



ОПИСАНИЕ КЪМ ПАТЕНТ

ЗА

ИЗОБРЕТЕНИЕ

6(51) C 07 D 251/16
C 07 D 251/18
C 07 D 251/46
A 01 N 43/70

ПАТЕНТНО ВЕДОМСТВО

(21) Регистров № 96471

(22) Заявено на 15.06.92

(24) Начало на действие
на патента от: 15.06.92

Приоритетни данни

(31) (32) (33)

(41) Публикувана заявка в
бюлетин № на

(45) Отпечатано на 30.01.98

(46) Публикувано в бюлетин № 10
на 31.10.07(56) Информационни източници:
EP 0044210; EP 0044807; EP 0044808;
EP 0044809

(62) Разделена заявка от рег. №

(73) Патентоприетател(и):

CIBA-GEIGY CORPORATION,
ARDSLEY, NY (US)(72) Изобретател (и):
Willy Meyer, Riehen
Konrad Oertle, Therwil (CH)(74) Представител по индустриална
собственост:
Георги Цветанов Перев, 1124 София,
ул. "Леонардо да Винчи" 3

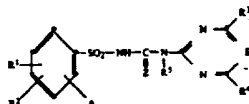
(86) № и дата на PCT заявка:

(87) № и дата на PCT публикация:

Издава се съгласно §4 от Преходните и заключителните разпоредби на Закона
за патентите на основание издаден патент на: US № 4671819 от 09.06.87

(54) N-ФЕНИЛСУЛФОНИЛ-N'-ТРИАЗИНИЛКАРБАМИДИ

(57) N-фенилсулфонил-N'-пиримидинил- и -триазинилкарбаמידите имат обща формула



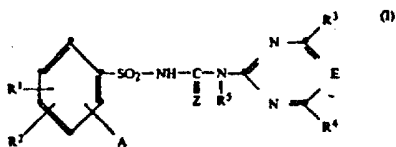
в която А означава 3,3,3-трифлуорпропил или 3,3-дифлуорбутил радикал; R¹ е водород, халогенен елемент, нитро, циано, C₁-C₄-алкил, C₁-C₄-халоалкил, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-алкилтио, C₁-C₄-алкилтионил, C₁-C₄-алкилсулфонил, -CO-R⁶, -NR⁷R⁸, -CO-NR⁹R¹⁰ или -SO₂-NR¹¹R¹² групи; R² е водород, халогенен елемент, C₁-C₄-алкил, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-алкилтио, C₁-C₄-алкилтионил или C₁-C₄-алкилсулфонил; R³ и R⁴, всеки независимо един от друг, е водород, халогенен елемент, C₁-C₄-алкил, C₁-C₄-халоалкил, C₂-C₄-халоалкокси, C₁-C₄-алкилтио, C₁-C₄-халоалкилтио, C₁-C₄-алкоксиалкил, C₁-C₄-алкокси или -NR¹²R¹³ радикали; R⁵ е водород, C₁-C₄-алкил, или C₁-C₄-алкокси радикали; R⁶ е C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-халоалкокси, C₁-C₄-алкилтио, C₂-C₆-алкоксиалкокси, водород, C₁-C₄-алкил или C₁-C₄-халоалкил радикали; R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹² и R¹³ са, всеки независимо един от друг, водород, или C₁-C₄-алкил радикал, Е е азот или метинова връзка, и Z е кислород или сяра.

24 претенции

(54) N-ФЕНИЛСУЛФОНИЛ-N'-ТРИАЗИНИЛ-КАРБАМИДИ

Настоящото изобретение се отнася до нови N-фенилсулфонил-N'-пиримидинил- и -триазирилкарбамиди, имащи хербицидни и регулиращи растежа на растения свойства, до методи за тяхното получаване, до съдържащи ги композиции като активна съставка, както и до приложението им за контролиране на плевелите, или за регулиране и потискане растежа на растенията.

N-фенилсулфонил-N'-пиримидинил- и -триазирилкарбамидите от настоящото изобретение са с обща формула



в която: А е 3,3,3-трифлуорпропил или 3,3-дифлуорбутил радикал; R¹ е водород, халогенен елемент, нитро, циано, C₁-C₄-алкил, C₁-C₄-халоалкил, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-алкилтио, C₁-C₄-алкилтионил, C₁-C₄-алкилсулфонил, -CO-R⁶, -NR⁷R⁸, -CO-NR⁹R¹⁰ или -SO₂-NR¹¹R¹² групи; R² е водород, халогенен елемент, C₁-C₄-алкил, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-алкилтио, C₁-C₄-алкилтионил или C₁-C₄-алкилсулфонил; R³ и R⁴, всеки независимо един от друг, е водород, халогенен елемент, C₁-C₄-алкил, C₁-C₄-халоалкил, C₂-C₄-халоалкокси, C₁-C₄-алкилтио, C₁-C₄-халоалкилтио, C₁-C₄-алкоксиалкил, C₁-C₄-алкокси или -NR¹²R¹³ радикали; R⁵ е водород, C₁-C₄-алкил, или C₁-C₄-алкокси радикали; R⁶ е C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-халоалкокси, C₁-C₄-алкилтио, C₂-C₆-алкоксиалкокси, водород, C₁-C₄-алкил или C₁-C₄-халоалкил радикали; R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹² и R¹³ са, всеки независимо един от друг, водород, или C₁-C₄-алкил радикал, Е е азот или метинова връзка, и Z е кислород или сяра, като изобретението се отнася и до солите на тези съединения.

Известни са карбамиди, триазини и пиримидини с хербицидни свойства. Сулфонилкарбамиди с хербицидно и регулиращо растежа на растения действие са описани например в EP №№ 44210, 44807, 44808, 44809.

Според горните определения алкил означава права или разклонена алкилова верига, например метил, етил, n-пропил, l-пропил, че-

тирите изомера на бутила, n-амил, i-амил, 2-амил, 3-амил, n-хексил или i-хексил. Предпочитани са метил и етил радикалите.

Алкокси означава метокси, етокси, n-пропилокси, i-пропилокси, четирите изомера на бутилокси групи, като предпочитани са метокси, етокси или изопропокси.

Примери за алкилтио са метилтио, етилтио, n-пропилтио, изопропилтио, n-бутилтио, като се предпочитат метилтио и етилтио радикали.

Примери за алкилтионил са метилтионил, етилтионил, n-пропилтионил, n-бутилтионил, като предпочитани са метилтионил и етилтионил радикалите.

Алкилсулфонил означава метилсулфонил, етилсулфонил, n-пропилсулфонил, n-бутилсулфонил, като предпочитани са метилсулфонил и етилсулфонил радикали.

Халогенен елемент както отделно, така и в халоалкил, халоалкокси, халоалкилтионил, халоалкилсулфонил и халоалкилтио означава хлор, флуор и бром, като предпочитани са хлорът и флуорът.

Халоалкил или заместени в по-горе означените R¹ до R¹³ части от халоалкил радикали могат да бъдат както следва хлорметил, флуорметил, дифлуорметил, трифлуорметил, 2-хлоретил, 2,2,2-трифлуоретил, 1,1,2,2-тетрафлуорметил, пентафлуоретил, 1,1,2-трифлуор-2-хлоретил, 2,2,2-трифлуор-1,1-дихлоретил, пентахлоретил, 3,3,3-трифлуорпропил, 2,3-дихлорпропил, 1,1,2,3,3,3-хексафлуорпропил, като предпочитани са флуорметил, хлорметил, дифлуорметил, трифлуорметил радикали.

Изобретението се отнася също и до солите, които съединенията от типа на формула I могат да образуват с амини, с основи на алкални или алкалоземни метали или с тетраамониеви основи.

Предпочитани основи на алкалните и алкалоземни метали са тези, съдържащи литий, натрий, калий, магнезий или калций и особено тези, съдържащи натрий и калий.

Примери за подходящи амини, участващи в образуването на соли, са първични, вторични и третични алифатни и ароматни амини, като метиламин, етиламин, пропиламин, изопропиламин, четирите изомера на бутиламина, диметиламин, диетиламин, диетаноламин, дипропиламин, диизопропиламин, ди-n-

бутиламин, пиролидин, пиперидин, морфолин, триметиламин, триетиламин, трипропиламин, хиноклидин, пиридин, хинолин, изохинолин. Предпочитани амини са етил-, пропи-, диетил-, или триетиламин и особено изопропиламин и диетаноламин.

Примери за тетраамониеви основи са катионите на халоамониевите соли, като тетраметиламониев катион, триетилбензоламониев катион, триметилбензоламониев катион, тетраетиламониев катион, триметилетиламониев катион, а също и амониев катион.

Предпочитани съединения съгласно формула I според изобретението са онези, при които:

- (а) R^1 е водород; или
- (б) R^2 е водород; или
- (в) Z е кислород; или
- (г) R^5 е водород; или
- (д) R^3, R^4 заедно не съдържат повече от 4 въглеродни атома;
- (е) радикалът А заема 2 място спрямо фенилното ядро.

Предпочитани групи от активни съединения от типа на тези съгласно формула I са онези, при които R^1, R^2 и R^5 са водород, а Z е кислород, или R^3 и R^4 заедно не съдържат повече от 4 въглеродни атома, а радикалът А заема второ място спрямо фенилния пръстен и съдържа поне един флуорен атом.

Особено предпочитани са съединенията от типа на формула I, при които R^1, R^2 и R^5 са водород, а Z е кислород, R^3 и R^4 заедно не съдържат повече от 4 въглеродни атома, а радикалът А заема 2-място спрямо фенилния пръстен.

Конкретно предпочитани съединения са:
N-[2-(3,3,3-трифлуорпропил)-фенилсулфонил]-N'-(4,6-диметокси-пиримидин-2-ил)карбамид;

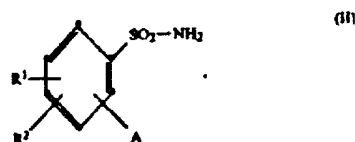
N-[2-(3,3,3-трифлуорпропил)-фенилсулфонил]-N'-(4,6-диметокси-1,3,5-триазин-2-ил)карбамид;

N-[2-(3,3-дифлуорбутил)-фенилсулфонил]-N'-(4-метокси-6-метил-1,3,5-триазин-2-ил)карбамид, и

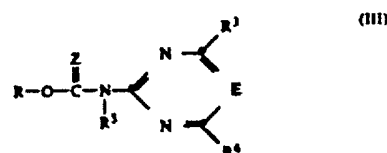
N-[2-(3,3,3-трифлуорпропил)-фенилсулфонил]-N'-(4-метокси-6-метил-1,3,5-триазин-2-ил)карбамид.

При методите за получаване на съединения от типа на формула I се използва инертен органичен разтворител.

Първи метод за получаване на съединения от типа на формула I е взаимодействието на фенилсулфонамид с формула II

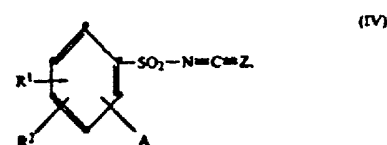


в която А, R^1 и R^2 имат значенията, дадени във формула I, с N-пиримидинил- или N-триазинилкарбамат с формула III

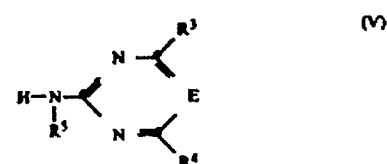


в която Е, R^3, R^4, R^5 и Z са както посочените във формула I, а R е фенил, алкил или заместен фенилов радикал, в присъствие на основа.

Съгласно втори метод съединения от типа на формула I се получават при взаимодействие на фенилсулфонилоцианат или изотиоцианат с формула IV

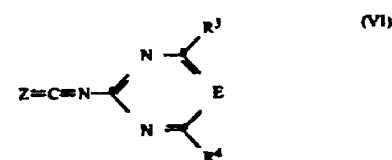


в която А, R^1, R^2 и Z са както посочените във формула I, за предпочитане в присъствие на основа, с амин с формула V



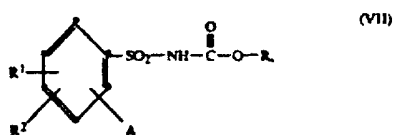
в която Е, R^3, R^4 и R^5 имат значенията, посочени във формула I.

Друг метод за получаване на съединения от типа на формула I, в които R^5 е водород, е чрез взаимодействие на сулфонамид съгласно формула II, за предпочитане в присъствие на основа, с изоцианат или изотиоцианат с формула VI



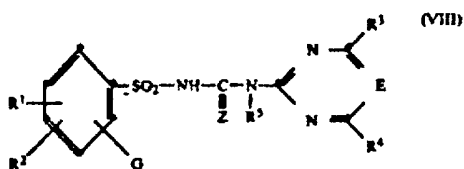
в която Е, R^3, R^4, R^5 и Z имат значенията, посочени във формула I.

Метод за получаване на съединения от типа на формула I включва и взаимодействие на N-фенилсулфонилкарбамат с формула



в която A, R¹ и R² имат значенията, посочени във формула I, R е фенил, алкил или заместен фенилов радикал с амин съгласно формула V.

Накрая, съединения от типа на формула I могат да се получат и чрез хидриране до набиране на сулфонилкарбамид с формула VIII



в която R¹, R², R³, R⁴, E и Z имат значенията, посочени във формула I, G е 3,3,3-трифлуор-1-пропенил или 3,3-дифлуор-1-бутенилов радикал.

Ако е необходимо, карбамидите от типа на формула I могат да се превърнат в соли с помощта на амини, основи на алкални или алкалоземни метали, или на тетраамониеви основи. Това превръщане се извършва чрез взаимодействие на съединенията от типа на формула I с еквимоларно количество от основите и последващо отстраняване на разтворителя чрез изпаряване. Целесъобразно е реакцията за получаване на съединения от типа на формула I да се провежда в присъствие на подходящ инертен органичен разтворител като метиленхлорид, хлороформ, тетрахлорметан или хлорбензол, етери като например диетилов етер, етиленгликолдиметилов етер, диетиленгликолдиметилов етер, тетрахидрофуран или диоксан, нитрили като например ацетонитрил или пропионитрил, амиди като например диметилформамид, диетилформамид или N-метилпиролидинон. За предпочитане е реакционната температура да бъде в интервала -20°C +120°C. Реакциите са обикновено слабо екзотермични и могат да протичат при стайна температура. За да се намали реакционното време, а също така и за да се иницира реакцията, е целесъобразно реакционната смес да се загрее бързо до температурата на кипене. Реакционното време може да се намали също

и чрез добавяне на няколко капки основа или изоцианат като катализатори. Подходящи основи са третичните амини като триметиламин, триетиламин, нуклидин, 1,4-диазабицикло-(2,2,2)-октан, 1,5-диазабицикло(4,3,0)нон-5-ен или 1,5-диазабицикло(5,4,0)ундек-7-ен.

Хлорирането се извършва при температури от 0°C до 100°C. Подходящо е в този случай реакционният разтвор да се облъчи със светлина или да се добави инициатор на верижната реакция, например дибензоилпероксид или α, α'-азизобутиронитрил, а също и да се използва хлориран въглеродород като например метиленхлорид, хлороформ или тетрахлорметан като разтворител. Хлорирането протича в присъствие на инертен разтворител, например карбонилни киселини, алкохоли, естери или въглеродороди, в атмосфера на водород и при наличието на катализатор като "Raney" никел, или паладий, или платина.

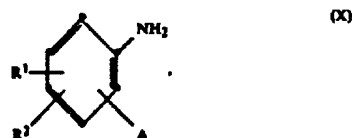
Крайните продукти от типа на формула I могат да се изолират чрез концентриране на реакционната смес и/или чрез отстраняване на разтворителя чрез изпаряване, а също и чрез прекристализация, или стриване на прах на твърдия остатък в разтворител, в който той е слабо разтворим, като например етер, ароматни въглеродороди и хлорирани въглеродороди.

Исходните вещества за получаване на съединенията по формули III, V и VI са известни в литературата и могат да се получат по известни методи. В частност, съединенията по формули III и VI могат да се получат чрез познати методи от съединенията по формула V.

Исходните съединения по формула VIII и методите за получаването им са описани в EP № 102925.

Междинните съединения съгласно формули II, IV и VII са нови и са предназначени специално за синтезите на съединенията от типа на формула I. Те също са обект на настоящото изобретение.

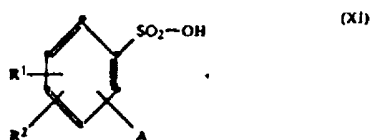
Новите междинни съединения съгласно формула II могат да се получат например чрез диазотиране на анилини с формула X



в която R^1 , R^2 и A са както посочените във формула I, чрез заместване на диазогрупата със серен двуокис в присъствие на катализатор (купрохлорид в солна или сярна киселина) и чрез последващо взаимодействие на

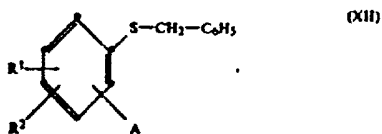
получения фенилсулфонилхлорид с разтвор на амониева основа.

Съединенията с формула II могат да се получат и чрез превръщане на фенилсулфоновата киселина с формула XI



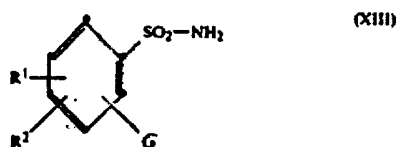
в която R^1 , R^2 и A са както във формула I, в съответния фенилсулфонилхлорид посредством хлориращ агент като например PCl_5 , $POCl_3$, $COCl_2$ или $SOCl_2$ и последващо взаимодействие на фенилсулфонилхлорида с разтвор на амониева основа.

Съединенията с формула II могат да се получат и чрез превръщане на бензотиоестер с формула XII



в която R^1 , R^2 и A са както посочените във формула I, до съответния фенилсулфонилхлорид с помощта на хлор и последващо взаимодействие с разтвор на амониева основа.

Съединенията с формула II, при които A е C_2-C_6 халоалкилрадикал, могат да се получат също чрез хидриране или халогениране до насищане на фенилсулфонамида съгласно формула XIII



в която R^1 , R^2 и G са както посочените във формула VIII.

Подобни нови фенилсулфонилоцианиди с формула IV могат да се получат например чрез взаимодействие на сулфонамидите с формула II с фосген в присъствие на бутилоцианат и в разтворител - хлориран въглерод, при температура на кондензация. Подобни методи на получаване са описани в "Neue Methoden der präparativen organischen Chemie",

Vol IV, 211-229, Verlag Chemie, Weinheim, 1970.

Изотиоцианатите с формула IV се получават чрез обработване на сулфонамидите с формула II със серовъглерод и калиева основа и последваща реакция на двукалиевата сол с фосген. Такива процеси са описани в Arch. Pharm. 229, 174 (1966).

N-фенилсулфонилкарбаматите с формула VII се получават при взаимодействие на сулфонамидите с формула II с дифенилкарбонат в присъствие на основа. Подобен процес е споменат в JP 61169.

Изходни съединения за получаване на съединенията с формули X, XV и XII са познати и могат да се получат по известни методи.

Съединенията с формула XIII са описани в EP 102925.

Методите за получаване на междинните съединения се реализират при условия, които са същите, както при методите за получаване на крайните продукти.

Съединенията с обща формула I са стабилни и не са необходими предпазни мерки при съхраняването им.

Приложени в малки количества, те проявяват изразени свойства за селективно инхибиране на растежа на растенията и селективни хербицидни свойства, което ги прави особено подходящи за прилагане при култивиранни растения, като например захарна тръстика, житни култури, памук, соя, царевица и ориз. В някои случаи се потиска и растежът на плевели, което обикновено се контролира чрез тотална хербидизация.

Начинът на действие на тези съединения е необичаен. Много от тях се придвижват от едно на друго място в растенията, т.е. абсорбират се от тях и се пренасят в други техни части, където проявяват действието си.

Необичайното им действие се състои в това, че те не само се придвижват в дървесинната част от корените към листата през васкуларните възли, но и се просмукват обратно от листото на листата към корените. Така например е възможно да се потисне растежът на многогодишните плевели в самите корени чрез повърхностна обработка. В сравнение с други хербициди и регулиращи растежа вещества съединенията с обща формула I са ефективни даже и при ниски норми на употреба.

Те проявяват изразен ефект за регулиране растежа на растенията, което се изразя-

ва в повишаване на добивите на култивирани-
те растения и на жътвените култури. Много
съединения съгласно изобретението потискат
растежа на растенията съответно на използваните
дозы. По този начин се управлява расте-
жът както на моно-, така и на двуседелните
култури. Така например съединенията с обща
формула I селективно инхибират растежа на
бобовите растения, които често се засяват като
"покривни" култури в тропическите райони,
така че предотвратявайки ерозията, последни-
те да не конкурират култивирани растения.

Намаляването на вегетативния растеж
позволява при много култури да се увеличи
плътността на посевите, така че се получава
по-висок добив от една и съща площ.

Допълнителен фактор, допринасящ за по-
вишаването на добива при използването на ин-
хибитори за растежа е, че цветовете и плодо-
вете се снабдяват с повече хранителни
вещества, поради ограничаването на вегетатив-
ния растеж.

В случая с едноседелните растения, ка-
то например тревата и житните култури, на-
маляването на вегетативния растеж е положи-
телен и желан факт. Намаляването на растежа
от този тип е и от икономически интерес, за-
щото примерно при тревите се намалява чест-
отата на косене в декоративните градини и
паркове, спортните игрища и тревните площи
покрай магистралите. Намаляването на расте-
жа е от значение и при храстите и дървесните
видове, намиращи се покрай пътищата и дру-
ги пътни артерии и като цяло е от значение
при всички пространства, където бързият рас-
теж е нежелателен.

Важно приложение на регулаторите на
растежа е използването им при намаляване ви-
сочината на житните култури, което намалява
или напълно отстранява опасността от поляга-
не на растенията преди жътва. Освен това ре-
гулаторите на растежа повишават здравината
на стеблата на житните култури, с което се
предотвратява огъването и прекъсването им.

Освен това, съединенията с формула I
са подходящи за предотвратяване прораства-
нето на складирани картофи. По време на зим-
ното складиране картофите прорастват, което
води до появяване, загуба в теглото и загиване.

Когато съединенията съгласно изобрете-
нието се прилагат в по-високи дози, се увреж-
дат всички изпитвани растения, така че те

изсъхват.

Изобретението се отнася също и до
композиции, съдържащи нови съединения с
формула I, които проявяват хербицидни и ре-
гулиращи растежа на растенията свойства,
както и до методи за контрол на плевелите в
периода преди и след покълването им, а също
и до методи за инхибиране растежа на едно-
и двуседелни растения, по-специално на
триви, "покривни" тропически култури и тю-
тюневи издънки.

Съединенията с обща формула I се из-
ползват директно или в комбинация с други
конвенционални средства под формата на
емулсионни концентрати - спрейобразни, или
на разредени разтвори, разредени емулсии,
омокрени прахове, разтворими прахове, пра-
хови гранулати или капсули от полимерни
субстанции. Методите за прилагане на
композициите, както и типът на самите
композиции, се подбират конкретно в зависи-
мост от обектите и обстановката и могат да
бъдат разпръскване, разпращаване, насипва-
не върху повърхността или дъждуване.

Композициите или съставите, съдържа-
щи съединенията с обща формула I, изпълня-
ват ролята на активна съставка, а също така,
ако е необходимо, и другите спомагателни теч-
ни или твърди вещества се получават по из-
вестни методи, например чрез хомогенизиране,
чрез смесване и/или чрез едновременно стри-
ване на активните съставки с разтворителя,
твърдия носител, и ако е необходимо, с по-
върхностно активни вещества (ПАВ).

Подходящи разтворители са: ароматни-
те въглеводороди, по-специално фракции, съ-
държащи от 8 до 12 въглеродни атома, като
ксиллови смеси, заместени нафталини, фта-
лати като дибутил- или диоктилфталат, али-
фатни въглеводороди като циклохексан или
парафини, алкохоли и гликоли и техни етери
и естери като етанол, етиленгликол, етиленг-
ликолмонометил- или моноетилов етер, кето-
ни като циклохексанон, силно полярни разт-
ворители като N-метил-2-пиридон, диметил-
сулфоксид или диметилформамид, както и
епоксидни растителни масла, епоксидно, ко-
ксово или соево масло; вода.

За твърди носители например при пра-
ховете се използват обикновено естествени
природни носители като калцит, талк, каолин,
монтморилонит или атапулгит. За да се пос-

тигнат необходимите физични свойства е възможно да се добавят и силно диспергирана силициева киселина или силно диспергирани адсорбиращи полимери. Подходящи носители при гранулирането са тези от порьозен тип с адсорбционни свойства като пемза, натрошени тухли, сепиолит или бентонит, или с неадсорбиращи свойства като калцит или пясък. За твърди носители могат да се използват и голям брой гранулирани материали от неорганичен и органичен произход като доломит или пулверизирани растителни отпадъци.

В зависимост от вида на съединенията с формула I при съставянето на композиции се използват и подходящи ПАВ като нейонни, катионни и/или анионни ПАВ, имащи добри емулгиращи, диспергиращи и омекрящи свойства. Под ПАВ се разбират също и смеси, съдържащи ПАВ.

Подходящи анионни ПАВ са водоразтворимите сапуни и водоразтворимите синтетични повърхностно активни съединения.

От сапуните подходящи са солите на висшите мастни киселини ($C_{10}-C_{22}$), като алкални, алкалоземни, незаместени или заместени амониеви соли, по-специално натриеви или калиеви соли на олеиновата или стеариновата киселина, или на смеси от природни мастни киселини, които биха се получили например от кокосово масло или от твърди мазнини (олеомаргарини). Трябва да се имат също предвид и метилтауриновите соли на мастните киселини.

По-често все пак се използват т.н. синтетични ПАВ като мастни сулфонати, мастни сульфати, сулфонирани бензимидазолни производни на алкиларилови сулфонати. Мастните сулфонати или сульфати са обикновено под формата на алкални, алкалоземни или незаместени или заместени амониеви соли и съдържат C_8-C_{22} алкилов радикал, който от своя страна съдържа алкилната част на ациловите радикали, като например натриевата или калиевата сол на лигносулфоновата киселина, на додецилсулфоновата или на смес от сулфати на мастни алкохоли, получени от природни мастни киселини. Тези съединения също обхващат продуктите на присъединяване към етиленов окис на солите на естерите на сяръната и сулфоновите киселини с мастен алкохол. Сулфоновите производни на бензимидабензола съдържат предимно 2 сулфокиселинни

групи и един мастнокисел радикал, включващ от 8 до 22 въглеродни атома. Примери за алкиларилсулфонати са натриевите, калиевите или триетаноламинови соли на додецилбензолсулфоновата киселина и на дибутилнафталинсулфоновата киселина, или кондензационният продукт на нафталинсулфоновата киселина и формалдехида. Подходящи са също и съответните фосфати, като например продуктите на присъединяване към 4 до 14 mol етиленов окис на солите на естерите на фосфорната киселина с p-нонилфенола.

Нейонни ПАВ са полигликолетерните производни на алифатните и циклоалифатни алкохоли, или наситени или ненаситени мастни киселини или алкилфеноли, накратко производни, съдържащи от 3 до 30 гликолетерни групи и от 8 до 20 въглеродни атома в алифатната въглеродна част и от 6 до 18 въглеродни атома в алкилната част на алкилфенолите.

Други подходящи нейонни ПАВ са водоразтворимите присъединителни продукти на полиетиленовия окис с полипропиленгликола, етилендиаминполипропиленгликола и с алкилполипропиленгликола, съдържащи от 1 до 10 въглеродни атома в алкилната верига, като присъединителните продукти включват от 20 до 250 етиленгликолетерни групи и от 10 до 100 пропиленгликолетерни групи. Тези съединения обикновено съдържат от 1 до 5 етиленгликолови единици за една пропиленгликолова единица. Примери за нейонни ПАВ са нонилфенолполиетоксиетанолите, полигликоловите етери на рициновото масло, присъединителните продукти на полипропилен/полиетиленовия окис, трибутилфеноксиполиетоксиетанолът, полиетиленгликолят, а също и октилфеноксиполиетоксиетанолът. Също подходящи нейонни ПАВ са мастнокиселите естери на полиоксиетилensorбитана и полиоксиетилensorбитантриолеата.

Катионни ПАВ са предимно тетраамониевите соли, съдържащи като N-заместител поне един полигликолов етер или C_8-C_{22} алкилов радикал, а като други заместители - нисши незаместени или халогенирани алкилов, бензилов или нисш хидроксиалкилов радикал. Солите обикновено са под формата на халогениди, метил- или стилсулфати, като например стеарилтриметиламониев хлорид или бензилди(2-хлор-етил) етиламониев бромид.

Повърхностно активните вещества, използвани най-често при формоването на композиции, са описани в "Mc Cutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publishing Corp., Ridgewood, N.J., 1981; H. Stache, "Tensid-Taschenbuch" (Tenside Handbook), 2-nd Edition, C. Hanser Verlag Munich, Vienna, 1981; M. and J. Ash. "Encyclopedia of Surfactants", Vol. I-III, Chem. Publishing Co., N.Y., 1980-81.

Композициите съдържат обикновено от 0,1 до 95%, предимно от 0,1 до 80%, съединения с формула I; от 1 до 99,9% твърда или течна добавка; и от 0 до 25%, предимно от 0,1 до 25%, ПАВ.

Предпочитаните композиции са описани по-долу (в мас. %).

Емулсионни концентрати

Активна съставка от 1 до 20, за предпочитане от 5 до 10;

ПАВ от 5 до 30, за предпочитане от 10 до 20;

Течен носител от 50 до 94, за предпочитане от 70 до 85.

Прахове

Активна съставка от 0,1 до 10, за предпочитане 0,1-1;

Твърд носител от 99,9 до 90, за предпочитане от 99,9 до 99.

Суспензионни концентрати

Активна съставка от 5 до 75, за предпочитане от 8 до 50;

Вода от 94 до 25, за предпочитане от 90 до 30;

ПАВ от 1 до 40, за предпочитане от 2 до 30.

Омокрени прахове

Активна съставка от 0,5 до 90, за предпочитане от 1 до 80,

ПАВ от 0,5 до 20, за предпочитане от 1 до 15,

Твърд носител от 5 до 95, за предпочитане от 15 до 90.

Гранулати

Активна съставка от 0,5 до 30, за предпочитане от 3 до 15,

Твърд носител от 99,5 до 70, за предпочитане от 15 до 90.

Търговските продукти обикновено се произвеждат като концентрати, докато потребителите ги използват като разредени разтвори. Композициите могат да се разреждат до кон-

центрации 0,001%. Дозите им за употреба обикновено са 0,01 до 10 kg акт. съставка/ha, за предпочитане 0,025 до 5 kg акт. съставка/ha.

Композициите могат да съдържат също и други компоненти като стабилизатори, антипенители, вещества, регулиращи вискозитета, свързващи вещества, адхезиви, торове или други активни компоненти, които биха придали на композициите специални свойства.

Изобретението се илюстрира със следните примери, в които температурата е в °C, а налягането в mbar.

Пример 1. N-[2-(3,3,3-трифлуорпропил)-фенилсулфонил]-N'-(4,6-диметокси-1,3,5-триазин-2-ил)карбамид.

(а) 2-(3,3,3-трифлуорпропил)-фенилсулфонамид

Смес от 50,2 g 2-(3,3,3-трифлуор-1-пропенил)-фенилсулфонамид, 500 ml етилацетат и 5 g катализатор Pd/C се разбърква в продължение на 30 min при 20-25°C във водородна атмосфера. След това катализаторът се филтрира, сместа се концентрира чрез изпаряване, а остатъкът изкрystalизира в смес от метиленхлорид и етер с добив 49,6 g 2-(3,3,3-трифлуорпропил)-фенилсулфонамид и т.т. 148-149°C.

(б) N-[2-(3,3,3-трифлуорпропил)-фенилсулфонил]-N'-метилкарбамид.

Към суспензия от 40,5 g 2-(3,3,3-трифлуор)-фенилсулфонамид и 250 ml абсолютен метиленхлорид се добавят 11,4 g метилизоцианат, след което на капки се добавят в продължение на 15 min и при температура 20-25°C 20,2 g триетиламин. Полученият бистър разтвор се разбърква при 20-25°C в продължение на 1 h и се концентрира чрез изпаряване. Остатъкът след това се разтваря в 5%-ен разтвор на солна киселина, като се получават 46,3 g N-[2-(3,3,3-трифлуорпропил)-фенилсулфонил]-N'-метилкарбамид с т.т. 176-177°C.

(в) 2-(3,3,3-трифлуорпропил)-фенилсулфонилоцианат

40,3 g N-[2-(3,3,3-трифлуорпропил)-фенилсулфонил]-N'-метилкарбамид се суспендират в 700 ml хлорбензол и се подлагат на азеотропна дестилация, докато останат 150 ml от разтворителя. След това при температура от 120 до 130°C и в продължение на 90 min се добавят 71 g фосген. След концентриране на разтвора чрез изпаряване се получава добив

от 37,3 g жълтеникаво масло от 2-(3,3,3-трифлуорпропил)-фенилсулфонилозианат, който директно може да се превръща.

(г) N-[2-(3,3,3-трифлуорпропил)-фенилсулфонил]-N'-(4,6-диметокси-1,3,3-триазин-2-ил)карбамид

Разтвор от 5,6 g 2-(3,3,3-трифлуорпропил)-фенилсулфонилозианат, 3,12 g 2-амино-4,6-диметокси-1,3,5-триазин и 60 ml абсолютен диоксан се разбърква в продължение на 2 h при температура от 70 до 80°C. След това сместа се обработва с активен въглен, филтрира се и се концентрира чрез изпаряване, докато остане 1/5 от обема ѝ. След прибавяне на етер от нея изкрystalлизират 6,8 g N-[2-(3,3,3-трифлуорпропил)-фенилсулфонил]-N'-(4,6-диметокси-1,3,5-триазин-2-ил)карбамид с т.т. 177-178°C.

Пример 2. N-[2-(3,3,3-трифлуорпропил)-фенилсулфонил]-N'-(4-диметиламин-6-метокси-пиримидин-2-ил)карбамид

(а) N-[2-(3,3,3-трифлуорпропил)-фенил]-фенилкарбамат

Разтвор от 2,8 g 2-(3,3,3-трифлуорпропил)-фенилсулфонамид в 25 ml диметилформамид се добавя на капки в продължение на 5 min при температура от 15 до 20°C към суспензия от 0,5 g 55%-ен натриев хидрид в 10 ml абсолютен диметилформамид. Суспензията се разбърква в продължение на 10 min, след което към нея на капки се добавят 2,5 g дифенилкарбонат в 15 ml диметилформамид и сместа се разбърква в продължение на 30 min, след което се изсипва към 100 ml етилацетат, 100 g лед и 10 ml солна киселина. Органичната фаза се отделя, промива се с ледена вода, суши се над натриев сулфат и се концентрира чрез изпаряване. Желаният продукт от N-[2-(3,3,3-трифлуорпропил)-фенил]-фенилкарбамат с т.т. 116-119°C се получава с добив 2,8 g след прекристализация от смес етер/петролев етер в съотношение 1:1.

(б) N-[2-(3,3,3-трифлуорпропил)-фенилсулфонил]-N'-(4-диметиламин-6-метокси-пиримидин-2-ил)карбамид

Смес от 2,65 g N-[2-(3,3,3-трифлуорпропил)-фенил]-фенилкарбамат и 1,18 g 2-

амин-4-диметиламин-6-метокси-пиримидин в 20 ml абсолютен диоксан се кипи на обратен хладник в продължение на 90 min, охлажда се при 20°C и се концентрира чрез изпаряване. Добивът от N-[2-(3,3,3-трифлуорпропил)-фенилсулфонил]-N'-(4-диметиламин-6-метокси-пиримидин-2-ил)карбамид с т.т. 183-184°C е 1,65 g след прекристализация от смес ацетон-етер.

Пример 3. N-[2-(3,3,3-трифлуорпропил)-фенилсулфонил]-N'-(4-метокси-6-метил-1,3,5-триазин-2-ил)-карбамид

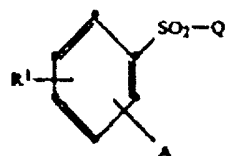
В 50 ml етилацетат се разтварят 2,9 g N-[2-(3,3,3-трифлуор-1-пропенил)-фенилсулфонил]-N'-(4-метокси-6-метил-1,3,5-триазин-2-ил)-карбамид. Към разтвора се прибавят 1,5 g катализатор - 5% паладий върху активен въглен и сместа се разбърква в продължение на 16 h при температура от 20 до 25°C във водородна атмосфера. Впоследствие катализаторът се филтрира, а остатъкът се концентрира чрез изпаряване, като след прекристализация от смес ацетон/етер се получават 2,2 g N-[2-(3,3,3-трифлуорпропил)-фенилсулфонил]-N'-(4-метокси-6-метил-1,3,5-триазин-2-ил)-карбамид с т.т. 157-158°C.

Пример 4. N-[2-(3,3,3-трифлуорпропил)-фенилсулфонил]-N'-(4-метокси-6-метил-пиримидин-2-ил)-карбамид

Смес от 2,53 g 2-(3,3,3-трифлуорпропил)-фенилсулфонамид, 2,59 g 4-метокси-6-метилпиримидин-2-ил-фенилкарбамат, 1,52 g 1,5-дiazобикло(5.4.0)ундек-5-ен и 20 ml диоксан се разбърква в продължение на 3 h при стайна температура от 20 до 25°C. Сместа се излива във вода, подкислява се с 10%-на солна киселина и се екстрахира с етилацетат. След това органичната фаза се изсушава на натриев сулфат, а остатъкът се концентрира чрез изпаряване и прекристализация от смес ацетон/етер в съотношение 1:5. Получава се добив от 3,5 g N-[2-(3,3,3-трифлуорпропил)-фенилсулфонил]-N'-(4-метокси-6-метил-пиримидин-2-ил)-карбамид с т.т. 174-175°C.

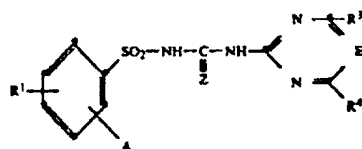
Междинните и крайни продукти, посочени в следващата таблица, се получават по аналогичен начин.

Таблица 1



№	A	Позиция на			Физ. данни
		A	R^1	Q	
1.1	$-CH_2-CH_2-CF_3$	2	H	Cl	т.т. 148-149°C
1.2	$-CH_2-CH_2-CF_3$	2	H	NH_2	
1.3	$-CH_2-CH_2-CF_3$	2	H	$-N=C=O$	масло
1.4	$-CH_2-CH_2-CF_3$	2	H	$-NH-CO-OC_6H_5$	т.т. 116-119°C
1.5	$-CH_2-CH_2-CF_2-CH_3$	2	H	Cl	
1.6	$-CH_2-CH_2-CF_2-CH_3$	2	H	NH_2	
1.7	$-CH_2-CH_2-CF_2-CH_3$	2	H	$-N=C=O$	
1.8	$-CH_2-CH_2-CF_2-CH_3$	2	H	$-NH-CO-O_5C_6H_5$	

Таблица 2



№	A	A	Позиция на			E	Z	т.т.°C
			R ¹	R ³	R ⁴			
2.1	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	2	H	CH ₃	OCH ₃	N	O	157-158
2.2	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	2	H	OCH ₃	OCH ₃	N	O	
2.3	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	2	H	CH ₃	OC ₂ H ₅	N	O	
2.4	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	2	H	C ₂ H ₅	OCH ₃	N	O	
2.5	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	2	H	C ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	N	O	150-152
2.6	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	2	H	OCH ₃	-OCH ₂ -CF ₃	N	O	
2.7	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	2	H	CH ₃	-OCH ₂ -CF ₃	N	O	
2.8	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	2	H	OCH ₃	-N(CH ₃) ₂	N	O	
2.9	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	2	H	OCH ₃	OC ₃ H ₇ -i	N	O	
2.10	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	2	H	SCH ₃	OCH ₃	N	O	
2.11	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	2	H	OCH ₃	-NHCH ₃	N	O	
2.12	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	2	H	CH ₃	CH ₃	N	O	
2.13	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	2	H	SCHF ₂	OCH ₃	N	O	
2.14	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₂ -CH ₃	2	H	CH ₃	OCH ₃	N	O	
2.15	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₂ -CH ₃	2	H	OCH ₃	OCH ₃	N	O	
2.16	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₂ -CH ₃	2	H	CH ₃	OC ₂ H ₅	N	O	
2.17	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₂ -CH ₃	2	H	C ₂ H ₅	OCH ₃	N	O	
2.18	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₂ -CH ₃	2	H	OCH ₃	-N(CH ₃) ₂	N	O	
2.19	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₂ -CH ₃	2	H	OCH ₃	-NHCH ₃	N	O	
2.20	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₂ -CH ₃	2	H	OCH ₃	-OCH ₂ -CF ₃	N	O	

2.21	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	3	H	CH ₃	OCH ₃	N	O	
2.22	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	3	H	OCH ₃	OCH ₃	N	O	
2.23	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	3	H	CH ₃	OC ₂ H ₅	N	O	
2.24	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	3	H	C ₂ H ₅	OCH ₃	N	O	
2.25	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	3	H	OCH ₃	-N(CH ₃) ₂	N	O	
2.26	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	3	H	OCH ₃	-NHCH ₃	N	O	
2.27	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	3	H	OCH ₃	-OCH ₂ -CF ₃		O	
2.28	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	2	H	CH ₃	CH ₃	CH	O	
2.29	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	2	H	CH ₃	OCH ₃	CH	O	174-175
2.30	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	2	H	CH ₃	-OCH ₂ -CF ₃	CH	O	
2.31	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	2	H	CH ₃	OC ₂ H ₅	CH	O	
2.32	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	2	H	OCH ₃	Cl	CH	O	191-192
2.33	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	2	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	O	182-183
2.34	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	2	H	OCH ₃	SCH ₂ F	CH	O	
2.35	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	2	H	OCH ₃	-N(CH ₃) ₂	CH	O	183-184
2.36	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	2	H	OCH ₃	-NHCH ₃	CH	O	
2.37	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	2	H	OCH ₃	CH ₂ F	CH	O	
2.38	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	2	H	OCH ₃	-CF ₃	CH	O	
2.39	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	2	H	OCH ₃	SCH ₃	CH	O	
2.40	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	2	H	OCH ₃	-OCH ₂ -CF ₃	CH	O	
2.41	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	2	H	OCH ₃	-CH ₂ -OCH ₃	CH	O	
2.42	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	2	H	OCH ₃	-CH ₂ -OC ₂ H ₅	CH	O	
2.43	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₂ -CH ₃	2	H	CH ₃	OCH ₃	CH	O	
2.44	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₂ -CH ₃	2	H	CH ₃	OCH ₃	CH	O	
2.45	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₂ -CH ₃	2	H	OCH ₃	Cl	CH	O	
2.46	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₂ -CH ₃	2	H	OCH ₃	-N(CH ₃) ₂	CH	O	
2.47	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₂ -CH ₃	2	H	OCH ₃	CH ₂ F	CH	O	
2.48	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₂ -CH ₃	2	H	OCH ₃	CH ₂ F	CH	O	
2.49	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₂ -CH ₃	2	H	OCH ₃	-CH ₂ -OCH ₃	CH	O	
2.50	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₂ -CH ₃	2	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	O	
2.51	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	3	H	OCH ₃	CH ₃	CH	O	
2.52	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	3	H	CH ₃	CH ₃	CH	O	
2.53	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	3	H	OCH ₃	Cl	CH	O	
2.54	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	3	H	OCH ₃	-N(CH ₃) ₂	CH	O	
2.55	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	3	H	OCH ₃	CH ₂ F	CH	O	
2.56	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	3	H	OCH ₃	-CH ₂ -OCH ₃	CH	O	
2.57	-CH ₂ -CH ₂ -CF ₃	3	H	OCH ₃	OCH ₃	CH	O	

Пример 1. Композиции с активни съставки с формула I, мас. %

(а) Омокренни прахове	(а)	(б)	(в)
Активна съставка	20	60	0,5
Натриев лигносулфонат	5	5	5
Натриев лаурилсулфат	3		
Натриев диизобутилнафталинсулфонат		6	6
Октилфенолполиетиленгликолов етер (7-8 mol етиленов окис)	2	2	
Финодиспергирана силициева киселина	5	27	27
Каолин	67		
Натриев хлорид			59,5

Активната съставка се смесва добре с

40 другите компоненти и сместа се смила по подходящ начин. Получават се омокрени прахове, които, размесени с вода, дават суспензии с подходяща концентрация.

(б) Емулсионен концентрат	мас. %	
	(а)	(б)
Активна съставка	10	1
Октилфенолполиетиленгликолов етер (4-5 mol етиленов окис)	3	3
Калциев додецилбензолсулфонат	3	3
Полигликолов етер на рициновото масло (36 mol етиленов окис)	4	4
Циклохексанон	30	10
Кендолова смес	50	79

Емулсии с необходимата концентрация се получават от емулсионния концентрат чрез разреждане с вода.

(в) Прах	мас. %		5
	(а)	(б)	
Активна съставка	0,1	1	10
Талк	99,9		
Каолин		99	

Приготвянето на праховете за употреба става чрез смесване на активната съставка и носителите и смилаването на сместа в подходяща мелница.

(г) Екструдерен гранулат	мас. %		15
	(а)	(б)	
Активна съставка	10	1	20
Натриев лигносулфонат	2	2	
Карбоксиметилцелулоза	1	1	
Каолин	87	96	

Активната съставка се смесва с другите компоненти, сместа се омокря с вода, екструдира се и полученият екструдат се суши в поток от въздух.

(д) Гранулат с полимерно покритие	мас. %		30
	(а)	(б)	
Активна съставка		3	35
Полиетиленгликол		3	
Каолин		94	

Активната съставка се разпределя равномерно в смес от каолин, омокрен с полиетиленгликол. Така се получава прахообразен гранулат с полимерно покритие.

(е) Суспензионен концентрат	мас. %		40
	(а)	(б)	
Активна съставка	40	5	45
Етиленгликол	10	10	
Нонилфенолетиленгликолов етер (15 mol етиленов окис)	6	1	
Натриев лигносулфонат	10	5	
Карбоксиметилцелулоза	1	1	

37%-ен воден разтвор на формалдехид	0,2	0,2
75%-на водна емулсия на силиконово масло	0,8	0,8
Вода	32	77

Окончателно стритата активна съставка се смесва добре с подсилващите ефекта й компоненти, за да се получи суспензионен концентрат, от който чрез разреждане с вода могат да се получават суспензии с желана концентрация.

(ж) Солев разтвор	мас. %
Активна съставка	5
Изопропиламин	1
Гликолов етер на октилфенолполиетилен (78 mol етиленов окис)	3
Вода	91

Пример В1. Хербицидно действие в периода преди покълване

Пластмасови съдове се запълват с обработен вермикулит (плътност 0,135 g/cm³, адсорбционен капацитет спрямо водата 0,565 l/l). След отделяне на неадсорбиращия вермикулит с водна емулсия в дейонизирана вода на активната съставка с концентрация 70,8 ppm върху повърхността се засяват семена от следните растения: *Nasturtium officinalis*, *Agrostis tennensis*, *Stellaria media*, *Digitaria sanguinalis*. След това пластмасовите съдове се държат в климатична камера при 20°C при изкуствено осветление от около 20 Klx и относителна влажност 70%. По време на периода на покълване от 4 до 5 дни съдовете се покриват със светопропусклив материал, с оглед да се увеличи влажността на въздуха над тях и се поливат с дейонизирана вода. След 5-ия ден към водата се добавят 0,5% търговски течен тор.

Тестът се оценява 12 дни след посяването, като въздействието върху растенията се оценява по следната скала:

- 1 растенията са напълно увредени;
- 2-3 твърде изразено действие;
- 4-6 средно въздействие;
- 7-8 незначително въздействие;
- 9 без въздействие (както необработените контролни растения).

Действие в периода преди покълване
Концентрация на активната съставка в
емулсията: 70,8 ppm

Активна състав- ка №	Изследвани растения			
	Nastur-Stellaria tium		Agro-Digitaria stis	
2.1	2	2	2	7
2.2	2	6	3	7
2.3	2	2	3	4
2.14	3	2	3	4
2.29	1	2	1	2
2.32	1	3	1	5
2.33	1	2	1	3
2.35	1	1	1	1

Пример В2. Проверка на селективното
хербицидно действие в периода преди покъл-
ване на растенията

Растителни семена се посяват в саксии
с диаметър 12-15 cm в парник. Веднага след
това повърхността на почвата се обработва с
водна суспензия или с разтвор на активната
съставка. Тя се прилага в концентрации 500,
125 и 30 g/ha. Саксиите се държат в парника
при температура 22-25°C и относителна влаж-
ност от 50 до 70%. Тестът се оценява след три
седмици като хербицидното въздействие се дава
по скалата от пример В1.

Действие Изп. конц. g акт. съст./ha Тествано растение	Съединение № 2.1		
	500	125	30
Ечемик	7	8	9
Пшеница	8	9	9
Царевица	6	7	9
Alopecurus myos.	2	4	5
Cyperus escul.	2	4	6
Abutilon	1	2	3
Sida spinosa	2	2	3
Xanthium Sp.	2	2	2
Amaranthus ret.	1	2	2
Chenopodium Sp.	2	2	3
Solanum nigrum	3	3	3
Ipomoea	2	2	2
Sinapis	2	2	2
Stellaria	2	2	2
Chrysanthemum leuc.	2	2	2
Viola tricolor	2	2	2
Veronica Sp.	1	1	2

Пример В3. Потискане растежа на тро-
пически бобови покривни култури

Изпитваните растения (*Centrosema
plumieri*, *Centrosema pubescens*) се оставят да
израстат напълно и се подрязват до височина
60 cm. След 7 дни растенията се пръскат с
водна емулсия от изпитваното съединение.
Растенията се държат при 70% отн. влажност
и 6000 lx изкуствена светлина по 14 h дневно,
като температурата през деня е 27°C, а през
нощта 21°C. Оценката се прави след 4 седмици.
Оценява се растежът на растенията, сравнен с
този на контролните, те се претеглят и тогава
се прави преценка за фитотоксичността.
Растенията, които са обработвани с активна
съставка от типа на формула I, показват явна
тенденция към намаляване на растежа си (на-
маляването на растежа е с около 20% в срав-
нение с необработваните контролни растения),
без при това да им са причинени никакви
увреждания.

Пример В4. Регулиране на растежа на
соеви растения

Соя от сорта "Hark" се засява в пласт-
масови контейнери, съдържащи смес от почва,
торф и пясък в съотношение 6:3:1 и се поста-
вя в климатична камера. При оптимална
температура, осветление, добавка на тор и
поливане, растенията се развиват за около 5
седмици на етап 5-6 листа. След това расте-
нията се напръскват добре с воден разтвор на
активната съставка от типа на формула I при
концентрация, не по-малка от 100 g акт. със-
тавка/ha. Констатация за получените резул-
тати се прави след около 5 седмици от време-
то на обработване с активна съставка.
Активните съставки с формула I съгласно изоб-
ретението предизвикват промишлено (с про-
мишлен ефект) увеличаване на теглото и броя
на растенията в засетите площи в сравнение с
броя и теглото на контролните необработени
растения.

Пример В5. Потискане растежа на жит-
ни растения

Житни растения от сорта *Hordeum
vulgare* (пролетен ечемик) и *Secale* (пролетна
ръж) се засяват в пластмасови съдове, съдър-
жащи стерилизирана почва и се държат в
парник, като се поливат според изискванията.
Младите растения се пръскат 21 дни след по-
сяването им с воден разтвор от активна със-
тавка от типа на формула I. Използваната кон-

центрация е не по-малко от 100 g акт. съставка/ha, като растежът на растения се оценява 21 дни след прилагането на активната съставка. Обработваните растения са с намален растеж в сравнение с необработваните контролни растения (растежът на третираните растения е от 60 до 90% от растежа на контролните растения). Наблюдава се също частично увеличаване на диаметъра на стеблата на обработваните растения.

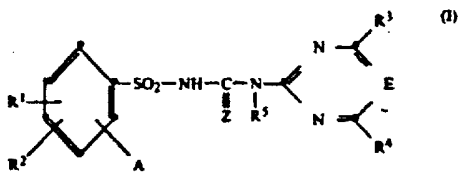
Пример В6. Потискане растежа на тревите *Lolium perenne*.

Триви от сортовете *Poa pratensis*, *Festuca ovina*, *Dactylis glomerata*, *Cynodon dactylon* се засяват в пластмасови съдове, съдържащи смес от почва, торф и пясък в съотношение 6:3:1, поставят се в парник и се поливат според изискванията. Поникиналите триви се подрязват ежеседмично до височина 4 cm, като се пръскат 50 дни след засяването и един ден след последното подрязване с воден разтвор на активната съставка от типа на формула I при концентрация, не по-малка от 100 g акт. съставка/ha. Растежът на тревите се оценява 21 дни след пръскането.

Растежът на тревите се намалява от въздействието на активните съставки с формула I с около 10 до 30% в сравнение с необработените контролни растения.

Патентни претенции

1. N-фенилсулфонил-N'-триазилилуреа с формула I



в която: А е 3,3,3-трифлуоропропил или 3,3-дифлуоробутил; R¹ е водород, халоген, нитро, циано, C₁-C₄алкил, C₁-C₄халоалкил, C₁-C₄алкокси, C₁-C₄алкилтио, C₁-C₄алкилсулфинил, C₁-C₄алкилсулфонил, -COO-R⁶, -NR⁷R⁸, -CO-NR⁹R¹⁰ или -SO₂-NR¹¹R¹²; R² е водород, халоген C₁-C₄алкил, C₁-C₄алкокси, C₁-C₄алкилтио, C₁-C₄алкилсулфинил, C₁-C₄алкилсулфонил; R³ и R⁴, независимо един от друг, означават водород, халоген, C₁-C₄алкил, C₁-C₄халоалкил, C₂-C₄халоалкокси, C₁-C₄алкилтио, C₂-C₄алкоксиалкил, C₁-

C₄алкокси или -NR¹³R¹³; R⁵ е водород, C₁-C₄алкил или C₁-C₄алкокси; R⁶ е C₁-C₄алкокси, C₁-C₄халоалкокси, C₁-C₄алкилтио, C₂-C₆алкоксиалкокси, водород, C₁-C₄алкил или C₁-C₄халоалкил, R⁷, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹² и R¹³, независимо един от друг, означават водород или C₁-C₄алкил, Е е азот и Z - кислород или сяра, както и соли на тези съединения.

2. Азинилурейно съединение съгласно претенция 1, в което R¹ е водород.

3. Азинилурейно съединение съгласно претенция 1, в което R² е водород.

4. Азинилурейно съединение съгласно претенция 1, в което Z е кислород.

5. Азинилурейно съединение съгласно претенция 1, в което R⁵ е водород.

6. Азинилурейно съединение съгласно претенция 1, в което R³ и R⁴ заедно съдържат най-много 4 въглеродни атома.

7. Азинилурейно съединение съгласно претенция 1, в което радикалът А заема 2 място във фенилния пръстен.

8. Азинилурейно съединение съгласно претенция 1, в което R¹, R² и R⁵ са водород, а Z е кислород.

9. Азинилурейно съединение съгласно претенция 1, в което R³ и R⁴ заедно съдържат най-много 4 въглеродни атома и радикалът А заема 2 място във фенилния пръстен.

10. Азинилурейно съединение съгласно претенция 1, в което R¹, R² и R⁵ са водород, а Z е кислород, R³ и R⁴ заедно съдържат най-много 4 въглеродни атома и радикалът А заема 2 място във фенилния пръстен.

11. N-[2-(3,3,3-трифлуоропропил)-фенилсулфонил]-N'-(4,6-диметокси-1,3,5-триазин-2-ил)уреа съгласно претенция 1.

12. N-[2-(3,3-дифлуоробутил)-фенилсулфонил]-N'-(4-метокси-6-метил-1,3,5-триазин-2-ил)уреа съгласно претенция 1.

13. N-[2-(3,3,3-трифлуоропропил)-фенилсулфонил]-N'-(4-метокси-6-метил-1,3,5-триазин-2-ил)уреа съгласно претенция 1.

14. Хербициден и регулиращ развитието на растенията състав, характеризиращ се с това, че като активна съставка съдържа N-фенилсулфонил-N'-триазилилуреа съгласно претенция 1 заедно с носител и/или с други добавки.

15. Метод за контрол на нежеланото развитие на растения, характеризиращ се с това, че се състои в прилагане върху растенията

или към мястото на засаждането им на ефективно количество от N-фенилсулфонил-N'-триазинилуреа съгласно претенция 1 или на състав, който я съдържа като активна съставка.

16. Метод за регулиране развитието на растения, характеризиращ се с това, че се състои в прилагане върху растенията или към мястото на засаждането им на ефективно количество от N-фенилсулфонил-N'-триазинилуреа съгласно претенция 1 или на състав, който я съдържа като активна съставка.

17. Метод за селективен контрол преди и след появата на плевели при посеви от култивирани растения, характеризиращ се с това, че се състои в прилагане върху растенията или към мястото на засаждането им на ефективно количество от N-фенилсулфонил-N'-триазинилуреа с формула I или на състав, който я съдържа като активна съставка съгласно претенция 15.

18. Метод за спиране развитието на растения преди двулистния стадий, характеризиращ се с това, че се състои в прилагане върху засятата площ, преди поникването на растенията, на ефективно количество от N-

фенилсулфонил-N'-триазинилуреа с формула I или на състав, който я съдържа като активна съставка съгласно претенция 16.

19. Метод съгласно претенция 17, характеризиращ се с това, че се прилага върху захарна тръстика, житни растения, царевица и памук.

20. Метод съгласно претенция 17, характеризиращ се с това, че се прилага върху соеви посеви.

21. Метод съгласно претенция 17, характеризиращ се с това, че се прилага върху оризови посеви.

22. Метод за регулиране развитието на култивирани растения с цел увеличаване на добивите, характеризиращ се с това, че се състои в прилагане върху засятата площ на ефективно количество от N-фенилсулфонил-N'-триазинилуреа съгласно претенция 1 или на състав, който я съдържа като активна съставка.

23. Метод съгласно претенция 22, характеризиращ се с това, че се прилага върху соеви посеви.

24. Метод съгласно претенция 22, характеризиращ се с това, че се прилага върху бобови посеви.

Издание на Патентното ведомство на Република България
1113 София, бул. "Д-р Г. М. Димитров" 52-Б

Експерт: Г.Тодоров

Редактор: Р.Николова

Пор. № 38755

Тираж: 40 СК