



УКРАЇНА

(19) UA (11) 26890 (13) C1

(51)6 C 07 D 239/34; A 01 N 43/54

ДЕРЖАВНЕ
ПАТЕНТНЕ
ВІДОМСТВООПИС ДО ПАТЕНТУ
НА ВІНАХІД(54) ПІРИМІДИНОВІ ПОХІДНІ, ЦО МАЮТЬ ГЕРБІЦИДНУ АКТИВНІСТЬ, СПОСІБ ЇХ ОТРИ-
МАННЯ, ГЕРБІЦИДНА КОМПОЗИЦІЯ І СПОСІБ ЗНИЩЕННЯ БУР'ЯНІВ

1

2

(20) 93002148, 30.07.93

(21) 4613101/SU

(22) 21.12.88

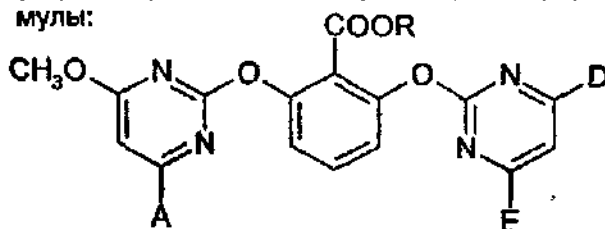
(24) 29.12.99

(31) 324964

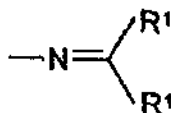
(32) 22.12.87

(33) JP

(46) 29.12.99. Бюл. № 8

(56) 1. Патент США № 4248619,
кл. A 01 N 43/54, 1981.2. Патент США № 4427437,
кл. A 01 N 5/00, 1984.3. Патент Франції № 2446597,
кл. A 01 N 9/12, 1980.(72) Нобухіде Вада (JP), Содзі Кусано (JP),
Ясухумі Тойокава (JP)(73) КУМІАЙ КЕМІКАЛ ІНДАСТРІ КО., ЛТД
(JP), ІХАРА КЕМІКАЛ ІНДАСТРІ КО., ЛТД
(JP)(57) 1. Пиримидиновые производные фор-
мулы:

в которой R представляет собой атом во-
дорода, группу $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_n\text{R}'$, где R'
является метильной или этильной груп-
пой, а n является целым числом от 0 до
2 или



где R' является метильной, этильной или
пропильной группой, A представляет со-
бой атом хлора или метоксильную группу,
D и E, одинаковые или различные, предс-
тавляют собой атом водорода, хлора, ме-

тильную группу, метокси- или этоксигруп-
пу, диформетоксигруппу, или их соли,
обладающие гербицидной активностью.

2. Пиримидиновые производные по п.1,
в которых D и E, одинаковые или различ-
ные, представляют собой атом водорода,
метокси- или этоксигруппу, или его соль.

3. Пиримидиновые производные по п.2,
в которых D и E, одинаковые или различ-
ные, представляют собой атом водорода
или метоксигруппу, или его соль.

4. Пиримидиновые производные по п.1,
в которых A представляет собой меток-
сигруппу, а D и E представляют собой
метоксигруппу, или его соль.

5. Пиримидиновые производные по лю-
бому из пп.1-4, в которых R представляет
собой атом водорода, или его соль.

6. Пиримидиновые производные по лю-
бому из пп.1-4, в которых R представляет
собой группу $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_3$,
 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SOCH}_2\text{CH}_3$ или $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SO}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$,
или его соль.

7. Пиримидиновые производные по лю-
бому из пп.1-6, в которых солью является
соль щелочного металла, щелочноземель-
ного металла, переходного металла, ор-
ганического амина или аммония.

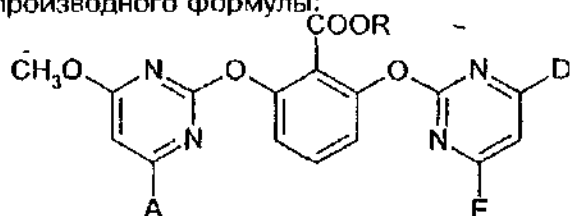
8. Пиримидиновые производные по лю-
бому из пп.1-6, в которых солью является
соль триэтаноламина, аммония, натрия,
калия или кальция.

9. Пиримидиновое производное по п.1,
выбранном из ряда: 2,6-бис[(4,6-диметок-
сипиримидин-2-ил)окси]бензойная кисло-
та, 2,6-бис[(4,6-диметоксипиримидин-2-
ил)окси]бензоат изопропиламмония, 2,6-
бис[(4,6-диметоксипиримидин-2-ил)окси]
бензоат натрия, 2,6-бис[(4,6-диметоксипи-
римидин-2-ил)окси]бензоат трис-(2-
оксиэтил)аммония, 2,6-бис[(4,6-диметокси-
пиримидин-2-ил)окси]бензоат бис-(2-

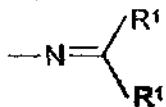
(19) UA (11) 26890 (13) C1

гидроксиэтил)аммония, бис-(2,6-бис[(4,6-диметоксипиримидин-2-ил)окси]бензоат) кальция, 2,6-бис[(4,6-диметоксипиримидин-2-ил)окси]бензоат аммония.

10. Гербицидная композиция, содержащая активное начало и сельскохозяйственно приемлемые носитель и разбавитель, отличающаяся тем, что в качестве активного начала она содержит от 0,5 до 95 мас % пиримидинового производного формулы:

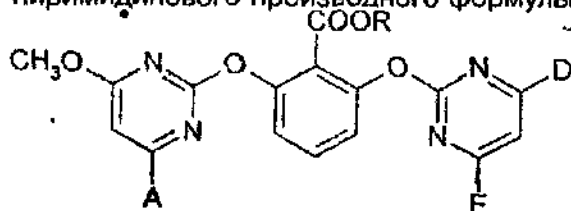


в которой R представляет собой атом водорода, группу $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_n\text{R}^1$, где R^1 является метильной или этильной группой, а n является целым числом от 0 до 2 или

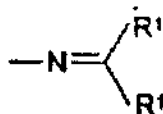


где R^1 является метильной, этильной или пропильной группой, A представляет собой атом хлора или метоксильную группу, D и E, одинаковые или различные, представляют собой атом водорода, хлора, метильную группу, метокси- или этокси-группу, диформетоксигруппу, или его соль, и остальное – сельскохозяйственно приемлемые добавки.

11. Способ уничтожения сорняков путем нанесения гербицидной композиции на очаг заражения, отличающийся тем, что наносят гербицидную композицию, содержащую от 0,5 до 95 мас.% пиримидинового производного формулы:



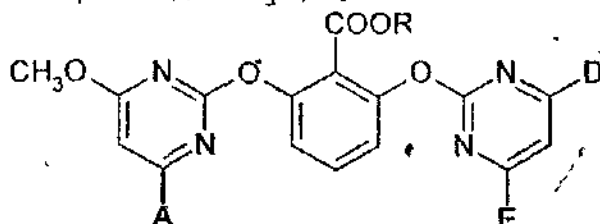
в которой R представляет собой атом водорода, группу $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_n\text{R}^1$, где R^1 является метильной или этильной группой, а n является целым числом от 0 до 2 или



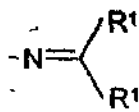
где R^1 является метильной, этильной или пропильной группой, A представляет со-

бой атом хлора или метоксильную группу, D и E, одинаковые или различные, представляют собой атом водорода, хлора, метильную группу, метокси- или этокси-группу, диформетоксигруппу, или его соль, и остальное – сельскохозяйственно приемлемые добавки, из расчета от 0,1 г до 1 кг пиримидинового производного или его соли на 10 ар.

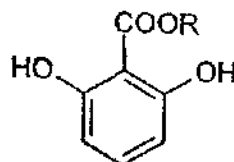
12. Способ получения пиримидинового производного формулы:



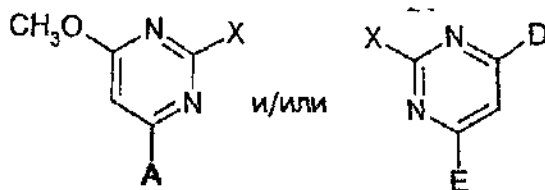
в которой R представляет собой атом водорода, группу $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_n\text{R}^1$, где R^1 является метильной или этильной группой, а n является целым числом от 0 до 2 или



где R^1 является метильной, этильной или пропильной группой, A представляет собой атом хлора или метоксильную группу, D и E, одинаковые или различные, представляют собой атом водорода, хлора, метильную группу, метокси- или этокси-группу, диформетоксигруппу, или его соли, отличающийся тем, что проводят взаимодействие сложного эфира 2,6-диоксисбензойной кислоты:

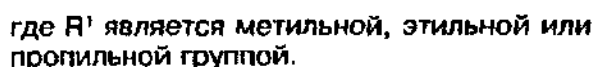
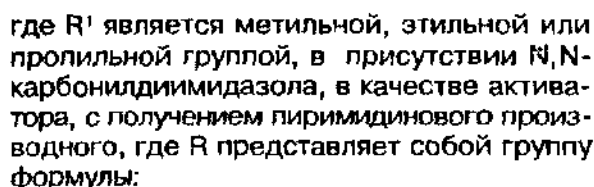


где R представляет собой бензил, 4-метоксисбензил, 2-этилтиоэтил, 2-метилтиоэтил с производным пиримидина формулы:



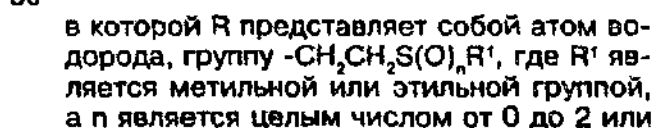
где A, D и E имеют значения, указанные выше, а X представляет собой атом галогена, алкилсульфонильную группу или бензилсульфонильную группу, в присутствии оснований, и, при необходимости:

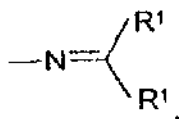
в) полученное соединение, где Я представляет собой атом водорода, подвергают взаимодействию с оксимом кетона формулы:



При сравнении соединений, представленных в Патенте США № 4248619, с

20 Настоящим изобретением предусматриваются пиримидиновые производные формулы:





где R¹ является метильной, этильной или пропильной группой,

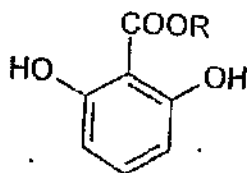
A представляет собой атом хлора или метоксильную группу,

D и E, одинаковые или различные, представляют собой атом водорода, хлора, метильную группу, метокси- или этоксигруппу, диформетоксигруппу, или его соли.

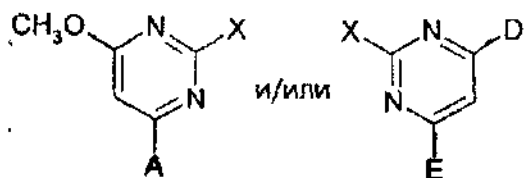
Настоящим изобретением также предусматривается гербицидная композиция, содержащая эффективное количество пиримидинового производного формулы (I) или его соли и сельскохозяйственную добавку.

Кроме того, настоящим изобретением предусматривается метод уничтожения сорняков, который состоит во внесении эффективного в гербицидном отношении количества пиримидинового производного формулы (I) или его соли в очаг заражения.

Настоящим изобретением также предусматривается способ получения пиримидинового производного формулы (I) или его соли, который включает взаимодействие сложного эфира 2,6-диоксибензойной кислоты:



где R представляет собой бензил, 4-метоксибензил, 2-этилтиозил, 2-метилтиозил с производным пиримидина формулы:



где A, D и E имеют значения, указанные выше, а X представляет собой атом галогена, алкилсульфонильную группу или бензилсульфонильную группу, в присутствии основания и, при необходимости:

а) полученное вещество подвергают гидролизу или гидрогенизации, с получением пиримидинового производного, где

5

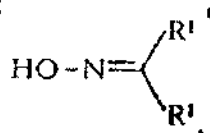
R представляет собой атом водорода, и, при необходимости, переводят полученное соединение в соль щелочного, щелочноземельного или переходного металла, органического амина или аммония,

10

б) полученное соединение, где R представляет собой 2-этилтиозил, 2-метилтиозил, подвергают окислению, с получением пиримидинового производного, где R представляет собой группу $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_n\text{R}^1$, где R¹ является метильной или этильной группой, а n = 1, 2,

15

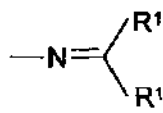
в) полученное соединение, где R представляет собой атом водорода, подвергают взаимодействию с оксимом кетона формулы:



20

где R¹ является метильной, этильной или пропильной группой, в присутствии N,N-карбонилдиимидазола, в качестве активатора, с получением пиримидинового производного, где R представляет собой группу формулы:

25



30

где R¹ является метильной, этильной или пропильной группой.

35

Далее настоящее изобретение будет детально описано со ссылкой на предпочтительные варианты осуществления этого изобретения.

40

В формуле (I) D и E, предпочтительно, одинаковые или различные, представляют собой атом водорода, метокси- или этоксигруппу.

45

Каждый из элементов D и E, одинаковые или различные, предпочтительно представляют собой атом водорода, метокси- или этоксигруппу.

50

Особое предпочтение отдается соединениям формулы (I), в которых A представляет собой метоксигруппу, а D и E представляют собой метоксигруппу.

55

В соединениях формулы (I) R предпочтительно представляет собой группу $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SOCH}_2\text{CH}_3$ или $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SO}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$. Солью пиримидинового производного формулы (I) может быть соль щелочного металла, щелочноземельного металла, соль переходного металла, органического амина или аммония. Особое предпочтение оказывается соли диэтаноламина, со-

ли аммония, соли натрия, соли калия или соли кальция.

В табл. 1 представлены типичные примеры соединений по настоящему изобретению. Номера соединений, приведенные в этой таблице, будут указываться в последующем описании изобретения.

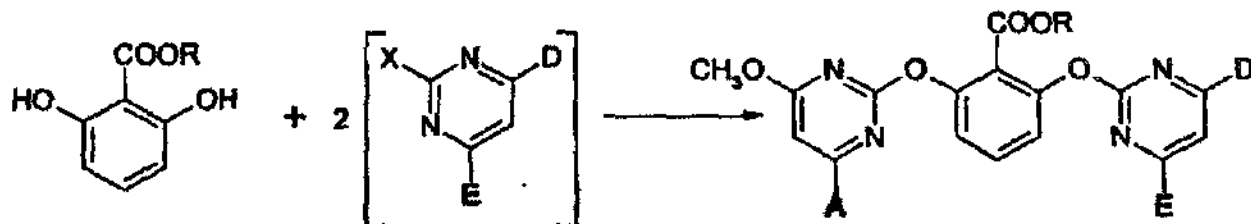
Среди соединений по настоящему изобретению, производные бензойной кислоты, в которых R представляет атом водорода, или их соли характеризуются осо-

бенно великолепным гербицидным действием.

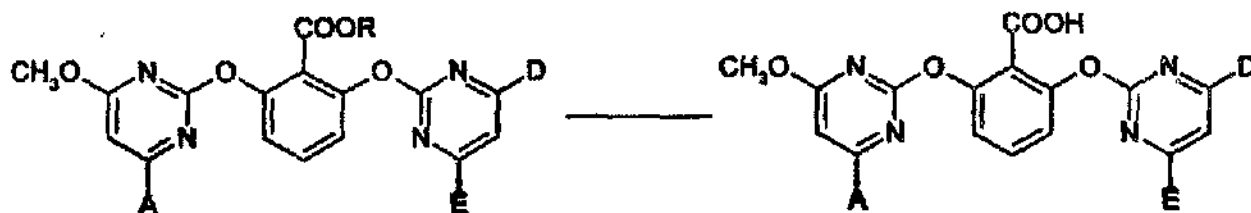
Соединения № 1, 17, 18, 19, 20, 21 и 22 превосходят остальные в том отношении, что они обладают великолепной гербицидной активностью и не проявляют значительной фитотоксичности в отношении хлебных злаков, в частности в отношении риса и пшеницы.

Соединения по настоящему изобретению можно получить в соответствии со следующим способом.

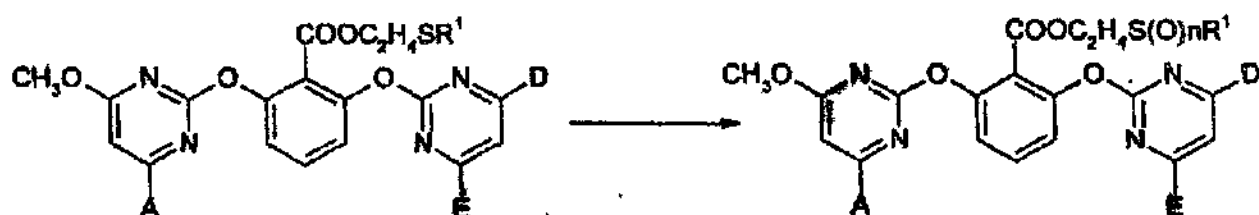
Стадия А:



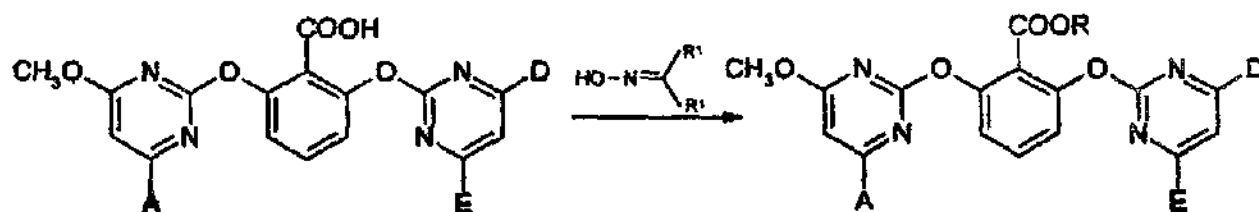
Сталія Б:



Сталія В:



Стадия Г:



Стадия А: соединение формулы (I) можно получить взаимодействием сложного эфира 2,6-доксибензойной кислоты с соединениями формулы (III), в присутст-

вию, по крайней мере, 2 эквивалентов основания в растворителе при температуре в интервале от комнатной до температуры кипения растворителя, в течение от 0,5 до

48 часов. В качестве основания можно использовать щелочной металл, такой как металлический натрий, металлический калий, гидрид щелочного металла или гидрид щелочноземельного металла, такой как гидрид калия или гидрид кальция, карбонат щелочного металла, такой как карбонат натрия или калия, либо органический амин, такой как триэтиламин или пиридин.

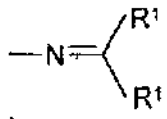
В качестве растворителя можно использовать углеводородный растворитель, такой как бензол, толуол или ксилол, галогензамещенный углеводородный растворитель, такой как метилен хлорид или хлороформ, спиртовой растворитель, такой как метанол, этанол или 2-пропанол, эфирный растворитель, такой как диизопропиловый эфир, тетрагидрофуран или диоксан, кетонный растворитель, такой как ацетон или метилэтилкетон, сложноэфирный растворитель, такой как метилацетат или этилацетат, апротонный полярный растворитель, такой как диметилформамид, диметилацетамид или диметилсульфоксид, ацетонитрил, воду или их смесь.

Молярное соотношение соединения формулы (II) и соединения формулы (III), предпочтительно составляет 1:2 соответственно.

Стадия Б: соединение формулы (I), где R представляет атом водорода, можно получить из соединения полученного на стадии А путем гидролиза или каталитическим восстановлением водородом.

Стадия В: соединение формулы (I), где R представляет собой группу $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_n\text{R}^1$, где R^1 имеет значения указанные выше, а n является целым числом равным 1 или 2, можно получить путем окисления соединения формулы (I), полученного на стадии А, где R представляет собой группу $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SR}^1$, в растворителе при помощи окислителя.

Стадия Г: соединение формулы (I), где R является



можно получить путем модификации соединения формулы (I), где R представляет атом водорода, имидазолилом или тионилхлоридом, хлорангидридом щавелевой кислоты или фосгеном, с последующим взаимодействием с оксимом диалкилкетона.

Полученную таким образом 2,6-бис[(4,6-диметоксипиримидин-2-ил)окси]бензойную кислоту можно прев-

ратить в соль щелочного металла путем взаимодействия с равным количеством бикарбоната натрия, гидроксида натрия, гидроксида калия или гидрида натрия.

Соль щелочного металла подвергают взаимодействию с хлоридом кальция, либо соответствующую бензойную кислоту подвергают взаимодействию с карбонатом кальция или гидридом кальция с образованием соли щелочноземельного металла. Соль щелочного металла далее может взаимодействовать с хлористым железом, с образованием соли переходного металла, такого как железо.

2,6-Бис[(4,6-диметоксипиримидин-2-ил)окси]бензойную кислоту, можно превратить в соль органического амина путем взаимодействия с алифатическим амином, таким как первичный, вторичный, третичный амин, диэтанолламин, триэтанолламин, алкоксиалкиламин, циклогексиламин или морфолин, или с ароматическим амином, таким как анилин или нафтиламин.

Пример 1. Получение изопропиламмоний 2,6-бис[(4,6-диметоксипиримидин-2-ил)окси]бензойной кислоты (соединение № 1).

2,0 г (3,8 ммоль) бензал-2,6-бис[(4,6-диметоксипиримидин-2-ил)окси]бензоата ($T_m = 130-132^\circ\text{C}$) растворяли в метаноле. К этому раствору добавили 0,3 г 10% палладия на угле, предварительно смоченного уксусной кислотой и метанолом. Восстанавливали водородом при атмосферном давлении. После прекращения поглощения водорода реакцию считают законченной и реакционный раствор подвергают фильтрованию. Фильтрат упаривают под вакуумом. К остатку затем добавляли этилацетат и воду, слои разделяли. Ацетатный слой промыли водой, высушили и концентрировали. Полученные таким образом кристаллы промывали гексаном, получили 1,0 г белого порошка с температурой плавления $148-150^\circ\text{C}$.

Пример 2. Получение 2,6-бис[(4,6-диметоксипиримидин-2-ил)окси]бензойной кислоты (соединение № 1).

При использовании 5,5 г (10 ммоль) 4-метоксибензил-2,6-бис[(4,6-диметоксипиримидин-2-ил)окси]бензоата (температура плавления: $82-83^\circ\text{C}$) выполняли такую же процедуру, что и в примере 1, что позволило получить 3,0 г целевого соединения в виде белого порошка с температурой плавления $148-150^\circ\text{C}$.

Пример 3. Получение 2-этилсульфенилэтил-2,6-бис[(4,6-диметоксипиримидин-2-ил)окси]бензоата (соединение № 4) 24,0 г (46,3 ммоль) 2-

этилтирзил-2,6-бис[(4,6-диметокси-пиримидин-2-ил)окси]бензоата растворителя в хлороформе. Раствор хлороформа, полученный в результате растворения 8,8 г мета-хлорпербензоата при охлаждении льдом, по каплям добавляли к первому раствору при температуре от 5 до 10°C. Эту смесь оставляли для взаимодействия при той же температуре в течение одного часа. В эту смесь добавляли водной раствор сульфата натрия, после чего от этой смеси отделяли жидкость. Органический слой промывали водным раствором бикарбоната натрия, высушивали и концентрировали с образованием 23,5 г бледно-коричневого вязкого вещества. Это вещество отверждали, в результате чего образовалось твердое вещество имело температуру плавления от 88 до 90°C.

Пример 4. Получение 2-(4-хлор-6-метокси-пиримидин-2-ил)-окси-6-(4,6-диметокси-пиримидин-2-ил)оксибензойной кислоты (соединение № 6).

1) Получение триметилсиллилэтил-2-(4-хлор-6-метокси-пиримидин-2-ил)-окси-6-(4,6-диметокси-пиримидин-2-ил)оксибензоата аН (0,4 г, чистота: 60%) суспендировали в 50 мл тетрагидрофурана. К этой суспензии добавляли триметилсиллилэтил-6-(4,6-диметокси-пиримидин-2-ил)оксисалицилат (3,0 г), после чего эту смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 30 минут. К этой смеси добавляли 4-хлор-метокси-2-метилсульфонилпиримидин (1,8 г), затем эту смесь перемешивали при комнатной температуре еще в течение 12 ч. После окончания реакции к этой смеси добавляли воду, после чего ее экстрагировали простым этиловым эфиром. Слой простого этилового эфира высушивали над безводным сульфатом магния. Растворитель отгоняли при пониженном давлении. Полученный таким образом сырой экстракт очищали при помощи хроматографии на колонках из силикагеля, что позволило получить указанное выше соединение в виде светло-желтой жидкости (4,0 г).

2) Получение 2-(4-хлор-6-метокси-пиримидин-2-ил)окси-6-(4,6-диметокси-пиримидин-2-ил)оксибензойной кислоты.

Триметилсиллилэтил-2-(4-хлор-6-метокси-пиримидин-2-ил)окси-6-(4,6-диметокси-пиримидин-2-ил)оксибензоат (4,0 г) растворяли в 30 мл диметилформамида. К этому раствору добавляли тригидрат фтористого тетрабутиламмония (5,9 г), после чего эту смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 15 мин. После окончания реакции в эту смесь

добавляли воду и небольшое количество водного раствора бисульфата калия, а затем эту смесь экстрагировали этилацетатом. Органический слой промывали насыщенным водным раствором хлористого натрия и высушивали над безводным сульфатом магния. Растворитель отгоняли при пониженном давлении, и полученные таким образом кристаллы промывали смесью гексана и изопропилена (IPE), что позволило получить указанное выше соединение в виде белых кристаллов (3,2 г). Температура плавления 150-152°C.

Пример 5. Получение изопропиламино-2,6-бис[(4,6-диметокси-пиримидин-2-ил)окси]бензоата (соединение № 17).

2,6-Бис[(4,6-диметокси-пиримидин-2-ил)окси]бензойную кислоту (2,0 г) и изопропиламин (1,0 г) растворяли в 30 мл тетрагидрофурана, после чего эту смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 12 ч. Реакционный раствор концентрировали, а осажденные в результате этого кристаллы промывали гексаном с образованием указанного выше соединения в виде белых кристаллов (1,9 г). Температура плавления 99-102°C.

Пример 6. Получение изопропилиденового аминоксифира 2,6-бис[(4,6-диметокси-пиримидин-2-ил)окси]бензойной кислоты (соединение № 23).

2,6-Бис[(4,6-диметокси-пиримидин-2-ил)окси]бензойную кислоту (3,0 г) и N,N-карбонилдимидазол (1,2 г) растворяли в 50 мл тетрагидрофурана, после чего этот раствор нагревали с обратным холодильником в течение 15 мин. К этому реакционному раствору добавляли оксим ацетона (0,6 г), а затем эту смесь нагревали с обратным холодильником еще в течение 16 ч.

После окончания реакции к этой смеси добавляли воду и смесь экстрагировали этилацетатом. Органический слой промывали насыщенным водным раствором хлористого натрия и высушивали над безводным сульфатом магния. Затем растворитель отгоняли при пониженном давлении. Полученный таким образом сырой экстракт очищали при помощи хроматографии на колонках из силикагеля, что позволило получить указанное выше соединение в виде белых кристаллов (2,1 г). Температура плавления 114-117°C.

Пример 7. Получение 2,6-бис[(4,6-диметокси-пиримидин-2-ил)окси]бензоата трис(2-оксиэтил)аммония (соединение № 19) 2,6-бис[(4,6-диметокси-пиримидин-2-ил)окси]бензойную кислоту (2,0 г) и

триэтаноламин (0,7 г) растворяли в 30 мл тетрагидрофурана, после чего этот раствор перемешивали при комнатной температуре в течение 12 ч.

Реакционный раствор концентрировали и осажденные в результате этого кристаллы промывали гексаном, что позволило получить указанное выше соединение в виде белых кристаллов (2,4 г). Температура плавления 103–110°C.

П р и м е р 8. Получение 2,6-бис[(4,6-диметоксипиримидин-2-ил)окси]бензоата аммония (соединение № 22).

2,6-Бис[(4,6-диметоксипиримидин-2-ил)окси]бензойную кислоту (5,1 г) и 28% водный раствор аммиака (1,7 г) смешивали со смесью растворителей, состоящей из тетрагидрофурана и этанола. Осажденные кристаллы промывали ацетоном с образованием указанного выше соединения в виде белых кристаллов (3,7 г). Температура плавления 135–140°C.

П р и м е р 9. Получение метилтиоэтил-2,6-бис[(4,6-диметоксипиримидин-2-ил)окси]бензоата (соединение № 2).

Метилтиоэтил-2,6-диоксибензоат (4,5 г) растворяли в диметилформамиде и к этому раствору добавляли 60% гидрид натрия (1,6 г). Затем в эту смесь добавляли 2-хлор-4,6-диметоксипиримидин (3,5 г), после чего эту смесь нагревали и подвергали взаимодействию при температуре в интервале от 90 до 110°C в течение двух часов. Реакционный раствор выливали в ледяную воду, а затем дважды экстрагировали этилацетатом. Слой этилацетата промывали водой и высушивали над безводным сульфатом натрия. После удаления неорганических веществ посредством фильтрования растворитель отгоняли при пониженном давлении. Остаток очищали при помощи хроматографии на колонках с образованием указанного выше соединения в виде бесцветной вязкой жидкости. $\eta_{\text{в}}^{20}$: 1,5706.

П р и м е р 10. Получение 2,6-бис[(4,6-диметоксипиримидин-2-ил)окси]бензостойкой кислоты (соединение № 1).

60% гидрид натрия (1,4 г) суспендировали в тетрагидрофуране. К этой суспензии добавляли бензил-2,6-диоксибензоат (8,0 г), а затем эту смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 15 мин. Затем к этой смеси добавляли 4,6-диметокси-2-метилсульфонилпиримидин (7,3 г), после чего эту смесь подвергали взаимодействию в течение 3 ч

при нагревании с обратным холодильником.

После охлаждения реакционный раствор выливали в воду и экстрагировали простым этиловым эфиром. Органический слой промывали насыщенным водным раствором хлористого натрия и высушивали над безводным сульфатом магния. Растворитель отгоняли при пониженном давлении. Остаток очищали при помощи хроматографии на колонках из силикагеля с образованием бензил-6-(4,6-диметоксипиримидин-2-ил)оксисалицилата (2,0 г) в виде белых кристаллов. Температура плавления 68–65°C.

Полученный таким образом бензил-6-(4,6-диметоксипиримидин-2-ил)оксисалицилат подвергали взаимодействию с 4,6-диметокси-2-метилсульфонилпиримидином так же, как в примере 4, в результате чего был получен бензил-2,6-бис[(4,6-диметоксипиримидин-2-ил)окси]бензоат. Температура плавления 130–132°C в виде белых игольчатых кристаллов.

Полученный таким образом бензил-2,6-бис[(4,6-диметоксипиримидин-2-ил)окси]бензоат подвергали гидролизу так же, как в примере 1, что позволило получить 2,6-бис[(4,6-диметоксипиримидин-2-ил)окси]бензостойкую кислоту в виде белого порошка. Температура плавления 148–150°C.

П р и м е р 11. Получение 2,6-бис[(4-хлор-6-метоксипиримидин-2-ил)окси]бензойной кислоты (соединение № 12).

60% гидрид натрия (1,6 г) суспендировали в тетрагидрофуране. К этой суспензии добавляли 2,6-диоксибензойную кислоту (2,0 г), после чего эту смесь перемешивали при комнатной температуре в течение 30 мин. Затем к этой смеси добавляли 4-хлор-6-метокси-2-метилсульфонилпиримидин (5,8 г), после чего эту смесь подвергали взаимодействию при комнатной температуре в течение двух дней.

После окончания взаимодействия реакционную смесь выливали в воду и экстрагировали этилацетатом. Органический слой промывали насыщенным водным раствором хлористого натрия и высушивали над безводным сульфатом натрия. Растворитель отгоняли при пониженном давлении. Остаток очищали при помощи хроматографии на колонках с образованием указанного выше соединения (1,6 г) в виде светло-желтых кристаллов. Температура плавления 149–150°C.

Гербицидная композиция по настоящему изобретению содержит эффектив-

ное в гербицидном отношении количество соединения по настоящему изобретению и сельскохозяйственную добавку. Гербицид по настоящему изобретению можно использовать в том виде, как он есть, или 5 приготавливать из него различные составы, такие как смачиваемый порошок, гранулы, эмульгируемый концентрат или дуст, 10 посредством смешивания его в количестве от 0,5 до 95 вес.ч., предпочтительно от 1 до 80 вес.ч., с носителем, поверхностно-активным веществом, диспергатором или добавкой, которая обычно применяется для изготовления сельскохозяйственных химических продуктов в количестве, 15 необходимом для достижения в общей сложности 100 вес.ч.

В качестве носителя, предназначенного для использования в этом составе, можно указать твердый носитель, такой как жиклит, тальк, бентонит, глина, каолин, диатомит, белая сажа, вермикулит, гашеная известь, кварцевый песок, сульфат аммония или мочевины, либо жидкий носитель, такой как изопропиловый спирт, ксилол, циклогексан или метилнафталин. В качестве поверхностно-активного вещества и диспергатора можно указать, например, сложный эфир спирта и серной кислоты, алкиларилсульфонат, лигнинсульфонат, эфир полиоксиэтиленгликоля, полиоксиэтиленаалкиларилового эфира или моноалкината полиоксиэтиленсорбита. В качестве добавки, например, можно указать карбоксиметилцеллюлозу, полиэтиленгликоль или арабийскую камедь.

Пропорция соединения по настоящему изобретению в этом составе может изменяться в зависимости от типа состава, метода применения, места применения, времени и т.д. Поэтому это количество обычно нельзя определить. Однако, как правило, оно составляет от 5 до 90 весовых процентов в смачиваемом порошке, от 5 до 80 весовых процентов в эмульгируемом концентрате, от 1 до 60 весовых процентов в текучем составе, от 0,5 до 20 весовых процентов в гранулированном составе, от 5 до 40 весовых процентов в жидком составе, от 0,5 до 10 весовых процентов в дусте и от 5 до 90 весовых процентов в сухом текучем составе.

Жидкий состав можно получить в результате использования активного ингредиента в форме соли или путем добавления основного вещества к активному ингредиенту в форме кислоты во время приготовления состава. В процессе практического применения такой гербицид мож-

но разбавлять до соответствующей концентрации перед применением, или его можно применять в том виде, как он есть.

Гербицид по настоящему изобретению способен уничтожать различные сорняки на таких сельскохозяйственных землях, как 5 суходол или плодовый сад, либо в лесу, на газонах или на других сельскохозяйственных землях путем обработки почвы до или после появления сорняков или путем 10 опрыскивания листьев. Кроме того, этот гербицид способен уничтожать различные сорняки на рисовом поле путем обработки орошаемой почвы до или после появления сорняков или в результате опрыскивания листьев.

Для обработки почвы гербицид по настоящему изобретению применяют в дозе 20 от 0,1 г до 1 кг, предпочтительно от 0,5 до 500 г и наиболее предпочтительно от 1 до 100 г активного ингредиента на 10 ар. Для опрыскивания листьев этот гербицид разбавляют до концентрации, равной 25 1-10000 частям на миллион. Наиболее предпочтительным вариантом является его применение в дозе от 1 до 10 г активного ингредиента на 10 ар для рисового поля, в дозе от 5 до 50 г на 10 ар для плодового сада или газона и в дозе от 10 до 100 г для леса или несельскохозяйственных земель.

Ниже приводятся примеры составов для гербицидной композиции по настоящему изобретению. Однако, необходимо 35 понять, что настоящее изобретение ни в каком случае не ограничивается этими типичными примерами. В этих примерах "%" означает "весовые проценты".

Пример состава 1 (смачиваемый порошок).

10% соединения № 1, 0,5% эмульгена 810 (торговое название фирмы "Као корпорейшн"), 0,5% демолы N (торговое название фирмы "Као корпорейшн"), 20% 45 кунилита 201 (торговое название фирмы "Кунимин Коджио К.К.") и 69% жиклита СА (торговое название фирмы "Жиклит компани лмт.") одновременно перемешивали и распыляли с образованием смачиваемого порошка.

Пример состава 2 (эмульгируемый концентрат).

30% соединения № 1, 20% циклогексананола, 11% полиоксиэтиленакрилового эфира, 4% алкилбензолсульфоната кальция и 35% метил-нафталина равномерно 55 растворяли с образованием эмульгируемого концентрата.

Пример состава 3 (гранулы).

5% соединения № 1, 2% соли натрия, полученной с помощью сложного эфира лаурилового спирта и серной кислоты, 5% лигнинсульфоната натрия, 2% карбоксиметилцеллюлозы и 86% глины однородно перемешивали и распыляли. К 100 весовым частям этой смеси добавляли 20 весовых частей воды, после чего эту смесь перемешивали и формировали из нее гранулы размером от 14 до 32 меш при помощи гранулирующего экструдера с последующей сушкой с целью получения гранул.

Пример состава 4 (дуст).

2% соединения № 2, 5% диатомита и 93% глины однородно перемешивали и распыляли с целью получения дуста.

Пример состава 5 (смачиваемый порошок).

5% соединения № 26, 5% сульфоната полиоксипропиленалкилового эфира (Дикзол WK, торговое название фирмы "Дай-иши Коджио Сейнку"), 5% лигнинсульфоната (сунксис Р 201, торговое название фирмы "Саньо кокусаку палп кабушики кайша") и 85% тонко измельченной глины (торговое название фирмы "Шова коджио кабушики кайша"), однородно смешивали и распыляли с образованием смачиваемого порошка.

Пример состава 6 (смачиваемый порошок).

50% соединения № 1, 5% лаурилсульфата (эмал 10, торговое название фирмы "Као корпорейшн"), 5% поликарбоната (демон ЕР, торговое название фирмы "Као корпорейшн"), 10% кунилита 201 (торговое название фирмы "Кунимин коджио К.К.") и 30% карбоната кальция (калфин, торговое название фирмы "Адачи секкаи Коджио кабушики кайша") равномерно смешивали и распыляли с образованием смачиваемого порошка.

Пример состава 7 (смачиваемый порошок).

90% соединения № 1, 3% алкилбензолсульфоната (детергент 60, торговое название фирмы "Лайон кабушики кайша") и 7% конденсата нафталинсульфокислоты и формалина (демон N, торговое название фирмы "Као корпорейшн") равномерно распыляли и смешивали с образованием смачиваемого порошка.

Пример состава 8 (текучее вещество).

5% соединения № 1, 2% лигнинсульфоната (сунксис С, торговое название фирмы "Саньо кокусаку палп кабушики кайша") и 1% полиоксипропиленалкилфениловый эфир (сорпол Ех-Т 15, торговое название фирмы "Тохо кагаку коджио ка-

бушики кайша"), 10% этиленгликоля, 0,5% гетерополисахарида ("Родопол 23", торговое название фирмы "Рон-поуленк"), 10% растворителя типа парафина (растворитель № 0, фирма "Нихон секио кабушики кайша") и 71,5% воды смешивали, а затем перемешивали. Эту смесь распыляли при помощи песочной мельницы (торговое название фирмы "Игараши кикаи кабушики кайша") с образованием текучего вещества.

Пример состава 9 (текучее вещество).

50% соединения № 1, 2% конденсата нафталинсульфокислоты и формалина (демон MS, торговое название фирмы "Као корпорейшн"), 7% этиленгликоля, 0,4% бентонита (кунипия F, торговое название фирмы "Саньо кабушики кайша") и 40,4% воды смешивали, а затем перемешивали. Эту смесь распыляли при помощи песочной мельницы (торговое название фирмы "Игараши кикаи кабушики кайша") с образованием текучего вещества.

Пример состава 10 (жидкий состав).

5% соединения № 1 диспергировали в 79% воды, после чего к этой дисперсии добавляли 1 н. водный раствор гидроокиси натрия при перемешивании с целью доведения показателя pH этого раствора до 7,0-7,5. К этому раствору добавляли воду для доведения общего количества раствора до 100%, в результате чего был получен жидкий состав соединения № 18.

Пример состава № 11 (жидкий состав).

20% соединения № 1 диспергировали в 47% воды, после чего к этой дисперсии постепенно добавляли 2 н. водный раствор триэтанолamina при перемешивании с целью доведения показателя pH этого раствора до 7,0-7,5. К этому раствору добавляли воду с тем, чтобы довести общее количество раствора до 100%, что позволило получить жидкий состав соединения № 19.

Пример состава 12 (жидкий состав).

40% соединения № 20 растворяли в 60% воды, в результате чего был получен жидкий состав.

Пример состава 13 (сухое текучее вещество).

5% соединения № 1, 10% лигнинсульфоната (Перл рекс СР, торговое название фирмы "Санио кокусаку палп кабушики кайша"), 3% алкилбензолсульфоната (детергент 60, торговое название фирмы "Лайон кабушики кайша"), 20% талька и 62% тонкой глины (торговое название фирмы "Шова коджио кабушики кайша") распыляли и смешивали. Затем до дости-

жения 100 весовых частей этой смеси добавляли 18 весовых частей воды и перемешивали. Из перемешанного продукта формировали гранулы размером от 20 до 48 меш при помощи экструзионного гранулятора. Затем гранулы высушивали с образованием сухого текучего вещества.

Пример состава 14 (сухое текучее вещество).

50% соединения № 25, 10% конденсата нафталинсульфокислоты и формалина (демоп SNB, торговое название фирмы "Као корпорейшн"), 10% карбоната кальция (калфие, торговое название фирмы "Адачи секкаи коджио кабушики кайша") и 30% сульфата аммония распыляли и смешивали. Затем эту смесь гранулировали при помощи гранулятора с псевдооживленным слоем (фирма "Фуджио санджио кабушики кайша"), после чего размер гранул доводили до 20-48 меш в результате просеивания, что позволило получить сухое текучее вещество.

Пример состава 15 (сухое текучее вещество).

80% соединения № 12, 5% поликарбоната (демоп EP, торговое название фирмы "Као корпорейшн") и 15% жиклита СА (торговое название фирмы "Жиклит компани лмт.") распыляли и смешивали. Затем эту смесь гранулировали при помощи вертикального гранулятора фирмы "Фуджио санджио кабушики кайша"), после чего гранулы просеивали с целью доведения их размера до 20-48 меш, в результате чего было получено сухое текучее вещество.

Пример состава 16 (эмульгируемый концентрат).

5% соединения № 12, 15% сополимеризованного со стиролом полиоксиэтиленфенилового эфира (сорпол Ex-T 20, торговое название фирмы "Тохо кагаку коджио кабушики кайша") и 80% метилнафталена (солвессо 200, торговое название фирмы "Эксон кагаку кабушики кайша") смешивали и растворяли с образованием эмульгируемого концентрата.

Пример состава 17 (эмульгируемый концентрат).

80% соединения № 2, 5% смеси сополимеризованного со стиролом полиоксиэтиленфенилового эфира, его конденсата с формальдегидом и алкилбензолсульфоната (сорпол SNX, торговое название фирмы "Тохо кагаку коджио кабушики кайша"), 5% N-метил-2-пирролидона и 10% ксилола смешивали и раст-

воряли с образованием эмульгируемого концентрата.

Пример состава 18 (гранулы).

0,5% соединения № 29, 2% алкилбензолсульфоната (детергент 60, торговое название фирмы "Као корпорейшн"), 40% талька (торговое название фирмы "Канто тальк коджио кабушики кайша") и 57,5% бентонита (кунигель V-1, торговое название фирмы "Кунимин коджио кабушики кайша") равномерно распыляли и смешивали. К 100 весовым частям этой смеси добавляли 17 весовых частей воды и перемешивали. Из перемешанного продукта формировали гранулы с размером от 14 до 32 меш, используя для этого экструзионный гранулятор, а затем высушивали с образованием гранул.

Пример состава 19 (гранулы).

20% соединения № 1 растворяли в 30% N-метил-2-пирролидона, после чего этот раствор смешивали с перемешанным субстратом 20% мелких гранул № 4 (торговое название фирмы "Есада сейфун кабушики кайша") и 30% калеонита № 0248 (торговое название фирмы "Мизусава когаку коджио кабушики кайша"), с целью адсорбции смешанного субстрата, в результате чего были получены гранулы.

Пример состава 20 (дуст).

0,5% соединения № 28, 1% таллового масла, 5% белой сажи (карплекс № 80, торговое название фирмы "Шионоджи сейяку кабушики кайша") и 93,5% жиклита СА (торговое название фирмы "Жиклит компани лмт.") равномерно распыляли и смешивали с образованием дуста.

Пример состава 21 (дуст).

5% соединения № 18, 1% таллового масла, 0,5% производного алкилфосфорной кислоты (дорилес, торговое название "Санкье кабушики кайша") и 93,5% глины (глина Мяки, торговое название фирмы "Мяки коджио кабушики кайша") равномерно распыляли и смешивали с образованием дуста.

Соединения и гербицидные композиции по настоящему изобретению способны эффективно уничтожать однолетние сорняки, такие как петушье просо (*Echinochloa crusgalli*), росичка кровавая (*Digitaria sanguinalis*), елеузина индийская (*Eleusine indica*), щетинник зеленый (*Setaria viridis*), лисохвост ровный (*Alopecurus cuqualis*), мятник однолетний (*Poa annuus*), овсюг (*Avena fatua*), плевел многоцветковый (*Lolium multiflorum*), горец перечный (*Polygonum Lapathifolium*), щирица тонкая (*Amaranthus viridis*), марь белая

(*Chenopodium album*), канатник Теофраста (*Abutilon theophrasti*), грудинка колючая (*Sida spinosa*), резуха канадская (*Cassia tora*), звездчатка (*Stellaria media*), ипомея (*Ipomea spp*), дурнишник обыкновенный (*Xanthium strumarium*), сыть рисовая (*Cyperus iria*), ветвянка широколиственная (*Brachiaria platyphylla*), чемерица зеленая (*Rotaboeia exaltata*), костер кровельный (*Bromus tectorum*), горец выющийся (*Polygonum convolvulu*), горчица полевая (*Brassica arvensis*) и череда листовенная (*Bidens frondosa*), и многолетние сорняки, такие как чуха (*Cyperus rotundus*), гумай (*Sorghum halepense*), собачья трава (*Cynodon dactylon*) и свинорой (*Agrorpyron verpens*), растущие на суходолах, в плодовых садах и на сельскохозяйственных землях.

Кроме того они способны эффективно уничтожать однолетние сорняки, такие как петушье просо (*Echinochloa crusgalli*), сырь вееровидная (*Cyperus difformis*), монокория (*Monochoria vaginalis*), и многолетние сорняки, такие как камыш (*Scirpus hotarui*), *Alisma canaliculatum*, *Cyperus serotinus*, *Sagittaria a pyamaea* и *Eleocharis kurogiwai*, растущие на рисовых полях. Кроме того, при применении в качестве гербицидов для газонов эти композиции способны уничтожать летние сорняки, такие как росичка кровяная (*Digitaria sanguinalis*), мяглик однолетний (*Poa annua*) и кислица стелющаяся (*Oxalis corniculata*), и многолетние сорняки, такие как чуха (*Cyperus rotundus*), растущие на площадках для игры в гольф или в садах. Они также способны уничтожать многолетние сорняки, такие как пуэария волосистая (*Pueraria thunbergiana*), серебряная трава (*Miscanthus sinensis utrideses*) и бамбук тростниковый (*Pleibastus spp*), растущие в лесах.

Далее гербицидная активность гербицидов по настоящему изобретению будет описана со ссылкой на испытательные примеры.

Соединения по настоящему изобретению обладают следующими отличительными признаками:

1). Они характеризуются высоким гербицидным действием и являются очень эффективными при низкой дозе.

2). Они являются весьма эффективными при обработке почвы до появления всходов. Однако, они являются особенно эффективными при опрыскивании листьев после появления всходов.

3). Они характеризуются широким спектром гербицидного действия. (Они

оказывают эффективное действие в отношении не только однолетних сорняков, относящихся к рисовым, широколиственным или осокоцветным сорнякам, но также в отношении многолетних сорняков, относящихся в рисовым, широколиственным или осокоцветным сорнякам).

4). Они характеризуются высоким уровнем сохранности для злаковых растений. В частности они обеспечивают высокую сохранность для риса, пшеницы и газонов. Эти гербициды также можно использовать для рассадного риса.

5). Они характеризуются весьма высокой эффективностью даже в отношении сорняков, находящихся на поздней стадии распускания листьев (то есть сильно выросшие сорняки).

6). Они не остаются в почве и не оказывают вредного влияния на севооборотные культуры.

7). Они не проявляют токсичности в отношении млекопитающих или рыб и характеризуются высокой степенью сохранности для этих видов.

Далее гербицидная активность гербицидов по настоящему изобретению будет описываться со ссылкой на испытательные примеры.

Следующие сокращения обозначают следующие испытываемые растения:

Or: Tr: пшеница, EC: петушье просо, Se: щетинник зеленый, Po: горец перечный, Am: ширица тонкая, Ip: ипомея, Ha: дурнишник обыкновенный, Cr: чуха, Di: росичка кровяная, Ch: марь белая, Ci: сыть рисовая, Cd: сырь вееровидная, Mo: монокория, Sc: камыш, So: гумай, Al: листовост ровный и Ab: канатник Теофраста.

Испытательный пример 1 (опрыскивание листьев на суходолах).

В горшок, заполненный почвой (площадь поверхности: 100 см²) высевали семена петушье проса (Kc), росички кровяной (Di), горца перечного (Po), ширицы тонкой (Am), мари белой (Ch) и сыти рисовой (Ci) и закрывали слоем почвы толщиной от 0,5 до 1 см. Горшок держали в теплице при температуре от 20 до 25°C в течение 2 недель, после чего заранее определенное количество смачиваемого порошка в соответствии с примером состава 1 разбавляли водой и этим составом опрыскивали листву при норме 100 литров на 10 ар (доза активного ингредиента: 400 г/10 ар). Оценку производили на 14-й день после опрыскивания в соответствии со стандартом, приведенным в табл.2. Результаты обозначены индексными числами в табл.3.

Испытательный пример 2 (обработка почвы на суходолах).

В горшок, заполненный почвой (площадь поверхности 600 см²), высевали пеньку просо (Ec), росички кровяной, щирцы тонкой (Am), мари белой и сыти рисовой и покрывали слоем почвы толщиной от 0,5 до 1 см. Через день после посева заранее определенное количество смачиваемого порошка, приготовленного в соответствии с примером 1, разбавляли водой и наносили на поверхность почвы при норме 100 литров на 10 ар (доза активного ингредиента 400 г на 10 ар). Оценку производили на 20-й день после обработки в соответствии со стандартом, указанным в табл.2. Результаты приведены в виде индексных чисел в табл.4.

Испытательный пример 3 (испытание на уничтожение сорняков на рисовом поле).

В горшок, заполненный почвой рисового поля (площадь поверхности 100 см²), высевали семена пеньку просо (Ec), сыти веероидной (Cd), монохории (Mo) и камыша (Sc), после чего почву поливали водой на глубину 3 см. Через два дня после посева заранее определенное количество смачиваемого порошка, приготовленного в соответствии с примером 1, разбавляли водой и по каплям вводили на поверхность воды в дозе, равной 100 г активного ингредиента на 10 ар. Оценку производили на 21-й день после обработки в соответствии со стандартом, указанным в табл.2. Результаты приведены в виде индексных чисел в табл.5.

Испытательный пример 4 (избирательное гербицидное испытание).

В горшок, заполненный почвой (площадь поверхности 600 см²), высевали семена риса (Or), пшеницы (Tr), пеньку просо (Ec), щетинника зеленого (Se), горца веречного (Po), щирцы тонкой (Am), ипомеи (Ip) и дурнишника обыкновенного (Ха), высаживали клубни чумы (Cr) и покрывали слоем почвы толщиной от 0,5 до 1 см. Этот горшок помещали в теплицу при температуре от 20 до 25°C на две недели, после чего заранее определенное количество смачиваемого порошка, приготовленного в соответствии с примером 1, разбавляли водой и этим составом опрыскивали листья при норме 100 литров на 10 ар. Оценку производили на 30-й день после опрыскивания в соответствии со стандартом, указанным в табл. 2. Результаты приведены в виде индексных чисел в табл. 6.

Испытательный пример 5 (опрыскивание листьев - гербицидное испытание).

В горшок, заполненный почвой (площадь поверхности 600 см²), высевали пеньку просо (Ec), росички кровяной (Di), щетинника зеленого (Se), гумья (So), горца веречного (Po), щирцы тонкой (Am), канатника Теофрата (Ab), ипомеи (Ip) и дурнишника обыкновенного (Ха), и покрывали слоем почвы толщиной от 0,5 до 1 см. Этот горшок помещали в теплицу при температуре от 20 до 25°C на две недели, после чего заранее определенное количество смачиваемого порошка, приготовленного в соответствии с примером 1, разбавляли водой, содержащей ингибитор, и этим составом опрыскивали листья при норме 100 литров на 10 ар. Оценку производили на 21-й день после опрыскивания в соответствии со стандартом, указанным в табл.2. Результаты приведены в виде индексных чисел в табл.7.

Ниже указаны сравнительные соединения 1, 2, 3, 4 и 5 (патент США № 4248619) (те же соединения приведены в последующих таблицах).

Сравнительное соединение 1.

1,3-Бис(4,6-диметил-2-пиримидинилокси)бензол.

Сравнительное соединение 2.

1,3-Бис(5-хлор-2-пиримидинилокси)-2-метилбензол.

Сравнительное соединение 3.

1,3-Бис(5-хлор-2-пиримидинилокси)-2-нитробензол.

Сравнительное соединение 4.

5-Хлор-2-[6-(4,6-диметил-2-пиримидинилокси)фенокси]пиримидин.

Сравнительное соединение 5.

1,2-Бис(5-хлор-2-пиримидинилокси)бензол.

Испытательный пример 6 (опрыскивание листьев - испытание на фитотоксичность в отношении риса).

В горшок, заполненный почвой (площадь поверхности 600 см²), высевали семена риса (сорт Лабелла) и покрывали слоем почвы толщиной от 0,5 до 1 см. Этот горшок помещали в теплицу при температуре от 20 до 25°C до достижения фазы распускания 2,5 листьев, после чего заранее определенное количество смачиваемого порошка, приготовленного в соответствии с примером 1, разбавляли водой, содержащей ингибитор роста, и этим составом опрыскивали листья при норме 100 литров на 10 ар (доза активного ингредиента: 6,3 г и 1,6 г на 10 ар). Фитотоксичность определяли на 30-й день после опрыскивания в соответствии со

стандартом, указанным в табл. 2. В результате этих испытаний было установлено отсутствие фитотоксичности при любой дозе в случае соединений № 1, 10, 17, 18, 19, 20, 21, 22 по данному изображению.

Испытательный пример 7 (обработка почвы – гербицидное испытание).

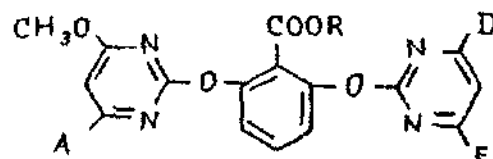
В горшок, заполненный почвой (площадь поверхности 600 см²), высевали пелюшье проса (Ec), щетинника зеленого (Se), гумей (So), и лисохвоста ровного (Al) и покрывали слоем почвы толщиной от 0,5 до 1 см. Через день после посева, заранее определенное количество смачиваемого порошка, приготовленного в соответствии с примером 1, разбавляли водой и наносили на поверхность почвы при норме 100 литров на 10 ар. После обработки этот горшок помещали в теплицу при температуре от 20 до 30°C. Оценку производили на 2-ой день после обработ-

ки в соответствии со стандартом, указанным в табл.2. Результаты приведены в виде индексных чисел в табл.8.

Испытательный пример 8 (гербицидное испытание в отношении чумы, используемой в качестве многолетнего сорняка).

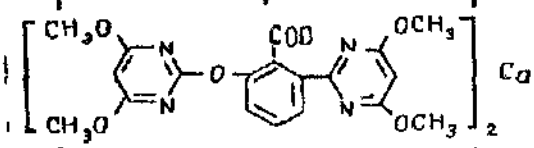
В горшок, заполненный почвой (площадь поверхности 100 см²), высаживали клубни чумы (Cr) и покрывали их слоем почвы толщиной 1 см. Этот горшок помещали в теплицу при температуре от 20 до 30°C до достижения фазы распускания четвертого листа, после чего заранее определенное количество смачиваемого порошка, приготовленного в соответствии с примером 1, разбавляли водой, содержащей ингибитор, и этим составом опрыскивали листья. Оценку производили на 20-й день после опрыскивания в соответствии со стандартом, указанным в табл.2. Результаты приведены в виде индексных чисел в табл.9.

Т а б л и ц а 1



№	R	A	D	E	Температура плавления (°C) или показатель преломления
1	H	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	148-150
2	C ₂ H ₄ SCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	η _D ²⁰ 1,5706
3	C ₂ H ₄ SC ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	76-79
4	C ₂ H ₄ SOC ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	89-90
5	C ₂ H ₄ SO ₂ C ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	92-96
6	H	OCH ₃	Cl	OCH ₃	150-152
7	H	OCH ₃	CH ₃	CH ₃	174-177
8	H	OCH ₃	H	H	120-125
9	H	OCH ₃	Cl	CH ₃	133-136

Продолжение табл. 1

№	R	A	D	E	Температура плавления (°C) или показатель преломления
10	H	OCH ₃	CH ₃	OCH ₃	150-152
11	H	OCH ₃	H	OCH ₃	132-135
12	H	Cl	Cl	OCH ₃	149-150
13	H	OCH ₃	H	CH ₃	153-157
14	H	OCH ₃	OC ₂ H ₅	OC ₂ H ₅	143-144
15	H	OCH ₃	OCHF ₃	OCHF ₂	127-130
16	H	OCH ₃	H	Cl	83-88
17	•NH ₃ C ₃ H ₇ -I	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	99-102
18	•Na	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	235-237
19	•HN(C ₂ H ₄ OH) ₃	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	103-110
20	•H ₂ N(C ₂ H ₄ OH) ₂	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	$n_D^{20} = 1,5528$
21					88-95
22	•NH ₄	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	135-140
23	N=C(CH ₃) ₂	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	114-117
24	N=C(CH ₃)(C ₂ H ₅)	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	121-122
25	N=C(C ₂ H ₅)(C ₃ H ₇)	OCH ₃	OCH ₃	OCH ₃	112-114
26	N=C(C ₃ H ₇) ₂	OCH ₃	H	H	$n_D^{20} = 1,5571$

Т а б л и ц а 2

Индексное число	Гербицидное действие и фитотоксичность
0	Отсутствие гербицидного действия (или отсутствие фитотоксичности)
1	Гербицидное действие (или фитотоксичность): более 0% и менее 30%
2	Гербицидное действие (или фитотоксичность): равное, по крайней мере, 30% и менее 50%
3	Гербицидное действие (или фитотоксичность): равное, по крайней мере, 50% и меньше 70%
4	Гербицидное действие (или фитотоксичность): равное, по крайней мере, 70% и меньше 90%
5	Гербицидное действие (или фитотоксичность): более 90%

Т а б л и ц а 3

Соедине- ние №	Гербицидное действие					
	Ec	Di	Po	Am	Ch	Ci
1	5	5	5	5	5	5
2	5	5	5	5	5	5
3	4	4	4	5	5	2
4	5	5	5	5	4	4
5	5	5	5	5	4	4
6	5	5	4	5	5	5
8	5	5	5	5	5	5
11	5	4	5	5	5	5
14	5	5	5	5	4	5
16	5	4	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	4	5

Т а б л и ц а 4

Соединение №	Гербицидное действие					
	Ec	Di	Po	Am	Ch	Ci
1	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
10	5	4	5	5	5	5
11	5	5	5	5	5	5
12	5	4	5	5	5	5
13	5	5	5	5	5	5
14	4	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

Т а б л и ц а 5

Соединение №	Гербицидное действие			
	Ec	Cd	Mo	Sc
1	5	5	5	5
2	5	5	5	5
3	4	5	5	5
4	4	5	5	4
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

Продолжение табл. 5

Соединение №	Гербицидное действие			
	Ec	Di	Mo	Sc
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

Т а б л и ц а 6

Соединение №	Доза активного ингредиента (г/10 ар)	Гербицидное действие								
		Or	Tr	Ec	Se	Po	Am	Ip	Xa	Cr
1	25	0	0	5	5	5	5	5	5	5
	6,3	0	0	4	5	5	5	4	5	4
4	400	0	0	5	5	5	5	4	5	2
	100	0	0	3	5	5	5	2	5	1
5	400	0	0	5	4	5	5	4	5	3
	100	0	0	4	2	5	4	3	5	2

Т а б л и ц а 7

Соединение №	Доза активного ингредиента (г/10 ар)	Гербицидное действие								
		Ec	Di	Se	So	Po	Am	Ab	Ip	Xa
1	6,3	5	5	5	5	5	5	5	5	5
	1,6	5	4	5	5	5	5	4	5	5
6	6,3	5	4	5	5	4	5	5	5	5
	1,6	5	3	5	5	4	5	5	5	5
10	6,3	5	3	4	5	5	5	4	5	5
	1,6	5	2	3	5	5	5	3	4	4
14	6,3	4	3	4	5	5	5	2	5	5
	6,3	5	5	5	5	5	5	5	5	5
18	1,6	5	4	5	5	5	5	3	4	5
	6,3	5	5	5	5	5	5	4	4	5
19	1,6	5	3	5	5	5	5	3	5	5
	6,3	5	5	5	5	5	5	5	5	5
20	1,6	5	5	5	5	5	5	3	4	5
	6,3	5	5	5	5	5	5	4	5	5
	1,6	5	4	5	5	5	5	3	3	5

Продолжение табл. 7

Соединение №	Доза активного ингредиента (г/10 ар)	Гербицидное действие								
		Ec	Di	Se	So	Po	Am	Ab	Ip	Xa
21	6,3	5	5	5	5	5	5	4	5	5
	1,6	5	3	5	5	5	5	3	4	5
22	6,3	5	5	5	5	5	5	5	5	5
	1,6	5	4	5	5	5	5	4	5	5
23	6,3	4	3	4	4	5	5	5	5	5
24	6,3	5	2	4	5	5	5	3	3	5
Сравнительное соединение										
1	6,3	0	0	0	0	0	3	1	0	0
	1,6	0	0	0	0	0	2	0	0	0
2	6,3	0	0	0	0	1	2	0	0	0
	1,6	0	0	0	0	0	1	0	0	0
3	6,3	0	0	0	0	2	4	1	0	0
	1,6	0	0	0	0	0	2	0	0	0
4	6,3	0	0	0	0	0	2	0	0	0
	1,6	0	0	0	0	0	0	0	0	0
5	6,3	0	0	0	0	4	4	2	2	2
	1,6	0	0	0	0	3	2	1	1	1

Таблица 8

Соединение №	Доза активного ингредиента (г/10 ар)	Гербицидное действие			
		Ec	Se	So	Al
1	6,3	5	5	5	5
6	6,3	4	5	5	5
17	6,3	4	4	5	5
18	6,3	5	5	5	5
19	6,3	4	5	5	5
20	6,3	5	5	5	5
21	6,3	4	3	5	5
22	6,3	5	5	5	5
23	6,3	3	4	5	5
24	6,3	4	4	5	5
Сравнительное соединение					
1	6,3	0	0	0	0
2	6,3	0	0	1	0
3	6,3	0	0	0	0
4	6,3	0	0	0	0
5	6,3	0	0	1	0

Т а б л и ц а 9

Соединение №	Доза активного ингредиента (г/10ар)	Гербицидное действие
		Сг
1	25	5
	6,3	4
6	25	4
	6,3	4
7	25	4
	6,3	3
10	25	4
	6,3	3
11	25	4
	6,3	3
12	25	5
	6,3	4
14	25	4
	6,3	4
17	25	5
	6,3	4
18	25	5
	6,3	4
19	25	5
	6,3	5
20	25	5
	6,3	4
21	25	5
	6,3	4
22	25	5
	6,3	5
23	25	4
	6,3	4
Сравнительное соединение		
1	25	0
	6,3	0
2	25	0
	6,3	0
3	25	0
	6,3	0
4	25	0
	6,3	0
5	25	0
	6,3	0

Упорядник	Техред М. Келемеш	Коректор О. Обручар
-----------	-------------------	---------------------

Замовлення 538	Тираж	Підписне
----------------	-------	----------

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

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

