

ÚŘAD PRO VYNÁLEZY
A OBJEVY

POPIS VYNÁLEZU K PATENTU

219348
(11) (B2)

[51] Int. Cl.³
A 01 N 41/06
A 01 N 43/80

[22] Přihlášeno 21 01 81
[21] (PV 439-81)

[32] [31] [33] Právo přednosti od 23 01 80
(8000414) Nizozemsko

[40] Zveřejněno 25 06 82

[45] Vydáno 15 07 85

[72]
Autor vynálezu

VAN HES ROELOF, GROSSCURT ARNOLDUS CORNELIS, BALK WOUTER,
WEESP (Nizozemsko)

[73]
Majitel patentu

DUPHAR INTERNATIONAL RESEARCH B. V., WEESP (Nizozemsko)

[54] Prostředek k potírání mšic a způsob výroby účinných látek

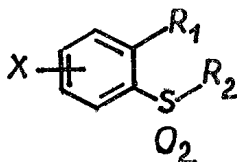
1

Vynález se týká nových sulfonylderivátů, způsobu výroby těchto nových sloučenin, prostředků k potírání mšic, obsahujících zmíněné nové sloučeniny, a použití těchto prostředků k hubení mšic v zemědělství, zahradnictví a lesním hospodářství.

Jsou již známy benzo[d]isothiazol-1,1-dioxydy vykazující fungicidní účinnost, jako například 3-aminobenzo[d]isothiazol-1,1-dioxyd.

V DOS č. 1 670 797 jsou popsány benzoisothiazol-1,1-dioxydy, například 3-dimethylamino-6-chlorbenzoisothiazol-1,1-dioxyd, a způsob výroby těchto sloučenin. V této publikaci je uvedeno, že připravované sloučeniny jsou meziprodukty pro výrobu barviv a pesticidů. V žádné z výše zmíněných publikací nejsou však obsaženy žádné zmínky o insekticidní účinnosti připravovaných sloučenin nebo o jejich účinnosti proti mšicím.

Nyní bylo zjištěno, že nové sulfonylderiváty obecného vzorce



2

ve kterém

X znamená atom halogenu, fenoxyskupinu nebo alkylovou či alkoxylovou skupinu obsahující vždy 1 až 4 atomy uhlíku a popřípadě substituovanou halogenem,

R₁ představuje kyanoskupinu a

R₂ znamená aminoskupinu, která může být popřípadě substituována halogenem, jednou nebo dvěma alkenylovými nebo alkinylovými skupinami obsahujícími vždy 2 až 6 atomů uhlíku, nebo jednou či dvěma alkylovými skupinami s 1 až 6 atomy uhlíku, kteréžto alkylové skupiny mohou společně s dusíkovým atomem, na který jsou navázány, tvořit nasycený heterocyklický kruh, jenž může rovněž obsahovat druhý heteroatom vybraný ze skupiny obsahující dusík, kyslík a síru, nebo kteréžto alkylové skupiny mohou být substituovány alkoxykupinou s 1 až 4 atomy uhlíku nebo dialkylaminoskupinou se 2 až 6 atomy uhlíku, přičemž alkylové skupiny této dialkylaminoskupiny mohou společně s dusíkovým atomem, na který jsou navázány, tvořit nasycený heterocyklický kruh, nebo

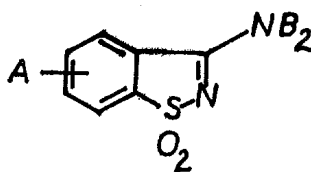
R₁ a R₂ společně tvoří S,S-dialkylsulfoximidoskupinu, v níž jednotlivé alkylové skupiny obsahují 1 až 4 atomy uhlíku, nebo 1-amino-2-azavinylenovou skupinu, v níž

může být aminoskupina popřípadě substituována cykloalkylkarbamoylovou skupinou se 4 až 8 atomy uhlíku, alkylkarbamoylovou skupinou se 2 až 5 atomy uhlíku, dialkylaminoskupinou obsahující v každé alkylové části vždy 1 až 4 atomy uhlíku, nebo alkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, popřípadě substituovanou hydroxyskupinou nebo atomem halogenu, nebo

R_1 a R_2 společně tvoří 1-imino-2-azaethylenovou skupinu, v níž je dusíkový atom v kruhu substituován alkylovou nebo alkenylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, a v níž může být iminoskupina substituována fenylkarbamoylovou skupinou, popřípadě substituovanou alkoxykupinou s 1 až 4

atomy uhlíku, vykazují účinnost proti mšicím.

Sulfonylderivát známý z výše citovaného DOS nevykazuje žádnou účinnost proti mšicím, a to ani v koncentraci 300 ppm. I když se ukázalo, že 3-aminobenzo[d]isothiazol-1,1-dioxid, známý jako fungicid, vykazuje mírnou účinnost proti mšicím, mají chemicky příbuzné sulfonylderiváty podle tohoto vynálezu mnohem vyšší účinnost proti mšicím, jak vyplývá z níže uvedených výsledků. Tyto výsledky byly získány při testu účinnosti proti mšici makové (*Aphis fabae*), prováděném postupem popsáním v příkladu 9.



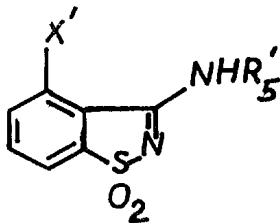
účinnost proti mšici makové
při koncentraci účinné látky
v mg/litr

testovaná látka	A	B	300	100	30	10	3	1
známá jako mezi- produkt z DOS č. 1 670 797	6-Cl	CH ₃	—					
známá jako fungi- cid z japonské pří- hlášky vynálezu č. 73/24735	H	H	+	±	—			
podle vynálezu	4-Cl	H	+	+	+	+	±	—

Legenda: jednotlivé symboly mají následující významy:

+ = 90 až 100% mortalita
± = 50 až 90% mortalita
— = nižší než 50% mortalita

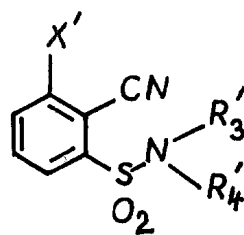
Z výše zmíněných sloučenin účinných proti mšicím se jako nejúčinnější ukázaly látky obecného vzorce



ve kterém

X' znamená atom fluoru nebo chloru a

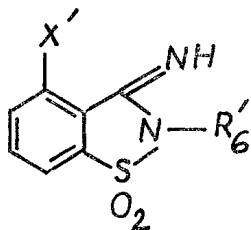
R_5' představuje atom vodíku, 2-chlorethyllovou skupinu nebo cyklohexylkarbamoylovou skupinu, a rovněž látky obecného vzorce



ve kterém

X' má shora uvedený význam a

R_3' a R_4' , které mohou být stejné nebo rozdílné, znamenají vždy atom vodíku nebo alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, jakož i látky obecného vzorce



ve kterém

X' má shora uvedený význam a R₆ představuje methylovou nebo ethylovou skupinu.

Jako příklady velmi vhodných sloučenin účinných proti mšicím se uvádějí:

- (1) 3-amino-4-chlorbenzo[d]isothiazol-1,1-dioxid,
- (2) 3-(3-cyklohexylureido)-4-chlorbenzo[d]isothiazol-1,1-dioxid,
- (3) 3-amino-4-fluorbenzo[d]isothiazol-1,1-dioxid,
- (4) 3-(2-chlorethyl)amino-4-chlorbenzo[d]isothiazol-1,1-dioxid,
- (5) 2-kyan-3-chlorbenzensulfonamid,
- (6) 2-kyan-3-chlor-N-isopropylbenzensulfonamid,
- (7) 2-kyan-3-fluor-N,N-diethylbenzensulfonamid,
- (8) 2-kyan-3-fluor-N-isopropylbenzensulfonamid,
- (9) 2-kyan-3-fluorbenzensulfonamid,
- (10) 2-kyan-3-fluor-N,N-dimethylbenzensulfonamid,
- (11) 2-methyl-3-imino-4-chlorbenzo[d]isothiazolin-1,1-dioxid,
- (12) 2-methyl-3-imino-4-fluorbenzo[d]isothiazolin-1,1-dioxid a
- (13) 2-ethyl-3-amino-4-fluorbenzo[d]isothiazolin-1,1-dioxid.

Z výše uvedených sloučenin se jako výtečně účinná jeví sloučenina č. (1).

Jako příklady dalších nových sulfonylderivátů podle vynálezu, vykazujících účinnost proti mšicím, se uvádějí:

- (14) 3-(3-methylureido)-4-chlorbenzo[d]isothiazol-1,1-dioxid,
- (15) 3-n-butylamino-4-chlorbenzo[d]isothiazol-1,1-dioxid,
- (16) 2-kyan-3-chlor-N,N-diallylbenzensulfonamid,
- (17) 2-kyan-3-fluor-N,N-diallylbenzensulfonamid,
- (18) 2-kyan-3-fluor-N-(3-methyl-1-butin-3-yl)benzensulfonamid,
- (19) 1-(2-kyan-3-fluorfenyl)sulfonylpipe-ridin,
- (20) 1-(2-kyan-3-fluorfenyl)sulfonylmor-folin,
- (21) 2-kyan-3-methyl-N,N-dimethylbenzen-sulfonamid,
- (22) 2-kyan-3-methyl-N,N-diallylbenzen-sulfonamid,

- (23) 2-allyl-3-imino-4-chlorbenzo[d]iso-thiazolin-1,1-dioxid,
- (24) 2-methyl-3-N-(4-ethoxyfenylkarba-moyl)imino-4-chlorbenzo[d]isothia-zolin-1,1-dioxid,
- (25) 2-kyan-3-fluor-N,N-dichlorbenzen-sulfonamid,
- (26) S,S-dimethyl-N-(2-kyan-3-fluorfenyl-sulfonyl)sulfoximid,
- (27) 1-(2-kyan-3-fluorfenyl)sulfonylpyrro-lidin,
- (28) 2-kyan-5-trifluormethoxy-N,N-dime-thylbenzensulfonamid,
- (29) 2-kyan-5-chlor-N,N-dimethylbenzen-sulfonamid,
- (30) 2-kyan-3-chlor-N-(2-methoxyethyl)-benzensulfonamid,
- (31) 3-(1-hydroxy-2-butyl)amino-4-chlor-benzo[d]isothiazol-1,1-dioxid,
- (32) 3-amino-4-methylbenzo[d]isothiazol-1,1-dioxid,
- (33) 3-amino-4-methoxybenzo[d]isothia-zol-1,1-dioxid,
- (34) 3-N',N'-dimethylhydrazino-4-chlorben-zo[d]isothiazol-1,1-dioxid,
- (35) 3-amino-4-fenoxybenzo[d]isothiazol-1,1-dioxid,
- (36) 2-allyl-3-imino-4-fluorbenzo[d]iso-thiazolin-1,1-dioxid a
- (37) 2-methyl-3-imino-4-methoxybenzo-[d]isothiazolin-1,1-dioxid.

Sloučeniny podle vynálezu je možno po-užívat k potírání mšic v zemědělství, za-hradnictví a lesním hospodářství.

K praktickým aplikacím se sloučeniny po-dle vynálezu obvykle zpracovávají na pří-slušné prostředky. V těchto prostředcích je účinná látka smísená s pevným nosným materiálem nebo je rozpuštěna či disper-gována v kapalném nosiči, popřípadě v kombinaci s pomocnými látkami, jako e-mulgátory, smáčedly, dispergátory, a stabi-lizátory.

Jako příklady prostředků podle vynálezu je možno uvést vodné roztoky a disperze, olejové roztoky a olejové disperze, rozto-ky v organických rozpouštědlech, pasty, popraše, dispergovatelné prášky, mísitelné oleje, granuláty, pelety, invertní emulze, aerosolové prostředky a dýmotvorné svíč-ky.

Dispergovatelné prášky, pasty a mísitel-né oleje jsou koncentrované prostředky, které se před nebo během použití ředí.

Invertní emulze a roztoky v organických rozpouštědlech se používají hlavně k letec-ké aplikaci, při níž se velké plochy ošetřu-jí poměrně malým množstvím prostředku. Invertní emulzi je možno připravit emulgo-váním vody v olejovém roztoku nebo ole-jové disperzi účinné látky v postřikovacím zařízení krátce před, nebo dokonce i bě-hem postřiku. Roztoky účinných látek v organických rozpouštědlech mohou obsa-hovat látku snižující fytoxicitu, jako tuk

z ovčí vlny, kyselinu nebo alkohol tuku z ovčí vlny. V další části jsou detailně popsány příklady několika prostředků podle vynálezu.

Granuláty se vyrábějí například tak, že se účinná látka rozpustí v rozpouštědle nebo disperguje v ředidle a vzniklým roztokem nebo suspenzí se, popřípadě v přítomnosti pojidla, impregnuje granulovaný nosný materiál, jako jsou porézní granule (například pemza nebo attaclay), minerální neporézní granule (písek nebo mletý slín) nebo organické granulované materiály (například vysušená kávová sedlina, sekané tabákové stonky a granulovaná dřevní kukuřičných klasů).

Účinný prostředek ve formě granulátu lze rovněž připravit slisováním účinné látky spolu s práškovým minerálním nosičem v přítomnosti lubrikačních přísad a pojiidel, rozdrčením výlisků a prosátím na žádanou velikost granulí.

Granulované prostředky lze dále připravovat smísením práškové účinné látky s práškovým nosičem a pak aglomerací směsi na žádanou velikost částic.

Popraše je možno získat důkladným promísením účinné látky s inertním pevným nosným materiálem, například maskem.

Dispergovatelné prášky se připravují smísením 10 až 80 hmotnostních dílů pevného inertního nosiče, například kaolinu, dolomitu, sádry, křídly, bentonitu, attapulgitu, koloidního kyslíčnicku křemičitého nebo směsí těchto a podobných látek, s 10 až 80 hmotnostními díly účinné látky, 1 až 5 hmotnostními díly dispergátoru, například ligninsulfonátu nebo alkylnaftalensulfonátu, známých pro použití k těmto účelům, a výhodně rovněž s 0,5 až 5 hmotnostními díly smáčedla, jako například sulfatovaného mastného alkoholu, alkylarylsulfonátu, kondenzačního produktu mastné kyseliny nebo polyoxyethylenderivátu, a v případě potřeby pak s dalšími přísadami.

K přípravě mísitelných olejů je možno účinnou látku rozpustit ve vhodném rozpouštědle, s výhodou špatně mísitelném s vodou, a k roztoku přidat jeden nebo několik emulgátorů. Takovéto mísitelné oleje se označují rovněž jako emulgovatelné koncentráty. Vhodnými rozpouštědly jsou například xylen, toluen, ropné destiláty bohaté na aromáty, jako je solventnafta, destilovaný dehtový olej a směsi těchto kapalin. Jako emulgátory je možno použít například polyoxyethylenderiváty nebo/a alkylarylsulfonáty. Koncentrace účinné látky v těchto mísitelných olejích není omezena nějakým úzkým rozmezím a může se pohybovat například mezi 2 a 50 % hmotnostními. Kromě mísitelných olejů je možno jako kapalinou a vysoce koncentrovanou primární kompozici uvést roztok účinné látky v kapalině, která je dobře mísitelná s vodou, například v glykolu, glykoletheru, dimethylformamidu nebo N-methylpyrrolidonu. K

tomuto roztoku se přidává dispergační činidlo a popřípadě povrchově aktivní činidlo. Zředěním tohoto koncentrátu vodou krátce před nebo během postřiku se získá vodná disperze účinné látky.

Aerosolové prostředky podle vynálezu se připravují obvyklým způsobem kombinací účinné látky, popřípadě v rozpouštědle, s těkavou kapalinou používanou jako propellant, jako je například směs chlorovaných a fluorovaných derivátů methanu a ethanu, směs nižších uhlovodíků, dimethylether nebo plyny, jako kyslíčnick uhlíčitý, dusík nebo kyslíčnick dusnatý.

Dýmotvorné svíčky nebo dýmotvorné prášky, tj. prostředky schopné při hoření vyvíjet pesticidní dým, se získají inkorporací účinné látky do hořlavé směsi, která může obsahovat například cukr nebo dřevo, s výhodou v rozmělněné formě, jako palivo, a látku schopnou udržet hoření, jako je například dusičnan amonný nebo chlorečnan draselný, a dále látku schopnou zpomalovat hoření, například kaolin, bentonit nebo/a koloidní kyselinu křemičitou.

Kromě shora uvedených přísad mohou prostředky podle vynálezu obsahovat ještě další látky, jejichž použití v prostředcích tohoto typu je známé.

Tak například do dispergovatelných prášků a do směsí určených ke granulaci je možno přidávat kluznou látku, jako stearát vápenatý nebo stearát hořečnatý. Ke zlepšení přilnavosti pesticidu k ošetřované kulturní rostlině je možno přidávat rovněž „adheziva“, jako jsou deriváty polyvinylalkoholu a celulózy nebo jiné koloidní materiály, jako kasein. Přidávat je možno i látky snižující fytotoxicitu účinné sloučeniny, nosného materiálu nebo pomocné látky, jako tuk z ovčí vlny nebo alkohol tuku z ovčí vlny.

K prostředkům podle vynálezu je možno rovněž přidávat známé pesticidně účinné sloučeniny. Přídavek těchto látek rozšiřuje spektrum účinnosti zmíněných prostředků a může vést i k synergismu.

Pro použití v takovýchto kombinovaných prostředcích přicházejí v úvahu následující známé insekticidní, akaricidní a fungicidní sloučeniny:

Insekticidy, jako

- 1) organické chlorderiváty, například 6,7,8,9,10,10-hexachlor-1,5,5a,6,9,9a-hexahydro-6,9-methano-2,4,3-benzo(e)-dioxathiepin-3-oxid,
- 2) karbamáty, například 2-dimethylamino-5,6-dimethylpyrimidin-4-yl-dimethylkarbamát a 2-isopropoxyfenyl-methylkarbamát,
- 3) di(m)ethylfosfáty, například 2-chlor-2-diethylkarbamoyl-1-methylvinyl-, 2-methoxykarbonyl-1-methylvinyl-,

2-chlor-1-(2,4-dichlorfenyl)vinyl- a
2-chlor-1-(2,4,5-trichlorfenyl)vinyl-
di(m)ethylfosfát,

- 4) O,O-di(m)ethylfosforothioáty, například O(S)-2-methylthioethyl-, S-2-ethylsulfinylethyl-, S-2-(1-methylkarbamoyl-ethylthio)ethyl-, O-4-brom-2,5-dichlorfenyl-, O-3,5,6-trichlor-2-pyridyl-, O-2-isopropyl-6-methylpyrimidin-4-yl- a O-4-nitrofenyl-O,O-di(m)ethylfosforothioát,
- 5) O,O-di(m)ethylfosforodithioáty, například S-methylkarbamoylmethyl-, S-2-ethylthioethyl-, S-[3,4-dihydro-4-oxobenzo(d)-1,2,3-triazin-3-ylmethyl]-, S-1,2-di(ethoxykarbonyl)ethyl-, S-6-chlor-2-oxobenzoxazolin-3-ylmethyl- a S-2,3-dihydro-5-methoxy-2-oxo-1,3,4-thiadiazol-3-ylmethyl-O,O-di(m)ethylfosforodithioát,
- 6) fosfonáty, například dimethyl-2,2,2-trichlor-1-hydroxyethylfosfonát,
- 7) deriváty benzoylmočoviny, například N-(2,6-difluorbenzyl)-N'-(4-chlorfenyl)-močovina,
- 8) přírodní a syntetické pyrethroidy,
- 9) amidiny, například N'-(2-methyl-4-chlorfenyl)-N,N-dimethylformamidin a
- 10) mikrobiální insekticidy, jako *Bacillus thuringiensis*.

Akaricidy, jako

- 1) organické sloučeniny cínu, například tri-cyklohexylcínhydroxid a di[tri-(2-methyl-2-fenylpropyl)cín]oxid,
- 2) organické halogenderiváty, například isopropyl-4,4'-dibrombenzilát, 2,2,2-trichlor-1,1-di(4-chlorfenyl)ethanol a 2,4,5,4'-tetrachlordifenylsulfon,

a dále 3-chlor- α -ethoxyimino-2,6-dimethoxybenzylbenzoát a O,O-dimethyl-S-methylkarbamoylmethylfosforothioát.

Fungicidy, jako

- 1) organické sloučeniny cínu, například trifenylcínhydroxid a trifenylcínacetát,
- 2) alkylenbisdithiokarbamáty, například ethylen-bis-dithiokarbamat zinečnatý a ethylen-bis-dithiokarbamat manganatý,
- 3) 1-acyl- nebo 1-karbamoyl-N-benzimidazol-2-ylkarbamáty a 1,2-bis(3-alkoxykarbonyl)-2-thioureidobenzen, a dále 2,4-dinitro-6-(2-oktylfenylkrotonát),

1-[bis-(dimethylamino)fosforyl]-3-fenyl-5-amino-1,2,4-triazol,
N-trichlormethylthioftalimid,
N-trichlormethylthiotetrahydroftalimid,
N-(1,1,2,2-tetrachlorethylthio)tetrahydroftalimid,
N-dichlorfluormethylthio-N-fenyl-N,N'-dimethylsulfamid, tetrachlorisofthalonitril,
2-(4'-thiazolyl)benzimidazol,
5-butyl-2-ethylamino-6-methylpyrimidin-4-yl-dimethylsulfamát,
1-[4-chlorfenoxy-3,3-dimethyl-1-(1,2,4-triazol-1-yl)-2-butanon,
 α -(2-chlorfenyl)- α -(4-chlorfenyl)-5-pyrimidinmethanol,
1-(isopropylkarbamoyl)-3-(3,5-dichlorfenyl)hydantoin,
N-(1,1,2,2-tetrachlorethylthio)-4-cyklohexen-1,2-karboximid,
N-trichlormethylmerkapt-4-cyklohexen-1,2-dikarboximid a
N-tridecyl-2,6-dimethylmorfolin.

Dávkování prostředků podle vynálezu při praktickém použití pochopitelně závisí na různých faktorech, například na ošetřované ploše, na zvolené účinné látce, na formě prostředku, na charakteru a rozsahu zamoření a na povětrnostních podmínkách.

Obecně se dosahuje příznivých výsledků při aplikaci dávek odpovídajících 20 až 5000 gramů účinné látky na hektar, s výhodou 100 až 500 g/ha.

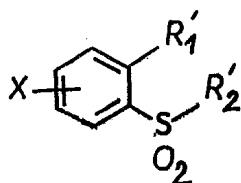
S překvapením bylo zjištěno, že prostředky podle vynálezu mají značně vyšší účinnost proti mšicím v případě, že kromě shora uvedených složek obsahují jednu nebo několik následujících látek:

alifatické nebo naftenové minerální oleje, rostlinné oleje, glykolethery, alkylované benzeny, polyoxyethylenderiváty, močovinu, polymerní pryskyřice, a povrchově aktivní činidla, jako estery polyoxyethylensorbitanu, estery mastných kyselin s polyglykoly, polyoxyethylenderiváty alkylovaných fenolů, polyoxyethylen-alkylethery nebo kvartérní amoniové sloučeniny.

Jako příklady přísad vhodných k tomuto účelu je možno uvést látky popsané v příkladu 14. Používané přísady pochopitelně nesmějí být vůbec nebo alespoň nijak výrazněji fytotoxické. Mírná fytotoxicita přísady nemusí být na závadu v případě, že prostředek rovněž obsahuje malé množství látky snižující fytotoxicitu, jako například tuku z ovčí vlny, alkoholu tuku z ovčí vlny, mastné kyseliny tuku z ovčí vlny nebo esteru mastného alkoholu tuku z ovčí vlny nebo mastné kyseliny tuku z ovčí vlny. Množství výše zmíněných přísad se může pohybovat v širokých mezích, v závislosti na dané aplikaci, a obvykle se pohybuje mezi 10 a 10 000 ml/ha.

Sloučeniny podle vynálezu jsou novými látkami, které je možno připravovat způsobem o sobě známým pro syntézu příbuzných sloučenin.

Kromě shora popsaných prostředků k potírání mšic je předmětem vynálezu rovněž způsob výroby účinných látek odpovídajících obecnému vzorci



ve kterém

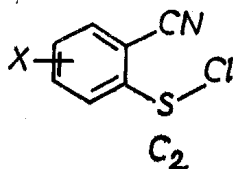
X znamená atom halogenu, fenoxyskupinu nebo alkylovou či alkoxylovou skupinu obsahující vždy 1 až 4 atomy uhlíku a popřípadě substituovanou halogenem,

R_1' představuje kyanoskupinu a

R_2' znamená aminoskupinu, která může být popřípadě substituována jednou nebo dvěma alkenylovými nebo alkinylovými skupinami obsahujícími vždy 2 až 6 atomů uhlíku, nebo jednou či dvěma alkylovými skupinami s 1 až 6 atomy uhlíku, kteréžto alkylové skupiny mohou společně s dusíkovým atomem, na který jsou navázány, tvořit nasycený heterocyklický kruh, jenž může rovněž obsahovat druhý heteroatom vybraný ze skupiny obsahující dusík, kyslík a síru, nebo kteréžto alkylové skupiny mohou být substituovány alkoxykupinou s 1 až 4 atomy uhlíku nebo dialkylaminoskupinou se 2 až 6 atomy uhlíku, přičemž alkylové skupiny této dialkylaminoskupiny mohou společně s dusíkovým atomem, na který jsou navázány, tvořit nasycený heterocyklický kruh, nebo

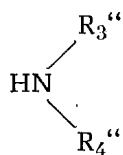
R_1' a R_2' společně tvoří 1-amino-2-azavinolenovou skupinu, nebo

R_1' a R_2' společně tvoří 1-imino-2-azaethylenovou skupinu, v níž je dusíkový atom v kruhu substituován alkylovou nebo alkenylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, vyznačující se tím, že se sloučenina obecného vzorce



ve kterém

X má shora uvedený význam, nechá reagovat s aminem obecného vzorce

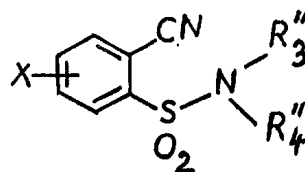


ve kterém

každý ze symbolů R_3'' a R_4'' , které mohou být stejné nebo rozdílné, znamená vždy atom vodíku, alkenylovou nebo alkinylovou skupinu se 2 až 6 atomy uhlíku, alkylovou skupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, popřípadě substituovanou alkoxykupinou s 1 až 4 atomy uhlíku nebo dialkylaminoskupinou se 2 až 6 atomy uhlíku, přičemž alkylové skupiny této dialkylaminoskupiny mohou popřípadě tvořit, společně s dusíkovým atomem, na který jsou navázány, nasycený heterocyklický kruh.

K této reakci se vychází amin nasazuje v alespoň dvojnásobném molárním množství, vztaheno na chlorid kyseliny, takže současně váže vznikající chlorovodík. Reakce se s výhodou provádí v polárním organickém rozpouštědle inertním vůči reakčním složkám, například v alkoholu (jako ethanolu), etheru (například diethyletheru), dimethylformamidu, acetonitrilu nebo vodě (za předpokladu, že používaný chlorid kyseliny je dostatečně odolný vůči hydrolýze za použitých reakčních podmínek), nebo ve směsi těchto rozpouštědel. Reakce se provádí při teplotě mezi 0 °C a teplotou varu rozpouštědla, s výhodou při teplotě mezi 0 °C a teplotou místnosti. Pokud se jako výchozí amin použije amoniak nebo primární amin, je žádoucí pracovat při teplotě zhruba 0 °C, aby se snížila možnost průběhu nežádoucích následných reakcí.

Sloučenina získaná shora popsanou reakcí, odpovídající obecnému vzorci



se pak popřípadě, pokud oba symboly R_3'' a R_4'' znamenají atomy vodíku, může podrobit reakci s chlornanem nebo bromnanem za vzniku odpovídající sloučeniny, v níž oba symboly R_3'' a R_4'' představují atomy chlóru nebo bromu. Je-li to žádoucí, může se tato sloučenina, po konverzi na N-monoderivát s alkalickým kovem, podrobit reakci s dialkylsulfoxidem, jehož alkylové skupiny obsahují vždy 1 až 4 atomy uhlíku, za vzniku sloučeniny posledně uvedeného obecného vzorce, v němž R_3'' a R_4'' společně s dusíkovým atomem, na který jsou navázány, tvoří S,S-dialkylsulfoximidoskupinu.

Reakce s chlornanem nebo bromnanem, s výhodou s chlornanem nebo bromnanem alkalického kovu, například s chlornanem či bromnanem sodným, se provádí ve vodě nebo ve směsi vody a rozpouštědla mísitelného s vodou, při teplotě mezi 0 °C a 100 stupňů Celsia nebo teplotou varu rozpouštědla, s výhodou při teplotě místnosti.

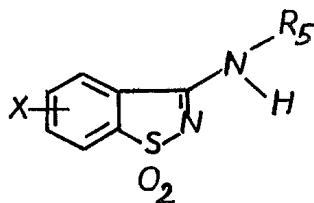
Konverze na N-monoderivát s alkalickým kovem, například na příslušný sodný de-

rivát, se provádí působením vodného roztoku hydroxidu alkalického kovu při teplotě mezi teplotou místnosti a 100 °C.

Reakce s dialkylsulfoxidem, například s dimethylsulfoxidem, se provádí při teplotě pohybující se mezi teplotou místnosti a teplotou varu rozpouštědla. Obecně se dialkylsulfoxid, působící jako reakční činidlo, používá rovněž jako rozpouštědlo. Reakci je možno katalyzovat vhodným katalyzátorem, například chloridem měďnatým.

Další sloučeniny, které lze používat jako účinné látky v prostředcích podle vynálezu, je možno připravit níže popsanými postupy, jež netvoří předmět vynálezu.

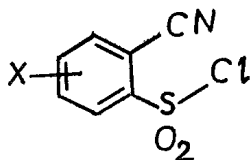
Sloučeniny obecného vzorce



ve kterém

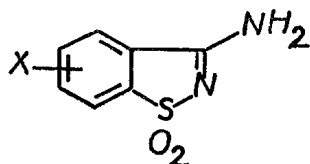
X má shora uvedený význam a

R₅ představuje atom vodíku, cykloalkylkarbamoylovou skupinu se 4 až 8 atomy uhlíku, alkylkarbamoylovou skupinu se 2 až 5 atomy uhlíku, dialkylaminoskupinu obsahující v každé alkylové části vždy 1 až 4 atomy uhlíku nebo alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, popřípadě substituovanou hydroxylovou skupinou nebo jedním či několika atomy halogenů, je možno připravit dvěma způsoby, a to tak, že se a) sloučenina obecného vzorce



ve kterém

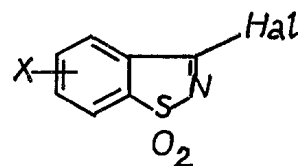
X má shora uvedený význam, nechá reagovat s amoniakem a výsledný produkt obecného vzorce



ve kterém

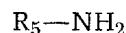
X má shora uvedený význam, se popřípadě podrobí reakci s cykloalkylisokyanátem se 4 až 8 atomy uhlíku, s alkylisokyanátem se 2 až 5 atomy uhlíku, s N,N-dialkylhydrazinem obsahujícím v každé alkylové části vždy 1 až 4 atomy uhlíku nebo s alkylami-

nem, v němž alkylová skupina obsahuje 1 až 4 atomy uhlíku a je popřípadě substituovaná hydroxyskupinou nebo jedním či několika atomy halogenů, nebo že se b) sloučenina obecného vzorce



ve kterém

X má shora uvedený význam a Hal představuje atom halogenu, nechá reagovat s aminem obecného vzorce



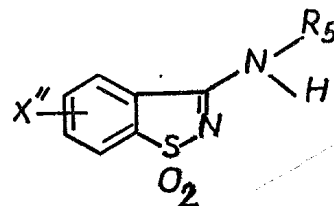
ve kterém

R₅ má shora uvedený význam.

Reakce s amoniakem, uvedená výše v odstavci a), se s výhodou provádí v polárním organickém rozpouštědle, například v etheru (jako diethyletheru nebo dioxanu), v alkoholu (například ethanolu), v dimethylformamidu, acetonitrilu nebo vodě, nebo ve směsi polárního organického rozpouštědla a vody, při teplotě místnosti nebo při zvýšené teplotě, například při teplotě varu použitého rozpouštědla. Následující reakce s aminem nebo hydrazinem, popsaná v odstavci a), se s výhodou provádí za stejných reakčních podmínek. Následující reakce s isokyanátem, popsaná v odstavci a), se s výhodou provádí v polárním organickém rozpouštědle, například v acetonitrilu nebo etheru, jako v diethyletheru, v přítomnosti silné organické báze, například triethylaminu, při teplotě mezi 0 °C a teplotou varu použitého rozpouštědla.

Reakce popsaná výše v odstavci b) se s výhodou provádí v polárním organickém rozpouštědle, například v acetonitrilu, dimethylformamidu, etheru (jako diethyletheru), alkoholu (například etheralkoholu) nebo ve vodě, nebo ve směsi těchto rozpouštědel, při teplotě mezi 0 °C a teplotou místnosti, s výhodou při teplotě zhruba 0 °C.

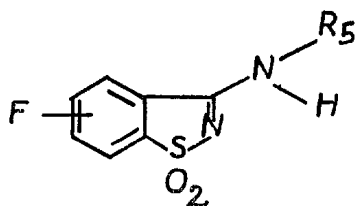
Sloučeniny obecného vzorce



ve kterém

X'' znamená fenoxyskupinu nebo alkoxy skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku, popřípadě substituovanou halogenem, a

R_5 má shora uvedený význam, lze rovněž připravit tak, že se sloučenina obecného vzorce

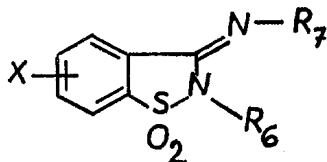


ve kterém

R_5 má shora uvedený význam, nechá reagovat s fenolem či alkoholem obsahujícím 1 až 4 atomy uhlíku a popřípadě substituo- vaným halogenem.

Tato reakce se provádí v přítomnosti vhodné báze, například fenoxidu nebo al- koxidu alkalického kovu, v inertním orga- nickém rozpouštědle, například alkoholu nebo acetonitrilu, při teplotě mezi 0 °C a teplotou varu použitého rozpouštědla, s vý- hodou při zvýšené teplotě.

Sloučeniny obecného vzorce

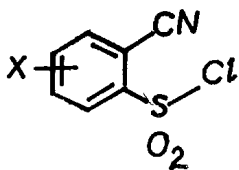


ve kterém

X má shora uvedený význam,

R_6 znamená alkylovou skupinu nebo al- kenylovou skupinu s až 4 atomy uhlíku, a

R_7 představuje atom vodíku nebo fenyl- karbamoylovou skupinu, popřípadě substi- tuovanou alkoxy skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, je možno připravit tak, že se slou- čenina obecného vzorce



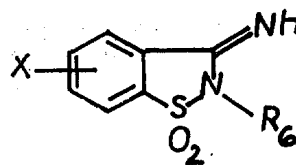
ve kterém

X má shora uvedený význam, nechá rea- govat s aminem obecného vzorce



ve kterém

R_6 má shora uvedený význam, a výsled- ný produkt obecného vzorce



ve kterém

X a R_6 mají shora uvedený význam, se popřípadě podrobí reakci s popřípadě sub- stituo- vaným fenylisokyanátem za vzniku produktu, v němž R_7 představuje fenylkar- bamoylovou skupinu, popřípadě substituo- vanou shora uvedeným způsobem.

Reakce s aminem se s výhodou provádí v polárním organickém rozpouštědle, na- příklad v etheru (jako diethyletheru nebo dioxanu), v alkoholu (jako ethylalkoholu), dimethylformamidu, acetonitrilu nebo vodě (za předpokladu, že používaný chlorid ky- seliny je za reakčních podmínek dostateč- ně stálý vůči hydrolýze), nebo ve směsi těchto rozpouštědel. Reakce se provádí při teplotě mezi 0 °C a teplotou varu použité- ho rozpouštědla, s výhodou při teplotě mezi 0 °C a teplotou místnosti.

Shora popsaná následující reakce s iso- kyanátem se s výhodou provádí v polárním organickém rozpouštědle, například v ace- tonitrilu nebo etheru, jako diethyletheru, při teplotě mezi 0 °C a teplotou varu roz- pouštědla, s výhodou při teplotě místnosti, popřípadě za přítomnosti báze, například triethylaminu nebo natriumhydridu.

Vynález blíže ilustrují následující příkla- dy provedení, jimiž se však rozsah vynále- zu v žádném směru neomezuje.

Příklad 1

Příprava 2-kyan-3-fluor-N-isopropylbenzen- sulfonamidu

K roztoku 5,2 ml isopropylaminu v 50 ml diethyletheru, ochlazenému v ledu, se za míchání a udržování teploty zhruba na 5 stupních Celsia přikape roztok 4,4 g 2-kyan- -3-fluorbenzensulfonylchloridu v 50 ml di- ethyletheru. Reakční směs se nechá 1 ho- dinu stát při teplotě místnosti, pak se dva- krát promyje vodou s ledem, vysuší se bez- vodým síranem sodným a po filtraci se od- paří k suchu. Ve výtěžku 4,16 g se získá žá- daný produkt o teplotě tání 97 až 105 °C.

Analogickým způsobem se, popřípadě za použití ethanolu nebo vody jako rozpouš- tědla, připraví následující sloučeniny:

2-kyan-3-chlorbenzensulfonamid o teplotě tání 184—189 °C,

2-kyan-3-chlor-N-isopropylbenzensulfon- amid o teplotě tání 78 až 82 °C,

- 2-kyan-3-fluorbenzensulfonamid o teplotě tání 163 °C,
 2-kyan-3-chlor-N,N-diallylbenzensulfonamid o teplotě tání 60 °C,
 2-kyan-3-fluor-N,N-diallylbenzensulfonamid o teplotě tání 76 až 78 °C,
 2-kyan-3-fluor-N-(3-methyl-1-butin-3-yl)-benzensulfonamid o teplotě tání 118,5 až 120 °C,
 2-kyan-3-fluor-N,N-dimethylbenzensulfonamid o teplotě tání 86 až 89 °C,
 1-(2-kyan-3-fluorfenyl)sulfonylpiperidin o teplotě tání 99 až 101 °C,
 1-(2-kyan-3-fluorfenyl)sulfonylmorfolin o teplotě tání 136,5 až 138 °C,
 2-kyan-3-methyl-N,N-dimethylbenzensulfonamid o teplotě tání 74 až 77 °C,
 2-kyan-3-methyl-N,N-diallylbenzensulfonamid o teplotě tání 70 až 72 °C,
 2-kyan-3-fluor-N,N-diethylbenzensulfonamid o teplotě tání 85 až 88 °C,
 1-(2-kyan-3-fluorfenyl)sulfonylpyrrolidin o teplotě tání 96 °C,
 2-kyan-5-trifluormethoxy-N,N-dimethylbenzensulfonamid o teplotě tání 100 °C,
 2-kyan-5-chlor-N,N-dimethylbenzensulfonamid o teplotě tání 97 °C a
 2-kyan-3-chlor-N-(2-methoxyethyl)benzensulfonamid o teplotě tání 98 °C.

Příklad 2

Příprava 2-kyan-3-fluor-N,N-dichlorbenzensulfonamidu a S,S-dimethyl-N-(2-kyan-3-fluorfenylsulfonyl)sulfoximidu

a) K 90 ml 10% vodného roztoku chloranu sodného se při teplotě místnosti přidá 7,55 g 2-kyan-3-fluorbenzensulfonamidu připraveného postupem podle příkladu 1, přičemž teplota vystoupí z 22 °C na 24 °C. Reakční směs se 1,5 hodiny míchá při teplotě místnosti, pak se ochladí v ledu a při teplotě cca 10 °C se k ní přidá 16 ml 96% kyseliny octové. Po 10 minutách se pevný materiál odfiltruje, třikrát se promyje vodou a vysuší se ve vakuu nad kyslíčnickem fosforečným. Ve výtěžku 6,15 g se získá 2-kyan-3-fluor-N,N-dichlorbenzensulfonamid o teplotě tání 149 až 152 °C.

b) K 45 ml 2N hydroxidu sodného se za míchání při teplotě 80 °C po částech přidá 5,4 g 2-kyan-3-fluor-N,N-dichlorbenzensulfonamidu, přičemž teplota vystoupí na 90 stupňů Celsia. Po filtraci se filtrát ochladí na -10 °C v chladič lánzi tvořené směsí ledu a methanolu. Vyloučený 2-kyan-3-fluor-N-chlor-N-natriumbenzensulfonamid se odsaje, postupně se dvakrát promyje studeným nasyceným roztokem chloridu sodného a třikrát isopropanolem, a vysuší se. Získá se 1,06 g produktu.

1,0 g 2-kyan-3-fluor-N-chlor-N-natriumbenzensulfonamidu se vnese do suspenze 0,1 g chloridu měďnatého v 5 ml dimethylsulfoxidu. Reakční směs se nejprve 1 hodinu míchá při teplotě místnosti, pak se 1

hodinu zahřívá na parní lázni, načež se vylije do směsi 30 ml vody a 4 ml nasyceného vodného roztoku dihydrátu dvojsodné soli ethylendiamin tetraoctové kyseliny. Po krátkém promíchání se vyloučený pevný produkt odfiltruje, třikrát se promyje vodou a vysuší se ve vakuu nad kyslíčnickem fosforečným. Získá se 0,50 g S,S-dimethyl-N-(2-kyan-3-fluorfenylsulfonyl)sulfoximidu o teplotě tání 184 °C.

Příklad 3

Příprava 3-amino-4-chlorbenzo[d]isothiazol-1,1-dioxidu

K roztoku 11,8 g 2-kyan-3-chlorbenzensulfonylchloridu ve 20 ml dioxanu se při teplotě zhruba 60 °C přidá 12,5 ml 25% amoniaku. Reakční směs se 30 minut zahřívá na parní lázni, pak se ochladí a zředí se vodou. Vyloučený krystalický produkt se odsaje a po promytí vodou se vysuší. Výtěžek žádaného produktu činí 8,9 g. Po překrystalování z ethanolu taje produkt při 261 až 263 °C.

Odpovídajícím způsobem se připraví následující sloučeniny:

- 3-amino-4-fluorbenzo[d]isothiazol-1,1-dioxid taje nad 260 °C,
 3-amino-4-methylbenzo[d]isothiazol-1,1-dioxid o teplotě tání 265 °C,
 3-amino-4-methoxybenzo[d]isothiazol-1,1-dioxid o teplotě tání 270 °C a
 3-amino-4-fenoxybenzo[d]isothiazol-1,1-dioxid o teplotě tání 216 °C.

Tytéž produkty je možno rovněž připravit uváděním plynného amoniaku do roztoku sulfonylchloridu v dioxanu, nebo směsím sulfonylchloridu a amoniaku ve vodě s ledem a následující reakcí těchto složek při teplotě místnosti.

3-amino-4-methoxybenzo[d]isothiazol-1,1-dioxid a 3-amino-4-fenoxybenzo[d]isothiazol-1,1-dioxid je možno rovněž připravit reakcí 3-amino-4-fluorbenzo[d]isothiazol-1,1-dioxidu s methanolem, resp. fenolem v přítomnosti vhodné báze, například alkoxidu nebo fenoxidu sodného, v inertním organickém rozpouštědle, jako v acetonitrilu, za varu pod zpětným chladičem.

Příklad 4

Příprava 3-n-butylamino-4-chlorbenzo[d]isothiazol-1,1-dioxidu

Roztok 2,17 g 3-amino-4-chlorbenzo[d]isothiazol-1,1-dioxidu, připraveného postupem podle příkladu 2, a 2 ml n-butylaminu v 15 ml dioxanu se zhruba 2 hodiny zahřívá k varu pod zpětným chladičem, přičemž uniká amoniak. Po oddestilování rozpouštědla se zbytek rozmíchá s vodou, produkt se odsaje, postupně se promyje vodou a

petroletherem, a vysuší se. Ve výtěžku 2,4 gramu se získá žádaný produkt o teplotě tání 136 až 138 °C.

Odpovídajícím způsobem se připraví následující sloučeniny:

3-(2-chlorethyl)amino-4-chlorbenzo[d]-isothiazol-1,1-dioxid o teplotě tání 184 až 185 °C a

3-(1-hydroxybut-2-yl)amino-4-chlorbenzo[d]isothiazol-1,1-dioxid o teplotě tání 149 stupňů Celsia.

Příklad 5

Příprava 3-(3-cyklohexylureido)-4-chlorbenzo[d]isothiazol-1,1-dioxidu

Roztok 2,17 g 3-amino-4-chlorbenzo[d]-isothiazol-1,1-dioxidu, připraveného postupem podle příkladu 2, 1,3 g cyklohexylisokyanátu a 0,3 ml triethylaminu ve 20 ml acetonitrilu se 4 hodiny zahřívá k varu pod zpětným chladičem. Po ochlazení vykrystaluje z čirého roztoku žádaný produkt tající za rozkladu při 192 °C. Výtěžek činí 2,1 gramu.

Odpovídajícím způsobem se připraví 3-(3-methylureido)-4-chlorbenzo[d]isothiazol-1,1-dioxid o teplotě tání 182 °C.

Příklad 6

Příprava 3-amino-4-chlorbenzo[d]isothiazol-1,1-dioxidu

K 15 ml 25% amoniaku v 15 ml vody s ledem se přidá 4,72 g 3,4-dichlorbenzo[d]-isothiazol-1,1-dioxidu. Reakční směs se 2 hodiny míchá při teplotě místnosti, načež se žádaný produkt odsaje a vysuší. Získá se 4,20 g produktu o teplotě tání 260 °C.

Odpovídajícím způsobem se připraví 3-N',N'-dimethylhydrazino-4-chlorbenzo[d]-isothiazol-1,1-dioxid o teplotě tání 218 °C.

Příklad 7

Příprava 2-methyl-3-imino-4-chlorbenzo[d]isothiazolin-1,1-dioxidu

K roztoku 9 ml methylaminu v cca 15 ml vody, ochlazenému na 0 °C se přidá 7,1 g 2-kyan-3-chlorbenzensulfonfylchloridu.

Reakční směs se 1 hodinu míchá při teplotě 0 až 10 °C, pak se vyloučený pevný materiál odsaje, promyje se vodou a vysuší se na vzduchu. Ve výtěžku 5,5 g se získá žádaný produkt o teplotě tání 140 až 142 °C.

Odpovídajícím způsobem se připraví následující sloučeniny:

2-allyl-3-imino-4-chlorbenzo[d]isothiazolin-1,1-dioxid o teplotě tání 92,5 až 95 °C,
2-methyl-3-imino-4-fluorbenzo[d]isothiazolin-1,1-dioxid o teplotě tání 142 °C,
2-allyl-3-imino-4-fluorbenzo[d]isothiazolin-1,1-dioxid o teplotě tání 101 °C,
2-methyl-3-imino-4-methoxybenzo[d]isothiazolin-1,1-dioxid o teplotě tání 138 °C a
2-ethyl-3-imino-4-fluorbenzo[d]isothiazolin-1,1-dioxid o teplotě tání 110 °C.

Příklad 8

Příprava 2-methyl-3-N-(4-ethoxyfenylkarbamoyl)imino-4-chlorbenzo[d]isothiazolin-1,1-dioxidu

2,3 g 2-methyl-3-imino-4-chlorbenzo[d]isothiazolin-1,1-dioxidu se rozpustí v 15 ml acetonitrilu, k vzniklému čirému roztoku se přidá 1,6 ml 4-ethoxyfenylisokyanátu a reakční směs se nechá přes noc stát při teplotě místnosti. Rozpouštědlo se odpaří za sníženého tlaku při teplotě 30 °C a zbytek se suspenduje v etheru. Po odsátí se ve výtěžku 1,0 g získá žádaný produkt o teplotě tání 147 až 154 °C.

Příklad 9

Sloučeniny podle vynálezu se převedou na vhodné prostředky tak, že se tyto sloučeniny suspendují ve vodě v přítomnosti dispergátoru, jako ligninsulfonátu, nebo/a smáčedla, jako alkylnaftalensulfonátu, alkylsulfátu, alkylbenzensulfonátu, alkylpolyoxyethylenu nebo alkylarylpolyoxyethylenu.

Typický prostředek obsahuje 25 % hmotnostních účinné látky, 2 % hmotnostních alkylnaftalensulfonátu, 5 % hmotnostních ligninsulfonátu a 68 % hmotnostních kaolínu.

Mladé rostliny bobu obecného, o výšce cca 10 cm, se sestříhnou na 2 páry listů a pak se postříkají shora připravenými prostředky o různých koncentracích. Po oschnutí se rostliny zamoří mšicí makovou (*Aphis fabae*) tak, že se na každou rostlinu umístí 10 mšic. Rostliny se pak uchovávají v klimatizované komoře, v níž se udržuje cyklus světlo—tma 18/6 hodin, teplota 20 °C/15 °C a relativní vlhkost 65/70 %. Po 7 dnech se zjistí mortalita mšic. Každý pokus se opakuje čtyřikrát. Dosažené výsledky jsou uvedeny v následující tabulce A. Jednotlivé symboly v této tabulce mají následující významy:

+ = 90 až 100% mortalita
± = 50 až 90% mortalita
— = nižší než 50% mortalita

Tabulka A

sloučenina číslo	účinnost proti mšici makové při koncentraci účinné látky v mg/litr					
	300	100	30	10	3	1
slepý pokus	—					
(1)	+	+	+	+	±	—
(2)	+	+	+	±	—	
(3)	+	+	+	—		
(4)	+	+	+	±	—	
(5)	+	+	+	±	—	
(6)	+	+	+	±	—	
(7)	+	+	+	±	—	
(8)	+	+	+	±	—	
(9)	±	±	±	±	—	
(10)	±	±	±	±	—	
(11)	+	+	±	±	—	
(12)	+	+	+	—		
(13)	+	+	+	±	—	
(14)	+	+	—			
(15)	+	+	±	—		
(16)	+	+	±	—		
(17)	+	+	±	—		
(18)	+	+	±	—		
(19)	±	±	±	—		
(20)	+	+	±	—		
(21)	+	+	±	—		
(22)	+	+	±	—		
(23)	+	±	±	—		
(24)	+	+	—			
(25)	+	+	+			
(26)	+	+	—			
(27)	+	+	±	—		
(28)	+					
(29)	+					
(30)	+					
(31)	+	+	—			
(32)	+	+	±	—		
(33)	+					
(34)	+					
(35)	+					
(36)	+	+	±	—		
(37)	+					

Příklad 10

Mladé rostliny bobu obecného o výšce 15 až 20 cm, pěstované v miskách z plastické hmoty o průměru cca 12 cm se zastříhnou na 3 plně vyvinuté listy a pak se infikují mšicí makovou (*Aphis fabae*) tak, že se na listy pokusných rostlin položí kousky rostlin bobu obecného, silně zamořeného mšicí makovou. Mšice z vadnoucího infikačního materiálu přelezou na čerstvé pokusné rostliny. Po 24 hodinách se nejprve odstraní zvadlé části rostlin, načež se pokus-

né rostliny postříkají od spodu a od vrchu různě koncentrovanými prostředky připravenými postupem podle příkladu 9. Po 6 dnech, kdy se rostliny uchovávají ve skleníku při teplotě 20 až 24 °C, se zjistí mortalita mšic.

Každý test se provádí na 3 rostlinách bobu obecného. Průměrné výsledky jsou uvedeny v následující tabulce B, kde se uvádí mortalita v procentech korigovaná na mortalitu mšic na neošetřených rostlinách bobu obecného.

Tabulka B

sloučenina číslo	účinnost proti mšici makové (mortalita v %) při koncentraci účinné látky v mg/litr				1
	100	30	10	3	
(1)	100	97	47		0
(5)		100	91	13	
(6)		100	92	13	
(7)	100	85	10		
(10)		98	48	4	
(11)		100	84	10	
(16)	86	32	0		
(17)	93	16	0		
(18)	96	27	0		
(19)		100	78	2	
(21)	100	65	10		

Příklad 11

Mladé rostliny bobu obecného pěstované v miskách z plastické hmoty o průměru cca 12 cm, o výšce 15 až 20 cm se analogickým způsobem jako v příkladu 10 zastříhnou a infikují. Po infikaci se rostliny postříkají prostředkem připraveným podle příkladu 8, obsahujícím 3-amino-4-chlorbenzo[d]-

isothiazol-1,1-dioxid (sloučenina č. 1) v různých koncentracích (každá koncentrace se zkouší na 3 rostlinách). Misky se nechají stát na vzduchu a za 3 až 7 dnů se zjistí mortalita mšic. Dosažené výsledky jsou uvedeny v tabulce C, kde se uvádí mortalita v %, korigovaná na mortalitu mšic na neošetřených rostlinách bobu obecného.

Tabulka C

počet dnů po postřiku	účinnost proti mšici makové (mortalita v %) při koncentraci účinné látky v mg/litr			
	100	30	10	3
3	95	0	0	0
7	100	95	70	0

Příklad 12

Níže popsaným způsobem se stanoví systemická účinnost 3-amino-4-chlorbenzo[d]isothiazol-1,1-dioxidu (sloučenina č. 1).

Mladé rostliny bobu obecného o výšce 15 až 20 cm, pěstované v miskách o průměru zhruba 12 cm (plocha půdy v každé misce cca 100 cm²), se ve skleníku ošetří následujícím způsobem. Půda v každé misce se zalije 50 ml vody, do které bylo přidáno příslušné množství testované sloučeniny. Po infikaci rostlin způsobem popsa-

ným v příkladu 10 (vynechává se sestřihování rostlin) se pak zjištěním mortality mšic v procentech za 6 dnů po infikaci stanoví účinnost testované látky, která je rostlinou přejímána z půdy prostřednictvím kořenů. Dosažené výsledky jsou uvedeny v následující tabulce D (hodnoty jsou korigovány na mortalitu mšic na neošetřených rostlinách). Jak vyplývá z tabulky D, byla zjištěna zajímavá residuální účinnost v případě, že infikace byla provedena až za 5, resp. 7 týdnů po ošetření prostředkem obsahujícím testovanou sloučeninu.

Tabulka D

počet týdnů mezi ošetřením a infikací	účinnost proti mšici makové (mortalita v %) při koncentraci účinné látky v mg/litr			
	10	3	1	0,3
0	100	96	80	20
5	99	82		
7	92	20		

Zjištěná systemická účinnost je odborníky pokládána za velmi důležitou.

Příklad 13

3-amino-4-chlorbenzo[d]isothiazol-1,1-dioxid (sloučenina č. 1) se na malých pokusných políčkách testuje co do účinnosti proti mšici makové (*Aphis fabae*) na bobu obecném, a to tak, že se účinné prostředky zapraví do horní vrstvy půdy. Účinná lát-

ka se používá ve formě suspenze popsané v příkladu 9. Za 6 dnů po infekci rostlin se pokus vyhodnotí. Výsledky jsou uvedeny v tabulce E ve formě mortality v %, přičemž uvedené hodnoty jsou korigovány na mortalitu mšic na neošetřených rostlinách. Jak vyplývá z tabulky, může být infekce posunuta bez potíží alespoň po dobu 7 týdnů po ošetření.

Tabulka E

dávka účinné látky (mg/ /0,25 m ²)	účinnost proti <i>Aphis fabae</i> (% mortality)							
	0	1	2	3	4	5	6	7
2000	90	98	100	98	100	100	100	100
1000	87	90	100	90	100	96	93	100
500	90	90	100	100	100	97	99	99

Příklad 14

Postupem popsaným v příkladu 10 se zjišťuje účinek přídatku minerálních olejů, jako alifatického uhlovodíku Sunoil 7 N (a) a naftenického uhlovodíku Sunoil 91 N (b), rostlinného oleje, jako oleje z bavlníkových semen (c), glykoletheru, jako preparátu trioxitol (d), alkylbenzeny, jako preparátu Dobane (e), esteru polyoxyethylensorbitanu, jako polyoxyethylensorbitan-monoolátu (Tween 80) (f), polyoxyethylensorbitan-monolaurátu (Tween 21) (v) a polyoxyethylen-sorbitan-monolaurátu (Tween 22) (w), polyglykolesteru masné kyseliny, jako preparátu Emulsogen EL (g), polyoxyethylen-derivátu alkylovaného fenolu, jako polyoxyethylenovaného isooktylfenolu (Citowett), (h), polyoxyethylenovaného nonylfenolu

(Agral LN) (i), (Arkopal N 060) (j), (Arkopal N 090) (k), (Arkopal N 130) (l) a (Arkopal N 150) (m), polyoxyethylenovaného tributylfenolu (Sapogenat T 060) (n) a (Sapogenat T 180) (o), polyoxyethylen-alkyl-etheru, jako polyoxyethylen-lauryletheru (Brij 30) (p), polyethylenglykolderivátu jako preparátu Carbowax 600 (q), močoviny (r), kvartérní amoniové sloučeniny, jako preparátu Aliquat 221 (s), směsi minerálního oleje a povrchově aktivního činidla, jako preparátu Atplus 411 F (t) a polymerní pryskyřice s kondenzačními činidly, jako preparátu Atplus 536 (u), na účinnost 3-amino-4-chlorbenzo[d]isothiazol-1,1-dioxidu (sloučenina č. 1) proti mšicím. Výsledky uvedené v tabulce F (mortalita v %) byly zjištěny při vyhodnocování za 1 (6) dnů po ošetření rostlin.

Tabulka F

účinnost proti mšicím (mortalita v %)

přísada	mg/litr	koncentrace účinné látky (mg/litr)			
		30	10	3	1
—	—	21 (92)	11 (43)	0 (7)	— —
(a)	5000	47 (100)	40 (100)	5 (98)	— —
	2500	43 (100)	27 (100)	17 (95)	8 (77)
(b)	500	— —	3 (96)	0 (67)	0 (20)
(c)	500	— —	23 (98)	0 (60)	0 (20)
(d)	5000	37 (99)	17 (97)	2 (62)	— —
(e)	2500	88 (100)	80 (99)	63 (98)	— —
(f)	500	— —	43 (100)	7 (33)	— —
(g)	500	— —	27 (100)	3 (10)	— —
(h)	500	— —	73 (98)	13 (47)	0 (7)
(i)	500	— —	57 (99)	3 (37)	— —
	1000	— —	70 (99)	20 (50)	— —
(j)	500	— —	96 (100)	30 (90)	0 (23)
(k)	500	— —	93 (100)	2 (87)	0 (17)
(l)	500	— —	80 (100)	3 (90)	0 (7)
(m)	500	— —	75 (100)	0 (90)	— —
(n)	500	— —	98 (100)	43 (80)	3 (7)
(o)	500	— —	92 (100)	33 (82)	0 (7)
(p)	500	— —	87 (100)	57 (63)	20 (20)
(q)	500	— —	0 (96)	0 (13)	— —
(r)	500	— —	3 (67)	— —	— —
(s)	500	— —	90 (99)	33 (47)	— —
(t)	500	— —	80 (99)	27 (77)	0 (20)
(u)	500	— —	90 (96)	20 (27)	— —
(v)	500	— —	47 (99)	10 (27)	— —
(w)	500	— —	33 (100)	0 (27)	— —

V nepřítomnosti testované účinné látky vykazují samotné níže uvedené přísady následující hodnoty mortality (%) při hodnocení prováděném po 1 (6) dnech:

preparát a koncentrace	mortalita v % [1 (6) dnů]
Sunoil 7N	5000 ppm
Sunoil 7N	2500 ppm
Trioxitol	5000 ppm
Dobane	2500 ppm
Arkopal N 090	500 ppm
	5 (23)
	0 (7)
	0 (0)
	0 (0)
	0 (0)

Příklad 15

Postupem popsaným v příkladu 11 se testuje účinek menších přídavek preparátu Sunoil 7N na účinnost 3-amino-4-chlorben-

zo[d]isothiazol-1,1-dioxidu (sloučenina č. 1) proti mšici makové (*Aphis fabae*). Výsledky uvedené v tabulce G (mortalita v %) byly zjištěny při vyhodnocování pokusu za 6 dnů po ošetření.

Tabulka G

účinnost proti mšicím (mortalita v %)

přísada (mg/litr)	koncentrace účinné látky (mg/litr)			
	30	10	3	1
—	100	94	23	
Sunoil 7N (2500)	100	100	100	90
Sunoil 7N (500)	100	100	94	37
Sunoil 7N (100)	100	99	93	57

Příklad 16

Mladé rostliny bramboru o výšce zhruba 15 cm se infikují mšicí broskvoňovou (*Myzus persicae*) stejným způsobem, jaký je popsán v příkladu 10 pro infekci mšicí makovou. Po infekci se pokusné rostliny postříkají od spodu a od vrchu různě koncentrovaným prostředkem připraveným podle příkladu 9. Každá koncentrace se zkouší na 3 rostlinách. Používaný prostředek obsahuje jako účinnou látku 3-amino-4-chlorbenzo[d]isothiazol-1,1-dioxid (sloučenina č. 1). Po 6 dnech, kdy se rostliny uchovávají ve

skleníku při teplotě 20 až 24 °C, se vyhodnotí mortalita mšic.

Průměrné výsledky jsou uvedeny v následující tabulce H, v níž jsou uvedené hodnoty mortality v procentech korigovány na mortalitu mšic na neošetřených rostlinách bramboru.

Byl rovněž testován účinek několika přísad na aktivitu shora uvedené účinné látky proti mšicím. Dosažené výsledky jsou uvedeny v tabulce H. Označení přísad písmeny v této tabulce odpovídá označování používanému v příkladu 14.

Tabulka H

účinnost proti *Myzus persicae* (mortalita v %)

přísada	mg/litr	koncentrace 30	účinné látky 10	(mg/litr) 3
—	—	95	70	—
(k)	500	100	97	40
(l)	500	100	99	40
(i)	1000	100	99	43
(h)	500	100	100	67
(p)	500	100	100	80

Příklad 17

Stejným postupem jako v příkladu 11 se zjišťuje účinnost 3-amino-4-chlorbenzo[d]isothiazol-1,1-dioxidu (sloučenina č. 1) proti mšici makové (*Aphis fabae*). Testy se provádějí na rostlinách bobu obecného ve volné přírodě, jak je popsáno v příkladu 11.

Zjišťuje se rovněž účinek některých přísad (viz příklady 14 a 16).

Výsledky, zjišťované za 6 6dnů po ošetření rostlin jsou uvedeny v následující tabulce K jako mortalita v %. Označení přísad písmeny odpovídá označování používanému v příkladu 14.

Tabulka K

účinnost proti *Aphis fabae* (mortalita v % po 6 dnech)

přísada	mg/litr	koncentrace 30	účinné látky (mg/litr) 10	3
—	—	100	99	63
(p)	250		100	91
(m)	250		100	83
(h)	250		100	89
(a)	250		100	97

Příklad 18

Stejným postupem jako v příkladu 10 se testuje účinnost 3-amino-4-chlorbenzo[d]isothiazol-1,1-dioxidu (sloučenina č. 1) ve formě několika různých prostředků proti mšici makové (*Aphis fabae*).

Testované prostředky se připravují známými postupy, jak je popsáno výše. K testu se používají následující prostředky:

suspenze A sestávající ze 7 hmotnostních dílů ligninsulfonátu, 3 hmotnostních dílů účinné látky, přičemž tato směs se ředí vodou na žádanou koncentraci;

kapalina B sestávající z 10 % hmotnostních účinné látky, 20 % hmotnostních po-

lyoxyethylenovaného alkylfenolu a 70 % hmotnostních dimethylformamidu;

kapalina C sestávající z 10 % hmotnostních účinné látky, 20 % hmotnostních polyoxyethylenovaného alkylfenolu a 70 % hmotnostních N-methylpyrrolidonu;

smáčitelný prášek D sestávající z 25 % hmotnostních účinné látky, 2 % hmotnostních alkylnaftalensulfonátu, 5 % hmotnostních ligninsulfonátu a 68 % hmotnostních kaolinu.

Po 6 dnech, kdy se rostliny uchovávají ve skleníku, se zjistí mortalita mšic. Dosažené výsledky jsou uvedeny v následující tabulce L.

Tabulka L

účinnost proti *Aphis fabae* (mortalita v % po 6 dnech)

prostředek	koncentrace účinné látky (mg/litr)		
	30	10	3
suspenze A	97	47	7
kapalina B	100	97	0
kapalina C	100	96	17
smáčitelný prášek D	97	67	17

Příklad 19

Analogickým postupem jako v příkladu 11 se testuje účinnost 3-amino-4-chlorbenzo[d]isothiazol-1,1-dioxidu (sloučenina č. 1) ve formě různých prostředků, proti mšici makové (*Aphis fabae*).

K testu se používají následující prostředky:

smáčitelný prášek F sestávající z 25 % hmotnostních účinné látky, 2 % hmotnost-

ních alkylnaftalensulfonátu, 5 % hmotnostních ligninsulfonátu a 68 % hmotnostních kaolinu;

kapalina G sestávající z 10 % hmotnostních účinné látky, 20 % hmotnostních polyoxyethylenovaného alkylfenolu a 70 % hmotnostních dimethylformamidu.

Po 6 dnech, kdy se rostliny uchovávají ve volné přírodě, se zjistí mortalita mšic. Dosažené výsledky jsou uvedeny v následující tabulce M.

Tabulka M

účinnost proti *Aphis fabae* (mortalita v % po 6 dnech)

prostředek	koncentrace účinné látky (mg/litr)		
	30	10	3
smáčitelný prášek F	100	99	63
kapalina G	100	100	63

Příklad 20

Postupem popsaným v příkladu 12 se testuje systemická účinnost několika různých prostředků obsahujících jako účinnou složku 3-amino-4-chlorbenzo[d]isothiazol-1,1-dioxid (sloučenina č. 1) proti mšici makové (*Aphis fabae*). Testované prostředky se aplikují tak, že se smísí s půdou. Za dva týdny po ošetření půdy se rostliny infikují způsobem popsaným v příkladu 10. Za 6 dnů po infikaci se zjistí mortalita mšic. Vždy po 1 týdnu se infikace opakuje a vždy na 6 dnů po této další infikaci se provede další vyhodnocení.

K testu se používají následující prostředky:

suspenze H sestávající z 1 hmotnostního dílu polyoxyethylensorbitan-monooleátu, 2 hmotnostních dílů ligninsulfonátu a 7 hmotnostních dílů účinné látky, kterážto směs se ředí vodou na žádanou koncentraci;

smáčitelný prášek I sestávající z 25 % hmotnostních účinné látky, 2 % hmotnostních alkylnaftalensulfonátu, 5 % hmotnostních ligninsulfonátu a 68 % hmotnostních kaolinu;

granulát J sestávající z 2,5 % hmotnostních účinné látky, 7,5 % hmotnostních kaolinu, 6,7 % hmotnostních ligninsulfonátu a 83,3 % hmotnostních granulovaného silikátu;

granulát K sestávající z 2,5 % hmotnostních účinné látky, 7,5 % hmotnostních kaolinu, 5 % hmotnostních polyvinylacetátu a 85 % hmotnostních granulovaného silikátu;

granulát L sestávající z 2,5 % hmotnostních účinné látky, 7,5 % hmotnostních kaolinu, 5 % hmotnostních křemičitanu sodného a 85 % hmotnostních granulovaného silikátu.

Dosažené výsledky jsou uvedeny v následující tabulce N.

Tabulka N

účinnost proti *Aphis fabae* (mortalita v % při opakované infekci po níže uvedeném počtu týdnů po ošetření půdy, po vyhodnocení prováděném po následujících 6 dnech)

prostředek	mg účinné látky/ /květináč	počet týdnů												
		1	2	3	4	5	6	7	8	9	10	11	12	13
suspenze H	1	100		100	100	100	100	100	98	85	63	33	0	
suspenze H	3	100		100	100	100	100	100	100	100	94	91	77	52
smáčitelný prášek I	1	100		100	99	99	100	98	95	73	53	23	10	
smáčitelný prášek I	3	100		100	100	100	100	100	100	99	96	93	85	63
granulát J	1	100		100	100	100	100	100	99	70	40	23	7	
granulát J	3	100		100	100	100	100	100	100	100	99	98	90	75
granulát K	1	100		100	100	99	99	99	97	80	67	37	7	
granulát K	3	100		100	100	100	100	100	100	99	96	93	83	50
granulát L	1	100		100	100	100	100	99	99	83	70	53	20	
granulát L	3	100		100	100	100	100	100	100	99	94	93	88	70

Příklad 21

Testy popsané v příkladu 20 se opakují v polních podmínkách. Jako pokusná rostlina se používá bob obecný, jako pokusný hmyz mšice maková (*Aphis fabae*) a jako účinná látka 3-amino-4-chlorbenzo[d]isothiazol-1,1-dioxid (sloučenina č. 1). Po každém vizuálním vyhodnocení a před každou ná-

sledující opětnou infekcí se rostliny zbaví mšic. Ošetření půdy se provádí tak, že se testovaný prostředek zaryje 10 cm hluboko do půdy.

Dosažené výsledky jsou uvedeny v následující tabulce O. Je třeba poznamenat, že během shora popsaných testů byly velice špatné povětrnostní podmínky (bylo mimořádně vlhko).

Tabulka O

účinnost proti *Aphis fabae* (mortalita v % při opakované infekci po níže uvedeném počtu týdnů po ošetření půdy, po vyhodnocení prováděném po následujících 6 dnech)

prostředek	kg účinné látky/ha	počet týdnů		
		1	3	5
smáčitelný prášek I	10	99	100	83
smáčitelný prášek I	3	99	63	10
smáčitelný prášek I	1	27	27	0
granulát J	10	100	100	88
granulát J	3	98	63	13
granulát J	1	50	30	0

Příklad 22

Analogickým postupem, jaký je popsán v příkladu 10 pro infekci mšicí makovou, se mladé rostliny bavníku o výšce cca 10 cm infikují mšicí *Aphis gossypii*. Po infekci se pokusné rostliny od spodu a od vrchu postříkají prostředkem připraveným podle příkladu 9, obsahujícím jako účinnou látku 3-amino-4-chlorbenzo[d]isothiazol-1,1-dio-

xid (sloučenina č. 1) v různých koncentracích, a přísadu. Po 6 dnech, kdy se rostliny udržují v klimatizované komoře při teplotě 20 °C, se zjistí mortalita mšic. Dosažené výsledky jsou uvedeny v tabulce P. Stejně jako ve všech dalších testech jsou uváděné výsledky korigovány na mortalitu zjištěnou u neošetřených rostlin. Přísady používané v tabulce P jsou označovány stejnými písmeny jako v příkladu 14.

Tabulka P

účinnost proti *Aphis gossypii* (mortalita v %)

přísada	mg/litr	koncentrace účinné látky (mg/litr)			
		100	30	10	3
(h)	250	100	100	100	100
(i)	250	100	100	100	70

Příklad 23

Mladé rostliny bobu obecného, vysoké zhruba 10 cm, se analogickým způsobem jako v příkladu 10 infikují kyjatkou *Acyrtosiphon pisum* a pak se ošetří postupem popsaným v příkladu 22. Jako účinná látka se

používá 3-amino-4-chlorbenzo[d]isothiazol-1,1-dioxid (sloučenina č. 1).

Po 5 dnech, kdy se rostliny udržují v klimatizované komoře při teplotě 20 °C, se zjistí mortalita mšic. Dosažené výsledky jsou uvedeny v následující tabulce Q.

Tabulka Q

účinnost proti *Acyrtosiphon pisum* (mortalita v %)

přísada	mg/litr	koncentrace účinné látky (mg/litr)		
		30	10	3
—	—	28	20	8
Agral LN	250	97	74	60
Arkopal N 150	250	97	57	0

Samotné přísady Agral LN a Arkopal N 150, aplikované ve shora uvedených množstvích, způsobují po 5 dnech, 5%, resp. 0% mortalitu.

Příklad 24

Mladé rostliny ovsa, vysoké zhruba 15 cm, se analogickým postupem jako v příkladu

10 infikují kyjatkou osenní (*Sitobion avenae*), načež se postupem popsaným v příkladu 22 ošetří. Jako účinná látka se používá 3-amino-4-chlorbenzo[d]isothiazol-1,1-dioxid (sloučenina č. 1).

Po 6 dnech, kdy se rostliny udržují v klimatizované komoře při teplotě 20 °C, se zjistí mortalita mšic. Dosažené výsledky jsou uvedeny v následující tabulce R.

Tabulka R

účinnost proti *Sitobion avenae* (mortalita v %)

přísada	mg/litr	koncentrace účinné látky (mg/litr)			
		100	30	10	3
Agral LN	250	100	100	100	71
Citowett	250	92	97	100	55

Samotné přísady Agral LN a Citowett, aplikované ve shora uvedených množstvích, způsobují po 6 dnech 6%, resp. 11% mortalitu.

Příklad 25

Mladé rostliny růžičkové kapusty, vysoké zhruba 10 cm, se analogickým postupem

jako v příkladu 10 infikují mšicí zelnou (*Brevicoryne brassicae*), načež se ošetří postupem popsaným v příkladu 22. Jako účinná látka se používá 3-amino-4-chlorbenzo[d]isothiazol-1,1-dioxid (sloučenina č. 1).

Po 6 dnech, kdy se rostliny udržují v klimatizované komoře při teplotě 20 °C, se zjistí mortalita mšic. Dosažené výsledky jsou uvedeny v následující tabulce S.

Tabulka S

účinnost proti *Brevicoryne brassicae* (mortalita v % po 6 dnech)

přísada	mg/litr	koncentrace účinné látky (mg/litr)				
		100	30	10	3	1
Citowett	250	92	58	39	23	5

Příklad 26

Mladé rostliny bramboru, vysoké zhruba 15 cm, se analogickým způsobem jako v příkladu 16 infikují mšicí broskvoňovou (*Myzus persicae*). Účinnost proti mšicím se zjišťuje ve volné přírodě způsobem popsaným v příkladu 10. Jako účinná látka se používá 3-amino-4-chlorbenzo[d]isothiazol-1,1-dio-

xid (sloučenina č. 1). Testuje se rovněž účinek několika přísad, specifikovaných v předcházejících příkladech.

Po 6 dnech po ošetření rostlin se zjistí mortalita mšic. Zjištěné výsledky jsou uvedeny v tabulce T. Písmena používaná v tabulce T k označování jednotlivých přísad odpovídají písmenům používaným v příkladu 14.

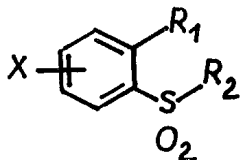
Tabulka T

účinnost proti *Myzus persicae* (mortalita v proc. po 6 dnech)

přísada	mg/litr	koncentrace účinné látky (mg/litr)		
		30	10	3
—	—	96	92	53
(p)	250	—	98	85
(m)	250	—	99	63
(h)	250	—	96	87
(a)	250	—	99	60

PŘEDMĚT VYNÁLEZU

1. Prostředek k potírání mšic, vyznačující se tím, že kromě pevného nebo kapalného inertního nosného materiálu a popřípadě pomocných látek obsahuje jako účinnou látku sloučeninu obecného vzorce



ve kterém

X znamená atom halogenu, fenoxyskupinu nebo alkylovou či alkoxylovou skupinu obsahující vždy 1 až 4 atomy uhlíku a popřípadě substituovanou halogenem,

R_1 představuje kyanoskupinu a

R_2 znamená aminoskupinu, která může být popřípadě substituována halogenem, jednou nebo dvěma alkenylovými nebo alkinylovými skupinami obsahujícími vždy 2 až 6 atomů uhlíku, nebo jednou či dvěma alkylovými skupinami s 1 až 6 atomy uhlíku, kteréžto alkylové skupiny mohou společně s dusíkovým atomem, na který jsou navázány, tvořit nasycený heterocyklický kruh, jenž může rovněž obsahovat druhý heteroatom vybraný ze skupiny obsahující dusík, kyslík a síru, nebo kteréžto alkylové skupiny mohou být substituovány alkoxykupinou s 1 až 4 atomy uhlíku nebo dialkylaminoskupinou se 2 až 6 atomy uhlíku, přičemž alkylové skupiny této dialkylaminoskupiny mohou společně s dusíkovým atomem, na který jsou navázány, tvořit nasycený heterocyklický kruh, nebo

R_1 a R_2 společně tvoří S,S-dialkylsulfoximidoskupinu, v níž jednotlivé alkylové skupiny obsahují 1 až 4 atomy uhlíku, nebo 1-amino-2-azavinylenovou skupinu, v níž může být aminoskupina popřípadě substituována cykloalkylkarbamoylovou skupinou se 4 až 8 atomy uhlíku, alkyلكarbamoylovou skupinou se 2 až 5 atomy uhlíku, dialkylaminoskupinou obsahující v každé alkylové části vždy 1 až 4 atomy uhlíku, nebo alkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, popřípadě substituovanou hydroxyskupinou nebo atomem halogenu, nebo

R_1 a R_2 společně tvoří 1-imino-2-azaethylenovou skupinu, v níž je dusíkový atom v kruhu substituován alkylovou nebo alkenylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, a v níž může být iminoskupina substituována fenyلكarbamoylovou skupinou, popřípadě substituovanou alkoxykupinou s 1 až 4 atomy uhlíku.

2. Prostředek podle bodu 1, vyznačující se tím, že jako účinnou látku obsahuje sloučeninu shora uvedeného obecného vzorce, ve kterém

X je navázán v poloze 3 benzenového kruhu a znamená atom halogenu nebo methylovou skupinu,

R_1 představuje kyanoskupinu a

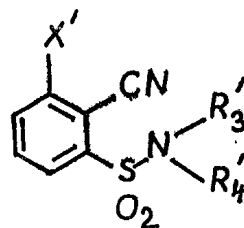
R_2 znamená aminoskupinu, která může být popřípadě substituována jednou nebo dvěma alkenylovými nebo alkinylovými skupinami, obsahujícími vždy 2 až 6 atomů uhlíku, nebo jednou či dvěma alkylovými skupinami s 1 až 6 atomy uhlíku, kteréžto alkylové skupiny mohou společně s dusíkovým atomem, na který jsou navázány, tvořit nasycený heterocyklický kruh, jenž může rovněž obsahovat druhý heteroatom vybraný ze skupiny zahrnující dusík, kyslík a síru, nebo

R_1 a R_2 společně tvoří 1-amino-2-azavinylenovou skupinu, v níž může být aminoskupina popřípadě substituována cykloalkylkarbamoylovou skupinou se 3 až 8 atomy uhlíku, alkyلكarbamoylovou skupinou se 2 až 5 atomy uhlíku nebo alkylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, popřípadě substituovanou atomem halogenu, nebo

R_1 a R_2 společně tvoří 1-imino-2-azaethylenovou skupinu, v níž je dusíkový atom v kruhu substituován alkylovou nebo alkenylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, a v níž může být iminoskupina substituována fenyلكarbamoylovou skupinou, popřípadě substituovanou alkoxykupinou s 1 až 4 atomy uhlíku.

3. Prostředek podle bodu 1 nebo 2, vyznačující se tím, že jako pomocnou látku obsahuje jednu nebo několik přísad vybraných ze skupiny zahrnující alifatické nebo naftenické minerální oleje, rostlinné oleje, glykoethery, alkylované benzeny, polyoxyethylenderiváty, močovinu, polymerní pryskyřice a povrchově aktivní činidla, jako estery polyoxyethylensorbitanu, estery mastných kyselin s polyglykoly, polyoxyethylenderiváty alkylovaných fenolů, polyoxyethylenalkylethery a kvartérní amoniové sloučeniny, a popřípadě látku snižující fytotoxicitu, vybranou ze skupiny zahrnující tuk z ovčí vlny, alkohol tuku z ovčí vlny, mastnou kyselinu tuku z ovčí vlny a ester mastného alkoholu nebo mastné kyseliny tuku z ovčí vlny.

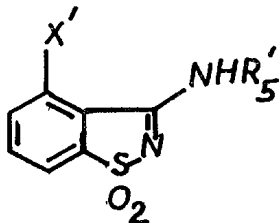
4. Prostředek podle bodů 1 až 3, vyznačující se tím, že jako účinnou látku obsahuje sloučeninu obecného vzorce



ve kterém

X' znamená atom fluoru nebo chloru a R_3' a R_4' , které mohou být stejné nebo rozdílné, znamenají vždy atom vodíku nebo alkylovou skupinu s 1 až 4 atomy uhlíku.

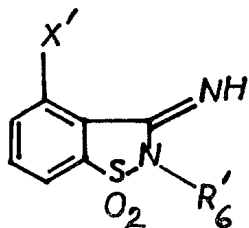
5. Prostředek podle bodů 1 až 3, vyznačující se tím, že jako účinnou látku obsahuje sloučeninu obecného vzorce



ve kterém

X' znamená atom fluoru nebo chloru a R_5' představuje atom vodíku, 2-chlorethylovou skupinu nebo cyklohexylkarbamoylovou skupinu.

6. Prostředek podle bodů 1 až 3, vyznačující se tím, že jako účinnou látku obsahuje sloučeninu obecného vzorce



ve kterém

X' znamená atom fluoru nebo chloru a R_6' představuje methylovou nebo ethylovou skupinu.

7. Prostředek podle bodů 1 až 3, vyznačující se tím, že jako účinnou látku obsahuje 3-amino-4-chlorbenzo[d]isothiazol-1,1-dioxid.

8. Prostředek podle bodů 1 až 3, vyznačující se tím, že jako účinnou látku obsahuje 3-(3-cyklohexylureido)-4-chlorbenzo[d]isothiazol-1,1-dioxid.

9. Prostředek podle bodů 1 až 3, vyznačující se tím, že jako účinnou látku obsahuje 2-kyan-3-chlorbenzensulfonamid.

10. Prostředek podle bodů 1 až 3, vyznačující se tím, že jako účinnou látku obsahuje 2-kyan-3-chlor-N-isopropylbenzensulfonamid.

11. Prostředek podle bodů 1 až 3, vyznačující se tím, že jako účinnou látku obsahuje 2-kyan-3-fluor-N,N-diethylbenzensulfonamid.

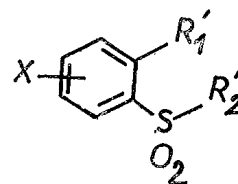
12. Prostředek podle bodů 1 až 3, vyznačující se tím, že jako účinnou látku obsahuje 2-kyan-3-fluor-N-isopropylbenzensulfonamid.

13. Prostředek podle bodů 1 až 3, vyznačující se tím, že jako účinnou látku obsahuje 3-[2-chlorethyl]amino-4-chlorbenzo[d]-

isothiazol-1,1-dioxid.

14. Prostředek podle bodů 1 až 3, vyznačující se tím, že jako účinnou látku obsahuje 2-ethyl-3-imino-4-fluorbenzo[d]isothiazol-1,1-dioxid.

15. Způsob výroby účinných látek obecného vzorce



ve kterém

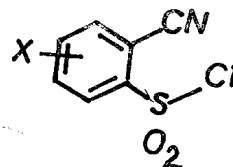
X znamená atom halogenu, fenoxyskupinu nebo alkylovou či alkoxylovou skupinu obsahující vždy 1 až 4 atomy uhlíku a popřípadě substituovanou halogenem,

R_1' představuje kyanoskupinu a

R_2' znamená aminoskupinu, která může být popřípadě substituována jednou nebo dvěma alkenylovými nebo alkinyllovými skupinami obsahujícími vždy 2 až 6 atomů uhlíku, nebo jednou či dvěma alkylovými skupinami s 1 až 6 atomy uhlíku, kteréžto alkylové skupiny mohou společně s dusíkovým atomem, na který jsou navázány, tvořit nasycený heterocyklický kruh, jenž může rovněž obsahovat druhý heteroatom vybraný ze skupiny obsahující dusík, kyslík a síru, nebo kteréžto alkylové skupiny mohou být substituovány alkoxykupinou s 1 až 4 atomy uhlíku nebo dialkylaminoskupinou se 2 až 6 atomy uhlíku, přičemž alkylové skupiny této dialkylaminoskupiny mohou společně s dusíkovým atomem, na který jsou navázány, tvořit nasycený heterocyklický kruh, nebo

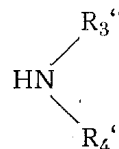
R_1' a R_2' společně tvoří 1-amino-2-azavinylenovou skupinu, nebo

R_1' a R_2' společně tvoří 1-imino-2-azaethylenovou skupinu, v níž je dusíkový atom v kruhu substituován alkylovou nebo alkenylovou skupinou s 1 až 4 atomy uhlíku, vyznačující se tím, že se sloučenina obecného vzorce



ve kterém

X má shora uvedený význam, nechá reagovat s aminem obecného vzorce



ve kterém

každý ze symbolů R_3 a R_4 , které mohou být stejné nebo rozdílné, znamená vždy atom vodíku, alkenylovou nebo alkinylovou skupinu se 2 až 6 atomy uhlíku, alkylovou skupinu s 1 až 6 atomy uhlíku, popřípadě substituovanou alkoxy skupinou s 1 až 4 ato-

my uhlíku nebo dialkylaminoskupinou se 2 až 6 atomy uhlíku, přičemž alkylové skupiny této dialkylaminoskupiny mohou popřípadě tvořit, společně s dusíkovým atomem, na který jsou navázány, nasycený heterocyklický kruh, ve vodě nebo v polárním organickém rozpouštědle, při teplotě mezi 0 °C a teplotou varu rozpouštědla.