



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU K PATENTU

199741

(11)

(B2)

(51) Int. Cl.³
A 01 N 47/34

(22) Přihlášeno 28 07 78
(21) (PV 5016-78)

(32) (31) (33) Právo přednosti od 01 08 77
(820882) Spojené státy americké

(40) Zveřejněno 31 10 79

(45) Vydáno 15 07 83

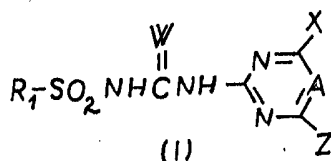
(72)
Autor vynálezu LEVITT GEORGE, WILMINGTON (Sp. st. a.)

(73)
Majitel patentu E. I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY, WILMINGTON (Sp. st. a.)

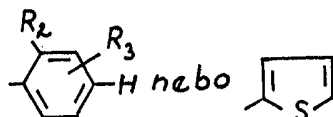
(54) Herbicidní prostředek

1

Vynález se týká herbicidních prostředků obsahujících jako účinnou látku heterocyklickým zbytkem substituované N-(amino-karbonyl)arylsulfonamidy obecného vzorce I



ve kterém
R₁ značí zbytek vzorce



R₂ a R₃ značí nezávisle na sobě atom vodíku, fluoru, chloru nebo bromu, nebo methylovou skupinu, methoxyskupinu, nitroskupinu nebo trifluormethylovou skupinu,

W představuje atom kyslíku nebo síry,
X značí skupinu vzorce —NHCH₃ nebo —N(CH₃)₂,

Z značí methylovou skupinu nebo methoxyskupinu a

2

A značí skupinu CH nebo atom dusíku, s podmínkou, že značí-li R₂ nitroskupinu nebo trifluormethylovou skupinu, nesmí R₃ představovat nitroskupinu nebo trifluormethylovou skupinu, nebo jejich zemědělsky vhodné soli, a způsobu výroby uvedených substituovaných arylsulfonamidů obecného vzorce I. Vynález se dále týká způsobu použití uvedených chemických prostředků jednak jako selektivních a jednak jako povšechných herbicidů s preemergentní i postemergentní účinností.

Přítomnost nežádoucí vegetace způsobuje velké škody na porostech kulturních rostlin, zvláště na porostech zemědělských plodin, které zabezpečují základní potřebu lidské potravy, jako jsou například sójové boby, pšenice a podobné. Současná populační exploze a s ní spojený celosvětový nedostatek potravin si vyžadují zlepšení efektivnosti pěstování uvedených kulturních plodin. Jednou z cest zlepšování zmíněné efektivnosti je zamezení nebo minimalizace ztrát těchto cenných kulturních rostlin tím, že se vyhubí nebo potlačí růst nežádoucí vegetace.

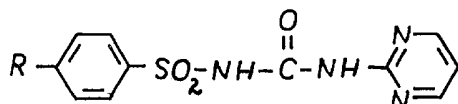
K hubení nežádoucí vegetace nebo k inhibici jejího růstu je k dispozici velké množství látek; takové látky se obvykle nazývají herbicidy. Avšak stále existuje potřeba ještě

účinnějších herbicidů, které by ničily nebo zpomalovaly růst plevelů, aniž by signifikantně poškozovaly kulturní rostliny.

Substituované arylsulfonamidy obecného vzorce I jsou vysoce účinnými herbicidy, kterých lze obzvláště používat k potlačování růstu plevelů v pšenici.

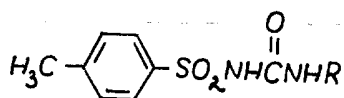
Některé substituované arylsulfonamidy strukturálně blízké sloučeninám obecného vzorce I jsou známy.

Ve francouzském patentu č. 1 468 747 jsou popsány para-substituované fenylysulfonamidy obecného vzorce

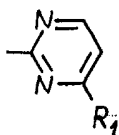


ve kterém R značí atom vodíku nebo halogenu, nebo trifluormethylovou nebo alkylovou skupinu, které mají antidiabetickou účinnost.

Logemann a spolupracovníci, Chem. Abstr. **53**, 18052g (1959), popisují řadu sulfonamidů, zahrnující též deriváty uracilu, obecného vzorce

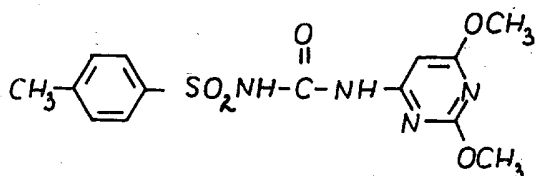


ve kterém R značí butylovou nebo fenylovou skupinu nebo zbytek obecného vzorce



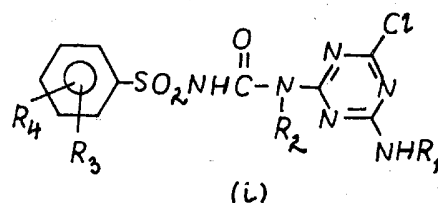
ve kterém R1 značí atom vodíku nebo methylovou skupinu. Při testování těchto látek na hypoglykemickou účinnost u krys (v orálních dávkách 25 mg/100 g) byla nejúčinnější sloučenina, ve které R značí butylovou nebo fenylovou skupinu. Ostatní látky vykazovaly nižší účinnost nebo byly inaktivní.

Wojciechowski, J. Acta Polon. Pharm. **19**, 121 až 125 (1962) [Chem. Abstr. **59**, 1633e] popisuje syntézu N-[(2,6-dimethoxypyrimidin-4-yl)aminokarbonyl]-4-methylbenzensulfonamidu vzorce



Vzhledem k podobnosti se známými látkami předpokládá autor u zmíněné sloučeniny hypoglykemickou účinnost.

V holandském patentu č. 121 788 je popsána příprava sloučenin obecného vzorce (i)

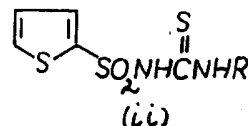


ve kterém

R1 a R2 značí nezávisle na sobě alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, a

R3 a R4 značí nezávisle na sobě atom vodíku nebo chloru, nebo alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, a jejich použití jako povšechných nebo selektivních herbicidů.

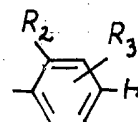
V časopisu J. Drug. Res. **6**, 123 (1974) jsou popsány sloučeniny obecného vzorce (ii)



ve kterém R značí pyridylovou skupinu, a jejich použití jako antidiabeticky účinných látek.

Ze substituovaných arylsulfonamidů obecného vzorce I podle vynálezu jsou pro vysokou herbicidní účinnost nebo pro příznivé výrobní náklady, nebo z obou uvedených důvodů, výhodné ty sloučeniny obecného vzorce I, ve kterém

R1 značí zbytek obecného vzorce



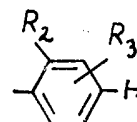
ve kterém, nezávisle na sobě,

R2 značí atom fluoru, chloru nebo bromu, methylovou skupinu nebo nitroskupinu, a

R3 značí atom vodíku, fluoru, chloru nebo bromu nebo methylovou skupinu.

Ještě výhodnější pro jejich vyšší herbicidní účinnost nebo příznivější výrobní náklady, nebo z obou uvedených důvodů, jsou ty sloučeniny obecného vzorce I, ve kterém

R1 značí zbytek obecného vzorce



ve kterém

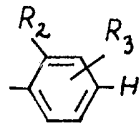
R2 značí atom chloru, methylovou skupinu nebo nitroskupinu, a

R3 značí atom vodíku nebo chloru, nebo methylovou skupinu.

Nejvýhodnější pro jejich vynikající herbicidní účinnost nebo pro jejich ještě přízni-

větší výrobní náklady, nebo z obou uvedených důvodů, jsou ty sloučeniny obecného vzorce I, ve kterém

R_1 značí zbytek obecného vzorce



ve kterém

R_2 značí atom chloru, methylovou skupinu nebo nitroskupinu,

R_3 značí atom vodíku nebo chloru nebo methylovou skupinu, a

W značí atom kyslíku.

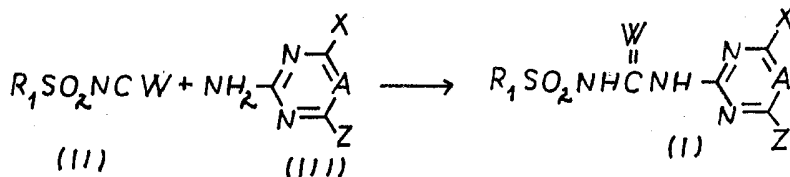
Specificky jsou pro vynikající herbicidní účinnost nebo pro vysoce příznivé výrobní náklady, nebo z obou uvedených důvodů, výhodné následující konkrétní sloučeniny:

2-chlor-N-[4-methoxy-6-methylamino-1,3,5-triazin-2-yl]aminokarbonylbenzensulfonamid, t. t. 224 až 228 °C;

2-chlor-N-[4-dimethylamino-6-methoxy-1,3,5-triazin-2-yl]aminokarbonylbenzensulfonamid, t. t. 200 až 206 °C;

N-[4-dimethylamino-6-methoxy-1,3,5-triazin-2-yl]aminokarbonyl-2-methylbenzensulfonamid, t. t. 194 až 198 °C;

N-[4-methoxy-6-methylamino-1,3,5-triazin-2-yl]aminokarbonyl-2-methylbenzensulfonamid, t. t. 199 až 202 °C;



ve které R_1 , W , X , Z a A mají shora uvedený význam.

Reakce se s výhodou provádí v inertním aprotickém organickém rozpouštědle, jako v methylenchloridu, tetrahydrofuranu nebo acetonitrilu, při normálním tlaku a za teploty místnosti. Způsob přidávání reakčních komponent není kritický, avšak většinou je účelné přidávat sulfonylisokyanát nebo sulfonylthiokyanát za míchání k suspenzi aminoheterocyklické sloučeniny. Vzhledem k tomu, že isokyanáty a isothiokyanáty jsou obvykle kapaliny, dá se jejich přidávání snadno kontrolovat.

Reakce je obvykle exotermická. V některých případech jest žádaný produkt nerozpustný v teplém reakčním prostředí a vykrytalizuje z něho v čisté formě. Produkty rozpustné v reakčním prostředí se izolují tím způsobem, že se rozpouštědlo odpaří, pevný odparek se roztře s malým množstvím vhodného rozpouštědla, jako s 1-chlorbutanem, ethyletherem nebo pentanem, a produkt se odfiltruje.

Výchozí sulfonylisokyanáty obecného vzorce II (ve kterém W značí atom kyslíku) se

N-[4-dimethylamino-6-methoxypyrimidin-2-yl]aminokarbonyl-2-methylbenzensulfonamid, t. t. 238 až 239 °C;

N-[4-dimethylamino-6-methoxy-1,3,5-triazin-2-yl]aminokarbonyl-2-nitrobenzensulfonamid, t. t. 212 až 213 °C, a

N-[4-methylamino-6-methoxy-1,3,5-triazin-2-yl]aminokarbonyl-2-nitrobenzensulfonamid.

Sloučeniny obecného vzorce I mají vedle vynikající herbicidní účinnosti vůči širokému spektru rostlin rovněž významnou selektivní účinnost na potlačování růstu kukuřice vzešlé z přirozeně zasetých semen v kulturách sójy, na inhibici růstu plevelů v pšenici, na inhibici růstu křovin a tropických vodních hyacintů. Sloučenin obecného vzorce I lze kromě toho používat též jako regulátorů růstu rostlin, jako například ke zvyšování obsahu cukru v cukrové třtině a v čiroku a k potlačování tvorby semen u trav, jako u tropické prosovitě obilniny druhu *Paspalum notatum*.

Substituované arylsulfonamidy obecného vzorce I lze podle vynálezu vyrábět tím způsobem, že se příslušná 2-aminosubstituovaná heterocyklická sloučenina obecného vzorce III uvede do reakce s příslušně substituovaným sulfonylisokyanátem nebo sulfonylthiokyanátem obecného vzorce II podle níže uvedené reakční rovnice

dají připravit reakcí příslušných sulfonamidů s fosgenem v přítomnosti n-butyliisokyanátu při teplotě varu vhodného rozpouštědla, jako chlorbenzenu, způsobem popsaným H. Ulrichem a A. A. Y. Sayighem v příručce o novějších metodách preparativní organické chemie [Newer Methods of Preparative Organic Chemistry, svazek VI, str. 223 až 241, Academic Press, New York and London, vydavatel W. Foerst]. V případech, kdy příprava žádaného sulfonylisokyanátu uvedeným způsobem je nesnadná, lze podle shora uvedeného odkazu postupovat tím způsobem, že se působí fosgenem na sulfonylmočovinu vzniklou reakcí butyliisokyanátu s příslušným sulfonamidem.

Příprava sulfonamidů působením hydroxidu amonného na sulfonylchloridy jest podrobně popsána v literatuře, viz například Crossley a spolupracovníci, J. Am. Chem. Soc. 60, 2223 (1938).

Některé sulfonylchloridy se nejlépe připravují chlorsulfonací substituovaného benzenu nebo thiofenu způsobem popsaným H. T. Clarkem a spolupracovníky, Org. Synth., kolektivní svazek 1, druhé vydání, 1941, str.

85. Jiné benzensulfonylchloridy se s výhodou připravují diazotací příslušného anilinu dusitanem sodným v prostředí kyseliny chlorovodíkové a následující reakcí vzniklé diazoniové soli s kyslíčným sířičitým v přítomnosti chloridu měďného v prostředí kyseliny octové, způsobem podle H. L. Yaleho a F. Sowinskiho, J. Org. Chem. **25**, 1824 (1960).

Sulfonylisothiokyanáty lze připravit působením sirouhlíku a hydroxidu draselného na příslušný sulfonamid a následující reakcí vzniklé dvojdraselné soli s fosgenem, způsobem popsaným K. Hartkem, Arch. Pharm. **229**, 174 (1966).

Syntéza heterocyklických aminoderivátů jest popsána v monografiích „The Chemistry of Heterocyclic Compounds“, sérii publikované nakladatelstvím Interscience Publ., New York a Londýn. 2-Aminopyrimidiny jsou popsány D. J. Brownem ve svazku XVI. shora uvedené řady „The Pyrimidines“.

2-Amino-1,3,5-triaziny lze syntetizovat způsobem popsanými E. M. Smolinem a L. Rapaportem ve svazku XIII. téže řady „s-Triazines and Derivatives“.

Zemědělsky vhodné soli sloučenin obecného vzorce I mají rovněž herbicidní účinnost a lze je připravovat různými způsoby, které jsou odborníkům dobře známé. Například soli s kovy lze připravit tím způsobem, že se na sloučeniny obecného vzorce I působí roztokem soli alkalického kovu nebo kovu alkalických zemin, která má dostatečně basický anion (například hydroxidem, alkoxidem, uhličitánem nebo hydridem kovu). Soli s kvartérními aminy lze vyrábět podobnou pracovní technikou.

Soli sloučenin obecného vzorce I lze rovněž připravit výměnou jednoho kationtu za jiný. Výměnu kationtů lze uskutečnit přímým působením vodného roztoku soli sloučeniny obecného vzorce I (například soli s alkalickým kovem nebo kvartérní amoniové soli) na roztok soli kationtu, který má být vyměněn. Tato metoda je nejúčinnější

tehdy, když žádaná sůl obsahující vyměněný kation je nerozpustná ve vodě a lze ji oddělit filtrací.

Výměnu kationtů lze rovněž provádět tak, že se vodný roztok soli sloučeniny obecného vzorce I (například soli s alkalickým kovem nebo kvartérní amoniové soli) nechá protékat přes sloupec katexové pryskyřice obsahující kation, který se má vyměnit. Při tomto způsobu se kation vázaný v pryskyřici vymění za kation v původní soli sloučeniny obecného vzorce I a žádaný produkt se pak ze sloupce eluuje. Tato metoda je zvláště výhodná tehdy, je-li žádaná sůl rozpustná ve vodě.

Adiční soli sloučenin podle vynálezu s kyselinami lze získat reakcí sloučeniny obecného vzorce I s vhodnou kyselinou, například s kyselinou p-toluensulfonovou, kyselinou trichloroctovou a podobnými.

Způsob výroby sloučenin obecného vzorce I je blíže objasněn v následujících příkladech provedení, ve kterých je teplota udána ve stupních Celsia (°C) a díly značí, pokud není uvedeno jinak, hmotnostní díly.

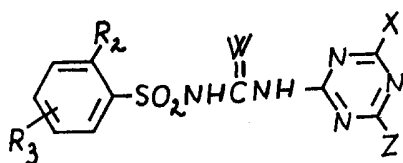
Příklad 1

2-Chlor-N-[(4-methoxy-6-methylamino-1,3,5-triazin-2-yl)aminokarbonyl]-benzensulfonamid

K roztoku 2,1 g 2-amino-4-methoxy-6-methylamino-1,3,5-triazinu v 60 ml horkého acetonitrilu se přikape za míchání roztok 3,3 g 2-chlorbensensulfonylisokyanátu ve 20 mililitrech acetonitrilu. Reakční směs se míchá 18 hodin při teplotě místnosti a pak se vyloučený produkt odfiltruje; získá se shora uvedená sloučenina o teplotě tání 224 až 228 °C.

Způsobem podle příkladu 1, ale za použití ekvivalentních množství příslušného derivátu amino-1,3,5-triazinu a sulfonylisokyanátu nebo sulfonylisothiokyanátu, lze připravit sloučeniny uvedené v tabulce I.

Sloučeniny obecného vzorce



R ₂	R ₃	W	X	Z	t. t. (°C)
Cl	H	O	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	200 až 206
Cl	5-Cl	O	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	204 až 206
Cl	5-Cl	O	NHCH ₃	OCH ₃	219 až 228
CH ₃	5-CH ₃	O	NHCH ₃	OCH ₃	192 až 195
CH ₃	H	O	NHCH ₃	OCH ₃	199 až 202
H	H	O	NHCH ₃	OCH ₃	281 až 286
H	H	O	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	210 až 213
F	H	O	NHCH ₃	OCH ₃	195 až 202
OCH ₃	5-Cl	O	NHCH ₃	OCH ₃	198 až 203
Cl	6-Cl	O	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	211 až 213
Cl	5-CH ₃	O	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	215 až 216
F	H	O	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	183 až 186
OCH ₃	5-Cl	O	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	225 až 230
CH ₃	5-CH ₃	O	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	193 až 196
OCH ₃	5-OCH ₃	O	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	195 až 200
NO ₂	H	O	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	212 až 213
NO ₂	H	O	NHCH ₃	OCH ₃	
Cl	5-NO ₂	O	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	
CH ₃	5-NO ₂	O	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	
Cl	3-Cl	O	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	
OCH ₃	5-OCH ₃	O	NHCH ₃	OCH ₃	
CF ₃	H	O	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	
CH ₃ O	H	O	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	
H	3-Cl	O	NHCH ₃	OCH ₃	
H	3-F	O	NHCH ₃	OCH ₃	
H	3-CH ₃	O	NHCH ₃	OCH ₃	
H	3-Br	O	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	
H	3-NO ₂	O	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	
F	6-F	O	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	
F	5-F	O	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	
Cl	5-CF ₃	O	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	
Cl	5-NO ₂	O	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	
Cl	5-CH ₃	O	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	
Cl	5-Cl	S	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	
Cl	H	S	N(CH ₃) ₂	CH ₃	
Cl	5-Cl	S	N(CH ₃) ₂	CH ₃	
Cl	3-F	O	NHCH ₃	CH ₃	
Br	5-Br	O	N(CH ₃) ₂	CH ₃	
Cl	6-Cl	S	N(CH ₃) ₂	CH ₃	
CH ₃	5-Br	O	N(CH ₃) ₂	CH ₃	
CH ₃	5-Cl	O	N(CH ₃) ₂	CH ₃	
CH ₃	5-F	O	N(CH ₃) ₂	CH ₃	
OCH ₃	5-Cl	S	N(CH ₃) ₂	CH ₃	
OCH ₃	5-Cl	O	N(CH ₃) ₂	CH ₃	
H	H	O	N(CH ₃) ₂	CH ₃	
Cl	H	O	N(CH ₃) ₂	CH ₃	
Cl	5-Cl	O	N(CH ₃) ₂	CH ₃	
OCH ₃	5-OCH ₃	O	N(CH ₃) ₂	CH ₃	
CH ₃	5-CH ₃	O	N(CH ₃) ₂	CH ₃	
Cl	6-Cl	O	N(CH ₃) ₂	CH ₃	
Br	H	O	N(CH ₃) ₂	CH ₃	
CH ₃	H	O	N(CH ₃) ₂	CH ₃	
CF ₃	H	O	N(CH ₃) ₂	CH ₃	
NO ₂	H	O	N(CH ₃) ₂	CH ₃	

9		10			
R ₂	R ₃	W	X	Z	t. t. (°C)
F	H	O	N(CH ₃) ₂	CH ₃	
F	6-F	O	N(CH ₃) ₂	CH ₃	
Cl	6-Cl	O	N(CH ₃) ₂	CH ₃	
H	H	O	NHCH ₃	CH ₃	
Cl	H	O	NHCH ₃	CH ₃	
Br	H	O	NHCH ₃	CH ₃	
CH ₃	H	O	NHCH ₃	CH ₃	
CF ₃	H	O	NHCH ₃	CH ₃	
NO ₂	H	O	NHCH ₃	CH ₃	
F	H	O	NHCH ₃	CH ₃	

Příklad 2

N-[(4-Dimethylamino-6-methoxy-1,3,5-triazin-2-yl)aminokarbonyl]-2-methylbenzensulfonamid

K roztoku 0,85 g 2-amino-4-dimethylamino-6-methoxy-1,3,5-triazinu ve 40 ml methylenchloridu se za míchání přikape roztok 1,0 g 2-methylbenzensulfonylisokyanátu v 10 ml methylenchloridu. Reakční směs se míchá 24 hodin při teplotě místnosti, ze vzniklého roztoku se oddestiluje rozpouštědlo a pevný odparek se překrystalizuje ze směsi benzenu s hexanem. Získá se v nadpisu uvedený produkt o teplotě tání 194 až 198 °C.

Příklad 3

N-[(4-Dimethylamino-6-methoxy-1,3,5-triazin-2-yl)aminokarbonyl]-2-thiophensulfonamid

K roztoku 1,7 g 2-amino-4-dimethylamino-6-methoxy-1,3,5-triazinu v 50 ml horkého acetonitrilu se za míchání přikape roztok 1,9 g thiophensulfonylisokyanátu v 10 ml acetonitrilu. Reakční směs se míchá 18 hodin a vyloučený produkt se odfiltruje. Získá se 2,0 g v nadpisu uvedeného produktu o t. t. 192 až 195 °C.

Způsobem popsaným v příkladu 3 se získá rovněž N-[(4-methoxy-6-methylamino-1,3,5-triazin-2-yl)aminokarbonyl]-2-thiophensulfonamid o teplotě tání 208 až 210 °C.

Příklad 4

N-[(4-Methoxy-6-methylamino-1,3,5-triazin-2-yl)aminokarbonyl]-2-thiophensulfonamid, sodná sůl

K suspenzi 2,5 g N-[(4-methoxy-6-methylamino-1,3,5-triazin-2-yl)aminokarbonyl]-2-thiophensulfonamidu v 50 ml vody se při-

dají 3 ml 10% hydroxidu sodného. Získaný roztok se zfiltruje a filtrát se ochladí, přičemž se vyloučí bezbarvý krystalický produkt. Po odfiltrování se získá 1,1 g shora uvedené sodné soli o teplotě tání 297 až 298 °C.

Příklad 5

N-[(4-Dimethylamino-6-methylpyrimidin-2-yl)aminokarbonyl]benzensulfonamid

K suspenzi 15,2 g 2-amino-4-dimethylamino-6-methylpyrimidinu ve 400 ml methylenchloridu se při teplotě místnosti pomalu přidá 18,3 g benzensulfonylisokyanátu. Reakční směs se míchá 4 hodiny, pak se rozpouštědlo oddestiluje za sníženého tlaku a bezbarvý polotuhý odparek se rozmíchá s ethyletherem. Pevná látka se odfiltruje, nasuspenduje do acetonu, suspenze se ochladí a produkt se odfiltruje. Získá se v nadpisu uvedená látka, která se rozkládá při 180 až 182 °C.

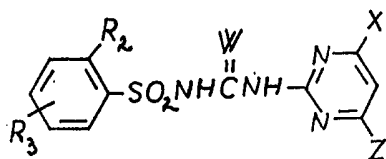
Příklad 6

2-Chlor-N-[(4-dimethylamino-6-methoxypyrimidin-2-yl)aminokarbonyl]benzensulfonamid

K roztoku 25 g 2-amino-4-dimethylamino-6-methoxypyrimidinu v 700 ml acetonitrilu se při teplotě místnosti přikape 32,5 g 2-chlorbenzensulfonylisokyanátu. Směs se zahřeje na 40 °C a pak se míchá pět hodin při teplotě místnosti. Vyloučený produkt se odfiltruje a promyje malým množstvím chladného ethyletheru. Získá se v nadpisu uvedená látka o teplotě tání 224 až 226 °C.

Způsobem podle příkladu 6, ale za použití ekvivalentních množství příslušného derivátu 2-aminopyrimidinu a sulfonylisokyanátu se připraví sloučeniny uvedené v následující tabulce II.

Sloučeniny obecného vzorce



R ₂	R ₃	W	X	Z	t. t. (°C)
H	H	O	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	
H	H	S	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	
CH ₃	H	O	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	238 až 239
Cl	H	O	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	224 až 226
F	H	O	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	
Br	H	O	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	
NO ₂	H	O	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	
OCH ₃	H	O	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	
CF ₃	H	O	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	
Cl	H	S	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	
CH ₃	H	S	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	
F	H	S	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	
Cl	6-Cl	O	NHCH ₃	OCH ₃	
Cl	5-CH ₃	O	NHCH ₃	OCH ₃	
Cl	5-CF ₃	O	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	
Cl	5-Br	O	NHCH ₃	OCH ₃	
Cl	3-Cl	O	NHCH ₃	OCH ₃	
Cl	3-F	O	NHCH ₃	OCH ₃	
OCH ₃	5-OCH ₃	O	NHCH ₃	OCH ₃	
H	3-Cl	O	NHCH ₃	OCH ₃	
H	3-F	O	NHCH ₃	OCH ₃	
H	3-NO ₂	O	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	
Cl	5-Cl	S	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	
Cl	3-Cl	S	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	
Cl	5-F	S	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	
Cl	5-OCH ₃	S	N(CH ₃) ₂	OCH ₃	
H	H	O	N(CH ₃) ₂	CH ₃	
Cl	H	O	N(CH ₃) ₂	CH ₃	
Br	H	O	N(CH ₃) ₂	CH ₃	
F	H	O	N(CH ₃) ₂	CH ₃	
CH ₃	H	O	N(CH ₃) ₂	CH ₃	
CF ₃	H	O	N(CH ₃) ₂	CH ₃	
NO ₂	H	O	N(CH ₃) ₂	CH ₃	
OCH ₃	H	O	N(CH ₃) ₂	CH ₃	
Cl	5-Cl	O	N(CH ₃) ₂	CH ₃	
Cl	6-Cl	O	N(CH ₃) ₂	CH ₃	
Br	5-Br	O	N(CH ₃) ₂	CH ₃	
OCH ₃	5-OCH ₃	O	N(CH ₃) ₂	CH ₃	
CH ₃	5-CH ₃	O	N(CH ₃) ₂	CH ₃	
Cl	3-Cl	O	N(CH ₃) ₂	CH ₃	
CH ₃	5-NO ₂	O	N(CH ₃) ₂	CH ₃	
OCH ₃	5-Cl	O	NHCH ₃	CH ₃	
Cl	5-NO ₂	O	N(CH ₃) ₂	CH ₃	
Cl	5-F	O	NHCH ₃	CH ₃	
H	3-CH ₃	O	N(CH ₃) ₂	CH ₃	
H	3-Br	O	N(CH ₃) ₂	CH ₃	
H	H	O	NHCH ₃	CH ₃	
Cl	H	O	NHCH ₃	CH ₃	
Br	H	O	NHCH ₃	CH ₃	
F	H	O	NHCH ₃	CH ₃	
CH ₃	H	O	NHCH ₃	CH ₃	
CF ₃	H	O	NHCH ₃	CH ₃	
NO ₂	H	O	NHCH ₃	CH ₃	
OCH ₃	H	O	NHCH ₃	CH ₃	

R ₂	R ₃	W	X	Z	t. t. (°C)
Cl	5-Cl	O	NHCH ₃	CH ₃	
Cl	6-Cl	O	NHCH ₃	CH ₃	
Br	5-Br	O	NHCH ₃	CH ₃	
OCH ₃	5-OCH ₃	O	NHCH ₃	CH ₃	
CH ₃	5-CH ₃	O	NHCH ₃	CH ₃	
Cl	3-Cl	O	NHCH ₃	CH ₃	
CH ₃	5-NO ₂	O	NHCH ₃	CH ₃	
NO ₂	H	O	NHCH ₃	OCH ₃	

Herbicidní prostředky podle vynálezu, obsahující jako účinnou látku substituované arylsulfonamidy obecného vzorce I, lze vyrábět obvyklými způsoby. Lze je připravovat ve formě poprašků, granulí, pelet, roztoků, suspenzí, emulzí, smáčivých poprašků, emulgovatelných koncentrátů a podobných přípravků. Mnohé z nich lze aplikovat přímo. Postřikové přípravky lze rozředit ve vhodném prostředí a zředěného roztoku používat v množství od několika litrů na hektar až do několika stovek litrů na hektar. Vy-

sokoprocenní koncentráty jsou především určeny jako meziprodukty pro výrobu dalších přípravků. Herbicidní prostředky podle vynálezu obsahují obecně asi 0,1 až 99 hmotnostních procent účinné sloučeniny, resp. sloučenin, a alespoň jednu z následujících pomocných látek: asi 0,1 až 20 % povrchově aktivní látky (látek), a b) asi 1 až 99,9 % pevného nebo kapalného ředidla (ředidel). Specificky mohou uvedené herbicidní prostředky obsahovat zmíněné složky v následujících přibližných množstvích:

TABULKA III

Přípravek	Složky (hmotnostní procenta)		
	účinná látka	ředidlo (a)	povrchově účinná látka (y)
smáčivé poprašky	20 až 90	0 až 74	1 až 10
olejové suspenze, emulze, roztoky (včetně emulgovatelných koncentrátů)	3 až 50	40 až 95	0 až 15
vodné suspenze	10 až 50	40 až 84	1 až 20
poprašky	1 až 25	70 až 99	0 až 5
granule a pelety	0,1 až 95	5 až 99,9	0 až 15
vysokoprocenní koncentráty	90 až 99	0 až 10	0 až 2

V herbicidních přípravcích mohou být samozřejmě přítomny účinné složky v nižším nebo vyšším množství, v závislosti na předpokládaném použití a na fyzikálních vlastnostech použité sloučeniny. Někdy je žádoucí vyšší obsah povrchově aktivní látky vzhledem k účinné látce; toho lze dosáhnout buď přimísením povrchově aktivní látky přímo do přípravku, nebo jejím přidáním do cisterny před postřikem.

Typická pevná ředidla vhodná pro herbicidní prostředky jsou popsána v příručce Watkinse a spolupracovníků „Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers“, 2. vydání, Dorland Books, Caldwell, New Jersey. Pevná ředidla s vyšší nasáklivostí jsou vhodnější pro smáčivé poprašky, a hutnější ředidla jsou vhodnější pro poprašky.

Typická kapalná ředidla a rozpouštědla jsou popsána v Marsdenově příručce „Solvents Guide“, 2. vydání, Interscience, New York, 1950. Rozpustnost pod 0,1 % je vhodná pro suspenzní koncentráty; koncentrované (vysokoprocenní) roztoky se nemají rozdělovat při teplotě 0 °C na jednotlivé fáze. V příručce „McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual“, MC Publishing Corp.,

Ridgewood, New Jersey, a rovněž v encyklopedii autorů Siselyho a Wooda „Encyclopedia of Surface Active Agents“, Chemical Publishing Co., Inc., New York (1964), jsou uvedena vhodná povrchově aktivní činidla a jejich doporučené použití. Všechny uvedené herbicidní prostředky mohou dále obsahovat minoritní množství dalších přísad, jako látek snižujících pěnovost, spékání, korozi, mikrobiální růst a podobně.

Způsoby výroby herbicidních prostředků jsou o sobě dobře známé. Roztoky se připravují pouhým mícháním složek až do rozpuštění. Jemně práškovité pevné přípravky se vyrábí smícháním složek a obvykle mletím směsi, na příklad v kladivovém mlýnu nebo ve fluidním mikronizéru. Suspenze se připravují mletím za vlhka (viz například Litter, USA patent 3 060 084). Granule a pelety lze vyrábět na příklad nastříkáním roztoku účinné látky na předem vyrobený granulovaný nosič, nebo různými běžnými aglomeračními pracovními postupy, viz například J. E. Browning „Agglomeration“, časopis Chemical Engineering, 4. prosinec 1967, strana 147 a další, a příručku „Perry's Chemical Engineer's Handbook“, čtvrté

vydání, McGraw-Hill, New York (1963), str. 8 až 59 a následující.

Další informace týkající se způsobu formulování herbicidních prostředků viz například:

H. M. Loux, USA patent č. 3 235 361, 15. února 1966, sloupec 6, řádek 16, až sloupec 7, řádek 19, a příklady 10 až 41.

R. W. Luckenbaugh, USA patent 3 309 192, 14. března 1967, sloupec 5, řádek 43, až sloupec 7, řádek 62, a příklady 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138 až 140, 162 až 164, 166, 167, 169 až 182.

H. Gysin a E. Knusli, USA patent 2 981 855, 23. června 1959, sloupec 3, řádek 66, až sloupec 5, řádek 17, a příklady 1 až 4.

G. C. Klingman, „Weed Control as a Science“, John Wiley & Sons, Inc., New York, 1961, str. 81–96.

J. D. Fryer a S. A. Evans: „Weed Control Handbook“, 5. vydání, Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, str. 101 až 103.

V následujících příkladech značí všechny díly a procenta, pokud není uvedeno jinak, hmotnostní díly a hmotnostní procenta.

Příklad 7

Smáčivý poprašek

2-chlor-N-[(4-methoxy-6-methylamino-1,3,5-triazin-2-yl)amino-karbonyl]benzensulfonamid	80 %
alkylnaftalensulfonan sodný	2 %
ligninsulfonan sodný	2 %
syntetický amorfní silikagel	3 %
kaolinit	13 %

Jednotlivé složky se smíchají, směs se roztřepe v kladivovém mlýnu tak, aby průměr všech částíček byl menší než 50 mikronů, směs se znovu promísí a plní do obalů.

Příklad 8

Smáčivý poprašek

2-chlor-N-[(4-dimethylamino-6-methoxy-1,3,5-triazin-2-yl)amino-karbonyl]benzensulfonamid	50 %
alkylnaftalensulfonan sodný	2 %
methylcelulóza o nízké viskozitě	2 %
infusoriová hlínka	46 %

Jednotlivé složky se smísí, směs se roztřepe nejprve v kladivovém mlýnu a pak se mikronizuje v tryskovém mikronizéru tak, aby průměr v podstatě všech částíček byl menší než 10 mikronů. Směs se znovu promísí a plní do obalů.

Příklad 9

Granule

Smáčivý poprašek z příkladu 8	5 %
granulovaný attapulgit	95 %

(U. S. S. 20 až 40 mesh; průměr 0,84 až 0,42 mm).

Suspenze smáčivého poprašku obsahující asi 25 % pevných látek se nastříká na povrch granulí attapulgitu za míchání v dvoukuželové míchačce. Granule se vysuší a plní do obalů.

Příklad 10

Vytlačované pelety

N-[(4-dimethylamino-6-methoxy-pyrimidin-2-yl)aminokarbonyl]-2-methylbenzensulfonamid	25 %
bezvodý síran sodný	10 %
surový ligninsulfonan vápenatý	5 %
alkylnaftalensulfonan sodný	1 %
vápenato-hořečnatý bentonit	59 %

Jednotlivé složky se smísí, směs se roztřepe v kladivovém mlýnu a pak se ovlhčí asi 12 % vody. Zvlhčená směs se vytlačuje ve formě válcových tyčí o průměru asi 3 mm, které se rozřežou na pelety asi 3 mm dlouhé. Získané pelety se vysuší a buď je lze používat přímo, nebo se rozdrtí tak, aby získaná drť prošla U. S. S. sítím číslo 20 (otvory o průměru 0,84 mm). Získaný materiál se znovu třídí na sítěch, a granule zadržené na sítu U. S. S. číslo 40 (otvory 0,42 mm) se plní do obalů pro použití a jemnější granule, které prošly, se recyklují.

Příklad 11

Olejevá suspenze

2-chlor-N-[(4-dimethylamino-6-methoxy-1,3,5-triazin-2-yl)aminokarbonyl]benzensulfonamid	25 %
hexaoleát polyoxyethylensorbitolu	5 %
olej na bázi vysokých alifatických uhlovodíků	70 %

Jednotlivé složky se smísí a směs se roztřepe v mlýnu na písek tak, aby se průměr částíček snížil asi pod 5 mikronů. Získanou suspenzi lze aplikovat buď přímo, nebo výhodně po zředění vhodnými oleji, nebo po emulgování ve vodě.

Příklad 12

Smáčivý poprašek

N-[(4-dimethylamino-6-methoxy-1,3,5-triazin-2-yl)amino-karbonyl]-2-methylbenzensulfonamid	20 %
alkylnaftalensulfonan sodný	4 %
ligninsulfonan sodný	4 %
methylcelulóza o nízké viskozitě	3 %
attapulgit	69 %

Jednotlivé složky se navzájem smísí, směs

se rozele v kladivovém mlýnu tak, aby průměr prakticky všech částeczek byl menší než 10 mikronů, získaný materiál se znovu promíchá, prosije U. S. S. sítím číslo 50 (otvory o průměru 0,3 mm) a plní do obalů.

Příklad 13

Olejoá suspenze

2-chlor-N-[(4-methoxy-6-methyl-amino-1,3,5-triazin-3-yl)amino-karbonyl]benzensulfonamid	35 %
směs esterů polyalkoholů s karboxlovými kyselinami a v oleji rozpustných sulfonátů ropných uhlovodíků	6 %
xylén	59 %

Jednotlivé složky se navzájem smísí a směs se rozele v mlýnu na písek tak, aby průměr prakticky všech částeczek byl menší než 3 mikrony. Získaný přípravek se dá používat buď přímo, nebo po zředění oleji, nebo po emulgování ve vodě.

Příklad 14

Vysokoprocentní koncentrát

N-[(4-dimethylamino-6-methoxy-pyrimidin-2-yl)aminokarbonyl]-2-methylbenzensulfonamid	99 %
silika-aerogel	0,5 %
syntetický amorfní silikagel	0,5 %

Jednotlivé složky se navzájem smísí a směs se rozele v kladivovém mlýnu tak, aby se získal materiál, který prakticky všech projde U. S. S. sítím číslo 50 (otvory o průměru 0,3 mm). Koncentrátu se dá použít pro přípravu dalších přípravků.

Příklad 15

Nízko procentní granule

N-[(4-dimethylamino-6-methoxy-1,3,5-triazin-2-yl)aminokarbonyl]-2-methylbenzensulfonamid	1 %
N,N-dimethylformamid	9 %
granulovaný attapulgit (U. S. S. 20 až 40 mesh)	90 %

Účinná látka se rozpustí v rozpouštědle a roztokem se postříkají odprášené granule v rotační míchačce. Po nastříkání roztoku se nechá míchačka ještě krátkou dobu běžet a pak se granule naplní do obalů.

Příklad 16

Vodná suspenze

N-[(4-dimethylamino-6-methoxy-1,3,5-triazin-2-yl)aminokarbonyl]-2-methylbenzensulfonamid	40 %
--	------

zahušťovač na bázi kyseliny polyakrylové	0,3 %
polyethylenglykolether dodecylfenolu	0,5 %
hydrogenfosforečnan sodný	1,0 %
dihydrogenfosforečnan sodný	0,5 %
polyvinylalkohol	1,0 %
voda	56,7 %

Jednotlivé složky se smísí navzájem a směs se rozmělní v mísicím kolovém mlýnu na písek tak, aby v podstatě všechny částecčky byly menší než 5 mikronů.

Příklad 17

Roztok

sodná sůl N-[(4-methoxy-6-methyl-amino-1,3,5-triazin-2-yl)amino-karbonyl]-2-methylbenzen-sulfonamidu	5 %
voda	95 %

Sůl se vnese za míchání přímo do vody a po rozpuštění se roztok plní do obalů. Přípravek je určen k postřiku.

Příklad 18

Granule

2-chlor-N-[(4-methoxy-6-methyl-amino-1,3,5-triazin-2-yl)amino-karbonyl]benzensulfonamid	80 %
smáčecí prostředek	1 %
surová sůl kyseliny ligninsulfonové (obsahující 5 až 20 % přírodních cukrů)	10 %
attapulgitová hlínka	9 %

Jednotlivé složky se smísí a směs se rozele tak, aby prošla sítím 100 mesh. Rozele se směs vnese do fluidního granulátoru, proud vzduchu se seřídí tak, aby materiál živě vířil a vířící směs se zkrápí jemným postříkem vody. Ve fluidizaci a postřikování vodou se pokračuje tak dlouho, až se vytvoří granule požadované velikosti. Přidávání vody se skončí, ale směs se fluidizuje dále, popřípadě za zahřívání, tak dlouho, až se obsah vody sníží na požadovanou hladinu, obvykle na méně než 1 %. Zgranulovaná směs se vyjme, prosije sítím na požadovanou velikost, obvykle 14 až 100 mesh (1410 až 149 mikronů) a plní do obalů.

Příklad 19

Granule s nízkým obsahem

N-[(4-methoxy-6-methylamino-1,3,5-triazin-2-yl)amino-karbonyl]-2-methylbenzen-sulfonamid	0,1 %
granulovaný attapulgit (U. S. S. 20 až 40 mesh)	99,9 %

Účinná látka se rozpustí ve vhodném rozpouštědle a roztokem se za míchání ve dvoukuželové míchačce postříkají granule attapulgitu zbavené prachových podílů. Po skončení postřiku se granule zahřejí, aby se odpařilo rozpouštědlo, pak se nechají zchladnout a plní do obalů.

Příklad 20

Smáčivý poprašek

N-[4-dimethylamino-6-methoxy-pyrimidin-2-yl]aminokarbonyl]-2-methylbenzensulfonamid	95 %
sodná sůl dioktylsulfosukcinátu	0,1 %
syntetický jemný silikagel	4,9 %

Jednotlivé složky se navzájem smísí a směs se rozele v kladivovém mlýnu tak, aby prakticky všechny částičky byly menší než 100 mikronů. Rozemletá směs se prosije U. S. S. sítím číslo 50 a plní se do obalů.

Příklad 21

Smáčivý poprašek

N-[4-methoxy-6-methylamino-1,3,5-triazin-2-yl]aminokarbonyl]-2-methylbenzensulfonamid	40 %
ligninsulfonan sodný	20 %
montmorillonitová hlínka	40 %

Jednotlivé složky se navzájem smísí, směs se rozele nejprve na hrubo v kladivovém mlýnu a pak se mikronizuje tak, aby prakticky všechny částičky byly menší než 10 mikronů. Rozemletý materiál se znovu promísí a plní do vhodných obalů.

Způsoby popsány v příkladech 7 až 21 lze formulovat všechny sloučeniny obecného vzorce I do příslušných herbicidních přípravků.

Herbicidní prostředky obsahující jako účinnou látku substituované arylsulfonamidy obecného vzorce I lze aplikovat buď preemergentně, nebo postemergentně, jednak k hubení nežádoucí vegetace na plochách nepoužívaných k pěstování kulturních rostlin, a jednak k selektivnímu hubení plevelů v porostech některých kulturních rostlin, například pšenice a sóji. Za použití vhodné dávky a vhodné doby k aplikaci lze herbicidních prostředků podle vynálezu používat rovněž k prospěšnému modifikování růstu rostlin.

Přesné množství sloučeniny obecného vzorce I, které je třeba použít v dané situaci, závisí na žádaném konečném účinku, na očekávaném použití ošetřených rostlin, na druhu plevelů, který se má hubit, na druhu půdy, na použité formě herbicidního prostředku a způsobu jeho aplikace, na povětrnostních podmínkách a podobných faktorech. Vzhledem k tomu, že při aplikaci herbicidního prostředku hrajou roli tak četné pro-

měnné faktory, není možné přesně určit aplikční dávku vhodnou pro všechny situace. Obecně řečeno, lze sloučeniny obecného vzorce I aplikovat v dávce v rozmezí asi 0,1 až 20 kg/ha, výhodně v rozmezí 0,1 až 10 kg/ha. Nižší dávky v uvedených rozmezích se obvykle volí pro aplikaci na lehčí půdy, pro selektivní hubení plevelů v kulturách užitkových rostlin, nebo v situacích, kdy není žádoucí dlouhodobé setrvávání preparátu. Některých sloučenin obecného vzorce I lze používat ve velmi nízkých dávkách k regulaci růstu rostlin, avšak někdy se dají aplikovat i vyšší dávky, v závislosti na takových faktorech, jako je druh kulturní rostliny, která má být ošetřena, doba ošetření a další.

Substituované arylsulfonamidy obecného vzorce I se dají rovněž kombinovat s jinými herbicidy. Zvláště vhodné jsou kombinace na příklad s 3-(3,4-dichlorfenyl)-1,1-dimethylmočovinou, s triaziny, jako s 2-chlor-4-(ethylamino)-6-(isopropylamino)-s-triazinem, s uracily, jako s 5-brom-3-sek.butyl-6-methyluracilem, dále s N-(fosfonomethyl)glycinem, 3-cyklohexyl-1-methyl-6-dimethylamino-s-triazin-2,4(1H,3H)-dionem, N,N-dimethyl-2,2-difenylacetamidem, s kyselinou 2,4-dichlorfenoxycetovou (a látkami blíže příbuznými), s 4-chlor-2-butyl-3-chlorfenylkarbamátem, s esterem 2,3-dichlorallylalkoholu s kyselinou diisopropylthiokarbamovou, s S-(2,3,3-trichlorallyl)esterem kyseliny diisopropylthiokarbamové, s ethyl-N-benzoyl-N-(3,4-dichlorfenyl)-2-aminopropionátem, s 1,2-dimethyl-3,5-difenylpyrazolium-methylsulfátem, s methyl-2-[4-(2,4-dichlorfenoxyl)fenoxyl]propanoátem, se 4-amino-6-terc-butyl-3-(methylthio)-1,2,4-triazin-5(4H)-onem, s 3-(3,4-dichlorfenyl)-1-methoxy-1-methylmočovinou, s 3-isopropyl-1H-2,1,3-benzothiadiazin-(4)-3H-on-2,2-dioxidem, s α,α,α -trifluor-2,6-dinitro-N,N-dipropyl-p-toluidinem, s 1,1'-dimethyl-4,4'-bipyridiniovým iontem, s methanarsonátem monosodným, s 2-chlor-2',6'-diethyl(methoxymethyl)acetanilidem a s 1,1-dimethyl-3-(α,α,α -trifluor-m-tolyl)močovinou.

Herbicidní účinnost sloučenin obecného vzorce I byla stanovována pomocí testů prováděných ve skleníku. Uvedené testy a nalezená data jsou uvedeny níže.

Test A

Semena rosičky (*Digitaria* sp.), ježatky kuří nohy (*Echinochloa crusgalli*), oves plavý (*Avena fatua*), kasie (*Cassia tora*), povíjnice (*Ipomoea* sp.), řepně (*Xanthium* sp.), čiroku, kukuřice, sóji, rýže, pšenice a oštrice byla pěstována v živném prostředí a ošetřena preemergentně v tabulce uvedeným chemickým prostředkem rozpuštěným v rozpouštědle nepůsobícím fyto toxicky. Ve stejné době byly herbicidní sloučeninou postříkány rostlinky bavlníku ve stadiu pěti

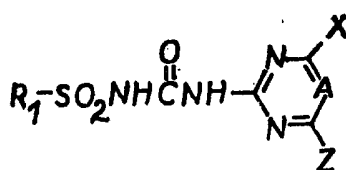
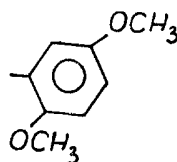
listů (včetně děložních), bobů ve stadiu třetího rozvíjecího se trojčetného listu, rosníčky krvavé ve stadiu dvou listů, ježatky kuří nohy ve stadiu dvou listů, ovesa planého ve stadiu jednoho listu, kasie ve stadiu tří listů (včetně děložních), povíjnice ve stadiu čtyř listů (včetně děložních), čiroku ve stadiu tří listů, kukuřice ve stadiu tří listů, sóji ve stadiu dvou děložních listů, rýže ve stadiu dvou listů, pšenice ve stadiu jednoho listu a ostřice ve stadiu 3 až 5 listů. Ošetřené rostliny a kontrolní rostliny byly pěstovány ve skleníku po dobu 16 dnů, pak byly všechny druhy ošetřených rostlin srovnány s kontrolami a vizuálně zhodnocena odezva na ošetření.

Dávky uvedeným způsobem testovaných sloučenin obecného vzorce I jsou uvedeny v tabulce III.

Stupnice, použitá k hodnocení stupně poškození rostlin:

- 0 = žádný účinek
 10 = maximální účinek (zahubení rostliny)
 C = chlorosa nebo nekrosa
 E = inhibice emergence
 G = zpomelní růstu
 H = účinek na tvar rostliny
 S = albinismus
 U = neobvyklé pigmentování
 6Y = opadávání pupenů nebo květů.

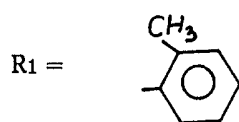
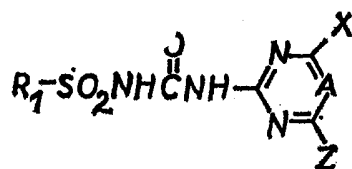
TABULKA III

R₁ =

A = N

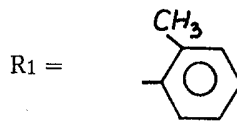
X = N(CH₃)₂Z = OCH₃

Dávka kg/ha	2,0	2,0	2,0	0,4	0,4	0,4
Postemergentní aplikace						
keříčkový bob	3S	8G	6Y	3S	7G	6Y
bavlník	4C	7G		2C	3H	8G
čirok	2U	8G		2U	8G	
kukuřice	5U	9G		8G		
sója	2C	3H	8G	3C	8G	
pšenice	3C	8G		2C	9G	
oves planý	7G			8G		
rýže	3C	7G		4C	8G	
ježatka	2C	8H		7G		
rosička	2C	7G		5G		
povíjnice	2C			2C	7G	
Preemergentní aplikace						
čirok	2U	9G		2U	9G	
kukuřice	9G			10E		
sója	5H			8H		
pšenice	9G			9G		
oves planý	9G			2C	8G	
rýže	10E			10E		
ježatka	9H			9H		
rosička	9G			9G		
povíjnice	9C			9C		
řepení	9H			9G		
kasie	8G			1C	9G	
ostřice	9G			8G		



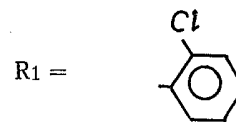
A = N
X = NHCH₃
Z = OCH₃

0,4



A = N
X = N(CH₃)₂
Z = OCH₃

0,4

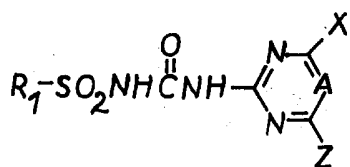
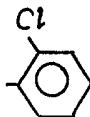


A = N
X = N(CH₃)₂
Z = OCH₃

0,4

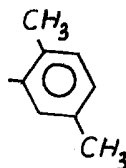
0,4

Dávka kg/ha	0,4	0,4	0,4	0,4	0,4	0,4
Postemergentní aplikace						
keříčkový bob	4C	9G	6C	9G	9C	
bavlník	5C	9G	5C	9G	2C	9G
čirok	5U	9G	2U	9G	2U	9G
kukuřice	5C	9G	1C	9G	9G	
sója	3H	9G	3C	9G	2C	9G
pšenice	2C		2C	7G	8G	
oves planý	2C	8G	1C	8H	1C	8G
rýže	5C	9G	5C	8G	5C	8G
ježatka	9H		2C	9H	6C	9H
rosička	8G		2C	6G	5C	9G
povíjnice	10C		10C		10C	
Preemergentní aplikace						
čirok	9H		9H		9H	
kukuřice	10E		10E		9G	
sója	8H		9H		8H	
pšenice	9H		9H		2C	8G
oves planý	8G		8G		2C	8G
rýže	10E		10E		10E	
ježatka	9H		9C		9H	
rosička	6G		8G		2C	9G
povíjnice	9G		9G		8G	
řepaň	9G		8G		8G	
kasie	9G		9G		7G	
ostřice	8G		5G		9G	

R₁ =

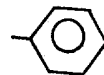
A = N
X = NHCH₃
Z = OCH₃

0,4

R₁ =

A = N
X = NHCH₃
Z = OCH₃

0,4

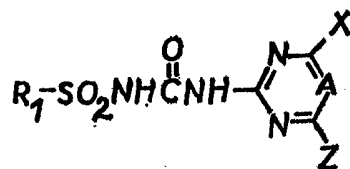
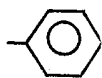
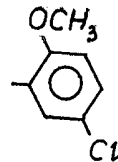
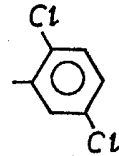
R₁ =

A = N
X = NHCH₃
Z = OCH₃

0,4

Dávka kg/ha

Postemergentní aplikace						
keříčkový bob	4H	7G	5C	4G 6Y	5C	4G 6Y
bavlník	5H	4G	5C	3G	4C	2G
čirok	6G		3G		3C	2G
kukuřice	5G		0		1G	
sója	5C	5G	3C	5G	2C	2G
pšenice	4G		2G		2G	
oves planý	4G		0		2G	
rýže	4C	4G	4G		5G	
ježatka	8C		2C		1C	
rosička	7C		2C		1C	
povíjnice	8C		10C	2C		
Preemergentní aplikace						
čirok	10E		5G		5G	5C
kukuřice	8G		2G		2G	
sója	7C	3G	1G		1G	
pšenice	3G		1G		2G	
oves planý	3G		2G		3G	
rýže	10E		8G		9C	
ježatka	6G		2G		3C	
rosička	10E		1G		1G	
povíjnice	8G		3G		3G	
řepěň	10E		2G		10E	
kasie	4G		3G		2G	
ostřice	5G		3G		2G	

R₁ =R₁ =R₁ =

A = N
X = N(CH₃)₂
Z = OCH₃

A = N
X = NHCH₃
Z = OCH₃

A = N
X = N(CH₃)₂
Z = OCH₃

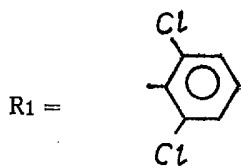
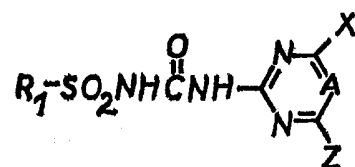
Dávka kg/ha

0,4

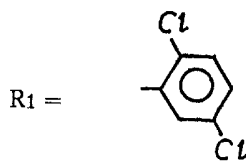
0,4

0,4

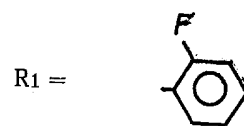
		Postemergentní aplikace							
		3G	6Y	4C	3G	6Y	8C		9G
keříčkový bob	5C								
bavlník	5C	3G			2C		2C		7G
čirok		1C			0				5G
kukuřice		0			0				4G
sója		1C			0		2C		7G
pšenice		0			0				3G
oves planý		0			0				3G
rýže		4G			0		1C		5G
ježatka		1C			0		3C		7G
rosička		0			0		2C		5G
povíjnice		1G			0				10C
		Preemergentní aplikace							
čirok	4C	5G		3C	6G				3C
kukuřice		2C		2C	3G				3G
sója		1C		2C	2G				0
pšenice		4G			1C				5G
oves planý		2G			2C				7G
rýže		10E			10E		1C		9H
ježatka		2C			3C		2C		6G
rosička		0			0				0
povíjnice		5C			7C				7G
řepěň		3C			2C				5G
kasie		2C			2C				0
ostřice		0			0				0



A = N
X = N(CH₃)₂
Z = OCH₃
0,4



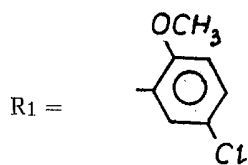
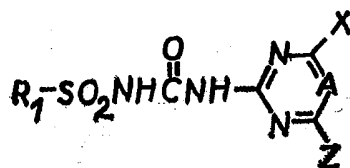
A = N
X = N(CH₃)₂
Z = OCH₃
0,4



A = N
X = N(CH₃)₂
Z = OCH₃
0,4

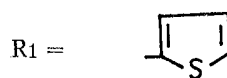
Dávka kg/ha

Postemergentní aplikace									
keříčkový bob	5C		9G	3C	8G	6Y	3C	9G	6Y
bavlník	2H	3C	9G	3C	6G		6C	9G	
čirok	7C		9G	8H			3H	8G	
kukuřice	5C		9G	5G			5C	9G	
sója	5C		9G	3H			4C	8G	
pšenice	9C			3G			2C	7G	
oves planý	6C		8G	2G				7G	
rýže	9C			8G				9C	
ježatka	9C		9G	2C	8H	3C		9H	
rosička	2C		8G	3G				9C	
povíjnice	9C			10C				10C	
Preemergentní aplikace									
čirok		9H			9G			9G	
kukuřice	1C		8H	1C	5G	2C		8G	
sója		8H			0			1H	
pšenice		9H			6G			7G	
oves planý	2C		6G		7G			7G	
rýže		10E			10E			10E	
ježatka		9H			9H			9C	
rosička	2C		7G		0			5G	
povíjnice		9C			9G			5G	
řepa		10E			8G			7G	
kasie		7G			0			6G	
ostřice		10E			5G			8G	



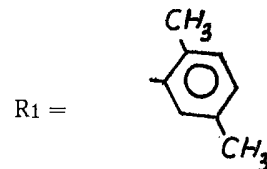
A = N
X = N(CH₃)₂
Z = OCH₃

0,4



A = N
X = N(CH₃)₂
Z = OCH₃

0,4

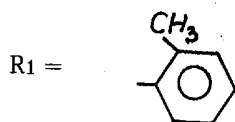
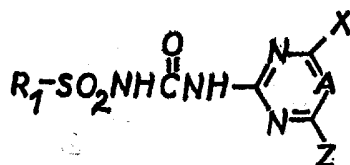


A = N
X = N(CH₃)₂
Z = OCH₃

0,4

Dávka kg/ha

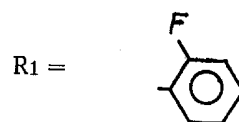
Postemergentní aplikace							
keříčkový bob	3C	4H	6F	2H	8G	6Y	3C
bavlník	2C	6G		4C	7G		3C
čirok	2C	8G		2C	6G		2C
kukuřice	4G			9H			7H
sója	3H			4C	8G		5C
pšenice	4G						5G
oves planý	3G			1C	3G		4G
rýže	6G			2C	8G		1C
ježatka	3C			7C	4G		2C
rosička	1C			1C			3G
povíjnice	1C			3C	9G		5C
Preemergentní aplikace							
čirok	1C	7G		2C	8G		1C
kukuřice	0			1C	7G		2C
sója	0				0		2H
pšenice	3C	6G			3G		4G
oves planý	6G				6G		6G
rýže	9H				10E		9H
ježatka	3G				9H		9H
rosička	4G			1C		7G	2G
povíjnice	7G				9G		7G
řepěň	0				7G		7G
kasie	1C				5H		3H
ostřice	0				9G		5G



A = CH
X = N(CH₃)₂
Z = OCH₃
2,0



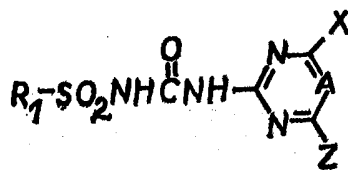
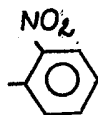
A = N
X = NHCH₃
Z = OCH₃
0,4



A = N Na⁺
X = NHCH₃
Z = OCH₃
0,4

Dávka kg/ha

Postemergentní aplikace									
keříčkový bob	2S	5G	6Y	3C	8G	6Y	3C	8G	6Y
bavlník	3C	3H		3C	8G		4C		8G
čirok	2U	9G		2C	7G		2C		8G
kukuřice	2U	8G		8H	5G		3U		8G
sója	3C	3H		2C			5C		7G
pšenice	4C	9G		4G			2G		
oves planý	2C	8G		3G			6G		
rýže	3C	6G		2C	5G		5C		7G
ježatka	3C	9H		1C	5G		3C		7G
rosička	3C	7G		6G			3C		
povíjnice	2C			2C	3H		2C		6G
Preemergentní aplikace									
čirok	2C	9G		9G			9H		
kukuřice	1C	9G		9G			2C		9G
sója	2C	6H		1H			2H		
pšenice	9G			5G			1C		8G
oves planý	2C	8G		6G			2C		5G
rýže	10E			10E			10E		
ježatka	9H			9H			9H		
rosička	2C			8G			2C		9G
povíjnice	9G			9G			9G		
řepěň	8G			10E			9C		
kasie	8G			7G			8G		
ostřice	10E			10E			9G		

R₁ =

A = N

X = N(CH₃)₂Z = OCH₃

Dávka kg/ha

0,4

		Postemergentní aplikace
keříčkový bob	9C	
bavlník	9C	
čirok	5U	9G
kukuřice	9C	
sója	3C	9G
pšenice	7C	8G
oves planý	9C	
rýže	9C	
ježatka	10C	
rosička	10C	
povíjnice	10C	
		Preemergentní aplikace
čirok	2U	9G
kukuřice	10E	
sója	9G	
pšenice	9G	
oves planý	3C	9H
rýže	10E	
ježatka	9C	
rosička	5C	9G
povíjnice	9G	
řepa	9G	
kasie	5C	9G
ostřice	10E	

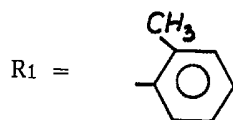
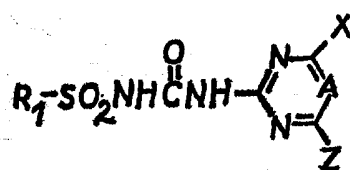
Použitelnost sloučenin obecného vzorce I pro selektivní hubení plevelů v porostech pšenice a sóji byla nejprve ověřena zkouškami prováděnými ve skleníku. Použitý test B je popsán níže.

Test B

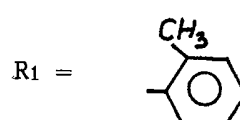
Dvě kulovité misky z plastické hmoty o průměru 25 cm byly naplněny hnojenou a vápněnou Fallsingtonskou hlinito-písčitou půdou. Jedna miska byla oseta kukuřicí, čirokem a několika druhy plevelných trav. Druhá miska byla oseta sójou, šáchorem jedlým (*Cyperus rotundus*) a několika druhy širokolistých plevelů. K testování bylo použito následujících druhů plevelných trav a širokolistých plevelů: rosička (*Digitaria sanguinalis*), ježatka kuří noha (*Echinochloa crusgalli*), oves planý (*Avena fatua*), čirok halebský (*Sorghum halepense*), bér obrovský (*Setaria faberii*), lipnice luční (*Poa*

pratensis), sveřep obilní (*Bromus secalinus*), hořčice rolní (*Brassica arvensis*), řepa (*Xanthium pennsylvanicum*), laskavec ohnutý (*Amaranthus retroflexus*), aeschynoména (*Aeschynomene virginica*), povíjnice (*Ipomoea hederacea*), kasie (*Cassia tora*), sida (*Sida spinosa*), mračník *Theoprastis* (*Abutilon theophrasti*) a durman (*Datura stramonium*). Dále byly preparovanou půdou naplněny dva papírové hrnečky o průměru 12,5 cm a jeden byl oset rýží a pšenicí, a druhý řepou cukrovkou. Shora uvedeným osázené čtyři nádoby byly ošetřeny preemergentně, tj. testované sloučeniny obecného vzorce I byly nastříkány na povrch půdy před vyklíčením semen.

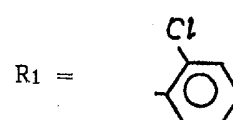
Za 28 dnů po ošetření byl zhodnocen stav rostlin. Získaná data jsou shrnuta v následující tabulce IV. Z tabulky vyplývá, že pšenice snáší lépe testované sloučeniny obecného vzorce I než většina použitých druhů plevelů.



A = N
X = NHCH₃
Z = OCH₃

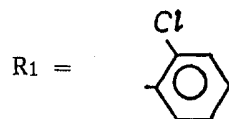
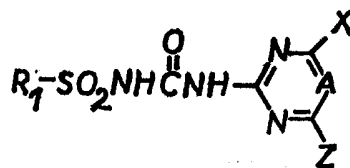


A = N
X = N(CH₃)₂
Z = OCH₃



A = N
X = N(CH₃)₂
Z = OCH₃

Dávka kg/ha	1/16		1/4		1/16		1/4		1/16		1/4	
rosička	0		4G		2G		4G		5G		7G	3H
ježatka	5G		8G	5H	4G		6G	3H	4G		7G	5H
čirok	6G		8G	5H	2G		5G	3G	5G		10C	
oves planý		2G	6G		0		6G		0		5G	
čirok halebský	4G	3H	3G	3H	0		3G		3G		5G	3H
bér obrovský	4G		6G		3G		6G		5G		7G	5H
lipnice luční	5G		8G		2G		6G		6G		8G	5H
sveřep obilní	5G		8G	5H	4G		6G		6G		7G	5H
kukuřice	5G		6G		0		5G		2G		5G	5H
hořčice rolní	0		C		0		7G	5H	7G	5C	9G	9C
řepěň	0		—		0		4G		—		0	
laskavec	10C		10C		10C		10C		10C		10C	
šáchor	0		0		0		0		0		0	
aeschynomene	—		—		—		—		—		—	
povíjnice	6G		2G		0		2G		0		6G	3H
kasie	0		0		0		0		10C		10C	
sida	8G		6G		0		7G		0		C	
mračňák	5G		5G	5H	0		3G	5H	0		3G	3C
durman	0		5G		0		4G		0		6G	3C
sója	0		0		0		2H		0		0	
rýže	6G	7H	9G	8H	6G	5H	10C		10H		—	
pšenice	0		4G		0		5G		5G		—	
cukrovka	4G	3H	8G	5H	0		6G	3H	5G		8G	8C
Paspalum	—		—		—		—		5G		6G	



A = N
X = NHCH₃
Z = OCH₃

A = N
X = N(CH₃)₂
Z = OCH₃

Dávka kg/ha

	1/16	1/4	1/16	1/4
rosička	6G	8G	5C	2G
ježatka	5G	5H	7G	5H
čirok	6G	3H	10C	0
oves planý	4G	7G	3H	0
čirok halebský	6G	5H	7G	5H
bér obrovský	7G	5H	10C	0
lípnice luční	8G	8G	0	3G
sveřep obilní	7C	8G	5H	0
kukuřice	7G	5H	8G	5H
hořčice rolní	7G	3C	8G	5C
řepaň	0	0	0	4G
laskavec	10C	10C	10E	10E
šáchor	0	5G	0	5G
aeschynomene	—	—	—	—
povíjnice	4G	10C	0	5G
kasie	—	—	0	5G
sída	—	—	0	6G
mračňák	—	—	0	7G
durman	5G	7G	5C	0
sója	0	0	0	2H
rýže	10C	10C	5G	5H
pšenice	2G	5G	2G	5G
cukrovka	7G	10C	0	3G
Paspalum	5G	5H	3G	5H

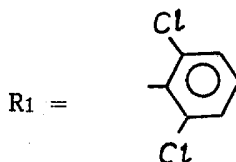
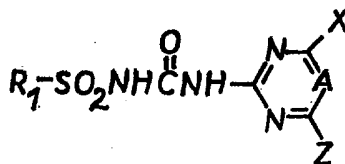
Test C

Misky z plastické hmoty o průměru 25 cm naplněné Fallsingtonskou hlinitopísčitou půdou byly osety sójou, bavlníkem, vojtěškou, kukuřicí, rýží, pšenicí, čirokem, mračňákem (*Abutilon theophrasti*), sesbaní (*Sesbania exaltata*), kasí (*Cassia tora*), povíjnicí (*Ipomoea* sp.), durmanem (*Datura stramonium*), řepení (*Xanthium pennsylvanicum*), rosičkou (*Digitaria* sp.), šáchorem (*Cyperus rotundus*), ježatkou kuří nohou (*Echinochloa crusgalli*), bérem obrovským (*Setaria fabe-*

rii) a ovšem planým (*Avena fatua*). Asi za 2,5 týdne po zasetí byly mladé rostlinky a půda kolem nich postříkány po celé ploše roztokem testované sloučeniny obecného vzorce I v nefytotoxickém rozpouštědle. Za 14 dnů po postřiku byly všechny ošetřené druhy rostlin srovnány s neošetřenými kontrolními rostlinami, a byla vizuálně zhodnocena reakce na ošetření. Zjištěná data jsou uvedena v tabulce V.

Z výsledků tohoto testu je zřejmá použitelnost sloučenin obecného vzorce I jako obecných postemergentních herbicidů.

Tabulka V
Aplikace postřiku na list a povrch půdy

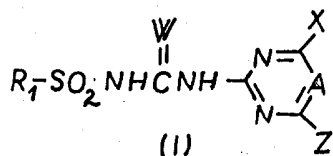


A = N,
X = N(CH₃)₂
Z = OCH₃

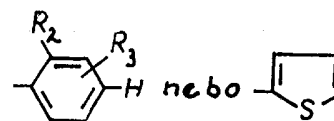
Dávka kg/ha	1/16		1/4	
sója	10C	5C	10G	5C
mračňák	5G	2H	7G	5H
sesbanie	10C		10C	6C
kasie	10C		—	
bavlník	10G	5C	10G	7C
povíjnice	10G		10G	
vojtěška	10G	3C	10G	6C
durman	10G	2C	10G	4C
řepeň	10G	5C	10G	8C
kukuřice	7G	3U	8G	4U
rosička	0		3G	
rýže	8G	3C	8G	4C
šáchor	5G		6G	
ježatka	7G	3C	9G	3C
pšenice	10G		10G	3H
bér	4G		6G	2C
oves planý	8G		10G	3C
čirok	6G	4U	9G	6U

PŘEDMĚT VYNÁLEZU

1. Herbicidní prostředek určený k hubení nežádoucí vegetace, vyznačující se tím, že obsahuje povrchově aktivní činidlo a/nebo pevné nebo kapalné ředidlo a jako účinnou látku substituovaný N-(aminokarbonyl)aryl-sulfonamid obecného vzorce I



kde znamená
R₁ zbytek vzorce



R₂ a R₃ nezávisle na sobě atom vodíku, fluoru, chloru nebo bromu, methylovou skupinu, methoxyskupinu, nitroskupinu nebo trifluormethylovou skupinu,
W atom kyslíku nebo síry,
X skupinu vzorce —NHCH₃ nebo —N(CH₃)₂,
Z methylovou skupinu nebo methoxyskupinu, a

A skupinu CH nebo atom dusíku, s podmínkou, že značí-li R₂ nitroskupinu nebo trifluormethylovou skupinu, nesmí R₃ znamenat nitroskupinu nebo trifluormethylovou skupinu, nebo jeho zemědělsky vhodnou sůl.

2. Herbicidní prostředek podle bodu 1 vyznačující se tím, že obsahuje jako účinnou látku obecného vzorce I N-[(4-methoxy-6-methylamino-1,3,5-triazin-2-yl)aminokarbonyl]-2-chlorbenzensulfonamid.

3. Herbicidní prostředek podle bodu 1 vyznačující se tím, že obsahuje jako účinnou látku obecného vzorce I N-[(4-dimethylamino-6-methoxy-1,3,5-triazin-2-yl)aminokarbonyl]-2-chlorbenzensulfonamid.

4. Herbicidní prostředek podle bodu 1 vyznačující se tím, že obsahuje jako účinnou látku obecného vzorce I N-[(4-dimethylamino-6-methoxy-1,3,5-triazin-2-yl)aminokarbonyl]-2-methylbenzensulfonamid.

5. Herbicidní prostředek podle bodu 1 vyznačující se tím, že obsahuje jako účinnou látku obecného vzorce I N-[(4-methoxy-6-methylamino-1,3,5-triazin-2-yl)aminokarbonyl]-2-methylbenzensulfonamid.

6. Herbicidní prostředek podle bodu 1 vyznačující se tím, že obsahuje jako účinnou látku obecného vzorce I N-[(4-dimethylamino-6-methoxypyrimidin-2-yl)aminokarbonyl]-2-methylbenzensulfonamid.

7. Herbicidní prostředek podle bodu 1 vyznačující se tím, že obsahuje jako účinnou látku obecného vzorce I N-[(4-methoxy-6-methylamino-1,3,5-triazin-2-yl)aminokarbonyl]-2-nitrobenzensulfonamid.

8. Herbicidní prostředek podle bodu 1 vyznačující se tím, že obsahuje jako účinnou látku obecného vzorce I N-[(4-dimethylamino-6-methoxy-1,3,5-triazin-2-yl)aminokarbonyl]-2-nitrobenzensulfonamid.