

Ausschliessungspatent

Erteilt gemäß § 5 Absatz 1 des Änderungsgesetzes
zum Patentgesetz

ISSN 0433-6461

(11) **202 798**

Int.Cl.³ 3(51) A 01 N 25/32
A 01 N 43/54

AMT FÜR ERFINDUNGS- UND PATENTWESEN

In der vom Anmelder eingereichten Fassung veröffentlicht

(21) AP A 01 N/ 2360 965
(31) 9522/80-3;2363/81-3

(22) 22.12.81
(32) 23.12.80;08.04.81

(44) 05.10.83
(33) CH;CH

(71) siehe (73)
(72) BURDESKA, KURT, DR.; DE; KABAS, GUGLIELMO, DR.; CH; BRUNNER, HANS-GEORG, DR.; CH;
FOERY, WERNER, DR.; CH;
(73) CIBA-GEIGY AG, BASEL, CH
(74) IPB (INTERNATIONALES PATENTBUERO BERLIN 60 235/18/35/37 1020 BERLIN WALLSTR.
23/24

(54) **MITTEL ZUM SCHÜTZEN VON KULTURPFLANZEN VOR DURCH HERBIZIDE VERURSACHTE
PHYTOTOXISCHE SCHÄDEN**

(57) Die Erfindung betrifft Mittel zum Schützen von Kulturpflanzen vor der phytotoxischen Wirkung von Herbiziden für die Anwendung in empfindlichen landwirtschaftlichen Kulturen wie Hirse, Getreide, Mais, Reis. Ziel ist die Bereitstellung eines (Gegen-) Mittels, daß die phytotoxische Wirkung auf die Kulturpflanzen annehmbar verringert, so daß eine totale Verträglichkeit besteht. Erfindungsgemäß enthalten die neuen Mittel als Wirkstoff Phenylpyrimidine der Formel I, worin beispielsweise R Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyan, ein gegebenenfalls substituierter aliphatischer Oxy- oder Mercaptoest oder Oxycarbonylrest u. a.; R₁ und R₂ unabhängig voneinander je Wasserstoff, Halogen, Cyan, einen gegebenenfalls substituierten Alkyl-, oder einen gegebenenfalls substituierten Phenylrest u. a.; R₂ Wasserstoff, Halogen sowie einen gegebenenfalls substituierten Phenyl-, Alkyl-, Alkenyl- oder Alkinyrest und n eine Zahl von 1 bis 5 bedeuten. Als Herbizide, die zusammen mit den erfindungsgemäßen Mitteln verwendet werden, kommen solche der Klassen Halogenacetanilide, Halogenacetamide, Thiolcarbamate, Carbamate, Nitroanilide, Triazine, Phenylharnstoffe, Halogenessigsäuren, Phenoxy- und Pyridyloxy-phenoxyalkan-carbonsäurederivate, Benzoessäurederivate etc. in Frage. Formel I

236096 5 -1-

Berlin, den 18. 6. 82

AP A 01 N/236 096/5

60 235 18

Mittel zum Schützen von Kulturpflanzen

Anwendungsgebiet der Erfindung

Die Erfindung betrifft ein Mittel zum Schützen von Kulturpflanzen vor der phytotoxischen Wirkung von Herbiziden für die Anwendung in landwirtschaftlichen Kulturen.

Charakteristik der bekannten technischen Lösungen

Als Gegenmittel oder Antidote sind schon verschiedene Stoffe vorgeschlagen worden, welche befähigt sind, die schädigende Wirkung eines Herbizides auf die Kulturpflanze spezifisch zu antagonisieren, d. h. die Kulturpflanze zu schützen, ohne dabei die Herbizidwirkung auf die zu bekämpfenden Unkräuter merklich zu beeinflussen. Dabei kann ein solches Gegenmittel, auch Safener genannt, je nach seinen Eigenschaften, zur Vorbehandlung des Saatgutes der Kulturpflanze (Beizung des Samens oder der Stecklinge) oder vor der Saat in die Saatfurchen oder als Tankmischung zusammen mit dem Herbizid vor oder nach dem Auflaufen der Pflanzen verwendet werden.

So beschreibt die GB-PS 1 277 557 die Behandlung von Samen bzw. Sprößlingen von Weizen und Hirse mit gewissen Oxamsäureestern und Amiden vor dem Angriff durch N-Methoxymethyl-2', 6'-diäthyl-chlor-acetanilid (Alachlor). In andere Literaturstellen (DE-OS 1 952 910, DE-OS 2 245 471, FR-PS 2 021 611) werden Gegenmittel zur Behandlung von Getreide, Mais- und Reis-Samen zum Schutz gegen den Angriff herbizider Thiolcarbamate vorgeschlagen. In der DE-PS 1 576 676 und der US-PS 3 131 509 werden Hydroxy-amino-acetanilide und Hydantoine für den Schutz von Getreidesamen gegenüber Carbamaten wie

236096 5

18. 6. 82

AP A 01 N/236 096/5

60 235 18

²
- 14 -

IPC, CIPC etc. vorgeschlagen. In der weiteren Entwicklung haben sich alle diese Präparate jedoch als ungenügend erwiesen.

Ziel der Erfindung

Ziel der Erfindung ist die Bereitstellung neuer Mittel zur Behandlung empfindlicher landwirtschaftlicher Kulturen wie Hirse, Getreide, Mais und vor allem Reis mit Herbiziden, welche keine phytotoxischen Schäden an den Kulturpflanzen verursachen ohne daß die Herbizidwirkung den Unkräutern gegenüber abnimmt.

Darlegung des Wesens der Erfindung

Der Erfindung liegt die Aufgabe zugrunde, eine Verbindung aufzufinden, die als Wirkstoff in einem (Gegen-)Mittel geeignet ist, das, wenn zusammen mit dem Herbizid appliziert, spezifisch die phytotoxische Wirkung auf die Kulturpflanze soweit verringert, daß eine annehmbare, wenn möglich totale Verträglichkeit besteht.

Die vorliegende Erfindung betrifft daher ein Verfahren sowie ein Mittel zum Schützen von Kulturpflanzen vor der phytotoxischen Wirkung von Herbiziden. Dabei werden Phenylpyrimidine der untenstehenden Formel I gleichzeitig oder in kurzer Folge mit dem Herbizid den Kulturpflanzungen appliziert oder es wird ein Mittel, welches neben dem Herbizid noch ein Phenylpyrimidin der Formel I enthält, angewendet.

236096 5

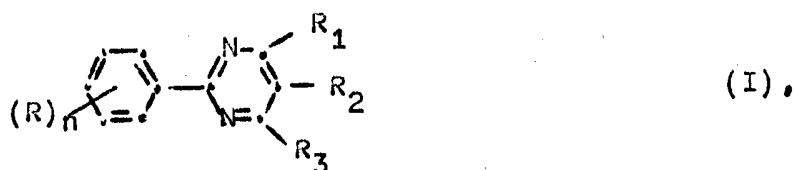
18. 6. 82

AP A 01 N/236 096/5

60 235 18

- ³/₁₆ -

Die Phenylpyrimidine entsprechen der Formel I



worin

n eine Zahl von 1 bis 5

R Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyan, ein gegebenenfalls substituierter aliphatischer Oxy- oder Mercptorest oder Oxycarbonylrest, eine gegebenenfalls substituierte Amino-, Carbonyl-, Thiocarbonyl-, Sulfamoyl- oder Ketalgruppe, den Diäthylphosphorsäurerest oder einen gegebenenfalls substituierten Alkyl-, Alkenyl- oder Alkinylrest,

R₁ und R₂ unabhängig voneinander je Wasserstoff, Halogen, Cyan, eine gegebenenfalls substituierte Alkyl-, Imino- gruppe, eine aliphatische Oxy- oder Mercapto- oder Carbonylrest oder einen gegebenenfalls substituierten Phenylrest,

236096 5 - 2 - 4 -

R₂ Wasserstoff, Halogen sowie einen gegebenenfalls substituierten Phenyl-, Alkyl-, Alkenyl- oder Alkinylrest bedeuten.

Spezifisch bedeuten dabei

R Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyan, -XR₅, -NR₆R₇, -CO-A, -CS-NR₆R₇, -SO₂-NR₆R₇, C(OR₄)₂-R₄, , -PO(OR₄)₂, -SO₃H, -N=CR₈R₉, eine

unsubstituierte oder durch Halogen, -XR₅, -NR₆R₇, -PO(OR₄)₂, -CO-A oder Cyan substituierte C₁-C₆-Alkyl- oder C₃-C₆-Cycloalkylgruppe oder eine unsubstituierte oder durch Halogen oder -XR₄ substituierte C₂-C₆-Alkenyl-, C₃-C₆-Cycloalkyl- oder C₂-C₆-Alkinylgruppe,

R₁ und R₃ unabhängig voneinander je Wasserstoff, Halogen, C₁-C₆-Alkyl, Cyan, -CO-A, -NR₆R₇, -XR₅ oder unsubstituiertes oder durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl, Nitro oder -XR₅ substituiertes Phenyl,

R₂ Wasserstoff, Halogen, unsubstituiertes oder durch Halogen, C₁-C₄-Alkyl, Trifluormethyl, Nitro oder -XR₅ substituiertes Phenyl oder eine unsubstituierte oder durch Halogen oder -XR₅ substituierte C₁-C₆-Alkyl-, C₃-C₆-Cycloalkyl-, C₂-C₆-Alkenyl- oder C₂-C₆-Alkinylgruppe,

R₄ Wasserstoff, eine unsubstituierte oder durch Halogen, -CO-A, Hydroxy, C₁-C₆-Alkoxy oder -NR₆R₇ substituierte C₁-C₆-Alkyl- oder C₃-C₆-Alkenyl- oder C₂-C₆-Alkinylgruppe,

R₅ dasselbe wie R₄, ausserdem C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₃-C₆-Alkenylcarbonyl, C₃-C₆-Alkinylcarbonyl,

R₆ und R₇ unabhängig voneinander je Wasserstoff, C₃-C₆-Alkenyl, C₃-C₆-Alkinyl, C₃-C₆-Cycloalkyl oder unsubstituiertes oder durch -CO-A substituiertes C₁-C₆ Alkyl, oder einer der Reste R₆ und R₇ bedeutet eine Gruppe -COA oder -OR₄ oder

R₆ und R₇ zusammen eine 4- bis 6-gliedrige Alkylenkette, die durch Sauerstoff, Schwefel, eine Imino- oder C₁-C₄-Alkylaminogruppe unterbrochen sein kann,

B eine verzweigte oder unverzweigte C₁-C₆-Alkylenkette und

X Sauerstoff, Schwefel, -SO- oder -SO₂- bedeuten,

236096 5 - 8 - 5 -

A die gleiche Bedeutung wie R_4 hat oder für $-OR_4$ oder $-NR_6R_7$ steht,
 R_8 unsubstituiertes oder durch C_1-C_6 -Alkoxy substituiertes C_1-C_6 Alkyl,
 R_9 Wasserstoff oder dasselbe wie R_8 oder
 R_8 und R_9 zusammen eine 4-5-gliedrige Alkylenkette bedeuten.

Der Ausdruck Alkyl allein oder als Teil eines Substituenten umfasst verzweigte oder unverzweigte Alkylgruppen, welche die angegebene Anzahl Kohlenstoffatome enthalten. Beispiele sind Methyl, Aethyl, Propyl, Isopropyl, Butyl, Isobutyl, sec.-Butyl, tert.-Butyl, sowie die höheren Homologen Amyl, Isoamyl, Hexyl, Heptyl, Octyl samt ihren Isomeren. Entsprechend können die Alkenyl- und Alkynylgruppen geradkettig oder verzweigt sein. Cycloalkylgruppen sind Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl und Cyclohexyl.

Die Phenylpyrimidine der Formel I eignen sich hervorragend, Kulturpflanzen wie Kulturhirse, Reis, Mais, Getreidearten (Weizen, Roggen, Gerste, Hafer), Baumwolle, Zuckerrüben, Zuckerrohr, Soja etc. vor dem Angriff von pflanzenaggressiven Agrarchemikalien, insbesondere von Herbiziden verschiedenster Stoffklassen, wie Triazinen, Phenylharnstoffderivaten, Carbamaten, Thiolcarbamaten, Halogenacetaniliden, Halogenphenoxyessigsäureestern, substituierte Phenoxyphenoxyessigsäureestern und -propionsäureestern, substituierten Pyridinoxyphenoxy-essigsäureestern und -propionsäureestern, Benzoessäurederivaten usw. zu schützen, sofern diese nicht oder nicht genügend selektiv wirken, also neben den zu bekämpfenden Unkräutern auch die Kulturpflanzen mehr oder weniger schädigen. Die Erfindung betrifft auch Mittel, welche diese Phenylpyrimidine der Formel I zusammen mit Herbiziden enthalten.

Unter den Verbindungen der Formel I haben sich vor allem diejenigen bewährt, in denen

n eine Zahl von 1 bis 5

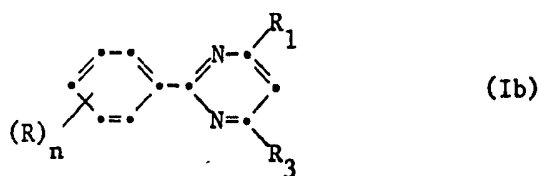
R Wasserstoff, Halogen, Cyan, Nitro oder Hydroxyl, eine C_1-C_6 -Alkyl-, C_1-C_6 Alkoxy- oder C_1-C_6 -Alkylthiogruppe, die unsubstituiert oder

durch Halogen, C_1-C_6 -Alkoxy, C_2-C_{12} -Alkoxyalkyl, C_1-C_6 -Alkylcarbonyl, C_1-C_6 Alkylcarbonyloxy, C_1-C_6 -Alkoxycarbonyl, C_2-C_6 -Alkenyl- oder -Alkynylcarbonyl, $Di(C_1-C_6)$ alkylamino, C_1-C_6 Alkylendioxy, Phosphonyl- oder C_1-C_6 Alkylphosphonyl substituiert ist; eine C_2-C_6 -Alkenyl- oder C_2-C_6 -Alkenyloxygruppe der Formyl- oder Carboxylrest; eine Carbonyl- oder Carbonyloxygruppe, die durch C_1-C_6 Alkyl, C_1-C_6 Alkoxy, C_2-C_6 Alkenyl, C_2-C_6 Alkynyl, Amino, $Di(C_1-C_6)$ di-alkylamino oder einen über das Stickstoffatom gebundenen 5-6-gliedrigen, gesättigten Heterocyclus substituiert ist; eine Aminogruppe die unsubstituiert oder durch C_1-C_6 Alkyl, C_1-C_6 Alkoxy, C_1-C_6 Alkylcarbonyl substituiert ist; ein Ureidorest, der unsubstituiert oder durch C_1-C_6 Alkyl oder durch C_1-C_6 Alkoxy substituiert ist,

R_1 und R_3 unabhängig voneinander Halogen, Cyan, Hydroxy, einen C_1-C_6 -Alkyl-, C_1-C_6 Alkoxy- oder C_1-C_6 Alkylthiorest, der unsubstituiert oder durch Halogen, C_1-C_6 Alkoxy substituiert sein kann, einen C_2-C_6 Alkenyl- oder einen C_2-C_6 Alkynylrest, oder C_3-C_6 Cycloalkylrest, eine Amino-, C_1-C_6 Alkylimino- oder $Di(C_1-C_6)$ Alkylamino- gruppe, einen über das Stickstoffatom gebundenen 5-6-gliedrigen gesättigten Heterocyclus, Phenyl oder Phenoxy,

R_2 Wasserstoff, Halogen, C_1-C_6 Alkyl, Phenyl oder Formyl bedeuten.

Als besonders geeignete Gegenmittel haben sich die Phenylpyrimidine der Formel Ib erwiesen



worin n , R , R_1 und R_3 den oben gegebenen allgemeinen und vor allem restriktiveren Bedeutungen entsprechen.

Wichtig sind diejenigen Verbindungen, in denen n eine Zahl von 1-3, R Wasserstoff, Halogen, Cyan, Hydroxy oder Mercapto, eine C_1-C_6 Alkyl-, C_1-C_6 Alkoxy oder C_1-C_6 Alkylthiogruppe, die unsubstituiert oder

18. 6. 82

AP A 01 N/236 096/5

60 235 18

236096 5

- 5 - 7 -

Halogen oder C_1-C_6 Alkoxy substituiert ist, eine C_2-C_6 Alkenyl-, C_2-C_6 Alkynyl oder C_3-C_6 Cycloalkylgruppe, der Phenyl, Carboxyl oder Formylrest oder Aminorest, Carbamoylrest, eine C_1-C_6 Alkylcarbonyl-, C_1-C_6 Alkylamino-, $Di(C_1-C_6 \text{ Alkyl})$ -amino-, $Di(C_1-C_6\text{-Alkyl})$ carbamoylgruppe, oder zwei benachbarte Reste R bilden eine C_1-C_6 Alkylendioxygruppe,

R_1 und R_3 unabhängig voneinander Halogen, Hydroxy, C_1-C_6 Alkyl, C_1-C_6 Alkoxy,

unter diesen wiederum wirkten diejenigen am besten, in denen R_1 und R_3 je ein Halogenatom, insbesondere Chlor und worin sich R in der meta- oder para-Stellung in bezug auf den Pyrimidinring befinden.

Ueberraschenderweise besitzen Phenylpyrimidine der Formel I die Eigenschaft, Kulturpflanzen vor dem Angriff pflanzenaggressiver Agrarchemikalien zu schützen, insbesondere vor Herbiziden der verschiedensten Stoffklassen, wie beispielsweise Chloracetanilide, Chloracetamide, Carbamate und Thiocarbamate, Diphenyläther und Nitrodiphenyläther, Benzoessäurederivate, Triazine und Triazinone, Phenylharnstoffe, Nitroaniline, Oxdiazolone, Pyridyloxyphenoxyderivate, Phosphate und Pyrazole, sofern diese nicht oder ungenügend kulturentolerant sind.

Vorzugsweise werden die Herbizide der Klassen Chloracetanilide, Chloracetamide, Thiocarbamate, Phosphate durch die erfindungsgemässen Phenylpyrimidine geschützt.

Ein solches Gegenmittel oder Antidote der Formel I kann je nach Anwendungszweck zur Vorbehandlung des Saatgutes der Kulturpflanze (Beizung des Samens oder der Stecklinge) eingesetzt oder vor oder nach der Saat in den Erdboden gegeben werden oder aber für sich allein oder zusammen mit dem Herbizid vor oder nach dem Auflaufen der Pflanzen appliziert werden. Die Behandlung der Pflanze oder des Saatgutes mit dem Antidote kann daher grundsätzlich unabhängig vom Zeitpunkt der Applikation der phytotoxischen Chemikalie erfolgen. Sie kann jedoch auch gleichzeitig durchgeführt werden (Tankmischung). Vorauflauf-Behandlung schliesst sowohl die Behandlung der Anbaufläche vor der Aussaat (ppi = "pre plant incorporation") als auch die Behandlung der angesäten, aber noch nicht bewachsenen Anbauflächen ein.

Die Aufwandmengen des Antidotes im Verhältnis zum Herbizid richten sich weitgehend nach der Anwendungsart. Sofern eine Feldbehandlung vorgenommen wird, entweder als Tankmischung oder bei getrennter Applikation von Herbizid und Gegenmittel, verhalten sich die Mengen von Gegenmittel zu Herbizid in der Regel wie 1:100 bis 10:1, bevorzugt wird jedoch der Bereich 1:5 bis 8:1, besonders 1:1.

Bei Samenbeizung und ähnlich gezielten Schutzmassnahmen werden jedoch weit geringere Mengen Gegenmittel im Vergleich mit den z.B. später pro Hektar Anbaufläche verwendeten Herbizidmengen benötigt. Bei der Samenbeizung werden üblicherweise pro kg Samen 0,1-10 g Gegenmittel benötigt, die bevorzugte Menge liegt zwischen 1 und 2 Gramm. Falls das Gegenmittel kurz vor der Aussaat durch Samenquellung appliziert werden soll, werden z.B. Gegenmittel-Lösungen, welche den Wirkstoff in einer Konzentration von 1-10 000 ppm enthalten, bevorzugt 100-1000 ppm, verwendet.

In der Regel folgen sich protektive Massnahmen wie Samenbeizung mit einem Gegenmittel der Formel I und mögliche spätere Feldbehandlung mit Agrarchemikalien in zeitlich grösserem Abstand. Vorbehandeltes Saat- und Pflanzengut kann später in Landwirtschaft, Gartenbau und Forstwirtschaft mit unterschiedlichen Chemikalien in Berührung kommen. Die Erfindung bezieht sich daher auch auf kulturpflanzenprotektive Mittel, die als Wirkstoff ein Gegenmittel der Formel I zusammen mit üblichen Trägerstoffen enthalten. Solche Mittel können gegebenenfalls zusätzlich mit jenen Agrarchemikalien gemischt sein, vor deren Einfluss die Kulturpflanze geschützt werden soll, z.B. mit einem Herbizid.

Als Kulturpflanzen gelten im Rahmen vorliegender Erfindung alle Pflanzen, die in irgendeiner Form Ertragsstoffe produzieren (Samen, Wurzeln, Stengel, Knollen, Blätter, Blüten, Inhaltsstoffe wie Öle, Zucker, Stärke, Eiweiss etc.) und zu diesem Zweck angebaut und gehegt werden. Zu diesen Pflanzen gehören beispielsweise sämtliche Getreidearten, Weizen, Roggen, Gerste, Hafer, daneben vor allem Reis, Kulturhirse, Mais, aber auch Baumwolle, Zuckerrüben, Zuckerrohr, Soja, Bohnen, Erbsen.

Das Gegenmittel soll überall dort eingesetzt werden, wo eine Kulturpflanze vor der Phytotoxizität einer Chemikalie geschützt werden soll.

Als Herbizide, vor deren Wirkung es die Kulturpflanzen zu schützen gilt, seien beispielsweise folgende genannt:

Chloracetanilide: 2-Chlor-2',6'-diäthyl-N-(2"-propyloxyäthyl)acetanilid ("Propalochlor"), 2-Chlor-6'-äthyl-N-(2"-methoxy-1"-methyläthyl)-acet-o-toluidid ("Metolachlor"), 2-Chlor-2',6'-diäthyl-N-(butoxymethyl)acetanilid ("Butachlor"), 2-Chlor-6'-äthyl-N-(äthoxymethyl)acet-o-toluidid ("Acetochlor"), 2-Chlor-6'-äthyl-N-(2"-propoxy-1"-methyläthyl)acet-o-toluidid, 2-Chlor-2',6'-dimethyl-N-(2"-methoxy-1"-methyläthyl)acetanilid, 2-Chlor-2',6'-dimethyl-N-(2"-methoxyäthyl)acetanilid ("Dimethachlor"), 2-Chlor-2',6'-diäthyl-N-(pyrazol-1-ylmethyl)acetanilid, 2-Chlor-6'-äthyl-N-(pyrazol-1-ylmethyl)acet-o-toluidid, 2-Chlor-6'-äthyl-N-(3,5-dimethyl-pyrazol-1-ylmethyl)acet-o-toluidid, 2-Chlor-6'-äthyl-N-(2"-butoxy-1"-methyläthyl)acet-o-toluidid ("Metazolachlor"), 2-Chlor-6'-äthyl-N-(2"-butoxyl-1"-(methyläthyl)acet-o-toluidid, 2-Chlor-2'-trimethylsilyl-N-(butoxymethyl)-acetanilid, 2-Chlor-2',6'-diäthyl-N-(methoxymethyl)acetanilid ("Alachlor") und 2-Chlor-2',6'-diäthyl-N-(äthoxycarbonylmethyl)acetanilid.

Chloracetamide: N-[1-Isopropyl-2-methylpropen-1-yl-(1)]-N-(2'-methoxyäthyl)-chloracetamid.

Carbamate und Thiocarbamate: N(3',4'-Dichlorphenyl)-propionanilid ("propanil"), S-4-Chlorbenzyl-diäthyl-thiocarbamat ("Thiobencarb"), S-Aethyl-N,N-hexamethylen-thiocarbamat ("Molinate"), S-Aethyl-dipropylthiocarbamat ("EPTC"), N,N-di-sec-Butyl-S-benzyl-thiocarbamat (Drepanon), S-(2,3-Dichlorallyl)-di-isopropylthiocarbamat und S(2,3,3-Trichlorallyl)-di-isopropylthiocarbamat ("Di- und Tri-allate"), 1-(Propylthiocarbonyl)-decahydro-chinaldin, S-4-Benzyl-diäthylthiocarbamat sowie entsprechende Sulfinylcarbamate.

Diphenyläther und Nitrodiphenyläther: 2,4-Dichlorphenyl-4'-nitrophenyl-äther ("Nitrofen"), 2-Chlor-1-(3'-äthoxy-4'-nitrophenoxy)-4-trifluormethyl-benzol ("Oxyfluorfen"), 2',4'-Dichlorphenyl-3-methoxy-4-nitrophenyl-äther ("Chlormethoxinyl"), 2-[4'-(2",4"-Dichlorphenoxy)-phenoxy]propionsäure-methylester, N-(2'-Methoxyäthyl)-2-[5'-(2"-chlor-4"-trifluormethylphenoxy)-phenoxy]-propionsäureamid.

Benzoessäurederivate: Methyl-5-(2',4'-dichlorphenoxy)-2-nitrobenzoat ("Bifenox"), 5-(2'-Chlor-4'-trifluormethylphenoxy)-2-nitrobenzoessäure ("Acifluorfen"), 2,6-Dichlorbenzonitril ("Dichlobenil").

Triazine und Triazinone: 2,4-Bis(isopropylamino)-6-methylthio-1,3,5-triazin ("Prometryn"), 2,4-bis(äthylamino)-6-methylthio-1,3,5-triazin ("Simetryn"), 2-(1',2'-Dimethylpropylamino)-4-äthylamino-6-methylthio-1,3,5-triazin ("Dimethametryn"), 4-Amino-6-tert.butyl-4,5-dihydro-3-methylthio-1,2,4-triazin-5-on ("Metribuzin").

Phenylharnstoffe: N-(3'-Isopropylphenyl)-N',N'-dimethyl-harnstoff ("Isoproturon"), N-(3',4'-Dimethylbenzyl)-N'-4-tolyl-harnstoff ("Dimuron"), N-(3'-Chlor-4'-isopropylphenyl)-N',N'-(3-methyl-pentamethylen-1,5-yl)-harnstoff.

Nitroaniline: 2,6-Dinitro-N,N-dipropyl-4-trifluormethylanilin ("Trifluralin"), N-(1'-Äthylpropyl)-2,6-dinitro-3,4-xylidin ("Pendimethalin").

Oxadiazolone: 5-tert.-Butyl-3-(2',4'-dichlor-5'-isopropoxyphenyl)-1,3,4-oxadiazol-2-on ("Oxdiazon").

Pyridyloxyphenoxyderivate: 2-[4'-(3",5"-Dichlorpyridyl-2"-oxy)phenoxy]-propionsäure-(2-propinyl)ester.

Phosphate: S-2-Methylpiperidino-carbonylmethyl-0,0-dipropyl-phosphorodithioat ("Piperophos").

Pyrazole: 1,3-Dimethyl-4-(2',4'-dichlorbenzoyl)-5-(4'-tolylsulfonyloxy)-pyrazol.

18. 6. 82

AP A 01 N/236 096/5

60 235 18

236096 5 - 10 - 12 -

Das als Gegenmittel wirkende Phenylpyrimidin der Formel I kann wahlweise vor oder nach Applikation der Agrarchemikalie oder auch gleichzeitig mit der Agrarchemikalie angewendet werden.

Viele erfindungsgemäße Phenylpyrimidine sind neu, andere sind bekannte Verbindungen. Phenylpyrimidine werden als Zwischenprodukte in der Farbstoffherstellung benutzt, siehe z. B. GB-PS 1 502 912 oder die publizierten EP-OS No. 20 298 und 31 796. Man trifft sie ebenfalls als Zwischenprodukte von pharmakologisch aktiven Verbindungen, s. J. Med. Chem. 1978 (21), p. 123 - 126 oder sonst in der chemischen Literatur Bull. Soc. Chem. Jap. 44 (8), p. 2182-5 (1971).

Bekannt sind 2-Phenyl-4,6-dichloro- und 4,6-difluoro-pyrimidin, ferner die 2-Phenyl-4,6-Dichlorpyrimidine, die in der 4-Stellung des Phenylringes durch Chlor, C_1 - C_2 -Alkyl, C_1 - C_3 -Alkoxy oder eine Gruppe $-CCl_3$, $-CH_2Br$, $-COOH$ oder $-CH_2PO(OC_2H_5)$ substituiert sind, ferner diejenigen, welche in der 3-Stellung des Phenylringes durch Methyl, Methoxy, Chlor, Fluor, Nitro, Amino, CCl_3 oder $COOH$ substituiert sind sowie diejenigen, die in der 3- und 4-Stellung durch die Paare 3,4-Dichlor-4-methyl-3-nitro-, 3-Chlor-4-methyl und 4-Aethoxy-3-nitro substituiert sind.

Neu sind die Phenylpyrimidine der Formel Ib, worin R_1 und R_2 Halogen bedeuten, mit Ausnahme der oben erwähnten Verbindungen. Die neuen Verbindungen können in folgende Untergruppen eingeteilt werden:

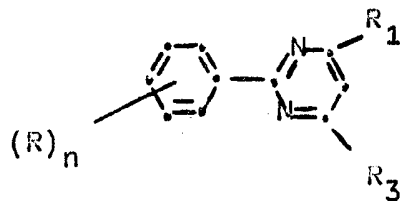
18. 6. 82

AP A 01 N/236 096/5

60 235 18

236096 5

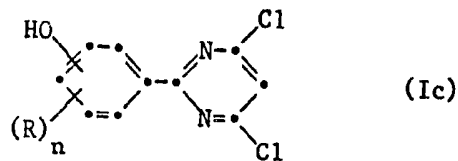
- 10a - 13 -



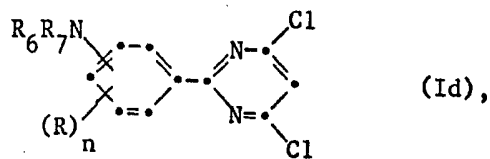
(Ib)

worin R_1 Fluor, Brom oder Jod, R_2 Fluor, Chlor, Brom oder Jod bedeuten, während n und R den unter Formel I gegebenen Bedeutungen entsprechen, wobei R nicht Wasserstoff sein darf, wenn R_1 und R_3 Fluor bedeuten.

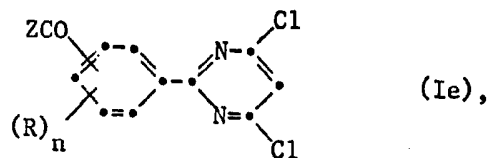
236096 5 - 14 -



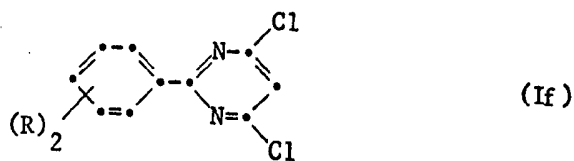
worin n eine Zahl von 1 bis 4 bedeutet und R der unter Formel I gegebenen Bedeutung entspricht,



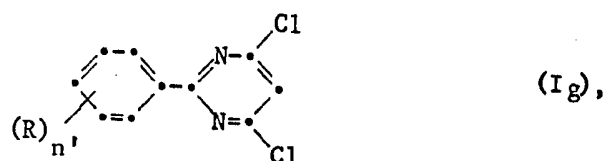
worin R, R₆ und R₇ die unter Formel I gegebene Bedeutung haben und n eine Zahl von 1 bis 4 bedeutet,



worin Z einen Rest R₅, NR₇R₈, OR₄ falls R₄ nicht Wasserstoff bedeutet, darstellt und R, R₄, R₅, R₇ und R₈ die unter Formel I gegebene Bedeutung haben und n eine Zahl von 1 bis 4 bedeutet,

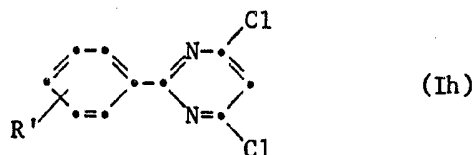


worin die R unabhängig voneinander die unter Formel I gegebene Bedeutung haben, mit Ausnahme von Wasserstoff und der Paare para meta Dichlor, para Chlor/meta Methyl, para Methyl/meta Nitro und para Aethoxy/meta Nitro.



236096 5 - 12 - 15 -

worin R die im Anspruch 1 gegebene Bedeutung hat mit Ausnahme von Wasserstoff, und n eine Zahl von 3-5 bedeutet.



worin R' Fluor in der ortho- oder para-Position zum Pyrimidylrest, Chlor, in der ortho-Stellung zum Pyrimidylrest, Brom, Jod, Trifluormethyl, Dichlormethyl, Chlormethyl, Difluorchlormethyl, Cyan oder einen Rest $-OR'_5$, $-SR_5$, $-SOR_5$, $-SO_2R_5$, $-NR_6R_7$, $-COA$, $-SCNR_6R_7$, $-SO_2NR_6R_7$, $-C(OR_4)_2R_4$, $-CR_4$, $PO(OR_4)_2$, $-SO_3H$, $-N=CR_8R_9$, eine unsubstituierte

 C_3-C_6 Alkyl- oder C_3-C_6 Cycloalkylgruppe oder eine durch $-XR_5$, $-NR_6R_7$, $-PO(OR_4)_2-COA$ oder Cyan substituierte C_1-C_6 -Alkyl- oder C_3-C_6 -Cycloalkylgruppe oder eine durch Halogen, $PO(OR_5)_2$ substituierte C_1-C_6 Alkyl oder C_3-C_6 Cycloalkylgruppe eine unsubstituierte oder durch Halogen oder XR_5 substituierte C_2-C_6 -Alkenyl-, C_3-C_6 -Cycloalkenyl- oder C_2-C_6 Alkinylgruppe, worin R_5 , R_6 , R_7 , R_8 , R_9 , A und B die unter Formel I gegebene Bedeutung haben, während R'_5 eine unsubstituierte C_4-C_6 -Alkyl-, C_3-C_6 -Alkenyl-, oder C_3-C_6 -Alkinylgruppe, oder eine durch Halogen, $-CO-A$, Hydroxy, C_1-C_6 -Alkoxy, C_1-C_6 -Alkenylthio oder $-NR_6R_7$ substituierte C_1-C_6 -Alkyl-, C_3-C_6 -Alkenylgruppe, oder eine C_2-C_6 -Alkylcarbonyl-, C_3-C_6 -Alkenylcarbonyl- oder eine C_3-C_6 -Alkinylcarbonylgruppe bedeutet.

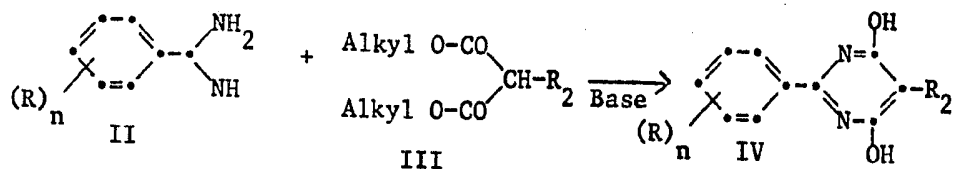
Die Phenylpyrimidine der Formel I können durch bekannte Synthesewege hergestellt werden. Der 2-Phenylpyrimidinring wird z.B. durch Kondensation eines Phenylamidins mit einem Malonsäurederivat hergestellt.

Die erfindungsgemässen 2-Phenylpyrimidine werden dadurch erhalten, dass man in alkoholisch-basischer Lösung ein Phenylamidin mit einem Malonsäuredialkylester kondensiert

15 FEB 1983 * 069165

236096 5

- 15 - 16 -



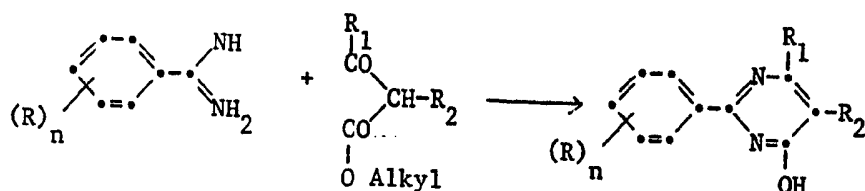
und dann gewünschtenfalls am erhaltenen 2-Phenyl-4,6-dihydroxy-pyrimidin der Formel IV die Hydroxylgruppen mittels Halogenierungsmitteln (Phosphoroxychlorid, Phosphoroxybromid, Sulfurylchlorid, Bromsuccinimid etc.) durch Halogenatome und auch diese gewünschtenfalls durch weitere Reste R_1 und R_3 ersetzt.

Falls R_2 Wasserstoff bedeutet, kann dieses ersetzt werden z.B. durch Einwirkenlassen von Chlor oder Brom in einem polaren Lösungsmittel wie z.B. Eisessig.

Die Halogenatome in den Positionen 4, 5 und 6 des Pyrimidinringes wiederum lassen sich ihrerseits in bekannter Weise durch Alkohole, Mercaptane oder Amine ersetzen.

Siehe dazu. z.B. J. Chem. Soc. 1965, S. 5467-5473,
J.prakt. Chem. 312 (1970), S. 494-506.
J.chem. Soc. Perkin Trans 1 1977, S. 2285-6.

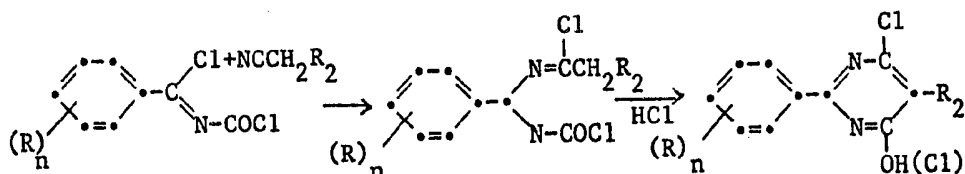
Phenylpyrimidine, in denen R_1 einen Alkyl- oder Phenylrest bedeuten soll, werden beispielsweise durch Kondensation eines Phenylamidins mit einem Alkylester einer Acetessigsäure erhalten.



Auch hier kann die -OH Gruppe dann in bekannter Weise durch ein Halogenatom und dieses weiter durch einen Alkohol, Thiol oder ein Amin ersetzt werden.

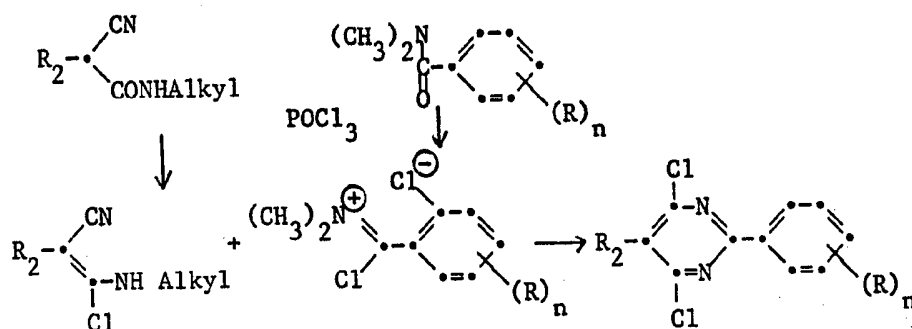
15 FEB 1982 * 060165

Ferner gelingt es z.B. auch 2-Phenyl-4,6-dichlorpyrimidin und 2-Phenyl-4-chlor-6-hydroxypyrimidine herzustellen durch Umsetzung von Chlorbenzyliden-carbamoyl-chloride mit einem aliphatischen Nitril in Gegenwart von Chlorwasserstoff



Siehe dazu Bull. Soc. Chem. Japan 44 (1971), S. 2182-2185.

2-Phenyl-4,6-dichlorpyrimidin lässt sich beispielsweise gemäss Ang. Chemie 89 (1977), S. 816-817 beispielsweise durch Kondensation von einem N-Phenylcyanamid und einem N,N-Dialkylamid in POCl_3 bei 100° erhalten.



In den obigen Formeln haben R, R_2 und n die in Formel I gegebene Bedeutung.

Die Synthese solcher Verbindungen oder der Austausch von Resten R_1 , R_2 und R_3 durch andere in der Definition gegebene Substituenten sind an sich bekannte Vorgänge. Für die Herstellung dieser Verbindungen verweisen wir auf die Beispiele oder auf die Fachliteratur. Siehe dazu auch "The Chemistry of Heterocyclic compounds" 16 Interscience Publishers, New York 1962 Seiten 119 ff.

Die Verbindungen der Formel I können für sich allein oder zusammen mit den zu antagonisierenden Wirkstoffen verwendet werden.

Dabei werden Verbindungen der Formel I in unveränderter Form oder vorzugsweise zusammen mit den in der Formulierungstechnik üblichen Hilfsmitteln eingesetzt und werden daher z.B. zu Emulsionskonzentrationen, direkt versprühbaren oder verdünnbaren Lösungen, verdünnten Emulsionen, Spritzpulvern, löslichen Pulvern, Stäubemitteln, Granulaten, auch Verkapselungen in z.B. polymeren Stoffen in bekannter Weise verarbeitet. Die Anwendungsverfahren wie Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Giessen werden gleich wie die Art der Mittel den angestrebten Zielen und den gegebenen Verhältnissen entsprechend gewählt.

Die Formulierungen, d.h. die den Wirkstoff der Formel I und gegebenenfalls einen festen oder flüssigen Zusatzstoff enthaltenden Mittel, Zubereitungen oder Zusammensetzungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch inniges Vermischen und/oder Vermahlen der Wirkstoffe mit Streckmitteln, wie z.B. mit Lösungsmitteln, festen Trägerstoffen, und gegebenenfalls oberflächenaktiven Verbindungen (Tensiden).

Als Lösungsmittel können in Frage kommen: Aromatische Kohlenwasserstoffe, bevorzugt die Fraktionen C_8 bis C_{12} , wie z.B. Xylolgemische oder substituierte Naphthaline, Phthalsäureester wie Dibutyl- oder Dioctylphthalat, aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Cyclohexan oder Paraffine, Alkohole und Glykole sowie deren Aether und Ester, wie Aethanol, Aethylenglykol, Aethylenglykolmonomethyl- oder Äthyläther, Ketone wie Cyclohexanon, stark polare Lösungsmittel wie N-Methyl-2-pyrrolidon, Dimethylsulfoxid oder Dimethylformamid, sowie gegebenenfalls epoxydierte Pflanzenöle wie epoxydiertes Kokosnussöl oder Sojaöl; oder Wasser.

Als feste Trägerstoffe, z.B. für Stäubemittel und dispergierbare Pulver, werden in der Regel natürliche Gesteinsmehle verwendet, wie Calcit, Talkum, Kaolin, Montmorillonit oder Attapulgit. Zur Verbesserung der physikalischen Eigenschaften können auch hochdisperse Kiesel-

säure oder hochdisperse saugfähige Polymerisate zugesetzt werden. Als gekörnte, adsorptive Granulatträger kommen poröse Typen, wie z.B. Bimsstein, Ziegelbruch, Sepiolit oder Bentonit, als nicht sorptive Trägermaterialien z.B. Calcit oder Sand in Frage. Darüberhinaus kann eine Vielzahl von vorgranulierten Materialien anorganischer oder organischer Natur wie insbesondere Dolomit oder zerkleinerte Pflanzenrückstände verwendet werden.

Als oberflächenaktive Verbindungen kommen je nach der Art des zu formulierenden Wirkstoffes der Formel I nichtionogene, kation- und/oder anionaktive Tenside mit guten Emulgier-, Dispergier- und Netzeigenschaften in Betracht. Unter Tensiden sind auch Tensidgemische zu verstehen.

Geeignete anionische Tenside können sowohl sog. wasserlösliche Seifen wie wasserlösliche synthetische oberflächenaktive Verbindungen sein.

Als Seifen eignen sich die Alkali-, Erdalkali- oder gegebenenfalls substituierten Ammoniumsalze von höheren Fettsäuren ($C_{10}-C_{22}$), wie z.B. die Na- oder K-Salze der Oel- oder Stearinsäure, oder von natürlichen Fettsäuregemischen, die z.B. aus Kokosnuss- oder Talgöl gewonnen werden können. Ferner sind auch die Fettsäure-methyl-aurinsalze zu erwähnen.

Häufiger werden jedoch sog. synthetische Tenside verwendet, insbesondere Fettsulfonate, Fettsulfate, sulfonierte Benzimidazolderivate oder Alkylarylsulfonate.

Die Fettsulfonate oder -sulfate liegen in der Regel als Alkali-, Erdalkali- oder gegebenenfalls substituierte Ammoniumsalze vor und weisen einen Alkylrest mit 8 bis 22 C-Atomen auf, wobei Alkyl auch den Alkylteil von Acylresten einschliesst, z.B. das Na- oder Ca-Salz der Ligninsulfonsäure, des Dodecylschwefelsäureesters oder eines aus natürlichen Fettsäuren hergestellten Fettalkoholsulfatgemisches. Hier-

her gehören auch die Salze der Schwefelsäureester und Sulfonsäuren von Fettalkohol-Aethylenoxid-Addukten. Die sulfonierten Benzimidazol-derivate enthalten vorzugsweise 2 Sulfonsäuregruppen und einen Fettsäurerest mit 8-22 C-Atomen. Alkylarylsulfonate sind z.B. die Na-, Ca- oder Triäthanolaminsalze der Dodecylbenzolsulfonsäure, der Dibutylnaphthalinsulfonsäure, oder eines Naphthalinsulfonsäure-Formaldehydkondensationsproduktes.

Ferner kommen auch entsprechende Phosphate, wie z.B. Salze des Phosphorsäureesters eines p-Nonylphenol-(4-14)-Aethylenoxid-Adduktes in Frage.

Als nichtionische Tenside kommen in erster Linie Polyglykoläther-derivate von aliphatischen oder cycloaliphatischen Alkoholen, gesättigten oder ungesättigten Fettsäuren und Alkylphenolen in Frage, die 3 bis 30 Glykoläthergruppen und 8 bis 20 Kohlenstoffatome im (aliphatischen) Kohlenwasserstoffrest und 6 bis 18 Kohlenstoffatome im Alkylrest der Alkylphenole enthalten können.

Weitere geeignete nichtionische Tenside sind die wasserlöslichen, 20 bis 250 Aethylenglykoläthergruppen und 10 bis 100 Propylenglykoläthergruppen enthaltenden Polyäthylenoxidaddukte an Polypropylenglykol, Aethylendiaminopolypropylenglykol und Alkylpolypropylenglykol mit 1 bis 10 Kohlenstoffatomen in der Alkylkette. Die genannten Verbindungen enthalten üblicherweise pro Propylenglykol-Einheit 1 bis 5 Aethylenglykoleinheiten.

Als Beispiele nichtionischer Tenside seien Nonylphenolpolyäthoxyäthanol, Ricinussölpolyglykoläther, Polypropylen-Polyäthoxyäthoxyaddukte, Tributylphenoxypolyäthoxyäthanol, Polyäthylenglykol und Octylphenoxypolyäthoxyäthanol erwähnt.

Ferner kommen auch Fettsäureester von Polyoxyäthylensorbitan wie das Polyoxyäthylensorbitan-trioleat in Betracht.

18. 6. 82

AP A 01 N/236 096/5

60 235 18

236096 5 - 18 - 21 -

Bei den kationischen Tensiden handelt es sich vor allem um quartäre Ammoniumsalze, welche als N-Substituenten mindestens einen Alkylrest mit 8 bis 22 C-Atomen enthalten und als weitere Substituenten niedrige, gegebenenfalls halogenierte Alkyl-, Benzyl- oder niedrige Hydroxyalkylreste aufweisen. Die Salze liegen vorzugsweise als Halogenide, Methylsulfate oder Aethylsulfate vor, z. B. das Stearyltrimethylammoniumchlorid oder als Benzyldi(2-chloräthyl)äthylammoniumbromid.

Die in der Formulierungstechnik gebräuchlichen Tenside sind u. a. in folgenden Publikationen beschrieben:

"Mc Cutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual"
MC Publishing Corp., Ringwood, New Jersey, 1979.
Sisely and Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chemical Publishing Co., Inc. New York, 1964.

Die pestiziden Zubereitungen enthalten in der Regel 0,1 bis 99 %, insbesondere 0,1 bis 95 %, Wirkstoff der Formel I, 1 bis 99 % eines festen oder flüssigen Zusatzstoffes und 0 bis 25 %, insbesondere 0,1 bis 25 %, eines Tensides.

Während als Handelsware eher konzentrierte Mittel bevorzugt werden, verwendet der Endverbraucher in der Regel verdünnte Mittel.

Die Mittel können auch weitere Zusätze wie Stabilisatoren, Entschäumer, Viskositätsregulatoren, Bindemittel, Haftmittel

18. 6. 82

AP A 01 N/236 096/5

60 235 18

236096 5 - 18~~a~~ - 22 -

sowie Dünger oder andere Wirkstoffe zur Erzielung spezieller Effekte enthalten.

Ausführungsbeispiel

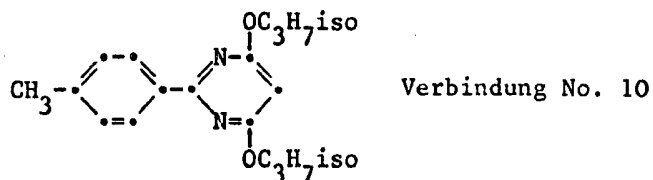
Die Erfindung wird nachstehend an einigen Beispielen näher erläutert.

In den nachfolgenden Beispielen sind die Temperaturen in Celsiusgraden angegeben, Prozente und Angaben von "Teilen" beziehen sich auf das Gewicht.

236096 5 - 19 - 23 -

Herstellungsbeispiele:

Beispiel 1: 2-para-Tolyl-4,6-bis-isopropoxy-pyrimidin



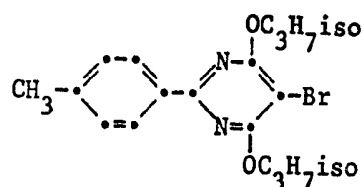
(a) Man löst 21,16 g Natrium in wasserfreiem Isopropanol. In die entstandene Lösung trägt man danach bei 60-65°C innerhalb von 15 Minuten 95,64 g 4,6-Dichlor-2-para-tolyl-pyrimidin ein. Das Gemisch wird anschliessend zum Sieden erhitzt und zur Vervollständigung der Reaktion noch 4 Stunden am Rückfluss weitergekocht. Dann wird der überschüssige Isopropanol abdestilliert und das zurückbleibende Oel in Chloroform aufgenommen. Die Chloroformschicht wird mit Wasser gewaschen, über Natriumsulfat getrocknet, filtriert und das Lösungsmittel wird abdestilliert. Man erhält so 112 g 2-para-Tolyl-4,6-bis-isopropoxy-pyrimidin als gelbliches Oel, welches man zwecks Reinigung am Hochvakuum destilliert. Der Siedepunkt beträgt 123°C/5.332 Pascal.

Das als Ausgangsprodukt benötigte 2-para-Tolyl-4,6-dichlor-pyrimidin wird auf folgende Weise hergestellt:

b) 102,3 g p-Tolylamidinhydrochlorid und 99,3 g Malonsäurediäthylester werden in 520 ml wasserfreiem Aethanol angeschlämmt. Unter gutem Rühren und Kühlung lässt man nun 323,7 g einer 30%igen Natriummethylatlösung einfliessen. Danach wird zum Rückfluss erhitzt und 4 bis 5 Stunden am Rückfluss gerührt. Nach Abdestillation des Lösungsmittels wird der Rückstand in 1000 ml Wasser aufgenommen, auf 80°C erhitzt und die etwas trübe Lösung über Kieselsäure filtriert. Nach dem Abkühlen wird mit 15%iger Salzsäure angesäuert. Der dicke Kristallbrei wird abfiltriert, mit Wasser gewaschen und bei 100°C getrocknet. Man erhält 100-110 g 2-para-Tolyl-4,6-Dihydroxypyrimidin, Schmelzpunkt 314°C (Zersetzung).

(c) 72,6 g der Dihydroxy-Verbindung werden mit 72,6 g N,N-Dimethylanilin und 363 g Phosphoroxychlorid zum Sieden erhitzt und eine Stunde am Rückfluss gerührt. Nach Abdestillation des überschüssigen Phosphoroxychlorids wird das zurückbleibende Produkt, zur Entfernung des noch anhaftenden Phosphoroxychlorids, mit Eiswasser behandelt, danach mit Eiswasser fein gemahlen, abfiltriert, mit Eiswasser gewaschen und bei 40-50°C im Vakuum getrocknet. Man erhält so 85,9 g 2-para-Tolyl-4,6-dichloro-pyrimidin vom Schmelzpunkt 86-87°C.

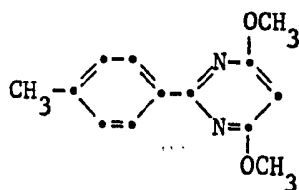
Beispiel 2: 2-para-Tolyl-4,6-bis-isopropyloxy-5-brom-pyrimidin



Verbindung No. 37

Man erhitzt 111,7 g 4,6-Di-isopropyloxy-2-para-tolyl-pyrimidin und 450 ml Tetrachlorkohlenstoff auf 70-75°C. In die entstandene Lösung gibt man 0,5 g Dibenzoylperoxid und anschliessend innerhalb von 45 Minuten ein Gemisch von 1 g Azoisobutyronitril und 70,8 g N-Bromsuccinimid. Zur Vervollständigung der Reaktion wird noch 2 Stunden am Rückfluss erhitzt. Das ausgefallene Succinimid wird dann abfiltriert und der überschüssige Tetrachlorkohlenstoff abdestilliert. Man erhält 141 g Titelprodukt, welches nach Behandlung mit Methanol zwecks Reinigung, einen Schmelzpunkt von 74-75°C aufweist.

Beispiel 3: 2-para-Tolyl-4,6-dimethoxy-pyrimidin



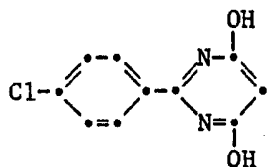
Verbindung No. 31

156,1 g einer 30,5%igen Natriummethylatlösung werden mit 700 ml wasserfreiem Methanol verrührt. In die Lösung werden nun innerhalb von 10 Minuten unter leichter Kühlung 95,64 g 2-para-Tolyl-4,6-dichloro-pyrimidin eingetragen. Danach wird auf Rückfluss erhitzt

236096 5 - 2X - 25 -

und 4 Stunden am Sieden gehalten. Nach Abdestillieren des Lösungsmittels wird das zurückbleibende Produkt in 1000 ml Wasser eingetragen. Zur Entfernung des entstandenen Natriumchlorids wird mit Wasser fein gemahlen. Danach abfiltriert, mit Wasser gewaschen und an der Luft getrocknet. Man erhält so 90,4 g Titelverbindung mit einem Schmelzpunkt von 61-62°C.

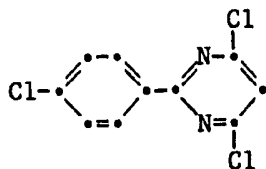
Beispiel 4: 2-para-Chlorphenyl-4,6-dihydroxy-pyrimidin



Verbindung No. 196

Zu einer Suspension von 38,2 g 4-Chlorbenzylamidin-Hydrochlorid und 33,6 g Malonsäurediäthylester in 175 ml Methanol gibt man innerhalb 10 Minuten 108 g 30%ige Natriummethylat/Methanol-Lösung und kocht anschliessend das Ganze während 5 Stunden am Rückfluss. Dann wird das Lösungsmittel am Rotationsverdampfer abdestilliert und der Rückstand in 1000 ml heissem Wasser aufgenommen und filtriert. Das Filtrat wird dann auf pH 1 angesäuert, der ausgefallene Niederschlag wird abfiltriert und im Vakuum bei 80°C getrocknet. Man erhält so 44 g 2-para-Chlorphenyl-4,6-dihydroxypyrimidin mit einem Schmelzpunkt von 333°C (Zersetzung).

Beispiel 5: 2-para-Chlorphenyl-4,6-dichlor-pyrimidin



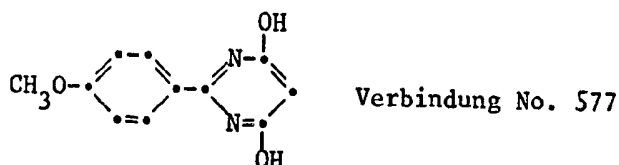
Verbindung No. 53

Zu 22 ml N,N-Dimethylanilin tropft man bei Raumtemperatur 50 ml Phosphoroxychlorid (POCl_3), dann werden unter Kühlung, so dass die Temperatur unterhalb 40°C bleibt, 22,3 g 2-para-Chlorphenyl-4,6-dihydroxy-pyrimidin portionenweise zugegeben und 2 Stunden bei Raumtemperatur gerührt, nachher noch 2 Stunden unter Rückfluss gekocht. Das Reaktionsgemisch wird anschliessend am Rotationsverdampfer ein-

236096 5 - 22-26 -

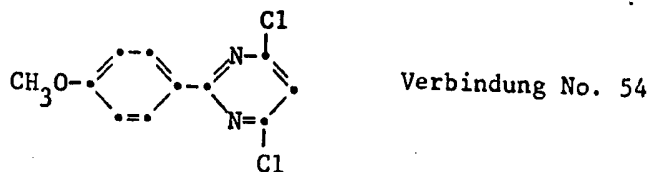
geengt und der Rückstand mit 500 ml Wasser zerrieben. Das Produkt wird abgenutscht, in Methylenchlorid gelöst, mit Bleicherde behandelt, getrocknet und eingeengt. Der Rückstand kristallisiert und ergibt 16,2 g 2-para-Chlorphenyl-4,6-dichlorpyrimidin mit Schmelzpunkt 119-120°C. Eine bei 80°/0,02 mbar sublimierte Probe schmilzt bei 120-121°C.

Beispiel 6: 2-para Methoxyphenyl-4,6-dihydroxy-pyrimidin



Zu einer Suspension von 112 g para-Methoxybenzamidin-Hydrochlorid und 101 g Malonsäurediäthylester in 520 ml Aethanol werden innerhalb von 10 Minuten 338 g 30%ige Natriummethylat/Methanol-Lösung gegeben und das Ganze anschliessend während 5 Stunden am Rückfluss gekocht. Das Reaktionsgemisch wird anschliessend am Rotationsverdampfer eingeengt und der Rückstand in 1000 ml 80°C warmem Wasser gelöst. Man filtriert und säuert das Filtrat bis pH 1 an. Der Niederschlag wird abfiltriert und im Vakuum bei 80°C getrocknet. Man erhält so 109,8 g 2-para-Methoxyphenyl-4,6-dihydroxypyrimidin mit einem Schmelzpunkt von 318°C (Zersetzung).

Beispiel 7: 2-para Methoxyphenyl-4,6-dichlor-pyrimidin



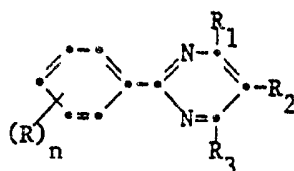
236096 5

- 23 - 27 -

Zu 54,5 g 2-para-Methoxyphenyl-4,6-dihydroxy-pyrimidin tropft man unter Kühlen, so dass die Reaktionstemperatur 45°C nicht überschreitet, innerhalb 30 Minuten 126 ml Phosphoroxychlorid (POCl_3) und anschliessend 57 ml N,N-Dimethylanilin. Das Reaktionsgemisch wird anschliessend während 2 Stunden bei Raumtemperatur gerührt und dann noch 2 Stunden unter Rückfluss gekocht. Dann wird am Rotationsverdampfer eingengt und der Rückstand in 2 l Eis/Wasser zerrieben. Das feste Produkt wird abgenutscht, in 1,5 l Methylenchlorid gelöst, mit Bleicherde behandelt und getrocknet. Nach dem Filtrieren und Einengen der Methylenchlorid-Lösung erhält man einen Rückstand, der sich aus Aethanol umkristallisieren lässt. Man erhält so 51 g kristallines 2-para-Methoxyphenyl-4,6-dichlor-pyrimidin vom Schmelzpunkt 127-128°C.

236096 5 - 24 - 28 -

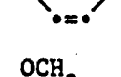
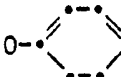
In analoger Weise zu diesen Beispielen werden folgende Verbindungen hergestellt:



No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃	phys. Daten
1	(H) ₅	Cl	H	Cl	Smp. 95-96°
2	4-CH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 86-87°
3	4-CH ₃	Cl	CH ₃	Cl	Smp. 153-154°
4	4-CH ₃	Cl		Cl	Smp. 132-133°
5	(H) ₅	Cl	H	CH ₃	Smp. 71-72°
6	4-CH ₃	Cl	H	CH ₃	Smp. 103-104°
7	4-CH ₃	Cl	H	OH	Smp. 229-234°
8	4-CH ₃	Cl	H	OCH ₃	Smp. 92-93°
9	4-CH ₃	Cl	CH ₃	OCH ₃	Smp. 143-144°
10	4-CH ₃	Cl	H	OC ₃ H ₇ iso	Smp. 55-57°
11	4-CH ₃	Cl	H		Smp. 86-87°
12	4-CH ₃	Cl	H		Smp. 102-104°
13	4-CH ₃	Cl	H	NHCH ₃	Smp. 107°
14	4-CH ₃	Cl	Br	NHCH ₃	Smp. 105-107°
15	4-CH ₃	Cl	H	N(C ₂ H ₅) ₂	Smp. 74-75°
16	(H) ₅	CH ₃	H	OH	Oel
17	4-CH ₃	CH ₃	H	OH	Smp. 206-207°
18	(H) ₅	CH ₃	H	OCH ₃	Sdp. 156-8°/ ₃ 1.33 · 10 ³ Pa
19	4-CH ₃	CH ₃	H	OCH ₃	Smp. 66-67°

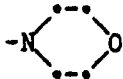
236096 5

- 28-29 -

No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃	phys. Daten
20	4-CH ₃	CH ₃	H		Smp. 90-91°
21	(H) ₅	CH ₃	H	OC ₂ H ₄ OCH ₃	Sdp. 158-160°/ 13.33 Pa
22	(H) ₅	CH ₃	H	(OC ₂ H ₄) ₂ OCH ₃	Sdp. 148-150°/ 2.66 Pa
23	4-CH ₃	CH ₃	H	OC ₂ H ₄ OCH ₃	Smp. 61-62°
24	(H) ₅	CH ₃	H	N(CH ₃) ₂	Smp. 55-57°
25	4-CH ₃	CH ₃	H	N(CH ₃) ₂	Smp. 97-98°
26	4-CH ₃	CH ₃	Br	N(CH ₃) ₂	Smp. 49-50°
27	(H) ₅	CH ₃	H		Smp. 88-90°
28	4-CH ₃	CH ₃	H		Smp. 123-124°
29	4-CH ₃	CH ₃	Br		Smp. 113-114°
30	4-CH ₃	OCH ₃	H		Smp. 99-100°
31	4-CH ₃	OCH ₃	H	OCH ₃	Smp. 61-62°
32	4-CH ₃	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	Smp. 93-94°
33	4-CH ₃	OCH ₃		OCH ₃	Smp. 214°
34	4-CH ₃	OC ₂ H ₅	H	OC ₂ H ₅	Smp. 71°
35	4-CH ₃	OC ₃ H _{7n}	H	OC ₃ H _{7n}	Smp. 62°
36	4-CH ₃	OC ₃ H _{7iso}	H	OC ₃ H _{7iso}	Sdp. 123°/5.332 Pa Beispiel 1
37	4-CH ₃	OC ₃ H _{7iso}	Br	OC ₃ H _{7iso}	Smp. 73-74° Beispiel 2
38	4-CH ₃	OC ₄ H _{9n}	H	OC ₄ H _{9n}	Sdp. 158-161°/ 13.332 Pa
39	4-CH ₃		H		Smp. 125-126°

236096 5

- 28-30 -

No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃	phys. Daten
40	4-CH ₃	SC ₂ H ₅	H	SC ₂ H ₅	Smp. 55-56°
41	4-CH ₃	OC ₂ H ₄ OCH ₃	H	OC ₂ H ₄ OCH ₃	Oel
42	4-CH ₃	OC ₂ H ₄ OCH ₃	CH ₃	OC ₂ H ₄ OCH ₃	Oel
43	4-CH ₃	OC ₂ H ₄ OCH ₃	Cl	OC ₂ H ₄ OCH ₃	Smp. 55-57°
44	4-CH ₃	OC ₂ H ₄ OCH ₃	Br	OC ₂ H ₄ OCH ₃	Smp. 55-56°
45	4-CH ₃	OC ₂ H ₄ OCH ₃	H	NHCH ₃	Smp. 65-66°
46	4-CH ₃	OC ₂ H ₄ OCH ₃	Br	NHCH ₃	Oel
47	4-CH ₃	OC ₂ H ₄ OCH ₃	H	N(C ₂ H ₅) ₂	Oel
48	4-CH ₃		H		Smp. 125-126°
49	4-CH ₃	Br	H	Br	Smp. 125-126°
50	(H) ₅	Br	H	Br	Smp. 115-118°
51	(H) ₅	Cl	H	OH	Smp. 218-221°
52	(H) ₅	Cl	H	SH	Smp. 150° Z
53	4-Cl	Cl	H	Cl	Smp. 120°
54	4-OCH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 127-128°
55	4-CN	Cl	H	Cl	Smp. 230-232°
56	3-CF ₃	Cl	H	Cl	Smp. 56-57°
57	2-CH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 74-75°
58	2-CH ₃	Cl	Cl	Cl	Smp. 122-125°

15 FEB 1983 * 069165

236096 5 - 27 - 31 -

No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃	phys. Daten
59	3-Cl, 4-F	Cl	H	Cl	Smp. 94-95°
60	2,6(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	Smp. 103-104°
61	3,4(CH ₃) ₂	Br	H	Br	
62	4-C ₃ H ₇ i	Cl	H	Cl	Smp. 63-64°
63	4-C ₃ H ₇ i	Cl	H	F	
64	4-Cl	F	H	F	Smp. 139-141°
65	2-CH ₃ , 6-C ₂ H ₅	Cl	H	Cl	
66	2-CH ₃ , 6-C ₂ H ₅	Cl	H	C ₂ H ₅	
67	2-Cl	Cl	H	Cl	Smp. 116-118°
68	3-C ₂ H ₅	Cl	H	Cl	
69	4-CH ₃	Cl	F	Cl	
70	4-F	Cl	F	Cl	
71	3-CHF ₂	Cl	H	Cl	
72	2,4(CH ₃) ₂	Br	H	Br	
73	2,3,6(CH ₃) ₃	Cl	H	Cl	
74	3-C ₃ H ₇ i	Cl	H	Cl	
75	4-CHF ₂	Cl	H	Cl	
76	2-Cl, 4-CH ₃	Br	H	Br	
77	3,4(Cl) ₂	Cl	H	OH	
78	4-OCH ₂ CH=CH ₂	Cl	H	Cl	Smp. 57-58°
79	4-OH	F	H	F	
80	4-COCH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 129-130°
81	4-OCOC ₂ H ₅	Cl	H	Cl	
82	4-OCH(CH ₃)COOCH ₃	Cl	H	Cl	
83	4-OCF ₂ Cl	Cl	H	OC ₂ H ₅	
84	4-OH	Cl	H	Cl	Smp. 135-137°
85	4-OCN(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	Smp. 191-193°
86	3-CH ₂ F	Cl	H	Cl	
87	2-COOCH ₃	Cl	H	OC ₄ H ₉ n	
88	4-CH ₂ F	Cl	H	Cl	
89	4-COOCH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 135-140°
90	4-COOC ₄ H ₉ n	Cl	H	OC ₄ H ₉ n	

236096 5

- 28 - 32 -

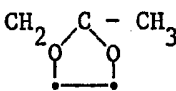
No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃	phys. Daten
91	4-Cl, 2,6(OCH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
92	4-CHO	Cl	H	Cl	Smp. 160-162°
93	3-CH ₂ Cl	Cl	H	Cl	
94	3,5(CF ₃) ₂	Cl	H	Cl	
95	4-CF ₃	Br	H	Br	
96	4-OCHF ₂	Cl	H	Cl	
97	3,5(OC ₂ H ₅) ₂	Cl	H	Cl	
98	4-OC ₃ H ₇ ⁱ	F	H	F	
99	3-NO ₂	Cl	H	Cl	Smp. 136-138°
100	4-NO ₂	Cl	H	Cl	Smp. 167-168°
101	3-NO ₂ , 4-CH ₃	Cl	H	Cl	
102	2-Cl, 4-NO ₂	Cl	H	Cl	
103	2-N(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
104	3-NHCOCH ₃	Br	H	Br	
105	3-NHCOCH ₂ Cl	Cl	H	Cl	
106	4-OCF ₃	Cl	H	OC ₃ H ₇ ⁱ	
107	3-OCF ₂ Cl, 5-Cl	Cl	H	Cl	
108	2-CON(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
109	4-OCF ₂ CHF ₂	Cl	H	Cl	
110	4-CONHC ₄ H ₉ ⁿ	Cl	H	Cl	
111	4-NHCOCH ₂ Cl	Cl	H	Cl	Smp. 196-198°
112	4-COCH ₃ , 3-CH ₃	Cl	H	CH ₃	
113	3-CH ₂ -COCH ₃	F	H	OCH ₃	
114	4-COC ₃ H ₇ ⁿ	Cl	H	Cl	
115	4-OCF ₂ CHFC1	Cl	H	Cl	
116	2-OH	Cl	H	Cl	
117	4-COOCH ₂ CH=CH ₂	Cl	H	Cl	
118	4-COOCH ₂ C≡CH	Cl	H	Cl	Smp. 105-109°
119	2-Cl, 6-C≡CH	Cl	H	Cl	
120	3-C≡C-C(CH ₃) ₂ OCH ₃	Br	H	Br	
121	4-C≡C-C(CH ₃) ₂ OH	Cl	H	Cl	

No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃	phys. Daten
122	4-C≡C-C(CH ₃) ₂ OCH ₃	Cl	H	Cl	
123	3,5(I) ₂ , 4-OCH(CH ₃)COOCH ₃	Cl	H	Cl	
124	(H) ₅	Cl	CF ₃	Cl	
125	4-CH=CH-C ₄ H ₉ ⁿ	Cl	H	Cl	
126	4Cl ₃	Cl	CF ₃	Cl	
127	4-OH	Br	H	Br	
128	4-Br	Cl	H	Cl	Smp. 130-131°
129	3-OH	Cl	H	Cl	Smp. 144-146°
130	3-OCH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 97-100°
131	3-OCOCH ₂ Cl	Cl	H	Cl	
132	2-OCH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 67-70°
133	2,6(F) ₂	Cl	H	Cl	
134	4-F	Cl	H	Cl	Smp. 102-105°
135	3-Cl, 4-CH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 91-92°
136	(H) ₅	F	H	F	Smp. 114-116°
137	(H) ₅	F	H	Cl	Smp. 105°
138	2,5(Cl) ₂ , 4-OH	F	H	F	
139	2-Cl, 4-OCH(CH ₃)COOC ₂ H ₅	Cl	H	Cl	
140	2,3,5(Cl) ₃ , 4-OH	Cl	H	Cl	
141	2,3,5(Cl) ₃ , 4-OC ₂ H ₅	Cl	H	Cl	
142	2,3,5,6(CH ₃) ₄ , 4-NO ₂	Cl	H	Cl	
143	(H) ₅	F	CF ₃	Cl	
144	3-SO ₂ N(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
145	4-CSN(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
146	4-C(CH ₃)=CH ₂	Cl	H	Cl	
147	4-CH ₂ COOCH ₃	Cl	H	Cl	
148	4-CH ₂ PO(OC ₂ H ₅) ₂	Cl	H	Cl	Smp. 110-112°
149	4-CH ₂ PO(OH) ₂	Br	H	Br	
150	4-SO ₂ N(CH ₃) ₂ , 5-CH ₃	Cl	H	OC ₄ H ₉ ⁿ	
151	4-PO(OH) ₂	Br	H	Br	
152	4-PO(OCH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
153	3-PO(OCH ₃) ₂	Cl	H	Cl	

236096 5 - 30 - 34 -

No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃	phys. Daten
154	H	SOCH ₃	H	Cl	
155	4-CH ₂ CH=CH ₂	Cl	H	Cl	
156	3-C≡CH, 5-CH ₃	Cl	H	Cl	
157	2-C≡CH	Cl	H	Cl	
158	4-C≡CH	Cl	H	Cl	Smp. 168-170°
159	H	SOCH ₃	H	Br	
160	4-C(OCH ₃) ₂ C ₃ H ₇ ⁿ	Cl	H	OCH ₃	
161	2-CH ₃ , 5-N(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
162	2-CH ₃ , 5-Cl	Cl	H	Cl	
163	3-Br, 4-OH	Cl	H	OCH ₂ CH=CH ₂	
164	3-Br, 4-OC ₃ H ₇ ⁿ	Cl	H	Cl	
165	3-NO ₂ , 4-Cl	Cl	H	Cl	Smp. 158-159°
166	3-NH ₂ , 4-Cl	Cl	H	Cl	
167	3-CH ₃ , 4-NO ₂	Cl	H	Cl	Smp. 173-175°
168	3-CH ₃ , 4-NH ₂	Cl	H	Cl	fest
169	3-CH ₃ , 4-NHCON(CH ₃) ₂	F	H	OCH ₂ CH=CH ₂	
170	2-Cl, 5-CF ₃	Cl	H	Cl	
171	3-CF ₃ , 4-Cl	Cl	H	Cl	
172	4-CH ₃	SOCH ₃	H	Cl	
173	2-Cl, 5-N(CH ₃) ₂	Cl	H	OH	
174	2,6(OCH ₃) ₂ , 3-NO ₂	Cl	H	Cl	
175	2,6(OCH ₃) ₂ , 3-NH ₂	Cl	H	Cl	
176	2,6(OCH ₃) ₂ , 3-NHCOCH ₃	Cl	H	Cl	
177	2-CH ₃ , 6-C ₂ H ₅ , 4-OCN(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
178	3,5(I) ₂ , 4-OH	Cl	H	Cl	
179	3,5(I) ₂ , 4-OCH ₃	Br	H	Br	
180	3,5(Br) ₂ , 4-OH	Cl	H	Cl	
181	3,5(Br) ₂ , 4-OCH ₂ -CH=CH ₂	Cl	H	Cl	
182	3,4,5(OCH ₃) ₃	Cl	H	Cl	Smp. 167-169°
183	2,3(Cl) ₂	Cl	H	Cl	Smp. 116-118°

236096 5 - 34 - 35 -

No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃	phys. Daten
184	4-CH ₃	F	H	SOCH ₃	
185	(H) ₅	SOCH ₃	H	CN	
186	(H) ₅	SCH ₃	H	CN	
187	(H) ₅	SO ₂ CH ₃	H	CN	
188	(H) ₅	-O-CO-CH ₃	H	Cl	
189	4-CH ₃	CN	Cl	Cl	
190	3-SO ₂ NHCOONC ₃ H ₇ (i)	Cl	H	Cl	
191	4- 	Cl	H	Cl	
192	3- 	Br	H	Br	
193	3- 	Cl	H	Cl	
194	3-  CH ₂ C - CH ₃	F	H	OCH ₃	
195	3-CF ₃	OH	H	OH	Smp. 286°C
196	4-CH ₃	OCH ₃	H	OH	
197	3-NH ₂	Cl	H	Cl	fest
198	4-NH ₂	Cl	H	Cl	fest
199	3-NHCOCH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 228-230°
200	4-NHCOCH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 190-192°
201	4-SO ₂ NHCOOCH ₃	Cl	H	Cl	
202	3-SO ₂ NCH ₃ COOCH ₃	Cl	H	Cl	
203	4-CH ₃ •3-SO ₂ H	Cl	H	Cl	
204	4-CH ₃ •3-SO ₂ NH ₂	Cl	H	Cl	
205	4-NHCONHC ₂ H ₅	Cl	H	Cl	
206	4-Cl, 3-NH ₂	Cl	H	Br	
207	3-I	Cl	H	Cl	
208	3- COOH	Cl	H	Cl	Smp. 250°

236096 5 - 32 - 36 -

No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃	phys. Daten
209	4-COOH	Cl	H	Cl	Smp. 236-238°
210	3-CH ₃	Cl	H	OH	Smp. 195-200°
211	4-N(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	Smp. 150-155°
212	3NHCH ₃	Cl	H	Cl	
213	HNHCH ₃				
214	3-NHCHO				
215	4-NHCHO				
216	3-NHCO • 	Cl	H	Cl	
217	4-OCH ₂ OCH ₃	Cl	H	Cl	
218	4-SCH ₃	Cl	H	F	
219	3-SH	Cl	H	Cl	
220	4-SCH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 109-111°
221	4-OCOOCH ₃	Cl	H	F	
222	3-OCOOCH ₃	Cl	H	Cl	
223	3-F	Cl	H	Cl	Smp. 72-74°
224	4-OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	Cl	H	Cl	Smp. 75-77°
225	4-OC ₂ H ₄ OC ₃ H ₇ n	Cl	H	Cl	Wachs
226	4-CH ₂ -CCl=CH ₂	CH ₃	H	Cl	
227	4-SO ₂ CH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 163-165°
228	4-OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	Cl	H	Cl	Smp. 42-43°
229	4-OCH ₃	Br	H	Br	Smp. 129-131°
230	-OC ₆ H ₁₃ n	Cl	H	Cl	
231	4-OCH ₂ -C=CH	Cl	H	Cl	
232	4-OC ₂ H ₄ N(C ₂ H ₅) ₂	Cl	H	Cl	
233	4-OC ₂ H ₄ Cl	Cl	H	Cl	
234	4-OC ₂ H ₄ OH	Cl	H	Cl	
235	4-OC ₂ H ₄ SCH ₃	Cl	H	Cl	
236	4-OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ Cl	Cl	H	Cl	Smp. 88-89°
237	4-OCF ₃	Cl	H	Cl	
238	4-OC ₂ H ₅	Cl	H	Cl	
239	4-OCOCH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 113-115°
240	4-OCH(CH ₃)COOCH ₃	Cl	H	Cl	

No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃	phys. Daten
241	4-OCH(CH ₃)COOCH ₃	Br	H	Cl	Smp. 118-120°
242	4-OCOCH=CH ₂	Cl	H	Cl	
243	4-OCOC ₃ H ₆ CH=CH ₂	Cl	H	Cl	
244	4-OCH ₂ CON(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
245	4-OCH ₂ CH=CHCH ₃	Cl	H	Cl	
246	4-OC ₂ H ₄ CH=CClCH ₃	Cl	H	Cl	
247	(H) ₅	Cl	CHF ₂	Cl	
248	(H) ₅	Cl	H	JF	
249	(H) ₅	Cl	H	Br	
250	(H) ₅	J	H	J	
251	4-SOCH ₃	Cl	H	Cl	
252	4-SC ₂ H ₄ N(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
253	4-SC ₂ H ₄ OCH ₃	Cl	H	Cl	
254	4-SC ₆ H ₁₃ n	Cl	H	Cl	
255	4-SC ₂ H ₄ COOC ₄ H ₉	Cl	H	Cl	
256	4-SCOCH ₃	Cl	H	Cl	
257	4-SCH ₂ CH=CH ₂	Cl	H	Cl	
258	4-NH ₂	Br	H	Br	
259	4-NHC ₆ H ₁₃ n	Cl	H	Cl	
260	4-NHC ₃ H ₇ i	Cl	H	Cl	
261	4-NHCH ₂ COOCH ₃	Cl	H	Br	
262	4-NHCH(CH ₃)CON(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
263	4-NHCOCH=CH ₂	Cl	H	Cl	
264	4-NHCH ₂ -CH=CH ₂	Cl	H	Cl	
265	4-N(CH ₂ -CH=CH ₂) ₂	Cl	H	Cl	
266	4-NHCH-C≡CH	Cl	H	Cl	
267	4-NHCH ₂ CH=CHC ₂ H ₅	Cl	H	Cl	
268	4-NH(CH ₂) ₄ C≡CH	Cl	H	Cl	
269	4-NHOCH ₃	Cl	H	Cl	
270	4-NHOCH ₂ CH=CH ₂	Cl	H	Cl	
271	4-N(CH ₃)OCH ₃	Cl	H	Cl	

236096 5 - 34 - 38 -

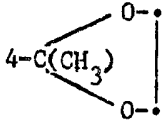
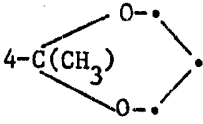
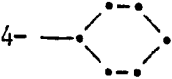
No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃
272	4-N(CH ₃)COCH ₃	Cl	H	Cl
273	4-B(OCH ₃)COCH ₃	Cl	H	Cl
274	4-NH - 	Cl	H	Cl
275	4-NH - 	Cl	H	Cl
276	4-N - 	Cl	H	Cl
277	4-N - 	Cl	H	Cl
278	4-N - 	Br	H	Br
279	4-N - 	Cl	H	Cl
280	4-N - 	Cl	H	F
281	4-NHCOOCH ₃	Cl	H	Cl
282	4-N(CH ₃)COOC ₃ H _{7i}	Cl	H	Cl
283	4-NHCONHCH ₃	Cl	H	Cl
284	4-NHCON(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl
285	4-N(CH ₃)CONHCH ₃	Cl	H	Cl
286	4-N(CH ₃)CON(CH ₃)OCH ₃	Cl	H	Cl
287	COOC ₆ H ₁₃ ⁿ	Cl	H	Cl
288	4-OCOCH ₂ CH=CHCH ₃	Cl	H	Cl
289	4-CONH ₂	Cl	H	Cl
290	4-CON(C ₃ H _{7n}) ₂	Cl	H	Cl
291	4-CONHC ₆ H ₁₃ ⁿ	Cl	H	Cl
292	4-OCOC ₂ H ₄ N(C ₂ H ₅) ₂	Br	H	Br

236096 5 - 38 - 39 -

No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃
293	4-CONHOCH ₃	Cl	H	Cl
294	4-CON(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl
295	4-CHO	Br	H	Br
296	4-COC ₄ H ₉ n	Cl	H	Cl
297	4-COCH=CH-N(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl
298	4-CSN(C ₃ H ₇) ₂	Cl	H	Cl
299	4-CSNHC ₆ H ₁₃ n	Cl	H	Cl
300	4-N=CHC ₃ H ₇ i	Cl	H	Cl
301	4-N=CHC ₆ H ₁₃ n	Cl	H	Cl
302	4-N=CH(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl
303	4- N= 	Cl	H	Cl
304	4-N(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	Cl	H	Cl
305	4-SO ₂ NH ₂	Cl	H	Cl
306	4-SO ₂ N(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl
307	4-SO ₂ NHC ₄ H ₉	Cl	H	Cl
308	3-SO ₂ N 	Br	H	Br
309	4-SO ₂ NHCH ₂ CH=CH ₂	Cl	H	Cl
310	4-CH(OCH ₃) ₂	Cl	H	Cl
311	4-CH(OC ₂ H ₄ OCH ₃) ₂	Cl	H	F
312	4-C(C ₄ H ₉ n)(OC ₂ H ₅) ₂	Cl	H	Cl
313	4-C(CH ₃)(OCH ₃) ₂	Cl	H	Cl
314	4-C(CH ₃)(OC ₂ H ₄ SCCH ₃) ₂	Cl	H	Cl
315	4-CH 	Cl	H	Cl
316	4-CH  CH ₃	Cl	H	Cl

15 FEB 1983 * 069165

236096 5 - 36-40 -

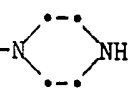
No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃	phys. Daten
317		Cl	H	Cl	
318		Cl	H	Cl	
319	4-PO(OH)OC ₂ H ₅	Cl	H	Cl	
320	4-SO ₃ H	Cl	H	Cl	
321	4-CF ₃	Cl	H	Cl	
322	4-CH ₂ Br	Cl	H	Cl	Smp. 155-156°
323	4-CH ₂ Cl	Cl	H	Cl	
324	4-CH ₂ OCH ₃	Cl	H	Cl	
325	4-CH ₂ OH	Cl	H	Cl	
326	4-CH ₂ OCOCH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 108-110°
327	4-CH ₂ OC ₄ H ₉ ⁿ	Cl	H	Cl	
328	4-CH ₂ SCH ₃	Cl	H	Cl	
329	4-CH ₂ N(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
330	4-CHClCH ₃	Cl	H	F	
331	4-C ₂ H ₅	Cl	H	Cl	
332	4-C ₆ H ₁₃ ⁿ	Cl	H	Cl	
333	4-C ₅ H ₁₁ ^{iso}	Br	H	Br	
334	4-C=CCH ₃	Cl	H	Cl	
335	4-CH=CH ₂	Cl	H	Cl	
336	4-CH ₂ -CH=CH ₂	Cl	H	F	
337	4-CCl=CH ₂	Cl	H	Cl	Smp. 128-130°
338	4-C ₂ H ₄ Cl	Cl	H	Cl	
339	4-C ₂ H ₄ N(C ₂ H ₅) ₂	Cl	H	Cl	
340		Cl	H	Cl	
341		Cl	H	Cl	

236096 5 - 37 - 41 -

No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃	phys. Daten
342	4- 	Cl	H	Cl	
343	4-CH=CH ₂ -CH ₂ OCH ₃	Cl	H	Cl	
344	4-N(CH ₃)COCH ₂ Cl	Cl	H	Cl	
345	4-CH ₂ CN	Cl	H	Cl	Smp. 151-158°
346	3-F	Br	H	Br	
347	3-Cl	Cl	H	Cl	Smp. 117-119°
348	3-NO ₂	Br	H	Br	Smp. 165-167°
349	3-NO ₂	F	H	F	
350	3-OC ₃ H ₇ i	Cl	H	Cl	
351	3-OCH ₂ CH=CHCH ₃	Cl	H	F	
352	3-OCH ₂ C=CH	Cl	H	Cl	
353	3-OC ₂ H ₄ N(C ₂ H ₅) ₂	Cl	H	Cl	
354	3-OCH(CH ₃)CH ₂ N(C ₂ H ₅)	Cl	H	Cl	
355	3-OC ₂ H ₄ Cl	Cl	H	Cl	
356	4-CH ₃	Br	H	Cl	
357	3-OC ₂ H ₄ SC ₂ H ₅	Cl	H	Cl	
358	3-OC ₂ H ₄ OC ₃ H ₇ n	Cl	H	Cl	
359	3-OCF ₃	Cl	H	F	
360	3-OCHF ₂	Cl	H	Cl	
361	3-OCF ₂ CHF ₂	Cl	H	Cl	
362	3-OCF ₂ CHFC1	Br	H	Br	
363	3-OCOC ₂ H ₅	Cl	H	Cl	
364	3-OCOCH ₂ Cl	Br	H	Br	
365	3-SC ₂ H ₅	Cl	H	Cl	
366	3-SCF ₃	Cl	H	Cl	
367	3-SCHF ₂	Cl	H	Cl	
368	3-SO ₂ CH ₃	Cl	H	Cl	
369	3-SC ₃ H ₆ N(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
370	3-SC ₃ H ₆ Cl	Cl	H	Cl	
371	3-SC ₅ H ₁₁ iso	Cl	H	Cl	

15 FEB 1963 * 069165

236096 5 - 38 - 42 -

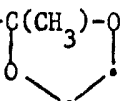
No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃	phys. Daten
372	3-SCH ₂ COOC ₃ H ₇ ⁿ	Cl	H	F	
373	3-S-CH ₂ -C=CH	Cl	H	Cl	
374	3-NH ₂	Br	H	Br	fest
375	3-N(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
376	3-NHC ₄ H ₉ ⁿ	Cl	H	Cl	
377	3-NHC ₄ H ₉ ^{sek}	Cl	H	Cl	
378	3-N(CH ₂ C=CH) ₂	Cl	H	F	
379	3-NHCH ₂ CH=CH ₂	Cl	H	Cl	
380	3-N(CH ₃)COCH ₂ Cl	Cl	H	Cl	
381	3-SO ₂ NHCO ₂ CH ₃				Smp. 160-161°
382	3-NHCOCH=CH-CH ₃	Cl	H	Cl	
383	3-NHOH	Br	H	Br	
384	3-NHOC ₂ H ₅	Cl	H	Br	
385	3-NCH ₃ OCH ₃	Cl	H	Cl	
386	3-N(C ₃ H ₇ ^{iso})CO ₂ C ₂ H ₅	Cl	H	Cl	
387	3-N 	Cl	H	Cl	
388	3-N 	Cl	H	Cl	
389	3-NHCOOC ₄ H ₉ ^{iso}	Cl	H	Cl	
390	3-NHCONHC ₄ H ₉ ⁿ	Cl	H	Cl	
391	3-N 	Br	H	Br	
392	3-N(CH ₃)CON(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
393	3-COOH	Cl	H	Cl	Smp. 250°C
394	3-COOCH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 190-191°
395	3-COOCH ₂ CH=CH ₂	Cl	H	Cl	Smp. 120-121°
396	3-COOC ₃ H ₇ ⁱ	Cl	H	Cl	
397	3-COCH ₂ -C≡C-C ₃ H ₇ ⁿ	Cl	H	Cl	
398	3-CONH ₂	Cl	H	Cl	

15 FEB 1963 * 069165

236096 5 - 39 - 43 -

No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃	phys. Daten
399	3-CONHOH	Cl	H	Cl	
400	3-CON(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
401	3-CONHCH ₃	Br	H	Br	
402	3-CONHCH ₂ CH=CH ₂	Cl	H	F	
403	3-COOC ₃ H ₆ N(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
404	3-CHO	Cl	H	Cl	
405	3-COCH ₃	Cl	H	Cl	
406	3-CO- 	Cl	H	Cl	
407	3-CSNHC ₄ H ₉ n	Cl	H	Cl	
408	3-CSNHC ₃ H ₇ iso	Cl	H	Cl	
409	3-CSN 	Cl	H	Cl	
410	3-N=CHC ₃ H ₇ (i)	Cl	H	Cl	
411	3-N=C(CH ₃)CH ₂ OCH ₃	Cl	H	Cl	
412	3-N=CHC ₂ H ₄ OC ₂ H ₅	Cl	H	Cl	
413	3-N=C 	Cl	H	Cl	
414	3-SO ₂ NH ₂	Cl	H	Cl	Smp. 207-208°
415	3-SO ₂ NHCH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 174-175°
416	3-SO ₂ N(C ₄ H ₉ n) ₂	Cl	H	Cl	
417	3-SO ₂ N 	Cl	H	Cl	
418	3-SO ₂ N(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	Smp. 144-145°
419	3-CH(OC ₂ H ₅) ₂	Cl	H	Cl	
420	3-C(CH ₃)(OCH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
421	3-C(CH ₃)(OC ₂ H ₄ OCH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
422	3-CH 	Cl	H	Cl	

236096 5 - 40 - 44 -

No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃	phys. Daten
423	$3-\text{C}(\text{CH}_3)_2-\text{O}$ 	Cl	H	Cl	
424	3-PO(OC ₂ H ₅) ₂	Cl	H	Cl	
425	3-P(OH) ₂	Cl	H	Cl	
426	3-P(OH)OCH ₃	Cl	H	Cl	
427	3-SO ₃ H	Cl	H	Cl	Smp. 95-96°
428	3-CF ₃	Cl	H	F	
429	3-CH ₂ CN	Cl	H	Cl	
430	3-CH ₂ Cl	Cl	H	Cl	
431	3-CH ₂ OC ₂ H ₅	Cl	H	Cl	
432	3-CH ₂ OH	Br	H	Br	
433	3-C ₂ H ₄ SCH ₃	Cl	H	Cl	
434	3-C ₂ H ₄ SOCH ₃	Cl	H	Cl	
435	3-CHCl-C ₂ H ₅	Cl	H	F	
436	3-C ₃ H ₇ n	Cl	H	Cl	
437	3-C ₆ H ₁₃ iso	Cl	H	Cl	
438	3-C≡CH	Cl	H	Cl	
439	3-C≡CCH ₃	Cl	H	Cl	
440	3-CH=CH ₂	Cl	H	Cl	
441	3-CCl=CH ₂	Cl	H	Cl	
442	3-CCl=CHCH ₃	Cl	H	Cl	
443	3-C ₂ H ₄ N(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
444	$3-\text{C}$ 	Cl	H	Cl	
445	3-CH=CH-C ₃ H ₇ n	Cl	H	Cl	
446	$3-\text{C}$ 	Cl	H	Cl	
447	3-CH ₂ COOC ₂ H ₅	Cl	H	Cl	
448	3-CH ₂ CONH ₂	Br	H	Br	
449	2-CH ₃	Br	H	Br	

236096 5 - 41 - 45 -

No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃	phys.Daten
450	2-F	Cl	H	Cl	
451	2-OCH ₂ C=CH	Cl	H	Cl	
452	2-SCH ₃	Cl	H	Cl	
453	2-SH	Cl	H	Cl	
454	2-COOH	Cl	H	Cl	
455	2-COOCH ₃	Cl	H	Cl	
456	2-CH ₂ OH	Br	H	Br	
457	2-CHO	Cl	H	Cl	
458	3-Cl, 4F	F	H	F	Smp. 101-103°
459	3-Cl, 4F	F	H	Cl	
460	3,4(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
461	3,5(Cl) ₂	Cl	H	Cl	Smp. 175-177°
462	2,6(Cl) ₂	Cl	H	Cl	
463	2,3(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
464	2,4(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
465	3-Cl, 4-C ₃ H ₇ iso	Cl	H	Cl	
466	2-Cl, 4-CH ₃	Cl	H	Cl	
467	3,4(Cl) ₂	Cl	H	Cl	
468	3,5(OCH ₃) ₂	Cl	H	Cl	Smp. 168-172°
469	3-NH ₂ , 4-CH ₃	Cl	H	Cl	
470	3-NHCH ₃ , 4-CH ₃	Cl	H	Cl	
471	3-OH, 5-Cl	Cl	H	Cl	
472	3-OCHF ₂ , 5-Cl	Cl	H	Cl	
473	3-OCH ₃ , 5-Cl	Cl	H	Cl	
474	3-COOH, 5-Cl	Cl	H	Cl	
475	3-COOCH ₃ , 5-Cl	Cl	H	Cl	
476	3-CONH ₂ , 5-Cl	Cl	H	Cl	
477	4-COCH ₃ , 4-CH ₃	Cl	H	Cl	
478	2-Cl, 6-C=CH	Br	H	Br	
479	4-SO ₂ N(CH ₃) ₂ , 5-CH ₃	Br	H	Br	
480	3-C=CH, 5CH ₃	Cl	H	F	

236096 5 - 42 - 46 -

No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃	phys. Daten
481	2-CH ₃ , 5-N(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
482	2-CH ₃ , 5-Cl	Cl	H	Cl	
483	3-Br, 4-OCH ₃	Cl	H	Cl	
484	3-CH ₃ , 4-NHCON(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
485	2 SCH ₃ , 5-NO ₂	Cl	H	Cl	
486	2 SCH ₃ , 5-NH ₂	Cl	H	Cl	
487	2 Cl, 5-NO ₂	Cl	H	Cl	
488	2 Cl, 5NH ₂	Cl	H	Cl	
489	3,4(OCH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
490	3,4 (OH) ₂	Cl	H	Cl	
491	2,3 • Cl ₂	Cl	H	Cl	Smp. 116-118°
492	2,5 (OCH ₃) ₂	Cl	H	Cl	Smp. 127-129°
493	2,5 (OH) ₂	Cl	H	Br	
494	4-CN ₃ , 3-CH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 120-123°
495	4-OH, 3-CH ₃	Cl	H	Br	
496	4-OCH ₃ , 3-NO ₂	Cl	H	Cl	
497	4-OH, 3-NO ₂	Cl	H	Cl	
498	4-OCH ₃ , 3-NH ₂	Cl	H	Cl	
499	4-OH, 3-NH ₂	Cl	H	Cl	
500	3,5 (OH) ₂	Cl	H	Cl	
501	2,6 Cl ₂ , 3-NO ₂	Cl	H	Cl	
502	2,6 Cl ₂ , 3-NH ₂	Cl	H	Cl	
503	2,6(OCH ₃) ₂ , 4-Cl	Br	H	Br	
504	2,6(OH) ₂ , 4-Cl	Br	H	Br	
505	3,5(J) ₂ , 4-OCH ₃	Cl	H	Cl	
506	3,5(J) ₂ , 4-OH	Br	H	Br	
507	3,5(Cl) ₂ , 4-OCH ₃	Br	H	Br	
508	3,5(Cl) ₂ , 4-OH	Cl	H	Cl	
509	2,5(Cl ₂), 4-OCH ₃	Cl	H	Cl	
510	2,5(Cl) ₂ , 4-OH	Cl	H	Cl	
511	4F	Cl	H	Br	
512	3,4(OH) ₂	Br	H	Br	

236096 5 - 43 - 47 -

No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃	phys. Daten
513	2,6(OH) ₂ , 3-NH ₂	Cl	H	Cl	
514	3-OCH ₂ OCH ₃	Cl	H	Cl	
515	3,5(OH) ₂ , 4-OCH ₃	Cl	H	Cl	
516	3,4,5(OH) ₃	Cl	H	Cl	
517	2,3,4(OCH ₃) ₃	Cl	H	Cl	
518	2,3,4(OH) ₃	Cl	H	Cl	
519	2,3,5(Cl) ₃ , 4-OCH ₃	Cl	H	Cl	
520	(CH ₃) ₅	Cl	H	Cl	
521	H	CN	H	CN	Smp. 150-155°
522	H	Cl	H	CN	
523	4-CH ₃	CN	H	CN	
524	4-CH ₃	Cl	H	CN	
525	4-OCH ₃	CN	H	CN	
526	4-OCH	CN	H	Cl	
527	4-OH	CN	H	CN	
528	4-OH	Cl	H	CN	
529	(H) ₅	SCH ₃	H	Cl	
530	(H) ₅	SO ₂ CH ₃	H	Cl	
531	(H) ₅	SCH ₃	H	Br	
532	(H) ₅	SO ₂ CH ₃	H	Br	
533	(H) ₅	SCH ₃	H	F	
534	(H) ₅	SO ₂ CH ₃	H	F	
535	(H) ₅	CN	Cl	Cl	
536	3-SCH ₂ CO ₂ CH ₃	Cl	H	Cl	
537	(H) ₅	OCF ₃	H	Cl	
538	4-CH ₃	OCF ₃	H	Cl	
539	4-CH ₃	OCOCH ₃	H	Cl	Smp. 110-112°
540	4-OH, 3CH ₃	Cl	H	Cl	
541	(H) ₅	Cl	F	Cl	
542	(H) ₅	Br	F	Br	
543	3-CH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 76-79°
544	3-SCH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 103-105°

236096 5 - 44 - 48 -

No.	(R) _n	R ₁	R ₂	R ₃	phys. Daten
545	3-CCl ₃	Cl	H	Cl	
546	4-CCl ₃	Cl	H	Cl	
547	4-OH, 3-CH ₃	Br	H	Cl	Smp. 140-145°
548	4-SCH ₂ COCH ₃	Cl	H	Cl	
549	3-SCOH=CH ₂	Cl	H	Cl	
550	4-SCOH=CHCH ₃	Cl	H	Cl	
551	3-SCO-CH ₂ C≡CH	Br	H	Br	
552	4-SOCH ₂ CH=CH ₂	Cl	H	Cl	
553	3-SOCH ₂ CH=CH ₂	Cl	H	Cl	
554	4-SOCH ₂ C≡CH	F	H	Cl	
555	3-SOCH ₂ C≡CH	Cl	H	Cl	
556	3-SO ₂ CH ₂ CH=CH ₂	Br	H	Br	
557	4-SO ₂ CH ₂ CH=CH ₂	Cl	H	Cl	
558	3-SO ₂ CH ₂ C≡CH	Cl	H	Cl	
559	4-SO ₂ CH ₂ C≡CH	Cl	H	Cl	
560	4-OCOC ₆ H _{13n}	Cl	H	Cl	
561	3-OCO-C ₅ H _{11i}	Cl	H	Cl	
562	4-ONHCH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 205-209°
563	3-ONHCH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 134-137°
564	4-ON(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	Smp. 191-193°
565	4-ONHC ₄ H ₉	Cl	H	Cl	
566	3-ONHC ₃ H _{7i}	Cl	H	Cl	
567	4-OCOCH=CH ₂	Cl	H	Cl	
568	3-OCOCH=CH-CH ₃	Cl	H	Cl	
569	4-OCOCH ₂ OCH ₃	Cl	H	Cl	
570	3-ON(CH ₃) ₂	Cl	H	Cl	
571	4-NHCONHC ₄ H _{9n}	Cl	H	Cl	
572	4-SH	Cl	H	Cl	
573	3-OC ₂ H ₄ OH	Cl	H	Cl	
574	3-NHC ₂ H ₄ COOCH ₃	Cl	H	Cl	
575	3-Br, 4-OH	Cl	H	Cl	
576	3-NHCONHCH ₃	Cl	H	Cl	Smp. 234-238°
577	4-OCH ₃	OH	H	OH	Smp. 318° Z

236096 5 - 45-49-

Formulierungsbeispiele

Die Verbindungen der Formel I werden im allgemeinen nicht als solche in der Landwirtschaft eingesetzt. Man verwendet gebrauchsfertige formulierte Mittel, welche entweder direkt oder mit Wasser verdünnt eingesetzt werden können.

Beispiel 8: Stäubemittel

Zur Herstellung eines a) 5%igen und b) 2%igen Stäubemittels werden die folgenden Stoffe verwendet:

- a) 5 Teile 2-para-Tolyl-4,6-bis-isopropoxy-pyrimidin oder einer Mischung davon mit 2-Chlor-2',6'-diäthyl-N-(butoxy-methyl)-acetanilid,
95 Teile Talkum,
- b) 2 Teile des obigen Wirkstoffes oder einer Mischung,
1 Teil hochdisperse Kieselsäure,
97 Teile Talkum.

Die Wirkstoffe werden mit den Trägerstoffen vermischt und vermahlen und können in dieser Form zur Anwendung verstäubt werden.

Beispiel 9: Granulat

Zur Herstellung eines 5%igen Granulates werden die folgenden Stoffe verwendet:

- 5 Teile 2-para-Tolyl-4,6-bis-isopropoxy-5-brom-pyrimidin oder einer Mischung davon mit 2-Chlor-2',6'-diäthyl-N-(methoxymethyl)-acetanilid,
0,25 Teile epoxidiertes Pflanzenöl,
0,25 Teile Cetylpolyglykoläther,
3,50 Teile Polyäthylenglykol,
91 Teile Kaolin (Korngrösse 0,3-0,8 mm).

15 FEB 1983 * 069165

236096 5 - 46 - 50 -

Die Aktivsubstanz oder die Mischung wird mit dem Pflanzenöl vermischt und mit 6 Teilen Aceton gelöst, hierauf wird Polyäthylenglykol und Cetylpolyglykoläther zugesetzt. Die so erhaltene Lösung wird auf Kaolin aufgesprüht, und anschliessend wird das Aceton im Vakuum verdampft. Ein derartiges Mikrogranulat lässt sich vorteilhaft in Saatsfurchen einarbeiten.

Beispiel 10: Spritzpulver

Zur Herstellung eines a) 70%igen, b) 40%igen, c) und d) 25%igen, e) 10%igen Spritzpulvers werden folgende Bestandteile verwendet:

- a) 70 Teile 2-para-Tolyl-4,6-bis-(methoxyäthyl)-5-chlorpyrimidin
 oder einer Mischung davon mit 2-Chloro-2',6'-diäthyl-
 N-(2"-propoxyäthyl)-acetanilid,
 5 Teile Natriumdibutyl-naphthylsulfonat,
 3 Teile Naphthalinsulfonsäuren-Phenolsulfonsäuren-Formaldehyd-
 Kondensat 3:2:1,
 10 Teile Kaolin,
 12 Teile Champagne-Kreide;
- b) 40 Teile Wirkstoff oder Mischung wie oben,
 5 Teile Ligninsulfonsäure-Natriumsalz,
 1 Teil Dibutyl-naphthalinsulfonsäure-Natriumsalz,
 54 Teile Kieselsäure;
- c) 25 Teile Wirkstoff oder Mischung wie oben,
 4,5 Teile Calcium-Ligninsulfonat,
 1,9 Teile Champagne-Kreide/Hydrixyäthylcellulose-Gemisch (1:1),
 1,5 Teile Natrium-dibutyl-naphthalinsulfonat,
 19,5 Teile Kieselsäure,
 19,5 Teile Champagne-Kreide,
 28,1 Teile Kaolin;
- d) 25 Teile Wirkstoff oder Mischung wie oben,
 2,5 Teile Isooctylphenoxy-polyoxyäthylenäthanol,

236096 5 - AT - 51 -

- 1,7 Teile Champagne-Kreide/Hydroxyäthylcellulose-Gemisch (1:1),
- 8,3 Teile Natriumaluminumsilkat,
- 16,5 Teile Kieselgur,
- 46 Teile Kaolin;
- e) 10 Teile Wirkstoff oder Mischung wie oben,
- 3 Teile Gemisch der Natriumsalze von gesättigten Fettalkohol-sulfaten,
- 5 Teile Naphthalinsulfonsäure/Formaldehyd-Kondensat,
- 82 Teile Kaolin.

Die Wirkstoffe werden in geeigneten Mischern mit den Zuschlagstoffen innig vermischt und auf entsprechenden Mühlen und Walzen vermahlen. Man erhält Spritzpulver von vorzüglicher Benetzbarkeit und Schwebefähigkeit, die sich mit Wasser zu Suspensionen der gewünschten Konzentration verdünnen und insbesondere zur Blattapplikation (zwecks Wuchsverzögerung oder für Fungizideinsatz) verwenden lassen.

Beispiel 11: Emulgierbare Konzentrate

Zur Herstellung eines 25%igen emulgierbaren Konzentrates werden folgende Stoffe verwendet:

- 25 Teile 2-Phenyl-4-chlor-6-methyl-pyrimidin oder einer Mischung davon mit 2-Chlor-6'-äthyl-N-(2"-methoxy-1"-methyläthyl)-acet-o-toluidid,
- 10 Teile eines Alkylarylsulfonat/Fettalkoholpolyglykoläther-Gemisches,
- 5 Teile Dimethylformamid,
- 57,5 Teile Xylol.

Beispiel 12: Paste

Zur Herstellung einer 45%igen Paste werden folgende Stoffe verwendet:

- a) 45 Teile 2-Phenyl-4-chlor-6-hydroxy-pyrimidin oder einer Mischung davon mit 2-Chlor-2',6'-diäthyl-N-(methoxymethyl)-acetanilid,

15 FEB 1983 * 069165

236096 5 - 48 - 52 -

- 5 Teile Natriumaluminiumsilikat,
- 14 Teile Cetylpolyäthylenglykoläther mit 8 Mol Äthylenoxid,
- 1 Teil Oleylpolyäthylenglykoläther mit 5 Mol Äthylenoxid,
- 2 Teile Spindelöl,
- 23 Teile Wasser,
- 10 Teile Polyäthylenglykol;
- b) 45 Teile des obigen Wirkstoffes oder der Mischung,
- 5 Teile Äthylenglykol,
- 3 Teile Octylphenoxypolyäthylenglykol mit 9-10 Mol Äthylenoxid pro Mol Octylphenol,
- 3 Teile von einem Gemisch aromatischer Sulfonsulfosäuren, kondensiert mit Formaldehyd als Ammoniumsalz,
- 1 Teil Siliconöl in Form einer 75%igen Emulsion,
- 0,1 Teile einer Mischung von 1-(3-Chlorallyl)-3m5m7-triazon-azonium-adamantan-chlorid mit Natriumcarbonat, Chloridwert mind. 11,5%,
- 0,2 Teile eines biopolymeren Verdickers mit max. 100 Keimen pro Gramm,
- 42,7 Teile Wasser.

Die Aktivsubstanz wird mit den Zuschlagstoffen in dazu geeigneten Geräten innig vermischt und vermahlen. Man erhält eine Paste, aus der sich durch Verdünnen mit Wasser Suspensionen jeder gewünschten Konzentration herstellen lassen.

Biologische Beispiele

Die Fähigkeit der Verbindungen der Formel I, Kulturpflanzen vor der phytotoxischen Wirkung starker Herbizide zu schützen, kann aus den folgenden Beispielen ersehen werden. In den Versuchsbeschreibungen werden die Verbindungen der Formel I als Antidote (Gegengmittel) bezeichnet. Die Schutzwirkung ist in % angegeben. 0% bedeutet die Wirkung des Herbizides wenn allein appliziert; 100% bedeutet das angestrebte normale Wachstum der Kulturpflanze. Signifikant ist eine Schutzwirkung von mindestens 10%.

236096 5 - 49 - 53 -

Beispiel 13: Versuche mit Antidote und Herbizid in verpflanztem Reis.

Applikationsmethode: Tankmischung

Reispflanzen werden bis zum 1 1/2-2 Blattstadium in Erde angezogen. Die Pflanzen werden dann büschelweise (immer 3 Pflanzen zusammen) in Container (47 cm lang, 29 cm breit und 24 cm hoch) in sandigen Lehm verpflanzt. Die Bodenoberfläche wird anschliessend mit Wasser von 1,5-2 cm Höhe beschichtet. 2-3 Tage nach dem Verpflanzen wird das Herbizid zusammen mit der als Antidote zu prüfenden Substanz als Tankmischung direkt ins Wasser appliziert. 24 Tage nach dem Verpflanzen wird die Schutzwirkung des Antidots in Prozent bonitiert. Als Referenzen dienen dabei die mit Herbizid allein behandelten Pflanzen, (keine Schutzwirkung) sowie die vollständig unbehandelte Kontrolle (= 100% Wachstum). Die Resultate sind untenstehend zusammengefasst.

Herbizid: 2-Chlor-2'.6'-diäthyl-N-(2"-propyloxyäthyl)acetanilid
"Pretolachlor"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmengen kg/ha	Schutzwirkung in %
1	1	1	50
2	0.75	0.75	25
49	0.75	0.75	12.5
50	1	1	12.5
53	1.5	1.5	25
59	1	1	25
84	1	1	25
99	1	1	25

Herbizid: 2-Chlor-2'.6'-diäthyl-N-(butoxymethyl)acetanilid
"Butachlor"

236096 5

- 56 - 54 -

Beispiel 13:

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmengen kg/ha	Schutzwirkung in %
2	1.5	1.5	12.5
49	1.5	1.5	12.5
50	1.5	1.5	25
53	1.5	1.5	12.5
54	1.5	1.5	12.5

Herbizid: 2-Chlor-2',6'-diäthyl-N-(methoxymethyl)acetanilid

"Alachlor"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmengen kg/ha	Schutzwirkung in %
1	0.125	0.125	12
2	0.125	0.125	25
49	0.125	0.126	25

Herbizid: 2-Chlor-6'-äthyl-N-(äthoxymethyl) cet-o-toluidid

"Acetochlor"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmengen kg/ha	Schutzwirkung in %
2	0.125	0.125	12.5
49	0.125	0.125	12.5

Herbizid: 2,6-Dinitro-N,N-dipropyl-4-trifluormethylanilin

"Trifluralin"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmengen kg/ha	Schutzwirkung in %
2	2	2	12.5

Herbizid: S-4-Chlorbenzyl-diäthylthiocarbamat "Thiobencarb"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmengen kg/ha	Schutzwirkung in %
1	8	8	50
1	4	4	25
1	2	2	12,5

Ebenso wird Reis vor der phytotoxischen Wirkung von S-Benzyl-N,N-di-äthylthiocarbamat geschützt.

236096 5 - 51 - 55 -

Beispiel 14: Versuche mit Antidote und Herbizid in verpflanztem Reis.

Applikationsmethode: Wurzelbehandlung

Reispflanzen der Sorte Yamabiko werden bis 1 1/2-2 Blattstadium in Erde angezogen und dann ausgewaschen. Die Pflanzen werden dann büschelweise (immer 3 Pflanzen zusammen) nur mit den Wurzeln während 15 bis 60 Minuten in eine Schale mit einer Lösung der als Antidote zu prüfenden Substanz von 1000 ppm getaucht. Anschliessend werden sie in Container (47 cm lang, 29 cm breit und 24 cm hoch) in sandigen Lehm verpflanzt. Die Bodenoberfläche wird mit Wasser von 1,5-2 cm Höhe beschichtet. 2-3 Tage nach dem Verpflanzen wird das Herbizid direkt ins Wasser appliziert. 24 Tage nach dem Verpflanzen wird die Schutzwirkung des Antidots in Prozent bonitiert. Als Referenzen dienen dabei die mit Herbizid allein behandelten Pflanzen (keine Schutzwirkung), sowie die vollständig unbehandelte Kontrolle (100% Wachstum).

Das Ergebnis ist wie folgt:

Herbizid: 2-Chlor-2',6'-diäthyl-N-(2"-propyloxyäthyl)acetanilid

"Pretolachlor"

Antidote Verbindung No.	Aufwandmenge	Herbizid Aufwandmengen kg/ha	Schutzwirkung in %
1	1000 ppm	0.75	87.5
2	1000 ppm	1	50

Beispiel 15: Versuch mit Antidote und Herbizid in verpflanztem Reis.

Applikation der Antidote auf die Pflanze mittels wässriger Lösung (Drench-Methode).

Reispflanzen der Sorte Yamabiko werden bis zum 1 1/2-2 Blattstadium in Anzuchtschalen angezogen. 1-2 Tage vor dem Verpflanzen wird die ganze Anzuchtschale mit den Reispflanzen in einer grösseren Schale, welche eine Lösung mit der als Antidote zu prüfenden Substanz in einer Konzentration von 1000 ppm enthält, getaucht. Die Pflanzen werden dann büschelweise (immer 3 Pflanzen) in Container (47 cm lang, 29 cm breit und 24 cm hoch) in sandigen Lehm verpflanzt. Die Bodenfläche wird mit Wasser 1,5-2 cm Höhe beschichtet. 2-3 Tage nach dem

236096 5 - 52 - 56 -

Verpflanzen wird das Herbizid direkt ins Wasser appliziert. 24 Tage nach dem Verpflanzen wird die Schutzwirkung des Antidots in Prozent bonitiert. Als Referenzen dienen dabei die mit Herbizid allein behandelten Pflanzen (keine Schutzwirkung), sowie die vollständig unbehandelte Kontrolle (100% Wachstum). Das Ergebnis ist wie folgt:

Herbizid: 2-Chlor-2',6'-diäthyl-N-(2"-propyloxyäthyl)acetanilid
"Pretolachlor"

Antidote Verbindung No.	Aufwandmenge	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
2	1000 ppm	1	37.5

Beispiel 16: Versuch mit Antidote und Herbizid in verpflanztem Reis.
Applikation der Antidote im Voraufbauverfahren.

Die als Antidote zu prüfende Substanz wird als verdünnte Lösung auf die feuchte Erdoberfläche von Anzuchtschalen versprüht. Anschliessend werden Reissamen eingesät und bis zum 1 1/2-2 Blattstadium angezogen. Die Pflanzen werden dann (immer 3 Pflanzen zusammen) in Container (47 cm lang, 29 cm breit und 24 cm hoch) in sandigen Lehm verpflanzt. Die Bodenoberfläche wird mit Wasser von 1,5-2 cm Höhe beschichtet. 2-3 Tage nach dem Verpflanzen wird das Herbizid direkt ins Wasser appliziert und 24 Tage nach dem Verpflanzen wird die Schutzwirkung des Antidots in Prozent bonitiert. Als Referenzen dienen dabei die mit Herbizid allein behandelten Pflanzen (keine Schutzwirkung) sowie die vollständig unbehandelte Kontrolle (100% Wachstum). Das Ergebnis ist wie folgt:

Herbizid: 2-Chlor-2'.6'-diäthyl-N-(2"-propyloxyäthyl)acetanilid
"Pretolachlor"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
2	4	1.5	25

236096 5 - 53 - 57 -

Beispiel 17: Versuch mit Antidote und Herbizid in verpflanztem Reis.
Applikation der Antidote durch Einmischen in den Boden (ppi-Methode).

Die als Antidote zu prüfende Substanz wird in die Erde in Anzucht-
schalen in einer Konzentration von 100 ppm eingemischt. 2 Tage später
werden die Reispflanzen bis zum 1 1/2-2 Blattstadium in den behandel-
ten Anzuchtschalen angezogen. Die Pflanzen werden dann büschelweise
(immer 3 Pflanzen zusammen) in Container (47 cm lang, 29 cm breit und
24 cm hoch) in sandigen Lehm verpflanzt. Die Bodenoberfläche wird mit
Wasser von 1,5-2 cm Höhe beschichtet. 2-3 Tage nach dem Verpflanzen
wird das Herbizid direkt ins Wasser appliziert. 24 Tage nach dem
Verpflanzen wird die Schutzwirkung des Antidots in Prozent bonitiert.
Als Referenzen dienen dabei die mit Herbizid allein behandelten
Pflanzen (keine Schutzwirkung) sowie die vollständig unbehandelte
Kontrolle (100% Wachstum). Die Ergebnisse sind wie folgt:

Herbizid: 2-Chkor-2',6'-diäthyl-N-(2"-propyloxyäthyl)-acetanilid
"Pretolachlor"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
2	100 ppm	1	25
2	100 ppm	0.75	25

Beispiel 18: Versuch mit Antidote und Herbizid in verpflanztem Reis.
Applikation der Antidote im Nachauflaufverfahren (over the top-Appli-
kation)

Reispflanzen der Sorte Yamabiko werden bis zum 1 1/2-2 Blattstadium
in Erde angezogen. Zu diesem Zeitpunkt wird die als Antidote zu
prüfende Substanz als verdünnte Lösung über den Reispflanzen ver-
sprüht. Zwei Tage später werden die Pflanzen büschelweise (immer 3
Pflanzen zusammen) in Container (47 cm lang, 29 cm breit und 24 cm
hoch) in sandigen Lehm verpflanzt. Die Bodenoberfläche wird mit Wasser
von 1,5-2 cm Höhe beschichtet. 2-3 Tage nach dem Verpflanzen wird das

236096 5 - 54 - 58 -

Herbizid direkt ins Wasser appliziert. 24 Tage nach dem Verpflanzen wird die Schutzwirkung des Antidots in Prozent bonitiert. Als Referenzen dienen dabei die mit Herbizid allein behandelten Pflanzen (keine Schutzwirkung) sowie die vollständig unbehandelte Kontrolle (100% Wachstum). Das Ergebnis ist wie folgt:

Herbizid: 2-Chlor-2',6'-diäthyl-N-(2"-propyloxyäthyl)acetanilid
"Protolachlor"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
2	4	1.5	12

Die erfindungsgemässen 2-Phenylpyrimidine bewirkten in den in den Beispielen 13 bis 18 beschriebenen Methoden eine gewisse Schutzwirkung auf den verpflanzten Reis auch dann wenn anstelle der oben erwähnten, die Herbizide S-2-Methylpiperidino-carbonylmethyl-0,0-dipropylphosphorodithioate ("Piperophos"), S-Aethyl-N,N-hexamethylen-thiocarbamat ("Molinate"), S-4-Chlorbenzyl-diäthyl-thiocarbamat ("Thiobencarb"), S-4-Benzyl-diäthyl-thiocarbamat, 5-tert. Butyl-3-(2,4-dichlor-5-isopropoxyphenyl)-1,3,4-oxadiazol-2-on ("Oxadiazon") oder N-(3,4-Dichlorphenyl-propionamid ("Propanil) verwendet werden.

Beispiel 19: Versuch mit Antidote und Herbizid mit in Wasser gesättem Reis. (Die Reissamen werden vorgequollen und direkt auf sehr nasse, sumpfbartige oder überflutete Böden gesät. Applikation der Antidote als Tankmischung.

Reissamen werden während 48 Stunden in Wasser vorgequollen. Plastik-Container (25 cm lang, 17 cm breit und 12 cm hoch) werden mit Erde gefüllt, in die die vorgequollenen Reissamen eingesät werden. Anschließend wird die als Antidote zu prüfende Substanz zusammen mit dem Herbizid als Tankmischung versprüht. Der Wasserstand wird entsprechend dem Wachstum der Reispflanzen sukzessive erhöht. 21 Tage danach wird die Schutzwirkung des Antidots in Prozent bonitiert. Als Referenzen dienen dabei die mit Herbizid allein behandelten Pflanzen

236096 5-55-59-

(keine Schutzwirkung) sowie die vollständig unbehandelte Kontrolle (100% Wachstum). Die Ergebnisse sind in den untenstehenden Tabellen zusammengefasst.

Herbizid: 2-Chlor-2',6'-diäthyl-N-(2"-propyloxyäthyl)acetanilid
"Pretolachlor"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
1	0.25	0.25	62.5
2	0.25	0.25	50
49	0.25	0.25	37.5
50	0.25	0.25	50
53	0.25	0.25	62.5
54	0.25	0.25	62.5
57	0.25	0.25	50
59	0.25	0.25	75
64	0.25	0.25	12.5
67	0.25	0.25	37.5
84	0.25	0.25	75
89	0.25	0.25	25
99	0.25	0.25	62.5
129	0.25	0.25	37.5
130	0.25	0.25	62.5
132	0.25	0.25	37.5
134	0.25	0.25	62.5
135	0.25	0.25	50
158	0.25	0.25	50
197	0.25	0.25	25
198	0.25	0.25	62.5
200	0.25	0.25	50
209	0.25	0.25	25
223	0.25	0.25	62.5

15 FEB 1983 * 069165

236096 5 - 56 - 60 -

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/hs	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
248	0.25	0.25	62.5
347	0.25	0.25	62.5
381	0.25	0.25	25
394	0.25	0.25	25
461	0.25	0.25	37.5
468	0.25	0.25	25
491	0.25	0.25	75

Herbizid: 2-Chlor-2'.6'-diäthyl-N-(butoxymethyl)acetanilid
"Butachlor"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
1	0.5	0.15	37.5
2	0.75	0.75	50
49	0.75	0.75	50
50	0.75	0.75	37.5
53	0.75	0.75	62.5
54	0.75	0.75	62.5

Herbizid: 2-Chlor-2'.6'-diäthyl-N-(methoxymethyl)acetanilid
"Alachlor"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
1	0.03	0.03	25
2	0.03	0.03	12.5
49	0.03	0.03	37.5
50	0.03	0.03	37.5
53	0.03	0.03	25
54	0.03	0.03	37.5

236096 5 - 57-61 -

Herbizid: 2-Chlor-6'-äthyl-N-(2"-methoxy-1"-methyläthyl)acet-o-
toluidid, "Metolachlor"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
1	0.03	0.03	25
2	0.03	0.03	12.5
49	0.03	0.03	25
50	0.03	0.03	12.5
53	0.03	0.03	25
54	0.03	0.03	12.5

Herbizid: S-Ethyl-diisopropyl-thiocarbamat, "EPTC"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
1	1	1	25

Herbizid: S-2-Methylpiperidino-carbonylmethyl-0,0-dipropyl-phospho-
thioat, "Piperophos"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
1	0.5	0.5	37.5

Herbizid: 5-Aethyl-N,N-hexamethylen-thiocarbamat
"Molinate"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
1	2	2	25

Herbizid: S-4-Chlorbenzyl-diäthylthiocarbamat
"Thiobencarb"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
1	4	4	37.5

236096 5 - 58-62 -

Das Antidote, Verbindung Nr. 1, aber auch andere erfindungsgemässe 2-Phenyl-pyrimidine vermochten in diesem Versuch den Reis auch gegen die phytotoxische Wirkung von S-4-Benzyl-diäthylthiocarbamat und 5-tert.-Butyl-3-(2,4-dichlor-5-isopropoxyphenyl)-1,3,4-oxdiazol-2-on ("Oxdiazon"), zu schützen.

Beispiel 20: Versuch mit Antidote und Herbizid mit in Wasser gesätem Reis. Applikation der Antidote während der Samenquellung des Reises.

Reissamen werden während 48 Stunden mit Lösungen der als Antidote zu prüfenden Substanz von 100 ppm getränkt. Anschliessend werden die Samen etwa 2 Stunden trocknen gelassen, bis sie nicht mehr kleben. Plasrik Container (25 cm lang, 17 cm breit und 12 cm hoch) werden bis 2 cm unter dem Rand mit sandigem Lehm gefüllt. Die vorgequollenen Samen werden auf der Bodenfläche des Containers gesät und nun ganz schwach gedeckt. Die Erde wird in einem feuchten (nicht sumpfigen) Zustand gehalten. Dann wird das Herbizid in verdünnter Lösung auf die Bodenoberfläche versprüht. Der Wasserstand wird entsprechend dem Wachstum sukzessive erhöht. 21 Tage danach wird die Schutzwirkung des Antidots in Prozent bonitiert. Als Referenzen dienen dabei die mit dem Herbizid allein behandelten Pflanzen (keine Schutzwirkung) sowie die vollständig unbehandelte Kontrolle (100% Wachstum). Die Ergebnisse sind in den untenstehenden Tabellen zusammengefasst.

236096 5 - 59 - 63 -

Herbizid: 2-Chlor-2',6'-diäthyl-N-(2"-propyloxyäthyl)acetanilid

"Propolachlor"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
1	100 ppm	0.25	62.5
2	100 ppm	0.25	75
49	100 ppm	0.25	75
50	100 ppm	0.25	87.5
53	100 ppm	0.25	62.5
54	100 ppm	0.25	62.5
57	100 ppm	0.25	50
59	100 ppm	0.25	62.5
64	100 ppm	0.25	50
67	100 ppm	0.25	50
84	100 ppm	0.25	50
89	100 ppm	0.25	62.5
99	100 ppm	0.25	62.5
128	100 ppm	0.25	50
130	100 ppm	0.25	50
132	100 ppm	0.25	37.5
134	100 ppm	0.25	50
135	100 ppm	0.25	50
158	100 ppm	0.25	75
197	100 ppm	0.25	62.5
198	100 ppm	0.25	75

236096 5 - 58 - 64 -

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
200	100 ppm	0.25	75
209	100 ppm	0.25	62.5
223	100 ppm	0.25	25
248	100 ppm	0.25	50
347	100 ppm	0.25	50
381	100 ppm	0.25	62.5
394	100 ppm	0.25	50
461	100 ppm	0.25	62.5
468	100 ppm	0.25	75
491	100 ppm	0.25	37.5

Herbizid: 2-Chlor-2',6'-diäthyl-N-(butoxymethyl)acetanilid

"Butachlor"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
1	100 ppm	0.5	50
2	100 ppm	0.5	50
49	100 ppm	0.5	37.5
50	100 ppm	0.5	50
53	100 ppm	0.5	50
54	100 ppm	0.5	50

Herbizid: 2-Chlor-2',6'-diäthyl-N-(methoxyäthyl)acetanilid.

"Alachlor"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
1	100 ppm	0.03	50
2	100 ppm	0.03	62.5
49	100 ppm	0.03	50
50	100 ppm	0.03	62.5
53	100 ppm	0.03	62.5
54	100 ppm	0.03	50

236096 5 - 61 - 65 -

Herbizid: 2-Chlor-6'-äthyl-N-(2"-methoxy-1"-methyläthyl)acet-o-toluidid, "Metolachlor"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
2	100 ppm	0.03	12.5
49	100 ppm	0.03	12.5

Herbizid: S-Ethyl-diisopropyl-thiocarbamat, "EPTC"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
1	100 ppm	0.5	12.5

Herbizid: S-2-Methylpiperidino-carbonylmethyl-0,0-dipropyl-phosphoro-dithioate, "Piperophos"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
1	1000 ppm	6.5	37.5
1	100 ppm	6.5	37.5
1	10 ppm	6.5	25

Herbizid: S-Aethyl-N,N-hexamethylen-thiocarbamat
"Molinate"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
1	1000 ppm	8	62.5
1	100 ppm	8	62.5
1	10 ppm	8	62.5
1	1000 ppm	2	37.5
1	100 ppm	2	37.5
1	10 ppm	2	37.5

15 FEB 1983 * 069165

236096 5 - 62 - 66 -

Herbizid: S-4-Chlorbenzyl-diäthylthiocarbamat
"Thiocarb"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
1	1000 ppm	8	37.5
1	100 ppm	8	37.5
1	1000 ppm	4	50
1	100 ppm	4	50
1	10 ppm	4	37.5
1	1000 ppm	2	37.5
1	100 ppm	2	25
1	10 ppm	2	25

Ebenso wurde Reis vor der phytotoxischen Wirkung von S-Benzyl-diäthylthiocarbamat und 5-tert. Butyl-3-(2,4-dichlor-5-isopropoxyphenyl)-1,3,4-oxdiazol-2-on ("Oxdiazon") geschützt.

Beispiel 21: Versuch mit Antidote und Herbizid mit in Wasser gesättem Reis. Applikation von Antidote und Herbizid in Nährlösung.

Man verwendete Reissamen, die in den eingesetzten Konzentrationen des Herbizides erwartungsgemäss geschädigt werden sollten und sät sie in gekörntes Zonolith (= expandierter Vermikulit), das sich in einem an der Unterseite durchlöcherten Plastik-Blumentopf (oberer Durchmesser 6 cm) befindet. Dieser wird in einen zweiten durchsichtigen Plastik-Blumentopf (oberer Durchmesser 7 cm) gestellt, in den sich ca. 50 ml der mit Herbizid und Antidote vorbereiteten Nährlösung befindet, die nunmehr kapillar im Filtermaterial des kleineren Topfes aufsteigt und Samen und keimende Pflanzen benetzt. Täglich wird der Flüssigkeitsverlust mit einer Hewitt-Nährlösung auf 50 ml ergänzt. 3 Wochen nach Testbeginn wird die Schutzwirkung des Antidots in Prozent bonitiert. Als Referenzen dienen dabei die mit Herbizid allein behandelten

236096 5 - 65 - 67 -

Pflanzen (keine Schutzwirkung) sowie die vollständig unbehandelte Kontrolle (100% Wachstum). Das Ergebnis ist wie folgt:

Herbizid: 2-Chlor-2',6'-diäthyl-N-(2"-propyloxyäthyl)acetanilid
"Propolachlor"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge	Herbizid Aufwandmenge	Schutzwirkung in %
1	10 ppm	4 ppm	75

Beispiel 22: Versuch mit Antidote und Herbizid mit trocken gesätem Reis (20 Tage nach der Saat, wenn die Reispflanzen das 3-Blatt Stadium erreicht haben, wird der Boden überflutet). Applikation von Antidote und Herbizid als Tankmischung.

Reissamen der Sorte IR-36 werden in Container (47 cm lang, 29 cm breit und 24 cm hoch) eingesät, bedeckt und leicht festgedrückt. Dann wird die als Antidote zu prüfende Substanz zusammen mit dem Herbizid als Tankmischung versprüht. Etwa 20 Tage nach der Saat (3-Blattstadium der Reispflanzen) wird die Bodenoberfläche mit 4 cm Wasser Höhe beschichtet. 30 Tage nach dem Verpflanzen wird die Schutzwirkung des Antidots in Prozent bonitiert. Als Referenzen dienen dabei die mit Herbizid allein behandelten Pflanzen (keine Schutzwirkung) sowie die vollständig unbehandelte Kontrolle (100% Schutzwirkung). Die Ergebnisse sind in den folgenden Tabellen festgehalten.

Herbizid: 2-Chlor-2',6'-diäthyl-N-(2"-propyloxyäthyl)acetanilid
"Propolochlor"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
1	2	2	62.5
2	2	2	50
49	2	2	50
50	2	2	50

15 FEB 1968 * 069165

236096 5 - 64-68 -

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
53	2	2	62.5
54	2	2	50
59	2	2	50
84	3	3	62.5
99	2	2	27.5

Herbizid: 2-Chlor-2',6'-diäthyl-N-(butoxymethyl)acetanilid
"Butachlor"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
1	3	3	25
2	3	3	25
49	3	3	37.5
50	3	3	37.5
53	3	3	25
54	3	3	37.5

Herbizid: 2-Chlor-2,6-diäthyl-N-(methoxymethyl)acetanilid
"Alachlor"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
1	0.25	0.25	37.5
2	0.5	0.5	25
49	0.5	0.5	12.5
50	0.25	0.25	25
53	0.25	0.25	25
54	0.5	0.5	25

15 FEB 1983 * 069165

236096 5 - 65 - 69 -

Herbizid: 2-Chlor-6-äthyl-N-(2"-methoxy-1"-methyläthyl)acet-o-toluidid, "Metolachlor"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/hs	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
1	3	0.75	37.5

Herbizid: 2-Chlor-6-äthyl-N-(äthoxymethyl)acet-o-toluidid
"Acetochlor"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
1	0.25	0.25	25
2	0.25	0.25	12.5
49	0.25	0.25	12.5
50	0.25	0.25	12.5
53	0.25	0.25	12.5
54	0.25	0.25	12.5

Herbizid: 2,6-Dinitro-N,N-dipropyl-4-trifluormethylanilin
"Trifluralin"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
1	1	1	37.5
2	1	1	25
50	1	1	12.5
53	1	1	25
54	1	1	37.5

15 FEB 1983 * 069165

236096 5 - 66 - 70 -

Herbizid: 2,6-Dichlorbenzonitril, "Dichlobenil"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/hs	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
1	0,5	0.5	12.5
2	0.5	0.5	12.5
49	0.5	0.5	25
50	0.5	0.5	25
53	0.5	0.5	25
54	0.5	0.5	25

Herbizid: S-2,3,3-Trichlorallyl-di-isopropyl-thiocarbamate
"Tri-allate"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
1	4	4	12.5
2	4	4	25
49	4	4	12.5
50	4	4	25
53	4	4	25
54	4	4	25

Beispiel 23: Versuch mit Antidote und Herbizid mit trocken gesätem Reis. Applikation der Antidote als Saatbeizung.

Reissamen werden mit der als Antidote zu prüfenden Substanz in einen Glasbehälter gemischt. Samen und Produkt werden durch Schütteln und Rotation gut zusammengemischt. Dann werden Container (47 cm lang, 29 cm breit und 24 cm hoch) mit sandiger Lehmerde gefüllt und die gebeizten Samen werden eingesät. Nach dem Bedecken des Samens wird das Herbizid in einer verdünnten Lösung auf die Bodenoberfläche versprüht. Etwa 20 Tage nach der Saat (3-Blattstadium der Reispflanzen) wird die Bodenoberfläche mit 4 cm Wasser Höhe beschichtet. 30 Tage nach der

15 FEB 1983 * 069165

236096 5 - 87-71 -

Herbizidapplikation wird die Schutzwirkung des Antidots in Prozent binitiiert. Als Referenzen dienen dabei die mit Herbizid allein behandelten Pflanzen (keine Schutzwirkung) sowie die vollständig unbehandelte Kontrolle (100% Wachstum). Die Ergebnisse sind wie folgt:

Herbizid: 2-Chlor-2',6'-diäthyl-N-(2"-propyloxyäthyl)acetanilid
"Propolachlor"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge g pro kg Saatgut	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
1	2 g	3	37.5

Herbizid: 2-Chlor-6'-äthyl-N-(2"-methoxy-1"-methyläthyl)acet-o-toluidid, "Metolachlor"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge pro kg Saatgut	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
1	1 g	0.5	62.5

Beispiel 24: Versuch mit Antidote und Herbizid in "Trockenreis".

(Der Reis wird trocken gesät, die Bewässerung erfolgt durch natürliche Regenfälle). Applikation von Antidote und Herbizid als Tankmischung.

Reissamen werden in Container (47 cm lang, 29 cm breit und 24 cm hoch) eingesät, bedeckt und leicht festgedrückt. Dann wird die als Antidote zu prüfende Substanz als verdünnte Lösung zusammen mit dem Herbizid als Tankmischung versprüht. 24 Tage nach der Saat wird die Schutzwirkung des Antidots in Prozent bonitiert. Als Referenzen dienen dabei die mit Herbizid allein behandelten Pflanzen (keine Schutzwirkung) sowie die vollständig unbehandelte Kontrolle (100% Wachstum). Die Ergebnisse sind in den untenstehenden Tabellen zusammengefasst.

15 FEB 1983 * 069165

236096 5 - 68 - 72 -

Herbizid: 2-Chlor-2',6'-diäthyl-N-(2"-propyloxyäthyl)acetanilid,
"Propolachlor"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
1	2	2	62.5
2	2	2	50
49	2	2	50
50	2	2	50
53	2	2	62.5
54	2	2	50
59	2	2	50
84	2	2	62.5
99	2	2	37.5

Herbizid: 2-Chlor-2',6'-diäthyl-N-(butoxymethyl)acetanilid
"Butolachlor"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
1	3	3	25
2	3	3	25
49	3	3	37.5
50	3	3	37.5
53	3	3	25
54	3	3	37.5

Herbizid: 2-Chlor-2'.6'-diäthyl-N-(methoxymethyl)acetanilid
"Alachlor"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
1	0.25	0.25	37.5
2	0.5	0.5	25
49	0.5	0.5	12.5

236096 5 - 69 - 73 -

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
50	0.5	0.5	25
53	0.25	0.25	25
54	0.5	0.5	25

Herbizid: 2-Chlor-6'-äthyl-N-(2"-methoxy-1"-methyläthyl)acet-o-toluidid, "Metolachlor"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
1	3	0.75	37.5

Herbizid: 2-Chlor-6'-äthyl-N-(äthoxymethyl)acet-o-toluidid
"Acetochlor"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
1	0.25	0.25	25
2	0.25	0.25	12.5
49	0.25	0.25	12.5
50	0.25	0.25	12.5
53	0.25	0.25	12.5
54	0.25	0.25	12.5

Herbizid: 2,6-Dinitro-N,N-dipropyl-4-trifluormethylanilin,
"Trifluralin"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
1	1	1	37.5
2	1	1	25
50	1	1	12.5
53	1	1	37.5
54	1	1	25

236096 5 - 70-74 -

Herbizid: 2,6-Dichlorbenzonitril, "Dichlobenil"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
1	0,5	0.5	12.5
2	0.5	0.5	12.5
49	0.5	0.5	25
50	0.5	0.5	25
53	0.5	0.5	25
54	0.5	0.5	25

Herbizid: S-2,3-Dichlorallyl-di-isopropyl-thiocarbamate,
"Di-allate"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
1	4	4	12.5
2	4	4	25
49	4	4	12.5
50	4	4	25
53	4	4	25
54	4	4	25

Beispiel 25: Versuch mit Antidote und Herbizid in "Trockenreis".

Applikation der Antidote als Saatbeizung.

Reissamen der Sorte 1R-36 werden mit der als Antidote zu prüfenden Substanz in einen Glasbehälter gemischt. Samen und Produkt werden durch Schütteln und Roation gut zusammengemischt. Anschliessend werden Plastikcontainer (47 cm lang, 29 cm breit und 24 cm hoch) mit sandiger Lehmerde gefüllt und die gebeizten Samen werden eingesät. Nach dem Bedecken des Samens wird das Herbizid auf die Bodenoberfläche versprüht. 18 Tage nach der Saat wird die Schutzwirkung des Antidots in Prozent bonitiert. Als Referenzen dienen dabei die mit Herbizid

236096 5 - 11 - 75 -

allein behandelten Pflanzen (keine Schutzwirkung) sowie die vollständig unbehandelte Kontrolle (100% Wachstum). Die Ergebnisse sind wie folgt.

Herbizid: 2-Chlor-6'-äthyl-N-(2"-methoxy-1"-methyläthyl)acet-o-toluidid, "Metolachlor"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge g pro kg Saatgut	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
1	1 g	0.5	62.5

Herbizid: 2-Chlor-2,6-diäthyl-N-(2"propyloxyäthyl)acetanilid
"Propolachlor"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge g pro kg Saatgut	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
1	2 g	3	37.5

Beispiel 26: Versuche mit Antidote und Herbizid in Soja.

Applikation von Antidote und Herbizid als Tankmischung im Voraufbau.

Blumentöpfe (oberer Durchmesser 6 cm) werden mit sandiger Lehmerde gefüllt und Sojasamen der Sorte "Hark" werden eingesät. Nach dem Bedecken der Samen wird die als Antidote zu prüfende Substanz zusammen mit dem Herbizid in verdünnte Lösung als Tankmischung auf die Bodenoberfläche versprüht. 21 Tage nach der Herbizidapplikation wird die Schutzwirkung des Antidots in Prozent bonitiert. Als Referenzen dienen dabei die mit Herbizid allein behandelten Pflanzen (keine Schutzwirkung) sowie die vollständig unbehandelte Kontrolle (100% Wachstum). Das Ergebnis ist wie folgt:

236096 5 - 72 - 76 -

Herbizid: 4-Amino-6-tert.butyl-4,5-dihydro-3-methylthio-1,2,4-triazin-S-on, "Metribuzin"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
1	0,5	0,5	25

Beispiel 27: Versuch mit Antidote und Herbizid in Hirse (Sorghum). Applikation von Antidote und Herbizid als Tankmischung im Voraufbau.

Blumentöpfe (oberer Durchmesser 6 cm) werden mit sandiger Lehmerde gefüllt und Hirsesamen der Sorte "Funk G 522" werden eingesät. Nach dem Bedecken des Samens wird die als Antidote zu prüfende Substanz zusammen mit dem Herbizid in verdünnter Lösung als Tankmischung auf die Bodenoberfläche versprüht. 14 Tage nach der Herbizidapplikation wird die Schutzwirkung des Antidots in Prozent bonitiert. Als Referenzen dienen dabei die mit Herbizid allein behandelten Pflanzen (keine Schutzwirkung) sowie die vollständig unbehandelte Kontrolle (100% Wachstum). Das Ergebnis ist wie folgt:

Herbizid: 2-Chlor-6'-äthyl-N-(2"-methoxy-1"-methyläthyl)acet-o-toluidid, "Metolachlor"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
468	1.5	1.5	37.5

Beispiel 28: Versuch mit Antidote und Herbizid in Weizen. Applikation von Antidote und Herbizid als Tankmischung im Voraufbau.

Weizensamen werden in Plastiktöpfe, die 0,5 l Gartenerde enthalten, im Gewächshaus ausgesät. Nach dem Auflaufen werden die Pflanzen im 2-3 Blattstadium mit den als Antidote zu prüfenden Substanzen zusammen mit dem Herbizid als Tankmischung appliziert. 20 Tage nach der Applikation wird die Schutzwirkung des Antidots in Prozent

15 FEB 1982 * 069165

236096 5 - 77 -

bonitiert. Als Referenzen dienen dabei die mit Herbizid allein behandelten Pflanzen (keine Schutzwirkung) sowie die vollständig unbehandelte Kontrolle (100% Wachstum). Das Ergebnis ist wie folgt:

Herbizid: α -[4-(3',5'-Dichlorpyridyloxy-2'-)phenoxy]-propionsäure-(propinyl)ester

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
54	0.5	0.5	50
132	0.5	0.5	25
197	0.5	0.5	25
461	0.5	0.5	37.5

Beispiel 29: Versuch mit Antidote und Herbizid in Getreide.

Applikation von Antidote und Herbizid als Tankmischung im Voraufbau.

Weizen- oder Gerstensamen werden in Plastiktöpfe (oberer Durchmesser 11 cm), die 0,5 l Gartenerde enthalten, im Gewächshaus ausgesät. Nach dem Bedecken der Samen wird die als Antidote zu prüfende Substanz zusammen mit dem Herbizid als Tankmischung appliziert. 24 Tage nach der Applikation wird die Schutzwirkung des Antidots in Prozent bonitiert. Als Referenzen dienen dabei die mit Herbizid allein behandelten Pflanzen (keine Schutzwirkung) sowie die vollständig unbehandelte Kontrolle (100% Wachstum). Die Ergebnisse sind wie folgt:

Herbizid: 2-Chlor-6'-äthyl-N-(2"-methoxy-1"-methyläthyl)acet-o-toluidid, "Metolachlor"

Kultur Weizen (Sorte Farnese)

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
2	1	1	25

15 FEB 1983 * 069165

236096 5 - 74-78 -

Kultur Gerste

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
1	1	1	25

Beispiel 30: Versuch mit Antidote und Herbizid in Mais.

Applikation von Antidote und Herbizid als Tankmischung im Voraufbau.

Maissamen der Sorte "LG 5" werden in Plastiktöpfe (oberer Durchmesser 11 cm), die 0,5 l Gartenerde enthalten, im Gewächshaus ausgesät. Nach dem Bedecken der Samen wird die als Antidote zu prüfende Substanz zusammen mit dem Herbizid als Tankmischung auf die Bodenoberfläche appliziert. 18 Tage nach der Applikation wird die Schutzwirkung des Antidots in Prozent bonitiert. Als Referenzen dienen dabei die mit Herbizid allein behandelten Pflanzen (keine Schutzwirkung) sowie die vollständig unbehandelte Kontrolle (100% Wachstum). Das Ergebnis ist wie folgt:

Herbizid: 2-Chlor-2',6'-dimethyl-N-(2"-methoxy-1"-methyläthyl) acetanilid

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
2	2	2	25

Beispiel 31: Versuch mit Antidote und Herbizid in Mais.

Applikation der Antidote durch Saatbeizung.

Maissamen der Sorte "LG 5" werden mit der als Antidote zu prüfenden Substanz in einen Glasbehälter gemischt. Samen und Produkt werden durch Schütteln und Rotation gut zusammengemischt. Plastiktöpfe (oberer Durchmesser 11 cm) werden mit Gartenerde gefüllt und die gebeizten Samen werden eingesät. Nach dem Bedecken der Samen wird das Herbizid im Voraufbau appliziert. 18 Tage nach der Herbizidaplika-

15 FEB 1983 * 069165

236096 5 - 28-79

tion wird die Schutzwirkung des Antidots in Prozent bonitiert. Als Referenzen dienen dabei die mit Herbizid allein behandelten Pflanzen (keine Schutzwirkung) sowie die vollständig unbehandelte Kontrolle (100% Wachstum). Das Ergebnis ist wie folgt:

Herbizid: 2-Chlor-2',6'-dimethyl-N-(methoxyäthyl)acetanilid
"Dimetolachlor"

Antidote Verbindung Nr.	Aufwandmenge kg/ha	Herbizid Aufwandmenge kg/ha	Schutzwirkung in %
2	2	0.5	25

236096 5

18. 6. 82

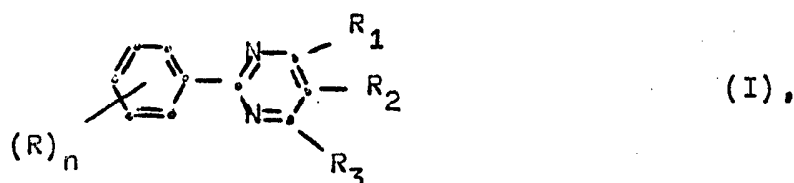
AP A 01 N/236 096/5

60 235 18

- 76 - 80 -

Erfindungsanspruch

1. Mittel zum Schützen von Kulturpflanzen vor der phytotoxischen Wirkung von Herbiziden, gekennzeichnet dadurch, daß es ein Phenylpyrimidin der Formel I



worin

n eine Zahl von 1 bis 5

R Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyan, $-XR_5$, $-NR_6R_7$, $-CO-A$, $-CS-NR_6R_7$, $-SO_2-NR_6R_7$, $C(OR_4)_2-R_4$, $-C-R_4$, $-PO(OR_4)_2$, $-SO_3H$, $-N=CR_8R_9$, eine unsubstitu-



ierte oder durch Halogen, $-XR_5$, $-NR_6R_7$, $-PO(OR_4)_2$, $-CO-A$ oder Cyan substituierte C_1-C_6 -Alkyl- oder C_3-C_6 -Alkyl- oder C_3-C_6 -Cycloalkylgruppe oder eine unsubstituierte oder durch Halogen oder $-XR_5$ substituierte C_2-C_6 -Alkenyl-, C_3-C_6 -Cycloalkenyl- oder C_2-C_6 -Alkinylgruppe,

R_1 und R_3 unabhängig voneinander je Wasserstoff, Halogen, C_1-C_6 -Alkyl, Cyan, $-CO-A$, $-NR_6R_7$, $-XR_5$ oder unsubstituiertes oder durch Halogen, C_1-C_4 -Alkyl, Nitro oder $-XR_5$ substituiertes Phenyl,

R_2 Wasserstoff, Halogen, unsubstituiertes oder durch Halogen, C_1-C_4 -Alkyl, Trifluormethyl, Nitro oder $-XR_5$

18. 6. 82

AP A 01 N/236 096/5

60 235 18

236096 5

- 77 - 81 -

substituiertes Phenyl oder eine unsubstituierte oder durch Halogen oder $-XR_5$ substituierte C_1-C_6 -Alkyl-, C_3-C_6 -Cycloalkyl-, C_2-C_6 -Alkenyl- oder C_3-C_6 -Alkynylgruppe,

R_4 Wasserstoff, eine unsubstituierte oder durch Halogen, $-CO-A$, Hydroxy, C_1-C_6 -Alkylthio oder $-NR_6R_7$ substituierte C_1-C_6 -Alkyl-, C_3-C_6 -Alkenyl- oder C_3-C_6 -Alkynylgruppe.

R_5 dasselbe wie R_4 , außerdem C_1-C_6 -Alkylcarbonyl, C_3-C_6 -Alkenylcarbonyl oder C_3-C_6 -Alkynylcarbonyl.

R_6 und R_7 unabhängig voneinander je Wasserstoff, C_3-C_6 -Alkenyl, C_3-C_6 -Alkynyl, C_3-C_6 -Cycloalkyl oder unsubstituiertes oder durch $-CO-A$ substituiertes C_1-C_6 -Alkyl, oder einer der Reste R_6 und R_7 bedeutet eine Gruppe $-CO-A$ oder $-OR_4$ oder R_6 und R_7 zusammen eine 4- bis 6-gliedrige Alkylenkette, die durch Sauerstoff, Schwefel, eine Imino- oder C_1-C_4 -Alkyliminogruppe unterbrochen sein kann,

B eine verzweigte oder unverzweigte C_1-C_6 -Alkylenkette und

X Sauerstoff, Schwefel, $-SO-$ oder $-SO_2-$ bedeuten,

A die gleiche Bedeutung hat wie R_5 oder für $-OR_4$ oder $-NR_6R_7$ steht,

R_8 unsubstituiertes oder durch C_1-C_6 -Alkoxy substituiertes C_1-C_6 -Alkyl,

R_9 Wasserstoff oder dasselbe wie R_8 oder

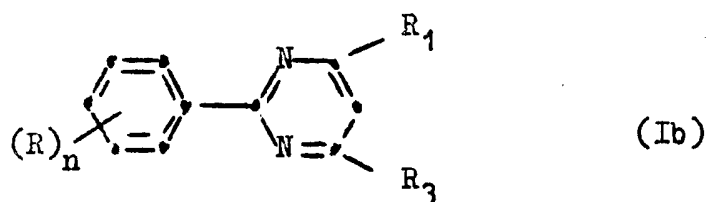
R_8 und R_9 zusammen eine 4- bis 5-gliedrige Alkylenkette bedeuten,

enthält, zusammen mit einem geeigneten Trägermaterial.

236096 5

- 78-82 - AP A 01 N /236 096 5
60 235 18

2. Mittel gemäß Punkt 1 zum Schützen von Kulturpflanzen vor der phytotoxischen Wirkung von Herbiziden, gekennzeichnet dadurch, daß es ein Phenylpyrimidin der Formel Ib



enthält,
worin R, R₁, R₃ und n die im Punkt 1 gegebene Bedeutung haben.

3. Mittel gemäß Punkt 1 zum selektiven Bekämpfen von mono- und dikotylen Unkräutern in Nutzpflanzenkulturen, gekennzeichnet dadurch, daß es als Wirkstoff-Komponente ein Herbizid und ein Phenylpyrimidin der Formel I, Punkt 1, als Gegenmittel im Verhältnis 100 : 1 bis 1 : 5 enthält, zusammen mit einem geeigneten Trägermaterial.