–4 szénatomos halogén-alkinil-szulfonil-csoporttal, 2–4 szénatomos alkoxi-alkil-szulfonil-csoporttal, 2–4 szénatomos amino-alkil-szulfonil-csoporttal, 1–4 szénatomos alkil-szulfonil-csoporttal, 3–4 szénatomos cikloalkil-szulfonil-csoporttal, ciklopropil-metil-szulfonil-csoporttal, 1–4 szénatomos halogén-alkil-szulfonil-csoporttal, 2–4 szénatomos alkenil-szulfonil-csoporttal, 2–4 szénatomos halogén-alkenil-szulfonil-csoporttal, 3–4 szénatomos alkinil-szulfonil-csoporttal, 3–4 szénatomos halogén-alkinil-szulfonil-csoporttal, 2–4 szénatomos alkoxi-alkil-szulfonil-csoporttal, 2–4 szénatomos amino-alkil-szulfonil-csoporttal, 1–4 szénatomos alkil-szulfonil-csoporttal, 3–4 szénatomos cikloalkil-szulfonil-csoporttal, ciklopropil-metil-szulfonil-csoporttal, 1–4 szénatomos halogén-alkil-szulfonil-csoporttal, 2–4 szénatomos alkenil-szulfonil-csoporttal, 2–4 szénatomos halogén-alkenil-szulfonil-csoporttal, 3–4 szénatomos alkinil-szulfonil-csoporttal, 3–4 szénatomos halogén-alkinil-szulfonil-csoporttal, 2–4 szénatomos alkoxi-alkil-szulfonil-csoporttal vagy 2–4 szénatomos amino-alkil-szulfonil-csoporttal szubsztituálva van,

R_a és R_b jelentése egymástól függetlenül hidrogénatom vagy 1–3 szénatomos alkilcsoport,

R_c jelentése 2–4 szénatomos alkilcsoport, ciklopropil-metil-csoport, 2–4 szénatomos ciano-alkil-csoport, $-\text{CH}_2\text{CO}-\text{CH}_3$ vagy $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CO}-\text{CH}_3$ képletű csoport, 1–4 szénatomos halogén-alkil-csoport, 3–4 szénatomos alkenilcsoport, 3–4 szénatomos halogén-alkenil-csoport, 3–4 szénatomos alkinilcsoport, 3–4 szénatomos halogén-alkinil-csoport, 1–4 szénatomos alkilcsoport, amely 1–4 szénatomos alkoxicsoporttal, 1–4 szénatomos alkiltio-csoporttal, 1–4 szénatomos alkil-szulfonil-csoporttal, 1–4 szén-

- atomos alkil-szulfonil-csoporttal, hidroxil-csoporttal, aminocsoporttal, metil-amino-csoporttal vagy dimetil-amino-csoporttal szubsztituálva van,
 X jelentése metilcsoport, metoxycsoport, etoxycsoport, klóratom vagy brómatom,
 Y szénatomos alkilcsoport, 1–2 szénatomos alkoxycsoport, $-OCH_2CH_2F$, $-OCH_2CHF_2$ vagy $-OCH_2CF_3$ képletű csoport, metil-amino-csoport vagy dimetil-amino-csoport, és
 Z jelentése $=CH-$ vagy $=N-$, valamint mezőgazdaságilag alkalmazható sói.

34–44. példák

Az alkalmazott hatóanyagok:

- A: etil-2-[[[(4-klór-6-metoxi-2-pirimidinil)-amino]-karbonil]-amino]-szulfonil]-benzoát
 B: metil-3-[[[(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)-amino]-karbonil]-amino]-szulfonil]-2-tiofén-karboxilát
 C: metil-2-[[[(4-dimetilamino-6-(2,2,2-trifluor-etoxi)-1,3,5-triazin-2-il)-amino]-karbonil]-amino]-szulfonil]-3-metil-benzoát
 D: 2-klór-N-[[[(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)-amino]-karbonil]-benzol-szulfonamid
 E: metil-2-[[[(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)-amino]-karbonil]-amino]-szulfonil]-benzoát
 F: N-[[[(4,6-dimetoxi-2-pirimidinil)-amino]-karbonil]-3-(etil-szulfonil)]-2-piridin-szulfonamid

A tabletta előállítás:

Az egyes komponenseket elkülönítve megőröljük, majd 0,7 mm-es kerek lyukú szitával ellátott kalapácsmalmon hajtjuk keresztül. A kapott szemcseméret mintegy 5–10 μm .

A komponenseket kimérjük, és egy kisméretű edényben rázogatva összekeverjük. Egy kézi működésű hidraulikus présrel 15 g tömegű és 4,34 cm átmérőjű tablettákat állítunk elő. Az alkalmazott nyomás 525 kg/cm^2 .

Az egyes készítmények összetételét (tömeg%) az alábbi táblázatban adjuk meg:

Komponens	Példa száma					
	34	35	36	37	38	39
A	20					
B		30			67	70
C			40			
citromsav	20	15	20	10	5	5
NaHCO_3	50	45				
KHCO_3				19,8		10
K_2CO_3			25		7	
Lomar PWA	0,5	1,0	10	10	20	10
Polyplasdone XL-10	4,5	5,0	2,0	0,1	0,5	2,5
Monawet MB-100	5,0	4,0	3,0	0,1	0,5	2,5

Komponens	Példa száma				
	40	41	42	43	44
B	40	35			
D			40		
E				35	
F					40
citromsav	20	20	20	20	20
NaHCO_3	30	25	30		30
K_2CO_3				25	
Lomar PWA	5,0	15	5,0	15	5,0
Polyplasdone XL-10	2,5	3,0	2,5	3,0	2,5
Monawet MB-100	2,5	2,0	2,5	2,0	2,5

A tabletták vizsgálata:

A tabletták szétesési idejét 1 l, 25 °C hőmérsékletű vízben 6–7 percnél rövidebb ideig vizsgáljuk.

A diszperzió minőségét három szitából (0,3 mm, 0,15 mm, 0,075 mm) álló sorozaton ellenőrizzük. A szitaméretnek a szokásos fűvókaméretnek felel meg. Az egyes szitákon felfogott maradékot leöblítjük, és szárazra pároljuk. A kapott száraz maradékot tömegét az alábbi táblázatban adjuk meg. A nemzetközi CIPAC módszer szerint legfeljebb 2% maradék mérhető a 0,075 mm-es szitán. Ez egy 15 g-os tabletta esetében 0,3 g-nak felel meg. A táblázatban megadott mérési adatok a fenti határ alatt maradnak.

Példaszám	Szétesési idő (perc : másodperc)	Nedves szitammaradék (g)		
		0,3 mm	0,15 mm	0,075 mm
34	5 : 20	0,005	0,002	0,057
35	4 : 52	0,003	0,002	0,017
36	3 : 49	0,001	0,001	0,057
37	5 : 11	0,001	0,002	0,002
38	4 : 26	0,025	0,034	0,081
39	2 : 13	0,014	0,022	0,079
40	4 : 11	0,006	0,005	0,023
41	2 : 25	0,002	0,003	0,023
42	5 : 26	0,002	0,003	0,072
43	4 : 17	0,002	0,002	0,018
44	2 : 19	0,002	0,002	0,032

45. példa (összehasonlító példa)

Hatóanyagként permetrint tartalmazó tablettát állítunk elő a GB 2 139 893 sz. irat 2. oldalán található példa szerint. Az összetételt csak annyiban változtattuk meg, hogy a hatóanyag mennyiségét a jelenleg igényelt tartománynak megfelelően megnöveltük. A permetrint összekevertük a Siponate és Tergitol nevű

adalékokkal, majd a keveréket metilén-dikloridban oldottuk. A porított anyagokat külön összekevertük, majd egyesítettük a metilén-dikloridos oldattal, végül szárítottuk. Szitálás után a 3a táblázatban megadott módon tablettáztuk.

A 3a táblázatban megadott adatok szerint a 90 t% hatóanyagot tartalmazó tablettá rosszul oldódik. További problémát jelent a sziták eltömődése, valamint a készítmény gumiszertű, tapadós jellege.

3. táblázat

Komponensek	tömeg %		gramm		tömeg %		gramm	
permetrin	20	4	25	5	30	6		
Siponate DS-10 (emulgeátor)	0,35	0,07	0,35	0,07	0,35	0,07		
Tergitol XD (diszpergátor)	0,65	0,13	0,65	0,13	0,65	0,13		
polivinil-pirrolidon	8	1,6	8	1,6	8	1,6		
bórsav	4,9	0,98	4,9	0,98	4,9	0,98		
borkósav	28,1	5,62	26	5,2	23,8	4,76		
NaHCO ₃	37,5	7,5	34,6	6,92	31,8	6,36		
Cab-O-Sil (habzágátló)	0,5	0,1	0,5	0,1	0,5	0,1		

3a táblázat

Fizikai tulajdonságok	Hatóanyag mennyisége		
	20 tömeg%	25 tömeg%	30 tömeg%
szárítási idő	1,5 óra	1,5 óra	1,5 óra
szárítási hőmérséklet (°C)	45	45	45
szita méret (mm)	1,19	1,19	1,19
prés mérete (cm)	3,5	3,5	3,5
nyomás (10 ⁷ Pa)	1,38	1,38	1,38
tömeg (g)	5	5	5
vastagság (cm)	0,391	0,388	0,373
víz hőmérséklete (°C)	21	21	21
szita	darabos	darabos	darabos
0,075 mm-es szita maradéka (g)	0,384	0,837	1,2479
alámerülés ideje (perc : mperc)	1 : 40	1 : 58	2 : 29
megjegyzés:			
(1) oldódás ideje (perc : mperc)	3 : 24	3 : 00	3 : 45-10 : 00

5

10

Fizikai tulajdonságok	Hatóanyag mennyisége		
	20 tömeg%	25 tömeg%	30 tömeg%
(2)	enyhén eltömíti a prést	enyhén eltömíti a prést	mindkét présfóát eltömíti
(3)	gumiszertű maradék a szitán	20% gumiszertű maradék	25% gumiszertű maradék

46. példa (összehasonlító példa)

Hatóanyagként deltametrin tartalmazó tablettát állítottunk elő a 45. példában leírt módon. A mérési eredmények szerint az oldódási idő nagyon hosszú (több mint 9,5 perc), a szita eltömődik. A 0,075 mm-es szitán mért maradék a tablettá tömegének mintegy 10%-a, ami túlságosan nagy érték.

15

20

25

30

4. táblázat

Komponensek	tömeg%	gramm
deltametrin	20	1,8
Siponate DS-10 (emulgeátor)	0,35	0,0315
Tergitol XD (diszpergátor)	0,65	0,0585
polivinil-pirrolidon	8	0,72
bórsav	4,9	0,441
borkósav	28,1	2,529
NaHCO ₃	37,5	3,375
Cab-O-Sil (habzágátló)	0,5	0,045

35

40

45

50

4a táblázat

Fizikai tulajdonságok	
szárítási idő	1,5 óra
szárítási hőmérséklet (°C)	45
szita méret (mm)	1,19
prés mérete (cm)	3,5
nyomás (10 ⁷ Pa)	1,38
tömeg (g)	8,6
vastagság (cm)	0,732
víz hőmérséklete (°C)	21
0,075 mm-es szita maradéka (g)	0,8751
alámerülés ideje (perc : mperc)	0 : 02
megjegyzés:	
(1) oldódás ideje (perc : mperc)	9 : 37
(2) sok maradék a szitán	

55

60

47. példa (összehasonlító példa)

Hatóanyagként deltametrin tartalmazó tablettát állítottunk elő a 2. példában bemutatott találmány szerinti megoldással. A mérési eredmények alapján a készítmény megfelelő oldódási idővel rendelkezik, az előállítás során nehézségek nem jelentkeznek, a szitamaradék csekély.

5. táblázat

Komponens	tömeg%	gramm
deltametrin	20	1,8
citromsav	18,4	1,656
NaHCO ₃	47,2	4,248
Lomar PWA (diszpergátor)	5	0,45
Polypladone XL-10	1	0,09
Monawet MB-100 (nedvesítőszer)	1	0,09
bórsav	5	0,45
magnézium-sztearát	0,3	0,027

5a táblázat

Fizikai tulajdonságok	
Órlés	1 perc CRC analitikai malomban
prés mérete (cm)	3,5
nyomás (10 ⁷ Pa)	5,17
tömeg (g)	8,6
vastagság (cm)	0,617
víz hőmérséklete (°C)	21
0,075 mm-es szita maradéka (g)	0,0097
alámértülés ideje (perc : mperc)	0 : 35
megjegyzés:	
(1) oldódás ideje (perc : mperc)	4 : 20
(2) a tableta préshez nem tapad	
(3) a szítán csak nyomnyi maradék	

SZABADALMI IGÉNYPONTOK

1. Tabletta formájú peszticid vagy növekedésszabályozó készítmény, *azzal jellemezve*, hogy összetétele:

- i) 20–75 tömeg% peszticid vagy növekedésszabályozó hatóanyag, amelynek olvadáspontja legalább 100 °C, és vízzoldékonysága 20 °C hőmérsékleten legfeljebb 5 tömeg%,
- ii) 25–80 tömeg%, a hatóanyaggal komplementer hordozóanyag-rendszer, amelynek összetétele:
 - a) 5–20 tömeg% dibázisos vagy tribázisos szerves karbonsav vagy ilyenek elegye,
 - b) 7–50 tömeg% ammónium- vagy alkálifém-karbonát vagy -hidrogén-karbonát vagy ilyenek elegye,
 - c) 0,5–20 tömeg% diszpergálószer,
 - d) 0,1–5 tömeg% vízben oldhatatlan, keresztkötéses poli(vinil-pirrolidon),
 - e) 0,1–5 tömeg% anionos vagy nemionos nedvesítőszer,
- iii) a 100 tömeg%-hoz szükséges mennyiségű hordozóanyag és adott esetben adalékanyag, ahol a készítmény vízben diszpergálva 0,30 mm-es szil-

tán áthaladó diszperziót képez, és sűrűsége nagyobb, mint 1,00.

2. Az 1. igénypont szerinti készítmény, *azzal jellemezve*, hogy peszticidként herbicid hatóanyagot tartalmaz.

3. Az 1. igénypont szerinti készítmény, *azzal jellemezve*, hogy peszticidként fungicid hatóanyagot tartalmaz.

4. Az 1. igénypont szerinti készítmény, *azzal jellemezve*, hogy peszticidként inszekticid hatóanyagot tartalmaz.

5. Az 1. igénypont szerinti készítmény, *azzal jellemezve*, hogy peszticidként nematocid hatóanyagot tartalmaz.

6. Az 1. igénypont szerinti készítmény, *azzal jellemezve*, hogy peszticidként akaricid hatóanyagot tartalmaz.

7. Az 1. igénypont szerinti készítmény, *azzal jellemezve*, hogy peszticidként baktericid hatóanyagot tartalmaz.

8. Az 1. igénypont szerinti készítmény, *azzal jellemezve*, hogy hatóanyagként növekedésszabályozó anyagot tartalmaz.

9. A 2. igénypont szerinti készítmény, *azzal jellemezve*, hogy herbicidként 3-ciklohexil-6-dimetil-amino-1-metil-1,3,5-triazin-2,4(1H,3H)-diont tartalmaz.

10. A 2. igénypont szerinti készítmény, *azzal jellemezve*, hogy herbicid hatóanyagként (2,4-diklór-fenoxi)-ecetsavat tartalmaz.

11. A 2. igénypont szerinti készítmény, *azzal jellemezve*, hogy herbicid hatóanyagként valamely szulfonamidot tartalmaz.

12. A 11. igénypont szerinti készítmény, *azzal jellemezve*, hogy szulfonamidként 3-[[[(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)-amino]-karbonil]-amino]-szulfonil]-2-tiofén-karbonsav-metil-észtert tartalmaz.

13. A 11. igénypont szerinti készítmény, *azzal jellemezve*, hogy szulfonamidként metil-2-[[[(4-metoxi-6-metil-1,3,5-triazin-2-il)-amino]-karbonil]-amino]-szulfonil]-benzoátot tartalmaz.

14. A 11. igénypont szerinti készítmény, *azzal jellemezve*, hogy szulfonamidként etil-2-[[[(4-klór-6-metoxi-2-pirimidinil)-amino]-karbonil]-amino]-szulfonil]-benzoátot tartalmaz.

15. A 11. igénypont szerinti készítmény, *azzal jellemezve*, hogy 52 tömeg% szulfonamidot, 10 tömeg% citromsavat, 26 tömeg% nátrium-hidrogén-karbonátot, 5 tömeg% naftalin-szulfonsavsó és ammóniumsó kondenzátumot, 1 tömeg% keresztkötéses polivinil-pirrolidon, 1 tömeg% nátrium-dialkil-szulfoszukcinátot és 5 tömeg% bórsavat tartalmaz.

16. A 11. igénypont szerinti készítmény, *azzal jellemezve*, hogy 52,1 tömeg% szulfonamidot, 25,6 tömeg% nátrium-hidrogén-karbonátot és 0,3 tömeg% magnézium-sztearátot tartalmaz.

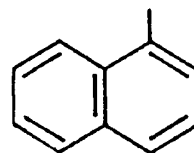
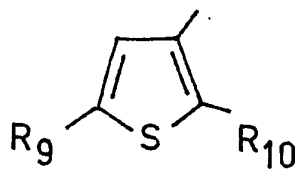
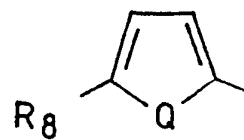
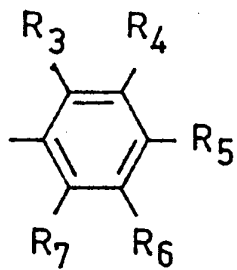
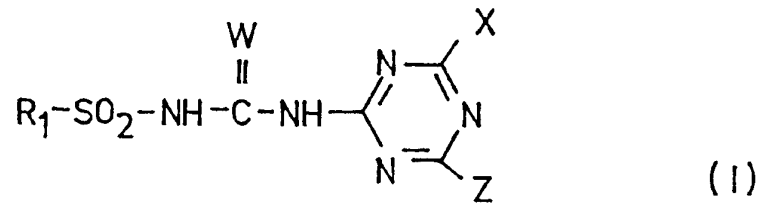
17. A 3. igénypont szerinti készítmény, *azzal jellemezve*, hogy fungicid hatóanyagként metil-2-benzimidazol-karbamátot tartalmaz.

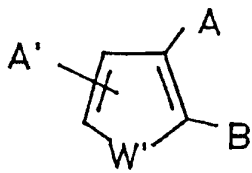
18. A 4. igénypont szerinti készítmény, *azzal jellemezve*, hogy inszekticid hatóanyagként transz-5-(4-

klór-fenil)-N-ciklohexil-4-metil-2-oxotiazolidin-3-karboxamidot tartalmaz.

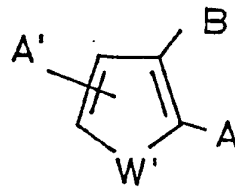
19. A 6. igénypont szerinti készítmény, *azzal jelle-*

mezve, hogy akaricid hatóanyagként (4RS,5RS)-5-(4-klór-fenil)-N-ciklohexil-4-metil-2-oxo-1,3-tiazolidin-3-karboxamidot tartalmaz.

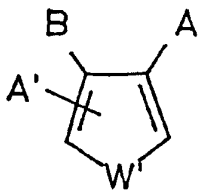




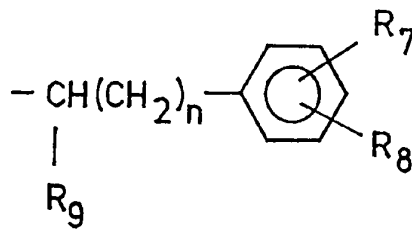
(II)



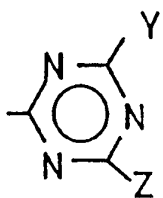
(II')



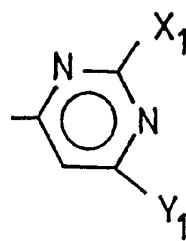
(II'')



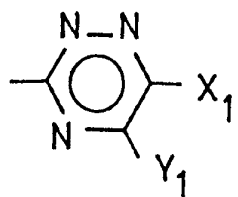
(IIa)



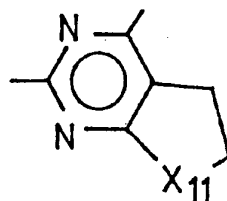
(IIb)



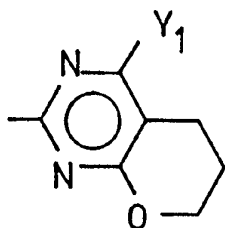
(IIc)



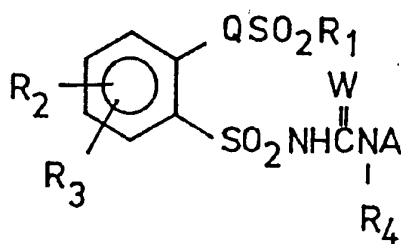
(II d)



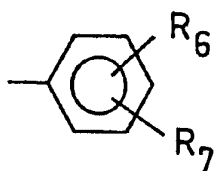
(II e)



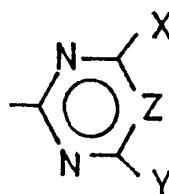
(II f)



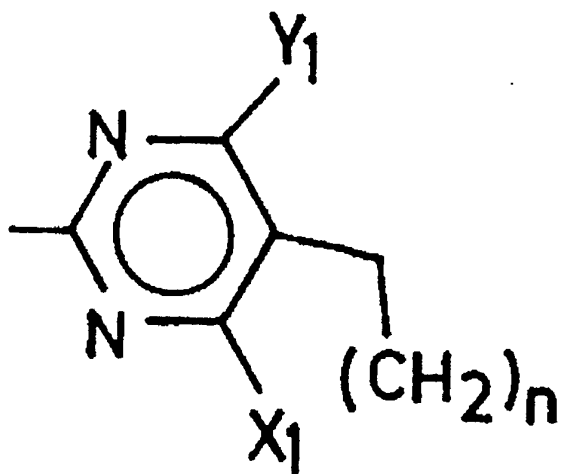
(III)



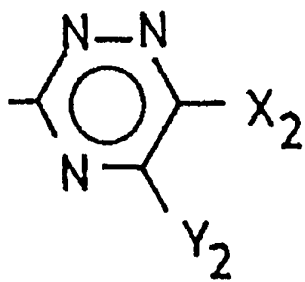
(III a)



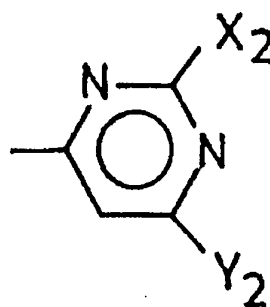
(III b)



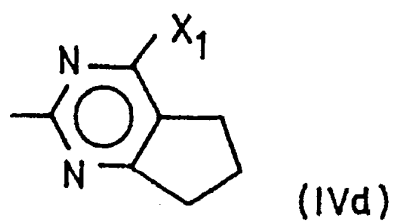
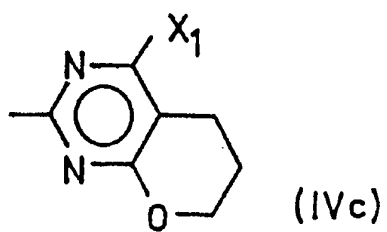
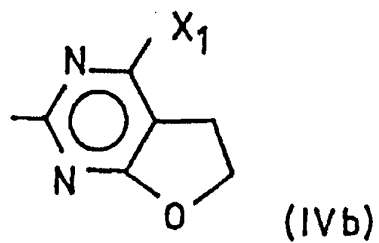
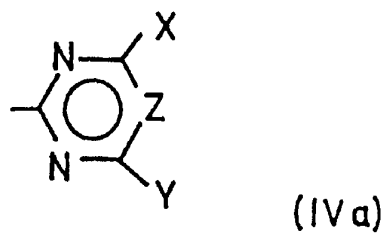
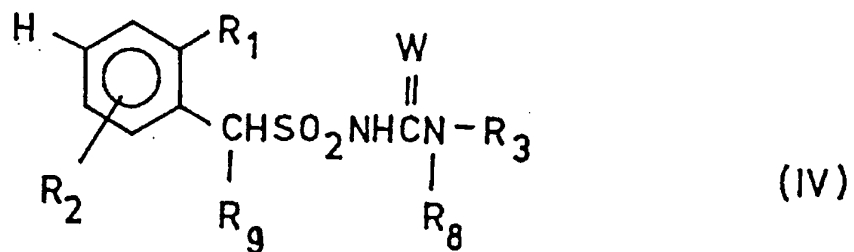
(III c)

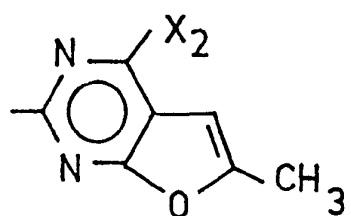


(III d)

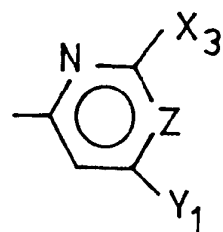


(III e)

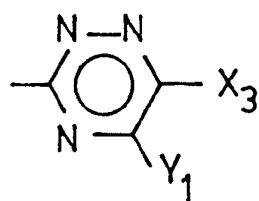




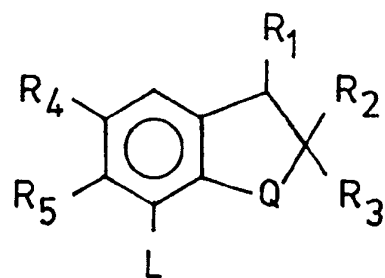
(IVe)



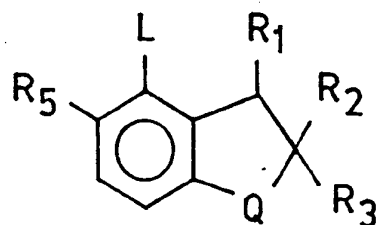
(IVf)



(IVg)



(V)



(V')

