

ČESkoslovenská
SOCIALISTICKÁ
REPUBLIKA
(19)



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU K PATENTU

247184

(11) (B2)

(51) Int. Cl.⁴
A 01 N 31/06

- (22) Přihlášeno 13 09 84
(21) PV 6906-84
(32) (31)(33) Právo přednosti od 17 08 84
(640791) a od 16 09 83 (532882) Spojené
státy americké
(40) Zveřejněno 15 05 86
(45) Vydáno 16 05 88

(72) Autor vynálezu MICHAELY WILLIAM JAMES, RICHMOND, KRAATZ GARY WAYNE, SAN JOSE
(Sp. st. a.)
(73) Majitel patentu STAUFFER CHEMICAL COMPANY, WESTPORT (Sp. st. a.)

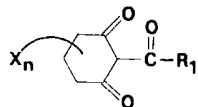
(54) Herbicidní prostředek

Prostředek pro potlačování nežádoucí vegetace na bázi 2-(2-substituovaný benzoyl)-1,3-cyklohexandionů obecného vzorce I, kde R je C₁-C₆alkyl, R¹ je vodík,

C₁-C₆alkyl nebo skupina vzorce R^a-O-C-, kde R^a je C₁-C₄alkyl, nebo R a R₁ společně představují alkylenovou skupinu s 3 až 6 uhlíkovými atomy, R² je chlor, brom, jod, fluor nebo C₁-C₄alkoxyskupina, R³ a R⁴ nezávisle představují vodík, halogen, C₁-C₄alkyl, C₁-C₄alkoxyskupinu, skupinu OCF₃, kyanoskupinu, nitroskupinu, C₁-C₄-halogenalkyl, skupinu vzorce R^bSO_n⁻, kde R^b je C₁-C₄alkyl, C₁-C₄halogenalkyl, fenyl, benzyl, skupina vzorce -NR^dR^e, kde R^d a R^e nezávisle představují vodík nebo C₁-C₄alkyl, a n je celé číslo 0, 1 nebo 2, a C₁-C₄alkylthioskupinu, R⁵ je vodík nebo C₁-C₆alkyl, R⁶ je vodík nebo C₁-C₆alkyl, R⁷ je vodík nebo C₁-C₆alkyl a R⁸ je vodík nebo C₁-C₆ alkyl nebo R⁵ a R⁶ společně tvoří substituovaný nebo ne-substituovaný alkylenový kruh s 2 až 5 uhlíkovými atomy, kde substituentem je jedna nebo dvě methylové skupiny, a/nebo jejich agrochemicky přijatelných solí.

Vynález se týká prostředku pro potlačování nežádoucí vegetace.

Sloučeniny strukturního vzorce



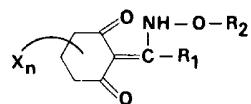
kde

X představuje alkyl,

n může být 0, 1 nebo 2 a

R_1 představuje fenyl nebo substituovaný fenyl,

jsou popsány ve zveřejněné japonské patentové přihlášce č. 84632-1974 jako meziprodukty pro přípravu herbicidních sloučenin vzorce



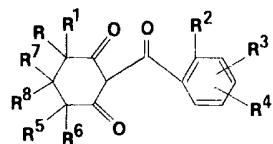
kde R_1, X a n mají výše uvedený význam a

R_2 představuje alkyl, alkenyl nebo alkinyl.

Konkrétně jsou z posledně uvedené skupiny jmenovány sloučeniny, kde n je 2, X je 5,5-dimethyl, R_2 je allyl a R_1 je fenyl, 4-chlorfenyl nebo 4-methoxyfenyl. Intermediární prekury těchto tří konkrétně uvedených sloučenin nemají žádnou nebo téměř žádnou herbicidní účinnost.

Naproti tomu sloučeniny podle vynálezu mají výjimečnou herbicidní účinnost, která je důsledkem substituce polohy 2 ve fenylové skupině chlorem, bromem, jodem nebo alkoxykupinou. Výhodným substituentem je chlor. Přesný důvod, proč takováto substituce dodává sloučenině výjimečnou herbicidní účinnost, není plně objasněn.

Předmětem vynálezu je prostředek pro potlačování nežádoucí vegetace na bázi nových herbicidních 2-(2-substituovaný benzoyl)-cyklohexan-1,3-dionů. Sloučeniny podle vynálezu mají strukturní vzorec



kde

R je C_1-C_6alkyl, výhodně C_1-C_4alkyl, výhodněji methyl,

R^1 je vodík nebo C_1-C_6alkyl, výhodně C_1-C_4alkyl, výhodněji methyl, nebo skupina vzorce



kde R^a je C_1-C_4alkyl, město R^a a R^b mohou mít tvorí alkylen o 3 až 6 uhlíkových atomech, nejvhodněji je R^a=R^b=etilen.

R^2 je chlor, brom, jod, fluor nebo C_1-C_4 alkoxyskupina, výhodně methoxyskupina, nejvýhodněji je R^2 chlor, brom nebo methoxyskupina,

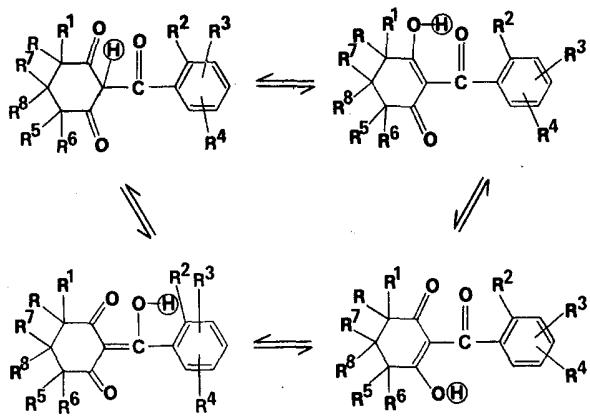
R^3 a R^4 nezávisle představují vodík, halogen, výhodně fluor, chlor nebo brom, C_1-C_4 -alkoxyskupinu výhodně methoxyskupinu, skupinu OCF_3 , kyanoskupinu, nitroskupinu, C_1-C_4 halogenalkyl, výhodně trifluormethyl, skupinu vzorce $R^bSO_n^-$, kde R^b je C_1-C_4 alkyl, výhodně methyl, C_1-C_4 halogenalkyl, fenyl, benzyl, skupina vzorce $-NR^dR^e$, kde R^d a R^e nezávisle představují vodík nebo C_1-C_4 alkyl, a \underline{n} je celé číslo 0, 1 nebo 2, výhodně 2, a C_1-C_4 alkylthioskupinu,

R^5 , R^6 , R^7 a R^8 jsou nezávisle stejné nebo různé a jsou vybrány ze skupiny, zahrnující vodík, C_1-C_6 alkyl, výhodně C_1-C_4 alkyl, výhodněji methyl, nejvýhodněji vodík nebo methyl, a jejich soli,

s podmínkou, že R^5 a R^6 mohou společně tvořit nesubstituovaný nebo substituovaný alkylenový kruh s 2 až 5 uhlíkovými atomy, přičemž výhodným substituentem je 1 nebo 2 methylové skupiny.

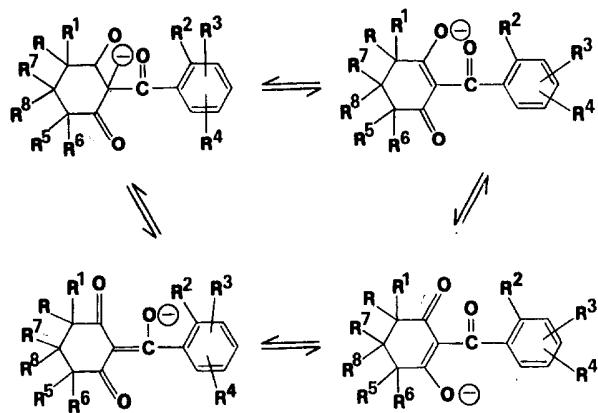
výhodněji je R^3 chlor, vodík, methyl, alkylthioskupina nebo methoxyskupina. R^4 je výhodněji vodík, chlor, nitroskupina, skupina CF_3 nebo skupina $R^bSO_n^-$, kde R^b je C_1-C_4 alkyl, výhodně methyl, a \underline{n} je celé číslo 0, 1 nebo 2, výhodně 2.

Sloučeniny podle vynálezu mohou mít v důsledku tautomerie následující čtyři strukturní vzorce:



kde R , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 a R^8 mají shora uvedený význam.

Proton, označený ve všech tautomerech kroužkem, je poměrně labilní. Tyto protony mají kyselý charakter a mohou být odstraněny jakoukoli basí za vzniku soli, jejíž anion má tyto čtyři resonanční formy:



kde R , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 a R^8 mají shora uvedený význam.

Příklady kationtů těchto basí jsou anorganické kationty, jako jsou alkalické kovy, například lithium, sodík a draslík, kovy alkalických zemin, například baryum, hořčík, vápník a stroncium, nebo organické kionty, jako je substituovaná amoniová, sulfoniová nebo fosfoniiová skupina, kde substituentem je alifatická nebo aromatická skupina.

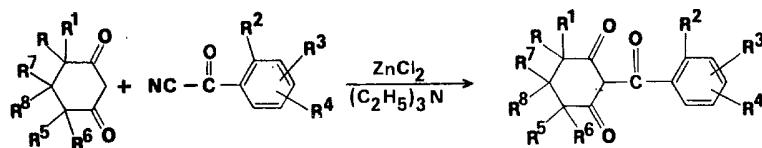
Termín "alifatická skupina" se zde používá v širokém smyslu, pokrývajícím velkou skupinu organických skupin, charakterisovaných tím, že jsou odvozeny od a) acyklických (s otevřeným řetězecem) sloučenin parafinické, olefinické a acetylenické řady uhlvodíků a jejich derivátů nebo b) od alicycklických sloučenin. Alifatická skupina může mít 1 až 10 uhlíkových atomů.

Termín "aromatická skupina" se zde používá v širokém smyslu pro odlišení od alifatické skupiny a zahrnuje skupinu odvozenou a) od sloučenin se 6 až 20 uhlíkovými atomy, které jsou charakterisovány přítomností alespoň jednoho benzenového jádra a zahrnují monocyklické, bicyklické a polycykllické uhlvodíky a jejich deriváty a b) od heterocyklických sloučenin s 5 až 19 uhlíkovými atomy, které mají podobnou strukturu a jsou charakterisovány nenasycenou kruhovou strukturou obsahující alespoň jeden atom jiný než uhlík, například dusík, síru a kyslík, a deriváty těchto heterocyklických sloučenin.

V uvedeném popisu sloučenin podle vynálezu alkylové a alkoxylové skupiny zahrnují jak přímé, tak rozvětvené konfigurace, například methyl, ethyl, n-propyl, isopropyl, n-butyl, sek.butyl, isobutyl a terc.butyl.

Sloučeniny podle vynálezu a jejich soli jsou aktivními herbicidy obecného typu. To znamená, že jsou herbicidně účinné proti širokému spektru rostlinných druhů. Potlačování nežádoucí vegetace se provádí aplikováním herbicidně účinného množství sloučenin podle vynálezu na dané ploše.

Sloučeniny podle vynálezu je možno připravit následující obecnou metodou:



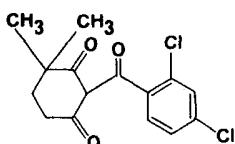
Obvykle se používají molární množství dionu a substituovaného benzoylkyanidu spolu s mírným molárním přebytkem chloridu zinečnatého. Oba reakční komponenty a chlorid zinečnatý se uvedou do styku v rozpouštědle, jako je methylenchlorid. K reakční směsi se za chlazení pomalu přidá mírný molární přebytek triethylaminu. Směs se míchá 5 h při teplotě místnosti. Reakční produkt se zpracuje běžným způsobem.

Výše uvedený substituovaný benzoylkyanid je možno připravit podle údajů v T. S. Oakwood a C. A. Weisberger, *Organic Synthesis Collected*, díl III, str. 122 (1955).

V následujícím příkladu je popsána příprava representativní sloučeniny podle vynálezu.

Příklad

4,4-dimethyl-2-(2,4-dichlorobenzyl)-cyklohexan-1,3-dion



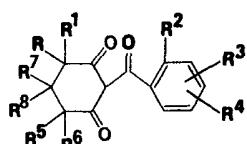
4,4-dimethyl-1,3-cyklohexandion (14,0 g, 0,1 mol), 20,0 g (0,1 mol) 2,4-dichlorbenzoylkyanidu a 13,6 g (0,11 mol) bezvodého práškového chloridu zinečnatého se uvede do styku ve 100 ml methylenchloridu. Za chlazení se pomalu přidává triethylamin (10,1 g, 0,12 mol).

Reakční směs se 5 h míchá při teplotě místnosti a pak se vlije do 2N kyseliny chlorovo-díkove. Vodná fáze se odstraní a organická fáze se čtyřikrát promyje 150 ml 5% uhličitanu sodného Na_2CO_3 .

Vodné promývací roztoky se spojí a okyselí kyselinou chlorovodíkovou, extrahuje methylenchloridem, vysuší a koncentrují za vzniku 25,3 g surového produktu. Surový produkt se chromatografuje ($2\% \text{ AcOH}/\text{CH}_2\text{Cl}_2$) v 5 g alikvotních dílech a pak se 30 min zahušťuje na rotační odparce pod tlakem separátoru při 50°C pro odstranění AcOH. Získá se olej (výtěžek 40 %). Struktura byla potvrzena instrumentální analýsou.

Následuje tabulka určitých vybraných sloučenin, které je možno připravit výše popsaným postupem. Každá sloučenina je označena číslem, které je pak používáno v celém dalším textu.

T a b u l k a T



pokračování tabulky I

Číslo slouč.	R	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	t. tání (°C)
4	triethanolamoniová sůl sloučeniny č. 7									olej
5	C ₂ H ₅ -O-C-	O	CH ₃	Cl	3-Cl	4-Cl	H	H	H	olej
6	triethanolamoniová sůl sloučeniny č. 5									olej
7	CH ₃	CH ₃	Cl	H	4-Cl	H	H	H	H	olej
8	CH ₃	CH ₃	Cl	H	4-Cl	CH ₃	H	H	H	olej
9	CH ₃	n-C ₃ H ₇	Cl	H	4-Cl	H	H	H	H	olej
13	CH ₃	H	Cl	H	4-Cl	H	H	H	H	olej
14	CH ₃	H	Cl	H	4-Cl	CH ₃	H	H	H	olej
21	-C ₅ H ₁₀ -		Cl	H	4-Cl	H	H	H	H	olej
22	-C ₅ H ₁₀ -		Cl	H	4-Cl	CH ₃	H	H	H	olej
23	CH ₃	CH ₃	Cl	3-Cl	4-Cl	H	H	H	H	olej
24	CH ₃	CH ₃	Cl	3-Cl	4-Cl	CH ₃	H	H	H	olej
35	i-C ₃ H ₇	H	Cl	3-Cl	4-Cl	H	H	H	H	olej
39	CH ₃	CH ₃	Cl	H	4-CH ₃ SO ₂	H	H	H	H	olej
40	CH ₃	CH ₃	Cl	H	4-CH ₃ SO ₂	CH ₃	H	H	H	olej
45	CH ₃	H	Cl	H	4-CH ₃ SO ₂	H	H	H	H	48-56
55	CH ₃	CH ₃	Cl	3-Cl	4-CH ₃ SO ₃	H	H	H	H	olej
71	CH ₃	CH ₃	Cl	3-Cl	4-C ₂ H ₅ SO ₂	H	H	H	H	127-129
87	CH ₃	CH ₃	Cl	H	4-C ₂ H ₅ SO ₂	H	H	H	H	47-50
88	CH ₃	CH ₃	Cl	H	4-C ₂ H ₅ SO ₂	CH ₃	H	H	H	olej
135	CH ₃	CH ₃	Cl	3-OCH ₃	4-CH ₃ SO ₂ -	H	H	H	H	olej
167	CH ₃	CH ₃	Cl	3-CH ₃	4-Cl	H	H	H	H	olej
183	CH ₃	CH ₃	Cl	3-OCH ₃	4-Cl	H	H	H	H	olej
199	CH ₃	C ₂ H ₅	Cl	H	4-Cl	H	H	H	H	olej
200	CH ₃	CH ₃	Cl	H	H	H	H	H	H	olej

pokračování tabulky I

Číslo slouč.	R	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	t. tání (°C)
201	CH ₃	CH ₃	Cl	3-OC ₂ H ₅	Br	H	H	H	H	88-93
202	CH ₃	CH ₃	Cl	H	4-Br	H	H	H	H	58-69
203	CH ₃	C ₂ H ₅	Cl	3-Cl	4-Cl	H	H	H	H	olej
204	n-C ₃ H ₇	H	Cl	H	4-Cl	H	H	H	H	olej
205	C ₂ H ₅ O ⁺ -	n-C ₃ H ₇	Cl	H	4-Cl	H	H	H	H	olej
206	CH ₃	CH ₃	Cl	H	4-i-C ₃ H ₇ SO ₂ H	H	H	H	H	olej
207	CH ₃	CH ₃	Cl	4-iC ₃ H ₇ O	4-Br	H	H	H	H	olej
208	CH ₃	CH ₃	Cl	H	6-F	H	H	H	H	olej
209	i-C ₃ H ₇	H	Cl	3-Cl	4-Cl	H	H	H	H	olej
210	CH ₃	CH ₃	Cl	3-OC ₂ H ₅	4-Br	H	H	H	H	olej
211	i-C ₃ H ₇ OC(O)	H	Cl	H	4-Cl	H	H	H	H	olej
212	C ₂ H ₅ OC(O)-	n-C ₃ H ₇	Cl	H	4-Cl	H	H	H	H	olej
213	-C ₅ H ₁₀ -		Cl	H	4-Cl	H	H	H	H	olej
214	CH ₃	CH ₃	Cl	H	4-Cl	H	H	CH ₃	H	olej
215	CH ₃	CH ₃	Cl	H	4-n-C ₃ H ₇ SO ₂ H	H	H	H	H	olej
216	CH ₃	CH ₃	Cl	3-Cl	4-n-C ₃ H ₇ SO ₂ H	H	H	H	H	olej
217	CH ₃	CH ₃ O	CH ₃ O	3-CH ₃ O	H	H	H	H	H	54-60
218	CH ₃	CH ₃	CH ₃ O	H	4-Cl	H	H	H	H	olej
219	CH ₃	CH ₃	Cl	H	4-Br	CH ₃	H	H	H	olej
220	CH ₃	CH ₃	Br	H	H	H	H	H	H	olej
221	CH ₃	CH ₃	I	H	H	H	H	H	H	olej
222	CH ₃	CH ₃	F	H	H	H	H	H	H	olej
223	CH ₃	CH ₃	CH ₃ O	H	H	H	H	H	H	olej
224	CH ₃	CH ₃	Cl	3-allyloxy 4-Br		H	H	H	H	olej

pokračování tabulky I

Číslo slouč.	R	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	R ⁸	t. tání (°C)
225	CH ₃	CH ₃	Cl	H	4-CH ₃ SO ₂	H	H	CH ₃	H	olej
226	CH ₃	CH ₃	Cl	3-CH ₃ O	4-Br	CH ₃	H	H	H	olej
227	CH ₃	CH ₃	Br	H	3-CN	H	H	H	H	128-134
228	CH ₃	CH ₃	Cl	H	4N(CH ₃)SO ₂ CF ₃	H	H	H	H	olej
229	CH ₃	CH ₃	Cl	3-NO ₂	H	H	H	H	H	olej
230	CH ₃	CH ₃	C ₂ H ₅ O	H	4-Cl	H	H	H	H	olej
231	CH ₃	CH ₃	Cl	H	4-butylsulfinyl	H	H	H	H	olej
232	CH ₃	CH ₃	Cl	3-C ₂ H ₅ O	4-CH ₃ SO ₂	H	H	H	H	45-52
233	CH ₃	CH ₃	Cl	3-CH ₃ O	4-C ₂ H ₅ SO ₂	H	H	H	H	olej
234	CH ₃	CH ₃	Cl	H	4-n-C ₄ H ₉ SO ₂	H	H	H	H	olej
235	CH ₃	CH ₃	Cl	3-Cl	4-n-C ₄ H ₉ SO ₂	CH ₃	H	H	H	olej
236	CH ₃	CH ₃	Cl	3-Cl	4-C ₂ H ₅ SO ₂	CH ₃	H	H	H	olej
237	CH ₃	CH ₃	Cl	H	4-F	H	H	H	H	olej
238	CH ₃	H	Cl	3-CH ₃ O	4-Br	H	H	H	H	olej
239	CH ₃	CH ₃	Cl	3-CH ₃ O	H	H	H	H	H	olej
240	CH ₃	CH ₃	Cl	EtS	PrSO ₂	H	H	H	H	olej
241	CH ₃	CH ₃	Cl	EtS	EtS	H	H	H	H	olej
242	CH ₃	CH ₃	Cl	EtS	EtSO ₂	H	H	H	H	olej
243	CH ₃	CH ₃	Cl	EtS	MeSO ₂	H	H	H	H	olej

Zkoušky herbicidní účinnosti:

Jak bylo uvedeno, popisované sloučeniny, připravované výše popsaným způsobem, jsou fyto-toxické a jsou vhodné a účinné při potlačování různých rostlinných druhů. Vybrané sloučeniny podle vynálezu byly zkoušeny na herbicidní účinnost následujícím způsobem.

Preemergentní herbicidní test. Den před ošetřením se semena osmi druhů plevelů zasijí v jednotlivých řádcích do hlinitopísčité půdy, přičemž jeden řádek přes šířku plochy je tvořen jedním druhem.

Zasijí se semena béru zeleného (*Setaria viridis*, FT), ježatky kuří nohy (*Echinochloa crusgalli*, WG), ovsu hluchého (*Avena fatua*, WO), *Ipomoea lacunosa* (AMG), *Abutilon theophrasti* (VL), *Brassica juncea* (MD), laskavce ohnutého (*Amaranthus retroflexus*, PW) nebo *Rumex crispus* (CD) a *Cyperus esculentus*, (YNG).

Zasije se dostatečné množství semen tak, aby po vzejití bylo v každém řádku podle velikosti rostlin asi 20 až 40 semenáčů.

Pomocí analytických vah se na kousku pergamenového navažovacího papírku vyváží 600 mg zkoumané sloučeniny. Papírek se sloučeninou se umístí do 60 ml čiré láhve se širokým hrdlem a rozpustí ve 45 ml acetonu nebo náhradního rozpouštědla.

18 ml tohoto roztoku se převede do 60ml čiré láhve se širokým hrdlem a zředí 22 ml směsi vody a acetonu (19:1), obsahující dostatečné množství polyoxyethylensorbitanmonolaurátu jako emulgátoru pro vznik konečného roztoku o koncentraci 0,5 % objemových.

Roztok se pak rozprašuje na osetou plochu pomocí lineárního postřikovacího stolu, kalibrovaného na postřik 748 l/ha. Aplikuje se 4,48 kg/ha.

Po ošetření se rostliny umístí do skleníku o teplotě 21,1 až 26,7 °C a zavlažují se postřikováním. Po dvou týdnech po ošetření se stanoví stupeň poškození nebo potlačení srovnáním s neošetřenými kontrolními rostlinami stejného stáří.

Pro každý druh se zaznamenává rozsah poškození od 0 do 100 %, přičemž 0 % představuje žádné poškození a 100 % představuje úplné potlačení.

Výsledky testu jsou uvedeny v tabulce II.

T a b u l k a II

Preemergentní herbicidní účinnost
aplikace 4,48 kg/ha

Č. sloučeniny	FT	WG	WO	AMG	VL	MD	CD	PW	YNG
1	0	85	10	75	100	80	80		75
2	90	90	80	10	90	90	-		80
3									
4	100	100	80	60	100	80	90		100
5	80	100	20	40	100	100	80		100
6	40	100	0	40	100	100	80		100
7	100	100	100	80	100	100	90		100
8	100	100	60	45	60	60	80		100
9	60	100	90	20	60	60	60		100
13	100	100	40	5	80	60	80		100
14	80	90	60	95	90	90	100		80
21	25	95	10	20	20	20	60		40
23	100	100	90	90	100	100	100		100
35	100	60	50	80	90	90	40		60
39	60	60	80	80	90	90	60		65
40	100	100	100	100	100	100	100		97
45	100	100	85	100	100	100	90		95
55	100	80	85	100	100	90	100		70
71	90	65	90	85	70	60	100		40
88	40	70	40	40	40	60	70		50
183	64	70	80	40	90	80	70		80

pokračování tabulky II

Č. sloučeniny	FT	WG	WO	AMG	VL	MD	CD	PW	YNG
199	20	95	60	5	100	100	90		100
200	100	100	80	20	90	40	80		100
201	100	100	70	20	100	100	100		100
202	100	100	80	60	100	100	80		100
203	100	100	0	10	100	100	100		100
204	90	70	10	0	0	0	80		10
205	0	10	0	0	10	10	0		0
206	100	100	90	80	100	100	90		100
207	100	100	90	40	80	90	90		90
208	100	100	85	0	95	85	95		90
209	90	90	50	20	100	100	100		80
211	90	80	25	30	30	45	50		90
212	0	10	0	0	10	10	0		0
213	0	20	0	0	10	20	10		0
214	100	100	90	45	100	100	65		100
215	80	90	95	95	100	100	100		5
216	100	95	95	95	40	100	100		30
217	30	65	0	30	45	40	65		50
218	70	75	0	65	100	50	50		70
219	100	100	100	98	100	100	100		85
220	100	100	85	15	100	100	85		95
221	100	100	65	0	100	100	50		50
222	80	80	55	0	98	55	80		65
223	95	95	10	0	65	0	25		60
224	100	100	100	100	100	100	100		50
225	100	100	75	100	100	100	100		50
226	100	100	60	15	100	100	100		80
227	100	100	55	15	100	100	90		95
228	100	100	60	20	95	100	90		10
229	5	10	0	0	40	20	0		0
230	10	40	10	10	95	40	100		80
231	100	100	75	80	100	100	100		75
232	100	100	90	100	100	100	85		-
233	100	100	80	100	100	100	100		-
234	95	100	50	95	100	100	85		-
235	100	100	70	100	90	100	100		-
236	100	100	75	100	100	100	85		-
237	100	100	55	40	100	100	90		7
238	100	100	65	95	100	100	100		95
239	100	100	30	15	100	100	95		90

- = druh z nějakého důvodu nevykličil
prázdná plocha označuje nezkoumaný plevele

Postemergentní herbicidní test. Test se provádí stejným způsobem jako preemergentní herbicidní test, avšak semena osmi druhů plevele se zasijí 1012 dní před ošetřením. Zavlažování ošetřovaných ploch se omezuje na povrch půdy, nikoli na listy rašících rostlin.

Výsledky postemergentního herbicidního testu jsou uvedeny v tabulce III.

T a b u l k a III

Postemergentní herbicidní účinnost
aplikace 4,48 kg/ha

Č. slouženiny	FT	WG	WO	AMG	VL	MD	CD	PW	YNG
1	85	95	20	95	100	100	95		95
2	90	100	65	100	100	100	100		100
3									
4	60	60	90	40	60	60	90		70
5	40	60	10	20	40	40	90		80
6	40	50	10	60	20	20	60		50
7	80	80	80	60	60	90	60		60
8	100	80	60	30	80	80	80		80
9	70	70	60	40	60	60	60		70
13	40	40	60	30	60	60	90		60
14	100	100	90	10	20	20	90		100
21	0	20	0	0	10	20	10		0
23	100	100	95	70	60	60	80		100
35	90	90	50	20	100	100	100		80
39	100	100	95	100	100	100	90		100
40	100	70	90	100	-	90	98		70
45	100	85	100	85	-	100	100		65
55	100	100	95	100	100	100	100		95
71	100	100	85	100	100	100	100		90
88	100	100	80	100	100	100	100		90
167	100	100	75	80	100	100	100		90
183	100	100	65	30	100	100	100		90
199	100	80	60	20	90	90	80		45
200	90	60	60	60	60	60	40		70
201	90	70	70	40	70	70	60		60
202	100	90	70	50	100	100	80		80
203	100	100	10	20	20	20	80		60
204	50	30	10	0	0	0	60		0
205	20	40	10	60	90	40	60		40
206	80	80	80	80	100	100	80		50
207	60	50	50	20	60	60	80		60
208	100	80	80	75	-	100	100		95
209	100	60	50	80	90	90	40		60
211	15	100	0	50	100	80	70		40
212	20	40	10	60	90	90	60		40
213	25	45	10	20	20	20	60		45
214	90	80	80	100	100	100	100		70
215	100	100	90	100	100	100	100		90
216	100	100	85	100	100	100	100		95
217	65	100	0	0	100	20	20		90
218	100	100	0	20	100	100	98		95
219	100	100	90	85	100	100	100		95
220	100	65	80	50	100	100	60		60
221	60	70	70	40	80	70	30		50
222	0	60	40	60	100	90	20		30
223	100	75	80	40	100	50	20		30
224	90	100	100	100	100	100	100		40
225	60	70	70	70	90	65	40		60

pokračování tabulky II

Č. sloučeniny	FT	WG	WO	AMG	VL	MD	CD	PW	YNG
226	100	100	85	100	100	100	100		60
227	95	85	90	100	100	100	90		45
228	85	100	0	10	15	95	40		50
229	85	70	65	0	0	0	0		35
230	20	40	10	15	70	40	35		40
231	100	95	100	95	100	95	100		40
232	65	75	75	80	90	85	80		60
233	80	80	70	95	80	85	80		50
234	100	80	25	80	75	80	75		35
235	100	100	40	95	95	100	95		50
236	75	70	50	90	90	100	90		50
237	100	80	80	60	85	60	0		-
238	98	90	60	35	-	100	60		90
239	70	65	20	15	95	40	70		45

Preemergentní širokospektrální herbicidní test. Některé sloučeniny se při aplikaci 2,24 kg/ha zkoumají na preemergentní účinnost proti většímu počtu druhů plevelů:

Postup je obecně podobný výše popsanému preemergentnímu testu, avšak vyváží se pouze 300 mg zkoumané sloučeniny a aplikuje se 374 l/ha.

V testu byl vynechán laskavec ohnutý (PW) a Rumex cerispus (CD) a byly přidány tyto druhy:

traviny: sverep střešní (Bromus tectorum)	(DB)
jílek mnohokvětý (Lolium multiflorum)	(ARG)
Sorghum bicolor	(SHC)
Sesbania exaltata	(SESB)
lilek (Solanum)	(SP)
řepeň (Xanthium)	(CB)

Výsledky testu jsou uvedeny v tabulce IV.

T a b u l k a IV

Preemergentní širokospektrální herbicidní test

Č. sl.	DB	FT	AFG	WG	SHC	WO	BSG	AMG	SESB	VL	SP	MD	YNS	CB
24	80	100	100	100	100	80	95	70	60	100	40	85	100	10
210	100	100	100	100	100	100	100	20	10	100	20	95	100	20

Sloučeniny podle vynálezu jsou vhodné jako herbicidy, zvláště preemergentní herbicidy, a mohou být aplikovány různými způsoby v různých koncentracích. V praxi se popisované sloučeniny formují do herbicidních kompozic tak, že se k herbicidně účinnému množství přimísí doprovodné látky a nosiče, obvykle používané pro usnadnění dispergace aktivních složek k zemědělským účelům, s přihlédnutím k faktu, že formulace a způsob aplikace toxickej látky může ovlivnit účinnost látek v dané aplikaci.

Tyto účinné herbicidní sloučeniny tedy mohou být formulovány jako granule o relativně velké velikosti částic, jako smáčitelné prášky, jako emulgovatelné koncentráty, jako práško-

vé popraše, jako roztoky nebo jako kterékoli z dalších známých typů formulací v závislosti na požadovaném způsobu aplikace.

Pro preemergentní herbicidní aplikaci jsou výhodnými formulacemi smáčitelné prášky, emulgovatelné koncentráty a granule. Tyto formulace mohou obsahovat od pouhých asi 0,5 až do asi 95 % hmotnostních nebo více účinné složky.

Herbicidně účinné množství závisí na charakteru potlačovaných semen nebo rostlin a aplikované množství se pohybuje od asi 0,06 do přibližně 28 kg/ha, výhodně od asi 0,11 do asi 11,2 kg/ha.

Smáčitelné prášky mají formu jemně rozdělených částic, které snadno dispergují ve vodě nebo jiných dispersních prostředích. Konečná aplikace smáčitelného prášku na půdu probíhá buď ve formě suchého prášku nebo ve formě disperse ve vodě nebo jiné kapalině.

Jako nosiče se pro smáčitelné prášky používají například valchářská hlinka, kaolinové jíly, siliky a jiná snadno smáčitelná organická nebo anorganická zředovadla. Smáčitelné prášky se běžně připravují tak, že obsahují asi 5 až asi 95 % účinné složky a obvykle také obsahují pro usnadnění smáčení a dispergace malé množství smáčecího, dispergačního nebo emulgačního prostředku.

Emulgovatelné koncentráty jsou homogenní kapalné komposice, které jsou dispergovatelné ve vodě nebo v jiném dispersním prostředí, a mohou být zcela tvořeny účinnou sloučeninou a kapalným nebo pevným emulgátorem nebo mohou dále obsahovat kapalný nosič, například xylen, těžké aromatické benziny, isoforon a jiná netěkavá organická rozpouštědla.

Pro herbicidní aplikaci se tyto koncentráty dispergují ve vodě nebo jiném kapalné nosiči a na ošetřovanou plochu se obvykle aplikují postříkem. Hmotnostní zastoupení nezbytné účinné složky se může měnit podle způsobu, jakým se má kompozice aplikovat, ale obecně činí asi 0,5 až 95 % hmotnostních aktivní složek v herbicidní kompozici.

Granulované kompozice, kde je toxickej složka nesena na relativně hrubých částicích, se obvykle na plochu, kde se požaduje potlačení vegetace, aplikují bez ředění. Jako nosiče pro granulované kompozice se používají například písek, valchářská hlinka, bentonitové jíly, vermiculit, perlit a jiné organické nebo anorganické materiály, které absorbujují toxickej látku nebo ji mohou být povlečeny.

Granulované kompozice se obvykle připravují tak, že obsahují asi 5 až asi 25 % účinné složky, která může obsahovat povrchově aktivní látky, jako jsou těžké aromatické benziny, petrolej nebo jiné ropné frakce nebo rostlinné oleje, a/nebo prostředky pro zvýšení přilnavosti, jako jsou dextriny, klih nebo synthetické pryskyřice.

Jako smáčecí, dispergační nebo emulgační prostředky se v agrochemických formulacích používají například alkyl- a alkylarylsulfonáty a -sulfáty a jejich sodné soli, polyfunkční alkoholy a jiné typy povrchově aktivních látek, z nichž mnohé jsou obchodně dostupné. Povrchově aktivní látka činí obvykle 0,1 až 15 % z hmotnosti herbicidní kompozice.

Popraše, což jsou volně tekoucí směsi účinné složky s jemně rozdělenými pevnými látkami, jako je talek, jíly, moučky nebo jiné organické a anorganické pevné látky, které působí jako dispergátory a nosiče toxickej látky, jsou vhodnými formulacemi pro vpravování do půdy.

Pasty, což jsou homogenní suspenze jemně rozdělené pevné toxickej látky v kapalném nosiči, jako je voda nebo olej, se používají pro speciální účely. Tyto formulace obvykle obsahují asi 5 až asi 95 % hmotnostních účinné složky a mohou také obsahovat malé množství smáčecího, dispergačního nebo emulgačního prostředku pro usnadnění dispergace. Pro aplikaci se pasty obvykle ředí a aplikují se na příslušnou plochu postříkem.

Mezi další vhodné formulace pro herbicidní aplikaci patří prosté roztoky účinné složky v dispergačním prostředku, ve kterém je v požadované koncentraci zcela rozpustná, například v acetonu, alkylovaných naftalenech, xylenu a jiných organických rozpouštědlech.

Je možno rovněž používat tlakových sprejů, například aerosolů, kde je účinná složka dispergována v jemně rozdělené formě jako výsledek odpaření nízkovroucího nosného rozpouštědla, jako jsou freony.

Fytotoxicke komposice podle tohoto vynálezu se na rostliny aplikují běžným způsobem. Práškové a kapalné komposice je možno na rostliny aplikovat pomocí strojních rozprašovačů, rámových a ručních postřikovačů a postřikových rozprašovačů.

Komposice mohou být rovněž aplikovány z letounu ve formě prášku nebo postřiku, poněvadž jsou účinné ve velmi nízkých dávkách. Například za účelem modifikace nebo omezení růstu klíčících semen nebo vzcházejících semenáčů se práškové a kapalné komposice aplikují na půdu běžnými metodami a jsou v půdě distribuovány do hloubky alespoň 1,27 cm pod povrchem půdy.

Není nutné, aby byly fytotoxicke komposice přimíseny k částicím půdy, poněvadž tyto komposice mohou být aplikovány také pouhým postřikováním nebo zavlažováním povrchu půdy. Fytotoxicke komposice podle tohoto vynálezu mohou být rovněž přidány k závlahové vodě, dodávané na ošetřovaný pozemek.

Tento způsob aplikace umožnuje penetraci kompozic do půdy spolu s absorpcí vody. Práškové komposice, granulované kompozice nebo kapalné formulace, aplikované na povrch půdy, mohou být distribuovány pod povrch půdy běžnými způsoby, jako je diskování, smykování nebo míchání.

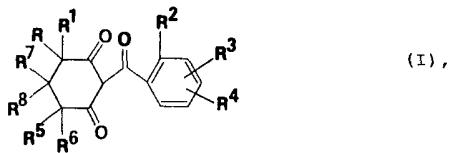
Fytotoxicke komposice podle tohoto vynálezu mohou dále obsahovat jiné přísady, například hnojiva a jiné herbicidy, pesticidy apod., používané jako doprovodné látky nebo v kombinaci s kterýmkoli z výše popsaných doprovodných prostředků.

Mezi další fytotoxicke sloučeniny, použitelné v kombinaci s výše popsanými sloučeninami, patří například aniliidy, jako je 2-benzothiazol-2-yloxy-N-methylacetanilid, 2-chlor-2',6'-dimethyl-N-(n-propylethyl)acetanilid, 2-chlor-2',6'-diethyl-N-(butoxymethyl)acetanilid, 2,4-dichlorfenoxyoctové kyseliny, 2,4,5-trichlorfenoxyoctová kyselina, 2-methyl-4-chlorfenoxyoctová kyselina a jejich soli, estery a amidy, deriváty triazinu, jako je 2,4-bis(3-methoxypropylamino)-6-methylthio-s-triazin, 2-chlor-4-ethylamino-6-isopropylamino-s-triazin a 2-ethylamino-4-isopropylamino-6-methylmerkapto-s-triazin, deriváty močoviny, jako je 3-(3,5-dichlorfenyl)-1,1-dimethylmočovina a 3-(p-chlorfenyl)-1,1-dimethylmočovina, acetamidy, jako je N,N-diallyl-alfa-chloracetamid apod., benzoové kyseliny, jako je 3-amino-2,5-dichlorbenzoová kyselina, thiokarbamaty, jako je S-(1,1-dimethylbenzyl)-piperidin-1-karbothioát, 3-(4-chlorfenyl)-methyldiethylkarbothioát, ethyl-1-hexahydro-1,4-azepin-1-karbothioát, S-ethylhexahydro-1H-azepin-1-karbothioát, S-propyl-N,N-dipropylthiokarbamat, S-ethyl-N,N-dipropylthiokarbamat, S-ethylcyklohexylethylthiokarbamat apod., aniliny, jako je 4-(methylsulfonyl)-2,6-dinitro-N,N-substituovaný anilin, 4-trifluormethyl-2,6-dinitro-N,N-di-n-propylanilin, 4-trifluormethyl-2,6-dinitro-N-ethyl-N-butylanilin, 2-[4-(2,4-dichlorfenoxy)fenoxy]-propanová kyselina, 2-[1-(ethoxyiminobutyl)-5-[2-ethylthio]propyl]-3-hydroxy-2-cyklohexen-1-on, (+)-butyl-2-[4-(5-trifluormethyl)-2-pyridinyl]oxy]-fenoxy)propanát, 5-[2-chlor-4-(trifluormethyl)fenoxy]-2-nitrobenzoát sodný, 3-isopropyl-1H, 2,1,3-benzothiadiazin-4(3H)-on-2,2-dioxid a 4-amino-6-terc.butyl-3(methylthio)-as-triazin-5(4H)-on nebo 4-amino-6-(1,1-dimethylethyl)-3-(methylthio)-1,2,4-triazin-5(4H)-on a S-(O,O-diisopropyl)-benzensulfonamid.

Mezi hnojiva, použitelná v kombinaci s účinnými složkami, patří například dusičnan amonný, močovina a superfosfát. Mezi další vhodné přísady patří materiály, ve kterých rostlinné organismy zakořenují a rostou, jako je kompost, mrva, humus, písek apod.

PŘEDMĚT VÝNÁLEZU

1. Herbicidní prostředek, vyznačující se tím, že jako účinnou složku obsahuje sloučeninu obecného vzorce I



kde

R je C_1-C_6 alkyl,

R^1 je vodík, C_1-C_6 alkyl nebo skupina vzorce



kde R^a je C_1-C_4 alkyl, nebo

R a R^1 společně představují alkylenovou skupinu s 3 až 6 uhlíkovými atomy,

R^2 je chlor, brom, jod, fluor nebo C_1-C_4 alkoxyskupina,

R^3 a R^4 nezávisle představují
vodík,
halogen,
 C_1-C_4 alkyl,
 C_1-C_4 alkoxyskupinu,
skupinu OCF_3 ,
kyanoskupinu,
nitroskupinu,
 C_1-C_4 halogenalkyl,
skupinu vzorce $R^bSO_n^-$, kde R^b je C_1-C_4 alkyl, C_1-C_4 halogenalkyl, fenylo, benzyl,
skupina vzorce $-NR^dR^e$, kde R^d a R^e nezávisle představují vodík nebo C_1-C_4 alkyl,
a n je celé číslo 0, 1 nebo 2, a C_1-C_4 alkylthioskupinu,

R^5 je vodík nebo C_1-C_6 alkyl,

R^6 je vodík nebo C_1-C_6 alkyl,

R^7 je vodík nebo C_1-C_6 alkyl a

R^8 je vodík nebo C_1-C_6 alkyl nebo

R^5 a R^6 společně tvoří substituovaný nebo nesubstituovaný alkylenový kruh s 2 až 5 uhlíkovými atomy, kde substituentem je jedna nebo dvě methylové skupiny,
a/nebo její agrochemicky přijatelné soli.

2. Herbicidní prostředek podle bodu 1, vyznačující se tím, že jako účinnou složku obsahuje sloučeninu vzorce I, kde

- R je C_1-C_4 alkyl,
- R^1 je vodík nebo C_1-C_4 alkyl,
- R^2 je chlor, brom, jod nebo methoxyskopina,
- R^3 a R^4 nezávisle představují vodík, chlor, brom, methyl, methoxyskopinu, nitroskopinu, skupinu CF_3 nebo skupinu vzorce $R^bSO_n^-$, kde R^b je C_1-C_4 alkyl a n je číslo 2,
- R^5 je vodík nebo C_1-C_4 alkyl,
- R^6 je vodík nebo C_1-C_4 alkyl,
- R^7 je vodík a
- R^8 je vodík.

3. Herbicidní prostředek podle bodu 1, vyznačující se tím, že jako účinnou složku obsahuje sloučeninu vzorce I, kde

- R je methyl,
- R^1 je vodík nebo methyl,
- R^2 je chlor, brom, jod nebo methoxyskopina,
- R^3 a R^4 nezávisle představují vodík, chlor, brom, methyl, methoxyskopinu, nitroskopinu, skupinu CF_3 nebo skupinu vzorce $R^bSO_n^-$, kde R^b je C_1-C_4 alkyl a n je číslo 2,
- R^5 je vodík nebo methyl,
- R^6 je vodík nebo methyl,
- R^7 je vodík a
- R^8 je vodík.

4. Herbicidní prostředek podle bodu 1, vyznačující se tím, že jako účinnou složku obsahuje sloučeninu vzorce I, kde R je methyl, R^1 je methyl, R^2 je chlor, R^3 je vodík, R^4 je 4-chlor, R^5 je vodík, R^6 je vodík, R^7 je vodík a R^8 je vodík.

5. Herbicidní prostředek podle bodu 4, vyznačující se tím, že jako účinnou složku obsahuje sloučeninu vzorce I, kde R je methyl, R^1 je methyl, R^2 je chlor, R^3 je vodík, R^4 je 4-chlor, R^5 je vodík, R^6 je vodík, R^7 je vodík a R^8 je vodík, ve formě triethanolamoni-ové soli.

6. Herbicidní prostředek podle bodu 1, vyznačující se tím, že jako účinnou složku obsahuje sloučeninu vzorce I, kde R je methyl, R^1 je methyl, R^2 je chlor, R^3 je vodík, R^4 je $4-CH_3SO_2^-$, R^5 je vodík, R^6 je vodík, R^7 je vodík a R^8 je vodík.