



УКРАЇНА

(19) UA (11) 39885 (13) C2

(51) 7 C07D239/60, C07D401/12,
C07D405/12, C07D409/12, A01N43/54МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ
І НАУКИ УКРАЇНИДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІОПИС
ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД

(54) ПОХІДНІ 3-(ГЕТ)АРИЛКАРБОНОВОЇ КИСЛОТИ, ГЕРБИЦИДНИЙ ПРЕПАРАТ ТА ЗАСІБ ДЛЯ ПРИГНІЧЕННЯ РОСТУ РОСЛИН

(21) 95114907

(22) 13.04.1994

(24) 16.07.2001

(31) P 43 13 412.2

(32) 23.04.1993

(33) DE

(86) PCT/EP94/01141, 13.04.1994

(46) 16.07.2001, Бюл. № 6, 2001 р.

(72) Бауманн Ернст, DE, Рейнхеймер Йоахім, DE, Фогельбахер Уве Йосеф, DE, Братц Маттіас, DE, Теобальд Ханс, DE, Гербер Маттіас, DE, Вестфален Карл-Отто, DE, Валтер Хельмут, DE, Радемахер Вільгельм, DE

(73) БАСФ АГ, DE

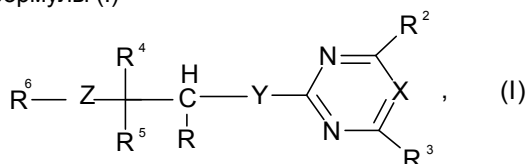
(56) EP, 0 481 512.

EP, 0 409 368.

EP, 0 517 215.

CHEMICAL ABSTRACTS, vol. 119, no. 13, abstract
no. 139254e

(57) 1. Производные 3-(гет)арилкарбонической кислоты формулы (I)



в которой R обозначает группу -COOH или гидролизуемый до -COOH радикал -COR¹, в котором R¹ обозначает радикал -OR¹⁰, где R¹⁰ представляет собой: катион щелочного металла, эквивалент катиона щелочноземельного металла, катион аммония, органический ион аммония или C₁-C₈ алкил; R₂ обозначает C₁-C₄-алкоксигруппу; X обозначает CR¹⁴, где R¹⁴ является водородом; R³ обозначает C₁-C₄-алкоксигруппу; R⁴ обозначает фенил, который может быть замещен одним или несколькими остатками, выбранными из группы, включающей галоген, C₁-C₄-алкил, C₁-C₄-галогеналкил, C₁-C₄-алкоксигруппу и нитрогруппу, или 5-членный гетероароматический остаток, содержащий 1-2 атома азота и/или один

атом кислорода или серы, или 6-членный азотсодержащий гетероароматический остаток;

R⁵ обозначает водород, C₁-C₄-алкил;

R⁶ обозначает C₁-C₈-алкил, который может быть однократно или многократно замещен фенилом или фенилом, замещенным одним или несколькими остатками, выбранными из галогена и C₁-C₄-галогеналкила;

Y обозначает серу или кислород;

Z представляет собой кислород;

при условии, что R⁶ представляет собой незамещенный C₁-C₄-алкил, если R⁴ обозначает незамещенный фенил, Z обозначает кислород и одновременно R⁵ обозначает метил или водород.

2. Соединения по п. 1, в которых R⁴ обозначает фенил, который может быть замещен, как указано в п. 1, а остальные заместители имеют значение, указанное в п. 1.

3. Соединения по п. 1, в которых Z обозначает кислород, R⁴ обозначает фенил, который может быть замещен, как указано в п. 1, R⁵ обозначает метил, X обозначает CH, R² и R³ обозначают метокси, а Y, R¹ и R⁶ имеют значение, указанное в п. 1.

4. Соединения по п. 1, в которых R⁴ представляет собой пяти- либо шестичленный гетероароматический углеводород по п. 1, а остальные заместители имеют значение, указанное в п. 1.

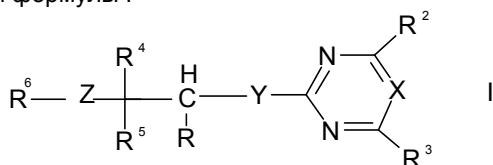
5. Соединения по п. 1, в которых Z обозначает кислород, R⁴ представляет собой пяти- либо шестичленный гетероароматический углеводород по п. 1, R⁵ обозначает метил, X обозначает CH, R² и R³ обозначают метокси, а Y, R¹ и R⁶ имеют значение, указанное в п. 1.

6. Гербицидный препарат, содержащий активное начало на основе (гет)арилзамещенного производного карбоновой кислоты и инертные добавки, **отличающийся** тем, что в качестве активного начала содержит соединение формулы (I) по п. 1.

7. Средство для подавления роста растений, содержащее активное начало на основе (гет)арилзамещенного производного карбоновой кислоты и инертные добавки, **отличающееся** тем, что в качестве активного начала содержит соединение формулы (I) по п. 1.

(19) UA (11) 39885 (13) C2

Настоящее изобретение относится к новым производным 3-(гет)арилкарбоновой кислоты общей формулы I



в которой R обозначает группу -COOH или гидролизуемый до -COOH радикал -COR¹, в котором R¹ обозначает радикал -OR¹⁰, где R¹⁰ представляет собой:

катион щелочного металла, эквивалент катиона щелочноземельного металла, катион аммония, органический ион аммония или C₁-C₈-алкил;

R² - C₁-C₄-алкоксигруппу;

X обозначает CR¹⁴, где R¹⁴ является водородом;

R обозначает C₁-C₄-алкоксигруппу;

R⁴ обозначает фенил, который может быть замещен одним или несколькими остатками, выбранными из группы, включающей галоген, C₁-C₄-алкил, C₁-C₄-галогеналкил, C₁-C₄-алкоксигруппу и нитрогруппу, или 5-членный гетероароматический остаток, содержащий 1-2 атома азота и/или один атом кислорода или серы, или 6-членный азотсодержащий гетероароматический остаток;

R⁵ обозначает водород, C₁-C₄-алкил;

R⁶ обозначает C₁-C₈-алкил, который может быть однократно или многократно замещен фенилом или фенилом, замещенным одним или несколькими остатками, выбранными из галогена и C₁-C₄-галогеналкила;

Y обозначает серу или кислород;

Z представляет собой кислород;

при условии, что R⁶ представляет собой незамещенный C₁-C₄-алкил, если R⁴ обозначает незамещенный фенил, Z обозначает кислород и одновременно R⁵ обозначает метил или водород.

В известных публикациях, относящихся к уровню техники, например в европейских заявках EP-A 347811, EP-A 400741, EP-A 409368, EP-A 481512, EP-A 517215, Chemical Abstracts, 119, N 139254e (1993 г.) и в более ранней немецкой заявке P 4142570 (европейская заявка EP-A 548710), описываются близкие аналогичные производные карбоновой кислоты, в том числе 3-алкоксипроизводные, однако в этих публикациях отсутствуют производные, имеющие гетарильный радикал в положении 3.

В европейской заявке EP-A 0409368 описаны гербицидные и подавляющие рост растений композиции на основе гетероарилзамещенного производного карбоновой кислоты, содержащие инертные добавки.

Однако гербицидная и/или биорегуляционная активность и селективность действия известных соединений далеко не всегда являются удовлетворительными. Поэтому задачей настоящего изобретения является изыскание соединений, обладающих более высоким избирательным действием по отношению к культурным растениям и/или

более высокой гербицидной или биорегуляционной активностью.

Производные 3-(гет)арилкарбоновой кислоты общей формулы I настоящего изобретения обладают очень хорошими гербицидными и регулирующими рост растений свойствами. Кроме того, соединения I проявляют фармакологическое действие, прежде всего в отношении сердечно-сосудистой системы.

Предпочтительны соединения общей формулы I, в которых R⁴ обозначает фенил, возможно замещенный, как указано выше, а остальные заместители имеют значения, указанные выше.

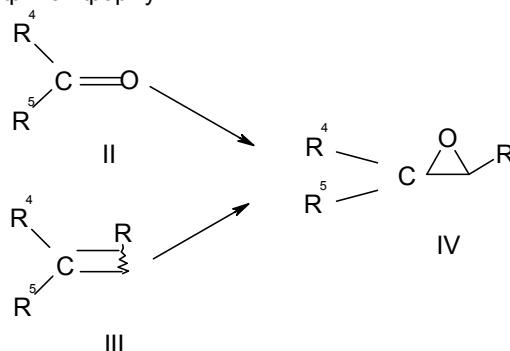
Особенно предпочтительны соединения формулы I, в которых Z обозначает кислород, R⁴ обозначает фенил, который может быть замещен, как указано выше, R⁵ обозначает метил, X обозначает CH, R² и R³ обозначают метокси, а Y, R¹ и R⁶ имеют значения, указанные выше; либо соединения формулы I, в которых R⁴ представляет собой пяти- либо шестичленный гетероароматический углеводород, указанные выше, а остальные заместители имеют значения, указанные выше.

Особенно предпочтительны соединения формулы I, в которых Z обозначает кислород, R⁴ представляет собой пяти- либо шестичленный гетероароматический углеводород, указанные выше, R⁵ обозначает метил, X обозначает CH, R² и R³ обозначают метокси, а Y, R¹ и R⁶ имеют значения, указанные выше.

Настоящее изобретение относится также к гербицидному препарату, содержащему активное начало на основе (гет)арилзамещенного производного карбоновой кислоты и инертные добавки, который в качестве активного начала содержит соединение формулы (I).

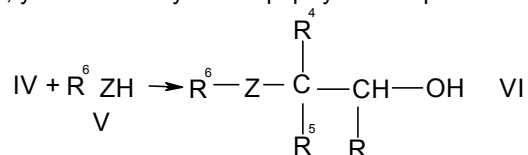
Изобретение также относится к средству для подавления роста растений, содержащему активное начало на основе гетероарилзамещенного производного карбоновой кислоты и инертные добавки, которое в качестве активного начала содержит соединение формулы (I).

Соединения согласно изобретению получают из эпосидов формулы IV, получаемых по общеизвестной методике, например, как это описано в J. March, Advanced Organic Chemistry, 2-е издание, 1983 г., стр. 862, соответственно стр. 750, из альдегидов, соответственно кетонов формулы II или олефинов формулы III:



Производные 3-(гет)арилкарбоновой кислоты общей формулы VI могут быть получены взаимно-

действием эпоксидов общей формулы IV (например, с R, обозначающим COOR¹⁰) со спиртами общей формулы V, в которой R⁶ и Z имеют значение, указанное в пункте 1 формулы изобретения.



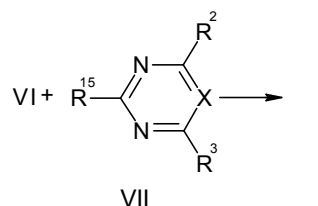
С этой целью соединения общей формулы IV нагревают с избыточным количеством, составляющим, например, 1,2-7, предпочтительно 2-5 молярных эквивалентов соединений формулы V, до температуры 50-200°C, предпочтительно 80-150°C.

Указанная реакция может осуществляться в присутствии разбавителя. Для этой цели могут применяться все растворители, являющиеся инертными по отношению к используемым реагентам. Примерами таких растворителей, соответственно разбавителей, служат вода, алифатические, алициклические и ароматические углеводороды или их хлорированные производные, такие как, например, гексан, циклогексан, петролейный эфир, лигроин, бензол, толуол, ксилол, метиленхлорид, хлороформ, четыреххлористый углерод, этиленхлорид и трихлорэтилен, простые эфиры, такие как, например, диизопропиловый эфир, дибутиловый эфир, оксид пропилена, диоксан и тетрагидрофуран, кетоны, такие как, например, ацетон, метилэтилкетон, метилизопропилкетон и метилизобутилкетон, нитрилы, такие как, например, ацетонитрил и пропионитрил, спирты, такие как, например, метанол, этанол, изопропанол, бутанол и этиленгликоль, сложные эфиры, такие как, например, этилацетат и амилацетат, амиды кислот, такие как, например, диметилформамид и диметилацетамид, сульфоксиды и сульфоны, такие как, например, диметилсульфоксид и сульфолан, и основания, такие как, например, пиридин.

Реакцию при этом осуществляют предпочтительно в интервале от 0°C до температуры кипения растворителя или соответственно смеси растворителей.

Возможно также использование в реакции катализатора, наличие которого может дать определенные преимущества. В качестве катализаторов при этом могут рассматриваться сильные органические кислоты и неорганические кислоты, а также кислоты Льюиса. Примерами таких кислот являются, например, серная кислота, соляная кислота, трифторуксусная кислота, эфират трехфтористого бора и алколяты титана (IV).

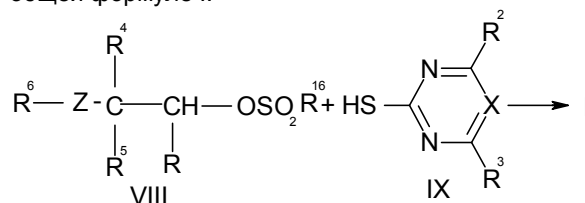
Предлагаемые согласно изобретению соединения, в которых Y обозначает кислород, а остальные заместители имеют значения, указанные для общей формулы I, могут быть получены, например, взаимодействием производных 3-(гет)арилкарбоновой кислоты общей формулы VI, в которых заместители имеют указанные выше значения, с соединениями общей формулы VII,



в которой R¹⁵ обозначает галоген или R¹⁶-SO₂-, где R¹⁶ может представлять собой C₁-C₄-алкил, C₁-C₄-галогеналкил или фенил. Реакция протекает предпочтительно в одном из названных выше инертных разбавителей с добавками соответствующего основания, т.е. такого основания, которое может депротонировать промежуточный продукт VI, при температуре от комнатной до температуры кипения растворителя.

В качестве основания могут служить гидриды щелочных и щелочноземельных металлов, такие как гидрид натрия, гидрид калия либо гидрид кальция, карбонаты, например карбонаты щелочных металлов, такие как карбонат натрия либо карбонат калия, гидроксиды щелочных или щелочноземельных металлов, такие как гидроксид натрия либо гидроксид калия, металлоорганические соединения, такие как бутиллитий, или амиды щелочных металлов, такие как диизопропиламид лития.

Соединения по изобретению, в которых Y обозначает серу, а остальные заместители имеют значения, указанные для общей формулы I, могут быть получены, например, взаимодействием производных 3-(гет)арилкарбоновой кислоты общей формулы VIII, которые можно получить по известной методике из соединений общей формулы VI и в которых заместители имеют указанное выше значение, с соединениями общей формулы IX, в которой R², R³ и X имеют значение, указанное в общей формуле I.



Реакция протекает предпочтительно в одном из названных выше инертных разбавителей с добавками соответствующего основания, т.е. такого основания, которое может депротонировать промежуточный продукт IX, в интервале температур от комнатной до температуры кипения растворителя.

В качестве оснований наряду с вышеназванными могут служить также органические основания, как третичные амины, например триэтиламин, пиридин, имидазол либо диазабициклоундекан.

Соединения общей формулы I могут быть получены также из соответствующих карбоновых кислот, т.е. соединений формулы I, в которых R¹ представляет собой гидроксильную группу, которые переводят по известной методике сначала в активированную форму, например в галогенид, ангидрид или имидазолид, а затем подвергают взаимодействию с соответствующим гидроксильным соединением HOR¹⁰. Это взаимодействие

может осуществляться в обычных растворителях, желательно с добавлением одного из оснований, указанных выше. Осуществление обеих описанных стадий может быть упрощено, в частности, проведением реакции карбоновой кислоты в присутствии отщепляющего воду средства, такого как карбодиимид, с гидроксильным соединением.

Кроме того, соединения общей формулы I могут быть получены из солей соответствующих карбоновых кислот, т.е. из соединений формулы I, в которых R представляет собой группу COR¹, а R¹ обозначает OM, где M может быть катионом щелочного металла либо эквивалентом катиона щелочноземельного металла. Указанные соли могут подвергаться взаимодействию со многими соединениями формулы R¹-A, где A обозначает обычную нуклеофобную отщепляемую группу, например галоген, такой как хлор, бром, иод, или возможно замещенный галогеном, алкилом или галогеналкилом арил- либо алкилсульфонил, такой как, например, толуолсульфонил и метилсульфонил, или же A обозначает какую-либо другую эквивалентную отщепляемую группу. Соединения формулы R¹-A с реакционно-способным заместителем A известны или их легко можно получить с помощью общеизвестных методов. Такая реакция может осуществляться в обычных растворителях и ее проводят преимущественно в присутствии одного из вышеназванных оснований.

Радикал R в формуле I изменяется в широких пределах. Этот радикал может представлять собой, например, группу



в которой R¹ имеет следующее значение:

- а) водород;
 - б) R¹ представляет собой далее радикал OR¹⁰, где R¹⁰ обозначает: водород, катион щелочного металла или катион щелочноземельного металла, как литий, натрий, калий, соответственно кальций, магний и барий, или экологически безопасный органический ион аммония, как трет.- C¹-C⁴-алкиламмоний, либо катион аммония; C₁-C₈-алкил означает прежде всего метил, этил, пропил, 1-метилэтил, бутил, 1-метилпропил, 2-метилпропил, 1,1-диметилэтил, пентил, 1-метилбутил, 2-метилбутил, 3-метилбутил, 1,2-диметилпропил, 1,1-диметилпропил, 2,2-диметилпропил, 1-этилпропил, гексил, 1-метилпентил, 2-метилпентил, 3-метилпентил, 4-метилпентил, 1,2-диметилбутил, 1,3-диметилбутил, 2,3-диметилбутил, 1,1-диметилбутил, 2,2-диметилбутил, 3,3-диметилбутил, 1,1,2-триметилпропил, 1,2,2-триметилпропил, 1-этилбутил, 2-этилбутил, 1-этил-2-метилпропил.
- R² обозначает C₁-C₄-алкоксильную группу, которая может быть замещена галогеном, такую как метокси, этокси, дифторметокси, трифторметокси, особенно предпочтительно метокси; X обозначает CR¹⁴, где R¹⁴ представляет собой водород; R³ обозначает C₁-C₄-алкоксильную группу, такую как метокси, этокси; R⁴ представляет собой 5- либо 6-членный гетероарил, как фурил, тиенил, пирролил, пиразолил, имидазолил, изоксазолил, оксазолил, изотиазо-

лил, тиазолил, тиадиазолил, пиридил, пиримидинил, пиазинил, пиридазинил, триазинил, например 2-фуранил, 3-фуранил, 2-тиенил, 3-тиенил, 3-изоксазолил, 4-изоксазолил, 5-изоксазолил, 3-изотиазолил, 4-изотиазолил, 5-изотиазолил, 2-оксазолил, 4-оксазолил, 5-оксазолил, 2-тиазолил, 4-тиазолил, 5-тиазолил, 2-имидазолил, 4-имидазолил, 5-имидазолил, 2-пирролил, 3-пирролил, 4-пирролил, 3-пиразолил, 4-пиразолил, 5-пиразолил, 2-пиридил, 3-пиридил, 4-пиридил, окса-2,4-диазолил, окса-3,4-диазолил, тиа-2,4-диазолил, тиа-3,4-диазолил, причем гетероароматические углеводороды могут нести от одного до пяти атомов галогена, прежде всего фтор и хлор, и/или от одного до трех остатков из числа следующих:

C₁-C₄-алкил, C₁-C₄-алкокси, C₁-C₄-алкилтио, циано, нитро, C₁-C₈-алкилкарбонил, C₁-C₈-алкоксикарбонил, фенил, фенокси, фенилкарбонил, как указано выше, в частности; R⁴ обозначает далее фенил, который может быть замещен одним либо несколькими, например одним-тремя, остатками из числа следующих: галоген, нитро, гидроксиль, C₁-C₄-алкил, C₁-C₄-галогеналкил, C₁-C₄-алкокси, например 3-гидроксифенил;

R⁵ представляет собой водород, C₁-C₄-алкил; R⁶ обозначает C₁-C₈-алкил, однократно либо многократно замещенный фенилом или фенилом, замещенным галогеном, и/или C₁-C₄-галогеналкилом;

Y представляет собой серу, кислород;

Z представляет собой кислород, при условии, что R⁶ представляет собой незамещенный C₁-C₄-алкил, если R⁴ обозначает незамещенный фенил, Z обозначает кислород и одновременно R⁵ обозначает метил или водород.

Среди соединений формулы I предпочтительны те из них, в которых R² и R₃ обозначают метокси и X обозначает СН. Однако могут быть получены и другие соединения формулы I, представленные в табл. 1. (см. в конце описания). Представленные в ней, равно как и в таблицах 2 и 3, значения R⁴ следует также рассматривать как предпочтительные, независимо от сочетаний значений других радикалов с R⁴.

Соединения I, равно как и их экологически безопасные соли, например соли щелочных и щелочноземельных металлов, и соответственно содержащие эти соединения гербицидные препараты могут высокоэффективно применяться для борьбы с сорняками и вредоносными растениями в таких культурах, как пшеница, рис, кукуруза, соя и хлопчатник, не нанося при этом вреда культурным растениям, - эффект, которого можно достичь, прежде всего, и при использовании малых количеств действующих веществ.

Соединения I или содержащие эти соединения гербицидные препараты могут применяться в виде различных форм, например в виде предназначенных для непосредственного опрыскивания растворов, порошков, суспензий, а также в виде высокопроцентных водных, масляных или каких-либо других суспензий или дисперсий, эмульсий, масляных дисперсий, паст, препаратов для опыливания, распыливания или гранулятов. При этом используют самые разные методы, а именно: оп-

рыскивание, опыливание, аэрозольную обработку туманами или полив. Эти формы и методы определяются целью применения, но во всех случаях должно быть обеспечено максимально равномерное и предельно тонкое распределение действующих веществ.

Соединения I пригодны в принципе для изготовления из них предназначенных для непосредственного опрыскивания растворов, эмульсий, паст или масляных дисперсий. В качестве инертных добавок могут использоваться, например, минерально-масляные фракции со средней и высокой температурой кипения, такие как керосин или дизельное масло, далее, масла на основе каменноугольной смолы, а также масла растительного или животного происхождения, алифатические, циклические и ароматические углеводороды, например толуол, ксилол, парафин, тетрагидронафталин, алкилированные нафталины или их производные, метанол, этанол, пропанол, бутанол, циклогексанол, пиклогексанол, хлорбензол, изофорон или сильно полярные растворители, как N,N-диметилформамид, диметилсульфоксид, N-метилпирролидон или вода.

Водные формы могут приготавливаться из эмульсионных концентратов, дисперсий, паст, смачивающихся порошков или диспергируемых в воде гранулятов путем добавок воды. Для приготовления эмульсий, паст или масляных дисперсий действующие вещества либо в их исходном виде, либо после их растворения в масле или растворителе можно гомогенизировать в воде с помощью смачивателей, прилипателей, диспергаторов или эмульгаторов. Наряду с этим из действующих веществ, смачивателей, прилипателей, диспергаторов или эмульгаторов и, если необходимо, растворителей и масел могут изготавливаться также соответствующие концентраты, пригодные для разбавления водой.

В качестве поверхностно-активных веществ могут использоваться соли щелочных и щелочно-земельных металлов и аммониевые соли ароматических сульфокислот, например лигнинсульфокислоты, фенолсульфокислоты, нафталинсульфокислоты и дибутилнафталинсульфокислоты, а также жирных кислот, алкил- и алкиларилсульфонатов, алкилсульфатов, сульфатов лаурилового эфира и жирных спиртов, далее, соли сульфатированных гекса-, гепта- и октадеканола, а также гликолевого эфира жирного спирта, продукты конденсации сульфированного нафталина и его производных с формальдегидом, продукты конденсации нафталина или нафталинсульфокислот с фенолом и формальдегидом, простой полиоксиэтиленоктилфеноловый эфир, этоксилированный изооктил-, октил- или нонилфенол, простой алкилфенол- или трибутилфенилполигликолевый эфир, алкиларилполиэфирные спирты, изотридециловый спирт, продукты конденсации этиленоксида жирного спирта, этоксилированное касторовое масло, простой полиоксиэтиленалкиловый эфир или полиоксипропилен, ацетат лаурилового спирта и полигликолевого эфира, сложные сорбитовые эфиры, отработанный лигнинсульфитный щелок или метилцеллюлоза.

Порошкообразные препараты, препараты для опыливания и распыливания могут изготавливаться

с смешиванием или одновременным измельчением действующих веществ вместе с твердым наполнителем.

Грануляты, например грануляты с оболочкой, импрегнированные грануляты и гомогенные грануляты могут изготавливаться связыванием действующих веществ с твердыми наполнителями. К таким твердым наполнителям относятся минеральные земли, в частности кремниевые кислоты, кизельгели, силикаты, тальк, каолин, известняк, известь, мел, болюс, лесс, глина, доломит, диатомовая земля, сульфат кальция и сульфат магния, оксид магния, измельченные синтетические вещества, удобрения, такие как сульфат аммония, фосфат аммония, нитрат аммония, мочевины, и продукты растительного происхождения, как мука зерновых, мука из древесной коры, древесная мука и мука из ореховой скорлупы, целлюлозные порошки или какие-либо другие твердые наполнители.

Композиции содержат действующие вещества, как правило, в количестве от 0,01 до 95 мас.%, предпочтительно от 0,5 до 90 мас.%. Степень чистоты применяемых действующих веществ составляет при этом 90-100%, предпочтительно 95-100% (согласно спектру ЯМР).

Примерами таких композиций являются следующие:

I. 20 масс. частей соединения N 2.1 растворяют в смеси, состоящей из 80 масс. частей алкилированного бензола, 10 масс. частей продукта присоединения 8-10 молей этиленоксида к 1 молю N-моноэтаноламида олеиновой кислоты, 5 масс. частей кальциевой соли додецилбензолсульфокислоты и 5 масс. частей продукта присоединения 40 молей этиленоксида к 1 молю касторового масла. После сливания этого раствора в 100000 масс. частей воды и его равномерного и тонкого распределения в этой воде получают водную дисперсию, содержащую 0,02 мас.% действующего вещества.

II. 20 масс. частей соединения N 2.1 растворяют в смеси, состоящей из 40 масс. частей циклогексана, 30 масс. частей изобутанола, 20 масс. частей продукта присоединения 7 молей этиленоксида к 1 молю изооктилфенола и 10 масс. частей продукта присоединения 40 молей этиленоксида к 1 молю касторового масла. После сливания раствора в 100000 масс. частей воды и его равномерного и тонкого распределения в этой воде получают водную дисперсию, содержащую 0,02 мас.% действующего вещества.

III. 20 масс. частей действующего вещества N 2.1 растворяют в смеси, состоящей из 25 масс. частей циклогексана, 65 масс. частей минерально-масляной фракции с температурой кипения 210-280°C и 10 масс. частей продукта присоединения 40 молей этиленоксида к 1 молю касторового масла. После сливания раствора в 100000 масс. частей воды и его равномерного и тонкого распределения в этой воде получают водную дисперсию, содержащую 0,02 мас.% действующего вещества.

IV. 20 масс. частей действующего вещества N 2.1 тщательно смешивают с 3 масс. частями натриевой соли диизобутилнафталин- α -сульфокислоты, 17 вес. частями натриевой соли лигнин-

сульфокислоты из отработанного сульфитного щелока и 60 масс. частями порошкообразного геля кремниевой кислоты, после чего измельчают в молотковой мельнице. Путем равномерного и тонкого распределения смеси в 20000 масс. частях воды получают раствор для опрыскивания, содержащий 0,1 мас.% действующего вещества.

V. 3 масс. части действующего вещества N 2.1 смешивают с 97 масс. частями высокодисперсного каолина. Таким путем получают препарат для опыливания, содержащий 3 мас. % действующего вещества.

VI. 20 масс. частей действующего вещества N 2.1 тщательно смешивают с 2 масс. частями кальциевой соли додецилбензолсульфокислоты, 8 масс. частями полигликолевого эфира жирного спирта, 2 масс. частями натриевой соли конденсата фенол-мочевин-формальдегида и 68 масс. частями парафинового минерального масла. Таким путем получают стабильную масляную дисперсию.

Гербицидные препараты и соответственно действующие вещества могут использоваться как при предвсходовой обработке, так и при послевсходовой обработке. В случае, если действующие вещества обладают меньшей совместимостью с определенными культурными растениями, может применяться такая технология обработки, при которой опрыскивание гербицидными препаратами с помощью соответствующих опрыскивателей производят таким образом, чтобы по возможности не повредить листья чувствительных культурных растений и чтобы в то же время действующие вещества попадали на листья растущих под ними нежелательных растений или на открытые участки почвы (постэффект, полоса испытаний).

В зависимости от целей обработки, времени года, вида обрабатываемых растений и стадии роста количество применяемого действующего вещества составляет от 0,001 до 5,0 кг/га, предпочтительно от 0,01 до 2,0 кг активной субстанции (а.с.)/га.

С учетом многообразия методов обработки предлагаемые согласно изобретению соединения, соответственно препараты, содержащие эти соединения, могут применяться для борьбы с нежелательными растениями при возделывании не только указанных выше культурных растений, но и целого ряда других. Речь идет, в частности, о следующих культурах:

Allium *sepa*, *Ananas* *comosus*, *Arachis* *hypogaea*, *Asparagus* *officinalis*, *Beta* *vulgaris* spp. *altissima*, *Beta* *vulgaris* spp. *rapa*, *Brassica* *napus* var. *napus*, *Brassica* *napus* var. *napobrassica*, *Brassica* *rapa* var. *silvestris*, *Camellia* *sinensis*, *Carthamus* *tinctorius*, *Carya* *illinoensis*, *Citrus* *limon*, *Citrus* *sinensis*, *Coffea* *arabica* (*Coffea* *canephora*, *Coffea* *liberica*), *Cucumis* *sativus*, *Cynodon* *dactylon*, *Daucus* *carota*, *Elaeis* *guineensis*, *Fragaria* *vesca*, *Glycine* *max*, *Gossypium* *hirsutum* (*Gossypium* *arboreum*, *Gossypium* *herbaceum*, *Gossypium* *vitifolium*), *Helianthus* *annuus*, *Hevea* *brasiliensis*, *Hordeum* *vulgare*, *Humulus* *lupulus*, *Ipomoea* *batatas*, *Juglans* *regia*, *Lens* *culinaris*, *Linum* *usitatissimum*, *Lycopersicon* *lycopersicum*, *Malus* spp., *Manihot* *esculenta*, *Medicago* *saliva*, *Musa* spp., *Nicotiana* *tabacum* (*N. rustica*), *Olea* *europaea*, *Oryza* *saliva*, *Phaseolus* *luna-*

tus, *Phaseolus* *vulgaris*, *Picea* *abies*, *Pinus* spp., *Pisum* *sativum*, *Prunus* *avium*, *Prunus* *persica*, *Pyrus* *communis*, *Ribes* *sylvestre*, *Ricinus* *communis*, *Saccharum* *officinarum*, *Secale* *cereale*, *Solanum* *tuberosum*, *Sorghum* *bicolor* (*S. vulgare*), *Theobroma* *cacao*, *Trifolium* *pratense*, *Triticum* *aestivum*, *Triticum* *durum*, *Vicia* *faba*, *Vitis* *vinifera*, *Zea* *mays*.

Соединения формулы I могут оказывать различное воздействие практически на все стадии развития того или иного растения и поэтому их применяют в качестве регуляторов роста. Многообразие такого воздействия регуляторов роста растений зависит прежде всего:

- а) от вида и сорта растений,
- б) от времени обработки, применительно к стадии развития растения, и от времени года,
- в) от места и метода обработки (например, протравливание семян, обработка почвы, обработка листьев или инъекции в ствол (у древовидных культур)),
- г) от климатических факторов, например температуры, количества выпавших осадков, а также от продолжительности светового дня и интенсивности освещения,
- д) от особенностей почв (включая внесение удобрений),
- е) от состава композиций, соответственно формы применения действующих веществ и, наконец,
- ж) от применяемой концентрации активной субстанции.

Ниже представлены некоторые из множества разнообразных возможностей применения регуляторов роста растений формулы I, используемых в растениеводстве, в сельском хозяйстве и в садоводстве.

A). С помощью применяемых соединений изобретения удастся в значительной степени угнетать вегетативный рост растений, что проявляется в первую очередь в уменьшении роста в высоту. Вследствие этого обработанные растения имеют укороченную, "приземистую" форму; кроме того, у таких растений наблюдается более темная окраска листьев.

Существенное преимущество заключается в том, что снижается интенсивность роста трав и таких подверженных полеганию культур, как зерновые, кукуруза, подсолнечник и соя. Такое "снижение интенсивности роста способствует формированию у растений укороченного и утолщенного стебля, вследствие чего при неблагоприятных погодных условиях до уборки урожая уменьшается или вовсе устраняется опасность полегания (ломки) растений.

Применение регуляторов роста является важным также для угнетения роста в высоту и для изменения по времени процесса созревания хлопчатника. Тем самым обеспечивается возможность для полной механизированной уборки этой важной культуры.

При уходе за плодовыми деревьями и другими древесными насаждениями благодаря регуляторам роста удастся значительно снизить затраты при обрезке. Кроме того, с помощью регуляторов роста можно варьировать листорасположение на плодовых деревьях.

Благодаря применению регуляторов роста можно также способствовать боковому ветвлению растений или соответственно подавлять его. Подобное может заинтересовать, например, при возделывании табака, когда требуется подавить формирование боковых побегов (летних побегов) для стимулирования роста листьев.

С помощью регуляторов роста можно существенно повысить также морозостойкость некоторых растений, например озимого рапса. При этом, с одной стороны, угнетается рост в высоту и подавляется образование слишком разросшейся (и по этой причине особенно чувствительной к морозу) листвы, соответственно растительной массы. С другой стороны, после посева и до наступления зимних холодов молодые растения рапса, несмотря на благоприятные условия роста, сдерживаются в стадии их вегетативного развития. Благодаря этому устраняется также опасность повреждения морозом таких растений, которые обладают способностью к преждевременному преодолению угнетающего воздействия на их цветение и переход в генеративную фазу. При возделывании других культур, например озимых зерновых, также целесообразно обрабатывать посевы соединениями изобретения с тем, чтобы осенью растения хотя и хорошо кустились, зимовали, однако, не слишком разросшимися. Тем самым это станет профилактической мерой против повышенной морозочувствительности и, благодаря относительно негустой листве, соответственно растительной массе, будет предотвращена возможность поражения различными заболеваниями, например грибной болезнью.

Б). С помощью регуляторов роста можно повысить урожайность как в отношении растительной массы, так и в отношении содержащихся в растениях веществ. Так, например, можно индуцировать образование большего количества почек, цветков, листьев, плодов, зерен, корней и клубней, повысить содержание сахара в сахарной свекле, сахарном тростнике и в цитрусовых, увеличить содержание протеина в зерновых культурах и сое или стимулировать каучуковые деревья к повышенному выделению латекса.

При этом соединения формулы I могут способствовать повышению урожайности за счет воздействия на обмен веществ в растениях или стимулированием, соответственно угнетением вегетативного и/или генеративного роста.

В). С помощью регуляторов роста можно сокращать, соответственно увеличивать продолжительность тех или иных стадий развития растений, а также ускорять, соответственно замедлять спелость растительной массы до или после уборки.

Интерес с экономической точки зрения может представить, например, следующий фактор. Благодаря сконцентрированному в определенный отрезок времени снижению или уменьшению прилипаемости к дереву цитрусовых, маслин или других видов и сортов семечковых и косточковых плодов и орехов можно существенно облегчить их съем. Тот же самый механизм, т.е. создание условий для формирования разделительной ткани между плодами, листьями и побегами растений, играет важную роль также для хорошо контролируемой

дефолиации полезных культур, как, например, хлопчатника.

Г). И, наконец, с помощью регуляторов роста можно сокращать потребление воды растениями. Благодаря применению соединений по изобретению удастся снизить интенсивность орошения и тем самым повысить экономичность ведения хозяйства, проявляющуюся, в частности, в том, что:

- уменьшается ширина устьиц,
- образуются более толстый эпидермис и кутикула,
- улучшается прорастание корней в почве и
- благодаря более компактному росту оказывается положительное влияние на микроклимат растительного покрова.

Особенно положительный эффект получают при применении соединений I для формирования укороченных стеблей у таких культурных растений, как ячмень, рапс и пшеница.

Применяемые по изобретению действующие вещества формулы I могут доводиться до культурных растений различными путями, начиная от протравливания семян и обработки почвы, т.е. через корневую систему, и кончая, что особенно предпочтительно, опрыскиванием листьев.

Применяемое количество действующих веществ, вследствие высокой совместимости последних с растениями не является критическим. Оптимальные нормы расхода следует выбирать в зависимости от целей применения, времени года, особенностей обрабатываемых растений и стадии роста.

При обработке семенного материала нормы расхода действующего вещества составляют, как правило, от 0,001 до 50 г, предпочтительно от 0,01 до 10 г, на 1 кг семян.

Для обработки листьев и почвы следует признать в основном достаточными нормы расхода в пределах от 0,001 до 10 кг/га, предпочтительно 0,01-3 кг/га, прежде всего 0,01-0,5 кг/га.

Для расширения спектра действия и достижения синергистического эффекта соединения общей формулы I можно смешивать с различными представителями других групп действующих веществ, обладающих гербицидными и регулирующими рост свойствами, и проводить обработку совместно с ними. В качестве компонентов для таких смесей могут служить, например, диазины, производные 4Н-3,1-бензоксазина, бензотиадиазиноны, 2,6-динитроанилины, N-фенилкарбаматы, тиолкарбаматы, галоген-карбоновые кислоты, триазины, амиды, мочевины, простые дифениловые эфиры, триазины, урацилы, производные бензофурана, производные циклогексан-1,3-диона, имеющие в положении 2, например, карбоксильную группу или карбиминогруппу, производные хинолинкарбоновой кислоты, имидазолиноны, сульфонамиды, сульфонил-мочевины, арилокси-, соответственно гетероарилоксифеноксипропионовые кислоты, а также их соли, эфиры и амиды и другие вещества.

Кроме того, соединения формулы I без добавок либо в комбинации с другими гербицидами можно использовать также в смеси с другими средствами защиты растений, например со средствами борьбы с вредителями или фитопатогенными грибами и бактериями. Интерес может пред-

ставить также возможность приготовления смесей с растворами минеральных солей, которые используют для компенсации недостатка питательных веществ и микроэлементов. Наряду с этим могут вводиться добавки нефитотоксичных масел и масляных концентратов.

Примеры по синтезированию

Синтез соединений общей формулы VI.

Пример 1. Метилловый эфир 3-метокси-3-(3-метоксифенил)-2-гидроксимасляной кислоты

19,5 г (88 ммоль) метилового эфира 3-(3-метоксифенил)-2,3-эпоксимасляной кислоты растворяют в 200 мл абсолютного метанола и смешивают с 0,1 мл эфира трихлористого бора. Затем перемешивают в течение 12 ч. при комнатной температуре и отгоняют растворитель. Остаток растворяют в уксусном эфире, промывают раствором бикарбоната натрия и водой и сушат над сульфатом натрия. После отгонки растворителя получают 21,1 г бледно-желтого масла. Выход: 94% (смесь диастереомеров 1:1).

Пример 2. Метилловый эфир 3-бензилокси-3-фенил-2-гидроксимасляной кислоты

9,6 г (50 ммоль) метилового эфира 3-фенил-2,3-эпоксимасляной кислоты растворяют в 150 мл бензилового спирта и смешивают с 0,5 мл концентрированной серной кислоты. Затем перемешивают в течение 6 ч. при 50°C и охлаждают до комнатной температуры. После нейтрализации раствором бикарбоната натрия отгоняют избыточный бензиловый спирт под высоким вакуумом и очищают остаток посредством быстрой хроматографии на кизельгеле с помощью системы растворителей *n*-гексан/уксусный эфир 9:1. После отгонки растворителя получают 6,5 г бесцветного масла. Выход: 43% (смесь диастереомеров 3:2).

Аналогично получали все представленные в табл. 2 соединения (см. в конце описания).

Синтез соединений общей формулы I

Пример 3. Метилловый эфир 3-бензилокси-3-фенил-2-(4,6-диметоксипиримидин-2-ил)оксимасляной кислоты

3 г (10 ммоль) метилового эфира 3-бензилокси-3-фенил-2-гидроксимасляной кислоты (соединение 1.1) растворяют в 40 мл диметилформамида и смешивают с 0,3 г (12 ммоль) гидроксида натрия. Затем перемешивают в течение 1 ч., после чего добавляют 2,2 г (10 ммоль) 4,6-диметокси-2-метилсульфонилпиримидина. После перемешивания в течение 24 ч. при комнатной температуре осторожно гидролизуют 10 мл воды, с помощью уксусной кислоты устанавливают значение pH 5 и растворитель отгоняют под высоким вакуумом. Остаток растворяют в 100 мл уксусного эфира, промывают водой, сушат над сульфатом натрия и растворитель удаляют отгонкой. Остаток смешивают с 10 мл метил-трет.-бутилового эфира и образовавшийся осадок отсасывают. После сушки получают 2,4 г белого порошка.

Выход: 55% (смесь диастереомеров 1:1).

$T_{\text{тек}}$ 115-117°C.

Пример 4. 3-бензилокси-3-фенил-2-(4,6-диметоксипиримидин-2-ил)оксимасляная кислота

1,4 г (3 ммоль) метилового эфира 3-бензилокси-3-фенил-2-(4,6-диметоксипиримидин-2-ил)-оксимасляной кислоты (пример 3) растворяют в 20 мл метанола и 20 мл тетрагидрофурана и

смешивают с 3,7 г 10%-ного раствора NaOH. Затем перемешивают в течение 6 ч. при 60°C и в течение 12 ч. при комнатной температуре, после чего растворитель удаляют в вакууме и остаток растворяют в 100 мл воды с получением водного раствора натриевой соли (R-COONa), далее, для удаления непрореагировавшего эфира экстрагируют с помощью уксусного эфира. Затем водную фазу устанавливают с помощью разбавленной соляной кислоты на pH 1-2 и экстрагируют целевой продукт (R-COOH) с помощью уксусного эфира. После сушки над сульфатом магния и отгонки растворителя остаток смешивают с небольшим количеством ацетона и образовавшийся осадок отсасывают. После сушки получают 1,2 г белого порошка. Выход: 88%.

$T_{\text{тек}}$ 165°C (разложение, смесь диастереомеров 3:2).

Пример 5. Метилловый эфир 3-бензилокси-3-фенил-2-[(4,6-диметоксипиримидин-2-ил) тию]-масляной кислоты

11 г (25 ммоль) метилового эфира 3-бензилокси-3-фенил-2-гидроксимасляной кислоты (соединение 1.1) растворяют в 50 мл дихлорметана, затем добавляют 3 г (30 ммоль) триэтиламина и при перемешивании добавляют по каплям еще 3,2 г (28 ммоль) хлорида метансульфокислоты. Затем перемешивают в течение 2 ч. при комнатной температуре, промывают водой, сушат над сульфатом магния и концентрируют в вакууме. Остаток растворяют в ДМФА и при температуре 0°C по каплям добавляют в суспензию из 12,9 г (75 ммоль) 4,6-диметоксипиримидин-2-тиола и 8,4 г (100 ммоль) гидрокарбоната натрия в 100 мл ДМФА. После перемешивания в течение 2 ч. при комнатной температуре и последующего перемешивания еще в течение 2 ч. при 60°C сливают в 1 л ледяной воды и отсасывают образовавшийся осадок.

После сушки получают 3,2 г белого порошка. Выход: 29% (смесь диастереомеров 1:1).

Аналогичным путем, как это описано в приведенных примерах, получали соединения, представленные в табл. 3 (см. в конце описания).

Примеры по применению

Гербицидное действие производных 3-(гет)арилкарбоновой кислоты общей формулы I подтверждают результаты опытов, проводившихся в теплице.

В качестве вегетационных сосудов служили пластиковые цветочные горшочки с почвой типа песчаные на суглинках, содержащей примерно 3% гумуса в качестве субстрата. Семена опытных растений высевали отдельно по видам.

При предвсходовой обработке непосредственно после посева проводили мелкокапельное опрыскивание суспендированными либо эмульгированными в воде действующими веществами с помощью соответствующих сопел. Сосуды подвергали легкому дождеванию с тем, чтобы благоприятствовать прорастанию и развитию растений, после чего вегетационные сосуды накрывали прозрачными пластиковыми крышками, пока растения не пошли в рост. Благодаря таким крышкам обеспечиваются условия для равномерного прорастания опытных растений, поскольку таким образом нейтрализуется воздействие активных веществ.

При проведении послевсходовой обработки опытные растения в зависимости от их экстерьера обрабатывали суспендированными либо эмульгированными в воде действующими веществами лишь по достижении ими высоты порядка 3-15 см. С этой целью опытные растения либо непосредственно высевали и выращивают в тех же самых сосудах, либо их сначала выращивают по отдельности до появления проростков и за несколько дней до обработки пересаживают в опытные сосуды. При проведении послевсходовой обработки активные вещества (а.в.) применяют в количестве 0,125, соответственно 0,06 кг/га. Растения выдерживали отдельно по видам при температурах в диапазоне от 10 до 25°C, соответственно от 20 до 35°C. Опыты продолжались в течение 2-4 недель.

В течение всего этого периода времени за растениями вели тщательный уход и фиксировали их реакцию после каждой проведенной обработки. Оценку производили по шкале значений от 0 до 100. При этом показатель 100 означает, что растения не взошли, т.е. имеет место полное разрушение по крайней мере их надземных частей, а 0 означает, что повреждения отсутствуют и наблюдается нормальный процесс роста.

Обобщенные в таблицах 4-8 данные свидетельствуют о высокой гербицидной активности предложенных соединений. Кроме того, таблица 5 иллюстрирует избирательное воздействие соединения 2.16 на рис, а таблица 6 - избирательное воздействие соединения 2.52 на яровую пшеницу.

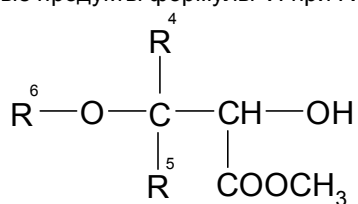
Таблица 1

R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ²	R ³	X	Y	Z
ОН	Фенил	Метил	Метил	OCH ₃	OCH ₃	CH	S	S
ОН	Фенил	Метил	Метил	OCH ₃	OCH ₃	CH	O	S
OCH ₃	Фенил	Метил	Метил	OCH ₃	OCH ₃	CH	S	S
ОН	Фенил	Изо-пропил	Метил	OCH ₃	OCH ₃	CH	O	O
OCH ₃	2-фторфенил	Этил	Метил	OCH ₃	OCH ₃	CH	O	O
OC ₂ H ₅	3-хлорфенил	Пропил	Метил	OCH ₃	OCH ₃	N	O	O
ONCH ₃) ₂	4-бромфенил	Изо-пропил	Метил	CF ₃	CF ₃	CH	S	O
ON=C(CH ₃) ₂	2-тиенил	Метил	Метил	OCF ₃	OCF ₃	CH	O	S
HNSO ₂ C ₆ H ₅	3-тиенил	Метил	Метил	CH ₃	CH ₃	CH	O	O
NHфенил	2-фурил	Метил	Метил	Cl	Cl	CH	O	O
ONa	3-фурил	Метил	Метил	OCH ₃	-O-CH ₂ -CH ₂ -	S	O	
O-CH ₂ -C≡CH	Фенил	Этил	Этил	OCH ₃	CF ₃	CH	O	O
ОН	Фенил	Пропил	Пропил	OCH ₃	OCF ₃	CH	O	S
OCH ₃	Фенил	Изо-пропил	Изо-пропил	OCH ₃	CH ₃	CH	O	O
OC ₂ H ₅	Фенил	Метил	Втор-бутил	OCH ₃	Cl	CH	S	O
ON(CH ₃) ₂	2-метилфенил	Метил	Метил	OCH ₃	OCH ₃	CH	O	O
ON(CH ₃) ₂	3-метоксифенил	Метил	Метил	OCH ₃	OCH ₃	CH	O	O
ON=C(CH ₃) ₂	4-нитрофенил	Метил	Метил	OCH ₃	OCH ₃	CH	O	O
NHфенил	2-оксазолил	Метил	Метил	CF ₃	CF ₃	N	S	O
ONa	4-оксазолил	Метил	Пропен-3-ил	OCF ₃	OCF ₃	N	O	S
O-CH ₂ -C≡CH	5-оксазолил	Метил	Пропин-3-ил	CH ₃	CH ₃	N	O	O
ОН	3-изоксазолил	Метил	Циклопентил	Cl	Cl	N	O	O
OCH ₃	4-изоксазолил	Метил	Циклогексил	OCH ₃	-O-CH ₂ -CH ₂ -	O	O	
OC ₂ H ₅	5-изоксазолил	Метил	Циклопропилметил	OCH ₃	CF ₃	N	S	O
ON(CH ₃) ₂	Фенил	Метил	1-фенилпропил-3-ил	OCH ₃	OCF ₃	N	O	S
ON=C(CH ₃) ₂	2-гидроксифенил	Метил	Метил	OCH ₃	CH ₃	N	O	O

ONSO ₂ C ₆ H ₅	3-трифторметил-фенил	Метил	Метил	OCH ₃	Cl	N	O	O
NHфенил	4 –диметиламино-фенил	Метил	Метил	OCH ₃	OCH ₃	CH	S	O
ONa	2-имидазолил	Этил	Метил	OCH ₃	OCH ₃	CH	S	S
O-CH ₂ -C≡CH	4-имидазолил	Пропил	Метил	OCH ₃	OCH ₃	N	S	S
OH	3-пиразолил	Изо-пропил	Метил	CF ₃	CF ₃	CH	O	S
OCH ₃	4-пиразолил	Метил	Метил	OCF ₃	OCF ₃	CH	O	O
OC ₂ H ₅	Фенил	Метил	Трифторэтил	CH ₃	CH ₃	CH	O	O
ON(CH ₃) ₂	Фенил	Метил	Бензил	Cl	Cl	CH	O	O
ON(CH ₃) ₂	Фенил	Метил	2-метоксиэтил	OCH ₃	-O-CH ₂ -CH ₂ -	S	O	
ON=C(CH ₃) ₂	Фенил	Метил	3-метоксикарбонил-пропил	OCH ₃	CF ₃	N	S	S
NH-фенил	2-пиридил	Метил	2-хлорэтил	OCH ₃	OCF ₃	N	S	S
ONa	3-пиридил	Метил	Метил	OCH ₃	CH ₃	N	O	O
O-CH ₂ -C≡CH	4-пиридил	Метил	Метил	OCH ₃	Cl	N	O	O

Таблица 2

Промежуточные продукты формулы VI при R¹, обозначающих OCH₃

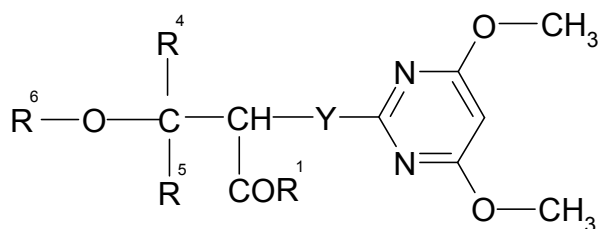


№	R ⁶	R ⁴	R ⁵	СИ*	T _{тек} [°C]
1.1	Метил	3-метоксифенил	Метил	1:1	Масло
1.2	Бензил	Фенил	Метил	3:2	Масло
1.3	Метил	2-фторфенил	Метил	1:1	Масло
1.4	Метил	4-изо-пропилфенил	Метил		
1.5	Метил	2-метилфенил	Метил	2:1	Масло
1.6	Метил	3-метилфенил	Метил		
1.7	Метил	4-метилфенил	Метил	3:2	Масло
1.8	Метил	3-нитрофенил	Метил		
1.9	Метил	4-бромфенил	Метил	3:1	Масло
1.10	Метил	2-фурил	Метил		
1.11	Метил	3-фурил	Метил		
1.12	Метил	2-тиенил	Метил		
1.13	Метил	3-тиенил	Метил		
1.14	Метил	2-пиридил	Метил		
1.15	Метил	3-пиридил	Метил		
1.16	Метил	4-пиридил	Метил		
1.17	Метил	2-тиазолил	Метил		

1.18	Метил	3-изоксазолил	Метил		
1.19	Метил	4-имидазолил	Метил		
1.20	Метил	2-пиразолил	Метил		
1.21	Метил	4-хлорфенил	Метил	2:1	Масло
1.22	Бензил	3-метилфенил	Метил	1:1	Масло
1.23	Метил	4-фторфенил	Метил	1:1	Масло
1.24	Бензил	4-бромфенил	Метил	1:1	Масло
1.25	Бензил	4-хлорфенил	Метил	3:2	Масло
1.26	Бензил	4-фторфенил	Метил	1:1	Масло
1.27	Метил	Фенил	Этил	1:1	Масло
1.28	Метил	3-нитрофенил	Метил	2:1	Масло
1.29	Этил	4-метилфенил	Метил	1:1	Масло
1.30	Бензил	4-метилфенил	Метил	1:1	Масло
1.31	Бензил	Фенил	Этил	1:0	Масло
1.32	4-фторбензил	Фенил	Метил	1:1	Масло

* Соотношение диастереомеров

Таблица 3



№	R ⁶	R ⁴	R ⁵	Y	R ¹	Диастерео- меры	T _{тек} [°C]
2.1	Бензил	Фенил	Метил	O	OCH ₃	1:1	115-117
2.2	Бензил	Фенил	Метил	O	OH	3:2	165 (разлож.)
2.3	Бензил	Фенил	Метил	S	OCH ₃	1:1	
2.4	Бензил	Фенил	Метил	S	OH		
2.5	Метил	2-фторфенил	Метил	O	OCH ₃	1:1	126-128
2.6	Метил	2-фторфенил	Метил	O	OH	2:1	185-186
2.7	Метил	3-метоксифенил	Метил	O	OCH ₃	1:0 (5:1)	131-132 (93-95)
2.8	Метил	3-метоксифенил	Метил	O	OH	1:0	187-189
2.9	Метил	4-изо-пропилфенил	Метил	O	OCH ₃		
2.10	Метил	4-изо-пропилфенил	Метил	O	OH		
2.11	Метил	2-метилфенил	Метил	O	OCH ₃	3:1	122-124
2.12	Метил	2-метилфенил	Метил	O	OH	1:1	135-137
2.13	Метил	3-метилфенил	Метил	O	OCH ₃	1:1	105-110
2.14	Метил	3-метилфенил	Метил	O	OH	1:1	130-132
2.15	Метил	4-метилфенил	Метил	O	OCH ₃	1:1	99-102
2.16	Метил	4-метилфенил	Метил	O	OH	1:1	145-147

2.17	Метил	4-бромфенил	Метил	O	OCH ₃	1:0	148-150
2.18	Метил	4-бромфенил	Метил	O	OH	1:0	189-190
2.19	Метил	2-фурил	Метил	O	OCH ₃		
2.20	Метил	2-фурил	Метил	O	OH		
2.21	Метил	3-фурил	Метил	O	OCH ₃		
2.22	Метил	3-фурил	Метил	O	OH		
2.23	Метил	2-тиенил	Метил	O	OCH ₃		
2.24	Метил	2-тиенил	Метил	O	OH		
2.25	Метил	2-пиридил	Метил	O	OCH ₃	2:1	Масло
2.26	Метил	2-пиридил	Метил	O	ONa		175-176
2.27	Метил	3-пиридил	Метил	O	OCH ₃		
2.28	Метил	3-пиридил	Метил	O	OH		
2.29	Метил	4-пиридил	Метил	O	OCH ₃		
2.30	Метил	4-пиридил	Метил	O	OH		
2.31	Метил	3-хлорфенил	Метил	O	OCH ₃		
2.32	Метил	3-хлорфенил	Метил	O	OH		
2.33	Метил	2-тиазолил	Метил	O	OCH ₃		
2.34	Метил	2-тиазолил	Метил	O	OH		
2.35	Метил	3-изоксазолил	Метил	O	OCH ₃		
2.36	Метил	3-изоксазолил	Метил	O	OH		
2.37	Метил	4-имидазолил	Метил	O	OCH ₃		
2.38	Метил	4-имидазолил	Метил	O	OH		
2.39	Метил	2-пиразолил	Метил	O	OCH ₃		
2.40	Метил	2-пиразолил	Метил	O	OH		
2.41	Бензил	4-хлорфенил	Метил	O	OCH ₃	1:1	112-114
2.42	Бензил	4-хлорфенил	Метил	O	OH		
2.43	Изо-пропил	2-фторфенил	Метил	O	OCH ₃	4:1	115-120
2.44	Изо-пропил	2-фторфенил	Метил	O	OH	2:1	143-145
2.45	Метил	4-фторфенил	Метил	O	OCH ₃	1:1	122-125
2.46	Метил	4-фторфенил	Метил	O	OH	3:1	170-172
2.47	Бензил	3-метилфенил	Метил	O	OCH ₃	1:1	94-95
2.48	Бензил	3-метилфенил	Метил	O	OH	1:1	154-156
2.49	Метил	4-хлорфенил	Метил	O	OCH ₃	1:1	125-127
2.50	Метил	4-хлорфенил	Метил	O	OH	5:1	206-207
2.51	Метил	Фенил	Этил	O	OCH ₃	1:0	95-100
2.52	Метил	Фенил	Этил	O	OH	1:0	140-142
2.53	Бензил	4-фторфенил	Метил	O	OCH ₃	1:1	95-98
2.54	Бензил	4-фторфенил	Метил	O	OH	4:1	153-154
2.55	4-фторбензил	Фенил	Метил	O	OCH ₃	1:0	152-153
2.56	4-фторбензил	Фенил	Метил	O	OH	7:3	160-162
2.57	4-бромбензил	Фенил	Метил	O	OCH ₃	9:1	158-160
2.58	4-бромбензил	Фенил	Метил	O	OH	1:0	203-204

2.59	Бензил	2-фторфенил	Метил	O	OCH ₃	1:0	129-130
2.60	Бензил	2-фторфенил	Метил	O	OH	1:0	200-201
2.61	Бензил	4-бромфенил	Метил	O	OCH ₃	1:1	78-79
2.62	Бензил	4-бромфенил	Метил	O	OH	1:1	156-158
2.63	Бензил	4-метилфенил	Метил	O	OCH ₃	1:1	Масло
2.64	Бензил	4-метилфенил	Метил	O	OH	4:1	158-159
2.65	Бензил	Фенил	Этил	O	OCH ₃	1:0	110-112
2.66	Бензил	Фенил	Этил	O	OH	1:0	92-93
2.67	Этил	4 -метилфенил	Метил	O	OCH ₃	1:0	117-119
2.68	Этил	4 -метилфенил	Метил	O	OH	1:1	Масло
2.69	Метил	2-фурил	H	O	OCH ₃	1:1	Масло
2.70	Метил	2-фурил	H	O	OH	1:1	Масло
2.71	4-хлорбензил	Фенил	Метил	O	OCH ₃	1:0	172-174
2.72	4-хлорбензил	Фенил	Метил	O	OH	1:0	60-61
2.73	2-бутил	4-бромфенил	Метил	O	OCH ₃	-	104-106
2.74	2-бутил	4-бромфенил	Метил	O	OH	1:0	153-154
2.75	н-пропил	4-фторфенил	Метил	O	OCH ₃	9:1	119-120
2.76	н-пропил	4-фторфенил	Метил	O	OH	9:1	104-105
2.77	Метил	3-нитрофенил	Метил	O	OCH ₃	1:1	101-102
2.78	Метил	3-нитрофенил	Метил	O	OH	1:1	165-172
2.79	Метил	4 -трифторфенил	Метил	O	OCH ₃	1:0	112-113
2.80	Метил	4 -трифторфенил	Метил	O	OH	4:1	68-70
2.81	Метил	3-тиенил	H	O	OCH ₃	1:1	80-82
2.82	Метил	3-тиенил	H	O	OH	1:1	Масло
2.83	4-хлорбензил	Фенил	Метил	O	OCH ₃	0:1	112-113
2.84	4-хлорбензил	Фенил	Метил	O	OCH ₃	0:1	60-61
2.85	Метил	Фенил	Этил	O	OCH ₃	1:3	125-130
2.86	Метил	Фенил	Этил	O	OH	0:1	133-135
2.87	Бензил	3-метоксифенил	Метил	O	OCH ₃	3:1	86-87
2.88	Бензил	3 -метоксифенил	Метил	O	OH	1:0	155
2.89	Бензил	3 -метоксифенил	Метил	O	OH	0:1	138-140
2.90	2-фенилэтил	Фенил	Метил	O	OH	1:0	147-149
2.91	Метил	3-фурил	H	O	OCH ₃	1:1	Масло
2.92	Метил	3-фурил	H	O	OH	1:1	131-135
2.93	3-CF ₃ -бензил	Фенил	Метил	O	OCH ₃	2:1	151-152
2.94	3-CF ₃ -бензил	Фенил	Метил	O	OH	1:1	Масло
2.95	2-фторбензол	Фенил	Метил	O	OCH ₃	2:1	170-173
2.96	2-фторбензол	Фенил	Метил	O	OH	1:0	160-162
2.97	2-фторбензол	Фенил	Метил	O	OH	1:3	138-141
2.98	3-фторбензил	Фенил	Метил	O	OCH ₃	1:1	81-86

2.99	3-фторбензил	Фенил	Метил	O	OH	4:1	195-197
2.100	3-фторбензил	Фенил	Метил	O	ONa	3:1	250-260
2.101	4-фторбензил	Фенил	Метил	O	OCH ₃	1:1	112-115
2.102	4-фторбензил	Фенил	Метил	O	OH		

В опытах использовали растения следующих видов:

Латинское название	Русское название	Сокращенное название
<i>Gossypium hirsutum</i>	Хлопчатник	GOSHI
<i>Oryza sativa</i>	Рис	ORYSA
<i>Triticum aestivum</i>	Яровая пшеница	TRZAS
<i>Alopecurus myosyroides</i>	Лисохвост полевой	ALOMY
<i>Amaranthus retroflexus</i>	Щирица запрокинутая	AMARE
<i>Brachiaria platyphylla</i>	Ветвянка широколистная	BRAPP
<i>Chenopodium album</i>	Марь белая	CHEAL
<i>Sesbania exaltata</i>	-	SEBEX
<i>Setaria faberii</i>	Щетинник большой	SETFA
<i>Setaria viridis</i>	Щетинник зеленый	SETVI
<i>Solanum nigrum</i>	Паслен черный	SOLNI
<i>Veronica spp.</i>	Различные виды вероники	VERSS

Обобщенные в таблице А результаты проведенных опытов показывают, что соединение № 2.2 по изобретению по гербицидной эффективности превосходит вещество А, известное из европейской заявки EP-A 409368, и обладает по сравнению с ним более совершенной избирательностью действия.

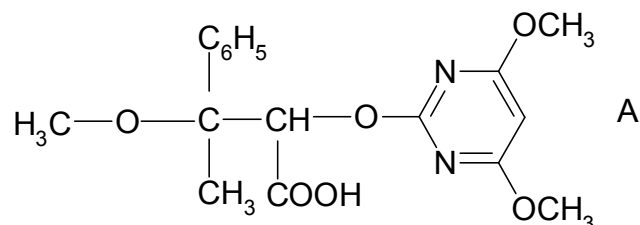
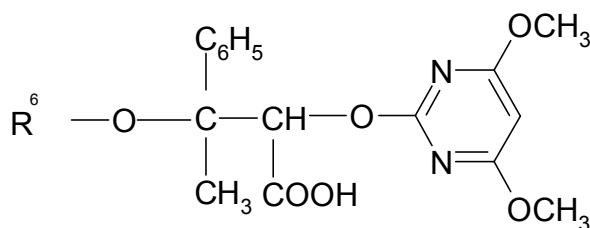


Таблица А

Примеры борьбы с нежелательными растениями и избирательности действия в культуре хлопчатника при послевсходовой обработке в теплице с нормой расхода 0,125, соответственно 0,06 кг а.в./га



R ⁶	Бензил		CH ₃	
Пример №	2.2		А	
Опытные растения	Повреждение %		Повреждение %	
	0,125 кг/га	0,06 кг/га	0,125 кг/га	0,06кг/га
GOSHI	10	5	35	20
SETFA	100	100	75	70
SETVI	100	98	80	60
AMARE	98	98	100	75
SOLNI	100	100	98	90

Соединения №№ 2.84, 2.16, 2.52, 2.86 и 2.25 показали при нормах расхода от 5 кг/га до 0,25 кг/га высокую гербицидную эффективность. При этом соединения №№ 2.84 и 2.16 показали одновременно очень хорошую избирательность в культуре хлопчатника. Кроме того, в примере

2.16 отмечалась также хорошая избирательность действия в культуре риса. В примере 2.52 была выявлена хорошая совместимость яровой пшеницы.

Испытания предложенных соединений проводили в соответствии с методиками, приведенными выше.

В поставленных в теплице опытах использовали растения следующих видов:

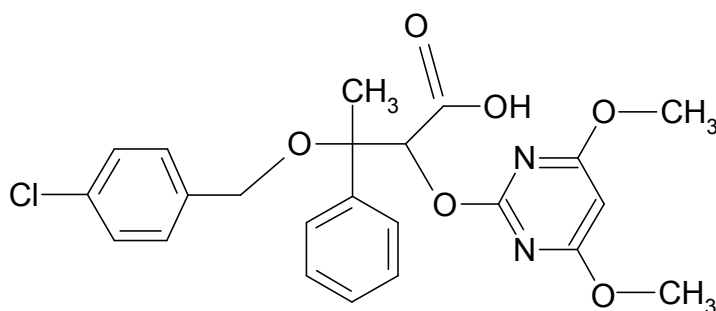
Латинское название	Русское название	Сокращенное название
<i>Gossypium hirsutum</i>	Хлопчатник	GOSHI
<i>Oryza sativa</i>	Рис	ORYSA
<i>Triticum aestivum</i>	Яровая пшеница	TRZAS
<i>Alopecurus myosyroides</i>	Лисохвост полевой	ALOMY
<i>Amaranthus retroflexus</i>	Щирица запрокинутая	AMARE
<i>Brachiaria platyphylla</i>	Ветвянка широколистная	BRAPP
<i>Chenopodium album</i>	Марь белая	CHEAL
<i>Sesbania exaltata</i>	Вид конопли	SEBEX
<i>Setaria faberii</i>	Щетинник большой	SETFA
<i>Veronica spp.</i>	Различные виды вероники	VERSS
<i>Setaria viridis</i>	Щетинник зеленый	SETVI

Обобщенные в таблицах 1-3 данные свидетельствуют о высокой гербицидной активности предложенных соединений. Кроме того, таблица 5 иллюстрирует избирательное воздействие со-

единения 2.16 на рис, а таблица 6 - избирательное воздействие соединения 2.52 на яровую пшеницу.

Таблица 4

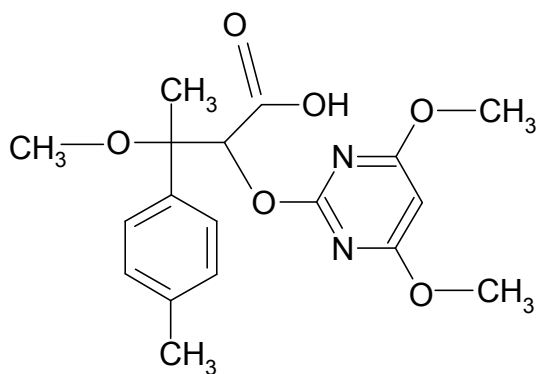
Гербицидная активность и избирательность действия при послевсходовой обработке в теплице



Пример №	2.84	
Норма расхода, кг а.в./га	0.25	0.125
Опытные растения	Повреждение, в %	
ORYSA	25	25
GOSHI	15	0
SETVI	100	100
AMARE	98	90
SHEAL	95	90

Таблица 5

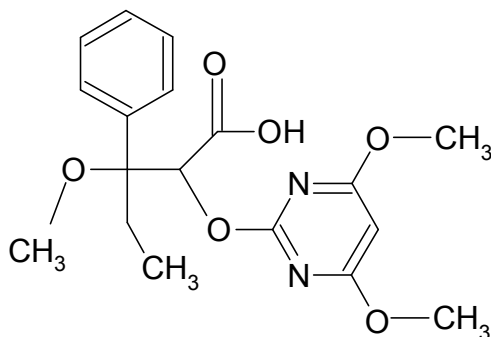
Гербицидная активность и избирательность действия при послевсходовой обработке в теплице



Пример №	2.16
Норма расхода, кг а.в./га	0.25
Опытные растения	Повреждение, в %
ORYSA	10
ALOMY	85
SEBEX	100
VERSS	95

Таблица 6

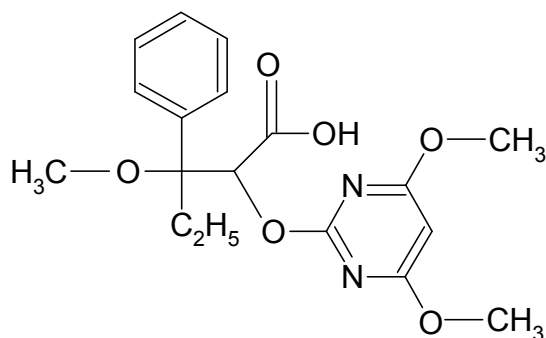
Гербицидная активность и избирательность действия при послевсходовой обработке в теплице



Пример №	2.52	
Норма расхода, кг а.в./га	0.5	0.25
Опытные растения	Повреждение, в %	
TRZAS	30	20
ALOMY	90	90
BRAPP	98	90
SETFA	80	75

Таблица 7

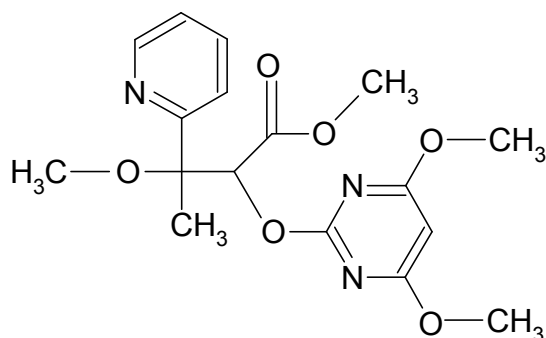
Гербицидная активность и избирательность действия при послевсходовой обработке в теплице



Пример №	2.86	
Норма расхода, кг а.в./га	0.5	0.25
Опытные растения	Повреждение, в %	
BRAPP	98	95
SETFA	95	95
AMARE	95	90
CHEAL	70	60

Таблица 8

Гербицидная активность и избирательность действия при послевсходовой обработке в теплице



Пример №	2.25	
Норма расхода, кг а.в./га	0.5	0.25
Опытные растения	Повреждение, в %	
BRAPP	98	98
SETFA	95	85
AMARE	85	85
CHEAL	98	90

ДП "Український інститут промислової власності" (Укрпатент)
Україна, 01133, Київ-133, бульв. Лесі Українки, 26
(044) 295-81-42, 295-61-97

Підписано до друку _____ 2001 р. Формат 60х84 1/8.
Обсяг _____ обл.-вид. арк. Тираж 50 прим. Зам. _____

УкрІНТЕІ, 03680, Київ-39 МСП, вул. Горького, 180.
(044) 268-25-22
