



УКРАЇНА

(19) UA (11) 85431 (13) C2
(51) МПК
C07D 413/14 (2006.01)
A01N 47/38 (2006.01)

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ
І НАУКИ УКРАЇНИ

ДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ

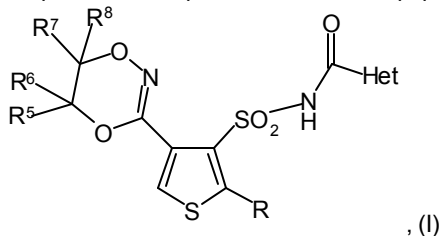
ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД

(54) ДІОКСАЗИНІЛЗАМІЩЕНІ ТІЄНІСУЛЬФОНІЛАМІНОКАРБОНІЛИ

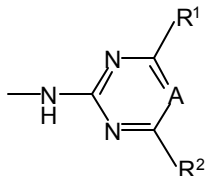
1

2

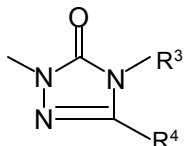
- (21) а200702131
(22) 13.07.2005
(24) 26.01.2009
(86) РСТ/ЕР2005/007580, 13.07.2005
(31) 10 2004 036 551.2
(32) 28.07.2004
(33) DE
(46) 26.01.2009, Бюл.№ 2, 2009 р.
(72) ГЕЗІНГ ЕРНСТ Р. Ф., ФОЙХТ ДІТЕР, КЕНЕ
ХАЙНЦ, АУЛЕР ТОМАС, ХІЛЛЬС МАРТІН, GB/DE
(73) БАЄР КРОПСАЄНС АГ
(56) US 5476936, А, 19.12.1998
WO 9807721, А1, 26.02.1998
WO 03037086, А, 08.05.2003
WO 03056922, А, 17.07.2003
(57) 1. Діоксазинілзаміщені тієнісульфоніламінокарбоніли загальної формули (I)



в якій
Het означає



або



А означає азот або СН-групу,
R означає водень, ціано, нітро, галоген, відповідно, в разі потреби, заміщені ціано, галогеном або С₁-С₄-алкокси алкіл, алкокси, алкоксикарбоніл, алкілтіо, алкілсульфініл або алкілсульфоніл, що містять відповідно від 1 до 6 атомів вуглецю в алкілній групі, або відповідно, в разі потреби, замі-

щені ціано або галогеном алкеніл, алкініл, алкенілокси або алкінілокси, що містять відповідно від 2 до 6 атомів вуглецю в алкенільній або алкінільній групі,

R¹ означає водень, галоген, відповідно, в разі потреби, заміщені ціано, галогеном або С₁-С₄-алкокси алкіл, алкокси, алкілтіо, алкіламіно або діалкіламіно, що містять відповідно від 1 до 4 атомів вуглецю в алкільних групах, або відповідно, в разі потреби, заміщені ціано, галогеном, С₁-С₄-алкілом або С₁-С₄-алкокси фенокси, оксетанілокси, фурилокси або тетрагідрофурилокси,

R² означає водень, галоген, відповідно, в разі потреби, заміщені ціано, галогеном або С₁-С₄-алкокси алкіл, алкокси, алкілтіо, алкіламіно або діалкіламіно, що містять відповідно від 1 до 4 атомів вуглецю в алкільних групах, або відповідно, в разі потреби, заміщені ціано, галогеном, С₁-С₄-алкілом або С₁-С₄-алкокси фенокси, оксетанілокси, фурилокси або тетрагідрофурилокси,

R³ означає водень, гідрокси, аміно, ціано, С₂-С₁₀-алкіліденаміно, в разі потреби, заміщений фтором, хлором, бромом, ціано, С₁-С₄-алкокси, С₁-С₄-алкілкарбонілом або С₁-С₄-алкоксикарбонілом алкіл, що містить від 1 до 6 атомів вуглецю, відповідно, в разі потреби, заміщений фтором, хлором та/або бромом алкеніл або алкініл, що містять відповідно від 2 до 6 атомів вуглецю, відповідно, в разі потреби, заміщений фтором, хлором, бромом, ціано, С₁-С₄-алкокси або С₁-С₄-алкоксикарбонілом алкокси, алкіламіно або алкілкарбоніламіно, що містять відповідно від 1 до 6 атомів вуглецю в алкільних групах, алкенілокси, що містить від 3 до 6 атомів вуглецю, діалкіламіно, що містить відповідно від 1 до 4 атомів вуглецю в алкільних групах, відповідно, в разі потреби, заміщений фтором, хлором, бромом, ціано та/або С₁-С₄-алкілом циклоалкіл, циклоалкіламіно або циклоалкілалкіл, що містять відповідно від 3 до 6 атомів вуглецю в алкілній групі та, в разі потреби, від 1 до 4 атомів вуглецю в алкілній частині, або відповідно, в разі потреби, заміщений фтором, хлором, бромом, ціано, нітро, С₁-С₄-алкілом, трифторметилом та/або С₁-С₄-алкокси арил або арилалкіл, що містять відповідно 6 або 10 атомів вуглецю в арильній групі та, в разі потреби, від 1 до 4 атомів вуглецю в алкілній частині,

(13) C2

(11) 85431

(19) UA

R^4 означає водень, гідрокси, меркапто, аміно, ціано, фтор, хлор, бром, йод, в разі потреби, заміщений фтором, хлором, бромом, ціано, C_1 - C_4 -алкокси, C_1 - C_4 -алкілкарбонілом або C_1 - C_4 -алкоксикарбонілом алкіл, що містить від 1 до 6 атомів вуглецю, відповідно, в разі потреби, заміщені фтором, хлором та/або бромом алкеніл або алкініл, що містять відповідно від 2 до 6 атомів вуглецю, відповідно, в разі потреби, заміщені фтором, хлором, ціано, C_1 - C_4 -алкокси або C_1 - C_4 -алкоксикарбонілом алкокси, алкілтію, алкіламіно або алкілкарбоніламіно, що містять відповідно від 1 до 6 атомів вуглецю в алкільних групах, алкенілокси, алкінілокси, алкенілітію, алкінілітію, алкеніламіно або алкініламіно, що містять відповідно від 3 до 6 атомів вуглецю в алкенільній або алкінільній групах, діалкіламіно, що містять від 1 до 4 атомів вуглецю в алкільних групах, відповідно, в разі потреби, заміщені фтором, хлором, бромом, ціано та/або C_1 - C_4 -алкілом циклоалкіл, циклоалкеніл, циклоалкілокси, циклоалкілітію, циклоалкіламіно, циклоалкілалкіл, циклоалкілалкокси, циклоалкілалкілітію або циклоалкілалкіламіно, що містять відповідно від 3 до 6 атомів вуглецю в циклоалкільній або циклоалкенільній групі та, в разі потреби, від 1 до 4 атомів вуглецю в алкільній частині, або відповідно, в разі потреби, заміщені фтором, хлором, бромом, ціано, нітро, C_1 - C_4 -алкілом, трифторметилом, C_1 - C_4 -алкокси та/або C_1 - C_4 -алкоксикарбонілом арил, арилалкіл, арилокси, арилалкокси, арилтію, арилалкілітію, ариламіно або арилалкіламіно, що містять відповідно 6 або 10 атомів вуглецю в арильній групі та, в разі потреби, від 1 до 4 атомів вуглецю в алкільній частині, та R^5 , R^6 , R^7 та R^8 незалежно один від одного означають водень, галоген, ціано або тіоціанато, або, в разі потреби, заміщений галогеном алкіл, алкокси, алкілітію, алкілсульфініл, алкілсульфоніл алкіламіно, алкілкарбоніл, алкоксикарбоніл або алкіламінокарбоніл, що містять відповідно від 1 до 3 атомів вуглецю в алкільній частині, а також солі сполук формули (I).

2. Сполуки за п. 1, які **відрізняються** тим, що R означає водень, ціано, фтор, хлор, бром, відповідно, в разі потреби, заміщені ціано, фтором, хлором, метокси або етокси метил, етил, n - або i -пропіл, n -, i -, втор- або трет-бутил, метокси, етокси, n - або i -пропокси, метоксикарбоніл, етоксикарбоніл, n - або i -пропоксикарбоніл, метилтію, етилтію, n - або i -пропілтію, метилсульфініл, етилсульфініл, метилсульфоніл або етилсульфоніл, або відповідно, в разі потреби, заміщені ціано, фтором або хлором пропеніл, бутеніл, пропініл, бутиніл, пропенілокси, бутенілокси, пропінілокси або бутинілокси,

R^1 означає фтор, хлор, бром, йод або відповідно, в разі потреби, заміщені ціано, фтором, хлором, метокси або етокси метил, етил, n - або i -пропіл, метокси, етокси, n - або i -пропокси, метилтію, етилтію, n - або i -пропілтію, метиламіно, етиламіно, n - або i -пропіламіно, диметиламіно або діетиламіно, R^2 означає фтор, хлор, бром, йод або відповідно, в разі потреби, заміщені ціано, фтором, хлором, метокси або етокси метил, етил, n - або i -пропіл, метокси, етокси, n - або i -пропокси, метилтію, етил-

тію, n - або i -пропілтію, метиламіно, етиламіно, n - або i -пропіламіно, диметиламіно або діетиламіно, R^3 означає водень, гідрокси, аміно, відповідно, в разі потреби, заміщені фтором, хлором, ціано, метокси або етокси метил, етил, n - або i -пропіл, n -, i -, втор- або трет-бутил, відповідно, в разі потреби, заміщені фтором, хлором та/або бромом етеніл, пропеніл, бутеніл, пропініл або бутиніл, відповідно, в разі потреби, заміщені фтором, хлором, ціано, метокси або етокси метокси, етокси, n - або i -пропокси, n -, i -, втор- або трет-бутокси, метиламіно, етиламіно, n - або i -пропіламіно, n -, i -, втор- або трет-бутиламіно; пропенілокси або бутенілокси, диметиламіно або діетиламіно, відповідно, в разі потреби, заміщені фтором, хлором, метилом та/або етилом циклопропіл, циклобутил, циклопеніл, циклогексил, циклопропіламіно, циклобутиламіно, циклопентиламіно, циклогексиламіно, циклопропілметил, циклобутилметил, циклопентилметил або циклогексилметил, або відповідно, в разі потреби, заміщені фтором, хлором, метилом, трифторметилом та/або метокси феніл або бензил,

R^4 означає водень, гідрокси, меркапто, аміно, ціано, фтор, хлор, бром, відповідно, в разі потреби, заміщені фтором, хлором, ціано, метокси, етокси, n - або i -пропокси, ацетилом, пропіонілом, n - або i -бутироїлом, метоксикарбонілом, етоксикарбонілом, n - або i -пропоксикарбонілом метил, етил, n - або i -пропіл, n -, i -, втор- або трет-бутил, відповідно, в разі потреби, заміщені фтором, хлором та/або бромом етеніл, пропеніл, бутеніл, етиніл, пропініл або бутиніл, відповідно, в разі потреби, заміщені фтором, хлором, ціано, метокси, етокси, n - або i -пропокси, метоксикарбонілом, етоксикарбонілом, n - або i -пропоксикарбонілом метокси, етокси, n - або i -пропокси, n -, i -, втор- або трет-бутокси, метилтію, етилтію, n - або i -пропілтію, n -, i -, втор- або трет-бутилтію, метиламіно, етиламіно, n - або i -пропіламіно, n -, i -, втор- або трет-бутиламіно, ацетиламіно або пропіонаміно; пропенілокси, бутенілокси, етинілокси, пропінілокси, бутинілокси, пропенілітію, бутенілітію, пропінілітію, бутинілітію, пропеніламіно, бутеніламіно, пропініламіно або бутиніламіно, диметиламіно, діетиламіно або дипропіламіно, відповідно, в разі потреби, заміщені фтором, хлором, метилом та/або етилом циклопропіл, циклобутил, циклопентил, циклогексил, циклопентеніл, циклогексеніл, циклопропілокси, циклобутилокси, циклопентилокси, циклогексилокси, циклопропілтію, циклобутилтію, циклопентилтію, циклогексилтію, циклопропіламіно, циклобутиламіно, циклопентиламіно, циклогексиламіно, циклопропілметил, циклобутилметил, циклопентилметил, циклогексилметил, циклопропілметокси, циклобутилметокси, циклопентилметокси, циклогексилметокси, циклопропілметилтію, циклобутилметилтію, циклопентилметилтію, циклогексилметилтію, циклопропілметиламіно, циклобутилметиламіно, циклопентилметиламіно або циклогексилметиламіно, або відповідно, в разі потреби, заміщені фтором, хлором, бромом, метилом, трифторметилом, метокси або метоксикарбонілом феніл, бензил, фенокси, бензилокси, фенілтію, бензилтію, феніламіно або бензиламіно та R^5 , R^6 , R^7 та R^8 незалежно

один від одного означають водень або метил, а також натрієві, калієві, магнієві, кальцієві, амонієві, С₁-С₄-алкіламонієві, ді-(С₁-С₄-алкіл)амонієві три-(С₁-С₄-алкіл)амонієві, тетра-(С₁-С₄-алкіл)амонієві, три-(С₁-С₄-алкіл)сульфонієві, С₅- або С₆-циклоалкіламонієві та ді-(С₁-С₂-алкіл)бензиламонієві солі цих сполук.

3. Сполуки за п. 1, які **відрізняються** тим, що R означає фтор, хлор, бром, відповідно, в разі потреби, заміщені ціано, фтором, хлором, метокси або етокси метил, етил, н- або і-пропіл, н-, і-, втор- або трет-бутил, метокси, етокси, н- або і-пропокси, R¹ означає фтор, хлор, бром, або йод або, в разі потреби, заміщені фтором або хлором метил, етил, н- або і-пропіл, метокси, етокси, н- або і-пропокси, або диметиламіно,

R² означає фтор, хлор, бром, або йод або, в разі потреби, заміщені фтором або хлором метил, етил, н- або і-пропіл, метокси, етокси, н- або і-пропокси або диметиламіно,

R³ означає метил, етил, н- або і-пропіл або циклопропіл,

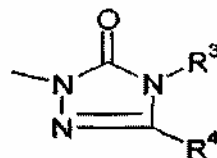
R⁴ означає метокси, етокси, н- або і-пропокси, н-, і-, втор- або трет-бутокс,

R⁵, R⁶, R⁷ та R⁸ означають водень, а також натрієві, калієві, магнієві, кальцієві, амонієві, С₁-С₄-алкіламонієві, ді-(С₁-С₄-алкіл)амонієві, три-(С₁-С₄-алкіл)амонієві, тетра-(С₁-С₄-алкіл)амонієві, три-(С₁-С₄-алкіл)сульфонієві, С₅- або С₆-циклоалкіламонієві та ді-(С₁-С₂-алкіл)бензиламонієві солі сполук формули (I).

Винахід стосується нових заміщених тієнілсульфоніламінокарбонілів, способу та проміжних продуктів для їх одержання та їх застосування як гербіцидів.

Відомо, що певні діоксазинілзаміщені тієнілсульфоніламінокарбоніли проявляють гербіцидні властивості (див. US 5,476,936). Однак гербіцидна активність цих відомих сполук не в усіх випадках є задовільною.

Нещодавно були одержані нові заміщені тієнілсульфоніламінокарбоніли загальної формули (I)



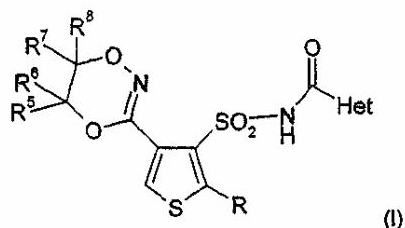
A означає азот або СН-групу,

R означає водень, ціано, нітро, галоген, відповідно, в разі потреби, заміщені ціано, галогеном або С₁-С₄-алкокси алкіл, алкокси, алкілтію, алкіламіно або діалкіламіно, що містять відповідно від 1 до 6 атомів вуглецю в алкільній групі, або відповідно, в разі потреби, заміщені ціано або галогеном алкеніл, алкініл, алкенілокси або алкінілокси, що містять відповідно від 2 до 6 атомів вуглецю в алкенільній або алкінільній групі,

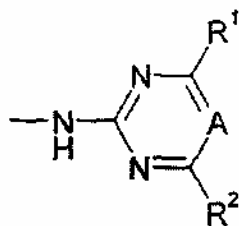
R¹ означає водень, галоген, відповідно, в разі потреби, заміщені ціано, галогеном або С₁-С₄-алкокси алкіл, алкокси, алкілтію, алкіламіно або діалкіламіно, що містять відповідно від 1 до 4 атомів вуглецю в алкільних групах, або відповідно, в разі потреби, заміщені ціано, галогеном, С₁-С₄-алкілом або С₁-С₄-алкокси фенокси, оксетанілокси, фурилокси або тетрагідрофурилокси,

R² означає водень, галоген, відповідно, в разі потреби, заміщені ціано, галогеном або С₁-С₄-алкокси алкіл, алкокси, алкілтію, алкіламіно або діалкіламіно, що містять відповідно від 1 до 4 атомів вуглецю в алкільних групах, або відповідно, в разі потреби, заміщені ціано, галогеном, С₁-С₄-алкілом або С₁-С₄-алкокси фенокси, оксетанілокси, фурилокси або тетрагідрофурилокси,

R³ означає водень, гідрокси, аміно, ціано, С₂-С₁₀-алкіліденаміно, в разі потреби, заміщений фтором, хлором, бромом, ціано, С₁-С₄-алкокси, С₁-С₄-алкілкарбонілом або С₁-С₄-алкоксикарбонілом алкіл, що містить від 1 до 6 атомів вуглецю, відповідно, в разі потреби, заміщений фтором, хлором та/або бромом алкеніл або алкініл, що містять відповідно від 2 до 6 атомів вуглецю, відповідно, в разі потреби, заміщені фтором, хлором, бромом,



в якій
Het означає



або

ціано, C₁-C₄-алкокси або C₁-C₄-алкоксикарбонілом алкокси, алкіламіно або алкілкарбоніламіно, що містять відповідно від 1 до 6 атомів вуглецю в алкільних групах, алкенілокси, що містить від 3 до 6 атомів вуглецю, діалкіламіно, що містить відповідно від 1 до 4 атомів вуглецю в алкільних групах, відповідно, в разі потреби, заміщені фтором, хлором, бромом, ціано та/або C₁-C₄-алкілом циклоалкіл, циклоалкіламіно або циклоалкілалкіл, що містять відповідно від 3 до 6 атомів вуглецю в алкільній групі та, в разі потреби, від 1 до 4 атомів вуглецю в алкільній частині, або відповідно, в разі потреби, заміщені фтором, хлором, бромом, ціано, нітро, C₁-C₄-алкілом, трифторметилом та/або C₁-C₄-алкокси арил або арилалкіл, що містять відповідно 6 або 10 атомів вуглецю в арильній групі та, в разі потреби, від 1 до 4 атомів вуглецю в алкільній частині.

R⁴ означає водень, гідрокси, меркапто, аміно, ціано, фтор, хлор, бром, йод, в разі потреби, заміщений фтором, хлором, бромом, ціано, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-алкілкарбонілом або C₁-C₄-алкоксикарбонілом алкіл, що містить від 1 до 6 атомів вуглецю, відповідно, в разі потреби, заміщений фтором, хлором та/або бромом алкеніл або алкініл, що містять відповідно від 2 до 6 атомів вуглецю, відповідно, в разі потреби, заміщені фтором, хлором, ціано, C₁-C₄-алкокси або C₁-C₄-алкоксикарбонілом алкокси, алкілтіо, алкіламіно або алкілкарбоніламіно, що містять відповідно від 1 до 6 атомів вуглецю в алкільних групах, алкенілокси, алкінілтіо, алкеніламіно або алкініламіно, що містять відповідно від 3 до 6 атомів вуглецю в алкенільній або алкінільній групах, діалкіламіно, що містить від 1 до 4 атомів вуглецю в алкільних групах, відповідно, в разі потреби, заміщені фтором, хлором, бромом, ціано та/або C₁-C₄-алкілом циклоалкіл, циклоалкеніл, циклоалкілокси, циклоалкілтіо, циклоалкіламіно, циклоалкілалкіл, циклоалкілалкокси, циклоалкілалкілтіо або циклоалкілалкіламіно, що містять відповідно від 3 до 6 атомів вуглецю в циклоалкільній або циклоалкенільній групі та, в разі потреби, від 1 до 4 атомів вуглецю в алкільній частині, або відповідно, в разі потреби, заміщені фтором, хлором, бромом, ціано, нітро, C₁-C₄-алкілом, трифторметилом, C₁-C₄-алкокси та/або C₁-C₄-алкоксикарбонілом арил, арилалкіл, арилокси, арилалкокси, арилтіо, арилалкілтіо, ариламіно або арилалкіламіно, що містять відповідно 6 або 10 атомів вуглецю в арильній групі та, в разі потреби, від 1 до 4 атомів вуглецю в алкільній частині, та

R⁵, R⁶, R⁷ та R⁸ незалежно один від одного означають водень, галоген, ціано або тіоціанато або, в разі потреби, заміщений галогеном алкіл, алкокси, алкілтіо, алкілсульфініл, алкілсульфоніл алкіламіно, алкілкарбоніл, алкоксикарбоніл або алкіламінокарбоніл, що містять відповідно від 1 до 3 атомів вуглецю в алкільній частині, а також солі сполук формули (I).

Насичені або ненасичені вуглеводневі групи, такі як алкіл, алкеніл або алкініл, -також разом з гетероатомами, як в алкокси -, якщо це можливо, можуть бути нерозгалуженими або розгалуженими.

В разі потреби, заміщені залишки можуть бути заміщеними один або кілька разів, причому при багаторазовому заміщенні замісники можуть бути однаковими або різними.

R означає переважно водень, ціано, фтор, хлор, бром, відповідно, в разі потреби, заміщені ціано, фтором, хлором, метокси або етокси метил, етил, н- або і-пропіл, н-, і-, втор.- або трет.-бутил, метокси, етокси, н- або і-пропокси, метоксикарбоніл, етоксикарбоніл, н- або і-пропоксикарбоніл, метилтіо, етилтіо, н- або і-пропілтіо, метилсульфініл, етилсульфініл, метилсульфоніл або етилсульфоніл, або відповідно, в разі потреби, заміщені ціано, фтором або хлором пропеніл, бутеніл, пропініл, бутініл, пропенілокси, бутенілокси, пропінілокси або бутінілокси.

R означає особливо переважно фтор, хлор, бром, відповідно, в разі потреби, заміщені ціано, фтором, хлором, метокси або етокси метил, етил, н- або і-пропіл, н-, і-, втор.- або трет.-бутил, метокси, етокси, н- або і-пропокси.

R означає найбільш переважно метил, етил, н- або і-пропіл.

R¹ означає переважно водень, фтор, хлор, бром, йод або відповідно, в разі потреби, заміщені ціано, фтором, хлором, метокси або етокси метил, етил, н- або і-пропіл, метокси, етокси, н- або і-пропокси, метилтіо, етилтіо, н- або і-пропілтіо, метиламіно, етиламіно, н- або і-пропіламіно, диметиламіно або діетиламіно.

R¹ означає особливо переважно фтор, хлор, бром, або йод або, в разі потреби, заміщені фтором або хлором метил, етил, н- або і-пропіл, метокси, етокси, н- або і-пропокси, або диметиламіно.

R² означає переважно фтор, хлор, бром, йод або відповідно, в разі потреби, заміщені ціано, фтором, хлором, метокси або етокси метил, етил, н- або і-пропіл, метокси, етокси, н- або і-пропокси, метилтіо, етилтіо, н- або і-пропілтіо, метиламіно, етиламіно, н- або і-пропіламіно, диметиламіно або діетиламіно.

R² означає особливо переважно фтор, хлор, бром, або йод або, в разі потреби, заміщені фтором або хлором метил, етил, н- або і-пропіл, метокси, етокси, н- або і-пропокси або диметиламіно.

R³ означає переважно водень, гідрокси, аміно, відповідно, в разі потреби, заміщені фтором, хлором, ціано, метокси або етокси метил, етил, н- або і-пропіл, н-, і-, втор.- або трет.-бутил, відповідно, в разі потреби, заміщені фтором, хлором та/або бромом етеніл, пропеніл, бутеніл, пропініл або бутініл, відповідно, в разі потреби, заміщені фтором, хлором, ціано, метокси або етокси метокси, етокси, н- або і-пропокси, н-, і-, втор.- або трет.-бутокси, метиламіно, етиламіно, н- або і-пропіламіно, н-, і-, втор.- або трет.-бутиламіно; пропенілокси або бутенілокси, диметиламіно або діетиламіно, відповідно, в разі потреби, заміщені фтором, хлором, метилом та/або етилом циклопропіл, циклобутил, циклопентил, циклогексил, циклопропіламіно, циклобутиламіно, циклопентиламіно, циклогексиламіно, циклопропілметил, циклобутил метил, циклопентилметил або циклогексилметил, або відповідно, в разі потреби, замі-

щені фтором, хлором, метилом, трифторметилом та/або метокси феніл або бензил.

R^3 означає особливо переважно метил, етил, н- або і-пропіл або циклопропіл.

R^4 означає переважно водень, гідрокси, меркапто, аміно, ціано, фтор, хлор, бром, відповідно, в разі потреби, заміщені фтором, хлором, ціано, метокси, етокси, н- або і-пропокси, ацетилом, пропіонілом, н- або і-бутироїлом, метоксикарбонілом, етоксикарбонілом, н- або і-пропоксикарбонілом метил, етил, н- або і-пропіл, н-, і-, втор.-або трет.-бутил, відповідно, в разі потреби, заміщені фтором, хлором та/або бромом етеніл, пропеніл, бутеніл, етиніл, пропініл або бутиніл, відповідно, в разі потреби, заміщені фтором, хлором, ціано, метокси, етокси, н- або і-пропокси, метоксикарбонілом, етоксикарбонілом, н- або і-пропоксикарбонілом метокси, етокси, н- або і-пропокси, н-, і-, втор.- або трет.-бутокси, метилтіо, етилтіо, н- або і-пропілтіо, н-, і-, втор.- або трет.-бутилтіо, метиламіно, етиламіно, н- або і-пропіламіно, н-, і-, втор.- або трет.-бутиламіно, ацетиламіно або пропініламіно; пропенілокси, бутенілокси, етинілокси, пропінілокси, бутинілокси, пропенілтіо, бутенілтіо, пропінілтіо, бутинілтіо, пропеніламіно, бутеніламіно, пропініламіно або бутиніламіно, диметиламіно, діетиламіно або дипропіламіно, відповідно, в разі потреби, заміщені фтором, хлором, метилом та/або етилом циклопропіл, циклобутил, циклопентил, циклогексил, циклопентеніл, циклогексеніл, циклопропілокси, циклобутилокси, циклопентилокси, циклогексилокси, циклопропілтіо, циклобутилтіо, циклопентилтіо, циклогексилтіо, циклопропіламіно, циклобутиламіно, циклопентиламіно, циклогексиламіно, циклопропілметил, циклобутилметил, циклопентилметил, циклогексилметил, циклопропілметокси, циклобутилметокси, циклопентилметокси, циклогексилметокси, циклопропілметилтіо, циклогексилметилтіо, циклопропілметиламіно, циклобутилметиламіно, циклопентилметиламіно або циклогексилметиламіно, або відповідно, в разі потреби, заміщені фтором, хлором, бромом, метилом, трифторметилом, метокси або метоксикарбонілом феніл, бензил, фенокси, бензилокси, фенілтіо, бензилтіо, феніламіно або бензиламіно.

R^4 означає особливо переважно метокси, етокси, н- або і-пропокси, н-, і-, втор.- або трет.-бутокси.

R^5 , R^6 , R^7 та R^8 незалежно один від одного означають переважно водень або метил.

R^5 , R^6 , R^7 та R^8 означають особливо переважно водень.

Об'єктом даного винаходу є також переважно натрієві, калієві, магнієві, кальцієві, амонієві, C_1 - C_4 -алкіламонієві, ді-(C_1 - C_4 -алкіл)амонієві, три-(C_1 - C_4 -алкіл)амонієві, тетра-(C_1 - C_4 -алкіл)амонієві, три-(C_1 - C_4 -алкіл)сульфонієві, C_5 - або C_6 -циклоалкіламонієві та ди-(C_1 - C_2 -алкіл)бензиламонієві солі сполуки формули (I), в якій A, Het, R, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 та R^8 мають вказані вище переважні значення.

Зазначені вище загальні або переважні визначення залишків стосуються як кінцевих продуктів

формули (I), так і відповідно необхідних для їх одержання вихідних або проміжних сполук. Ці визначення залишків можуть бути в будь-якій послідовності комбіновані між собою, а також з іншими областями значень переважних сполук.

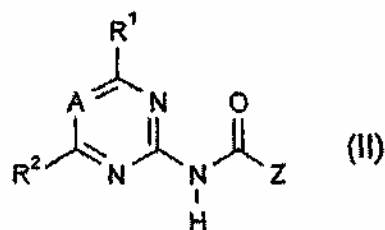
Згідно з винаходом переважними є такі сполуки формули (I), в яких представлена комбінація зазначених вище переважних значень.

Згідно з винаходом особливо переважними є такі сполуки формули (I), в яких представлена комбінація зазначених вище особливо переважних значень.

Нові заміщені тієнілсульфоніламінокарбоніли загальної формули (I) характеризуються високою гербіцидною активністю.

Нові заміщені тієнілсульфоніламінокарбоніли загальної формули (I) одержують таким чином:

(a) заміщені аміноазини загальної формули (II)

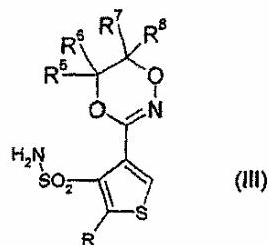


в якій

A, R^1 та R^2 мають вказані вище значення та

Z означає галоген, алкокси або арилокси,

піддають взаємодії з похідними тіофену загальної формули (III)

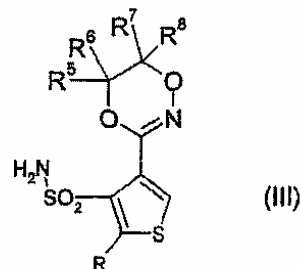


в якій

R та R^5 - R^8 мають вказані вище значення,

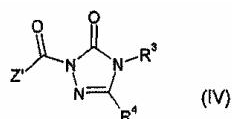
в разі потреби, в присутності засобу, що допомагає здійсненню реакції, та, в разі потреби, в присутності розріджувача,

або (b) заміщені тіофен-3-сульфонаміди загальної формули (III)



в якій R та R^5 - R^8 мають вказані вище значення,

піддають взаємодії із заміщеними триазолінами загальної формули (IV)



в якій

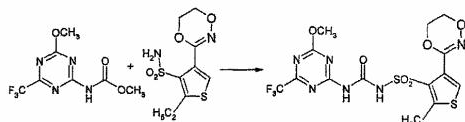
R^3 та R^4 мають вказані вище значення та

Z' означає галоген, алкокси, арилокси або арилалкокси,

в разі потреби, в присутності засобу, що допомагає здійсненню реакції, та, в разі потреби, в присутності розріджувача,

та, в разі потреби, одержані способами (а) або (б) сполуки формули (I) звичайними методами перетворюють на солі.

Якщо як вихідні речовини застосовують, наприклад, 2-метоксикарбоніламіно-4-метокси-6-трифторметил-1,3,5-триазин та 2-етил-4-(5,6-дигідро-[1,4,2]-діоксазин-3-іл)-тіофен-3-сульфонамід, то хід реакції відповідно до способу (а) згідно з винаходом демонструє наведена нижче схема:



Заміщені аміноазини, які як вихідні речовини застосовують при здійсненні способу згідно з винаходом для одержання сполук формули (I), загалом характеризуються формулою (II). У формулі (II) A , R^1 та R^2 переважно або особливо переважно мають такі значення, які були вказані вище у зв'язку з описом сполук формули (I) та визначені як переважні або особливо переважні для A , R^1 та R^2 ; Z означає переважно фтор, хлор, бром, C_1 - C_4 -алкокси або фенокси, зокрема хлор, метокси, етокс або фенокс.

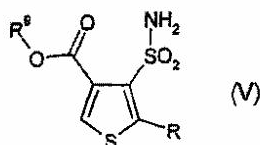
Вихідні речовини формули (II) є відомими та/або можуть бути одержані відомими способами (див. US 4,690,707, DE 19501174).

Похідні тіофену, які як вихідні речовини застосовують при здійсненні способу згідно з винаходом, загалом характеризуються формулою (III). У формулі (III) R та R^5 - R^8 переважно або особливо переважно мають такі значення, які були вказані вище у зв'язку з описом сполук формули (I) та визначені як переважні або особливо переважні для R та R^5 - R^8 .

Заміщені тіофен-3-сульфонаміди загальної формули (III) є ще невідомим з літературних джерел, тому вони також є об'єктом даного винаходу. Під сполуками формули (III) розуміють переважно такі, в яких R не означає водень.

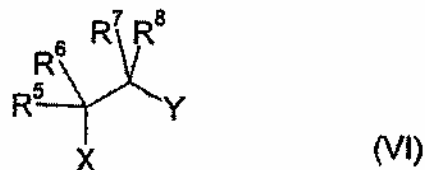
Заміщені тіофен-3-сульфонаміди загальної формули (III) одержують таким чином:

заміщені тіофен-3-сульфонаміди загальної формули (V)



в якій

R має вказані вище, а R^9 означає C_1 - C_4 -алкіл, піддають взаємодії з гідрохлоридом гідроксиламіну та заміщеним алканом формули (VI)



в якій R^5 - R^8 мають вказані вище значення та

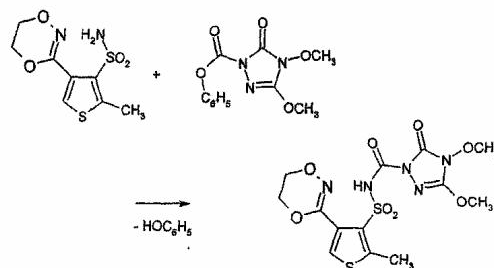
X і Y незалежно один від одного означають галоген, C_1 - C_6 -алкілкарбонілокси, C_6 - C_{12} -арилкарбонілокси, C_1 - C_6 -алкілсульфонілокси або C_1 - C_6 -арилсульфонілокси,

в разі потреби, в присутності розріджувача та, в разі потреби, в присутності засобу, що допомагає здійсненню реакції (див. приклад одержання). Аналогічні способи відомі також з US 5,476,936 (див. колонки 11/12).

Вихідні речовини формули (V) є відомими та/або можуть бути одержані відомими способами (див. WO 01/05788, WO 01/10863).

Алкани формули (VI) як вихідні сполуки для синтезу є наявними у продажу або можуть бути одержані відомими способами (див. US 5,476,936, колонка 13).

Якщо як вихідні речовини застосовують, наприклад, 2-метил-4-(5,6-дигідро-[1,4,2]-діоксазин-3-іл)-тіофен-3-сульфонамід та 4,5-диметокси-2-феноксикарбоніл-2,4-дигідро-3Н-1,2,4-триазол-3-он, то хід реакції відповідно до способу (б) згідно з винаходом демонструє наведена нижче схема:



Заміщені тіофен-3-сульфонаміди, які як вихідні речовини застосовують при здійсненні способу (б) згідно з винаходом для одержання сполук загальної формули (I), загалом характеризуються формулою (III). При цьому йдеться про ті самі сполуки формули (III), які були застосовані у способі (а) згідно з винаходом.

Заміщені триазолінони, які як вихідні речовини також застосовують здійсненні способу (б) згідно з винаходом для одержання сполук загальної формули (I), загалом характеризуються формулою (IV). У загальній формулі (IV) R^3 та R^4 переважно або особливо переважно мають такі значення, які були вказані вище у зв'язку з описом сполук загальної формули (I) та визначені як переважні або особливо переважні для R^3 та R^4 .

Вихідні речовини загальної формули (IV) є відомими та/або можуть бути одержані відомими способами (див. також вказівки в WO 01/05788). Z'

у формулі (IV) означає переважно хлор, бром, метокси, етокси, фенокси або бензилокси.

Як розріджувачі при здійсненні способів (а) і (б) згідно з винаходом та способом одержання проміжних продуктів формули (III) передусім використовують інертні органічні розчинники. До них належать зокрема аліфатичні, аlicиклічні або ароматичні, в разі потреби, галогеновані вуглеводні, такі як, наприклад, бензин, бензол, толуол, ксилол, хлорбензол, дихлорбензол, петролейний етер, гексан, циклогексан, дихлорметан, хлороформ, тетрахлорвуглець; етери, такі як діетиловий етер, діізопропіловий етер, діоксан, тетрагідрофуран або диметиловий або діетиловий етер етиленгліколю; кетони, такі як ацетон, бутанон або метилізобутиловий кетон; нітрили, такі як ацетонітрил, пропіонітрил або бензонітрил; аміди, такі як N,N-диметилформамід, N,N-диметилацетамід, N-метилформанілід, N-метилпіролідон або триамід гексаметилфосфорної кислоти; естери, такі як метиловий або етиловий естер оцтової кислоти, а також сульфоксиди, такі як диметилсульфоксид.

Способи (а) та (б) згідно з винаходом, а також спосіб одержання проміжних сполук формули (III) переважно здійснюють в присутності придатного засобу, що допомагає здійсненню реакції. Як такі засоби застосовують всі звичайні неорганічні або органічні основи. До них належать, наприклад, гідриди, гідроксиди, аміди, алкоголяти, ацетати, карбонати або гідрокарбонати лужних або лужноземельних металів, так як, наприклад, гідрид натрію, амід натрію, метилат натрію, етилат натрію, трет.-бутилат калію, гідроксид натрію, гідроксид кальцію, гідроксид амонію, ацетат натрію, ацетат калію, ацетат кальцію, ацетат амонію, карбонат натрію, карбонат калію, гідрокарбонат калію, гідрокарбонат натрію або карбонат амонію, а також третинні аміни, такі як триметиламін, триетиламін, трибутиламін, N,N-диметиламінопіридин, N-метилпіперидин, N,N-диметиламінопіридин, діазабіциклооктан (DABCO), діазабіциклононен (DBN) або діазабіциклоундецен (DBU).

Температуру реакції при здійсненні способу (а) згідно з винаходом можна варіювати у широкому діапазоні. Загалом працюють при температурі від -20°C до +150°C, переважно від -10°C до +120°C.

Температуру реакції при здійсненні способу (б) згідно з винаходом можна варіювати у широкому діапазоні. Загалом працюють при температурі від -20°C до +150°C, переважно від 0°C до +100°C.

Температуру реакції при здійсненні способу згідно з винаходом для одержання проміжних сполук формули (III) можна варіювати у широкому діапазоні. Загалом працюють при температурі від 0°C до +150°C, переважно від +10°C до +80°C.

Способи (а) та (б) згідно з винаходом, а також спосіб для одержання проміжних сполук формули (III) загалом здійснюють при нормальному тиску. Однак можливо також способи згідно з винаходом здійснювати при підвищеному або пониженому тиску - загалом від 0,1 бар до 10 бар.

Для здійснення способів (а) та (б) згідно з винаходом, а також способу для одержання проміжних сполук формули (III) вихідні речовини загалом застосовують у приблизно еквімолярних кількостях.

Однак можливо один із компонентів застосовувати у надлишку. Взаємодію здійснюють загалом у придатному розчиннику в присутності засобу, що допомагає здійсненню реакції, при цьому реакційну суміш протягом кількох годин перемішують при необхідній температурі. Обробку здійснюють звичайними методами (див. приклади одержання).

Зі сполук загальної формули (I) згідно з винаходом, в разі потреби, можуть бути одержані солі. Такі солі одержують звичайними методами солеутворення, наприклад, розчиненням або диспергуванням сполуки формули (I) у придатному розчиннику, такому як, наприклад, метиленхлорид, ацетон, трет.-бутилметиловий етер або толуол, та додаванням придатної основи. Потім солі - в разі потреби, після тривалого перемішування - виділяють шляхом концентрування або відсмоктування.

Активні речовини згідно з винаходом можуть бути застосовані як дефоліанти, десиканти, агенти придушення росту трав та зокрема як агенти для знищення бур'янів. Під бур'янами в широкому смислі розуміють усі рослини, що виростають у тих місцях, де вони є небажаними. Тотальна або селективна гербіцидна дія речовин згідно з винаходом звичайно залежить від їх витратної кількості.

Активні речовини згідно з винаходом можуть бути застосовані, наприклад, для таких рослин:

Дводольні бур'яни родів: *Abutilon*, *Amaranthus*, *Ambrosia*, *Anoda*, *Anthemis*, *Aphanes*, *Atriplex*, *Beilis*, *Bidehs*, *Capsella*, *Carduus*, *Cassia*, *Centaurea*, *Chenopodium*, *Cirsium*, *Convolvulus*, *Datura*, *Desmodium*, *Emex*, *Erysimum*, *Euphorbia*, *Galeopsis*, *Galinsoga*, *Galium*, *Hibiscus*, *Ipomoea*, *Kochia*, *Lamium*, *Lepidium*, *Lindemia*, *Matricaria*, *Mentha*, *Mercurialis*, *Mullugo*, *Myosotis*, *Papaver*, *Pharbitis*, *Plantago*, *Polygonum*, *Portulaca*, *Ranunculus*, *Raphanus*, *Rorippa*, *Rotala*, *Rumex*, *Salsola*, *Senecio*, *Sesbania*, *Sida*, *Sinapis*, *Solanum*, *Sonchus*, *Sphenoclea*, *Stellaria*, *Taraxacum*, *Thlaspi*, *Trifolium*, *Urtica*, *Veronica*, *Viola*, *Xanthium*.

Дводольні культурні рослини родів: *Arachis*, *Beta*, *Brassica*, *Cucumis*, *Cucurbita*, *Helianthus*, *Daucus*, *Glycine*, *Gossypium*, *Ipomoea*, *Lactuca*, *Linum*, *Lycopersicon*, *Nicotiana*, *Phaseolus*, *Pisum*, *Solanum*, *Vicia*.

Однодольні бур'яни родів: *Aegilops*, *Agropyron*, *Agrostis*, *Alopecurus*, *Apera*, *Avena*, *Brachiaria*, *6poMus*, *Cenchrus*, *Commelina*, *Cynodon*, *Cyperus*, *Dactyloctenium*, *Digitaria*, *Echinochloa*, *Eleocharis*, *Eleusine*, *Eragrostis*, *Eriochloa*, *Festuca*, *Fimbristylis*, *Heteranthera*, *Imperata*, *Ischaemum*, *Leptochloa*, *Lolium*, *Monochoria*, *Panicum*, *Paspalum*, *Phalaris*, *Phleum*, *Poa*, *Rottboellia*, *Sagittaha*, *Scirpus*, *Setaria*, *Sorghum*.

Однодольні культурні рослини родів: *Аліїт*, *Ananas*, *Asparagus*, *Avena*, *Hordeum*, *Oryza*, *Panicum*, *Saccharum*, *Seeale*, *Sorghum*, *Triticale*, *Triticum*, *Zea*.

Застосування активних речовин згідно з винаходом в жодному разі не обмежується зазначеними видами, а так само поширюється на інші рослини.

Активні речовини згідно з винаходом залежно від концентрації є придатними для повного знищення бур'янів, наприклад, на промисловому

устаткуванні та рейкових шляхах, на дорогах та площах з ростом або без росту дерев. Також можливе застосування запропонованих згідно з винаходом активних речовин для боротьби з бур'янами в багаторічних культурах, наприклад, при посадці деревних, декоративних, плодкових, винних, цитрусових, горіхових, бананових, кавових, чайних, каучукових, оліє-пальмових культур, какао, фруктово-ягідних та хмелевих культур, на декоративних газонах та спортивних майданчиках, на пасовищах, а також для селективної боротьби з бур'янами в однолітніх культурах.

Сполуки згідно з винаходом проявляють високу гербіцидну активність та широкий спектр дії при обробці ґрунту та зелених частин рослин над поверхнею землі. У певному обсязі вони також є придатними для селективної боротьби з однодольними та дводольними бур'янами в однодольних та дводольних культурах, а також при обробці рослин як до, так і після сходження.

Активні речовини згідно з винаходом у визначеній концентрації або нормі витрати також можуть бути використані для боротьби з тваринними шкідниками та грибковими або бактеріальними захворюваннями рослин. Вони, в разі потреби, також можуть бути використані як проміжні або первинні продукти для синтезу інших активних речовин.

Згідно з винаходом можуть бути оброблені всі рослини або частини рослин. Під рослинами при цьому розуміють всі рослини та популяції рослин, як бажані і небажані дикоростучі рослини або культурні рослини (включаючи культурні рослини природного походження). Культурними рослинами можуть бути рослини, які можна одержати звичайними методами культивування та оптимізації або біотехнологічними методами та методами генної інженерії або комбінацією цих методів, включаючи трансгенні рослини та сорти рослин, що захищаються або не захищаються законом про охорону нових сортів рослин. Під частинами рослин слід розуміти всі надземні та підземні частини та органи рослин, такі як парость, лист, квітка та корінь, причому слід назвати, наприклад, листи, голки, стебла, стовбури, квіти, плодові тіла, плоди та насіння, а також корені, бульби та ризоми. До частин рослин належить також зібраний врожай та вегетативний і генеративний матеріал для розмноження, наприклад, черешки, бульби, ризоми, відводки та насіння.

Згідно з винаходом обробку рослин та частин рослин активними речовинами здійснюють безпосередньо або шляхом впливу на їх оточення, середовище їх росту або закрите сховище відповідно до звичайних методів обробки, наприклад, шляхом занурення, обприскування, випару, створення штучного туману, розкидання, намазування, а у випадку матеріалу для розмноження, особливо у випадку насіння, шляхом нанесення одношарового або багатшарового покриття.

Активні речовини можуть бути перетворені у звичайні препаративні форми, такі як розчини, емульсії, порошки для розбризкування, суспензії, порошки, засоби для запилення, пасту, розчинні порошки, грануляти, концентрати емульсій та су-

спензій, природні та синтетичні речовини, просочені активною речовиною, а також мікрокапсульовані в полімерні речовини.

Ці препаративні форми одержують відомим способом, наприклад, змішуванням активних речовин з розріджувачами, наприклад, рідкими розчинниками та/або твердими носіями, в разі потреби, з використанням поверхнево-активних речовин, наприклад, емульгаторів та/або диспергаторів та/або піноутворювальних засобів.

У випадку використання води як розріджувача можуть, наприклад, бути застосовані і органічні розчинники як допоміжні засоби, що сприяють розчиненню. Як рідкі розчинники в основному мають на увазі: ароматичні сполуки, такі як ксилол, толуол або алкілнафталіни, хлоровані ароматичні сполуки та хлоровані аліфатичні вуглеводні, такі як хлорбензоли, хлоретилен або метиленхлорид, аліфатичні вуглеводні, такі як циклогексан або парафіни, наприклад, фракції нафти, мінеральні масла та рослинні олії, спирти, такі як бутанол або гліколь, а також їх етери та естери, кетони, такі як ацетон, метилетилкетон, метилізобутилкетон або циклогексанон, сильнополярні розчинники, такі як диметилформамід та диметилсульфоксид, а також воду.

Як тверді носії мають на увазі: наприклад, солі амонію та помели природних каменів, таких як каоліни, глиноземи, тальк, крейда, кварц, атапульгіт, монтморилоніт або діатомова земля, та помели синтетичних каменів, такі як вискодисперсна кремнієва кислота, оксид алюмінію та силікати, як тверді носії для гранулятів мають на увазі: подрібнені та фракціоновані природні кам'яні породи, такі як кальцит, мармур, пемза, сепіоліт, доломіт, а також синтетичні грануляти із неорганічного та органічного борошна, а також грануляти із органічного матеріалу, такого як тирса, шкарлупа кокосових горіхів, кукурудзяні качани та стебла тютюну; як емульгатори та/або піноутворюючі засоби мають на увазі: наприклад, неіоногенні та аніонні емульгатори, такі як поліоксиетиленовий естер жирної кислоти, поліоксиетиленовий етер жирного спирту, наприклад, алкіларилполігліколевий етер, алкілсульфонати, алкілсульфати, арилсульфонати, а також гідролізати білку; як диспергуючі засоби мають на увазі: наприклад, відпрацьовані лігнінсульфітні луи та метилцелюлозу.

У препаративних формах можуть бути застосовані речовини, що покращують адгезію, такі як карбоксиметилцелюлоза, природні та синтетичні порошкоподібні, зернисті або латексоподібні полімери, такі як гуміарабік, полівініловий спирт, полівінілацетат, а також природні фосфоліпіди, такі як кефаліни та лецитини, та синтетичні фосфоліпіди. іншими добавками можуть бути мінеральні масла та рослинні олії.

Крім того можуть бути застосовані барвники, такі як неорганічні пігменти, наприклад, оксид заліза, оксид титану, фероціан синій, та органічні барвники, такі як алізарин-, азо- та металфталоціанінові барвники та слідові кількості живильних мікроелементів, такі як солі заліза, марганцю, бору, міді, кобальту, молібдену та цинку.

Препаративні форми містять, як правило, від 0,1 до 95 ваг. % активної речовини, переважно від 0,5 до 90 ваг. %.

Активні речовини згідно з винаходом для боротьби з бур'янами можуть бути застосовані як такі або у своїй препаративній формі змішані з іншими агрохімічними активними речовинами, такими як, наприклад, відомі гербіциди, та/або з речовинами, які покращують сумісність з культурними рослинами (сафенери), причому можливими є готові композиції або суміші у резервуарах. Крім того можливими є також суміші з агентами для боротьби з бур'янами, які містять один або кілька гербіцидів та один сафенер.

Для змішування застосовують відомі гербіциди, такі як, наприклад, ацетохлор; ацифторфен(-натрій); аклоніфен; алахлор; алоксидим(-натрій); аметрин; амікарбазон; амідохлор; амідосульфурон; анілофос; асулам; атразин; азафенідин; азімсульфурон; бефлубутамід; беназолін(-етил), бенфурезат; бенсульфурон(-метил); бентазон; бензфендизон; бензобіциклон; бензофенап; бензоілпроп(-етил); біалафос; біфенокс; біспірибак(-натрій); бромобутид; бромофеноксим; бромоксиніл; бутахлор; бутафенацил(-аліл); бутроксидим; бутилат; кафенстрол; калоксидим; карбетамід; карфентразон(-етил); хлometоксифен; хлорамбен; хлорідазон; хлорімурон(-етил); хлорнітрофен; хлорсульфурон; хлортолурон; цинідон(-етил); цинметилін; циносульфурон; клефоксидим; клетодим; клодинафоп(-пропаргіл); кломазон; кломепрон; клопіралід; клопірасульфурон(-метил); клорансулам(-метил); куміурон; ціаназин; цибуترین; циклоат; циклосульфамурон; циклоксидим; цигалофоп(-бутил); 2,4-D; 2,4-DB; десмедифам; діалат; дикамба; дихлорпроп(-P); диклофоп(-метил); диклосулам; діетатил(-етил); дифензокват; дифлуфенікан; дифлуфензопір; димефурон; димепіперат; диметахлор; диметаметрин; диметенамід; димексифлам; динітрамін; дифенамід; дикват; дитіопір; діурон; димрон; епроподан; EPTC; еспрокарб; еталфлуралін; етаметсульфурон(-метил); етофумезат; етоксифен; етоксисульфурон; етобензанід; феноксапроп(-P-етил); фентразамід; флампроп(-ізопропіл, -ізопропіл-L, -метил); флазасульфурон; флорасулам; флазифоп(-P-бутил); флазолат; флукарбазон(-натрій); флуфенацет; флуфенпір; флуметсулам; флуміклорак(-пентил); флуміоксазин; флуміпролін; флуметсулам; флуометурон; фторохлоридон; фтороглікофен(-етил); флупоксам; флупропацил; флупирсульфурон(-метил або -натрій); флуренол(-бутил); флуридон; флуороксипір(-бутоксипропіл, -метил); флурпримідол; флуртамон; флутіацет(-метил); флутіамід; фомезафен; форамсульфурон; глюфосинат(-амоній); гліфосат(-ізопропіламоній); галосафен; галоксифоп(-етоксиетил, -P-метил); гексазинон; імазаметабенз(-метил); імазаметатіп; імазамокс; імазапік; імазапір; імазаквін; імазетатіп; імазосульфурон; іодосульфурон(-метил, -натрій); іоксиніл; ізопропалін; ізопротурон; ізоурон; ізоксабен; ізоксахлортол; ізоксафлутол; ізоксапірифоп; кетоспірадокс; лактофен; ленацил; лінурон; MCPA; мекопроп; мефенацет; мезотріон; метамітрон; метазахлор; метабензтіазурон; метобензурон; метобромурон;

(альфа-)метолахлор; метосулам; метоксурон; метрибузин; метсульфурон(-метил); молінат; монолінурон; напроанілід; напропамід; небурон; нікосульфурон; норфлуразон; орбенкарб; оризалін; оксадіаргіл; оксадіазон; оксасульфурон; оксазикломефон; оксифторфен; паракват; пеларгонова кислота; пендиметалін; пендралін; пеносулам; пентоксазон; петоксамід; фенмедифам; піколінафен; піперофос; претилахлор; примісульфурон(-метил); профлуазол; профоксидим; прометрин; пропахлор; пропаніл; пропаквізафоп; пропізохлор; пропоксикарбазон(-натрій); пропізамід; просульфокарб; просульфурон; пірафлуфен(-етил); піразогіл; піразолат; піразосульфурон(-етил); піразоксифен; пірибензоксим; пірибутикарб; піридат; піридатол; пірифталід; піримідобак(-метил); піритіобак(-натрій); квінклорак; квінмерак; квіннокламін; квінофоп(-P-етил, -P-тефурил); римсульфурон; сетоксидим; симазин; симетрин; сулькотріон; сульфентразон; сульфометурон(-метил); сульфозат; сульфосульфурон; тебутам; тебутіурон; тепралоксидим; тербутилазин; тербутрин; тенілхлор; тіафлуамід; тіазопір; тідіазімін; тифенсульфурон(-метил); тіобенкарб; тіокарбацил; тралкоксидим; триалат; триасульфурон; трибенурон(-метил); триклопір; тридифан; трифлуралін; трифлуксисульфурон; трифлусульфурон(-метил); тритосульфурон.

Для змішування використовують також відомі сафенери, такі як, наприклад, AD-67, BAS-145138, беноксакор, клоквінтоцет(-мексил), ціометриніл, 2,4-D, DKA-24, дихлормід, димрон, фенклорим, фенхлоразол(-етил), флуразол, флуксофенім, фурилазол, ізоксацифен(-етил), MCPA, мекопроп(-P), мефенпір(-діетил), MG-191, оксабетриніл, PPG-1292, R-29148.

Можливою є також суміш з іншими відомими активними речовинами, такими як фунгіциди, інсектициди, акарициди, нематодици, речовини для захисту від птахів, речовини для підживлення рослин та засоби для поліпшення структури ґрунту.

Активні речовини можуть бути застосовані як такі, у вигляді звичайних препаративних форм або у вигляді одержаних шляхом подальшого розділення готових до застосування форм, таких як розчини, суспензії, емульсії, порошки, пасти та грануляти. Застосування відбувається звичайними способами, наприклад, шляхом поливання, обприскування, мілкокрапельного обприскування, розкидання.

Активні речовини згідно з винаходом можуть бути нанесені як до, так і після сходження рослин. Вони також можуть бути нанесені на ґрунт перед посівом.

Витратна кількість активних речовин може коливатися у широкому діапазоні. Вона в основному залежить від виду бажаного ефекту. Загалом витратна кількість становить від 1 г до 10 кг активної речовини на гектар поверхні ґрунту, переважно від 5 г до 5 кг на га.

Як уже було зазначено вище, згідно з винаходом можна обробляти всі рослини та їх частини. У переважному варіанті здійснення обробляють види та сорти рослин, а також їх частини, вирощені або одержані за умов біологічного розведення,

таких як схрещування або злиття протопластів. В іншому переважному варіанті здійснення обробляють трансгенні рослини та сорти рослин, одержані методами генної інженерії, в разі потреби, у комбінації зі звичайними методами (генетично модифіковані організми) та їх частини. Поняття «частини» або «частини рослин» або «органи рослин» було пояснене вище.

Особливо переважно згідно з винаходом обробляють рослини відповідних комерційно доступних або зазвичай використовуваних сортів. Під сортами рослин розуміють рослини з визначеними властивостями (ознаками), які одержують умовним розведенням, мутагенезом або рекомбінантними методиками ДНК. Це можуть бути сорти, біотипи та генотипи.

Залежно від виду або сорту рослин, їх місцезнаходження та умов росту (ґрунт, клімат, період вегетації, харчування) в результаті обробки згідно з винаходом можуть спостерігатися нададитивні («синергічні») ефекти. Так, наприклад, можливе зниження кількості застосовуваних речовин та/або розширення спектру дії та/або посилення дії речовин та засобів, застосовуваних згідно з винаходом, також у комбінації з іншими агрохімічними активними речовинами, покращення росту культурних рослин, підвищення толерантності культурних рослин по відношенню до високих або низьких температур, підвищення толерантності до браку вологи або вмісту солей у воді або ґрунті, підвищення продуктивності при цвітінні, полегшення збору врожаю, прискорення дозрівання, більш високий врожай, більш висока якість та/або більш висока поживність продуктів врожаю, краще збереження та/або краща перероблюваність продуктів врожаю, що виходять за межі власне очікуваних ефектів.

До переважних трансгенних (одержаних з використанням генних технологій) рослин або сортів рослин згідно з винаходом належать всі рослини, які містять генетичний матеріал, модифікований за генною технологією, що додає цим рослинам особливо вигідні цінні властивості. Прикладами таких властивостей є покращений ріст рослин, підвищена толерантність по відношенню до високих або низьких температур, підвищена толерантність до браку вологи або до вмісту солей у воді або у ґрунті, підвищена продуктивність при цвітінні, полегшення збору врожаю, прискорення дозрівання, більш високий врожай, більш висока якість та/або більш висока поживність продуктів врожаю, більша тривалість збереження та/або краща здатність до переробки продуктів врожаю. До інших та особливо переважних прикладів таких властивостей належать підвищена стійкість рослин до тваринних шкідників та до мікроорганізмів, таких як комахи, кліщі, патогенні для рослин грибки, бактерії та/або віруси, а також підвищена толерантність рослин до певних гербіцидних активних речовин. Як приклади трансгенних рослин слід згадати важливі культурні рослини, такі як зернові (пшениця, рис), кукурудза, соя, картопля, бавовна, рапс, а також фруктові рослини (з плодами яблук, груш, цитрусових та винограду), причому особливу перевагу надають кукурудзі, сої, картоплі, бавовні та рапсу. До особливо переважних властивостей належать

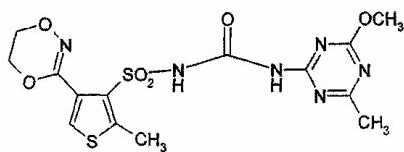
підвищена стійкість рослин до комах у зв'язку з токсинами, що утворюються в рослинах, особливо такими, які створюються за допомогою генетичного матеріалу з *Bacillus Thuringiensis* (наприклад, за допомогою генів CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb та CryIF, а також їх комбінацій) у рослинах (надалі "Бт. рослини"). До особливо переважних властивостей належать також підвищена стійкість рослин по відношенню до грибів, бактерій та вірусів завдяки набутій системній стійкості (SAR), системіну, фітоалексину, еліциторам, а також генам резистентності та відповідно експериментованим протеїнам та токсинам. Крім того до особливо переважних властивостей належать також підвищена толерантність рослин по відношенню до певних гербіцидно активних речовин, наприклад, імідазолінів, сульфонілкарбамідів, гліфозатів або фосфінотрицину (наприклад, "PAT"-ген). Гени, що забезпечують бажані властивості, можуть зустрічатися в трансгенних рослинах в комбінаціях між собою. Прикладами "Бт. рослин" є сорти кукурудзи, бавовни, сої та картоплі, наявні у продажу під торговельними марками YIELD GARD® (наприклад, кукурудза, бавовна, соя), KnockOut® (наприклад, кукурудза), StarLink® (наприклад, кукурудза), Bollgard® (бавовна), Nucotn® (бавовна) та NewLeaf® (картопля). Прикладами толерантних до гербіцидів рослин є сорти кукурудзи, бавовни та сої, наявні у продажу під торговельними марками Roundup Ready® (толерантність по відношенню до гліфозату, наприклад, кукурудза, бавовна, соя), Liberty Link® (толерантність по відношенню до фосфінотрицину, наприклад, рапс), IMI® (толерантність по відношенню до імідазолінонів) та STS® (толерантність по відношенню до сульфонілкарбамідів, наприклад, кукурудза). І стійкі до гербіцидів сорти рослин (звичайно вирощені в умовах толерантності по відношенню до гербіцидів) наявні у продажу під назвою Clearfield® (наприклад, кукурудза). Зрозуміло, що ці висловлення справедливі і для сортів рослин, що будуть створені в майбутньому або які в майбутньому потраплять на ринок, з цими або в майбутньому створеними генетичними властивостями.

Згадані вище рослини особливо переважно можуть бути оброблені сполуками або сумішами активних речовин згідно з винаходом, причому додатково до високої здатності до боротьби з бур'янами у випадку трансгенних рослин або сортів рослин спостерігаються зазначені вище синергічні ефекти. Зазначені у випадку активних речовин або сумішей області переважних значень стосуються також обробки цих рослин. Найбільшу перевагу надають обробці рослин окремо зазначеними в даному тексті сполуками або сумішами.

Наведені нижче приклади демонструють одержання та застосування активних речовин згідно з винаходом.

Приклади одержання:

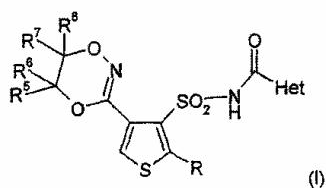
Приклад 1



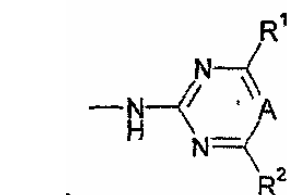
До розчину 0,41 г (1,59 ммоль) 2-феноксикарбоніламіно-4-метокси-6-метил-1,3,5-триазину в 40 мл ацетонітрилу при кімнатній температурі (прибл. 20 °С) послідовно додають 0,50 г (1,91 ммоль) 4-(5,6-дигідро-[1,4,2]-діоксазин-3-іл)-2-метилтієніл-3-сульфонамід та 0,29 г DBU (1,91 ммоль). Через 12 годин перемішування при кімнатній температурі розчинник видаляють у вакуумі водоструминного насоса, додають 100 мл метиленхлориду, промивають 2N соляною кислотою та водою, сушать над сульфатом натрію, а розчинник, який додавали, виділяють у вакуумі водоструминного насоса. Залишок перекристалізують з ізопропанолу, відфільтровують та сушать.

Одержують 0,40 г (59 % від теор.) M-(4-метокси-6-метил-1,3,5-триазин-2-іл)-N'-(4-(5,6-дигідро-[1,4,2]-діоксазин-3-іл)-2-метилтієніл-3-ілсульфоніл)карбаміду, температура плавлення якого становить 200 °С.

Аналогічно прикладу 1, а також відповідно до загального опису способу одержання згідно з винаходом можуть бути одержані, наприклад, також наведені в таблиці 1 сполуки загальної формули (I).



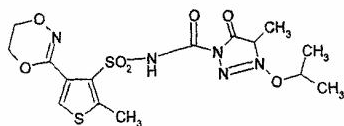
Таблиця 1: Приклади сполук формули (I)



Het =

Прикл. №	A	R ¹	R ²	R	R ⁵ , R ⁶ , R ⁷ , R ⁸	Температура плавлення (°C)
2	CH	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	H	211
3	CH	OCH ₃	Cl	CH ₃	H	97
4	N	OCH ₃	OCH ₃	CH ₃	H	199

Приклад 5

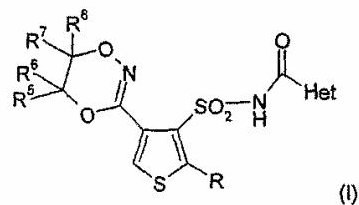


До розчину 0,44 г (1,59 ммоль) 5-ізопропілокси-4-метил-2-феноксикарбоніл-2,4-дигідро-3Н-1,2,4-триазол-3-ону в 40 мл ацетонітрилу при кімнатній температурі (прибл. 20 °С) по-

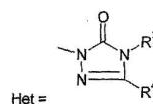
слідовно додають 0,50 г (1,91 ммоль) 4-(5,6-дигідро-[1,4,2]-діоксазин-3-іл)-2-метилтієніл-3-сульфонамід та 0,29 г DBU (1,91 ммоль). Через 12 годин перемішування при кімнатній температурі розчинник видаляють у вакуумі водоструминного насоса, додають 100 мл метиленхлориду, промивають 2N соляною кислотою та водою, сушать над сульфатом натрію, а розчинник, який додавали, виділяють у вакуумі водоструминного насоса. Залишок перекристалізують з ізопропанолу, відфільтровують та сушать.

Одержують 0,5 г (71 % від теор.) 5-ізопропілокси-4-метил-2-[[4-(5,6-дигідро-[1,4,2]-діоксазин-3-іл)-2-метилтієніл-3-іл]сульфоніламінокарбоніл]-2,4-дигідро-3Н-1,2,4-триазол-3-ону, температура плавлення якого становить 199 °С.

Аналогічно прикладу 5, а також відповідно до загального опису способу одержання згідно з винаходом можуть бути одержані, наприклад, також наведені в таблиці 1 (продовження) сполуки загальної формули (I).

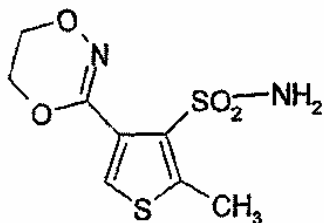


Таблиця 1 (продовження): Приклади сполук формули (I)



Прикл. №	R ³	R ⁴	R	R ⁵ , R ⁶ , R ⁷ , R ⁸	Температура плавлення (°C)
6	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	H	157
7	CH ₃	OCH ₂ CH ₃	CH ₃	H	185
8	CH ₃	O-(n-propyl)	CH ₃	H	177
9		OCH ₃	CH ₃	H	204
10		OCH ₂ CH ₃	CH ₃	H	202
11		O-(n-propyl)	CH ₃	H	190
12		O-(i-propyl)	CH ₃	H	200

Вихідні речовини формули (III):
Приклад (III-1)



27,8 г (0,4 моль) гідрохлориду гідроксиламіну суспендують в 400 мл метанолу та при кімнатній температурі (прибл. 20 °С) додають розчин 44,8 г (0,8 моль) гідроксиду калію в 400 мл метанолу. При кімнатній температурі порціями додають 47 г (0,7 моль) метилового естеру 2-метил-3-сульфамойлтієніл-4-карбонової кислоти та протягом 12 годин перемішують при 40 °С. Після охолодження до кімнатної температури по краплях додають 27,6 г (0,2 моль) карбонату калію та 185,8 г (0,92 моль) 1,2-диброметану. Потім суміш перемішують протягом наступних 12 годин при 60° С. Після охолодження до кімнатної температури розчинник видаляють у вакуумі водоструминного насосу, а залишок вилужнюють 400 мл метиленхлориду та 200 мл 25%-ного розчину дигідрофосфату

натрію. Осад, що утворився, відфільтровують та сушать.

Одержують 11,8 г (23 % від теор.) 4-(5,6-дигідро-[1,4,2]-діоксазин-3-іл)-2-метил-тієніл-3-сульфонаміду, температура плавлення якого становить 48 °С.

Приклади виконання

Приклад А

Дослідження після сходження

Насіння одно- або дводольних бур'янів або культурних рослин висівають у дерев'яні горщики, заповнені піщаним суглинком, покривають землею та поміщають у теплицю за сприятливих для вегетації умов. Через 2-3 тижні після висівання піддослідні рослини обробляють на стадії 1 листка. Досліджувану сполуку у вигляді змочуваного порошку (WP) у різних дозування при витратній кількості води 800л/га при додаванні 0,2 % зв'язувального агенту розбризкують на частини рослин. Через приблизно 3 тижні знаходження рослин в теплиці в оптимальних для росту умовах візуально оцінюють дію препаратів у порівнянні із необробленими контрольними групами (гербіцидна дія в %: 100 % дії = рослини відмирають, 0 % дії = ніякого ефекту, як в контрольній групі). У цьому дослідженні сполуки з прикладів одержання 1, 3, 6, 7 та 9 проявляють дуже високу активність проти бур'янів.

Таблиця А1: Дослідження після сходження/теплиця

Активна речовина з прикладу одержання №	Витратна кількість (г а.п./га)	<i>Amaranthus</i>	<i>Lolium</i>	<i>Setaria</i>	<i>Sinapis</i>	<i>Stellaria</i>	<i>Cyperus</i>	<i>Echinochloa</i>
(1)	80	90	90	90	90	90	100	90
(3)	80	90	90	80	90	90	100	90
(6)	80	90	90	80	80	90	80	80
(7)	80	90	90	90	80	90	90	90
(9)	80	100	90	90	80	90	70	90