



ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU K PATENTU

235957

(11) (B2)

(51) Int. Cl.³

A 01 N 47/34
A 01 N 47/36

(22) Přihlášeno 06 08 82
(21) (PV 5872-82)
(32) (31)(33) Právo přednosti od 08 08 81
(P 31 31 489.9) Německá spolková republika

(40) Zveřejněno 31 08 84

(45) Vydáno 15 12 86

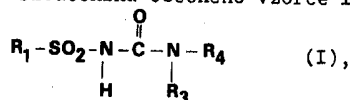
(72) Autor vynálezu

(73) Majitel patentu

WILLMS LOTHAR dr., UNKEL, HÜTTELMAIER THOMAS dr.,
MILDENBERGER HILMAR dr., KELKHEIM, BAUER KLAUS dr., RODGAU,
EÜRSTELL HELMUT dr., FRANKFURT/M, BIERINGER HERMANN dr., EPPSTEIN/Ts.
(NSR)
HOECHST AKTIENGESELLSCHAFT, FRANKFURT/M., (NSR)

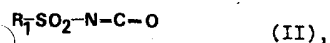
(54) Herbicidní prostředek a prostředek k regulaci růstu rostlin
a způsob výroby účinné složky

Herbicidní prostředek a prostředek
k regulaci růstu rostlin, vyznačující se
tím, že jako účinnou složku obsahuje ale-
spon jednu sloučeninu obecného vzorce I

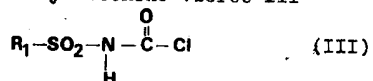


v němž uvedené symboly mají dále uvedený
význam.

Podle vynálezu se účinné látky obecné-
ho vzorce I připravují tím, že se slouče-
niny obecného vzorce II



nebo sloučeniny obecného vzorce III



uvádějí v reakci se sloučeninami obecného
vzorce IV



Předložený vynález se týká herbicidního prostředku a prostředku k regulaci růstu rostlin, který obsahuje jako účinnou složku heterocyklicky substituované sulfonylmočoviny. Dále se vynález týká způsobu výroby těchto nových heterocyklicky substituovaných sulfonylmočovín.

Je již známo, že heterocyklicky substituované fenylsulfonylmočoviny, jako například N-(4-chlor-6-isopropylamino-1,3,5-triazin-2-yl)-N-isopropyl-N'-(4-chlorfenylsulfonyl)močovina, mají herbicidní vlastnosti nebo mají schopnost regulovat růst rostlin (srov. nizozemský patentní spis č. 121 788, DE-OS 27 15 786, evropský patentní spis 1 485, evropský patentní spis 1 514, evropský patentní spis 1 515, evropský patentní spis 4 163, evropský patentní spis 7 687, evropský patentní spis 9 419, evropský patentní spis 10 560, evropský patentní spis 23 140, evropský patentní spis 23 141, evropský patentní spis 23 422).

Nyní bylo zjištěno, že také heterocyklicky substituované cyklo- popřípadě bicyklo-alkylsulfonylmočoviny jsou vhodné jako herbicidy a regulátory růstu rostlin.

Předmětem předloženého vynálezu je tudíž herbicidní prostředek a prostředek k regulaci růstu rostlin, který se vyznačuje tím, že jako účinnou složku obsahuje alespoň jednu sloučeninu obecného vzorce I



v němž

- R_1 znamená cykloalkylovou skupinu se 6 až 12 atomy uhlíku nebo cyklosalkenylovou skupinu se 6 až 8 atomy uhlíku, které jsou popřípadě substituovány až 4 atomy halogenu nebo/a alkylovým zbytkem s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenmetylovým zbytkem až se 3 atomy halogenu, popřípadě alkoxykarbonylovým zbytkem s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části, dále znamená bicyklo[2,2,1]heptylový zbytek, který popřípadě obsahuje až 6 atomů halogenu nebo znamená 7-oxabicyklo[2,2,1]heptenylový zbytek,
- R_3 znamená vodík nebo alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku,
- R_4 znamená 1,3,5-triazinylový nebo 1,3-pyrimidin-2-ylový zbytek, kteréžto zbytky jsou popřípadě jednou až dvakrát substituovány halogenem, alkyleminoskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, dialkyleminoskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylech, alkylovým zbytkem s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxykupinou s 1 až 4 atomy uhlíku nebo alkyltiioskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku,

nebo její fyziologicky snážitelnou sůl.

"Halogen" znamená výhodně fluor, chlor nebo brom.

Jako příklady heterocyklicky substituovaných sulfonylmočovín obecného vzorce I podle vynálezu lze navíc ke sloučeninám, které jsou popsány v experimentální části, jmenovat následující sloučeniny:

N-[(4-metoxi-6-metyl-1,3,5-triazin-2-yl)aminokarbonyl]-1,2-dichlorcyklohexylsulfonamid,

N-[(2,6-dimetyl-5-chlorpyrimidin-2-yl)aminokarbonyl]-3-bromcyklohex-1-enylsulfonamid,

N-[(4-metyl-6-metyltio-1,3,5-triazin-2-yl)aminokarbonyl]cyklohexa-1,3-dienylsulfonamid,

N-[(4-metyl-6-dimetylamino-1,3,5-triazin-2-yl)aminokarbonyl]-2-chlorcyklopentylsulfonamid,

N-[(5,6-dimetyl-1,2,4-triazin-3-yl)aminotiokarbonyl]-cyklopent-1-enylsulfonamid,

N-[(4,6-dimetoxi-5-chlorpyrimidin-2-yl)metylamino-karbonyl]cyklopent-1-enylsulfonamid,

N-[(4,5-dimetyl-6-metoxypyrimidin-2-yl)aminokarbonyl]-cyklohept-1-enylsulfonamid,
 N-[(4-metyl-5-nitro-6-chlorpyrimidin-2-yl)aminokarbonyl]-2-chlorcyklooktylsulfon-
 amid,
 N-[(4-metoxycarbonyl-6-metyl-1,3,5-triazin-2-yl)aminokarbonyl]-cyklookt-1-enylsulfon-
 amid,
 N-[(4-chlor-6-isopropylamino-1,3,5-triazin-2-yl)aminokarbonyl]-cyklookt-1-enylsulfon-
 amid,
 N-[(4-trifluormetyl-6-metylpyrimidin-2-yl)aminokarbonyl]-cyklohex-3-enylsulfonamid,
 N-[(4,6-dimetylmerkepto-1,3,5-triazin-2-yl)aminokarbonyl]-cyklohexylsulfonamid,
 N-[(4-metylpyrimidin-2-yl)aminokarbonyl]-3,4-dichlorcyklohexylsulfonamid,
 N-[(4-metoxy-5-n-butyl-6-metylpyrimidin-2-yl)aminokarbonyl]-1,2-dibromcyklohexyl-
 sulfonamid,
 sodná sůl N-[(4-/metoxycarbonylmetoxy/-6-metylpyrimidin-2-yl)aminokarbonyl]-cyklohex-
 -1-enylsulfonamidu,
 N-[(4-metoxy-6-metyl-1,3,5-triazin-2-yl)metylaminokarbonyl]-cyklohex-1-enylsulfon-
 amid,
 N-[(4-metoxy-6-metylpyrimidin-2-yl)aminokarbonyl]-cyklopentylsulfonamid,
 N-[(4-etyl-6-metoxy-1,3,5-triazin-2-yl)aminokarbonyl]-cyklopentylsulfonamid,
 N-[(4-metoxy-6-metylpyrimidin-2-yl)aminokarbonyl]-1,2-dichlorcyklopentylsulfonamid,
 N-[(4-metoxy-6-metylpyrimidin-2-yl)aminokarbonyl]-2-chlorcyklopentylsulfonamid,
 N-[(4,6-dimetoxyl-1,3,5-triazin-2-yl)aminokarbonyl]-2-chlorcyklododecylsulfonamid,
 N-[(4-metoxy-6-metylpyrimidin-2-yl)aminokarbonyl]-3-chlorbicyklo[2,2,1]hept-2-yl-
 sulfonamid,
 N-[(4-metoxy-6-metyl-1,3,5-triazin-2-yl)aminokarbonyl]-bicyklo[2,2,1]hept-5-en-2-
 -ylsulfonamid,
 N-[(4,6-dimetylpyrimidin-2-yl)aminokarbonyl]-bicyklo[2,2,2]okt-2-ylsulfonamid,
 N-[(4-metoxy-6-metyl-1,3,5-triazin-2-yl)aminokarbonyl]-2,3,3-trimetylbicyklo[2,2,1]-
 hept-2-ylsulfonamid,
 N-[(4-metoxy-6-metylpyrimidin-2-yl)aminokarbonyl]-bicyklo[2,2,1]hept-2-ylsulfonamid,
 N-[(5,6-dimetyl-1,2,4-triazin-3-yl)aminokarbonyl]-(4,5-dichlorbicyklo[2,2,1]heptyl)-
 sulfonamid,
 N-[(4,6-dimetylpyrimidin-2-yl)aminokarbonyl]-2,2,5,5-tetrametylcyklohex-3-enylsulfon-
 amid,
 N-[(4-metoxymetyl-6-metyltriazin-2-yl)aminokarbonyl]-2-chlorcyklohexenylsulfonamid,
 N-[(4-metoxy-6-metylpyrimidin-2-yl)aminokarbonyl]-2-chlor-3-metylcyklohex-4-enyl-
 sulfonamid,
 N-[(4,6-dimetyl-1,3,5-triazin-2-yl)aminokarbonyl]-2,4,5-trichlor-3-metylcyklohexyl-
 sulfonamid,
 N-[(4-metoxy-6-metylpyrimidin-2-yl)aminokarbonyl]-2-chlorcyklooktylsulfonamid,
 N-[(4,6-dimetyl-1,3,5-triazin-2-yl)aminokarbonyl]-cyklopropylsulfonamid,
 N-[(4-metoxy-6-metyl-1,3,5-triazin-2-yl)aminokarbonyl]-2-metyl-5-isopropylcyklohexyl-
 sulfonamid a
 N-[(4,6-dimetyl-1,3-pyrimidin-2-yl)aminokarbonyl]-bicyklo[3,2,2]non-2-ylsulfonamid.

Nové sloučeniny obecného vzorce I se dají syntetizovat z o sobě známých popřípadě
 podle známých způsobů výrobitelných výchozích látek.

Podle vynálezu se vyrábějí sloučeniny obecného vzorce I tím, že se sloučeniny obecného vzorce II



v němž

R_1 má shora uvedený význam,
nebo sloučeniny obecného vzorce III



v němž

R_1 má shora uvedený význam,
uvádějí v reakci se sloučeninami obecného vzorce IV



v němž

R_3 a R_4 mají shora uvedené významy.

Tento postup, který je předmětem vynálezu, bude v další části označován také jako postup a).

Sloučeniny obecného vzorce I lze kromě postupem podle vynálezu připravovat dále tím, že se

b) sloučeniny obecného vzorce V



v němž

R_1 má shora uvedený význam,
uvádějí v reakci se sloučeninami obecného vzorce VI



v němž

R_4 má shora uvedený význam,
nebo se sloučeninami obecného vzorce VII



v němž

R_4 má shora uvedený význam a
 R_3 znamená alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku,

nebo tím, že se

c) sloučeniny obecného vzorce VIII



v němž

R_3, R_4 mají shora uvedený význam a

R_5, R_6 a R_7 znamenají vodík, halogen nebo alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku,

uvádějí v reakci se sloučeninami obecného vzorce IX



v němž

R_8 až R_{13} znamenají vodík, halogen nebo metylovou skupinu a jeden ze zbytků R_9 až R_{12} může znamenat také alkylovou skupinu se 2 až 4 atomy uhlíku nebo alkoxykarbo-nylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části, nebo

R_8 a R_{13} znamenají společně také alkylenovou skupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, ve které může být jedna skupina $-CH_2-$ nahrazena také kyslíkem,

a popřípadě se získané sloučeniny vzorce I odštěpením halogenovodíku, adicí halogenu nebo vodíku na přítomné vícenásobné vazby nebo tvorbou solí převede na jiné sloučeniny vzorce I.

Postup podle vynálezu (varianta a), tj. reakce sloučenin vzorců II, popřípadě III a IV se provádí výhodně v inertních aprotických rozpouštědlech, jako například v acetonitri-
lu, dichlormetanu, toluenu, tetrahydrofuranu nebo dioxanu při teplotách mezi 0 °C a teplo-
tou varu rozpouštědla. Při použití výchozích látek vzorce III se pracuje v přítomnosti
činnidla vázajícího kyselinu, jako například uhlíčitánu draselného, pyridinu nebo trietyl-
aminu.

Varianta b)

Při reakci sloučenin vzorce V se sloučeninami vzorce VI, popřípadě VII se pracuje rovněž ve shora uvedených inertních rozpouštědlech za přídavku bázičických sloučenin, jako například uhlíčitánu draselného, pyridinu nebo triethylaminu při teplotách mezi 0 °C a teplotou varu rozpouštědla.

Varianta c)

Reakce sloučenin vzorce VIII a IX se provádí výhodně v inertních rozpouštědlech, jako například v toluenu, xylenu, dioxanu nebo dichlormetanu při teplotě mezi teplotou místnosti a teplotou varu rozpouštědla. Popřípadě se může reakce provádět v přítomnosti katalyzátorů, jako například chloridu hlinitého nebo v autoklávu za zvýšeného tlaku.

Dodatečné odštěpení halogenovodíku (chlorovodíku, bromovodíku) ze zbytků R_1 obsa-
hujících halogen se provádí známým způsobem, například působením alkoxidu alkalického
kovu, alkoholického roztoku hydroxidu sodného nebo hydroxidu draselného, triethylaminu
nebo dalších činnidel odštěpujících kyselinu, popřípadě v přítomnosti dalšího inertního
rozpouštědla nebo ředidla (například toluenu) při teplotách mezi teplotou místnosti a
teplotou varu.

Na přítomné nebo dodatečně vytvořené vícenásobné vazby v poloze R_1 lze adovat halogen (Cl_2 , Br_2), halogenovodík nebo vodík při atmosférickém tlaku nebo za zvýšeného tlaku, popřípadě v přítomnosti katalyzátoru, například paladia na uhlí nebo Raneyova niklu a to rovněž známým způsobem a tak se dospěje popřípadě k novým sloučeninám vzorce I. Bromace, popřípadě chlorece se provádí v inertních organických rozpouštědlech, jako například v dichlormetanu nebo chloroformu za osvětlení - například ultrafialovým světlem - nebo v přítomnosti sloučenin, které se rozkládají na radikály, například azodisobutyronitrilu, při teplotách mezi $0^\circ C$ a teplotou varu rozpouštědla. Adice halogenovodíku se provádí v přítomnosti inertních rozpouštědel (například toluenu) působením plynného chlorovodíku nebo bromovodíku při nižších teplotách, popřípadě v přítomnosti peroxidického katalyzátoru.

Sloučeniny obecného vzorce I mohou tvořit soli, ve kterých je atom vodíku nahrazen kationtem vhodným pro upotřebení v zemědělství. Těmito solemi jsou obecně soli s kovy, aminové soli nebo soli s organickými aminy a vyrábějí se výhodně v inertním rozpouštědlech, jako například ve vodě, metanolu nebo acetonu při teplotách od 20 do $100^\circ C$. Vhodnými bázemi k výrobě solí podle vynálezu jsou například uhličitán draselný, amoniak nebo etanolamin.

Výchozí látky obecného vzorce IV jsou známé nebo se dají vyrábět podle v principu známých postupů, například cyklizací odpovídajících derivátů guanidinu s příslušně substituovanými 1,3-diketony (srov. např. "The Chemistry of Heterocyclic compounds", Vol. XVI (1962) a Supplement I (1970)) nebo derivatizací kyanurchloridu (srov. např. "The Chemistry of Heterocyclic Compound", L. Rapoport "s-Triazines and Derivatives" (1959)).

Sulfonylisokyanáty obecného vzorce II jsou rovněž z valné části známé nebo se dají vyrábět jednoduchým způsobem pomocí postupů, které jsou principiálně známé (srov. DE-AS 1 211 165, DE-AS 1 230 016, DE-AS 1 297 601).

Sulfonylkarbamoylchloridy, popřípadě sulfonyltiokarbamoylchloridy obecného vzorce III se dají vyrábět obvyklými metodami ze solí odpovídajících sulfonamidů vzorce V s alkalickými kovy, které jsou známé z literatury, reakcí s fosgenem nebo tiofosgenem.

Isotiokyanáty vzorce VI potřebné pro reakce podle varianty b) postupu jsou známé nebo jsou dostupné známými způsoby (srov. Tetrahedron 29, 691 (1973); Japan Kokai Sho-51-143686).

Totéž platí pro heterocyklické karbamoylchloridy a tiokarbamoylchloridy vzorce VII (srov. například DE-AS 1 149 718 a DE-AS 2 238 870).

Alfa-beta-nenasycené sulfonylmočoviny vzorce VIII jsou popsány v DE-OS 31 11 451.

Deriváty heterocyklicky substituovaných sulfonylmočoviny podle vynálezu mají výtečný herbicidní účinek a v důležitých kulturních rostlinách mají velmi dobrou selektivitu. Tyto sloučeniny jsou tudíž vhodné k selektivnímu potírání dvojčlásočných a travnatých jednoletých a vytrvalých plevelů, zejména v kulturních rostlinách významných pro zemědělství, jako je například pšenice, ječmen, žito, rýže, kukuřice, cukrová řepa a sója. Přitom je lhostejné, zda se tyto látky aplikují před setím, preemergentně nebo postemergentně.

Aplikují-li se sloučeniny podle vynálezu před klíčením plevelných rostlin a to před setím nebo preemergentně na povrch půdy, pak se nezabrání vzejití klíčků. Plevelé dále rostou až k dosažení stadia klíčného listu, jejich růst se však potom zastaví a konečně po 3 až 5 týdnech zcela odumírají. Při aplikaci účinných látek na zelené části rostliny při postemergentním ošetření dochází rovněž velmi rychle po ošetření k drastickému zastavení růstu a plevelné rostliny zůstávají pak v takovém stadiu růstu, ve kterém se nacházely v okamžiku aplikace, nebo po určité době zcela odumírají, takže tímto způsobem se velmi rychle a trvale odstraní škodlivá konkurence plevelů pro kulturní rostliny.

Kromě toho vykazují látky podle vynálezu vynikající vlastnosti, které se projevují schopností regulovat růst kulturních rostlin. Tyto látky zasahují regulačním způsobem do látkové výměny, která je vlastní rostlinám, a mohou se tudíž používat k záměrnému ovlivňování látek obsažených v rostlinách a k ulehčení sklizně, jako například vyvoláním desikace a k zastavení růstu.

Tyto látky se dále hodí také k obecné regulaci a potlačování nežádoucího vegetativního růstu, aniž by přitom rostliny odumíraly. Potlačení vegetativního růstu má značný význam u četných jednoděložných a dvojděložných rostlin, vzhledem k tomu, že se tím může zabránit poléhání, nebo se mu může zcela zamezit. Zvláště nutno zdůraznit schopnost sloučenin regulovat růst v případě jejich použití jako inhibitorů růstu v obilninách, kukuřici, sóji, bavlníku, travách, jakož i jejich schopnost zvyšovat obsah žádoucích zásobních látek, jako uhlohydrátů a proteinu u užitkových rostlin. Konečně vykazují tyto sloučeniny velmi dobré zlepšení abscise plodů, zejména u citrusových plodů nebo schopnost snižovat sílu potřebnou k odtržení plodu.

Předmětem předloženého vynálezu jsou tudíž také herbicidní prostředky, popřípadě prostředky regulující růst rostlin, které se vyznačují tím, že obsahují alespoň jednu sloučeninu obecného vzorce I v kombinaci s obvyklými pomocnými látkami a inertními látkami, jakož i jejich použití v zemědělství.

Prostředky podle vynálezu obsahují obecně 2 až 95 % hmot. účinných látek vzorce I. Mohou se používat jako smáčitelné prášky, emulgovatelné koncentráty, rozstřikovatelne roztoky, popraše nebo granuláty, a to ve formě obvyklých přípravků.

Smáčitelné prášky jsou ve vodě rovnoměrně dispergovatelnými přípravky, které vedle účinné látky obsahují kromě ředidla nebo inertní látky ještě smáčedla, například polyoxetylované alkylfenoly, polyoxetylované mastné alkoholy, alkyl- nebo alkylfenylsulfonáty a dispergátory, například sodnou sůl kyseliny ligninsulfonové, sodnou sůl 2,2'-dinaftylmetan-6,6'-disulfonové kyseliny, sodnou sůl dibutyl-naftalensulfonové kyseliny nebo také sodnou sůl oleylmetylsaurinu.

Emulgovatelné koncentráty se vyrábějí rozpuštěním účinné látky v organickém rozpouštědle, například v butanolu, cyklohexanonu, dimethylformamidu, xylenu nebo také ve výše vroucích aromatických uhlovodících nebo uhlovodících za přídavku jednoho nebo několika emulgátorů. Jako emulgátory se mohou používat například: dreselné soli alkylarylsulfonových kyselin, jako vápenatá sůl dodecylbenzensulfonové kyseliny nebo neionogenní emulgátory jako polyglykolestery mastných kyselin, alkylarylpolyglykolétery, polyglykolétery mastných alkoholů, kondenzační produkty propylenoxidu a etylenoxidu, kondenzační produkty mastného alkoholu, propylenoxidu a etylenoxidu, alkylpolyétery, estery sorbitanu s mastnými kyselinami, estery polyoxyetylenorbitu s mastnými kyselinami nebo estery polyoxetylenorbitu.

Popraše se získají rozemletím účinné látky s jemně dispergovanými pevnými látkami, například s mastkem, přírodními jíly, jako je kaolin, bentonit, pyrofilit nebo diatomit.

Granuláty se mohou vyrábět buď nastříkáním účinné látky na adsorptivní granulovaný inertní materiál nebo nanášením koncentrátů účinné látky pomocí lepidel, například polyvinylalkoholu, sodné soli polyakrylové kyseliny nebo také minerálních olejů na povrchy nosných látek, jako je písek, kaolinit nebo předem granulovaný inertní materiál. Vyrábět se mohou také granuláty způsobem používaným pro výrobu granulovaných hnojiv a to za použití vhodných účinných látek, popřípadě ve směsi s hnojivy.

U herbicidních prostředků mohou být koncentrace účinných látek v přípravcích obvyklých na trhu různé.

U smáčitelných prášků se koncentrace účinné látky pohybuje například mezi asi 10 % a 80 %, zbytek sestává ze shora uvedených přísad do těchto přípravků. U emulgovatelných koncentrátů může koncentrace účinné látky činit rovněž asi 10 až 80 %. Popraše obsahují 2 až 20 % účinných látek. U granulátů závisí obsah účinné látky zčásti na tom, zda účinná sloučenina je přítomna v kapalně nebo v pevné formě a dále na tom, jaké pomocné granulární prostředky, plnidla atd. se používají.

Za účelem aplikace jako herbicidy se koncentráty obvyklé na trhu, popřípadě obvyklým způsobem ředí, například v případě smáčitelných prášků a emulgovatelných koncentrátů pomocí vody. Popraše a granulované přípravky, jakož i rozstřikovatelné roztoky se před aplikací již dalšími inertními látkami neředí. Potřebné aplikované množství se mění v závislosti na vnějších podmínkách, jako je teplota, vlhkost apod. Obecně činí mezi 0,01 a 10 kg/ha, výhodně mezi asi 0,1 a 5,0 kg/ha.

Pro některé oblasti aplikace může být účelné používat nové herbicidy společně s jedním nebo několika herbicidy, například ve formě připravené bezprostředně před použitím v tanku nebo ve formě hotového přípravku, aby se dosáhlo dalších výhodných účinků.

Účinné látky podle vynálezu se mohou kombinovat s dalšími herbicidy, insekticidy a fungicidy.

K aplikaci jako regulátory růstu rostlin se hodí koncentrace mezi 0,01 a 1,25 kg účinné látky na 1 ha. Výhodně se používá vodných disperzí smáčitelných prášků nebo zředěných emulgovatelných koncentrátů. Aplikace se provádí postemergentně. Výhodnými kulturními rostlinami jsou kukuřice a tabák.

Příklady ilustrující způsob výroby účinných látek:

P ř í k l a d 1

N-[(4-metoxi-6-metylpyrimidin-2-yl)aminokarbonyl]-2-chlorcyklohexylsulfonamid

41,7 g (0,3 mol) 2-amino-4-metoxi-6-metylpyrididinu se suspenduje v 500 ml dichlormetanu a k této suspenzi se při teplotě 0 °C přikape roztok 71,5 g (0,32 mol) 2-chlorcyklohexylsulfonylsokyanátu ve 200 ml dichlormetanu. Reakční směs se míchá 18 hodin při teplotě místnosti, potom se ochladí na teplotu 0 °C a přidá se k ní n-hexan. Vyloučený reakční produkt se odfiltruje a promyje se n-hexanem. Získá se 84,9 g (78 % teorie) N-[(4-metoxi-6-metylpyrimidin-2-yl)aminokarbonyl]-2-chlorcyklohexylsulfonamidu o teplotě tání 145 až 148 °C.

P ř í k l a d 2

N-[(4-metoxi-6-metylpyrimidin-2-yl)aminokarbonyl]-cyklohex-1-enylsulfonamid

36,2 g (0,1 mol) N-[(4-metoxi-6-metylpyrimidin-2-yl)aminokarbonyl]-2-chlorcyklohex-1-ylsulfonamidu (srov. příklad 1) se suspenduje ve 300 ml metanolu a při teplotě místnosti se k této suspenzi přidá 8 g (0,2 mol) hydroxidu sodného rozpuštěného ve 40 ml vody. Potom se reakční směs míchá 8 hodin pod zpětným chladičem, zahustí se ve vakuu a vyjme se 250 ml vody. Po filtraci a okyselení 2N roztokem chlorovodíkové kyseliny na pH 5 se provede extrakce etylacetátem a potom se extrakt vysuší síranem sodným a zahustí se. Po přidání n-hexanu se získá 17,2 g (52,7 % teorie) N-[(4-metoxi-6-metylpyrimidin-2-yl)-aminokarbonyl]cyklohex-1-enylsulfonamidu o teplotě tání 163 až 166 °C.

P ř í k l a d 3

N-[(4,5-dimethylpyrimidin-2-yl)aminokarbonyl]-7-oxabicyklo[2,2,1]hept-2-en-6-ylsulfonamid

30,7 g (0,25 mol) 2-amino-4,6-dimethylpyrimidinu se rozpustí v 350 ml dichlormetanu a při teplotě 0 °C se při míchání přidá roztok 52 g (0,26 mol) 7-oxabicyklo[2,2,1]hept-2-en-6-ylsulfonylisokyanátu (Diels-Alderův adukt vinylsulfonylisokyanátu a furanu) ve 100 ml dichlormetanu. Reakční směs se míchá 12 hodin při teplotě místnosti, ochladí se na 0 °C a přidá se n-hexan. Vyloučený reakční produkt se odfiltruje, promyje se n-hexanem a vysuší se. Získá se 73,6 g (90,8 % teorie) N-[(4,6-dimethylpyrimidin-2-yl)aminokarbonyl]-7-oxabicyklo[2,2,1]hept-2-en-6-ylsulfonamidu o teplotě tání 125 až 145 °C.

P ř í k l a d 4

N-[(4-metyltio-6-metyl-1,3,5-triazin-2-yl)aminokarbonyl]-3 (popř. 4)-methylcyklohex-3-en-ylsulfonamid

7,81 g (0,05 mol) 2-amino-4-metyltio-6-metyl-1,3,5-triazinu se suspenduje ve 150 ml dichlormetanu a při teplotě 0 °C se přidá roztok 11,05 g (0,055 mol) 3 (popř. 4)-methylcyklohex-3-en-ylsulfonylisokyanátu (směs isomerů; Diels-Alderův adukt isoprenu na vinylsulfonyl-isokyanát) v 50 ml dichlormetanu. Reakční směs se dále míchá 18 hodin při teplotě místnosti a potom se zpracuje analogickým způsobem jako v příkladu 1. Získá se 13,2 g (74 % teorie) N-[(4-metyltio-6-metyl-1,3,5-triazin-2-yl)-aminokarbonyl]-3- (popř. 4)-methylcyklohex-3-en-ylsulfonamidu o teplotě tání 156 až 160 °C.

P ř í k l a d 5

N-[(4,6-dimethylpyrimidin-2-yl)aminokarbonyl]-2-chlorcykloheptylsulfonamid

Předloží se 14,3 g (0,06 mol) 2-chlor-cykloheptylsulfonylisokyanátu ve 100 ml dichlormetanu a při teplotě 0 °C se po částech přidá 7,4 g (0,06 mol) 2-amino-4,6-dimethylpyrimidinu. Reakční směs se míchá nejprve 2 hodiny při teplotě 0 °C a potom 18 hodin při teplotě místnosti. Potom se organická fáze extrahuje třikrát vždy 40 ml 2N roztoku kyseliny sírové, promyje se do neutrální reakce a organická vrstva se vysuší síranem sodným. Potom se přidá 50 ml n-hexanu a rozpouštědlo se odpaří. Získá se 13,3 g (61 % teorie) N-[(4,6-dimethylpyrimidin-2-yl)aminokarbonyl]-2-chlorcykloheptylsulfonamidu (viskózní olej).

P ř í k l a d 6

N-[(4,6-dimethylpyrimidin-2-yl)aminokarbonyl]-2-chlorcyklododecylsulfonamid

15,4 g (0,05 mol) 2-chlorododecylsulfonylisokyanátu se předloží ve 100 ml dichlormetanu a při teplotě 0 °C se po částech přidá 6,2 g (0,05 mol) 2-amino-4,6-dimethylpyrimidinu. Reakční směs se míchá nejdříve 2 hodiny při teplotě 0 °C a potom 18 hodin při teplotě místnosti a zpracuje se analogickým způsobem jako v příkladu 5. Získá se 15,2 g (71 % teorie) N-[(4,6-dimethylpyrimidin-2-yl)aminokarbonyl]-2-chlorcyklododecylsulfonamidu (světle žlutá pevná látka, teplota tání 84 °C).

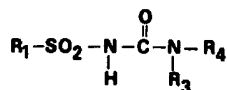
Příklad 7

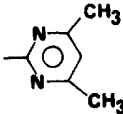
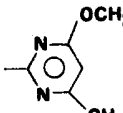
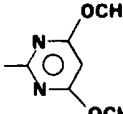
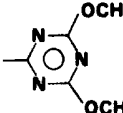
N-[(4,6-dimethylpyrimidin-2-yl)aminokarbonyl]-3-chlorbicyklo 2,2,1 hept-2-ylsulfonamid

Předloží se 14,1 g (0,06 mol) 3-chlorbicyklo[2,2,1] hept-2-ylsulfonylisokyanátu ve 100 ml dichlormetanu a při teplotě 0 °C se po částech přidá 7,4 g (0,06 mol) 2-amino-4,6-dimethylpyrimidinu. Reakční směs se míchá nejprve 2 hodiny při teplotě 0 °C a potom 18 hodin při teplotě místnosti a poté se zpracuje analogickým způsobem jako v příkladu 5. Získá se 14,1 g (66 % teorie) N-[(4,6-dimethylpyrimidin-2-yl)aminokarbonyl]-3-chlorbicyklo[2,2,1]hept-2-ylsulfonamidu (viskózní olej).

Analogickým způsobem se získají následující sloučeniny:

Tabulka 1

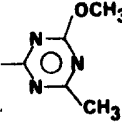
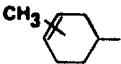
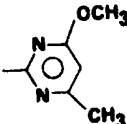
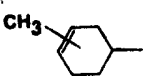
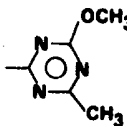
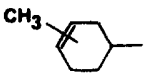
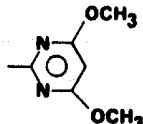
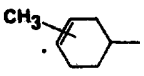
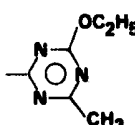
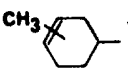
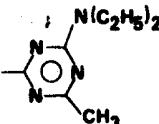
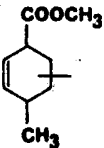
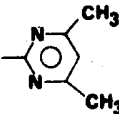
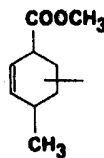
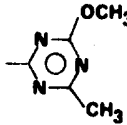


Příklad číslo	R ₁	R ₃	R ₄	Teplota tání (°C)
8		H		155 až 163
9		H		118 až 123
10		H		159 až 162
11		H		143 až 144

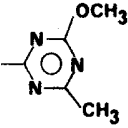
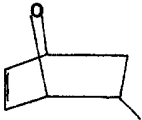
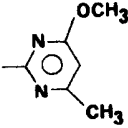
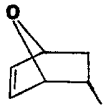
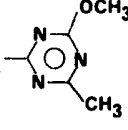
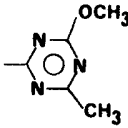
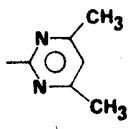
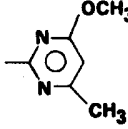
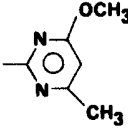
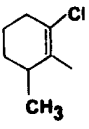
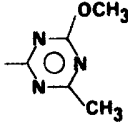
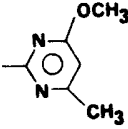
Pokračování tabulky 1

Příklad číslo	R ₁	R ₃	R ₄	Teplota tání (°C)
12		H		sklovitý produkt
13		H		48 až 52 (rozklad)
14		H		viskózní olej
15		H		103
16		H		142 až 144
17		H		165 až 169
18		H		150
19		H		159 až 167
20		H		viskózní olej

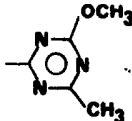
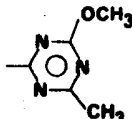
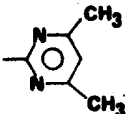
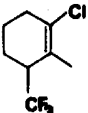
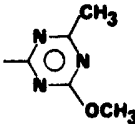
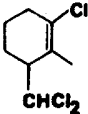
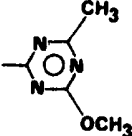
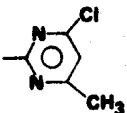
Pokračování tabulky 1

Príklad číslo	R ₁	R ₃	R ₄	Teplota tání (°C)
21		H		viskózní olej
22		H		195
23		H		143
24		H		173 až 176
25		H		89 až 92
26		H		161 až 164
27		H		54 až 57
28		H		88 až 91

Pokračování tabulky I

Příklad číslo	R ₁	R ₃	R ₄	Teplota tání (°C)
29		H		viskózní olej
30		H		146 až 150
31		H		135 až 145
32		H		pryskyřice
33		H		152 až 154
34		H		
35		H		
36		H		
37		H		78 až 80

Pokračování tabulky 1

Příklad číslo	R ₁	R ₃	R ₄	Teplota tání (°C)
38		CH ₃		
39		H		
40		H		137 až 138
41		H		pryskyřice
42		H		70
43		H		120 až 122

Příklady ilustrující složení a přípravu prostředků:

P ř í k l a d A

Emulgovatelný koncentrát se získá z následujících složek:

- 15 dílů hmotnostních účinné látky
- 75 dílů hmotnostních cyklohexanu jako rozpouštědla a
- 10 dílů hmotnostních oxetylovaného nonylfenolu (10 mol etylenoxidu) jako emulgátoru.

P ř í k l a d B

Ve vodě snadno dispergovatelný smáčitelný prášek:

- 25 dílů hmotnostních účinné látky
- 64 dílů hmotnostních křemene obsahujícího kaolin jako inertní látky a
- 10 dílů hmotnostních draselné soli ligninsulfonové kyseliny a
- 1 díl hmotnostní sodné soli oleylmetylteaurinu jako smáčedla a dispergátoru se smísí a získaná směs se rozemele v kolíkovém mlýnu.

P ř í k l a d C

Popraš se získá tím, že se smísí

- 10 dílů hmotnostních účinné látky a
- 90 dílů hmotnostních mastku jako inertní látky a získaná směs se rozmělní v kladivovém mlýnu.

P ř í k l a d D

Granulát sestává například z asi

- 2 až 15 dílů hmotnostních účinné látky a
- 98 až 85 dílů hmotnostních inertního granulovaného materiálu, jako například attapulgitu, pemzy a křemenného písku.

Příklady ilustrující biologickou účinnost:

a) Herbicidní účinek

Poškození plevelů popřípadě snášitelnost kulturními rostlinami se hodnotí podle následující stupnice od 0 do 5. Přitom znamená:

- 0 = bez účinku (bez poškození)
- 1 = 0 až 20% účinek
- 2 = 20 až 40% účinek
- 3 = 40 až 60% účinek
- 4 = 60 až 80% účinek
- 5 = 80 až 100% účinek.

V další části používání zkratky mají následující význam:

- LOM = jílek mnohokvětý (*Lolium multiflorum*)
- STM = ptačinec žabinec (*Stellaria media*)
- SIA = hořčice rolní (*Sinapis arvensis*)

1. Preemergentní pokus

Semena, popřípadě kousky rhizomů jednoděložných a dvojděložných plevelů se položí do jílovité půdy a zakryjí se vrstvou půdy. Sloučeniny podle vynálezu, zpracované ve formě smáčitelného prášku, se aplikují na povrch půdy ve formě vodných suspenzí nebo emulzí. Používané množství vody na 1 květináč přitom odpovídá po přepočtení 600 až 800 l/ha. Po ošetření se květináče s pokusnými rostlinami umístí do skleníku a pokusné rostliny se kultivují za dobrých růstových podmínek (teplota: asi 23 °C; relativní vlhkost vzduchu 60 až 80 %). Asi po 3 týdnech se vizuálně hodnotí poškození rostlin. Ke srovnání slouží přitom neošetřené kontrolní rostliny.

V následující tabulce 2 jsou shrnuty výsledky preemergentního pokusu. Z uvedených výsledků je zřejmé, že sloučeniny podle vynálezu mají dobrý herbicidní účinek jak proti jednoděložným, tak i proti dvojděložným plevelům, jestliže se účinné látky aplikují preemergentně.

T a b u l k a 2

Účinek sloučenin podle vynálezu vůči jednoděložným a dvojděložným plevelům při preemergentním ošetření

Příklad číslo	Dávka kg/ha	LOM	STM
1	2,5	3	4
9	2,5	2	3
10	2,5	3	2
16	2,5	5	5
19	2,5	5	5
3	2,5	4	4
30	2,5	5	5
31	2,5	5	4
28	2,5	2	3
32	2,5	5	5
33	2,5	5	5
37	2,5	5	5
39	2,5	5	5
40	2,5	3	3

V delším pokusu byly testovány při preemergentní aplikaci další účinné sloučeniny za použití různých dávek a za použití plevelů a kulturních rostlin, které jsou uvedeny v následující tabulce 2b pod následujícími zkratkami:

LOM = jílek mnohokvětý (*Lolium multiflorum*)
 SIA = hořčice rolní (*Sinapis arvensis*)
 STM = ptačinec žabinec (*Stellaria media*)
 GAA = svízel přitula (*Galium aparine*)
 MAI = heřmánek (*Matricaria anodora*)
 SAL = bér (*Setaria lutescens*)
 CYI = šáchor (*Cyperus iria*)
 TA = pšenice (*Triticum aestivum*)
 GS = sója (*Glycine soja*)

T a b u l k a 2b

Test na herbicidní účinek a selektivitu při preemergentní aplikaci

Příklad číslo	Dávka (kg/ha)	SIA	GAA	MAI	SAL	CYI	LOM	TA	GS
2	2,4	5	5	5	5	5	5	3	5
	0,6	5	5	5	4	5	5	1	3
	0,15	4	4	5	3	5	5	0	2
18	2,4	4	3	3	4	3	3	-	-
19	2,4	5	5	5	3	5	5	1	1
	0,6	5	2	4	0	4	4	0	1
	0,15	0	1	4	0	4	0	0	1
30	2,4	5	5	5	5	5	5	3	4
	0,6	5	5	5	4	5	4	0	3
	0,15	2	3	5	3	0	1	0	3
31	2,4	5	5	5	5	5	5	5	2
	0,6	5	4	5	5	5	5	3	1
	0,15	3	3	5	5	3	5	1	0
28	2,4	5	-	5	0	4	2	-	-
	0,6	-	-	-	-	-	-	-	-
srovnávací prostředek									
2,4-dichlor-	2,4	5	1	1	0	0	1	2	5
fenoxyocto-	0,6	5	0	1	0	0	1	1	4
vá kyselina	0,15	5	0	0	0	0	0	1	1

2. Postemergentní pokus

Semena jednoděložných a dvojděložných plevelů se zasejí do květináčů a ve skleníku se pěstují za dobrých růstových podmínek. 3 týdny po zasetí se pokusné rostliny ošetří ve stadiu 3 listů. Sloučeniny podle vynálezu zpracované ve formě smáčitelného prášku, popřípadě emulzního koncentrátu se aplikují v různých dávkách na zelené části rostlin postřikem a asi po 3 týdnech dalšího udržování rostlin ve skleníku za optimálních růstových podmínek (teplota: asi 23 °C; relativní vlhkost vzduchu 60 až 80 %) se hodnotí vizuálně účinek přípravků ve srovnání s neošetřenými kontrolními rostlinami.

Prostředky podle vynálezu mají dobrý herbicidní účinek vůči širokému spektru hospodářsky důležitých jednoletých a vytrvalých plevelů a trvanatých plevelů (srov. tabulku 3):

T a b u l k a 3

Herbicidní účinek sloučenin podle vynálezu vůči jednoděložným a dvojděložným plevelům při postemergentní aplikaci

Sloučenina číslo	Dávka kg/ha	LOM	SIA
9	2,5	1	5
10	2,5	3	4
19	2,5	5	5
3	2,5	3	5
30	2,5	4	5
31	2,5	5	5
27	2,5	0	4
32	2,5	5	5
33	2,5	5	5
37	2,5	5	5

V dalším pokusu byly testovány při postemergentní aplikaci další účinné sloučeniny za použití různých dávek a za požití plevelů a kulturních rostlin, které jsou uvedeny v následující tabulce 3b pod následujícími zkratkami:

SIA = hořčice rolní (*Sinapis arvensis*)
 GAA = svízel přítula (*Galium aparine*)
 MAI = heřmánek (*Matricaria inodora*)
 SAL = bér (*Setaria lutescens*)
 CYI = šáchor (*Cyperus iris*)
 LOM = jílek mnohokvětý (*Lolium multiflorum*)
 TA = pšenice (*Triticum aestivum*)
 GS = soja (*Glycine soja*)

T a b u l k a 3b

Test na herbicidní účinek a selektivitu při postemergentní aplikaci

Příklad číslo	Dávka kg/ha	Herbicidní účinek							
		SIA	GAA	MAI	SAL	CYI	LOM	TA	GS
2	2,4	3	3	5	4	5	3	-	-
	0,6	2	1	5	3	4	2	-	-
	0,15	2	1	5	1	4	2	-	-
18	2,4	5	1	3	3	1	1	-	-
19	2,4	5	5	5	5	5	5	-	-
	0,6	0	1	5	2	3	2	-	-
	0,15	0	1	5	1	3	2	-	-
30	2,4	5	5	5	4	3	4	1	3
	0,6	5	4	4	4	2	3	1	1
	0,15	4	3	3	3	0	1	1	0
31	2,4	5	2	5	5	5	5	1	0
	0,6	5	1	5	5	5	4	0	0
	0,15	4	0	4	3	1	0	0	0
28	2,4	5	4	5	2	3	2	-	-
	0,6	4	3	5	2	2	2	-	-
srovnávací prostředek									
2,4-dichlor-	2,4	5	2	5	2	5	1	0	5
fenoxyoctová	0,6	5	1	4	2	5	0	0	4
kyselina	0,15	4	0	3	1	5	0	0	3

b) Účinek na regulaci růstu rostlin

3. Zbrzdění růstu rostlin

V pokusných miskách ve skleníku se mladé rostliny obilnin (pšenice, ječmene a žito) ve stadiu 3 listů až do orosení postřikují sloučeninami uvedenými v tabulce 1 v uvedených koncentracích účinné látky (kg/ha). Jako srovnávací sloučeniny bylo použito 2-chloretyl-trimetylamoniumchloridu. Když neošetřené kontrolní rostliny dosáhly výšky vzrůstu asi 55 cm, byl u všech rostlin změřen přírůstek a vypočteno zbrzdění růstu v procentech přírůstku kontrolních rostlin. Kromě toho byl pozorován fytotoxický účinek testovaných sloučenin. Výsledky tohoto pokusu jsou shrnuty v tabulce 4. Údaj zbrzdění růstu 100 % znamená stav klidu (nedochází k dalšímu růstu) a údaj 0 % odpovídá růstu neošetřených kontrolních rostlin.

T a b u l k a 4

Zbrzdění růstu obilovin

Sloučenina číslo	Použitá koncentrace kg/ha	Zbrzdění růstu v %			Fytotoxický účinek
		pšenice	ječmen	žito	
3	0,62	22	24	22	žádný
	0,31	11	21	18	žádný
28	1,25	19	18	15	žádný
19	1,25	15	10	11	žádný
srovnávací sloučenina					
(2-chloretyl)- trimetylammo- niuchlorid					
	2,50	27	8	10	žádný
	1,25	23	0	0	žádný

4. Zbrzdění růstu keříčkových fazolí

10 až 15 cm vysoké rostliny keříčkových fazolí se postřikají až do stadia zvlhčení účinnými přípravky. Po 2 týdnech se změří přírůstek rostlin a vypočte se zbrzdění růstu v procentech přírůstku kontrolních rostlin.

Výsledky tohoto pokusu jsou shrnuty v následující tabulce 5:

T a b u l k a 5

Zbrzdění růstu keříčkových fazolí

Sloučenina číslo	Použitá množství kg/ha	Zbrzdění růstu v %	Fytotoxický účinek
3	0,62	40	žádný
	0,31	40	žádný
srovnávací sloučenina:			
$ \begin{array}{c} \text{CH}_2\text{-CO-NH-N} \begin{array}{l} \nearrow \text{CH}_3 \\ \searrow \text{CH}_3 \end{array} \\ \\ \text{CH}_2\text{-COOH} \end{array} $	2,50	34	žádný

5. Zbrzdění růstu trav

Směs trav, sestávající z 5 vybraných druhů, se po trojnásobném sestřihnutí postříká účinným přípravkem až do stádia orosení. Po 3 až 4 týdnech se změří přírůstek a vypočte se zbrzdění růstu v procentech přírůstku kontrolních rostlin. Přitom znamená údaj 100% stav, kdy nedochází k dalšímu růstu (stav klidu) a 0 % znamená růst odpovídající růstu neošetřených kontrolních rostlin.

T a b u l k a 6

Zbrzdění růstu trav

Sloučenina číslo	Použité množství kg/ha	Zbrzdění růstu v %	Fytotoxický účinek
3	0,62	82	žádný
	0,31	70	žádný
srovnávací sloučenina:			
hydrazid maleinové kyseliny	2,50	60	silné poškození

6. Zvýšení obsahu cukru u cukrové třtiny

Metoda testu:

Rostliny cukrové třtiny se pěstují za skleníkových podmínek při teplotě 25 až 35 °C a při asi 65% relativní vlhkosti vzduchu. Různá množství prostředků se suspendují ve vodě, která navíc obsahuje asi 0,25 % hmotnostního povrchově aktivního činidla (nonyl-fenolu).

Vždy 0,3 ml připravených suspenzí se pomocí stříčky aplikuje v místě řapíku ve výšce poslední patrné listové čepele ("dewlap") (10 rostlin na jednu koncentraci). Z ošetřených rostlin, jakož i z neošetřených kontrolních rostlin se po 3 týdnech při sklizni odstraní listy a internodia se po skupinách analyzují na obsah sacharózy. Výsledky jsou shrnuty v tabulce 7.

T a b u l k a 7

Sloučenina číslo	Použitá koncentrace (kg/ha)	Obsah cukru v % při sklizni
3	0,62	145
19	0,62	239
kontrola		100

7. Stimulace uvolňování etylenu

Pomeranče (Calemondin) se na dobu 2 minut ponoří do roztoku účinné látky, který obsahuje 2 000 ppm účinné látky, Etylen vzniklý z plodů se potom denně po dobu 5 dnů pomocí plynové chromatografie stenovuje.

Výsledky v tabulce 8 představují střední hodnotu z celkem tří řad pokusů.

T a b u l k a 8

Sloučenina číslo	Produkce etylenu (relativní jednotky) 1 až 5 dnů celkem
kontrola	2,4
3	12,4
10	9,0
srovnávací sloučenina:	
glyoxim	3,8

Sloučeniny podle vynálezu mají podstatně vyšší iniciační a trvalý účinek při uvolňování etylenu ve srovnání se srovnávací sloučeninou. Také celkem vzniklé množství etylenu zřetelně převyšuje množství etylenu uvolněné pomocí srovnávací sloučeniny. Vzhledem k tomu, že etylen, který se také tvoří z rostliny, se rozhodujícím způsobem podílí na procesu zrání a na procesu abscise, slouží tento pokus jako důkaz pro urychlování a dalekosáhlé vytváření dělivé tkáně, které je vyvoláváno sloučeninami podle vynálezu, a tím rovněž pro jeho stimulační schopnost při procesu abscise.

P Ř E D M Ě T V Y N Á L E Z U

1. Herbicidní prostředek a prostředek k regulaci růstu rostlin, vyznačující se tím, že jako účinnou složku obsahuje alespoň jednu sloučeninu obecného vzorce I



v němž

- R_1 znamená cykloalkylovou skupinu se 6 až 12 atomy uhlíku nebo cykloskenylovou skupinu se 6 až 8 atomy uhlíku, které jsou popřípadě substituovány až 4 atomy halogenu nebo/a alkylovým zbytkem s 1 až 4 atomy uhlíku nebo halogenmetylovým zbytkem s až 3 atomy halogenu popřípadě alkoxykarbonylovým zbytkem s 1 až 4 atomy uhlíku v alkoxylové části, dále znamená bicyklo-[2,2,1] heptylový zbytek, který popřípadě obsahuje až 6 atomů halogenu nebo znamená 7-oxabicyklo[2,2,1] heptenylový zbytek.
- R_3 znamená vodík nebo alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku,
- R_4 znamená 1,3,5-triazinylový nebo 1,3-pyrimidin-2-yllový zbytek, kteréžto zbytky jsou popřípadě jednou až dvakrát substituovány halogenem, alkylaminoskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, dialkylaminoskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku v alkylech, alkylovým zbytkem s 1 až 4 atomy uhlíku, alkoxykupinou s 1 až 4 atomy uhlíku nebo alkyltioskupinou s 1 až 4 atomy uhlíku,

nebo její fyziologicky snášitelné soli s bázemi.

2. Prostředek podle bodu 1, vyznačující se tím, že jako účinnou složku obsahuje alespoň jednu sloučeninu obecného vzorce I, v němž R_3 znamená vodík a R_1 a R_4 mají významy uvedené v bodě 1.

3. Prostředek podle bodu 1 nebo 2, vyznačující se tím, že jako účinnou složku obsahuje alespoň jednu sloučeninu obecného vzorce I, v němž R_1 znamená chlorem nebo bromem substituovaný cykloalkylový zbytek se 6 až 12 atomy uhlíku a zbývající symboly mají význam uvedený v bodě 1 nebo 2.

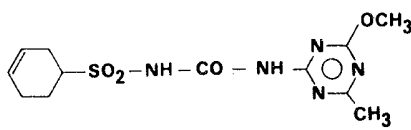
4. Prostředek podle bodu 1 nebo 2, vyznačující se tím, že jako účinnou složku obsahuje alespoň jednu sloučeninu obecného vzorce I, v němž R_1 znamená cyklohexenylovou skupinu, metylcyklohexenylovou skupinu nebo chlorcyklohexenylovou skupinu a zbývající symboly mají význam uvedený v bodě 1 nebo 2.

5. Prostředek podle bodu 1 nebo 2, vyznačující se tím, že jako účinnou složku obsahuje alespoň jednu sloučeninu obecného vzorce I, v němž R_1 znamená cykloheptenylový nebo oxabicyklo[2,2,1]heptenylový zbytek a zbývající symboly mají význam uvedený v bodě 1 nebo 2.

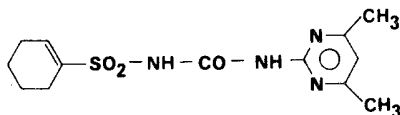
6. Prostředek podle bodu 1 nebo 2, vyznačující se tím, že jako účinnou složku obsahuje alespoň jednu sloučeninu obecného vzorce I, v němž R_1 znamená chlorbicyklo[2,2,1]heptylový zbytek a zbývající symboly mají význam uvedený v bodě 1 nebo 2.

7. Prostředek podle jednoho z bodů 1 až 6, vyznačující se tím, že jako účinnou složku obsahuje alespoň jednu sloučeninu obecného vzorce I, v němž R_4 znamená v poloze 4 a v poloze 6 metylovou skupinou nebo/a metoxyskupinou substituovaný pyrimidinový nebo s-triazinový kruh a zbývající symboly mají význam uvedený v bodě 1 až 6.

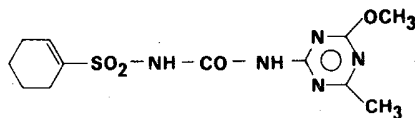
8. Prostředek podle bodu 1, vyznačující se tím, že jako účinnou složku obsahuje sloučeninu vzorce



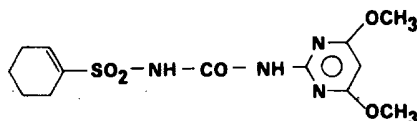
9. Prostředek podle bodu 1, vyznačující se tím, že jako účinnou složku obsahuje sloučeninu vzorce



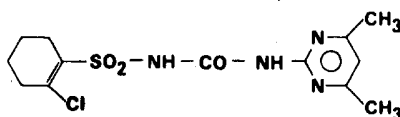
10. Prostředek podle bodu 1, vyznačující se tím, že jako účinnou složku obsahuje sloučeninu vzorce



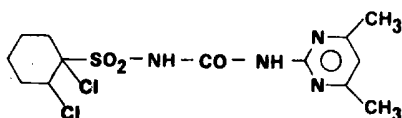
11. Prostředek podle bodu 1, vyznačující se tím, že jako účinnou složku obsahuje sloučeninu vzorce



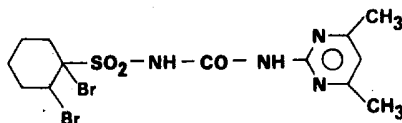
12. Prostředek podle bodu 1, vyznačující se tím, že jako účinnou složku obsahuje sloučeninu vzorce



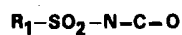
13. Prostředek podle bodu 1, vyznačující se tím, že jako účinnou složku obsahuje sloučeninu vzorce



14. Prostředek podle bodu 1, vyznačující se tím, že jako účinnou složku obsahuje sloučeninu vzorce



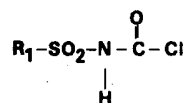
15. Způsob výroby účinné složky podle bodu 1, obecného vzorce I, vyznačující se tím, že se sloučeniny obecného vzorce II



(II),

v němž

R_1 má význam uvedený v bodě 1, nebo
sloučeniny obecného vzorce III



(III),

v němž

R_1 má význam uvedený v bodě 1,

uvádějí v reakci se sloučeninami obecného vzorce IV



(IV),

v němž

R_3 a R_4 mají významy uvedené v bodě 1.