



УКРАЇНА

(19) UA (11) 21892 (13) C1

(51) 6 A 01 N 43/54

ДЕРЖАВНЕ  
ПАТЕНТНЕ  
ВІДОМСТВООПИС ДО ПАТЕНТУ  
НА ВІНАХІД

(54) СПОСІБ БОРОТЬБИ З БУР'ЯНАМИ

(20) 93005935, 30 07 93

(21) 4356788/SU

(22) 03.11 88

(24) 30 04 98

(31) 278894

(32) 04 11.87

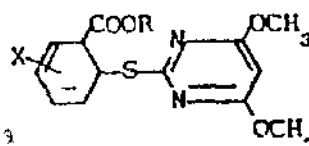
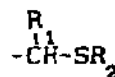
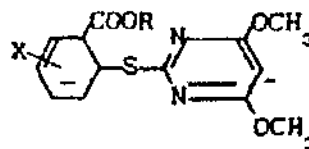
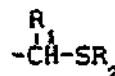
(33) JP

(46) 30 04 98 Бюл. № 2

(56) Патент EP № 1187, кл. A 01 N 9/22, 1979

(72) Йосіхіро Сaito (JP), Содзі Кусано (JP),  
Сатору Такахасі (JP), Ікуо Кадзівара (JP), Но-  
бухіде Вада (JP), Такесіче Міязава (JP), Ясу-  
хумі Тойокава (JP)(73) Куміай кемікал індастрі компані КО,  
Лтд (JP), Іхара кемікал індастрі КО, Лтд.  
(JP)(57) Способ борьбы с сорняками путем обра-  
ботки участка, подлежащего защите от сор-  
няков, производным пиримидина, о т л и ч а ю щ и й с я тем, что в качестве производного

пиримидина используют соединение общей формулы

где R – водород, низший алкил, C<sub>1</sub>–C<sub>2</sub>-алкокси-  
метил, бензилоксиметил, этоксикарбонилэтил,  
цианометил или группагде R<sub>1</sub> – водород, метил;R<sub>2</sub> – метил, незамещенный или заме-  
щенный нитрогруппой фенил;X – галоген, метил, метилфенокси,  
или его соль в количестве 0,16–10 г/ар.Изобретение относится к химическим  
способам защиты растений.Известно использование замещенных  
пиримидинов, например 2-/4,6-диметок-  
сипиримидин-2-ил/тио/бензойной кислоты  
в способе борьбы с сорняками [1].Однако известный способ обладает не-  
достаточным гербицидным действием.Задачей изобретения является усиле-  
ние гербицидного действия.Указанная задача достигается путем об-  
работки участка, подлежащего защите от  
сорняков, производным пиримидина фор-  
мулыгде R – водород, низший алкил, C<sub>1</sub>–C<sub>2</sub>-алкокси-  
симетил, бензилоксиметил, этоксикарбони-  
лэтил, цианометил или группагде R<sub>1</sub> – водород, метил;

(19) UA (11) 21892 (13) C1

R<sub>2</sub> — метил, незамещенный или замещенный нитрогруппой фенил;

X — галоген, метил, метилфенокси, или его соль в количестве 0,16–10 г/ар.

В способе использованы соединения, 5  
указанные в табл. 1.

Соединения из табл. 1 получают с помощью следующего процесса, которым, в частности, можно получить соединение 2.

Получение 2-[(4,6-диметоксипиримидин-2-ил)тио]-6-метилбензойной кислоты (соединение 2).

5,0 г гидрохлорида 2-амино-6-метилбензойной кислоты превращают в соль диазония с помощью концентрированной соляной кислоты и 2,3 г нитрита натрия. Затем постепенно по каплям соль диазония добавляют в предварительно приготовленный раствор дисульфида натрия (который получен из 8,7 г нонагидрата сульфида натрия 1,1 г серы, 1,5 г гидроксида натрия и 15 мл воды) при 0–5°C. После завершения добавления по каплям смесь перемешивают при комнатной температуре в течение 2 ч для окончания реакции. Реакционный раствор выливают в большое количество воды и добавляют концентрированную соляную кислоту. Затем смесь экстрагируют с помощью этилацетата. Водный раствор водородкарбоната натрия добавляют в слой этилацетата и растворимые компоненты водородкарбоната натрия экстрагируют, 5,8 г пиросульфата натрия добавляют в этот водный раствор и смесь отгоняют в течение 30 мин для завершения реакции. Концентрированную кислоту добавляют в реакционный раствор и затем смесь экстрагируют с помощью этилацетата. Экстракт просушивают и затем растворитель отгоняют при пониженном давлении для получения 3,6 г (выход 65%) 2-меркапто-6-метилбензойной кислоты.

После этого 3,6 г 2-меркапто-6-метилбензойной кислоты, 4,7 г 4,6-диметокси-2-метилсульфонилпиримидина и 3,5 г безводного карбоната калия растворяют в 20 мл диметилформамида, после чего смесь перемешивают при 110–120°C в течение 1 ч. Реакционный раствор выливают в большое количество воды и добавляют туда концентрированную соляную кислоту. Затем смесь экстрагируют хлороформом. Слой хлороформа промывают водой и просушивают, после чего растворитель отгоняют при пониженном давлении. Сырье кристаллы очищают с помощью хроматографии на колонках с использованием проявляющего растворителя/этилацетата и перекристаллизовывают из этилацетата для получения 0,8 г 2-[(4,6-диметоксипиримидин-2-ил)тио]-6-метилбензойной кислоты в

виде белого порошка. Температура плавления ~131–132°C.

Остальные соединения получают аналогичным образом.

Настоящее изобретение иллюстрируется следующими примерами.

Пример 1 (обработка почвы по появлению всходов сорняков на возвышенностях).

В горшочки, наполненные почвой (площадь поверхности — 600 см<sup>2</sup>), высевали семена хлопчатника (Co), проса куриного (Ec), гумая (So), горца перечного (Po), амаранта (Am), мари белой (Ch), выюнка пурпурного (Ip) и дурнишника обыкновенного (Ha), высаживали клубни *Cyperus rotundus* (Cr) и покрывали слоем почвы толщиной 0,5–1 см. Через день после посадки заданное количество смачивающего порошка, приготовленного по составу примера 1, разбавлялось водой и вносилось на поверхность почвы при номере расхода 100 л/10 акров. Оценка проводилась на 20 день после обработки. Результаты оценивались по стандарту, как показано в табл. 2 и приведены в табл. 3, 4.

Пример 2 (обработка листьев после всходов сорняков на возвышенности).

В горшочки, заполненные почвой (площадь поверхности 600 см<sup>2</sup>), высевали семена хлопчатника (Go), проса Куриного (Ec), гумая (So), горца перечного (Po), амаранта (Am), мари белой (Ch), выюнка пурпурного (Ip) и дурнишника обыкновенного (Ha), высаживали клубни *Cyperus rotundus* (Cr) и покрывали слоем почвы толщиной 0,5–1 см. Горшочки выдерживали в теплице при температуре 20–25°C в течение 2 недель, и затем заданное количество смачивающегося порошка разбавлялось водой и вносилось на листья при норме расхода 100 л/10 акров по активному веществу. Оценка проводилась на 14 день после обработки. Результаты приведены в табл. 5 и 6.

Пример 3 (обработка листьев на возвышенности).

В горшочки, заполненные почвой (площадь поверхности 100 см<sup>2</sup>), высевали просо куриное (Ec), росичку кровяную (Di), горец перечный (Po), амарант (Am), мари белую (Ch) и *Cyperus Iria* (Ci), покрывали слоем почвы толщиной 0,5–1 см. Горшочки помещали в теплицу при температуре 20–25°C на две недели и затем заданное количество смачивающегося порошка, приготовленного по примеру состава 1, разбавляли водой и вносили на листья при норме расхода 100 л/10 акров (норма расхода по д. в. — 100 г/10 акров). Оценка проводилась на 14 день после обработки гербицидов. Результаты приведены в табл. 7, 8.

**Пример 4** (обработка почвы на возвышенности).

В горшочки, заполненные почвой (площадь поверхности 100 см<sup>2</sup>), высевали просо куриное (Ec), росичку кровяную (Of), горец перечный (Po), амарант (Am), марь белую (Ch) и *Suregus Iria* (Cl) и покрывали слоем почвы толщиной 0,5–1 см. Через день после посадки заданное количество смачивающегося порошка, приготовленного по примеру состава 1, разбавляли водой и вносили на поверхность почвы при норме расхода 100 л/10 акров (норма расхода по д. в. 10 г/10 акров). Оценка проводилась на 20 день после обработки. Результаты приведены в табл. 9, 10.

**Пример 5** (борьба с сорняками на рисовом поле).

В горшочки, заполненные почвой рисового поля, высевали просо куриное (Ec), *Suregus Iria* (Cd), *Monocloria vaginalis* (Mo) и камыш (Sc) и добавляли воду до глубины 2 см. Через 2 дня после посадки заданное количество смачивающегося порошка, приготовленного по примеру состава 1, разбавляли водой и по каплям добавляли на поверхность воды при норме расхода 100 г д. в. /10 акров. Оценка проводилась на 21 день после обработки. Результаты приведены в табл. 11.

**Пример 6** (обработка почвы до появления сорняков на суходольном поле).

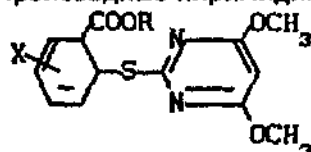
В горшок, заполненный почвой (площадь поверхности 600 см<sup>2</sup>), высевали семена хлопчатника (Go), гумая (So), горца перечного (Po), ширицы гибридной (Am) и мари белой (Ch) и покрывали их почвой толщиной от 0,5 до 1 см. Через один день после посева заранее определенное количество смачивающегося порошка, полученного в соответствии с примером состава 1, разбавляли водой и наносили на поверхность почвы при норме 100 л на 10 ар. Оценку производили на 20-й день после обработки. Результаты приведены в табл. 12.

**Пример 7** (опрыскивание листьев после появления сорняков на суходольном поле).

В горшок, заполненный почвой (площадь поверхности 600 см<sup>2</sup>) высевали семена хлопчатника (Go), гумая (So), горца перечного (Po), ширицы гибридной (Am) и мари белой (Ch) и покрывали их почвой толщиной от 0,5 до 1 см. Этот горшок помещали в теплицу с температурой от 20 до 25°C на 2 недели, после чего заранее определенное количество смачиваемого порошка, полученного в соответствии с примером состава 1, разбавляли водой и наносили на листья при норме 100 л на 10 ар. Оценку производили на 14-й день после обработки. Результаты приведены в табл. 13.

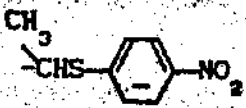
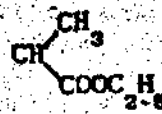
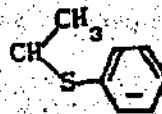
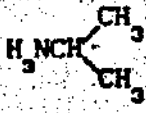
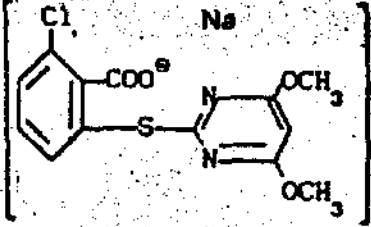
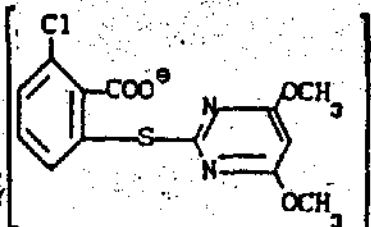
Таблица 1

Производные пиридина



Соединение	R	X	Температура плавления, °C, или показатель отражения
1	H	C-Cl	148–151
2	H	C-CH <sub>3</sub>	131–132
3	CH <sub>3</sub>	C-Cl	$n_D^{20}=1,5770$
4	CH <sub>3</sub>	C-CH <sub>3</sub>	$n_D^{20}=1,5775$
5	H	5-CH <sub>3</sub>	177–182
6	CH <sub>2</sub>	C-Cl	$n_D^{20}=1,6166$
7	CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	71–72
8	H	5-Cl	203–206
9	H	3-Cl	128–131
10	H	C-F	133–135
11	CH <sub>3</sub>	6-Cl	70–72

Продолжение табл. 1

Соединение	R	X	Температура плавления, °C, или показатель отражения
12	CH <sub>2</sub> OCH	6-Cl	70-72
13	CH <sub>2</sub> SCH	6-Cl	94-95
14	H	3-CH <sub>3</sub>	144-153
15		6-Cl	$n_D^{20}=1,6273$
16	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	6-Cl	70-72
17	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub>	6-Cl	$n_D^{20}=1,5590$
18	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub>	6-Cl	$n_D^{20}=1,5826$
19		6-Cl	$n_D^{20}=1,5483$
20		6-Cl	$n_D^{20}=1,6041$
21	CH <sub>2</sub> CN	6-Cl	97-105
22	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -I	6-Cl	68-70
23		6-Cl	149-151
24	HN(C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> CH) <sub>3</sub>	6-Cl	94-101
25	HN(C <sub>2</sub> H <sub>4</sub> CH) <sub>3</sub>	6-Cl	246-250
26		Fe <sup>3+</sup>	
27		Ca <sup>2+</sup>	172-175

Продолжение табл. 1

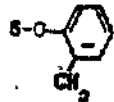
Соединение	R	X	Температура плавления, °С, или показатель отражения
28	H		124-127
29	NH <sub>4</sub>	6-Cl	150-154
30	H	6-Br	164-165
31	H	6-I	159-163

Таблица 2

## Шкала оценки биологического примера

Показатель	Гербицидное действие и фитотоксичность
0	Отсутствие гербицидного действия (или фитотоксичности)
1	Гербицидное действие (или фитотоксичность): более 0% и менее 30%
2	Гербицидное действие (или фитотоксичность): по меньшей мере 30% и менее 50%
3	Гербицидное действие (или фитотоксичность): по меньшей мере 50% и менее 70%
4	Гербицидное действие (или фитотоксичность): по меньшей мере 70% и менее 90%
5	Гербицидное действие (или фитотоксичность): более 90%

Таблица 3

## Эффективность заявленного способа

Соединение	Норма расхода по д.в., г д.в./10 акров	Фитотоксичность, Go	Гербицидное действие							
			Ec	So	Po	Am	Ch	Ip	Xa	Cr
1	100	0	5	5	5	5	5	5	5	5
	25	0	4	5	5	5	5	5	5	5
2	100	0	5	5	5	5	5	3	4	5
	25	0	3	5	5	5	5	0	3	4
Сравнительное	200	3	5	5	5	5	5	3	2	3
соединение 1	25	2	4	5	5	5	5	0	0	3

П р и м е ч а н и е. Ср. соединение: 1:2-[(4,6-диметоксиимидин-2-ил)окси]бензойная кислота.

Таблица 4

## Эффективность заявленного соединения

Соединение №	Норма расхода по д.в., г д.в./10 ак- ров	Фитоток- сич- ность, Go	Гербицидное действие							
			Ec	So	Po	Am	Ch	Ip	Xa	Cr
10	25	1	5	5	5	5	5	4	3	5
11	100	1	5	5	5	5	5	4	4	5
	25	0	5	5	5	5	5	3	2	5
12	100	0	5	5	5	5	5	5	5	5
	25	0	5	5	5	5	5	5	4	5
13	100	1	4	5	5	5	5	5	5	5
14	100	1	5	5	5	5	5	3	3	4
17	100	1	5	5	5	5	5	5	5	5
		0	5	5	5	5	5	5	5	5
18	100	1	5	5	5	5	5	5	5	5
	25	0	5	5	5	5	5	5	5	4
20	100	0	5	5	5	5	5	5	4	5
	25	0	5	5	5	5	5	4	2	3
23	25	1	5	5	5	5	5	5	5	5
24	25	1	5	5	5	5	5	5	4	5
6	100	0	5	5	5	5	5	5	5	5
	25	0	5	5	5	5	5	4	4	5
Сравнительное соединение 1	100	3	5	5	5	5	5	2	2	4
	25	3	4	4	5	5	5	0	0	2
30	100	1	5	5	5	5	5	5	5	5
	25	0	5	5	5	5	5	5	5	5
31	100	1	5	5	5	5	5	5	5	5
	25	0	5	5	5	5	5	5	5	5

Таблица 5

## Эффективность способа

Соединение	Норма расхода по д.в., г д.в./10 ак-ров	Фитотоксичность, Go	Гербицидное действие							
			Ec	So	Po	Am	Ch	Ip	Xa	Cr
1	100	1	5	5	5	5	5	5	5	5
	25	4	5	5	5	5	5	5	5	5
2	100	1	5	5	5	5	5	4	5	5
	25	0	3	5	5	5	5	3	4	5
Сравнительное	100	5	5	5	5	5	5	3	3	4
соединение 1	25	4	5	5	5	5	5	1	2	3

Таблица 6

## Эффективность способа

Соединение	Норма расхода по д.в., г д.в./10 ак-ров	Фитотоксичность, Go	Гербицидное действие							
			Ec	So	Po	Am	Ch	Ip	Xa	Cr
23	25	0	4	5	5	5	5	5	5	5
24	25	0	4	5	5	5	5	5	5	5
27	25	0	4	5	5	5	5	4	5	5
Сравнительное										
соединение 1	25	4	5	5	5	5	5	1	1	2
30	25	0	5	5	5	5	5	5	5	5
31	25	0	4	5	5	5	5	5	5	5

Таблица 7

## Эффективность способа

Соединение	Гербицидное действие					
	Ec	DI	Po	Am	Ch	Cr
1	5	5	5	5	5	5
2	5	5	5	5	5	5
Сравнительное соединение 1	5	5	4	5	5	5
Сравнительное соединение 2*	0	2	2	0	0	5
Сравнительное соединение 3**	1	1	2	1	1	3
Сравнительное соединение 4***	1	1	1	1	1	1

\*Соединение 2: этил-3-[(5-хлорпиримидин-2-ил)окси]бензоат.

\*\*Соединение 3: этил-5(5-хлорпиримидин-2-ил)окси-2-нитробензоат.

\*\*\*Сравнительное соединение 4: 2-/2-торилокси/-4,6-диметилпиримидин.

Таблица 8

## Эффективность способа

Соединение	Гербицидное действие					
	Ec	DI	Po	Am	Ch	Cr
3	5	5	5	5	5	5
10	5	5	5	5	5	5
11	5	5	5	5	5	5
12	5	5	5	5	5	5
13	5	5	5	5	5	5
14	5	5	5	5	5	5
16	5	5	5	5	5	5
17	5	5	5	5	5	5
18	5	5	5	5	5	5
20	5	5	5	5	5	5
23	5	5	5	5	5	5
24	5	5	5	5	5	5



Продолжение табл 8

Соединение	Гербицидное действие					
	Ec	DI	Po	Am	Ch	Cr
25	5	5	5	5	5	5
26	5	5	5	5	5	5
27	5	5	5	5	5	5
29	5	5	5	5	5	5
Сравнительное соединение 2	0	1	2	1	1	5
Сравнительное соединение 3	0	1	2	1	1	5
Сравнительное соединение 4	1	0	1	1	1	1
Сравнительное соединение 5*	2	2	3	2	2	3

\*Соединение 5: 2-/(4,6-диметоксипиримидин-2-ил)тио/-бензойной кислоты.

Таблица 9

Эффективность способа

Соединение	Гербицидное действие					
	Ec	DI	Po	Am	Ch	Cr
1	5	5	5	5	5	5
2	5	5	5	5	5	5
Сравнительное соединение 1	5	5	4	5	5	5
Сравнительное соединение 2	0	0	0	0	0	5
Сравнительное соединение 3	0	0	0	0	2	5
Сравнительное соединение 4	0	0	0	0	0	5

Таблица 10

## Эффективность способа

Соединение	Гербицидные эффекты					
	Ec	DI	Po	Am	Ch	Cr
3	5	5	5	5	5	5
4	5	5	5	5	5	5
5	5	5	5	5	5	5
6	5	5	5	5	5	5
7	5	5	5	5	5	5
8	5	5	5	5	5	5
9	5	5	5	5	5	5
10	5	5	5	5	5	5
11	5	5	5	5	5	5
12	5	5	5	5	5	5
13	5	5	5	5	5	5
14	5	5	5	5	5	5
15	5	5	5	5	5	5
16	5	5	5	5	5	5
17	5	5	5	5	5	5
18	5	5	5	5	5	5
19	5	5	5	5	5	5
20	5	5	5	5	5	5
21	5	5	5	5	5	5
22	5	5	5	5	5	5
23	5	5	5	5	5	5
24	5	5	5	5	5	5
25	5	5	5	5	5	5
26	5	5	5	5	5	5
27						
Сравнительное соединение 2	0	0	0	0	0	5
Сравнительное соединение 3	0	0	0	0	2	4
Сравнительное соединение 4	0	0	0	0	0	0
Сравнительное соединение 5	3	2	2	2	1	2

Таблица 11

Соединение	Гербицидное действие			
	Ec	Cd	Mo	Sc
1	5	5	5	5
2	5	5	5	5
3	5	5	5	5
4	5	5	5	5
5	5	5	5	5
6	5	5	5	5
7	5	5	5	5
8	5	5	5	5
9	5	5	5	5
10	5	5	5	5
11	5	5	5	5
12	5	5	5	5
13	5	5	5	5
14	5	5	5	5
15	5	5	5	5
16	5	5	5	5
17	5	5	5	5
18	5	5	5	5
19	5	5	5	5
20	5	5	5	5
21	5	5	5	5
22	5	5	5	5
23	5	5	5	5
24	5	5	5	5
25	5	5	5	5
26	5	5	5	5
27	5	5	5	5
28	5	5	5	5
29	5	5	5	5

Таблица 12

Соединение	Доза активного ингредиента, г/10а	Фитотоксичность	Гербицидное действие				
		Go	So	Ро	Am	Ch	
1	6,3	0	3	5	5	5	
	1,6	0	2	5	5	5	
2	6,3	0	5	5	5	5	
	1,6	0	4	3	5	3	
10	6,3	0	5	5	5	5	
	1,6	0	5	4	4	3	
11	6,3	0	5	5	5	5	
	1,6	0	5	5	4	4	
12	6,3	0	5	5	5	Н	
	1,6	0	5	5	5	5	
13	6,3	0	5	5	5	5	
	1,6	0	5	5	5	4	
14	6,3	0	5	5	5	4	
	1,6	0	5	5	5	5	
18	6,3	0	5	5	5	5	
	1,6	0	0	0	5	4	
20	6,3	0	5	5	5	5	
	1,6	0	4	4	5	5	
23	6,3	0	5	5	5	5	
	1,6	0	5	5	5	5	
24	6,3	0	5	5	5	5	
	1,6	0	5	5	5	5	
26	6,3	0	5	5	5	5	
	1,6	0	4	4	5	3	
Сравнительное соединение 1	6,3	0	4	3	3	4	
	1,6	0	2	1	1	2	

Таблица 13

Соединение	Доза активного ингредиента, г/10а	Фитотоксичность	Гербицидное действие			
		Go	So	Po	Am	Ch
1	6,3	0	5	5	5	5
	1,6	0	5	5	5	4
2	6,3	0	5	5	5	5
	1,6	0	4	4	5	3
24	6,3	0	5	5	5	5
	1,6	0	4	4	5	3
25	6,3	0	5	5	5	4
	1,6	0	4	4	5	3
19	6,3	0	0	5	5	5
	1,6	0	5	5	5	3
Сравнительное соединение 1	6,3	0	4	3	3	3
	1,6	0	2	1	1	1

Упорядник

Техред М.Келемеш

Коректор О.Кравцова

Замовлення 4459

Тираж

Підписне

Державне патентне відомство України,  
254655, ГСП, Київ-53, Львівська пл., 8

Відкрите акціонерне товариство "Патент", м. Ужгород, вул.Гагаріна, 101

1000

1000

1000

1000

1000

1000

1000

1000

1000

1000

1000

1000

1000

1000

1000

1000

1000

1000

1000

1000

1000

1000

1000

1000

1000

1000

1000

1000

1000

1000

1000

1000

1000

1000

1000

1000

1000

1000

1000

1000

1000

1000

1000