

POPIS VYNÁLEZU K PATENTU

245785

(11) (B2)



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

(22) Přihlášeno 14 06 83

(21) [PV 4301-83]

(32) (31) (33) Právo přednosti od 14 06 82
(3671/82) Švýcarsko

(40) Zveřejněno 17 09 85

(45) Vydáno 15 12 87

(51) Int. Cl.⁴
A 01 N 47/36

(72)

Autor vynálezu

BÖHNER BEAT dr., BINNINGEN; FÖRY WERNER dr., BASILEJ;
GASS KARL, MAGDEN; MEYER WILLY, RIEHEN (Švýcarsko)

(73)

Majitel patentu

CIBA-GEIGY AG, BASILEJ (Švýcarsko)

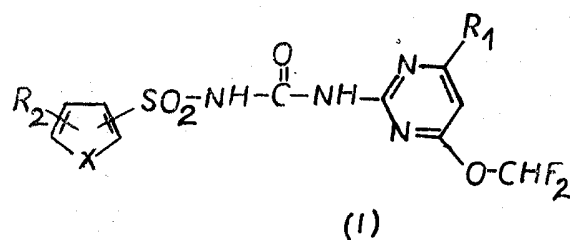
(54) **Herbicidní prostředek a prostředek k regulaci růstu rostlin a způsob výroby účinných látek**

1

Předložený vynález se týká herbicidního prostředku a prostředku k regulaci růstu rostlin, kteréžto prostředky obsahují jako účinnou složku nové N-heterocyklosulfonyl-N'-pyrimidinylmočoviny.

Dále se předložený vynález týká způsobu výroby těchto nových sloučenin a jejich použití k hubení plevelů především k selektivnímu hubení plevelů v kulturách užitkových rostlin nebo k regulaci a zbrzdění růstu rostlin.

N-heterocyklosulfonyl-N'-pyrimidinylmočoviny podle vynálezu odpovídají obecnému vzorci I



v němž

X znamená síru, skupinu —NH— nebo skupinu —CH=N—,

R1 znamená alkylovou skupinu s 1 až 4

2

atomy uhlíku, halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxykupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogen nebo dialkylaminoskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylových částech,

R2 znamená atom vodíku, atom halogenu, alkoxykupinu s 1 až 3 atomy uhlíku, alkylsulfonylovou skupinu s 1 až 3 atomy uhlíku nebo skupinu —CO—R9, přičemž R9 znamená alkoxykupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, alkenyloxyskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, alkenyloxyskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku nebo methoxyethoxykupinu, a zahrnují rovněž soli těchto sloučenin.

Deriváty močoviny, deriváty triazinu a deriváty pyrimidinu s herbicidním účinkem jsou obecně známými sloučeninami. V krátké formě se deriváty arylsulfonylheterocyklymočoviny s herbicidním účinkem a se schopností regulovat růst rostlin popisují například v publikacích evropských patentů č. 13 480, 30 142 nebo č. 39 239 nebo v DE-OS č. 2 715 786.

Předmětem předloženého vynálezu je herbicidní prostředek a prostředek k regulaci růstu rostlin, který se vyznačuje tím, že vedle nosných látek nebo/a dalších přísad obsahuje jako účinnou složku alespoň jednu N-heterocyklosulfonyl-N'-pyrimidinylmočo-

vinu shora uvedeného a definovaného obecného vzorce I nebo sůl této sloučeniny.

Alkylovou skupinou ve shora uvedeném obecném vzorci I, jakož i na jiných místech se rozumí přímá nebo rozvětvená alkylová skupina s 1 až 4 atomy uhlíku, jako například skupina methylová, ethylová, n-propylová, isopropylová, isomerní butylové skupiny.

Alkoxy skupinou se obecně rozumí methoxyskupina, ethoxyskupina, n-propyloxy skupina, isopropyloxy skupina, čtyři isomerní butyloxy skupiny, n-amyloxy skupina, isomeryloxy skupina, 2-amyloxy skupina nebo 3-amyloxy skupina, zejména však methoxyskupina, ethoxyskupina nebo isopropyloxy skupina.

Podle významu symbolu X přicházejí jako heterocykly, které jsou vázány přes sulfoskupinu, v úvahu: thiofen, pyrrol a pyridin.

Jako příklady alkenylových zbytků lze uvést allyl, isopropenyl, 1-propenyl, 1-butenyl, 2-butenyl-1-isobutenyl, 2-isobutenyl, 1-pentenyl, 2-pentenyl, 3-pentenyl, 4-pentenyl jakož i isomerní hexenylové zbytky, zejména však allyl a 4-pentenyl.

Jako příklady alkylsulfonylových skupin lze uvést skupinu methylsulfonylovou, ethylsulfonylovou nebo skupinu n-propylsulfonylovou, zejména však skupinu methylsulfonylovou a ethylsulfonylovou.

Halogenem se v definicích jakož i v části halogenalkoxy skupiny rozumí fluor, chlor a brom, výhodně však fluor a chlor.

Alkinylovými zbytky ve shora uvedených substituentech se rozumí zpravidla propargylový zbytek, 2-butylový zbytek, 3-butylový zbytek, jakož i isomerní pentinylové zbytky; výhodně je alkinylový zbytek představován propargylovým nebo 2- nebo 3-butylovým zbytkem.

Jako účinné složky herbicidního prostředku a prostředku k regulaci růstu rostlin přicházejí v úvahu rovněž soli, které mohou tvořit sloučeniny vzorce I s aminy, báze s kyselinami, zvláště pak hydroxidy alkalických kovů a kovů alkalických zemin nebo kvartérními amoniiovými bázemi.

Z hydroxidů alkalických kovů a kovů alkalických zemin jako solitvorných sloučenin nutno zdůraznit hydroxid sodný, hydroxid lithný, hydroxid draselný, hydroxid hořečnatý nebo hydroxid vápenatý, zvláště však hydroxid sodný nebo hydroxid draselný.

Jako příklady aminů vhodných pro tvorbu solí lze uvést primární, sekundární a terciární alifatické a aromatické aminy, jako methylamin, ethylamin, propylamin, isopropylamin, čtyři isomerní butylaminy, dimethylamin, diethylamin, diethanolamin, dipropylamin, diisopropylamin, di-n-butylamin, pyrrolidin, piperidin, morfolin, trimethylamin, triethylamin, tripropylamin, chinuklidin, pyridin, chinolin a isochinolin, zejména však ethylamin, propylamin, die-

thylamin nebo triethylamin, především isopropylamin a diethanolamin.

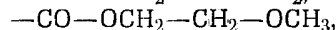
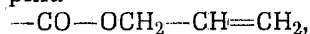
Příklady kvartérních amoniiových bází jsou obecně kationty halogenamoniiových solí, například tetramethylamoniiový kationt, trimethylbenzylamoniiový kationt, triethylbenzylamoniiový kationt, tetraethylamoniiový kationt, trimethylethylamoniiový kationt avšak také amoniiový kationt.

Ze sloučenin obecného vzorce I podle tohoto vynálezu jsou výhodné ty sloučeniny, ve kterých buď

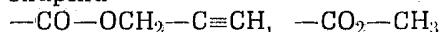
a) R_1 znamená chlor, dimethylaminoskupinu, methoxyskupinu, ethoxyskupinu, difluormethoxyskupinu, methylovou skupinu nebo ethylovou skupinu nebo

b) zbytek R_2 je v sousední poloze k sulfonylové skupině.

Dalšími výhodnými sloučeninami jsou takové sloučeniny obecného vzorce I, v němž R_2 znamená atom vodíku, fluoru, chloru, alkoxy skupinu s 1 až 3 atomy uhlíku, skupinu



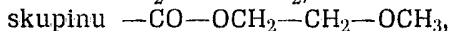
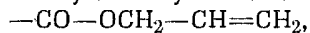
skupinu



nebo alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části.

Další výhodnou podskupinu tvoří sloučeniny obecného vzorce I, v němž R_1 znamená chlor, dimethylaminoskupinu, methoxyskupinu, difluormethoxyskupinu, ethoxyskupinu, methylovou skupinu nebo ethylovou skupinu, R_2 se nachází v sousedství k sulfonylové skupině a znamená atom vodíku, atom fluoru, chloru, alkoxy skupinu s 1 až 3 atomy uhlíku, methylsulfonylovou skupinu, skupinu $-\text{CO}-\text{OCH}_2-\text{CH}=\text{CH}_2$, skupinu $-\text{CO}-\text{OCH}_2-\text{CH}_2-\text{OCH}_3$, $-\text{CO}-\text{OCH}_2-\text{C}\equiv\text{CH}$, nebo alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části.

Zcela zvláště výhodné podskupiny účinných látek vzorce I tvoří ty sloučeniny, ve kterých X znamená atom síry, R_1 znamená chlor, dimethylaminoskupinu, methoxyskupinu, difluormethoxyskupinu, methylovou skupinu nebo ethylovou skupinu, R_2 se nachází v sousedství k sulfonylové skupině a znamená atom vodíku, atom fluoru, chloru, alkoxy skupinu s 1 až 3 atomy uhlíku, methylsulfonylovou skupinu, skupinu



$-\text{CO}-\text{OCH}_2-\text{C}\equiv\text{CH}$ nebo alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části;

dále pak ty sloučeniny, ve kterých X znamená skupinu $-\text{NH}-$, R_1 znamená chlor, dimethylaminoskupinu, methoxyskupinu, difluormethoxyskupinu, methylovou skupinu nebo ethylovou skupinu, R_2 se nachází v sousední poloze k sulfonylové skupině a znamená atom vodíku, fluoru, chloru, al-

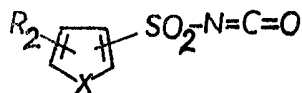
koxyskupinu s 1 až 3 atomy uhlíku, methylsulfonylovou skupinu, skupinu $-\text{CO}-\text{OCH}_2-\text{CH}=\text{CH}_2$, skupinu $-\text{CO}-\text{OCH}_2-\text{C}\equiv\text{CH}$ nebo alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části;

a dále pak ty sloučeniny, ve kterých X znamená skupinu $-\text{CH}=\text{N}-$, R_1 znamená chlor, dimethylaminoskupinu, methoxyskupinu, ethoxyskupinu, difluormethoxyskupinu, methylovou skupinu nebo ethylovou skupinu, R_2 se nachází v sousední poloze k sulfonylové skupině a znamená atom vodíku, fluoru, chloru, alkoxyskupinu s 1 až 3 atomy uhlíku, methylsulfonylovou skupinu, skupinu $-\text{CO}-\text{OCH}_2-\text{CH}=\text{CH}_2$, skupinu $-\text{CO}-\text{OCH}_2-\text{CH}_2-\text{OCH}_3$, skupinu $-\text{CO}-\text{OCH}_2-\text{C}\equiv\text{CH}$ nebo alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části.

Jako výhodné jednotlivé sloučeniny spadající pod obecný vzorec I lze uvést:

- N-(2-(methoxykarbonyl-3-thienylsulfonyl)-N'-(4-difluormethoxy-6-methylpyrimidin-2-yl)močovinu,
- N-(4-methoxykarbonyl-3-thienylsulfonyl)-N'-(4-difluormethoxy-6-methoxypyrimidin-2-yl)močovinu,
- N-(4-methoxykarbonyl-3-thienylsulfonyl)-N'-(4-difluormethoxy-6-methylpyrimidin-2-yl)močovinu,
- N-(2-chlor-3-pyridylsulfonyl)-N'-(4-difluormethoxy-6-methylpyrimidin-2-yl)močovinu,
- N-(2-pyridinylsulfonyl)-N'-(4-difluormethoxy-6-methylpyrimidin-2-yl)močovinu,
- N-(2-pyrrolylsulfonyl)-N'-(4-difluormethoxy-6-methylpyrimidin-2-yl)močovinu a
- N-(3-pyrrolylsulfonyl)-N'-(4-difluormethoxy-6-methylpyrimidin-2-yl)močovinu.

Sloučeniny obecného vzorce I a jejich soli se podle tohoto vynálezu připravují tím, že se při teplotě -20°C až $+120^\circ\text{C}$ nechá reagovat heterocyklosulfonylisokyanát obecného vzorce IV

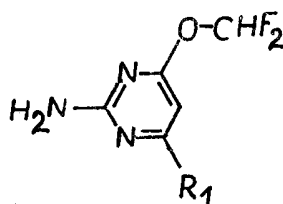


(IV)

v němž

R_2 a X mají význam uvedený pod vzor-

cem I, popřípadě za přítomnosti báze, s aminopyrimidinem obecného vzorce V



(V)

v němž

R_1 má význam uvedený pod vzorcem I, načež se popřípadě získané sloučeniny převedou na své soli tím, že se na sulfonylmočovinu vzorce I působí aminem, hydroxidem alkalického kovu nebo hydroxidem kovu alkalické zeminy nebo kvartérní amoniiovou bází.

Soli se připravují například reakcí s ekvimolárním množstvím báze v rozpouštědle a odpařením rozpouštědla.

Reakce podle vynálezu se provádí výhodně v aprotických, inertních, organických rozpouštědlech, jako je methylenchlorid, tetrahydrofuran, acetonitril, dioxan a toluen.

Reakční teploty se pohybují výhodně mezi -20°C a $+120^\circ\text{C}$. Reakce probíhá obecně mírně exothermně a může se provádět při teplotě místnosti. Ke zkrácení reakční doby nebo také k zahájení reakce se účelně reakční směs po krátkou dobu zahřívá až na teplotu varu reakční směsi. Reakční doba se může rovněž zkrátit přidáním několika kapek báze nebo isokyanátu jako reakčního katalyzátoru.

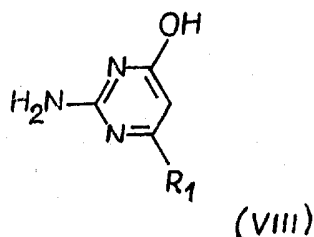
Jako báze se mohou používat jak organické báze, jako aminy, například triethylamin, chinuklidin, pyridin atd., tak i anorganické báze, jako hydridy, jako hydrid sodný nebo hydrid vápenatý, hydroxidy, jako hydroxid draselný, uhličitany, jako uhličitán sodný a uhličitán draselný nebo hydrogenuhličitany, jako hydrogenuhličitán sodný.

Reakční produkty se mohou izolovat zahuštěním nebo/a odpařením rozpouštědla a překrystalováním nebo roztíráním pevného zbytku v rozpouštědlech, ve kterých se dobře nerozpustí, jako jsou ethery, aromatické uhlovodíky nebo chlorované uhlovodíky, se čistí.

Účinné látky vzorce I jsou stálými sloučeninami. Manipulace s nimi nevyžaduje žádných bezpečnostních opatření.

Výchozí sloučeniny obecného vzorce IV jsou známé nebo se mohou vyrábět analogicky jako známé sloučeniny.

Výchozí sloučeniny obecného vzorce V se připravují postupem popsáním v evropské přihlášce vynálezu č. 70 804 tím, že se nechá reagovat aminopyrimidin obecného vzorce VIII



v němž

R_1 má význam uvedený pod vzorcem I, v přítomnosti báze s difluorchlormethanem nebo difluorbromethanem.

Způsob výroby sloučenin obecného vzorce V se provádí výhodně v inertním polárním rozpouštědle nebo ve směsi rozpouštědel. Vhodnými rozpouštědly jsou ethery, jako dioxan, tetrahydrofuran, ethylenglykoldimethylether, diethylenglykoldimethylether, alkoholy, jako methanol, ethanol; ketony, jako aceton, ethylmethyleketon, dimethylformamid, acetonitril nebo dimethylsulfoxid.

Jako báze jsou zvláště vhodné hydrid sodný a hydrid vápenatý, hydroxid draselný a hydroxid sodný, uhličitán draselný a uhličitán sodný. Ve vhodných případech lze bázi přidávat ve formě vodného roztoku.

Výchozí látky obecného vzorce VIII jsou známé nebo se připravují analogicky podle známých postupů.

Při nízkých aplikovaných množstvích se sloučeniny obecného vzorce I vyznačují dobrými selektivními vlastnostmi projevujícími se při potlačování růstu a dobrými selektivními herbicidními vlastnostmi, které je výtečným způsobem předurčují k použití v kulturách užitkových rostlin, zejména obilovinách, bavlníku, sóji, kukuřici a rýži. Při jejich použití se částečně ničí také plevel, který bylo dosud možno hubit jen za použití totálních herbicidů.

Druh účinku těchto sloučenin je neobvyklý. Četné z těchto látek jsou translokovatelné, tzn., že jsou rostlinou přijímány a dopravovány na jiná místa, kde se potom uplatňuje jejich účinek. Tak se daří například hubit povrchovým ošetřením vytrvalé druhy plevelů až k jejich kořenům. Tyto nové sloučeniny vzorce I působí — ve srovnání s jinými herbicidy a regulátory růstu — již při velmi nízkých aplikovaných množstvích.

Sloučeniny vzorce I mají kromě toho značnou schopnost regulovat růst rostlin, zejména pak schopnost brzdit růst rostlin. Tímto způsobem lze ovlivňovat růst jak jednoděložných, tak i dvojděložných rostlin.

Tak se mohou působením sloučenin vzorce I selektivně brzdit ve svém růstu, například luskoviny, které se často pěstují v zemědělství v tropických oblastech jako meziplodiny ke krytí půdy („cover crops“), tak, že se sice zabránilo erozi půdy mezi kulturními rostlinami, meziplodiny se však nemohou stát konkurencí pro kulturní rostlinu.

Zbrzdění vegetativního růstu dovoluje u četných kulturních rostlin hustší výsev kultur, takže je možno dosáhnout zvýšení výnosu, vztaženo na jednotku plochy půdy.

Další mechanismus zvýšení výnosů pomocí inhibitorů růstu spočívá v tom, že se živné látky využívají v intenzivnější míře při tvorbě květů a při tvoření plodů, zatímco se potlačuje vegetativní růst.

Dále se sloučeniny vzorce I hodí také k zabránění klíčení skladovaných brambor. Brambory při skladování přes zimu často začnou klíčit, což má za následek scvrkávání brambor, ztrátu na hmotnosti a hnělobu.

Při použití vyšších aplikovaných množství se všechny testované rostliny poškozuji ve svém vývoji do té míry, že odumírají.

Jak již bylo uvedeno, týká se předložený vynález také herbicidních prostředků a prostředků k regulaci růstu rostlin, které obsahují alespoň jednu účinnou látku vzorce I, jakož i způsobu preemergentního a postemergentního hubení plevelů a způsobu potlačování růstu jednoděložných a dvojděložných rostlin, zejména trav, meziplodin používaných v tropických oblastech ke krytí půdy a postranních výhonků u tabáku.

Sloučeniny vzorce I se používají v nezměněné formě nebo výhodně ve formě prostředků společně s pomocnými látkami obvyklými při přípravě takovýchto prostředků a zpracovávají se tudíž známým způsobem, například na emulzní koncentráty, na přímo rozstřikovatelné nebo dále ředitelné roztoky, zředěné emulze, smáčitelné prášky, rozpustné prášky, popraše, granuláty, také enkapsulované například v polymerních látkách.

Způsoby aplikace, jako je postřikování, zamlžování, posypávání nebo zalévání, se stejně jako druh prostředků volí v souladu s požadovanými cíli a podle daných poměrů.

Prostředky, které obsahují účinnou látku vzorce I a popřípadě pevnou nebo kapalnou přísadu, jakož i koncentráty nebo další přípravky tohoto typu se vyrábějí známým způsobem, například důkladným smísením nebo/a rozemletím účinných látek s plnidly, jako například s rozpouštědly, pevnými nos-

nými látkami a popřípadě povrchově aktivními sloučeninami (tenzidy).

Jako rozpouštědla mohou přicházet v úvahu aromatické uhlovodíky, výhodně frakce obsahující 8 až 12 atomů uhlíku, jako jsou například směsi xylenů, nebo substituované naftaleny, estery kyseliny ftalové jako dibutylftalát nebo dioktylftalát, alifatické uhlovodíky, jako cyklohexan nebo parafinické uhlovodíky, alkoholy a glykoly, jakož i jejich ethery a estery, jako ethanol, ethylenglykol, ethylenglykolmonomethylether nebo ethylenglykolmonoethylether, ketony, jako cyklohexanon, silně polární rozpouštědla, jako N-methyl-2-pyrrolidon, dimethylsulfoxid nebo dimethylformamid, jakož i popřípadě epoxidované rostlinné oleje, jako epoxidovaný kokosový olej nebo sójový olej, nebo voda.

Jako pevné nosné látky, například pro popraše a dispergovatelné prášky se používají zpravidla přírodní kamenné moučky, jako vápenec, mastek, kaolin, montmorillonit nebo attapulgit. Ke zlepšení fyzikálních vlastností se mohou přidávat také vysoce disperzní kyselina křemičitá nebo vysoce disperzní savé polymery.

Jako zrněné adsorptivní nosné látky granulátů přicházejí v úvahu porézní typy, jako například pemza, cihlová drť, sepiolit nebo bentonit, jako nesorptivní nosné materiály, například vápenec nebo písek. Kromě toho se může používat velký počet předem granulovaných materiálů anorganického nebo organického původu, jako zejména dolomit nebo rozmělněné zbytky rostlin.

Jako povrchově aktivní sloučeniny přicházejí v úvahu vždy podle druhu zpracovávané účinné látky vzorce I neionogenní, kationaktivní nebo/a anionaktivní tenzidy s dobrými emulgačními vlastnostmi, dispergačními vlastnostmi a smáčecími vlastnostmi. Tenzidy se rozumí také směsi tenzidů.

Vhodnými anionickými tenzidy mohou být jak tzv. ve vodě rozpustná mýdla, tak i ve vodě rozpustné syntetické povrchově aktivní sloučeniny.

Jako mýdla lze uvést soli vyšších mastných kyselin (s 10 až 22 atomy uhlíku) s alkalickými kovy, s kovy alkalických zemin nebo odpovídající, popřípadě substituované amoniové soli, jako jsou například sodné nebo draselné soli olejové kyseliny nebo stearové kyseliny nebo směsi přírodních mastných kyselin, které se získávají například z kokosového oleje nebo z oleje získaného z loje. Uvést nutno dále také soli mastných kyselin s methylaurinem.

Častěji se však používají tzv. syntetické tenzidy, zejména mastné sulfonáty, mastné sulfáty, sulfonované deriváty benzimidazolu nebo alkylarylsulfonáty.

Mastné sulfonáty nebo mastné sulfáty se vyskytují zpravidla jako soli s alkalickými kovy, s kovy alkalických zemin nebo popřípadě jako substituované amoniové soli a obsahují alkylový zbytek s 8 až 22 atomy uh-

líku, přičemž alkyl zahrnuje také alkylovou část acylových zbytků, jako je například sodná nebo vápenatá sůl ligninsulfonové kyseliny, esteru dodecylsírové kyseliny nebo směs sulfatovaných mastných alkoholů vyrobená z přírodních mastných kyselin. Sem patří také soli esterů sírové kyseliny a sulfonových kyselin aduktů mastných alkoholů s ethylenoxidem.

Sulfonované deriváty benzimidazolu obsahují výhodně 2 sulfoskupiny a zbytek mastné kyseliny s 8 až 22 atomy uhlíku. Alkylarylsulfonáty jsou představovány například sodnými, vápenatými nebo triethanolamoniovými solemi dodecylbenzensulfonové kyseliny, dibutylnaftalensulfonové kyseliny nebo kondenzačního produktu naftalensulfonové kyseliny a formaldehydu.

V úvahu přicházejí dále také odpovídající fosfáty, jako například soli esteru fosforečné kyseliny aduktu p-nonylfenolu s ethylenoxidem (4 až 14) nebo fosfolipidy.

Jako neionogenní tenzidy přicházejí v úvahu především deriváty polyglykoetheru alifatických nebo cykloalifatických alkoholů, nasycených nebo nenasyčených mastných kyselin a alkylfenolů, které mohou obsahovat 3 až 30 glykoetherových skupin a 8 až 20 atomů uhlíku ve zbytku (alifatického) uhlovodíku a 6 až 18 atomů uhlíku v alkylovém zbytku alkylfenolů.

Dalšími vhodnými neionogenními tenzidy jsou ve vodě rozpustné adukty polyethylenoxidu s polypropylenglykolem, ethylendiaminopolypropylenglykolem a alkylpolypropylenglykolem s 1 až 10 atomy uhlíku v alkylovém řetězci, obsahující 20 až 250 ethylenglykoetherových skupin a 10 až 100 propylenglykoetherových skupin. Uvedené sloučeniny obsahují obvykle na jednu jednotku propylenglykolu jednu až pět jednotek ethylenglykolu.

Jako příklady neionogenních tenzidů lze uvést nonylfenolpolyethoxyethanoly, polyglykoethery ricinového oleje, adukty polypropylenu s polyethylenoxidem, tributylfenoxypolyethoxyethanol, polyethylenglykol a oktylfenoxypolyethoxyethanol.

Dále přicházejí v úvahu také estery mastných kyselin odvozené od polyoxyethylen-sorbitanu, jako je polyoxyethylensorbitan-trioleát.

U kationických tenzidů se jedná především o kvartérní amoniové soli, které obsahují jako substituent na atomu dusíku alespoň jeden alkylový zbytek s 8 až 22 atomy uhlíku a které obsahují jako další substituenty nižší, popřípadě halogenované alkylové zbytky, benzylové zbytky nebo nižší hydroxyalkylové zbytky. Tyto soli se vyskytují výhodně ve formě halogenidů, methylsulfátů nebo ethylsulfátů a jako příklad lze uvést například stearyltrimethylamoniumchlorid nebo benzyl-di-(2-chlorethyl)-ethylamoniumbromid.

Tenzidy upotřebitelné při výrobě agroche-

některých prostředků podle vynálezu jsou popsány kromě jiného v následujících publikacích: „Mc Cutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual“ MC Publishing Corp., Ringewood, New Jersey, 1979; Sesley and Wood, „Encyclopedia of Surface Active Agents“, Chemical Publishing Co., Inc. New York 1964.

Emulgovatelné koncentráty:

účinná látka	1 až 20 %	výhodně 5 až 10 %
povrchově aktivní činidlo	5 až 30 %	výhodně 10 až 20 %
kapalná nosná látka	50 až 94 %	výhodně 70 až 85 %

Popraše:

účinná látka	0,1 až 10 %	výhodně 0,1 až 1 %
pevná nosná látka	99,9 až 90 %	výhodně 99,9 až 99 %

Suspenzní koncentráty:

účinná látka	5 až 75 %	výhodně 10 až 50 %
voda	94 až 25 %	výhodně 90 až 30 %
povrchově aktivní látka	1 až 40 %	výhodně 2 až 30 %

Smáčitelné prášky:

účinná látka	0,5 až 90 %	výhodně 1 až 80 %
povrchově aktivní látka	0,5 až 20 %	výhodně 1 až 15 %
pevná nosná látka	5 až 95 %	výhodně 15 až 90 %

Granuláty:

účinná látka	0,5 až 30 %	výhodně 3 až 15 %
pevná nosná látka	99,5 až 70 %	výhodně 97 až 85 %

Zatímco jako obchodní zboží jsou výhodné spíše koncentrované prostředky, používá konečný spotřebitel zpravidla zředěné prostředky. Aplicační prostředky se mohou ředit až na 0,001% obsah účinné látky. Aplikované množství činí zpravidla 0,01 až 10 kilogramů účinné látky na 1 ha, výhodně 0,025 až 5 kg účinné látky na 1 ha.

Příklady ilustrující způsob výroby účinných látek:

Příklad 1

N-(2-methoxykarbonyl-3-thienylsulfonfyl)-N'-(4-difluormethoxy-6-methylpyrimidin-2-yl)močovina

K roztoku 4,4 g 2-amino-4-difluormethoxy-6-methylpyrimidinu v 80 ml absolutního tetrahydrofuranu se nechá za míchání přikapat roztok 6,2 g 2-methoxykarbonyl-3-thienylsulfonfylisokyanátu v 50 ml absolutního tetrahydrofuranu. Teplota reakční směsi se přitom zvýší z 20 na 26 °C. Po dalším jednohodinovém míchání se reakční směs zfiltruje a potom se filtrát odpaří. Krystalizací zbytku z ethylacetátu se získá 5,3 g (50 % teorie) N-(2-methoxykarbonyl-3-thie-

nylsulfonfyl)-N'-(4-difluormethoxy-6-methylpyrimidin-2-yl)močoviny o teplotě tání 178 až 179 °C (sloučenina č. 2.1).

Kromě postupem podle vynálezu se mohou účinné sloučeniny obecného vzorce I vyrábět také dále popsanými postupy:

Příklad 2

N-(2-chlor-3-pyridinylsulfonfyl)-N'-(4-difluormethoxy-6-methylpyrimidin-2-yl)močovina

Ke směsi 0,652 g 2-chlor-3-pyridinylsulfonamidu, 0,55 ml 1,8-diazabicyklo[5,4,0]-undec-7-enu v 10 ml absolutního dioxanu se přidá při teplotě 25 °C 1,0 g N-(4-difluormethoxy-6-methylpyrimidin-2-yl)fenylkarbamátu. Reakční směs se při stejné teplotě míchá dále 1,5 hodiny a potom se odpaří. K odparku se přidá ledová voda a směs se zneutralizuje 1,86 ml 2 N roztoku chlorovodíkové kyseliny. Vzniklá sraženina se oddělí, promyje se vodou a vysuší se. Takto se získá 1,2 g (90 % teorie) N-(2-chlor-3-pyridinylsulfonfyl)-N'-(4-difluormethoxy-6-methylpyrimidin-2-yl)močoviny o teplotě tání 161 až 162 °C (sloučenina č. 1.15).

Příklad 3

N-(2-pyridinylsulfonyl)-N'-(4-difluormethoxy-6-methylpyrimidin-2-yl)močovina

K roztoku 0,52 g 2-pyridinylsulfonamidu a 0,55 g 1,8-diazabicyklo[5,4,0]undec-7-enu v 10 ml absolutního dioxanu se přidá 1,0 g N-(4-difluormethoxy-6-methylpyrimidin-2-yl)fenylkarbamátu a reakční směs se míchá 6 hodin při teplotě 20 až 25 °C. Potom se reakční směs vyjme vodou a okyslí se 2 N chlorovodíkovou kyselinou. Vzniklá sraženina se oddělí, promyje se vodou a překrystaluje se ze směsi acetonu a etheru. Takto se získá 0,5 g (42,4 % teorie) N-(2-pyridinylsulfonyl)-N'-(4-difluormethoxy-6-methylpyrimidin-2-yl)močoviny o teplotě tání 150 až 151 °C (sloučenina č. 1.1).

Příklad 4

N-pyrrolylsulfonyl-N'-(4-difluormethoxy-6-methylpyrimidin-2-yl)močovina

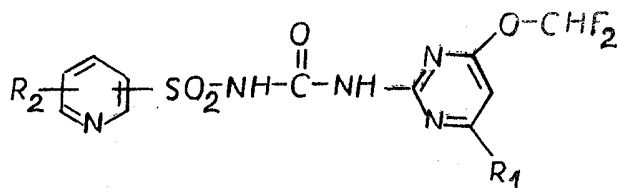
K roztoku 7,0 g 2-amino-4-difluormethoxy-6-methylpyrimidinu ve 100 ml absolutního tetrahydrofuranu se při teplotě 0 až 5 °C přikape 5,7 g chlorsulfonylisokyanátu. Po-

tom se vzniklý žlutý roztok míchá 10 minut při teplotě 0 °C a potom se přidá 5,6 ml pyrrolu a reakční směs se míchá 17 hodin při teplotě 20 až 25 °C. Po odpaření rozpouštědla se zbytek vyjme směsí 25 ml methanolu, 50 ml vody a 3,2 g hydroxidu sodného, protřepává se intenzivně po dobu 10 minut, dvakrát se promyje vždy 50 ml methylenchloridu a okyslí se ledovou kyselinou octovou. Potom se kyselý vodný roztok extrahuje ethylacetátem. Organické extrakty se vysuší síranem hořečnatým a odpaří se. Přitom se získá ve 20% výtěžku směs 1 : 1 dvou isomerních produktů.

Tato směs isomerů se chromatografuje na silikagelu za použití směsi petroletheru a ethylacetátu (4:1) jako elučního činidla. Takto se získá N-(2-pyrrolylsulfonyl)-N'-(4-difluormethoxy-6-methylpyrimidin-2-yl)močovina o teplotě tání 189 °C (sloučenina č. 4.1) a N-(3-pyrrolylsulfonyl)-N'-(4-difluormethoxy-6-methylpyrimidin-2-yl)močovina o teplotě tání 173 až 174 °C (sloučenina č. 4.8).

Analogickým způsobem se získají sloučeniny vzorce I uvedené v následujících tabulkách 1 až 4.

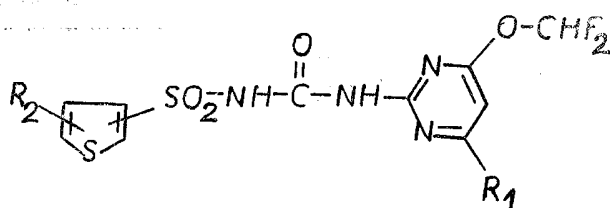
Tabulka 1



Sloučenina číslo	R ₁	R ₂	Poloha sulfonylové skupiny	Teplota tání °C
1.1	CH ₃	H	2	150 až 151
1.2	OCH ₃	H	2	
1.3	Cl	H	2	
1.4	—N(CH ₃) ₂	H	2	
1.5	C ₂ H ₅	H	2	138 až 141
1.7	—OCHF ₂	H	2	
1.8	CH ₃	H	3	
1.9	OCH ₃	H	3	
1.10	Cl	H	3	
1.11	—N(CH ₃) ₂	H	3	
1.12	C ₂ H ₅	H	3	
1.14	—OCHF ₂	H	3	
1.15	CH ₃	2-Cl	3	161 až 162
1.16	OCH ₃	2-Cl	3	
1.17	Cl	2-Cl	3	
1.18	—N(CH ₃) ₂	2-Cl	3	
1.19	C ₂ H ₅	2-Cl	3	
1.21	—OCHF ₂	2-Cl	3	
1.22	CH ₃	2-COOCH ₃	3	
1.23	OCH ₃	2-COOCH ₃	3	
1.24	Cl	2-COOCH ₃	3	
1.25	—N(CH ₃) ₂	2-COOCH ₃	3	
1.26	C ₂ H ₅	2-COOCH ₃	3	
1.28	—OCHF ₂	2-COOCH ₃	3	

Sloučenina číslo	R1	R2	Poloha sulfonylové skupiny	Teplota tání °C
1.29	CH ₃	2-SO ₂ -CH ₃	3	184 (rozklad)
1.30	OCH ₃	2-SO ₂ -CH ₃	3	
1.31	Cl	2-SO ₂ -CH ₃	3	
1.32	-N(CH ₃) ₂	2-SO ₂ -CH ₃	3	
1.33	C ₂ H ₅	2-SO ₂ -CH ₃	3	
1.35	-OCHF ₂	2-SO ₂ -CH ₃	3	
1.36	CH ₃	2-F	3	
1.37	OCH ₃	2-F	3	
1.38	Cl	2-F	3	
1.39	-N(CH ₃) ₂	2-F	3	
1.40	C ₂ H ₅	2-F	3	
1.42	-OCHF ₂	2-F	3	
1.43	CH ₃	3-Cl	3	
1.44	OCH ₃	3-Cl	2	
1.45	Cl	3-Cl	2	
1.46	-N(CH ₃) ₂	3-Cl	2	
1.47	C ₂ H ₅	3-Cl	2	
1.49	-OCHF ₂	3-Cl	2	
1.50	CH ₃	3-OCH ₃	2	
1.51	OCH ₃	3-OCH ₃	2	
1.52	Cl	3-OCH ₃	2	
1.53	-N(CH ₃) ₂	3-OCH ₃	2	
1.54	C ₂ H ₅	3-OCH ₃	2	
1.56	-OCHF ₂	3-OCH ₃	2	
1.71	CH ₃	6-F	2	
1.72	OCH ₃	6-F	2	
1.73	Cl	6-F	2	
1.74	-N(CH ₃) ₂	6-F	2	
1.75	C ₂ H ₅	6-F	2	
1.77	-OCH ₃	6-F	2	
1.78	CH ₃	6-OCH ₃	2	
1.79	OCH ₃	6-OCH ₃	2	
1.80	Cl	6-OCH ₃	2	
1.81	-N(CH ₃) ₂	6-OCH ₃	2	
1.82	C ₂ H ₅	6-OCH ₃	2	
1.84	-OCHF ₂	6-OCH ₃	2	
1.85	CH ₃	4-Cl	3	126 až 128
1.86	CH ₃	2-OCH ₃	3	148 až 150
1.87	CH ₃	2-OCH ₂ CH ₂ CH ₃	3	138 až 140
1.88	OCH ₃	2-OCH ₂ CH ₂ CH ₃	3	
1.89	CH ₃	4-COOC ₂ H ₅	3	
1.90	OCH ₃	4-COOC ₂ H ₅	3	

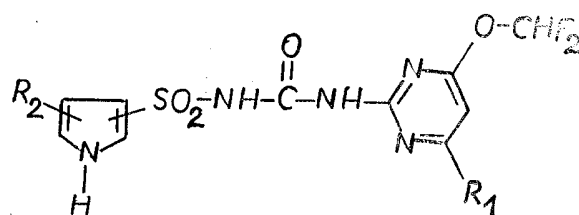
Tabulka 2



Sloučenina číslo	R ₁	R ₂	Poloha sulfonylové skupiny	Teplota tání °C
2.1	CH ₃	2-COOCH ₃	3	178 až 179
2.2	OCH ₃	2-COOCH ₃	3	171 až 174
2.3	Cl	2-COOCH ₃	3	119 až 120
2.4	—N(CH ₂) ₂	2-COOCH ₃	3	232
2.5	C ₂ H ₅	2-COOCH ₃	3	
2.7	—OCHF ₂	2-COOCH ₃	3	198 až 200
2.8	CH ₃	4-COOCH ₃	3	159 až 161
2.9	OCH ₃	4-COOCH ₃	3	161 až 162
2.10	Cl	4-COOCH ₃	3	
2.11	—N(CH ₃) ₂	4-COOCH ₃	3	225 až 227
2.12	C ₂ H ₅	4-COOCH ₃	3	
2.14	—OCHF ₂	4-COOCH ₃	3	178 až 179
2.15	CH ₃	2-CO—OCH(CH ₃) ₂	3	186 až 189
2.16	OCH ₃	2-CO—OCH(CH ₃) ₂	3	
2.17	Cl	2-CO—OCH(CH ₃) ₂	3	
2.18	—N(CH ₃) ₂	2-CO—OCH(CH ₃) ₂	3	
2.19	OC ₂ H ₅	2-CO—OCH(CH ₃) ₂	3	
2.21	—OCHF ₂	2-CO—OCH(CH ₃) ₂	3	
2.22	CH ₃	2-CO—OCH ₂ —CH=CH ₂	3	
2.23	OCH ₃	2-CO—OCH ₂ —CH=CH ₂	3	
2.24	Cl	2-CO—OCH ₂ —CH=CH ₂	3	
2.25	—N(CH ₃) ₂	2-CO—OCH ₂ —CH=CH ₂	3	
2.26	C ₂ H ₅	2-CO—OCH ₂ —CH=CH ₂	3	
2.28	—OCHF ₂	2-CO—OCH ₂ —CH=CH ₂	3	
2.29	CH ₃	5-Cl	2	
2.30	OCH ₃	5-Cl	2	
2.31	Cl	5-Cl	2	
2.32	—N(CH ₃) ₂	5-Cl	2	
2.33	C ₂ H ₅	5-Cl	2	
2.35	—OCHF ₂	5-Cl	2	
2.36	CH ₃	H	2	
2.37	OCH ₃	H	2	
2.38	Cl	H	2	
2.39	—N(CH ₃) ₂	H	2	
2.40	C ₂ H ₅	H	2	
2.42	—OCHF ₂	H	2	
2.43	CH ₃	H	3	
2.44	OCH ₃	H	3	
2.45	Cl	H	3	
2.46	—N(CH ₃) ₂	H	3	
2.47	C ₂ H ₅	H	3	
2.49	—OCHF ₂	H	3	
2.92	CH ₃	2-SO ₂ —CH ₃	3	
2.93	OCH ₃	2-SO ₂ —CH ₃	3	
2.94	Cl	2-SO ₂ —CH ₃	3	
2.95	—N(CH ₃) ₂	2-SO ₂ —CH ₃	3	
2.96	C ₂ H ₅	2-SO ₂ —CH ₃	3	
2.98	—OCHF ₂	2-SO ₂ —CH ₃	3	
2.99	CH ₃	3-SO ₂ —CH ₃	2	
2.100	OCH ₃	3-SO ₂ —CH ₃	2	
2.101	Cl	3-SO ₂ —CH ₃	2	
2.102	—N(CH ₃) ₂	3-SO ₂ —CH ₃	2	

Sloučenina číslo	R ₁	R ₂	Poloha sulfonylové skupiny	Teplota tání °C
2.103	C ₂ H ₅	3-SO ₂ --CH ₃	2	
2.105	--OCHF ₂	3-SO ₂ --CH ₃	2	
2.106	CH ₃	4-SO ₂ --CH ₃	3	
2.107	OCH ₃	4-SO ₂ --CH ₃	3	
2.108	Cl	4-SO ₂ --CH ₃	3	
2.109	--N(CH ₃) ₂	4-SO ₂ --CH ₃	3	
2.110	C ₂ H ₅	4-SO ₂ --CH ₃	3	
2.112	--OCHF ₂	4-SO ₂ --CH ₃	3	
2.141	CH ₃	2-CO--OC ₂ H ₅	3	
2.142	OCH ₃	2-CO--OC ₂ H ₅	3	
2.143	Cl	2-CO--OC ₂ H ₅	3	
2.144	--N(CH ₃) ₂	2-CO--OC ₂ H ₅	3	
2.145	C ₂ H ₅	2-CO--OC ₂ H ₅	3	
2.147	--OCHF ₂	3-COOC ₂ H ₅	3	
2.148	CH ₃	2-CO--OCH ₂ --C≡CH	3	
2.149	OCH ₃	2-CO--OCH ₂ --C≡CH	3	
2.150	Cl	2-CO--OCH ₂ --C≡CH	3	
2.151	--N(CH ₃) ₂	2-CO--OCH ₂ --C≡CH	3	
2.152	C ₂ H ₅	2-CO--OCH ₂ --C≡CH	3	
2.154	--OCHF ₂	2-CO--OCH ₂ --C≡CH	3	
2.155	CH ₃	3-COOCH ₃	2	
2.156	OCH ₃	3-COOCH ₃	2	
2.157	Cl	3-COOCH ₃	2	
2.158	--N(CH ₃) ₂	3-COOCH ₃	2	
2.159	C ₂ H ₅	3-COOCH ₂	2	
2.161	--OCHF ₂	3-COOCH ₃	2	
2.162	CH ₃	3-COOC ₂ H ₅	2	
2.163	OCH ₃	3-COOC ₂ H ₅	2	
2.164	Cl	3-COOC ₂ H ₅	2	
2.165	--N(CH ₃) ₂	3-COOC ₂ H ₅	2	
2.166	C ₂ H ₅	3-COOC ₂ H ₅	2	
2.168	--OCHF ₂	3-COOC ₂ H ₅	2	
2.169	CH ₃	3-CO--OCH(CH ₃) ₂	2	
2.170	OCH ₃	3-CO--OCH(CH ₃) ₂	2	
2.171	Cl	3-CO--OCH(CH ₃) ₂	2	
2.172	--N(CH ₃) ₂	3-CO--OCH(CH ₃) ₂	2	
2.173	C ₂ H ₅	3-CO--OCH(CH ₃) ₂	2	
2.175	--OCHF ₂	3-CO--OCH(CH ₃) ₂	2	
2.206	CH ₃	4-COO--CH ₂ --C≡CH	3	178 až 180
2.207	OCH ₃	4-COO--CH ₂ --C≡CH	3	
2.208	OCH ₃	4-COO--CH ₂ --CH=CH ₂	3	147 až 149
2.209	CH ₃	4-COOC ₂ H ₅	3	161
2.210	OCH ₃	4-COOC ₂ H ₅	3	158
2.211	CH ₃	2-COO(CH ₂) ₂ --OCH ₃	3	134 až 135

Tabulka 3



Sloučenina číslo	R ₁	R ₂	Poloha sulfonylové skupiny	Teplota tání °C
4.1	CH ₃	H	2	189
4.2	OCH ₃	H	2	
4.3	Cl	H	2	
4.4	—N(CH ₃) ₂	H	2	
4.5	C ₂ H ₅	H	2	
4.7	OCHF ₂	H	2	173 až 174
4.8	CH ₃	H	3	
4.9	OCH ₃	H	3	
4.10	Cl	H	3	
4.11	—N(CH ₃) ₂	H	3	
4.12	C ₂ H ₅	H	3	
4.14	—OCHF ₂	H	3	

Příklady ilustrující složení a přípravu prostředků:

Příklad 5

Příklady prostředků pro účinné látky vzorce I
(% = % hmotnostní)

a) Smáčitelný prášek	a)	b)	c)
účinná látka	20 %	60 %	0,5 %
natriumligninsulfonát	5 %	5 %	5 %
natriumlaurylsulfát	3 %	—	—
natriumdiisobutyl-naftalen-sulfonát	—	6 %	6 %
oktylphenolpolyethylenglykolether	—	2 %	2 %
(7 až 8 mol ethylenoxidu)	—	—	—
vysocedisperzní kyselina	—	—	—
křemičitá	5 %	27 %	27 %
kaolin	67 %	—	—
chlorid sodný	—	—	59,5 %

Účinná látka se dobře promísí s jednotlivými přísadami a směs se dobře rozemele ve vhodném mlýně. Získá se smáčitelný prá-

šek, který se dá ředit vodou na suspenze každé požadované koncentrace.

b) Emulzní koncentrát	a)	b)
účinná látka	10 %	1 %
oktylphenolpolyethylenglykolether	—	—
(4 až 5 mol ethylenoxidu)	3 %	3 %
vápenatá sůl dodecylbenzensulfonové kyseliny	3 %	3 %
polyglykolether ricinového oleje	—	—
(36 mol ethylenoxidu)	4 %	4 %
cyklohexanon	30 %	10 %
směs xylenů	50 %	79 %

Z tohoto koncentrátu se mohou ředěním vodou připravovat emulze každé požadované koncentrace.

c) Popraš	a)	b)
účinná látka	0,1 %	1 %
mastek	99,9 %	—
kaolin	—	99 %

Účinná látka se smísí s nosnou látkou a směs se rozemele na vhodném mlýně. Získá se přímo upotřebitelná popraš.

d) Granulát připravený vytlačováním	a)	b)
účinná látka	10 %	1 %
natriumligninsulfonát	2 %	2 %
karboxymethylcelulóza	1 %	1 %
kaolin	87 %	96 %

Účinná látka se smísí s přísadami, směs se rozemele a zvlhčí se vodou. Tato směs se zpracuje na vytlačovací stroji a potom se vysuší v proudě vzduchu.

Jemně rozemletá účinná látka se v mísi-
či rovnoměrně nanese na kaolin zvlhčený
polyethylenglykolem. Tímto způsobem se
získá neprašivý obalovaný granulát.

e) Obalovaný granulát

účinná látka

polyethylenglykol (molekulová	3 %
hmotnost 200)	3 %
kaolin	94 %

f) Suspenzní koncentrát	a)	b)
účinná látka	40 %	5 %
ethylenglykol	10 %	10 %
nonylfenolpolyethylenglykoether {15 mol ethylenoxidu}	6 %	1 %
natriumligninsulfonát	10 %	5 %
karboxymethylcelulóza	1 %	1 %
37% vodný roztok formaldehydu	0,2 %	0,2 %
silikonový olej ve formě 75% vodné emulze	0,8 %	0,8 %
voda	32 %	77 %

Jemně rozemletá účinná látka se důkladně smísí s přísadami. Tímto způsobem se získá suspenzní koncentrát, ze kterého se mohou připravovat ředěním vodou suspenze každé požadované koncentrace.

g) Roztok soli

účinná látka	5 %
isopropylamin	1 %
oktylfenolpolyethylenglykol- ether (78 mol ethylenoxidu)	3 %
voda	91 %

Příklady ilustrující biologickou účinnost:

Příklad 6

Herbicidní účinek při preemergentní aplikaci

a) Květináče z plastické hmoty se naplní expandovaným vermikulitem (měrná hmotnost: 0,135 g/cm³, schopnost absorpce vody: 0,565 litru/litr). Po nasycení neadsorptivního vermikulitu vodnou emulzí účinné látky v deionizované vodě, která obsahuje účinné látky v koncentraci 70,8 ppm, se na povrch zasejí semena následujících rostlin: *Nasturtium officinalis*, psineček (*Agrostis tenuis*), ptačinec žabinec (*Stellaria media*) a rosníčka krvavá (*Digitaria sanguinalis*). Pokusné nádoby se potom udržují v klimatizované místnosti při 20 °C osvětlení asi 20 kLux a při relativní vlhkosti 70 %. Po dobu fáze klíčení (4 až 5 dnů) se květináče ke zvýšení lokální vlhkosti vzduchu přikryjí materiálem propustným pro světlo a zalévají se demineralizovanou vodou. Po 5. dnu se k zálivkové vodě přidá 0,5 % na trhu ob-

vyklého hnojiva (® Greenzit). 12 dnů po zasetí se pokus vyhodnotí a na pokusných rostlinách se hodnotí účinek podle následujícího měřítka:

- 1 rostliny neklíčí nebo jsou zcela odumřelé
2—3 velmi silný účinek

4—6 střední účinek

7—8 slabý účinek

9 žádný účinek [jako v případě neošetřené kontroly]

Herbicidní účinek při preemergentní aplikaci (výsledky):

koncentrace účinné látky v emulzi: 70,8 ppm

Účinná látka číslo	Pokusná rostlina			
	Nasturtium	Stellaria	Agrostis	Digitaria
1.1	1	3	1	1
1.15	1	1	1	1
1.29	2	3	2	3
1.50	1	2	1	1
1.86	2	6	2	2
1.87	2	4	2	5
2.1	1	1	1	1
2.2	1	1	1	1
2.3	2	4	2	3
2.4	1	4	1	3
2.7	1	3	1	6
2.8	1	2	1	2
2.9	1	2	1	2
2.11	1	2	1	2
2.14	1	2	1	3
2.15	2	2	2	3
2.148	2	2	1	3
2.206	1	2	1	3
2.208	2	2	2	2
2.209	2	2	2	2
2.210	2	2	2	2
2.211	1	2	1	2

b) Ve skleníku se do květináčů o průměru 12 až 13 cm zasejí semena rostlin. Bezprostředně potom se povrch půdy ošetří vodnou disperzí nebo roztokem účinných látek. Používá se koncentrací 125 a 30 g účinné látky na 1 ha. Květináče se potom udr-

žují ve skleníku při teplotě 22 až 25 °C a při 50 až 70% relativní vlhkosti vzduchu. Po 3 týdnech se pokus vyhodnotí. Účinek na pokusné rostliny se hodnotí podle stejného měřítka jako je uvedeno shora.

Herbicidní účinek při preemergentní aplikaci:

Pokusná rostlina

Účinek při aplikovaném množství
g účinné látky/ha

	sloučenina č. 2.2		sloučenina č. 2.8		sloučenina č. 2.9		sloučenina č. 2.14	
	125	30	125	30	125	30	125	30
ječmen	8	9	2	4	2	6	7	9
pšenice	6	8	3	4	3	7	8	9
kukuřice	6	8	7	8	8	9	9	9
rýže (pěstovaná za sucha)	3	6	1	1	1	2	6	7
Alopecurus myosuroides	5	6	2	3	1	2	2	4
Echinochloa crus-galli	8	9	3	4	4	7	9	9
Rottboellia ex.	8	9	6	7	5	7	6	9
Cyperus esculentus	4	8	1	4	1	2	3	9
sója	8	8	8	9	5	7	7	9
bavlník	4	7	4	5	3	5	9	9
cukrová řepa	2	2	2	3	1	1	2	4
abutilon	2	4	5	6	2	4	7	7
Xanthium spec.	7	9	4	5	3	4	6	9
Amaranthus retroflexus	3	3	2	3	2	2	2	2
Chenopodium spec.	4	6	5	6	2	2	3	9
Solanum nigrum	5	8	3	4	2	3	3	9
Ipomoea	4	9	6	8	4	6	3	9
Sinapis	2	3	3	4	1	1	3	9
Stellaria	3	4	3	4	2	2	2	2
Chrysanthemum leucotrichum	2	3	2	2	1	1	2	9
Galium aparine	3	5	3	3	1	2	2	5
Viola tricolor	2	2	3	3	1	2	3	9
Veronica spec.	1	2	1	1	1	1	2	2

Příklad 7

Test na herbicidní účinek při postemergentní aplikaci (kontaktní účinek)

Plevele a kulturní rostliny, a to jak jednoděložné, tak i dvojděložné, se po vzejití, se stadiu 4 až 6 listů postříkají vodnou dis-

perzí účinných látek v dávkách od 125 do 30 g účinné látky na 1 ha. Potom se rostliny udržují při teplotě 24 až 26 °C a při 45 až 60% relativní vlhkosti vzduchu. 15 dnů po ošetření se pokus vyhodnotí podle stejného měřítka jako je uvedeno pro preemergentní test.

Herbicidní účinek při postemergentní aplikaci (výsledky):

Pokusná rostlina

Účinek při použitém množství
g účinné látky/ha

	sloučenina č. 2.2		sloučenina č. 2.9	
	125	30	125	30
pšenice	8	9	7	8
kukuřice	8	9	8	9
rýže (pěstovaná za sucha)	8	9	5	7
Alopecurus myosuroides	6	7	4	7
Echinochloa crus-galli	8	9	6	7
Cyperus esculentus	4	6	3	4
sója	6	7	5	7
bavlník	5	6	8	8
cukrová řepa	2	2	2	2
abutilon	3	4	2	3
Xanthium spec.	2	2	2	2
Chenopodium spec.	5	6	3	5
Ipomoea	4	7	4	5
Sinapis	2	2	3	3
Galium aparine	4	5	4	6
Viola tricolor	2	3	2	4

Příklad 8

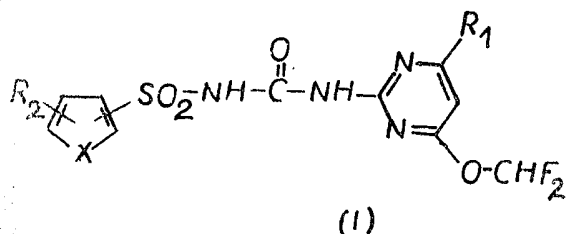
Test na zbrzdění růstu luskovin, používaných v tropických oblastech ke krytí půdy (cover crops)

Pokusné rostliny (*Centrosema plumieri* a *Centrosema pubescens*) se pěstují až do vzrostlého stadia a potom se sestříhnou na výšku 60 cm. Po 7 dnech se aplikuje účinná látka postřikem ve formě vodné emulze. Pokusné rostliny se udržují při 70% rela-

tivní vlhkosti vzduchu a při umělém světle 6 000 luxů, denně 14 hodin, při teplotách 27 °C přes den a při 21 °C v noci. 4 týdny po aplikaci se pokus vyhodnotí. Přitom se odhadne a zváží nový přírůstek ve srovnání s kontrolou a vyhodnotí se fytoxicita. Při tomto testu vykazují rostliny ošetřené účinnými látkami vzorce I patrné snížení nového přírůstku (méně než 20 % nového přírůstku u neošetřených kontrolních rostlin), aniž by přitom byly pokusné rostliny poškozeny.

PŘEDMĚT VYNÁLEZU

1. Herbicidní prostředek a prostředek k regulaci růstu rostlin, vyznačující se tím, že vedle nosných látek nebo/a dalších přísad obsahuje jako účinnou složku alespoň jednu N-heterocyklosulfonyl-N'-pyrimidinyl-močovinu obecného vzorce I



v němž

X znamená síru, skupinu $-\text{NH}-$ nebo skupinu $-\text{CH}=\text{N}-$,

R₁ znamená alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, halogenalkoxyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, alkokyskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, atom halogenu nebo dialkylaminoskupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylových částech,

R₂ znamená atom vodíku, atom halogenu, alkokyskupinu s 1 až 3 atomy uhlíku, alkylsulfonylovou skupinu s 1 až 3 atomy uhlíku nebo skupinu $-\text{CO}-\text{R}_3$, ve které R₃ znamená alkokyskupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, alkenyloxyskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku, alkinyloxyskupinu se 3 až 6 atomy uhlíku nebo methoxyethoxyskupinu, nebo sůl sloučeniny vzorce I.

2. Prostředek podle bodu 1, vyznačující se tím, že jako účinnou složku obsahuje alespoň jednu sloučeninu obecného vzorce I, v němž R₁ znamená atom chloru, dimethylaminoskupinu, methoxyskupinu, ethoxyskupinu, difluormethoxyskupinu, methylovou skupinu nebo ethylovou skupinu a X a R₂ mají významy uvedené v bodě 1.

3. Prostředek podle bodu 1, vyznačující se tím, že jako účinnou složku obsahuje alespoň jednu sloučeninu obecného vzorce I, v němž R₂ zaujímá sousední polohu vůči sulfonylové skupině, přičemž X, R₁ a R₂ mají významy uvedené v bodě 1.

4. Prostředek podle bodu 3, vyznačující

se tím, že jako účinnou složku obsahuje alespoň jednu sloučeninu obecného vzorce I, v němž R₂ znamená atom vodíku, atom fluoru, atom chloru, alkokyskupinu s 1 až 3 atomy uhlíku, methylsulfonylovou skupinu, skupinu $-\text{CO}-\text{OCH}_2\text{CH}_2-\text{OCH}_3$, skupinu $-\text{CO}-\text{OCH}_2-\text{CH}=\text{CH}_2$, skupinu $-\text{CO}-\text{OCH}_2-\text{C}\equiv\text{CH}$ nebo alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, přičemž X a R₁ mají význam uvedené v bodě 1.

5. Prostředek podle bodu 1, vyznačující se tím, že jako účinnou složku obsahuje alespoň jednu sloučeninu obecného vzorce I, v němž R₁ znamená atom chloru, dimethylaminoskupinu, methoxyskupinu, ethoxyskupinu, difluormethoxyskupinu, methylovou nebo ethylovou skupinu, R₂ se nachází v sousední poloze k sulfonylové skupině a znamená atom vodíku, atom fluoru, atom chloru, alkokyskupinu s 1 až 3 atomy uhlíku, methylsulfonylovou skupinu, skupinu $-\text{CO}-\text{OCH}_2-\text{CH}_2-\text{OCH}_3$, skupinu $-\text{CO}-\text{OCH}_2-\text{CH}=\text{CH}_2$, skupinu $-\text{CO}-\text{OCH}_2-\text{C}\equiv\text{CH}$ nebo alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části, a X má význam uvedený v bodě 1.

6. Prostředek podle bodu 1, vyznačující se tím, že jako účinnou složku obsahuje alespoň jednu sloučeninu obecného vzorce I, v němž X znamená atom síry, R₁ znamená atom chloru, dimethylaminoskupinu, methoxyskupinu nebo methylovou skupinu a R₂ zaujímá sousední polohu vůči sulfonylové skupině a znamená skupinu $-\text{CO}-\text{OCH}_2-\text{CH}=\text{CH}_2$, skupinu $-\text{CO}-\text{OCH}_2-\text{CH}_2-\text{OCH}_3$, skupinu $-\text{CO}-\text{OCH}_2-\text{C}\equiv\text{CH}$ nebo alkoxykarbonylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části.

7. Prostředek podle bodu 1, vyznačující se tím, že jako účinnou složku obsahuje alespoň jednu sloučeninu obecného vzorce I, v němž X znamená skupinu $-\text{CH}=\text{N}-$, R₁ znamená methylovou skupinu nebo ethylovou skupinu a R₂ se nachází v sousední poloze k sulfonylové skupině a znamená atom vodíku, atom chloru, alkokyskupinu s 1 až 3 atomy uhlíku.

8. Prostředek podle bodu 1, vyznačující se tím, že jako účinnou složku obsahuje

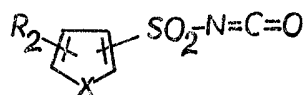
N-(4-methoxykarbonyl-3-thienylsulfonyl)-N'-(4-difluormethoxy-6-methoxypyrimidin-2-yl)močovinu.

9. Prostředek podle bodu 1, vyznačující se tím, že jako účinnou složku obsahuje N-(2-methoxykarbonyl-3-thienylsulfonyl)-N'-(4-difluormethoxy-6-methylpyrimidin-2-yl)močovinu.

10. Prostředek podle bodu 1, vyznačující se tím, že jako účinnou složku obsahuje N-(4-methoxykarbonyl-3-thienylsulfonyl)-N'-(4-difluormethoxy-6-methylpyrimidin-2-yl)močovinu.

11. Prostředek podle bodu 1, vyznačující se tím, že jako účinnou složku obsahuje N-(2-chlor-3-pyridinylsulfonyl)-N'-(4-difluormethoxy-6-methylpyrimidin-2-yl)močovinu.

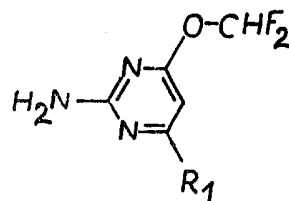
12. Způsob výroby účinné složky podle bodu 1, obecného vzorce I, vyznačující se tím, že se při teplotě mezi -20°C a $+120^{\circ}\text{C}$ nechá reagovat heterocyklosulfonylisokyanát obecného vzorce IV



(IV)

v němž

X a R₂ mají význam uvedený v bodě 1, popřípadě za přítomnosti báze, s aminopyrimidinem obecného vzorce V



(V)

v němž

R₁ má význam uvedený v bodě 1, a získaný derivát sulfonylmočoviny vzorce I se popřípadě převede na sůl působením amínu, hydroxidu alkalického kovu nebo kovu alkalické zeminy nebo kvartérní amoniové báze.