



УКРАЇНА

(19) UA

(11) 104290

(13) C2

(51) МПК

C07D 231/20 (2006.01)

A01N 43/56 (2006.01)

ДЕРЖАВНА СЛУЖБА
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
УКРАЇНИ

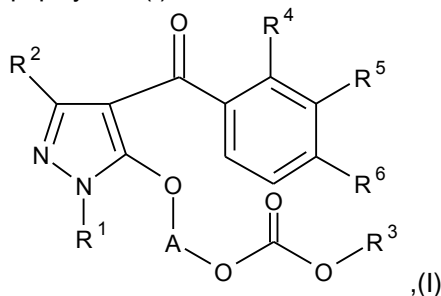
(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВІНАХІД

(21) Номер заявки:	а 2010 14772	(72) Винахідник(и):	Тсукамото Масаміцу (JP), Кікугава Хіроші (JP), Нагаяма Союшіро (JP), Окіта Татсця (JP), Хата Хороші (JP)
(22) Дата подання заявки:	19.05.2009	(73) Власник(и):	ІШІХАРА САНДІО КАІША, ЛТД., 3-15, Edobori 1-chome, Nishi-ku, Osaka-shi, Osaka, 5500002, Japan (JP)
(24) Дата, з якої є чинними права на винахід:	27.01.2014	(74) Представник:	Коваль Максим Павлович, реєстр. №208
(31) Номер попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції:	2008-132190, 2009-003467	(56) Перелік документів, взятих до уваги експертизою:	UA 94003 C2, 27.07.2009
(32) Дата подання попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції:	20.05.2008, 09.01.2009		
(33) Код держави-учасниці Паризької конвенції, до якої подано попередню заявку:	JP, JP		
(41) Публікація відомостей про заявку:	25.01.2011, Бюл.№ 2		
(46) Публікація відомостей про видачу патенту:	27.01.2014, Бюл.№ 2		
(86) Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору РСТ	PCT/JP2009/059489, 19.05.2009		

(54) СПОЛУКА ПІРАЗОЛУ, СПОСІБ ЇЇ ОДЕРЖАННЯ І ГЕРБІЦИДНА КОМПОЗИЦІЯ, ЩО ЇЇ МІСТИТЬ

(57) Реферат:

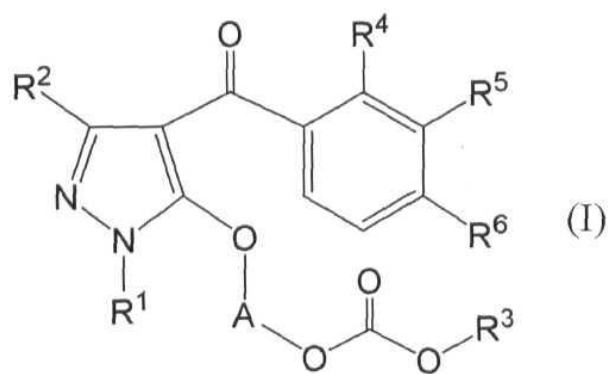
Винахід належить до нового гербіциду з чудовою гербіцидною активністю, який має широкий діапазон застосування, включаючи сільськогосподарські угіддя і землі несільськогосподарського призначення, а також різноманітні способи застосування, включаючи обробку ґрунту і обробку листяного покриву, де зазначена сполука піразолу представлена формулою (I) або її сіллю:



де R¹ являє собою етил,
R² являє собою водень,
R³ являє собою метил,
R⁴ являє собою метил,

UA 104290 C2

R^5 являє собою 2-метоксієтокси,
 R^6 являє собою метилсульфоніл,
 A являє собою $-CH(CH_3)-$.



ОБЛАСТЬ ТЕХНІКИ

Даний винахід відноситься до нових сполук піразолу, корисних як активний інгредієнт гербіцидів.

ПОПЕРЕДНІЙ РІВЕНЬ ТЕХНІКИ

В патентних документах 1) і 2) і розкриті сполуки піразолу. Проте сполуки піразолу, які представлені приведеною нижче формулою (I) або (II), конкретно в них не розкриті.

Патентний документ 1): EP0352543A1

Патентний документ 2): EP0282944A2

РОЗКРИТТЯ ВІНАХОДУ

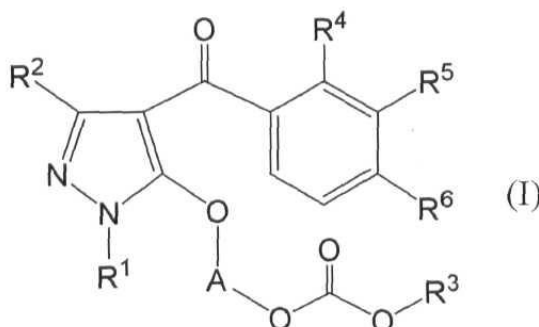
ЦІЛЬ, ЯКА МАЄ БУТИ ДОСЯГНУТА ВІНАХОДОМ

До недавнього часу гербіциди, які мають чудову гербіцидну активність проти бур'янів і які безпечні для сільськогосподарських культур, були бажаними з точки зору зменшення трудомісткості при боротьбі з бур'янами і підвищення врожайності сільськогосподарських і садових культур. При розробці нових гербіцидів в майбутньому доцільно розробляти такі сполуки, які здатні проявляти бажану гербіцидну активність при одночасному забезпеченні їхнього дозування на контрольованому низькому рівні. Крім того, доцільно розробляти такі сполуки, які не спричиняли б шкоду оточуючому середовищу, чи то в результаті перебування в ґрунті триваліше, ніж це необхідно, і зберігали би при цьому практичну залишкову ефективність, чи то в результаті вимивання активного інгредієнта в ґрунт за межі місця нанесення внаслідок дощу, тощо. Крім того, доцільно розробляти такі сполуки, які були б надзвичайно безпечними для тварин. Проте пошук нових сполук, які відповідали б таким вимогам, залежить від використання метода проб і помилок.

ЗАСОБИ ДЛЯ ДОСЯГНЕННЯ ЦІЛІ

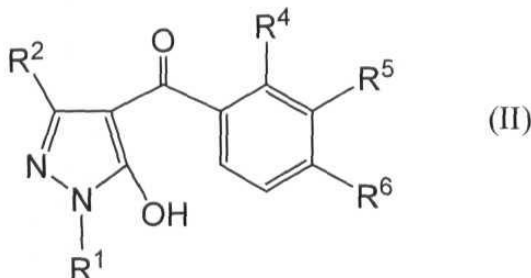
Авторами даного винаходу були проведені всебічні дослідження сполук піразолу з метою пошуку досконаліших гербіцидів, які б досягли вказаної вище цілі, що в результаті й привело до створення даного винаходу.

Більш конкретно, даний винахід відноситься до сполуки піразолу, представленої формулою (I), або її солі:



де R¹ являє собою алкіл, R² являє собою атом водню або алкіл, R³ являє собою алкіл, R⁴ являє собою алкіл, R⁵ являє собою алкіл, заміщений одним алкокси, алкокси, заміщений одним алкокси, або алкоксикарбоніл, R⁶ являє собою алкілсульфоніл, А являє собою алкілен, заміщений, щонайменше, одним алкілом; до способу її одержання; до гербіциду, що містить її як активний інгредієнт; і до способу боротьби з небажаними рослинами або інгібування їхнього росту, який включає застосування її гербіцидно ефективною кількістю до небажаних рослин або до місця, де вони ростуть.

Крім того, даний винахід відноситься до сполуки піразолу, представленої формулою (II), або її солі, яка є корисною як проміжна сполука для одержання сполуки піразолу, представленої формулою (I), або її солі, а також є корисною для виробництва гербіциду:



де R¹ являє собою алкіл, R² являє собою атом водню або алкіл, R⁴ являє собою алкіл, R⁵ являє собою алкіл, заміщений одним алкокси, алкокси, заміщений одним алкокси, або

алкоксикарбоніл, а R^6 являє собою алкілсульфоніл; до способу її одержання; до гербіциду, що містить її як активний інгредієнт; і до способу боротьби з небажаними рослинами або інгібування їхнього росту, який включає застосування її гербіцидно ефективною кількістю до небажаних рослин або до місця, де вони ростуть.

Сполуки піразолу, представлені формулою (I) або (II), або їхні солі забезпечують помітне покращення гербіцидної активності проти бур'янів у порівнянні з відомими сполуками аналогічного типу і характеризуються високим ступенем безпечності по відношенню до сільськогосподарських культур. Крім того, вони не будуть спричиняти шкоду оточуючому середовищу, чи то в результаті перебування в ґрунті триваліше, ніж це необхідно, зберігаючи при цьому практичну залишкову ефективність, або в результаті вимивання активного інгредієнта в ґрунт за межі місця нанесення внаслідок дощу, тощо.

КРАЩИЙ ВАРІАНТ ЗДІЙСНЕННЯ ВИНАХОДУ

В зазначеній вище формулі (I) або (II) алкіл або алкільна складова може мати нерозгалужений або розгалужений ланцюг, і конкретні приклади його включають алкіл C_{1-9} , такий як, наприклад, метил, етил, n-пропіл, ізопропіл, n-бутил, ізобутил, втор-бутил, трет-бутил, n-пентил, ізопентил, неопентил, трет-пентил, n-гексил, ізогексил, n-гептил, n-октил і n-ноніл.

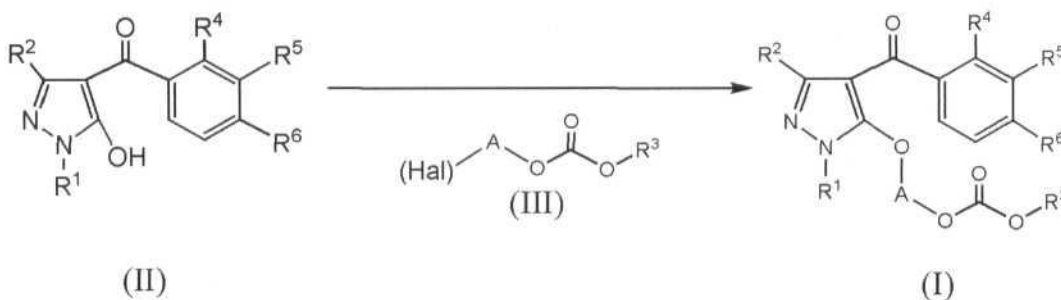
В зазначеній вище формулі (I) алкіленова складова може являти собою алкілен C_{1-9} , такий як, наприклад, метилен, етилен, триметилен, тетраметилен, пентаметилен, гексаметилен, гептаметилен, октаметилен або нонаметилен.

Сіль сполуки піразолу, представленої зазначеною вище формулою (I) або (II), включає всі види солей за умови, що вони прийнятні з сільськогосподарської точки зору. Приклади таких солей включають солі лужних металів, такі як, наприклад, сіль натрію і сіль калію; солі лужноземельних металів, такі як, наприклад, сіль магнію і сіль кальцію; солі амінів, такі як, наприклад, сіль диметиламіну і сіль триетиламіну; солі неорганічних кислот, такі як, наприклад, гідрохлорид, перхлорат, сульфат і нітрат; і солі органічних кислот, такі як, наприклад, ацетат і метансульфонат.

Для сполук піразолу, представлених зазначеною вище формулою (I) або (II), іноді можуть бути присутні оптичні ізомери, і даний винахід включає всі такі ізомери. В цьому опису дана сполука описана як суміш ізомерів, якщо інше не обумовлене.

Сполука піразолу, яка представлена зазначеною вище формулою (I) або (II), або її сіль (які названі далі просто як сполука у відповідності до даного винаходу) може бути одержана у відповідності до представленої нижче реакції і з використанням відомого способу одержання солі.

(A)



де R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 і A - як це визначено вище, а Hal являє собою галоген.

Зазначена вище реакція може бути здійснена в присутності розчинника, якщо цього вимагають обставини. Розчинник може являти собою будь-який розчинник за умови, що він залишається інертним до реакції. Він може, наприклад, являти собою кетон, такий як, наприклад, ацетон, етилметилкетон або діетилкетон; галогенізований вуглеводень, такий як, наприклад, метиленхлорид, хлороформ, дихлоретан або трихлоретан; вуглеводень ароматичного ряду, такий як, наприклад, бензол, толуол, ксилол або нітробензол; складний ефір, такий як, наприклад, метилацетат, етилацетат або пропілацетат; апротонний полярний розчинник, такий як, наприклад, ацетонітрил, N,N-диметилформамід (DMF), диметилсульфоксид (DMSO), диметилацетамід (DMA), триамід гексаметилфосфорної кислоти (HMPA) або сульфан; або простий ефір, такий як, наприклад, діетиловий ефір, діоксан, тетрагідрофуран (THF) або диметоксетан. Як розчинник відповідним чином можна вибрати

один з них або більше. Серед таких розчинників переважними є, наприклад, вуглеводні ароматичного ряду.

Зазначена вище реакція може бути здійснена в присутності основи, якщо цього вимагають обставини. Основа може являти собою як неорганічну основу, так і органічну основу. Органічна основа може, наприклад, являти собою третинний амін, такий як, наприклад, триетиламін або діізопропілетиламін; піридин, 4-(диметиламіно)-піридин або 2,6-диметилпіридин. Неорганічна основа може, наприклад, являти собою карбонат лужного металу, такий як, наприклад, карбонат натрію або карбонат калію; гідрокарбонат лужного металу, такий як, наприклад, гідрокарбонат натрію або гідрокарбонат калію; карбонат лужноземельного металу, такий як, наприклад, карбонат кальцію або карбонат барію; гідроксид лужного металу, такий як, наприклад, гідроксид натрію або гідроксид калію; або ціанід лужного металу, такий як, наприклад, ціанід натрію або ціанід калію. Що стосується таких основ, то відповідним чином можна вибрати одну з них або більше і змішати для використання в кількості, як правило, від 0,01 до 100, переважно від 0,1 до 10, еквівалентів по відношенню до сполуки, представленої формули (II).

Зазначена вище реакція може бути здійснена в присутності каталізатора. Каталізатор може, наприклад, являти собою бромід n-бутиламонію, хлорид n-бутиламонію, бромід тетра-n-бутилфосфонію, йодид натрію або йодид калію. Серед таких каталізаторів переважним є, наприклад, бромід n-бутиламонію. Відповідним чином можна вибрати один з таких каталізаторів або більше і змішати для використання в кількості, як правило, від 0,0001 до 10 еквівалентів, переважно від 0,001 до 1 еквівалента.

Зазначена вище реакція може бути здійснена при температурі реакції, яка становить, як правило, від 0 °C до 150 °C, переважно від 50 °C до 120 °C, при тривалості реакції, як правило, від 1 хвилини до 48 годин, переважно від 30 хвилин до 5 годин.

Як сполуку формули (II), яка має бути використана в зазначеній вище реакції, можна використати таку, яка одержана у вигляді солі у відповідності до представленої нижче реакції (B).

Сполука піразолу, яка представлена зазначеною вище формулою (II), містить нову сполуку і може бути одержана у відповідності до представленої нижче реакції (B).



де R^1 , R^2 , R^4 , R^5 і R^6 - як це визначено вище.

Більш конкретно, сполука, яка представлена формулою (II), може бути одержана шляхом введення сполуки, представленої формулою (IV), в реакцію перегрупування.

Зазначена вище реакція може бути здійснена в присутності розчинника, якщо цього вимагають обставини. Розчинник може являти собою будь-який розчинник за умови, що він залишається інертним до реакції. Він може, наприклад, являти собою галогенізований вуглеводень, такий як, наприклад, метиленхлорид, хлороформ, дихлоретан або трихлоретан; вуглеводень ароматичного ряду, такий як, наприклад, бензол, толуол, ксилол або нітробензол; складний ефір, такий як, наприклад, метилацетат, етилацетат або пропілацетат; апротонний полярний розчинник, такий як, наприклад, ацетонітрил, DMF, DMSO, DMA, HMPA або сульфолан; або простий ефір, такий як, наприклад, діетиловий ефір, діоксан, THF або диметоксіетан. Як розчинник відповідним чином можна вибрати один з них або більше. Серед таких розчинників переважним є, наприклад, вуглеводень ароматичного ряду або апротонний полярний розчинник, а більш переважним є, наприклад, вуглеводень ароматичного ряду, до якого підмішують апротонний полярний розчинник. Коли до вуглеводню ароматичного ряду підмішують апротонний полярний розчинник, вміст останнього становить, як правило, наприклад, від 1 до 20 об'ємних частин, переважно від 5 до 10 об'ємних частин, на 100 об'ємних частин вуглеводню ароматичного ряду.

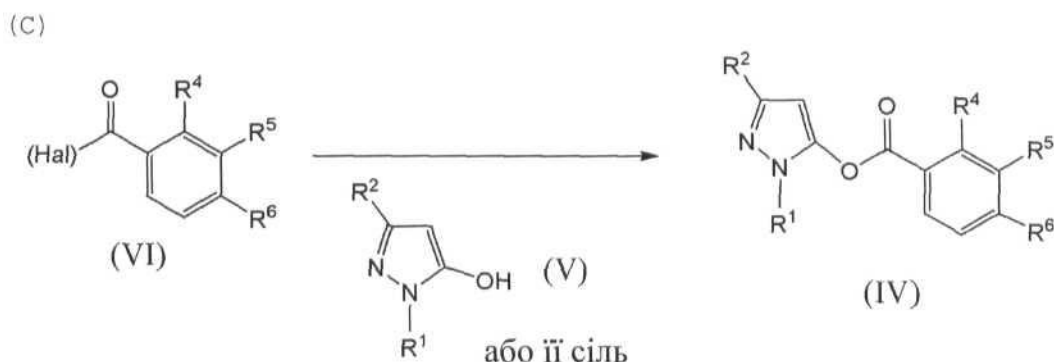
Зазначена вище реакція може бути здійснена в присутності основи, якщо цього вимагають обставини. Основа може являти собою як органічну основу, так і неорганічну основу, і в зв'язку з цим можуть бути зазначені, наприклад, ті з них, які приведені як приклад в зазначеній вище реакції (A). Що стосується таких основ, то відповідним чином можна вибрати одну з них або

більше або змішати для використання в кількості від 0,01 до 100, переважно від 0,1 до 10, еквівалентів по відношенню до сполуки формули (IV). Серед таких основ переважно є, наприклад, карбонат лужного металу. Коли використовують основу, сполуку формули (II) можна іноді одержати у вигляді солі. Навіть коли сполука формули (II) знаходиться у вигляді солі, така сіль сполуки формули (II) може бути використана сама по собі як матеріал для зазначеної вище реакції (A).

Крім того, в зазначену вище реакцію може бути доданий каталізатор, якщо цього вимагають обставини. Як такий каталізатор може бути використаний ціаногідрин ацетону в кількості від 0,01 до 10 еквівалентів по відношенню до сполуки формули (IV).

Зазначена вище реакція може бути здійснена при температурі реакції, яка становить, як правило, від 0 °C до 150 °C, переважно від 70 °C до 150 °C, при тривалості реакції, як правило, від 1 хвилини до 48 годин, переважно від 30 хвилин до 5 годин.

Сполука, яка представлена зазначеною вище формулою (IV), може бути приготована у відповідності до представленої нижче реакції (C).



де R^1 , R^2 , R^4 , R^5 , R^6 і Hal - як це визначено вище.

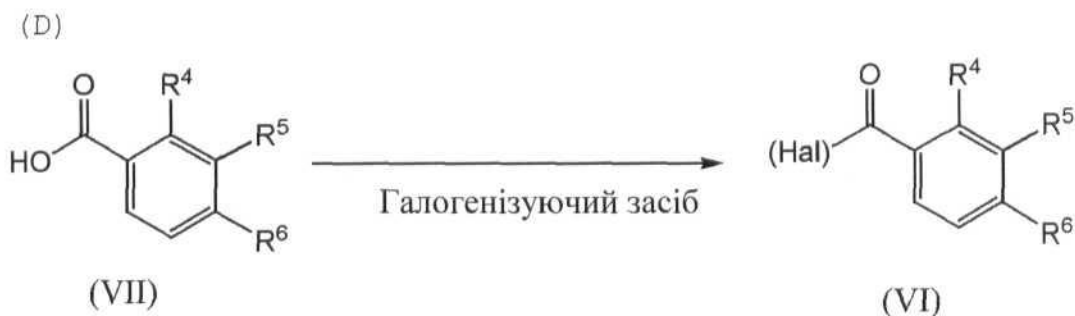
Більш конкретно, сполука, яка представлена формулою (IV), може бути одержана шляхом введення сполуки, представленої формулою (V), або її солі, такої як, наприклад, гідрохлорид, сульфат або нітрат, в реакцію зі сполукою, представленою формулою (VI). Сполука формули (V) або її сіль може бути використана в кількості від 0,01 до 100, переважно від 0,1 до 10, еквівалентів по відношенню до сполуки формули (VI).

Зазначена вище реакція може бути здійснена в присутності розчинника, якщо цього вимагають обставини. Розчинник може являти собою будь-який розчинник за умови, що він залишається інертним до реакції, і в зв'язку з цим можуть бути зазначені, наприклад, ті з них, які приведені як приклад в зазначеній вище реакції (B). Відповідним чином можна вибрати один з них або більше. Серед таких розчинників переважним є, наприклад, вуглеводень ароматичного ряду.

Зазначена вище реакція може бути здійснена в присутності основи, якщо цього вимагають обставини. Основа може бути являти собою органічну основу або неорганічну основу, і в зв'язку з цим можуть бути зазначені, наприклад, ті з них, які приведені як приклад в зазначеній вище реакції (A). Що стосується таких основ, то відповідним чином можна вибрати одну з них або більше і змішати для використання в кількості від 0,005 до 50, переважно від 0,05 до 5, еквівалентів по відношенню до сполуки формули (VI). Серед таких основ переважно є, наприклад, третинний амін.

Температура реакції для зазначеної вище реакції становить, як правило, від 0 °C до 150 °C, переважно від 10 °C до 100 °C, а тривалість реакції становить, як правило, від 1 хвилини до 48 годин, переважно від 30 хвилин до 5 годин.

Сполука, яка представлена зазначеною вище формулою (VI), може бути одержана у відповідності до представленої нижче реакції (D).



де R^4 , R^5 , R^6 і Hal - як це визначено вище.

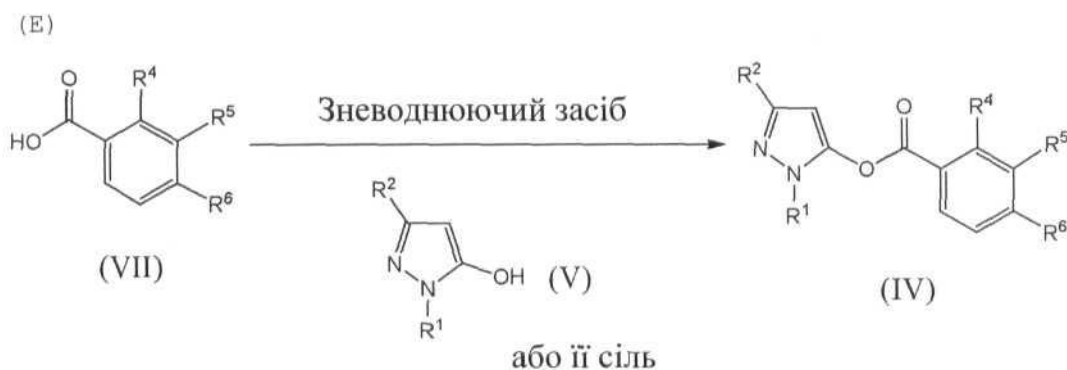
В зазначеній вище реакції галогенізуючий засіб, такий як, наприклад, тіонілхлорид або оксалілхлорид, вводять в реакцію в кількості, як правило, від 0,01 до 100, переважно від 0,1 до 10, еквівалентів по відношенню до сполуки, представлені формулою (VII). Серед таких галогенізуючих засобів переважним є, наприклад, тіонілхлорид.

Зазначена вище реакція може бути здійснена в присутності розчинника, якщо цього вимагають обставини. Розчинник може являти собою будь-який розчинник за умови, що він залишається інертним до реакції, і в зв'язку з цим можуть бути зазначені, наприклад, ті з них, які приведені як приклад в зазначеній вище реакції (B). Відповідним чином можна вибрати один з них або більше. Серед таких розчинників переважними є, наприклад, вуглеводень ароматичного ряду або галогенізований вуглеводень, а більш переважним є, наприклад, вуглеводень ароматичного ряду.

Для здійснення зазначеної вище реакції може бути використаний каталізатор, якщо цього вимагають обставини. Каталізатор може, наприклад, являти собою DMF. Каталізатор може бути використаний в кількості, як правило, від 0,001 до 1, переважно від 0,01 до 0,5, еквівалентів по відношенню до сполуки, представлені формулою (VII).

Температура реакції для зазначеної вище реакції становить, як правило, від 0 °C до 150 °C, переважно від 10 °C до 120 °C, а тривалість реакції становить, як правило, від 1 хвилини до 48 годин, переважно від 30 хвилин до 5 годин.

Сполука, яка представлена зазначеною вище формулою (IV), може бути одержана у відповідності до представлені нижче реакції (E) з використанням способу, який відрізняється від приведених вище способів.



де R^1 , R^2 , R^4 , R^5 і R^6 - як це визначено вище.

Більш конкретно, сполука, яка представлена формулою (IV), може бути одержана шляхом введення сполуки, представлені формулою (V), або її солі, такої як, наприклад, гідрохлорид, сульфат або нітрат, в реакцію зі сполукою, представлені формулою (VII), з використанням зневоднюючого засобу.

Зневоднюючий засіб, який має бути використаний для зазначеної вище реакції, може, наприклад, являти собою DCC (дициклогексилкарбодіімід) або гідрохлорид 1-етил-3-(3-диметиламінопропіл)-карбодііміду.

Зазначена вище реакція може бути здійснена в присутності розчинника, якщо цього вимагають обставини. Розчинник може являти собою будь-який розчинник за умови, що він залишається інертним до реакції, і в зв'язку з цим можуть бути зазначені, наприклад, ті з них, які

приведені як приклад в зазначеній вище реакції (B). Відповідним чином можна вибрати один з них або більше.

Зазначена вище реакція може бути здійснена в присутності основи, якщо цього вимагають обставини. Основа може, наприклад, являти собою третинний амін, такий як, наприклад, триетиламін і діізопропітиламін; піридин, 4-(диметиламіно)-піридин або 2,6-диметилпіридин. Як основу відповідним чином можна вибрати одну з них або більше і змішати для використання в кількості від 1 до 100 еквівалентів по відношенню до сполуки, яка представлена формулою (VII).

Зазначена вище реакція може бути здійснена при температурі реакції, яка становить, як правило, від 0 °C до 150 °C, при тривалості реакції, як правило, від 1 хвилини до 48 годин.

Сполука, яка представлена зазначеною вище формулою (VII), може бути одержана у відповідності до представленої нижче реакції (F).



де R^4 , R^5 і R^6 - як це визначено вище, а L являє собою захисну групу, таку як, наприклад, алкіл.

Сполука, яка представлена формулою (VII), може бути одержана шляхом гідролізу сполуки, представленої формулою (VIII), в присутності води.

Зазначена вище реакція може бути здійснена в присутності розчинника, якщо цього вимагають обставини. Розчинник може являти собою будь-який розчинник за умови, що він залишається інертним до реакції, і він може, наприклад, являти собою вуглеводень ароматичного ряду, такий як, наприклад, бензол, толуол або ксилол; апротонний полярний розчинник, такий як, наприклад, ацетонітрил, DMF, DMSO, DMA, HMPA або сульфолан; простий ефір, такий як, наприклад, діетиловий ефір, діоксан, THF або диметоксіетан; спирт, такий як, наприклад, метанол або етанол; або воду. Як розчинник відповідним чином можна вибрати один з них або більше.

Зазначена вище реакція може бути здійснена в присутності основи або кислоти, якщо цього вимагають обставини. Основа може являти собою як органічну основу, так і неорганічну основу, і в зв'язку з цим можуть бути зазначені ті з них, які приведені як приклад в зазначеній вище реакції (A). Кислота може, наприклад, являти собою хлористоводневу кислоту, сірчану кислоту або перхлорну кислоту. Як основу або кислоту відповідним чином можна вибрати одну з них або більше і змішати для використання в кількості від 1 до 100 еквівалентів по відношенню до сполуки, представленої формулою (VIII).

Зазначена вище реакція може бути здійснена при температурі реакції, яка становить, як правило, від 0 °C до 150 °C, при тривалості реакції, як правило, від 1 хвилини до 48 годин.

Серед сполук, представлених зазначеною вище формулою (VIII), сполука, де R^5 являє собою R^{5-a-1} , може бути одержана у відповідності до представленої нижче реакції (G).



де R^{5-a-1} являє собою алкокси, заміщений одним алкокси, R^{6-a-1} являє собою алкілтію, а L , R^4 і R^6 - як це визначено вище.

Більш конкретно, сполука, яка представлена формулою (VIII-a-i), може бути одержана шляхом введення сполуки, представленої формулою (IX), в реакцію з окислювачем в присутності розчинника.

Окислювач, який має бути використаний в зазначеній вище реакції, може, наприклад, являти собою пероксид водню, пероцтову кислоту або метаклорпербензойну кислоту.

Розчинник, який має бути використаний в зазначеній вище реакції, може являти собою будь-який розчинник за умови, що він залишається інертним до реакції, і він може, наприклад, являти собою галогенізований вуглеводень, такий як, наприклад, метиленхлорид, хлороформ, дихлоретан або трихлоретан; кетон, такий як, наприклад, ацетон або метил етил кетон; простий ефір, такий як, наприклад, діетиловий ефір, діоксан, THF або диметоксіетан; або оцтову кислоту. Як розчинник відповідним чином можна вибрати один з них або більше.

Зазначена вище реакція може бути здійснена при температурі реакції, яка становить, як правило, від 0°C до 150°C , при тривалості реакції як правило, від 1 хвилини до 48 годин.

Зазначена вище реакція може бути здійснена в присутності каталізатора, якщо цього вимагають обставини. Каталізатор може, наприклад, являти собою вольфрамат натрію або його гідрат.

Сполука, яка представлена зазначеною вище формулою (IX), може бути одержана у відповідності до представленої нижче реакції (H).



де L , R^4 , R^{5-a-1} і R^{6-a-1} - як це визначено вище.

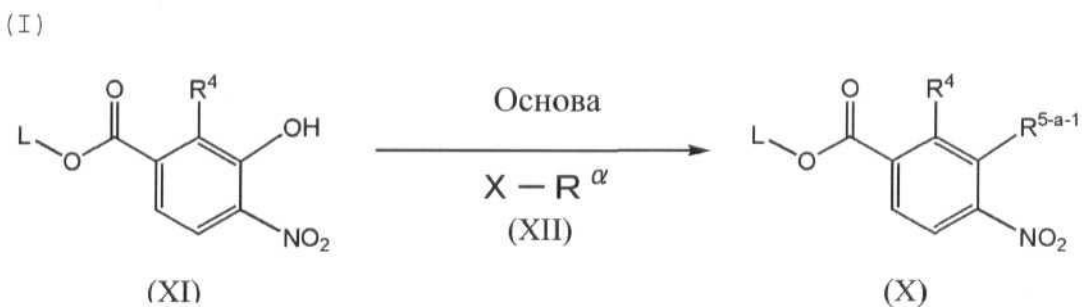
Більш конкретно, сполука, яка представлена формулою (IX), може бути одержана шляхом введення сполуки, представленої формулою (X), в реакцію з тіоалкоксидом лужного металу.

Тіоалкоксид лужного металу, який має бути використаний для зазначеної вище реакції, може, наприклад, являти собою тіометоксид натрію або тіоетоксид натрію.

Зазначена вище реакція може бути здійснена в присутності розчинника, якщо цього вимагають обставини. Розчинник може являти собою будь-який розчинник за умови, що він залишається інертним до реакції, і він може, наприклад, являти собою апротонний полярний розчинник, такий як, наприклад, ацетонітрил, DMF, DMSO, DMA, HMPA, сульфолан або диметоксіетан. Як розчинник відповідним чином можна вибрати один з них або більше.

Зазначена вище реакція може бути здійснена при температурі реакції, яка становить, як правило, від 0°C до 150°C , при тривалості реакції як правило, від 1 хвилини до 48 годин.

Сполука, яка представлена зазначеною вище формулою (X), може бути одержана у відповідності до представленої нижче реакції (I).



де R^a являє собою алкіл, заміщений одним алкокси, X являє собою групу, яка відщеплюється, таку як, наприклад, галоген або метансульфонілоксильна група, а L , R^4 і R^{5-a-1} - як це визначено вище.

Більш конкретно, сполука, яка представлена формулою (X), може бути одержана шляхом введення сполуки, представленої формулою (XI), в реакцію зі сполукою, представленою формулою (XII), в присутності основи.

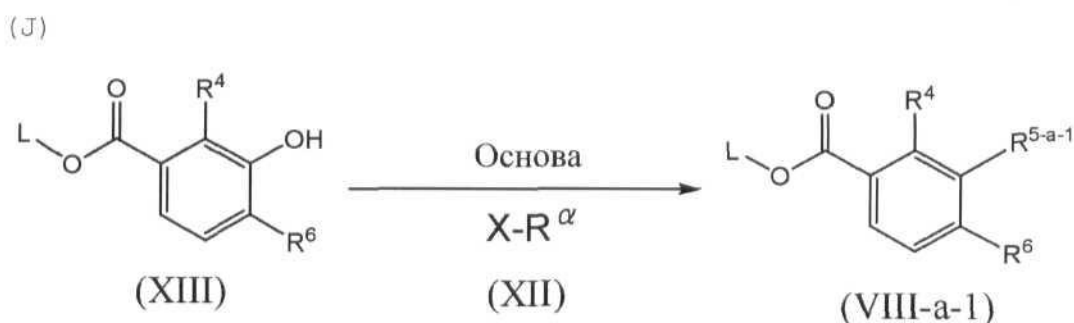
Основа, яка має бути використана в зазначеній вище реакції, може являти собою як неорганічну основу, так і органічну основу. Органічна основа може, наприклад, являти собою, триетиламін, діізопропілетиламін, піридин, 4-(диметиламіно)-піридин або 2,6-диметилпіридин. Неорганічна основа може, наприклад, являти собою карбонат лужного металу, такий як, наприклад, карбонат натрію або карбонат калію; гідроксид лужного металу, такий як, наприклад, гідроксид натрію або гідроксид калію; або гідрид лужного металу, такий як, наприклад, гідрид натрію або гідрид калію. Як основу відповідним чином можна вибрати одну з них або більше і змішати для використання в кількості від 0,5 до 100 еквівалентів по відношенню до сполуки, представленої формулою (XI).

Зазначена вище реакція може бути здійснена в присутності розчинника, якщо цього вимагають обставини. Розчинник може являти собою будь-який розчинник за умови, що він залишається інертним до реакції, і в зв'язку з цим можуть бути, наприклад, зазначені ті з них, які приведені як приклад в зазначеній вище реакції (B). Відповідним чином можна вибрати один з них або більше.

Зазначена вище реакція може бути здійснена в присутності каталізатора, якщо цього вимагають обставини. Каталізатор може, наприклад, являти собою йодид калію або йодид тетра-*n*-бутиламонію.

Зазначена вище реакція може бути здійснена при температурі реакції, яка становить, як правило, від 0 °C до 150 °C, при тривалості реакції, як правило, від 1 хвилини до 48 годин.

Сполука, яка представлена зазначеною вище формулою (VIII-a-1), може бути одержана у відповідності до представленої нижче реакції (J) з використанням способу, який відрізняється від приведеного вище способу.

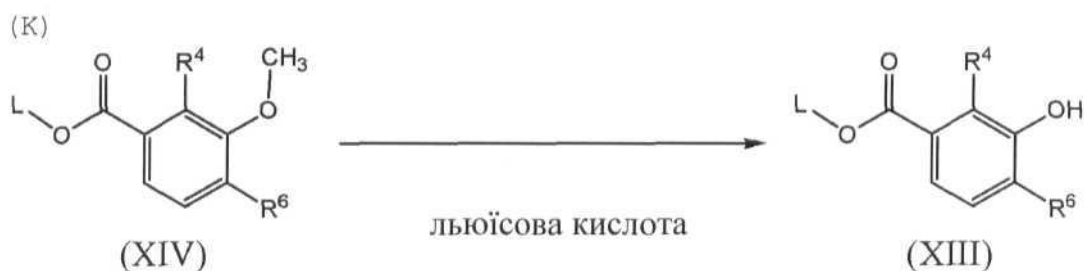


де L , R^4 , R^{5-a-1} , R^6 , R^a і X - як це визначено вище.

Більш конкретно, сполука, яка представлена формулою (VIII-a-1), може бути одержана шляхом введення сполуки, представленої формулою (XIII), в реакцію зі сполукою, представленою формулою (XII), в присутності основи.

Зазначена вище реакція може бути здійснена таким же чином, як і зазначена вище реакція (I).

Сполука, яка представлена зазначеною вище формулою (XIII), може бути одержана у відповідності до представленої нижче реакції (K).



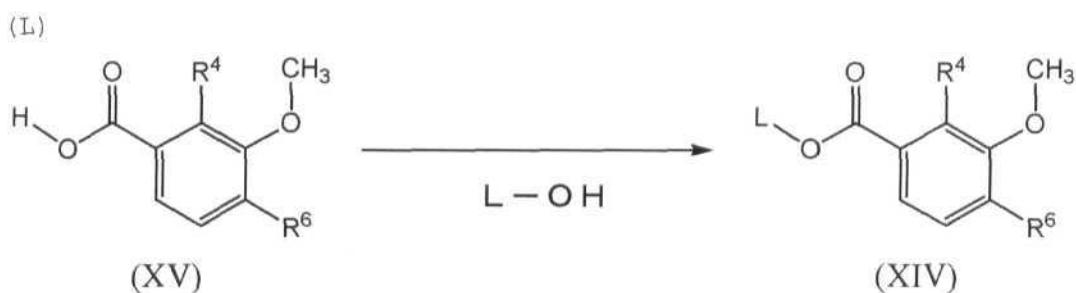
де R^4 , R^6 і L - як це визначено вище.

Більш конкретно, сполука, яка представлена формулою (XIII), може бути одержана шляхом введення сполуки, представленої формулою (XIV), в реакцію з льюїсовою кислотою, такою як, наприклад, трибромід бору, хлорид алюмінію або бромід заліза.

Зазначена вище реакція може бути здійснена в присутності розчинника, якщо цього вимагають обставини. Розчинник може являти собою будь-який розчинник за умови, що він залишається інертним до реакції, і в зв'язку з цим можуть бути, наприклад, зазначені галогенізований вуглеводень, такий як, наприклад, метиленхлорид, хлороформ, дихлоретан або трихлоретан; вуглеводень ароматичного ряду, такий як, наприклад, бензол, толуол або ксилол; або складний ефір, такий як, наприклад, метилацетат, етилацетат або пропілацетат. Як розчинник відповідним чином можна вибрати один з них або більше.

Зазначена вище реакція може бути здійснена при температурі реакції, яка становить, як правило, від 0°C до 150°C , при тривалості реакції, як правило, від 1 хвилини до 48 годин.

Сполука, яка представлена зазначеною вище формулою (XIV), може бути одержана у відповідності до представленої нижче реакції (L).



де R^4 , R^6 і L - як це визначено вище.

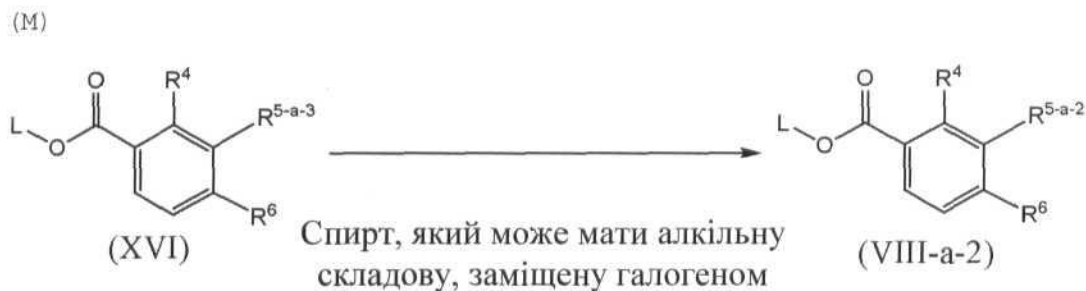
Більш конкретно, сполука, яка представлена формулою (XIV), може бути одержана з використанням реакції введення захисної групи L в сполуку, представлену формулою (XV).

Зазначена вище реакція може бути здійснена в присутності розчинника, якщо цього вимагають обставини. Розчинник може являти собою будь-який розчинник за умови, що він залишається інертним до реакції, і він може, наприклад, являти собою вуглеводень ароматичного ряду, такий як, наприклад, бензол, толуол або ксилол; складний ефір, такий як, наприклад, метилацетат, етилацетат або пропілацетат; галогенізований вуглеводень, такий як, наприклад, метиленхлорид, хлороформ, дихлоретан або трихлоретан; або апротонний полярний розчинник, такий як, наприклад, ацетонітрил, DMF, DMSO, DMA, HMPA або сульфолан. Як розчинник відповідним чином можна вибрати один з них або більше.

Зазначена вище реакція може бути здійснена в присутності кислоти, якщо цього вимагають обставини. Кислота, яка має бути використана для зазначеної вище реакції, може, наприклад, являти собою хлористоводневу кислоту або сірчану кислоту.

Зазначена вище реакція може бути здійснена при температурі реакції, яка становить, як правило, від 0°C до 150°C , при тривалості реакції, як правило, від 1 хвилини до 48 годин.

Серед сполук, представлених зазначеною вище формулою (VIII), сполука, де R^5 являє собою R^{5-a-2} , може бути одержана у відповідності до представленої нижче реакції (M).



де R^{5-a-2} являє собою алкіл, заміщений одним алкокси, R^{5-a-3} являє собою бромалкіл, а L , R^4 і R^6 - як це визначено вище.

Зазначена вище реакція може бути здійснена в присутності розчинника, якщо цього вимагають обставини. Розчинник може являти собою будь-який розчинник за умови, що він залишається інертним до реакції, і він може, наприклад, являти собою спирт, такий як, наприклад, метанол або етанол; складний ефір, такий як, наприклад, метилацетат, етилацетат або пропілацетат; простий ефір, такий як, наприклад, діетиловий ефір, діоксан, THF або диметоксіетан; або апротонний полярний розчинник, такий як, наприклад, ацетонітрил, DMF, DMSO, DMA, HMPA або сульфолан. Як розчинник відповідним чином можна вибрати один з них або більше.

Зазначена вище реакція може бути здійснена в присутності основи, якщо цього вимагають обставини. Основа може, наприклад, являти собою гідрид лужного металу, такий як, наприклад, гідрид натрію або гідрид калію.

Зазначена вище реакція може бути здійснена при температурі реакції, яка становить, як правило, від 0 °C до 150 °C, при тривалості реакції, як правило, від 1 хвилини до 48 годин.

Сполука, яка представлена зазначеною вище формулою (VII), може бути одержана у відповідності до представленої нижче реакції (N).



де R^4 , R^5 і R^6 - як це визначено вище, а Hal-1 являє собою галоген.

Більш конкретно, сполука, яка представлена формулою (VII), може бути одержана шляхом введення сполуки, представленої формулою (XVII), в реакцію з монооксидом вуглецю або еквівалентною йому сполукою і H_2O в присутності каталізатора і основи.

Основа, яка має бути використана в зазначеній вище реакції, може являти собою неорганічну основу або органічну основу. Органічна основа може, наприклад, являти собою, триетиламін, трибутиламін, діізобутилетиламін, піридин, 4-(диметиламіно)-піридин або 2,6-диметилпіридин. Неорганічна основа може, наприклад, являти собою карбонат лужного металу, такий як, наприклад, карбонат натрію, карбонат калію або карбонат цезію; гідроксид лужного металу, такий як, наприклад, гідроксид натрію або гідроксид калію; гідроксид лужноземельного металу, такий як, наприклад, гідроксид кальцію або гідроксид барію; або ацетат лужного металу, такий як, наприклад, ацетат натрію або ацетат калію. Одну або більше з таких основ можна відповідним чином вибрати або змішати для використання в кількості від 0,1 до 100 еквівалентів, переважно від 0,5 до 10 еквівалентів, по відношенню до сполуки, представленої формулою (XVII). Серед цих основ переважною може бути карбонат лужного металу.

Каталізатор, який має бути використаний в зазначеній вище реакції, може, наприклад, являти собою металевий каталізатор, наприклад, паладієвий каталізатор, такий як, наприклад, хлорид паладію, ацетат паладію, татракіс(трифенілфосфін)паладій, дихлоробіс(трифенілфосфін)паладій, транс-ди(μ -ацетат)біс[o -(ди- o -толілфосфіно)бензил]дипаладій або паладієва чернь; рутенієвий каталізатор, такий як, наприклад, додекарбонілтрирутений; або родієвий каталізатор, такий як, наприклад, хлоробіс(циклооктен)родій (I). Один з таких каталізаторів або більше можна відповідним чином вибрати або змішати для використання в кількості, як правило, від 10^{-10} до 1 еквівалента, переважно від 10^{-5} до 0,1 еквівалента, по відношенню до сполуки, представленої формулою (XVII). Серед цих каталізаторів переважним може бути паладієвий каталізатор.

Еквівалентна монооксиду вуглецю сполука, яка має бути використана в зазначеній вище реакції, може, наприклад, являти собою гексакарбонілмолибден, мурашину кислоту або хлороформ. Монооксид вуглецю або еквівалентна йому сполука може бути введений в реакцію в кількості від 1 до 1000 еквівалентів по відношенню до сполуки, представленої формулою (XVII), в умовах, якщо цього вимагають обставини, підвищеного тиску. Величину тиску можна відповідним чином вибрати у межах від 1 до 100 МПа, переважно від 1 до 10 МПа.

Зазначена вище реакція може бути здійснена в присутності розчинника, якщо цього вимагають обставини. Розчинник може являти собою будь-який розчинник за умови, що він залишається інертним до реакції, і він може, наприклад, являти собою спирт, такий як, наприклад, метанол, етанол, n-пропанол, i-пропанол, n-бутиловий спирт, i-бутиловий спирт, втор-бутиловий спирт або трет-бутиловий спирт; воду; галогенізований вуглеводень, такий як, наприклад, метиленхлорид, хлороформ, дихлоретан або трихлоретан; вуглеводень ароматичного ряду, такий як, наприклад, бензол, толуол, ксилол, нітробензол або хлорбензол; складний ефір, такий як, наприклад, метилацетат, етилацетат або пропіл ацетат; апротонний полярний розчинник, такий як, наприклад, ацетонітрил, DMF, DMSO, DMA, HMPA або сульфолан; або простий ефір, такий як, наприклад, діетиловий ефір, 1,4-діоксан, THF або 1,2-диметоксіетан. Як розчинник відповідним чином можна вибрати один з них або більше для використання. Серед цих розчинників переважним може, наприклад, бути спирт, а більш переважним може, наприклад, бути спирт C₄.

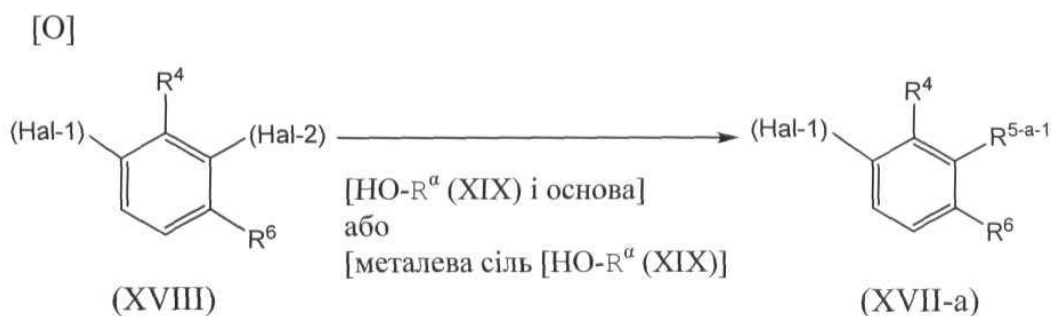
Зазначена вище реакція може бути здійснена в присутності ліганду, якщо цього вимагають обставини. Ліганд може, наприклад, являти собою три-*t*-бутилфосфін, трициклогексилфосфін, трифенілфосфін, три(*o*-толіл)фосфін, 1,4-біс(дифенілфосфіно)бутан, 1,3-біс(дифенілфосфіно)пентан або 1,1'-біс(дифенілфосфіно)фероцен. Один з таких лігандів або більше можна відповідним чином вибрати або змішати для використання в кількості від 10⁻¹⁰ до 1 еквівалента, переважно від 10⁻⁵ до 0,1 еквівалента, по відношенню до сполуки, представлені формулою (XVII).

Зазначена вище реакція може бути здійснена в присутності співкаталізатора, якщо цього вимагають обставини. Співкаталізатор може, наприклад, являти собою галогенід лужного металу, такий як, наприклад, хлорид натрію, хлорид калію, бромід натрію або бромід калію; або сіль четвертинного амонію, таку як, наприклад, бромід тетра(*n*-бутил)амонію. Один з таких співкаталізаторів або більше можна відповідним чином вибрати або змішати для використання в кількості, як правило, від 0,001 до 1 еквівалента, переважно від 0,01 до 0,1 еквівалента, по відношенню до сполуки, представлені формулою (XVII).

Зазначена вище реакція може бути здійснена в присутності інертного газу, якщо цього вимагають обставини. Інертний газ може, наприклад, являти собою газоподібний азот або газоподібний аргон.

Температура реакції для зазначеної вище реакції становить, як правило, від 0 °C до 300 °C, переважно від 120 °C до 180 °C, а тривалість реакції становить, як правило, від 1 хвилини до 72 годин, переважно від 1 години до 24 годин.

Серед сполук, які представлені зазначеною вище формулою (XVII), сполука, де R⁵ являє собою R^{5-a-1}, може бути одержана у відповідності до представлені нижче реакції (O):



де R^a, Hal-1, R^{5-a-1}, R⁴ і R⁶ - як це визначено вище, а Hal-2 являє собою галоген за умови, що Hal-1 і Hal-2 можуть бути однаковими або відрізнятися один від одного.

Зазначена вище реакція може бути здійснена в присутності основи, якщо цього вимагають обставини. Основа може, наприклад, являти собою карбонат лужного металу, такий як, наприклад, карбонат натрію, карбонат калію або карбонат цезію; карбонат лужноземельного металу, такий як, наприклад, карбонат кальцію або карбонат барію; гідроксид лужного металу, такий як, наприклад, гідроксид літію, гідроксид натрію або гідроксид калію; гідроксид лужноземельного металу, такий як, наприклад, гідроксид кальцію або гідроксид барію; гідрид лужного металу, такий як, наприклад, гідрид літію, гідрид натрію або гідрид калію; лужнолітійовий реагент, такий як, наприклад, *n*-бутиллітій; амід натрію (NaNH₂); або реагент Гриньяра, такий як, наприклад, бромід метилмагнію або хлорид ізопропілмагнію. Серед цих основ переважною може, наприклад, бути гідроксид лужного металу або карбонат лужного металу, а більш

переважною може, наприклад, бути гідроксид лужного металу. Ці основи можуть бути використані в кількості, як правило, від 0,02 до 200 еквівалентів, переважно від 0,2 до 20 еквівалентів, по відношенню до сполуки, представлені формулою (XVIII). Крім того, одна з цих основ або більше можуть бути вибрані відповідним чином для використання.

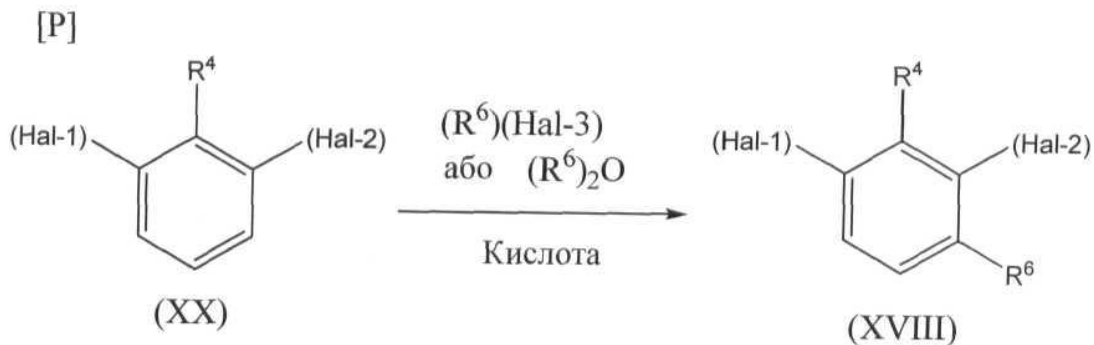
Металева сіль сполуки, представлені формулою (XIX), яка може бути використана в зазначеній вище реакції, може, наприклад, являти собою сіль лужного металу, таку як, наприклад, натрієва сіль або калієва сіль. Сполука формули (XIX) або її сіль може бути застосована в кількості, як правило, від 0,1 до 10 еквівалентів по відношенню до сполуки формули (XVIII).

Зазначена вище реакція може бути здійснена в присутності розчинника, якщо цього вимагають обставини. Розчинник може являти собою будь-який розчинник за умови, що він залишається інертним до реакції, і він може, наприклад, являти собою спирт, такий як, наприклад, метанол, етанол або 2-диметоксietанол; простий ефір, такий як, наприклад, діетиловий ефір, тетрагідрофуран, 1,4-діоксан, 1,2-диметоксietан або циклогексилметильовий ефір; апротонний полярний розчинник, такий як, наприклад, DMF, DMSO, DMA або сульфолан; або неполярний розчинник, наприклад, галогенізований вуглеводень, такий як, наприклад, метиленхлорид, хлороформ, дихлоретан або трихлоретан, або вуглеводень ароматичного ряду, такий як, наприклад, бензол, толуол, ксилол, нітробензол або хлорбензол. Крім того, сполука, яка представлена формулою (XIX), може служити одночасно як реагентом, так і розчинником. Як розчинник відповідним чином можна вибрати один з них або більше. Серед цих розчинників переважним може, наприклад, бути неполярний розчинник, а більш переважним може, наприклад, бути вуглеводень ароматичного ряду.

Зазначена вище реакція може бути здійснена в атмосфері інертного газу, якщо цього вимагають обставини. Інертний газ може, наприклад, являти собою газоподібний азот або газоподібний аргон.

Температура реакції в зазначеній вище реакції становить, як правило, від 0 °C до 200 °C, переважно від 70 °C до 150 °C, а тривалість реакції становить, як правило, від 1 хвилини до 48 годин, переважно від 30 хвилин до 10 годин.

Сполука, яка представлена зазначеною вище формулою (XVIII), може бути одержана у відповідності до представлені нижче реакції (P):



де R, R, Hal-1 і Hal-2 - як це визначено вище, Hal-3 являє собою галоген, а Hal-1, Hal-2 і Hal-3 можуть бути однаковими або відрізнятися один від одного.

Кислота, яка має бути використана в зазначеній вище реакції, може, наприклад, являти собою льюїсову кислоту, таку як, наприклад, хлорид цинку, бромід цинку, хлорид алюмінію, хлорид заліза, хлорид вісмуту, хлорид індію, хлорид сурми, трибромід бору або бромід заліза; метансульфонову кислоту, сірчану кислоту або трифторметансульфонову кислоту, і вона може бути використана в кількості, як правило, від 0,01 до 100 еквівалентів, переважно від 0,1 до 10 еквівалентів, по відношенню до сполуки, представлені формулою (XX). Відповідним чином можна вибрати одну з таких кислот або більше. Серед цих кислот переважною може, наприклад, бути хлорид заліза.

Алкілсульфонілгалогенід [(R⁶)(Hal-3)] або ангідрид алкілсульфонові кислоти [(R⁶)₂O], який має бути використаний у зазначеній вище реакції, може бути використаний в кількості, як правило, від 0,01 до 100 еквівалентів, переважно від 0,1 до 10 еквівалентів, по відношенню до сполуки, представлені формулою (XX). Галоген в алкілсульфонілгалогеніді може, наприклад, являти собою фтор, хлор, бром або йод. Серед такого алкілсульфонілгалогеніду або ангідриду алкілсульфонові кислоти переважним може, наприклад, бути алкілсульфонілгалогенід.

Зазначена вище реакція може бути здійснена в присутності розчинника, якщо цього вимагають обставини. Розчинник може являти собою будь-який розчинник за умови, що він залишається інертним до реакції, і він може, наприклад, являти собою галогенізований вуглеводень, такий як, наприклад, метиленхлорид, хлороформ, дихлоретан або трихлоретан; дисульфід вуглецю або нітромаган. Відповідним чином можна вибрати один з таких розчинників або більше. Крім того, сполука, яка представлена формулою (XX), може служити одночасно як реагентом, так і розчинником.

Температура реакції для зазначеної вище реакції становить, як правило, від 0 °C до 250 °C, переважно від 100 °C до 150 °C, а тривалість реакції становить, як правило, від 1 хвилини до 48 годин, переважно від 30 хвилин до 12 годин.

Коли реакційну суміш, яка містить сполуку формули (XVIII) і кислоту, яку одержують в результаті зазначеної вище реакції, залишають остигати, до неї повільно додають неорганічну кислоту і спиртовий розчинник, завдяки чому навіть після завершення процесу остигання реакційна суміш не загусає, що є перевагою з точки зору зручності роботи з нею і спрощує процес одержання продукту сполуки формули (XVIII) з невеликою кількістю включень. Неорганічна кислота, яка має бути використана в даному випадку, може, наприклад, являти собою хлористоводневу кислоту, сірчану кислоту, азотну кислоту або їхню суміш, а переважною може, наприклад, бути хлористоводнева кислота. Крім того, спиртовий розчинник може, наприклад, являти собою метанол, етанол, n-пропанол, i-пропанол, n-бутанол, втор-бутанол, i-пропанол або трет-бутанол, а переважним може, наприклад, бути спирт C₃, такий як, наприклад, n-пропанол або i-пропанол. Послідовність додавання неорганічної кислоти і спиртового розчинника може передбачати можливість додавання спочатку одного з них, або можливість додавання обох разом. Проте, переважною послідовністю є повільне додавання неорганічної кислоти з подальшим додаванням спиртового розчинника з тим, щоб температура реакційної суміші раптово не впала і щоб в результаті цього додавання вона не загустіла.

Сполуки у відповідності до даного винаходу мають чудову гербіцидну активність при їхньому використанні як активного інгредієнта гербіцидів. Діапазон застосування охоплює сільськогосподарські угіддя, такі як, наприклад, рисові плантації, поля із зерновими культурами, фруктові сади і шовковиці, і землі несільськогосподарського призначення, такі як, наприклад, лісові угіддя, путівці, ігрові майданчики і заводські площі. Спосіб застосування може бути вибраний відповідним чином з таких способів, як, наприклад, нанесення на ґрунт, нанесення на листяний покрив, внесення у воду, тощо.

Сполуки у відповідності до даного винаходу здатні боротися з широким рядом небажаних бур'янів, наприклад, з gramineae, такими як, наприклад, куряче просо (*Echinochloa crus-galli* L., *Echinochloa oryzicola* vasing), пальчатка кров'яна (*Digitaria sanguinalis* L., *Digitaria ischaemum* Muhl., *Digitaria adscendens* Henr., *Digitaria microbachne* Henr., *Digitaria horizontalis* Willd.), щетинник зелений (*Setaria viridis* L.), лисохвіст гігантський (*Setaria faberi* Herrm.), лисохвіст жовтий (*Setaria lutescens* Hubb.), елевзіна Індійська (*Eleusine indica* L.), віслюг (*Avena fatua* L.), сорго дике (*Sorghum halepense* L.), пирії повзучий (*Agropyron repens* L.), брахарія в'юнкава (*Brachiaria plantaginea*), просо велике (*Panicum maximum* Jacq.), просо пурпурне (*Panicum purpurascens*), лептохля Китайська (*Leptochloa chinensis*), лептохля червона (*Leptochloa panicea*), тонконіг однорічний (*Poa annua* L.), лисохвіст мишехвістникоподібний (*Alopecurus myosuroides* Huds.), пирій миготливий (*Agropyron tsukushiense* (Honda) Ohwi), брахіарія широколиста (*Brachiaria platyphylla* Nash), ценхрус південний (*Cenchrus echinatus* L.), плевел багатоквітковий (*Lolium multiflorum* Lam.) і свинорій пильчастий (*Cynodon dactylon* Pers.); з cyperaceae, такими як, наприклад, смикавець рисовий (*Cyperus iria* L.), смикавець пурпурний круглий (*Cyperus rotundus* L.), чуфа (*Cyperus esculentus* L.), очерет Японський (*Scirpus juncoides*), смикавець пізній (*Cyperus serotinus*), смикавець зонтичний дрібноквітковий (*Cyperus difformis*), ситняг (*Eleocharis acicularis*) і водяний каштан (*Eleocharis kuroguwai*); з alismataceae, такими як, наприклад, стрілолист карликовий Японський (*Sagittaria pygmaea*), стрілолист трилистий (*Sagittaria trifolia*) і подорожник вузьколистий (*Alisma canaliculatum*); з pontederiaceae, такими як, наприклад, монохорія піхвова (*Monochoria vaginalis*) і різновиди монохорії (*Monochoria korsakowii*); з scrophulariaceae, такими як, наприклад, просо гороб'яче несправжнє (*Lindernia pyxidaria*) і допатріум ситниковий (*Dopatrium junceum*); з lythraceae, такими як, наприклад, ротала Індійська (*Rotala indica*) і аманія багатоквіткова (*Ammannia multiflora*); з elatinaceae, такими як, наприклад, повійничок довгостебловий (*Elatine triandra* SCHK.); з malvaceae, такими як, наприклад, канатник Теофраста (*Abutilon theophrasti* MEDIC.) і грудинка колюча (*Sida spinosa* L.); з compositae, такими як, наприклад, реп'яшок овечий (*Xanthium strumarium* L.), амброзія звичайна (*Ambrosia elatior* L.), чортополох (*Breia setosa* (BIEB.) KITAM.), галінсого мохната (*Galinsoga ciliata* Blake) і ромашка лікарська (*Matricaria chamomilla* L.); з

solanaceae, такими як, наприклад, пасльон чорний (*Solanum nigrum* L.) і дурман смердючий (*Datura stramonium*); з amaranthaceae, такими як, наприклад, амарант зелений (*Amaranthus viridis* L.) і щириця колосиста (*Amaranthus retroflexus* L.); з polygonaceae, такими як, наприклад, горець білолистий (*Polygonum lapathifolium* L.), горець почечуйний (*Polygonum persicaria* L.),
 5 горець в'юнковий (*Polygonum convolvulus* L.) і спориш (*Polygonum aviculare* L.); з cruciferae, такими як, наприклад, жеруха звивиста (*Cardamine flexuosa* WITH.), пастуша сумка звичайна (*Capsella bursa-pastoris* Medik.) і гірчиця сиза (*Brassica juncea* Czern.); з convolvulaceae, такими як, наприклад, іпомея пурпурна (*Ipomoea purpurea* L.), березка польова *Calystegia arvensis* L.) і в'юнок плющоподібний (*Ipomoea hederacea* Jacq.); з Chenopodiaceae, такими як, наприклад,
 10 лобода біла звичайна (*Chenopodium album* L.) і кохія мексиканська (*Kochia scoparia* Schrad.); з Portulacaceae, такими як, наприклад, портулак городній (*Portulaca oleracea* L.); з leguminosae, такими як, наприклад, астрагал серповидний (*Cassia obtusifolia* L.); з caryophyllaceae, такими як, наприклад, зірочник середній (*Stellaria media* L.); з labiatae, такими як, наприклад, кропива глуха (*Lamium amplexicaule* L.); з rubiaceae, такими як, наприклад, підмаренник чіпкий (*Galium spurium* L.); з euphorbiaceae, такими як, наприклад, грушанка трьохнасінна (*Acalypha australis* L.); і з Commelinaceae, такими як, наприклад, комеліна (*Commelina communis* L.).

Таким чином, вони можуть ефективно використовуватися для селективної боротьби з шкідливими бур'янами або для неселективної боротьби зі шкідливими бур'янами при вирощуванні корисних зернових культур, таких як, наприклад, кукурудза (*Zea mays* L.), соя
 20 (*Glycine max* Merr.), бавовна (*Gossypium* spp.), пшениця (*Triticum* spp.), рис (*Oryza sativa* L.), ячмінь посівний (*Hordeum vulgare* L.), жито (*Secale cereale* L.), овес (*Avena sativa* L.), сорго (*Sorghum bicolor* Moench), рапс (*Brassica napus* L.), соняшник (*Helianthus annuus* L.), цукровий буряк (*Beta vulgaris* L.), цукрова тростина (*Saccharum officinarum* L.), газонна трава Японська (*Zoysia japonica* Steud.), арахіс (*Arachis hypogaea* L.), льон (*Linum usitatissimum* L.), тютюн
 25 (*Nicotiana tabacum* L.) і кава (*Coffea* spp.). Більш конкретно, сполуки у відповідності до даного винаходу ефективно використовуються для селективної боротьби з шкідливими бур'янами при вирощуванні кукурудзи, сої, бавовни, пшениці, рису, рапсу, соняшника, цукрового буряка, цукрової тростини, Японської газонної трави, арахісу, льону, тютюну, кави і тому подібне, а серед них, особливо кукурудзи, пшениці, рису, Японської газонної трави і тому подібне. При
 30 вирощуванні таких зернових культур, наприклад, при вирощуванні кукурудзи, серед зазначених вище шкідливих бур'янів gramineae і malvaceae, наприклад, є типовими шкідливими бур'янами, і в цьому зв'язку як бур'яни, з якими важко боротися, слід зазначити щетинник зелений, просо велике і канатник Теофраста. Будучи безпечними для зернових культур, сполуки у відповідності до даного винаходу можуть використовуватися особливо ефективно не тільки для боротьби із
 35 зазначеними вище шкідливими бур'янами, але й для боротьби з шкідливими бур'янами, які важко піддаються знищенню, наприклад, з щетинником зеленим, просом великим, канатником Теофраста і лисохвостом гігантським.

Сполука у відповідності до даного винаходу може бути змішана з різноманітними сільськогосподарськими добавками і застосована у формі різноманітних готових форм, таких як,
 40 наприклад, дуст, гранули, гранули, що диспергуються у воді, змочувальні порошки, таблетки, пілюлі, капсули (включаючи готову форму, упаковану у водорозчинну плівку), суспензії на водній основі, суспензії на масляній основі, мікроемульсії, емульсії на основі суспензій, водорозчинні порошки, концентрати емульсій, розчинні концентрати або пасти. Вона може бути сформульована в будь-яку форму, готову для застосування, яка традиційно використовується в
 45 даній області техніки, за умови, що при цьому може бути досягнута ціль даного винаходу.

Добавки, які мають бути використані в готовій для застосування формі, включають, наприклад, твердий носій, такий як, наприклад, діатомова земля, гашене вапно, карбонат кальцію, тальк, біла сажа, каолін, бентоніт, суміш каолініту і серициту, глина, карбонат натрію, бікарбонат натрію, мірабіліт, цеоліт або крохмаль; розчинник, такий як, наприклад, вода, толуол,
 50 ксилол, сольвент-нафта, діоксан, ацетон, ізофорон, метилізобутилкетон, хлорбензол, циклогексан, диметилсульфоксид, N,N-диметилформамід, диметилацетамід, N-метил-2-піролідон або спирт; аніоногенну поверхнево-активну речовину, таку як, наприклад, сіль жирної кислоти, бензоат, алкілсульфосукцинат, діалкілсульфосукцинат, полікарбоксилат, сіль складного ефіру алкілсірчаної кислоти, алкілсульфат, алкіларилсульфат, сульфат простого ефіру алкілдигліколю, сіль складного ефіру багатоатомного спирту і сірчаної кислоти,
 55 алкілсульфонат, алкіларилсульфонат, арилсульфонат, лігнінсульфонат, дисульфонат алкілдіфенілового ефіру, полістиролсульфонат, сіль складного ефіру алкілфосфорної кислоти, алкіларилфосфат, стирларилфосфат, сіль поліоксиетиленаалкілового ефіру і складного ефіру сірчаної кислоти, сульфат поліоксиетиленаалкіларилового ефіру, сіль
 60 поліоксиетиленаалкіларилового ефіру і складного ефіру сірчаної кислоти, фосфат

поліоксиетиленаалкілового ефіру, сіль складного ефіру поліоксиетиленаалкіларилфосфорної кислоти, сіль поліоксиетиленаарилового ефіру і складного ефіру фосфорної кислоти, нафталінсульфонат, конденсований з формальдегідом, або алкілнафталінсульфонат, конденсований з формальдегідом; неіоногенну поверхнево-активну речовину, таку як, наприклад, складний ефір сорбіту і жирної кислоти, складний ефір гліцерину і жирної кислоти, полігліцерид жирної кислоти, ефір полігліколю багатоатомного спирту і жирної кислоти, ацетиленгліколь, ацетиленовий спирт, оксіалкіленовий блок-полімер, поліоксиетиленаалкіловий ефір, поліоксиетиленаалкіларилловий ефір, поліоксиетиленстириларилловий ефір, алкіловий ефір поліоксиетиленгліколю, поліетиленгліколь, поліоксиетиленовий ефір жирної кислоти, поліоксиетиленовий ефір сорбіту і жирної кислоти, поліоксиетиленовий ефір гліцерину і жирної кислоти, касторова олія, гідрогенізована поліоксиетиленом, або поліоксипропіленовий ефір жирної кислоти; і рослинне масло або мінеральне масло, таке як, наприклад, оливкове масло, капокове масло, касторове масло, пальмове масло, камелієве масло, кокосове масло, кунжутне масло, кукурудзяне масло, масло з висівок рису, арахісове масло, бавовняне масло, соєве масло, рапсове масло, льняне масло, тунгове масло або рідкі парафіни. Ці добавки можуть бути вибрані відповідним чином для використання окремо або в комбінації у вигляді суміші двох з них або більше за умови, що вони відповідають цілі даного винаходу. Крім того, для використання серед відомих в даній області техніки добавок відповідним чином можуть бути вибрані добавки, які відрізняються від зазначених вище. Наприклад, можуть бути використані різноманітні традиційно застосовні добавки, такі як, наприклад, наповнювач, загусник, засіб проти утворення осаду, антифриз, стабілізатор дисперсії, консервуючий засіб, протицвілевий засіб, засіб для утворення пазирів, дезінтегратор і зв'язувальна речовина. Масове співвідношення між сполукою у відповідності до даного винаходу і такими різноманітними добавками може становити від 0,1: 99,9 до 95:5, переважно від 0,2:99,8 до 85:15.

Доза гербіциду, який містить сполуку у відповідності до даного винаходу, в цілому, не може бути визначена, оскільки вона коливається в залежності від погодних умов, стану ґрунту, типу готової для застосування форми, сезону застосування і т.п. Проте він, як правило, застосовується з урахуванням кількості сполуки у відповідності до даного винаходу від 0,1 до 5000 г, переважно від 0,5 до 1000 г, більш переважно від 1 до 500 г, на гектар. Даний винахід включає такий спосіб боротьби з небажаними бур'янами шляхом такого застосування гербіциду.

Крім того, гербіцид, який містить сполуку у відповідності до даного винаходу, може бути змішаний або може бути використаний в комбінації з агрохімічними засобами, добривами або засобами для зниження фітотоксичності, завдяки чому іноді може бути досягнутий синергічний ефект або дія. Такі інші агрохімічні засоби включають, наприклад, гербіцид, фунгіцид, антибіотик, рослинний гормон і інсектицид. Особливо, при застосуванні змішаної гербіцидної композиції, що містить сполуку у відповідності до даного винаходу, яка змішана з однією або більше активними сполуками інших гербіцидів або яка використовується в комбінації з ними, в переважних напрямках може бути модифікований діапазон бур'янів, які підлягають знищенню, вибраний час нанесення композиції, підвищена гербіцидна активність і тому подібне. Сполука у відповідності до даного винаходу і активні сполуки інших гербіцидів можуть бути приготовані окремо таким чином, що вони можуть бути змішані для використання під час застосування, або вони можуть бути приготовані разом. Даний винахід включає таку змішану гербіцидну композицію.

Співвідношення між сполукою у відповідності до даного винаходу і активними інгредієнтами інших гербіцидів, в цілому, не може бути визначене, оскільки воно коливається в залежності від погодних умов, стану ґрунту, типів готових для застосування форм, часу застосування, способу застосування і тому подібне, проте інші гербіциди підмішують в кількості від 0,001 до 10 000 масових частин, переважно від 0,01 до 1000 масових частин, на один тип активної сполуки, з розрахунку на 1 масову частину сполуки у відповідності до даного винаходу. Крім того, доза для застосування є такою, що сумарна концентрація активних сполук становить від 0,1 до 10 000 г, переважно від 0,2 до 5000 г, більш переважно від 10 до 3000 г, на гектар. Даний винахід включає спосіб боротьби з небажаними бур'янами шляхом застосування такої змішаної гербіцидної композиції.

Інша гербіцидно активна сполука включає, наприклад, сполуки, представлені нижче (загальноприйняті найменування, що включають й ті найменування, на які подані заявки для затвердження Міжнародною організацією зі стандартизації (ISO)). Навіть якщо вони й конкретно не згадуються в даному описі, в тих випадках, коли такі сполуки мають солі, алкілові ефіри і так далі, вони всі, звичайно, включені в даний винахід.

(1) Сполуки, які, як це прийнято вважати, виявляють гербіцидну активність шляхом порушення гормональної активності рослин, наприклад, сполуки, що відносяться до феноксильного типу, такі як, наприклад, 2,4-D, 2,4-D-бутотил, 2,4-D-бутил, 2,4-D-диметиламоній,

2,4-D-діоламін, 2,4-D-етил, 2,4-D-2-етилгексил, 2,4-D-ізобутил, 2,4-D-ізоктил, 2,4-D-ізопропіл, 2,4-D-ізопропіламоній, 2,4-D-натрій, 2,4-D-ізопропаноламоній, 2,4-D-троламін, 2,4-DB, 2,4-DB-бутил, 2,4-DB-диметиламоній, 2,4-DB-ізоктил, 2,4-DB-калій, 2,4-DB-натрій, дихлорпроп, дихлорпроп-бутотил, дихлорпроп-диметиламоній, дихлорпроп-ізоктил, дихлорпроп-калій, дихлорпроп-Р, дихлорпроп-Р-диметиламоній, дихлорпроп-Р-калій, дихлорпроп-Р-натрій, МСРА, МСРА-бутотил, МСРА-диметиламоній, МСРА-2-етилгексил, МСРА-калій, МСРА-натрій, МСРА-тіоетил, МСРВ, МСРВ-етил, МСРВ-натрій, мекопроп, мекопроп-бутотил, мекопроп-натрій, мекопроп-Р, мекопроп-Р-бутотил, мекопроп-Р-диметиламоній, мекопроп-Р-2-етилгексил, мекопроп-Р-калій, напроанлід або кломеппро; сполуки, що відносяться до типу карбонових кислот ароматичного ряду, такі як, наприклад, 2,3,6-ТВА, дикамба дикамба-бутотил, дикамба-диглікольамін, дикамба-диметиламоній, дикамба-діоламін, дикамба-ізопропіламоній, дикамба-калій, дикамба-натрій, дихлобеніл, піклорам, піклорам-диметиламоній, піклорам-ізоктил, піклорам-калій, піклорам-тріізопропаноламоній, піклорам-тріізопропіламоній, піклорам-троламін, триклопір, триклопір-бутотил, триклопір-тріетиламоній, клопіралід, клопіралід-оламін, клопіралід-калій, клопіралід-тріізопропаноламоній або амінопіралід; та інші, такі як, наприклад, напталам, напталам-натрій, беназолін, беназолін-етил, хінклорак, хінмерак, дифлуфензопір, дифлуфензопір-натрій, флуороксіпір, флуороксіпір-2-бутоксі-1-метилетил, флуороксіпір-мептил, хлорфлуренол або хлорфлуренол-метил.

(2) Сполуки, які, як це прийнято вважати, виявляють гербіцидну активність шляхом інгібування фотосинтезу рослин, наприклад, сполуки, що відносяться до типу сечовини, такі як, наприклад, хлоротолурон, діурон, флуометурон, лінурон, ізопротурон, метобензурон, тебутіурон, димефурон, ізоурон, карбутилат, метабензтіазурон, метоксурон, монолінурон, небурон, сидурон, тербуметон або тріетазин; сполуки, що відносяться до тріазинового типу, такі як, наприклад, симазин, атразин, атратон, симетрин, прометрин, диметаметрин, гексазинон, метрибузин, тербутилазин, ціаназин, аметрин, цибутрин, тріазифлам, тербутрин, пропазин, метамітрон, прометон або індазифлам; сполуки, що відносяться до урацилового типу, такі як, наприклад, бромацил, бромацил-літій, ленацил або тербацил, сполуки, що відносяться до анілідного типу, такі як, наприклад, пропаніл або ципромід, сполуки, що відносяться до карбаматного типу, такі як, наприклад, свеп, десмедифам або фенмедифам, сполуки, що відносяться до гідроксибензонітрилового типу, такі як, наприклад, бромоксиніл, бромоксиніл-октаноат, бромоксиніл-гептаноат, ізоксиніл, ізоксиніл-октаноат, ізоксиніл-калій або ізоксиніл-натрій; та інші, такі як, наприклад, піридат, бентазон, бентазон-натрій, амікарбазон, метазол або пентахлор.

(3) Сполуки, що відносяться до типу солі четвертинного амонію, наприклад, паракват або дикват, які, як це прийнято вважати, самі перетворювалися на вільні радикали з утворенням активного кисню в рослинному організмі і демонструють швидку гербіцидну дію.

(4) Сполуки, які, як це прийнято вважати, виявляють гербіцидну активність шляхом інгібування біосинтезу хлорофілу рослин і аномального акумулювання фотосинтезуючої пероксидної речовини в рослинному організмі, наприклад, сполуки, що відносяться до дифенілефірного типу, такі як, наприклад, нітрофен, хлометоксифен, біфенокс, ацифлуорфен, ацифлуорфен-натрій, фомезафен, фомезафен-натрій, оксифлуорфен, лактофен, аклоніфен, етоксифен-етил (НС-252), флуороглікофен-етил або флуороглікофен; сполуки, що відносяться до типу циклічних імідів, такі як, наприклад, хлорфталім, флуміоксазин, флуміклорак, флуміклорак-пентил, цинідон-етил або флутіацет-метил; та інші, такі як, наприклад, оксадіаргіл, оксадіазон, сульфентразон, карфентразон-етил, тидіазимін, пентоксазон, азафенідин, ізопропазол, пірафлуфен-етил, бензфендизон, бутафенацил, сафлуфенацил, флупоксам, флаузолат, профлаузол, пірахлоніл, флуфенпір-етил і бенкарбазон.

(5) Сполуки, які, як це прийнято вважати, виявляють гербіцидну активність, яка характеризується етіюванням, шляхом інгібування утворення пігменту в рослинах, наприклад, каротиноїдів, наприклад, сполуки, що відносяться до піридазинового типу, такі як, наприклад, норфлуразон, хлоридазон або метфлуразон, сполуки, що відносяться до піразольного типу, такі як, наприклад, піразолінат, піразоксифен, бензофенап, топрамезон (BAS-670H) або пірасульфтол; та інші, такі як, наприклад, амітрол, флуридон, флуортамон, дифлуфенікан, метоксифенон, кломазон, сулькотріон, мезотріон, темботріон, тефурилтріон (AVH-301), ізоксафлутол, дифензокват, дифензокват-метилсульфат, ізоксахлортол, бензобіциклон, піколінафен або бефлубутамід.

(6) Сполуки, які виявляють сильну гербіцидну активність особливо у відношенні до трав'янистих рослин, наприклад, сполуки, що відносяться до типу арилоксифеноксипропіонової кислоти, такі як, наприклад, диклофоп-метил, диклофоп, пірифеноп-натрій, флауазифоп-бутил, флауазифоп, флауазифоп-Р, флауазифоп-Р-бутил, галоксифоп-метил, галоксифоп, галоксифоп-

етотил, галоксифоп-Р, галоксифоп-Р-метил, хізалофоп-етил, хізалофоп-Р, хізалофоп-Р-етил, хізалофоп-Р-тефурил, цигалофоп-бутил, феноксапроп-етил, феноксапроп-Р, феноксапроп-Р-етил, метаміфоп-пропіл, метаміфоп, клодинафоп-пропаргіл, клодинафоп або пропахізафоп; сполуки, що відносяться до циклогександіонового типу, такі як, наприклад, алоксидим-натрій, алоксидим, клетодим, сетоксидим, тралкоксидим, бутроксидим, тепралоксидим, профоксидим або циклоксидим; або інші, такі як, наприклад, флампроп-М-метил, флампроп-М або флампроп-М-ізопропіл.

(7) Сполуки, які, як це прийнято вважати, виявляють гербіцидну активність шляхом інгібування біосинтезу амінокислоти рослин, наприклад, сполуки, що відносяться до типу сульфонілсечовини, такі як, наприклад, хлоримурон-етил, хлоримурон, сульфометурон-метил, сульфометурон, примісульфурон-метил, примісульфурон, бенсульфурон-метил, бенсульфурон, хлорсульфурон, метсульфурон-метил, метсульфурон, циносульфурон, піразоссульфурон-етил, піразоссульфурон, флазасульфурон, римсульфурон, нікосульфурон, імазосульфурон, циклосульфамурон, просульфурон, азимсульфурон, флупірсульфурон-метил-натрій, флупірсульфурон, трифлусульфурон-метил, трифлусульфурон, галосульфурон-метил, галосульфурон, тифенсульфурон-метил, тифенсульфурон, етоксисульфурон, оксасульфурон, етаметсульфурон, етаметсульфурон-метил, йодосульфурон, йодосульфурон-метил-натрій, сульфосульфурон, тріасульфурон, трибенурон-метил, трибенурон, тритосульфурон, форамсульфурон, трифлорисульфурон, трифлорисульфурон-натрій, мезосульфурон-метил, мезосульфурон, ортосульфамурон, флуцетосульфурон, амідосульфурон, пропірисульфурон (ТН-547), NC-620, сполука, розкрита в WO2005092104; сполуки, що відносяться до тріазолопіримідинсульфонамідного типу, такі як, наприклад, флуметсулам, метосулам, диклосулам, клорансулам-метил, флора сулам, пенокссулам або пірокссулам; сполуки, що відносяться до імідазолінонового типу, такі як, наприклад, імазапир, імазапир-ізопропіламоній, імазетапир, імазетапир-амоній, імазахін, імазахін-амоній, імазамокс, імазамокс-амоній, імазаметабенз, імазаметабенз-метил або імазапик; сполуки, що відносяться до типу піримідинілсаліцилової кислоти, такі як, наприклад, піритіобак-натрій, біспірибак-натрій, піримінобак-метил, пірибензоксим, пірифталід, піримісульфан (КУН-021); сполуки, що відносяться до сульфоніламінокарбонілтріазолінонового типу, такі як, наприклад, флукарбазон, флукарбазон-натрій, пропоксикарбазон-натрій або пропоксикарбазон; та інші, такі як, наприклад, гліфосат, гліфосат-натрій, гліфосат-калій, гліфосат-амоній, гліфосат-діамоній, гліфосат-ізопропіламоній, гліфосат-тримезій, гліфосат-сесквінатрій, глүфосинат, глүфосинат-амоній, глүфосинат-Р, глүфосинат-Р-амоній, глүфосинат-Р-натрій, біланафос, біланафос-натрій або цинметилін.

(8) Сполуки, які, як це прийнято вважати, виявляють гербіцидну активність шляхом інгібування мітозу клітин рослин, наприклад, сполуки, що відносяться до динітроанілінового типу, такі як, наприклад, трифлуралін, оризалін, нітралін, пендиметалін, еталфлуралін, бенфлуралін, продіамін, бутралін або динітрамін; сполуки, що відносяться до амідного типу, такі як, наприклад, бенсулід, напронамід, пропізамід або пронамід; сполуки, що відносяться до фосфорорганічного типу, такі як, наприклад, аміпрофос-метил, бутаміфос, анілофос або піперофос; сполуки, що відносяться до фенілкарбаматного типу, такі як, наприклад, профам, хлорпрофам, барбан або карбетамід; сполуки, що відносяться до куміламінового типу, такі як, наприклад, діамурон, куміурон, бромобутид або метилдимрон; та інші, такі як, наприклад, асулам, дитіопір, тіазопір, хлортал-диметил, хлортал або дифенамід.

(9) Сполуки, які, як це прийнято вважати, виявляють гербіцидну активність шляхом інгібування біосинтезу протеїнів або біосинтезу ліпідів рослин, наприклад, сполуки, що відносяться до хлорацетамідного типу, такі як, наприклад, алахлор, метазахлор, бутахлор, претилахлор, метолахлор, S-метолахлор, тенілхлор, петоксамід, ацетохлор, пропахлор, диметенамід, диметенамід-Р, пропізохлор або диметахлор; сполуки, що відносяться до тіокарбаматного типу, такі як, наприклад, молінат, димепіперат, пірибутикарб, ЕРТС, бутилат, вернолат, пебулат, циклоат, просульфоккарб, еспокарб, тіобенкарб, діалат, три-алат або орбенкарб; та інші, такі як, наприклад, етобензанід, мефенацет, флуфенацет, тридифан, кафенстрол, фентразамід, оксазикломефон, інданофан, бенфуресат, піроксасульфон (КІН-485), далапон, далапон-натрій, ТСА-натрій або трихлороцтова кислота.

(10) MSMA, DSMA, CMA, ендотал, ендотал-дикалій, ендотал-натрій, ендотал-моно-N,N-диметилалкіламоній), етофумесат, хлорат натрію, пеларгонова кислота, нонілова кислота, фосамін, фосамін-амоній, піноксаден, іпфенкарбазон (НОК-201), аклолеїн, сульфамат амонію, боракс, хлороцтова кислота, хлорацетат натрію, ціанамід, метиларсонова кислота, диметиларсонова кислота, диметиларсинат натрію, динотерб, динотерб-амоній, динотерб-діоламін, динотерб-ацетат, DNOC, гептагідрат сульфату заліза(II), флупропанат, флупропанат-

натрій, ізоксабен, мефлуїдид, мефлуїдид-діоламін, метам, метам-амоній, метам-калій, метам-натрій, метилізотіоціанат, пентахлорофенол, пентахлорфеноксид натрію, пентахлорфеноллаурат, хінокламін, сірчана кислота, сульфат сечовини і т.д.

5 (11) Сполуки, які, як це прийнято вважати, виявляють гербіцидну активність шляхом паразитування на рослинах, такі як, наприклад, *Xanthomonas campestris*, *Epicoccossirus nematosorus*, *Epicoccossirus nematosperus*, *Exserohilum monoseras* або *Drechsrela monoceras*.

Приклади переважних варіантів здійснення даного винаходу представлені нижче, але даний винахід жодним чином не обмежений ними.

10 (1) 1-(4-(3-(Етоксиметил)-2-метил-4-(метилсульфоніл)бензоїл)-1-метил-1Н-піразол-5-ілокси)етилметилкарбонат (представлена нижче сполука № 1-1)

(2) Метил-3-(5-(1-(метоксикарбонілокси)етокси)-1-метил-1Н-піразол-4-карбоніл)-2-метил-6-(метилсульфоніл)бензоат (представлена нижче сполука № 1-

2)

15 (3) 1-(4-(3-(Метоксиметил)-2-метил-4-(метилсульфоніл)бензоїл)-1-метил-1Н-піразол-5-ілокси)етилметилкарбонат (представлена нижче сполука № 1-3)

(4) 1-(4-(3-(Етоксиметил)-2-метил-4-(метилсульфоніл)бензоїл)-1-метил-1Н-піразол-5-ілокси)етилетилкарбонат (представлена нижче сполука № 1-4)

(5) Етил-1-(4-(3-(2-ізопропоксиетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)бензоїл)-1-метил-1Н-піразол-5-ілокси)етилкарбонат (представлена нижче сполука № 1-5)

20 (6) 1-(4-(3-(2-Метоксиетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)бензоїл)-1,3-диметил-1Н-піразол-5-ілокси)етилметилкарбонат (представлена нижче сполука № 1-6)

(7) 1-(1-Етил-4-(3-(2-метоксиетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)бензоїл)-1Н-піразол-5-ілокси)етилметилкарбонат (представлена нижче сполука № 2-1)

25 (8) Метил-3-(5-(1-(метоксикарбонілокси)етокси)-1-етил-1Н-піразол-4-карбоніл)-2-метил-6-(метилсульфоніл)бензоат (представлена нижче сполука № 2-2)

(9) Етил-1-(1-етил-4-(3-(2-метоксиетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)бензоїл)-3-метил-1Н-піразол-5-ілокси)етил карбонат (представлена нижче сполука № 2-3)

(10) Етил-1-(1-н-пропіл-4-(3-(2-метоксиетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)бензоїл)-1Н-піразол-5-ілокси)етилкарбонат (представлена нижче сполука № 3-1)

30 (11) 1-(1-Ізопропіл-4-(3-(2-метоксиетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)бензоїл)-1Н-піразол-5-ілокси)етилметилкарбонат (представлена нижче сполука № 4-1)

(12) (5-Гідрокси-1-метил-1Н-піразол-4-іл)(3-(2-ізопропілетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)феніл)кетон (представлена нижче сполука № 5-1)

35 (13) (5-Гідрокси-1,3-диметил-1Н-піразол-4-іл)(3-(2-метоксиетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)феніл)кетон (представлена нижче сполука № 5-2)

(14) (5-Гідрокси-1-метил-3-етил-1Н-піразол-4-іл)(3-(2-метоксиетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)феніл)кетон (представлена нижче сполука № 5-3)

(15) (1-Етил-5-гідрокси-3-метил-1Н-піразол-4-іл)(3-(2-метоксиетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)феніл)кетон (представлена нижче сполука № 6-1)

40 (16) (5-Гідрокси-1-н-пропіл-1Н-піразол-4-іл)(3-(2-метоксиетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)феніл)кетон (представлена нижче сполука № 7-1)

(17) (5-Гідрокси-1-ізопропіл-1Н-піразол-4-іл)(3-(2-метоксиетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)феніл)кетон (представлена нижче сполука № 8-1)

45 (18) (5-Гідрокси-1-ізопропіл-3-метил-1Н-піразол-4-іл)(3-(2-метоксиетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)феніл)кетон (представлена нижче сполука № 8-2)

(19) Металева сіль (5-гідрокси-1-етил-1Н-піразол-4-іл)(3-(2-метоксиетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)феніл)кетону

(20) Калієва сіль (5-гідрокси-1-етил-1Н-піразол-4-іл)(3-(2-метоксиетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)феніл)кетону

50 (21) Натрієва сіль (5-гідрокси-1-етил-1Н-піразол-4-іл)(3-(2-метоксиетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)феніл)кетону

(22) Гербіцидна композиція, яка містить сполуку піразолу у відповідності до зазначених вище пунктів (1) - (21) або її сіль і адьювант сільськогосподарського призначення.

55 (23) Спосіб боротьби з небажаними рослинами або інгібування їхнього росту, який включає застосування гербіцидно ефективної кількості сполуки піразолу у відповідності до зазначених вище пунктів (1) - (21) або її солі до небажаних рослин або до місця, де вони виростають.

(24) Спосіб у відповідності до зазначеного вище пункту (23), який відрізняється тим, що боротьба з небажаними рослинами або інгібування їхнього росту здійснюється на кукурудзяному полі.

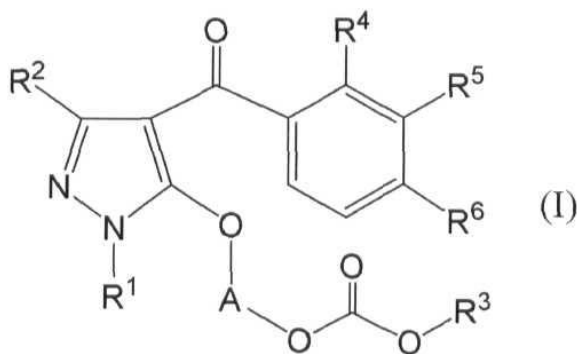
(25) Спосіб у відповідності до зазначеного вище пункту (24), який відрізняється тим, що кукурудза являє собою трансформовану кукурудзу.

(26) Спосіб у відповідності до зазначеного вище пункту (23), який відрізняється тим, що боротьбу з небажаними рослинами або інгібування їхнього росту здійснюють на пшеничному, ячмінному або житньому полі.

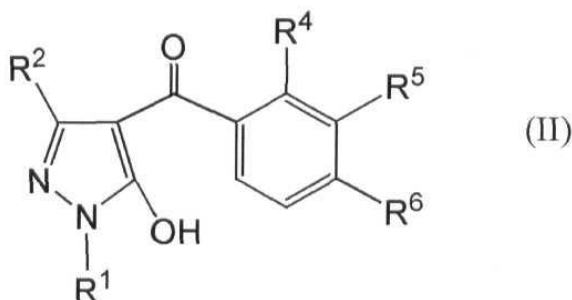
(27) Спосіб у відповідності до зазначеного вище пункту (23), який відрізняється тим, що боротьбу з небажаними рослинами або інгібування їхнього росту здійснюють на рисовому полі.

(28) Спосіб у відповідності до зазначеного вище пункту (23), який відрізняється тим, що боротьбу з небажаними рослинами або інгібування їхнього росту здійснюють на землі несільськогосподарського призначення.

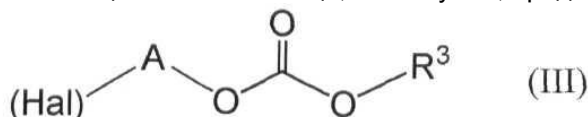
(29) Спосіб одержання сполуки піразолу, яка представлена формулою (I), або її солі:



де R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ і A - як це визначено вище, який включає введення сполуки піразолу, представленої формулою (II), або її солі:



де R¹, R², R³, R⁴, R⁵, і R⁶ - як це визначено вище, зі сполукою, представленою формулою (III):

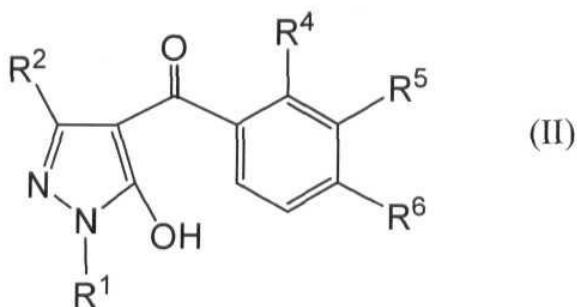


де R³, Hal і A - як це визначено вище.

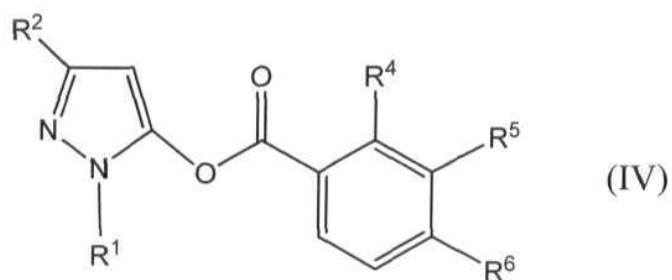
(30) Спосіб у відповідності до зазначеного вище пункту (29), який відрізняється тим, що його здійснюють в присутності броміду п-тетрабутиламонію і розчинника ароматичного ряду.

(31) Спосіб у відповідності до зазначеного вище пункту (30), який відрізняється тим, що розчинник ароматичного ряду являє собою толуол.

(32) Спосіб одержання сполуки піразолу, яка представлена формулою (II):



де R¹, R², R⁴, R⁵ і R⁶ - як це визначено вище, або її солі, який включає введення сполуки, представленої формулою (IV):



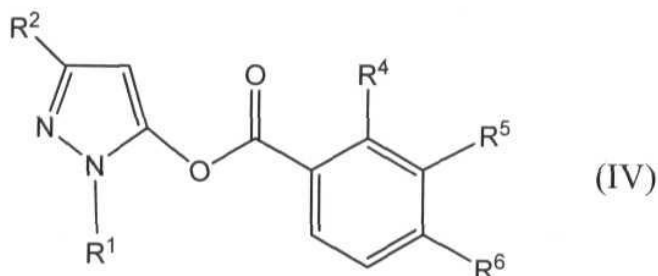
де R^1 , R^2 , R^4 , R^5 і R^6 - як це визначено вище, в реакцію перегрупування в присутності карбонату лужного металу і розчинника ароматичного ряду.

(33) Спосіб у відповідності до зазначеного вище пункту (32), який відрізняється тим, що карбонат лужного металу являє собою карбонат калію.

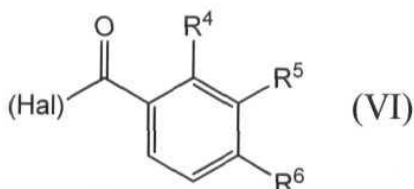
(34) Спосіб у відповідності до зазначеного вище пункту (32), який відрізняється тим, що розчинник ароматичного ряду являє собою толуол.

(35) Спосіб у відповідності до зазначеного вище пункту (32), який відрізняється тим, що сіль формули (II) являє собою сіль калію.

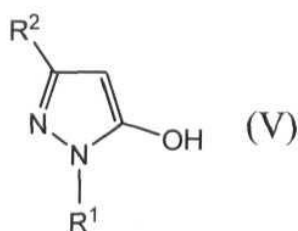
(36) Спосіб одержання сполуки, яка представлена формулою (IV):



де R^1 , R^2 , R^4 , R^5 і R^6 - як це визначено вище, який включає введення сполуки, представленої формулою (VI):



де R^4 , R^5 , R^6 і Hal - як це визначено вище, зі сполукою, представленою формулою (V):

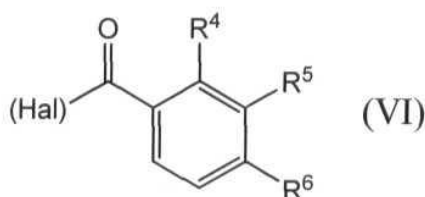


де R^1 і R^2 - як це визначено вище, або її сіллю в присутності основи і розчинника ароматичного ряду.

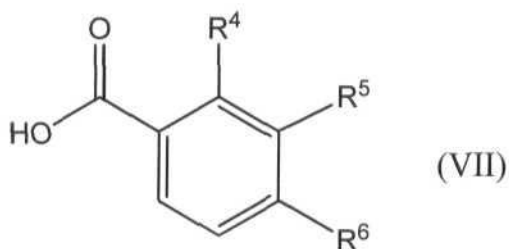
(37) Спосіб у відповідності до зазначеного вище пункту (36), який відрізняється тим, що основа являє собою триетиламін.

(38) Спосіб у відповідності до зазначеного вище пункту (36), який відрізняється тим, що розчинник ароматичного ряду являє собою толуол.

(39) Спосіб одержання сполуки, яка представлена формулою (VI):



де R^4 , R^5 , R^6 і Hal - як це визначено вище, який включає введення сполуки, представленої формулою (VII):

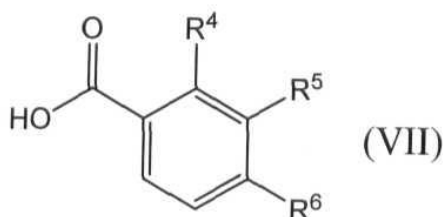


де R^4 , R^5 і R^6 - як це визначено вище, з галогенізуючим засобом в присутності розчинника ароматичного ряду.

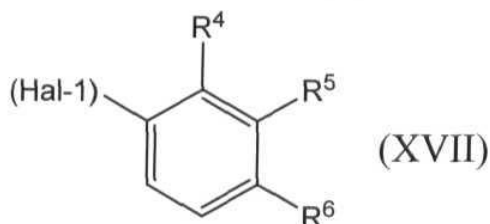
(40) Спосіб у відповідності до зазначеного вище пункту (39), який відрізняється тим, що галогенізуючий засіб являє собою тіоніл хлорид.

(41) Спосіб у відповідності до зазначеного вище пункту (39), який відрізняється тим, що розчинник ароматичного ряду являє собою толуол.

(42) Спосіб одержання сполуки, яка представлена формулою (VII):



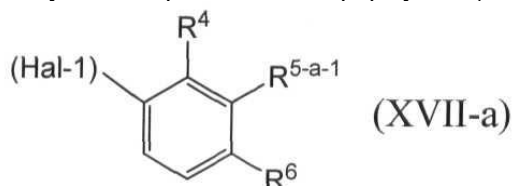
де R^4 , R^5 і R^6 - як це визначено вище, який включає введення сполуки, представленої формулою (XVII):



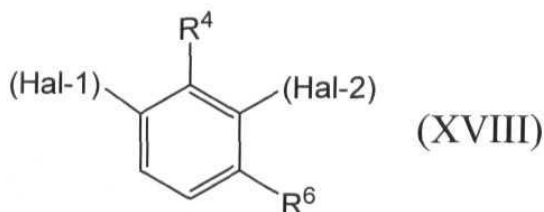
де R^4 , R^5 і R^6 і Hal-1 - як це визначено вище, з монооксидом вуглецю або еквівалентною йому сполукою і H_2O в присутності каталізатора і основи шляхом використання спирту C_4 як розчинника.

(43) Спосіб у відповідності до зазначеного вище пункту (42), який відрізняється тим, що спирт C_4 являє собою трет-бутиловий спирт.

(44) Спосіб одержання сполуки, яка представлена формулою (XVII-a):



де Hal-1, R^4 , R^6 і R^{5-a-1} - як це визначено вище, який включає введення сполуки, представленої формулою (XVIII):

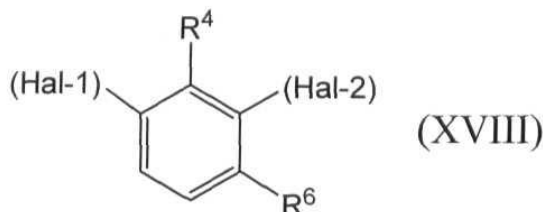


де R^4 , R^6 , Hal-1 і Hal-2 - як це визначено вище, зі сполукою, представленою формулою (XIX): $HO-R^a$, де R^a - як це визначено вище, в присутності гідроксиду лужного металу і розчинника ароматичного ряду.

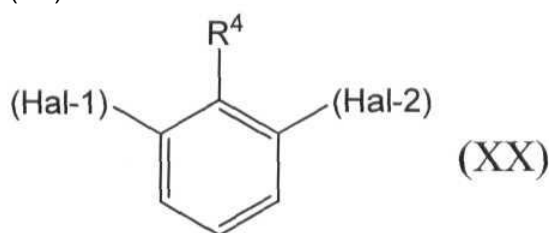
(45) Спосіб у відповідності до зазначеного вище пункту (44), який відрізняється тим, що гідроксид лужного металу являє собою гідроксид натрію.

(46) Спосіб у відповідності до зазначеного вище пункту (44), який відрізняється тим, що розчинник ароматичного ряду являє собою толуол.

(47) Спосіб одержання сполуки, яка представлена формулою (XVIII):

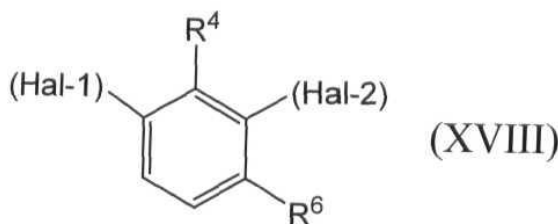


де Hal-1, Hal-2, R^4 і R^6 - як це визначено вище, який включає введення сполуки, представленої формулою (XX):



де R^4 , Hal-1 і Hal-2 - як це визначено вище, з $(R^6)(Hal-3)$, де R^6 і Hal-3 - як це визначено вище, в присутності хлориду заліза.

(48) Спосіб одержання продукту сполуки, представленої формулою (XVIII):



де R^4 , R^6 , Hal-1 і Hal-2 - як це визначено вище, а Hal-1 і Hal-2 можуть бути однаковими або відрізнятися один від одного, який включає додавання неорганічної кислоти і спиртового розчинника одночасно або роздільно до суміші, яка містить сполуку, представлену формулою (XVIII), і кислоту.

(49) Спосіб у відповідності до зазначеного вище пункту (48), який відрізняється тим, що суміш у відповідності до зазначеного вище пункту (48), являє собою суміш, одержувану в результаті реакції у відповідності до зазначеного вище пункту (47).

(50) Спосіб у відповідності до зазначеного вище пункту (48), який відрізняється тим, що неорганічна кислота являє собою хлористоводневу кислоту.

(51) Спосіб у відповідності до зазначеного вище пункту (50), який відрізняється тим, що спиртовий розчинник являє собою спирт C_3 .

ПРИКЛАДИ

Нижче представлений опис даного винаходу з посиланням на приклади. Проте слід розуміти, що даний винахід жодним чином не обмежений такими конкретними прикладами. Нижче представлений опис прикладів приготування сполук у відповідності до даного винаходу.

ПРИКЛАД ПРИГОТУВАННЯ 1

Приготування 1-(1-етил-4-(3-(2-метоксиетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)бензоїл)-1H-піразол-5-ілокси)етилметилкарбонату (представлена нижче сполука № 2-1)

5-Гідрокси-1-етилпіразол-4-іл-3-(2-метоксиетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)фенілкетон (300 мг) розчинили в 2-бутаноні (10 мл) і додали карбонат калію (130 мг) і бромід тетрабутиламонію (15 мг). Після перемішування при кімнатній температурі протягом 10 хвилин додали при кімнатній температурі 1-хлоретилметилкарбонат (чистота: 85 %, 270 мг) з подальшим нагріванням і дефлегмацією протягом 3 годин. Після завершення реакції реакційну суміш охолодили до кімнатної температури і влили у воду, після чого екстрагували

етилацетатом. Органічний шар промили 1 н. хлористоводневою кислотою і насиченим водним розчином хлориду натрію з подальшим просушуванням над безводним сульфатом натрію. Розчинник відігнали в умовах зниженого тиску. Одержаний залишок очистили методом колонкової хроматографії з n-гексан:етилацетат = 1:1, в результаті чого був одержаний цільовий продукт (180 мг) у вигляді твердої речовини жовтуватого кольору.

ПРИКЛАД ПРИГОТУВАННЯ 2

Приготування 1-(1,3-диметил-4-(3-(2-метоксиетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)бензоїл)-1H-піразол-5-ілокси)етилметилкарбонату (представлена нижче сполука № 1-6)

(1) 3-(2-Метоксиетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)бензойну кислоту (1 г) розчинили в хлороформі (20 мл) і додали оксалілхлорид (500 мг). Потім додали каталітичну кількість диметилформаміду з подальшим перемішуванням при кімнатній температурі протягом 3 годин. Потім розчинник відігнали в умовах зниженого тиску. Одержаний залишок розчинили в тетрагідрофурані (5 мл), а потім повільно додали розчин, який містив 5-гідрокси-1,3-диметилпіразол (450 мг), розчинений в тетрагідрофурані (15 мл). Потім додали триетиламін (0,65 мл) з подальшим нагріванням і дефлегмацією протягом 5 годин. Після завершення реакції реакційну суміш охолодили до кімнатної температури і влили у воду, потім підкислили розбавленою хлористоводневою кислотою, після чого екстрагували етилацетатом. Органічний шар промили насиченим водним розчином хлориду натрію, а потім просушили над сульфатом магнію. Розчинник відігнали в умовах зниженого тиску.

Одержаний залишок розчинили в ацетонітрилі (20 мл) і в умовах охолодження в льодовій бані додали триетиламін (0,65 мл) і ціаногідрин ацетону (100 мг) з подальшим перемішуванням протягом 18 годин при кімнатній температурі. Реакційний розчин влили у воду і промили невеликою кількістю етилацетату. Потім водний шар підкислили розбавленою хлористоводневою кислотою. Потім його екстрагували етилацетатом, після чого органічний шар промили насиченим водним розчином хлориду натрію, а потім просушили над сульфатом магнію. Розчинник відігнали в умовах зниженого тиску. Одержаний залишок очистили методом колонкової хроматографії (розчинник-проявник: етилацетат), в результаті чого був одержаний 5-гідрокси-1,3-диметилпіразол-4-іл-3-(2-метоксиетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)фенілкетон (500 мг, представлена нижче сполука № 5-2) у вигляді твердої речовини жовтуватого кольору.

(2) 5-Гідрокси-1,3-диметилпіразол-4-іл-3-(2-метоксиетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)фенілкетон (300 мг) розчинили в 2-бутаноні (10 мл) і додали карбонат калію (130 мг) і бромід тетрабутиламонію (15 мг). Після перемішуванням при кімнатній температурі протягом 10 хвилин додали 1-хлоретилметилкарбонат (чистота: 85 %, 270 мг) при кімнатній температурі з подальшим нагріванням і дефлегмацією протягом 3 годин. Після завершення реакції реакційний розчин охолодили до кімнатної температури і влили у воду, а потім екстрагували етилацетатом. Органічний шар промили 1 н. розчином хлористоводневої кислоти і насиченим водним розчином хлориду натрію, а потім просушили над безводним сульфатом натрію. Розчинник відігнали в умовах зниженого тиску. Одержаний залишок очистили методом колонкової хроматографії (n-гексан: етилацетат = 1:1), в результаті чого був одержаний цільовий продукт (200 мг) у вигляді твердої речовини жовтуватого кольору.

ПРИКЛАД ПРИГОТУВАННЯ 3

Приготування 1-(1-етил-4-(3-(2-метоксиетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)бензоїл)-1H-піразол-5-ілокси)етилметилкарбонату

(1) 2,6-Дихлортолуол (100 г) і метансульфонілхлорид (85,3 г) змішали і нагріли до 80 °С. Потім додали хлорид заліза(III) (101 г), після чого суміш додатково нагріли до 120 °С і піддали перемішуванню в умовах нагрівання протягом 6 годин. Після завершення реакції реакційну суміш охолодили до 90 °С, а потім повільно додали 10 % хлористоводневу кислоту (230 мл) таким чином, щоб уникнути швидкого зниження температури реакційної суміші і її затвердіння, після чого при 80 °С повільно додали ізопропанол (230 мл). Одержану суміш охолодили до кімнатної температури, а потім в умовах інтенсивного перемішування додали затравкові кристали 1,3-дихлоро-2-метил-4-(метилсульфоніл)бензолу з метою осадження твердої речовини. Осаджену тверду речовину зібрали фільтруванням і промили розчинником (вода:ізопропанол = 1:1, 300 мл). Одержану тверду речовину розчинили в етилацетаті (600 мл) в умовах нагрівання з подальшим фільтруванням з метою видалення нерозчинних домішок. Фільтрат піддали концентруванню, в результаті чого був одержаний 1,3-дихлоро-2-метил-4-(метилсульфоніл)бензол (105 г) у вигляді твердої речовини жовтуватого кольору.

¹H-ЯМР 400 МГц (CDCl₃ δ частин на мільйон): 2,57 (3H, c), 3,28 (3H, c), 7,50 (1H, d, J=8,4 Гц), 7,97 (1H, d, J=8,4 Гц).

(2) 1,3-Дихлоро-2-метил-4-(метилсульфоніл)бензол (13,1 г) і толуол (40 мл) змішали, після чого додали 2-метоксиетанол (4,49 г) і гідроксид натрію (4,55 г) з подальшим нагріванням і

дефлегмацією протягом 3 годин. Після завершення реакції суміш охолодили до кімнатної температури, а розчинник відігнали в умовах зниженого тиску. До одержаного залишку додали змішаний розчинник, який містив метанол (12 мл) і воду (48 мл), з подальшим нетривалим перемішуванням. Потім утворену тверду речовину зібрали фільтруванням, після чого промили

водою і просушили, в результаті чого був одержаний 1-хлоро-3-(2-метоксиетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)бензол (12,4 г) у вигляді твердої речовини жовтуватого кольору.

¹H-ЯМР 300 МГц (CDCl₃ δ частин на мільйон): 2,41 (3H, c), 3,25 (3H, c), 3,48 (3H, c), 3,78-3,81 (2H, м), 4,20-4,22 (2H, м), 7,33 (1H, д, J=8,4 Гц), 7,76 (1H, д, J=8,7 Гц).

(3) До 237,5 мл трет-бутанолу додали 12,5 мл води, після чого протягом 5 хвилин в нього вдували газоподібний азот з метою видалення розчиненого кисню, в результаті чого приготували реакційний розчинник. В автоклав місткістю 500 мл помістили 50,0 г 1-хлоро-3-(2-метоксиетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)бензолу, 28,5 г карбонату натрію, 1,5 г 1,4-біс(дифенілфосфіно)бутану, зазначений вище реакційний розчинник і 1,5 г 5 % Pd/C, після чого автоклав зачинили. Потім в умовах постійного перемішуванням автоклав двічі продули азотом (5,0 МПа) з подальшим подвійним продуванням монооксидом вуглецю (5,0 МПа). На завершення в автоклав завантажили монооксид вуглецю (2,5 МПа). Автоклав нагріли до 160 °C за допомогою електричної печі з подальшим перемішуванням суміші протягом 7 годин (300 об./хв.). Після охолодження до кімнатної температури газоподібний монооксид вуглецю, що залишався в автоклаві, видалили. Після цього вміст автоклава влили у воду і етилацетат, а нерозчинні домішки відфільтрували за допомогою целіту. Потім фільтрат піддали рідинному розділенню, а водний шар промили двічі етилацетатом. Потім водний шар підкислили хлористоводневою кислотою (pH = 1), після чого екстрагували етилацетатом. Органічний шар промили насиченим водним розчином хлориду натрію і просушили над сульфатом натрію, а потім розчинник відігнали в умовах зниженого тиску, в результаті чого була одержана 3-(2-метоксиетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)бензойна кислота (50,1 г). Крім того, одержану тверду речовину промили 150 мл гексану, а потім зібрали фільтруванням і просушили в умовах зниженого тиску, в результаті чого була одержана 3-(2-метоксиетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)бензойна кислота (48,1 г) у вигляді твердої речовини білого кольору.

¹H-ЯМР 300 МГц (CDCl₃ δ частин на мільйон): 2,63 (3H, c), 3,31 (3H, c), 3,50 (3H, c), 3,82-3,85 (2H, м), 4,22-4,25 (2H, м), 7,92 (2H, c).

(4) 3-(2-Метоксиетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)бензойну кислоту (100 г) і толуол (300 мл) змішали і додали тіонілхлорид (47,5 г) і DMF (2,5 г) з подальшим нагріванням і перемішуванням при 100 °C протягом 2 годин. Після завершення реакції відігнали 180 мл толуолу в умовах зниженого тиску, в результаті чого був одержаний розчин 3-(2-метоксиетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)бензоїлхлориду.

(5) До 1-етил-5-гідроксипіразолу (42,8 г) додали толуол (150 мл) і триетиламін (38,6 г), в результаті чого був одержаний однорідний розчин, після чого до нього, підтримуючи його при температурі не більш ніж 30 °C, по краплях додали кислий розчин хлориду, одержаний у відповідності до зазначеного вище процесу приготування (4). Внутрішню поверхню контейнера додатково промили толуолом (20 мл), а кислий розчин хлориду, що залишився, по краплях додали до реакційного розчину. Після перемішування при кімнатній температурі протягом 1 години реакційний розчин піддали додатковому перемішуванню при 80 °C протягом 0,5 години. Потім реакційний розчин охолодили до кімнатної температури, після чого влили у воду (150 мл) з метою рідинного розділення. Після рідинного розділення водний шар один раз екстрагували толуолом (200 мл) і промили невеликою кількістю насиченого водного розчину хлориду натрію. Потім органічний шар зібрали разом і просушили над сульфатом магнію. Сульфат магнію відфільтрували з подальшим промиванням толуолом (50 мл), в результаті чого був одержаний толуоловий розчин 1-етил-1H-піразол-5-іл-3-(2-метоксиетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)бензоату.

З цього розчину толуолу відібрали зразок в надзвичайно малої кількості, а з розчину відігнали толуол, при цьому для підтвердження його формування замірили ¹H-ЯМР спектр.

¹H-ЯМР 400 МГц (CDCl₃ δ частин на мільйон): 1,46 (3H, т, J=7,6 Гц), 2,64 (3H, c), 3,31 (3H, c), 3,48 (3H, c), 3,81 (2H, т, J=4,4 Гц), 4,16 (2H, к, J=7,6 Гц), 4,24 (2H, т, J=4,4 Гц), 6,30 (1H, д, J=2,0 Гц), 7,53 (1H, д, J=2,0 Гц), 7,95 (1H, д, J=8,4 Гц), 7,97 (1H, д, J=8,4 Гц).

(6) Розчин толуолу, одержаний у відповідності до процесу приготування (5), перенесли в контейнер, оснащений пристроєм для азеотропного сушіння, а частину толуолу (приблизно 100 мл) відігнали разом з водою, що містилась в ньому. Розчин охолодили до 80 °C, а потім додали DMF (40 мл) і порошкоподібний карбонат калію (33,6 г). Потім в умовах інтенсивного перемішування здійснили нагрівання і дефлегмацію, а толуол (приблизно 100 мл) відігнали методом азеотропного сушіння. Азеотропне сушіння здійснювали протягом 3 годин, а потім

частину розчинника відігнали в умовах зниженого тиску, в результаті чого був одержаний розчин толуолу, який містив калієву сіль (5-гідрокси-1-етилпіразол-4-іл)(3-(2-метоксиетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)феніл)кетону.

(7) Складний 1-хлоретилловий ефір хлормурашиної кислоти (250 г) розчинили в діетиловому ефірі (1 л) і в умовах охолодження льодом по краплях додали метанол (59 г) і триетиламін (195 г). Після завершення по краплинного додавання одержану суміш піддали перемішуванню при кімнатній температурі протягом 1 години. В одержану систему додали воду (250 мл) з метою рідинного розділення, а органічний шар промили розбавленою хлористоводневою кислотою. Залишок, одержаний в результаті відгонки розчинника, відігнали в умовах зниженого тиску, в результаті чого був одержаний 1-хлоретилметилкарбонат (217,6 г, температура кипіння: 85-90 °C/0,085-0,093 МПа).

¹H-ЯМР 400 МГц (CDCl₃ δ частин на мільйон): 1,79 (3H, д, J=4,4 Гц), 3,82 (3H, с), 6,39 (1H, к, J=6,0 Гц).

(8) Розчин толуолу, одержаний у відповідності до процесу приготування (6), охолодили до 90 °C і додали бромід тетра-н-бутиламонію (5,6 г), після чого повільно по краплях додали 1-хлоретилметилкарбонат (62,5 г). Після завершення по краплинного додавання реакційний розчин піддали перемішуванню при 100 °C протягом 3 годин, а потім охолодили до 50 °C. До нього додали гексан (150 мл) з подальшим перемішуванням протягом 30 хвилин. Крім того, послідовно додали воду (100 мл) і 3 н. хлористоводневу кислоту (100 мл) з подальшим перемішуванням при кімнатній температурі протягом 30 хвилин. Осаджені кристали зібрали фільтруванням, промили водою і додатково промили змішаною рідиною (300 мл), що містила гексан.толуол = 1:2, в результаті чого був одержаний зневоднений цільовий продукт (120,9 г) у вигляді твердої речовини коричневатого кольору.

ПРИКЛАД ПРИГОТУВАННЯ 4

Приготування 1-(1-етил-4-(3-(2-метоксиетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)бензоїл)-1H-піразол-5-ілокси)етилметилкарбонату

(1) 5-Гідрокси-1-етилпіразол-4-іл-3-(2-метоксиетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)фенілкетон (1 г) і гідроксид калію (180 мг) змішали в метанолі (20 мл) з подальшим нагріванням і дефлегмацією протягом 1 години. Одержаний розчин охолодили до кімнатної температури, а потім розчинник відігнали в умовах зниженого тиску, в результаті чого була одержана калієва сіль (1-етил-5-гідроксипіразол-4-іл)(3-(2-метоксиетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)феніл)кетону (1 г) у вигляді масла коричневатого кольору.

¹H-ЯМР 400 МГц (CD₃ OD δ частин на мільйон): 1,21 (3H, т, J=7,2 Гц), 2,27 (3H, с), 3,27 (3H, с), 3,42 (3H, с), 3,76 (4H, м), 4,19 (2H, м), 7,15 (1H, д, J=7,6 Гц), 7,75 (1H, д, J = 7,6 Гц).

(2) Калієву сіль (5-гідрокси-1-етилпіразол-4-іл)(3-(2-метоксиетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)феніл)кетону (1 г), одержану у відповідності до процесу приготування (1), розчинили в 2-бутаноні (10 мл) і додали бромід тетрабутиламонію (15 мг). Після цього реакцію здійснюють таким же чином, як в прикладі приготування 1, в результаті чого одержують цільовий продукт.

ПРИКЛАД ПРИГОТУВАННЯ 5

Приготування 1-(1-етил-4-(3-(2-метоксиетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)бензоїл)-1H-піразол-5-ілокси)етилметилкарбонату

(1) Натрієву сіль (1-етил-5-гідроксипіразол-4-іл)(3-(2-метоксиетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)феніл)кетону (1 г) одержали шляхом здійснення реакції таким же чином, як в зазначеному вище прикладі приготування 4, за винятком того, що гідроксид калію в зазначеному вище прикладі приготування 4 замінили гідроксидом натрію.

¹H-ЯМР 400 МГц (CD₃ OD δ частин на мільйон): 1,20 (3H, т, J=7,2 Гц), 2,27 (3H, с), 3,26 (3H, с), 3,42 (3H, с), 3,74 (2H, к, J=7,2 Гц), 3,77 (2H, м), 4,18 (2H, м), 7,16 (1H, д, J=8,4 Гц), 7,74 (1H, д, J=8,4 Гц).

(2) Натрієву сіль (300 мг) (1-етил-5-гідроксипіразол-4-іл)(3-(2-метоксиетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)феніл)кетону (1 г), одержану у відповідності до процесу приготування (1), вводять в реакцію таким же чином, як в зазначеному вище прикладі приготування 4 (2), в результаті чого одержують цільовий продукт.

ПРИКЛАД ПРИГОТУВАННЯ 6

Приготування 1-(1-етил-4-(3-(2-метоксиетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)бензоїл)-1H-піразол-5-ілокси)етилметилкарбонату

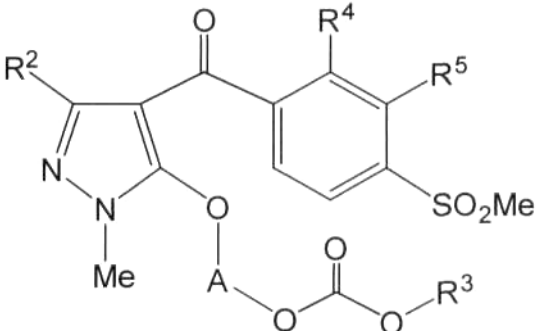




(1) 3-(2-Метоксиетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)бензойну кислоту (500 мг) розчинили в хлороформі (20 мл) і додали оксалілхлорид (500 мг) і каталітичну кількість DMF з подальшим перемішуванням при кімнатній температурі протягом 3 годин. Розчинник і надлишковий реагент

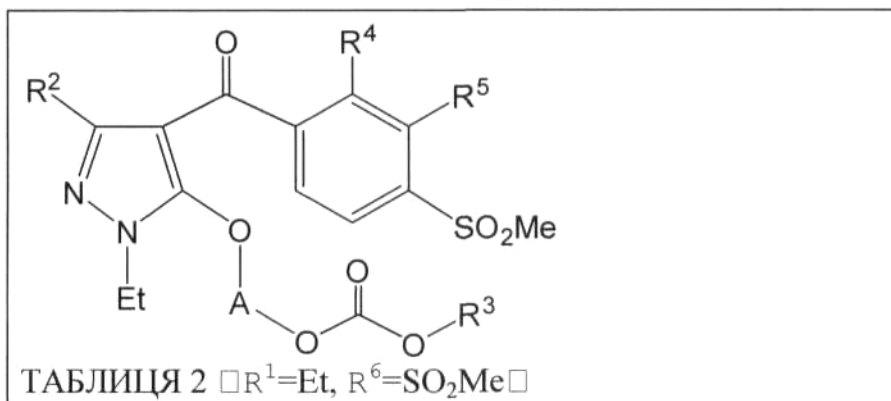
відігнали в умовах зниженого тиску, в результаті чого був одержаний 3-(2-метоксиетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)бензоїлхлорид (520 мг) у вигляді маслянистого продукту.

¹H-ЯМР 400 МГц (CDCl₃ δ частин на мільйон): 2,50 (3H, с), 3,26 (3H, с), 3,44 (3H, с), 3,77 (2H, м), 4,18 (2H, м), 7,92 (1H, д, J=8,8 Гц), 7,96 (1H, д, J=8,8 Гц).

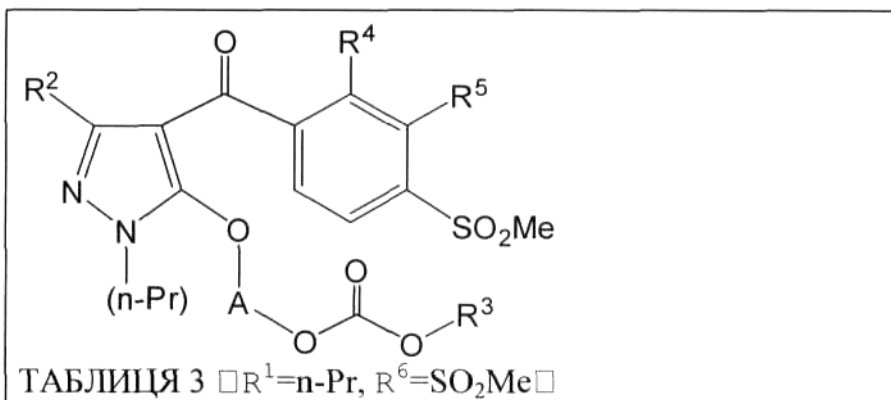
- 5 (2) Тололовий розчин 3-(2-метоксиетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)бензоїлхлориду, одержаний у відповідності до зазначеного вище процесу приготування (1), приготують і вводять в реакцію таким же чином, в як в зазначеному вище прикладі приготування 3 (5), з подальшим одержанням цільового продукту.

- 10 Нижче в таблицях 1-8 наведені типові приклади сполук у відповідності до даного винаходу, а дані їхнього ¹H-ЯМР спектру приведені в таблиці 9. Ці сполуки можуть бути приготовані у відповідності до зазначених вище прикладів приготування або зазначених вище різноманітних процесів одержання. В даному описі в таблицях 1-9 № вказує на номер сполуки. Крім того, в цих таблицях Me означає метильну групу, Et - етильну групу, n-Pr - n-пропільну групу, а i-Pr - ізопропільну групу. Крім того, ліва сторона -A- зв'язана з піразольною стороною, а права
- 15 сторона -A- зв'язана з карбонатною стороною.

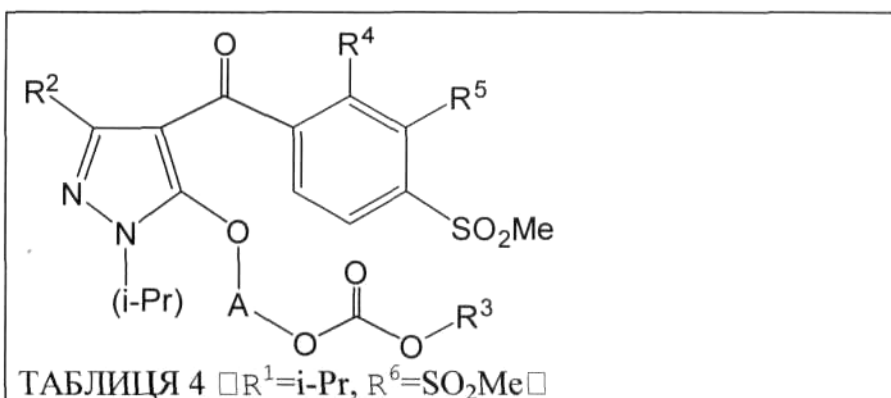
 <p>ТАБЛИЦЯ 1 (R¹=Me, R⁶=SO₂Me)</p>					
№					-A-
1-1	H	Me	Me	CH ₂ OEt	-CH(Me)-
1-2	H	Me	Me	C(O)OMe	-CH(Me)-
1-3	H	Me	Me	CH ₂ OMe	-CH(Me)-
1-4	H	Et	Me	CH ₂ OEt	-CH(Me)-
1-5	H	Et	Me	OCH ₂ CH ₂ OCH(Me) ₂	-CH(Me)-
1-6	Me	Me	Me	OCH ₂ CH ₂ OMe	-CH(Me)-



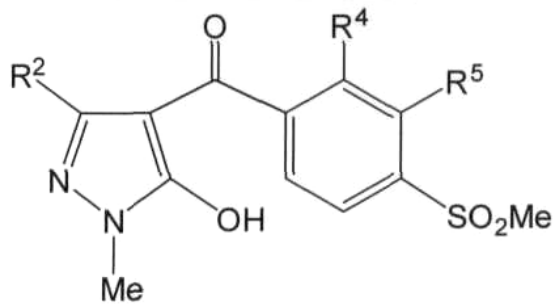
№	R^2	R^3	R^4	R^5	-A-
2-1	H	Me	Me	OCH_2CH_2OMe	-CH(Me)-
2-2	H	Et	Me	$C(O)OMe$	-CH(Me)-
2-3	Me	Et	Me	OCH_2CH_2OMe	-CH(Me)-



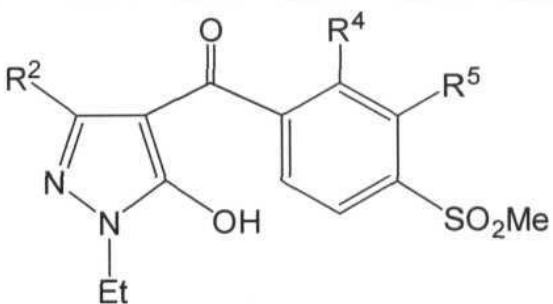
№	R^2	R^3	R^4	R^5	-A-
3-1	H	Et	Me	OCH_2CH_2OMe	-CH(Me)-



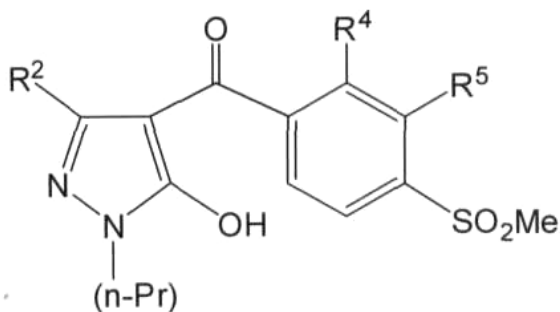
№	R^2	R^3	R^4	R^5	-A-
4-1	H	Me	Me	OCH_2CH_2OMe	-CH(Me)-

ТАБЛИЦЯ 5 ($R^1=Me$, $R^6=SO_2Me$)

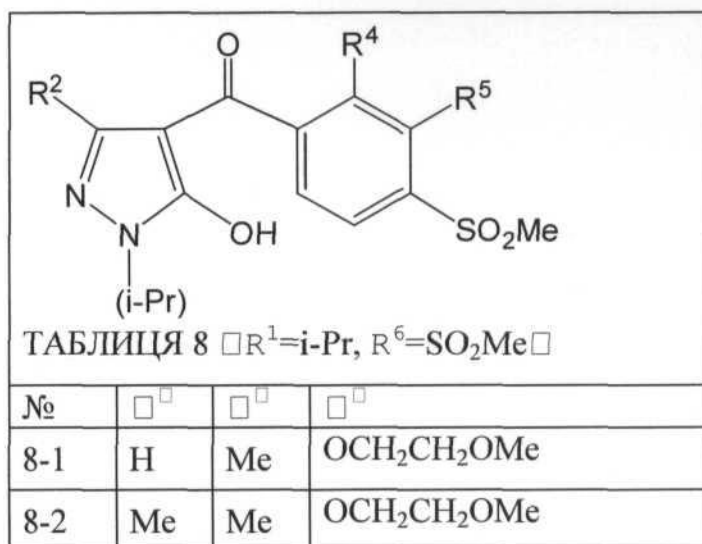
№	<input type="checkbox"/>	<input type="checkbox"/>	<input type="checkbox"/>
5-1	H	Me	$OCH_2CH_2OCH(Me)_2$
5-2	Me	Me	OCH_2CH_2OMe
5-3	Et	Me	OCH_2CH_2OMe

ТАБЛИЦЯ 6 $R^1=Et$, $R^6=SO_2Me$

№	<input type="checkbox"/>	<input type="checkbox"/>	<input type="checkbox"/>
6-1	Me	Me	OCH_2CH_2OMe

ТАБЛИЦЯ 7 $R^1=n-Pr$, $R^6=SO_2Me$

№	<input type="checkbox"/>	<input type="checkbox"/>	<input type="checkbox"/>
7-1	H	Me	OCH_2CH_2OMe



ТАБЛИЦЯ 9

№	¹ H-ЯМР δ частин на мільйон (Інструмент для вимірювання: JEOL-GSX (400 МГц)) (Розчинник: CDCl ₃ , якщо інше не визначене, а випадок, коли використовували дейтеризований ацетон, визначений як "в ацетоні-d6")
1-1	1,25 (3H, т, J=7,0 Гц), 1,76 (3H, д, J=5,2 Гц), 2,42 (3H, с), 3,24 (3H, с), 3,68 (1H, к, J=7,0 Гц), 3,69 (3H, с), 3,72 (3H, с), 4,99 (2H, шир. с), 6,74 (1H, к, J= 5,2 Гц), 7,26 (1H, с), 7,42 (1H, д, J=8,0 Гц), 8,04 (1H, д, J=8,0 Гц).
1-2	1,77 (3H, д, J=5,2 Гц), 2,32 (3H, с), 3,18 (3H, с), 3,69 (3H, с), 3,71 (3H, с), 3,98 (3H, с), 6,73 (1H, к, J=5,2 Гц), 7,27 (1H, с), 7,52 (1H, д, J=8,0 Гц), 7,94 (1H, д, J=8,0 Гц).
1-3	1,77 (3H, д, J=5,2 Гц), 2,41 (3H, с), 3,21 (3H, с), 3,49 (3H, с), 3,69 (3H, с), 3,71 (3H, с), 4,95 (2H, шир. с), 6,74 (1H, к, J=5,2 Гц), 7,25 (1H, с), 7,42 (1H, д, J=8,4 Гц), 8,04 (1H, д, J=8,4 Гц).
1-4	1,24 (6H, м), 1,76 (3H, д, J=5,6 Гц), 2,42 (3H, с), 2,23 (3H, с), 3,68 (2H, к, J =6,8 Гц), 3,69 (3H, с), 4,11 (2H, к, J=7,2 Гц), 4,99 (2H, шир. с), 6,73 (1H, к, J= 5,6 Гц), 7,26 (1H, с), 7,42 (1H, д, J=8,0 Гц), 8,04 (1H, д, J=8,0 Гц).
1-5	1,19 (6H, д, J=6,0 Гц), 1,24 (3H, т, J=7,2 Гц), 1,76 (3H, д, J=5,2 Гц), 2,35 (3H, с), 3,29 (3H, с), 3,68 (1H, м), 3,69 (3H, с), 3,81 (2H, м), 4,11 (2H, к, J =7,2 Гц), 4,21 (2H, м), 6,70 (1H, к, J=5,2 Гц), 7,23 (1H, д, J=8,0 Гц), 7,28 (1H, с), 7,87(1H, д, J=8,0 Гц).
1-6	1,44 (3H, д, J=6,4 Гц), 1,93 (3H, с), 2,32 (3H, с), 3,27 (3H, с), 3,45 (3H, с), 3,62 (3H, с), 3,71 (3H, с), 3,79 (2H, т, J=4,8 Гц), 4,22 (2H, т, J=4,8 Гц), 6,21 (1H, к, J=6,4 Гц), 7,20 (1H, д, J=8,0 Гц), 7,88 (1H, д, J=8,0 Гц).
2-1	1,40 (3H, т, J=7,2 Гц), 1,77 (3H, д, J=5,2 Гц), 2,35 (3H, с), 2,94 (3H, с), 3,46 (3H, с), 3,71 (3H, с), 3,80 (2H, т, J=4,4 Гц), 4,05 (2H, м), 4,24 (2H, т, J=4,4 Гц), 6,78 (1H, к, J=5,2 Гц), 7,26 (1H, д, J=7,6 Гц), 7,28 (1H, с), 7,88 (1H, д, J=7,6 Гц).
2-2	1,23 (3H, т, J=7,0 Гц), 1,40 (3H, т, J=7,4 Гц), 1,76 (3H, д, J=5,6 Гц), 2,33 (3H, с), 3,18 (3H, с), 3,97 (3H, с), 4,0-4,1 (4H, м), 6,79 (1H, к, J=5,6 Гц), 7,27 (1H, с), 7,52 (1H, д, J=8,0 Гц), 7,94 (1H, д, J=8,0 Гц).
2-3	1,18 (3H, т, J=7,2 Гц), 1,35 (3H, т, J=7,2 Гц), 1,96 (3H, д, J=5,2 Гц), 2,33 (3H, с), 2,79 (3H, с), 3,35 (3H, с), 3,42 (3H, с), 3,80 (2H, т, J=4,4 Гц), 3,96 (2H, к, J=7,2 Гц), 4,10 (2H, м), 4,25 (2H, т, J=4,4 Гц), 6,20 (1H, к, J=5,2 Гц), 7,30 (1H, д, J=7,6 Гц), 7,85 (1H, д, J=7,6 Гц).

Нижче представлений опис прикладів випробувань.

5 ПРИКЛАД ВИПРОБУВАНЬ 1

Ґрунт з суходолу помістили в горщик площею 1/170 000 га і засіяли насінням різноманітних рослин. Коли відповідні рослини досягли заданої стадії появи листів ((1) куряче просо (*Echinochloa crus-galli* L.): стадія появи від 1,2 до 3,0 листів, (2) пальчатка кров'яна (*Digitaria sanguinalis* L.): стадія появи від 1,0 до 3,0 листів, (3) щетинник зелений (*Setaria viridis* L.): стадія появи від 1,5 до 3,0 листів, (4) щириця колосиста (*Amaranthus retroflexus* L.): стадія появи сім'ядолі -стадія появи 1,5 листів, (5) грудинка колюча (*Sida spinosa* L.): стадія появи сім'ядолі -стадія появи 2,0 листів, (6) канатник Теофраста (*Abutilon theophrasti* MEDIC): стадія появи

сім'ядолі - стадія появи 1,3 листів, (7) рис (*Oryza sativa* L.): стадія появи від 1,2 до 2,5 листів, (8) кукурудза (*Zea mays* L.): стадія появи від 2,0 до 3,3 листів, (9) соя (*Glycine max* Merr.): стадія появи первинного листа - стадія появи 0,3 листів) і пшениця (*Triticum* spp.): стадія появи від 2,0 до 3,0 листів), змочувальні порошки або концентрати емульсій на основі сполук у відповідності до даного винаходу, приготовані у відповідності до відомого способу приготування, відважили таким чином, щоб активні інгредієнти були присутні в заданих кількостях, і розбавили водою в кількості, яка відповідала 500 літрам на 1 гектар (що містила 1 % об. поверхнево-активної речовини сільськогосподарського призначення ("KUSARINOH", виробник: NIHON NONYAKU CO., LTD.). Приготовані таким чином розчини для розприскування застосовували для нанесення на листяний покрив за допомогою невеликого обприскувача.

Стан росту відповідних рослин спостерігали візуально на 20-22 день після нанесення, а гербіцидну активність оцінювали шляхом визначення коефіцієнта інгібування росту (%) в межах від 0 % (еквівалент необробленої площі) до 100 % (повне знищення). Результати представлені в таблиці 10.

Таблиця 10

Сполука №	Кількість активного інгредієнта, г/га	Коефіцієнт інгібування, %										Дата спостереження
		Куряче просо	Пальчатка кров'яна	Щириця колосиста	Амарант зелений	Грудинка колюча	Канатник Теофраста	Рис	Кукурудза	Соя	Пшениця	
1-1	7	95	90	60	60	-	50	20	-	70	0	21
1-2	7	100	90	100	95	-	80	70	0	95	0	21
1-3	7	90	95	80	80	-	75	60	-	70	0	21
1-4	7	95	95	75	80	-	80	-	0	80	0	21
1-5	7	95	90	80	80	0	80	20	10	-	0	21
1-6	7	90	90	95	90	70	98	70	0	80	0	20
2-1	7	95	100	100	90	60	100	70	0	95	0	20
2-2	7	98	80	80	98	70	95	50	0	-	0	22
3-1	7	70	70	30	80	0	60	0	0	-	0	22
4-1	7	90	90	95	85	60	100	80	0	95	0	20
5-1	7	30	50	50	60	40	10	0	0	-	0	22
5-2	7	90	90	100	90	40	70	50	0	70	-	21
5-3	7	90	90	90	95	30	80	50	0	0	-	21
6-1	7	10	50	60	60	0	50	20	0	-	0	22
7-1	7	60	70	70	70	20	75	10	0	60	0	22
8-1	7	60	95	90	90	30	80	10	0	40	0	21
8-2	7	20	40	50	60	20	60	0	0	10	0	21

ПРИКЛАД ВИПРОБУВАНЬ 2

Ґрунт з суходолу помістили в горщик площею 1/170 000 га і засіяли насінням різноманітних рослин (куряче просо (*Echinochloa crus-galli* L.), пальчатка кров'яна (*Digitaria sanguinalis* L.), щетинник зелений (*Setaria viridis* L.), щириця колосиста (*Amaranthus retroflexus* L.), грудинка колюча (*Sida spinosa* L.), канатник Теофраста (*Abutilon theophrasti* MEDIC), рис (*Oryza sativa* L.), кукурудза (*Zea mays* L.), соя (*Glycine max* Merr.) і пшениця (*Triticum* spp.). Наступного дня після засівання змочувальні порошки або концентрати емульсій на основі сполук у відповідності до даного винаходу, приготовані у відповідності до відомого способу приготування, відважили таким чином, щоб активні інгредієнти були присутні в заданих кількостях, і розбавили водою в кількості, яка відповідала 500 літрам на 1 гектар, з подальшим нанесенням на ґрунт за допомогою невеликого обприскувача.

Стан росту відповідних рослин спостерігали візуально на 21-22 день після нанесення, а гербіцидну активність оцінювали шляхом визначення коефіцієнта інгібування росту (%) в межах від 0 % (еквівалент необробленої площі) до 100 % (повне знищення). Результати представлені в таблиці 11.

Таблиця 11

Сполука №	Кількість активного інгредієнта, г/га	Коефіцієнт інгібування, %										Дата спостереження
		Куряче просо	Пальчатка кров'яна	Щириця коло-систа	Амарант зелений	Грудинка колюча	Канатник Теофраста	Рис	Кукурудза	Соя	Пшениця	
1-1	250	100	100	98	90	90	98	95	10	20	20	21
1-2	250	100	100	100	100	98	100	100	0	70	20	21
1-3	250	98	98	98	98	95	100	98	20	60	10	21
1-4	250	98	80	80	98	90	100	60	0	40	0	21
1-5	250	100	95	100	100	90	100	80	10	10	0	21
1-6	250	100	100	70	100	99	100	98	0	0	5	21
2-1	250	95	100	100	100	90	100	98	0	0	0	21
3-1	250	60	80	60	40	80	80	20	0	0	10	21
4-1	250	100	100	100	100	95	100	98	0	0	10	21
5-1	250	98	98	95	100	98	100	98	10	0	20	21
5-2	250	10	100	60	90	0	70	10	0	20	0	21
5-3	250	50	95	60	100	20	30	20	20	0	0	21
6-1	250	100	100	98	100	80	80	100	0	60	20	21
7-1	250	98	100	90	100	80	95	98	0	20	40	21
8-1	250	100	100	100	100	40	100	80	0	0	0	21
8-2	250	100	100	100	100	60	70	100	60	-	20	22

ПРИКЛАД ВИПРОБУВАНЬ 3

- 5 Грунт з рисовника помістили в горщик площею 1/1 000 000 га і засіяли насінням курячого проса (*Echinochloa oryzicola vasing*) і очерету Японського (*Scirpus juncoides*) і злегка пригорнули ґрунтом. Потім горщик залишили в теплиці у стані занурення у зрошувальну воду на глибину від 0,5 до 1 см, а через день або два висадили бульби стрілолиста карликового Японського (*Sagittaria rugosa*). Потім глибину зрошувальної води підтримували на рівні від 3 до 4 см, і коли куряче просо і очерет Японський досягли стадії появи 0,5 листів, а стрілолист карликовий
- 10 Японський досяг стадії появи первинного листа, розбавлений водою розчин змочувального порошку або концентрату емульсії на основі сполуки у відповідності до даного винаходу, приготувані у відповідності до відомого способу приготування, рівномірно по краплях за допомогою піпетки нанесли таким чином, щоб кількість активних інгредієнтів дорівнювала заданій кількості. Крім того, ґрунт з рисовника помістили в горщик площею 1/1 000 000 га з подальшим скаламученням ґрунту до глибини зрошувальної води від 3 до 4 см. Наступного дня рис (*Oryza sativa* L.) (var.: *Nihonbare*) на стадії появи двох листів пересадили на глибину пересадки 3 см. На 4 день після пересадки сполуку у відповідності до даного винаходу застосували таким же чином, як це було описано вище.

- 20 Стан росту курячого проса, очерету Японського і стрілолиста карликового Японського спостерігали візуально на 13-17 день після нанесення, а стан росту рису спостерігали візуально на 20-23 день після нанесення, при цьому гербіцидну активність оцінювали шляхом визначення коефіцієнта інгібування росту (%) в межах від 0 % (еквівалент необробленої площі) до 100 % (повне знищення). Результати представлені в таблиці 12.

Таблиця 12

Сполука №	Вміст активного інгредієнта (г/га)	Коефіцієнт інгібування росту, %			
		Куряче просо	Очерет Японський	Стрілолист карликовий Японський	Рис
1-1	63	100	70	90	10
1-2	63	100	70	95	40
1-3	63	100	70	70	40
1-4	63	100	60	70	20
1-5	63	100	20	90	30
1-6	63	100	70	60	30
2-1	63	100	80	80	20
2-2	63	100	80	90	80
3-1	63	100	90	95	30
4-1	63	100	98	70	40
5-1	63	60	20	95	30
5-2	63	80	70	80	20
5-3	63	60	50	50	20
6-1	63	60	80	60	40
7-1	63	30	70	90	20
8-1	63	95	95	95	60
8-2	63	40	70	-	10

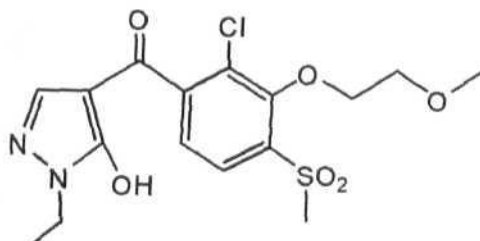
ПРИКЛАД ВИПРОБУВАНЬ 4

- Грунт з суходолу поміщають в горщик площею 1/1 000 000 га і засівають насінням різноманітних рослин. Коли відповідні рослини досягають заданої стадії появи листів ((1) канатник Теофраста (*Abutilon theophrasti* MEDIC), (2) просо велике (*Panicum maximum* Jacq.), (3) щетинник зелений (*Setaria viridis* L.) і (4) кукурудза (*Zea mays* L.), змочувальний порошок на основі сполуки № 2-1 у відповідності до даного винаходу, концентрат емульсії на основі
- приведеної нижче контрольної сполуки 1 і змочувальний порошок на основі приведеної нижче контрольної сполуки 2, приготовані у відповідності до відомого способу приготування, відважують таким чином, щоб активні інгредієнти були присутні в заданих кількостях від 3,5 до 15 г/га, і розбавляють водою в кількості, яка відповідає 300 літрам на 1 гектар (що містить 0,5 % об. поверхнево-активної речовини сільськогосподарського призначення (Концентрат MSO, виробник: Cognis Corporation)). Приготовані таким чином розчини для розприскування застосовують для нанесення на листяний покрив за допомогою невеликого обприскувача.

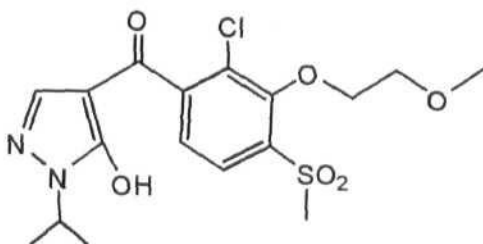
Стан росту відповідних рослин спостерігали візуально на 14-28 день після нанесення, а гербіцидну активність оцінювали шляхом визначення коефіцієнта інгібування росту (%) в межах від 0 % (еквівалент необробленої площі) до 100 % (повне знищення). Сполука 2-1 у відповідності до даного винаходу демонструє більш високу гербіцидну активність і чудові показники безпечності по відношенню до сільськогосподарських культур у порівнянні з контрольними сполуками, які представлені нижче.

Контрольна сполука 1:

(Сполука № 1, яка розкрита в EP0352543A1 на сторінці 18)



Контрольна сполука 2:



(Сполука № 20, яка розкрита в EP0352543A1 на сторінці 21)

ПРИКЛАД ВИПРОБУВАНЬ 5

Грунт з суходолу помістили в горщик площею 1/1 000 000 га і засіяли насінням різноманітних
 5 рослин. Коли відповідні рослини досягли заданої стадії появи листів ((1) канатник Теофраста
 (Abutilon theophrasti MEDIC): стадія появи від 3,0 до 3,5 листів, (2) лисохвіст гігантський (Setaria
 faberi Herrm.): стадія появи від 4,0 до 4,5 листів, (3) щетинник зелений (Setaria viridis L.): стадія
 появи від 5,0 до 5,5 листів і (4) кукурудза (Zea mays L.): стадія появи від 4,0 до 4,3 листів),
 змочувальний порошок на основі сполуки № 2-1 у відповідності до даного винаходу,
 10 змочувальний порошок на основі зазначеної вище контрольної сполуки 1 і змочувальний
 порошок на основі зазначеної вище контрольної сполуки 2, приготовані у відповідності до
 відомого способу приготування, відважили таким чином, щоб активні інгредієнти були присутні в
 заданих кількостях, і розбавили водою в кількості, яка відповідала 300 літрам на 1 гектар (що
 містила 0,5 % об. поверхнево-активної речовини сільськогосподарського призначення (Destiny
 15 HC: WINFIELD SOLUTIONS, виробник LLC)). Приготовані таким чином розчини для
 розприскування застосовували для нанесення на листяний покрив за допомогою невеликого
 обприскувача.

Стан росту відповідних рослин спостерігали візуально на 7-20 день після нанесення, а
 гербіцидну активність оцінювали шляхом визначення коефіцієнта інгібування росту (%) в межах
 20 від 0 % (еквівалент необробленої площі) до 100 % (повне знищення). Результати представлені
 в таблицях 13-16.

Таблиця 13

Сполука №	Кількість активного інгредієнта, г/га	Коефіцієнт інгібування росту, % (20 день після нанесення)
		Канатник Теофраста
2-1	3,5	80
Контрольна сполука 1	3,5	45
Контрольна сполука 2	3,5	50

Таблиця 14

Сполука №	Кількість активного інгредієнта, г/га	Коефіцієнт інгібування росту, % (20 день після нанесення)
		Лисохвіст гігантський
2-1	3,5	83
Контрольна сполука 1	3,5	30
Контрольна сполука 2	3,5	0

Таблиця 15

Сполука №	Кількість активного інгредієнта, г/га	Коефіцієнт інгібування росту, % (18 день після нанесення)
		Щетинник зелений
2-1	7	70
Контрольна сполука 1	7	40
Контрольна сполука 2	7	35

Таблиця 16

Сполука №	Кількість активного інгредієнта, г/га	Коефіцієнт інгібування росту, % (7 день після нанесення)
		Кукурудза
2-1	90	0
Контрольна сполука 2	90	25

ПРИКЛАД ВИПРОБУВАНЬ 6

- Грунт (стерилізований ґрунт:пісок = 3:1) упаковали (4 л) у стовбець (9,5 см у діаметрі × 40 см по висоті, площа нанесення: 0,007 м²) і окропили зверху водопровідною водою за допомогою шлангового насоса перед нанесенням гербіциду з метою підтримання у ґрунті рівномірного рівня вологості. Потім за допомогою піпетки по краплях нанесли 10 мл розчину для обприскування, приготованого таким чином, щоб концентрація кожного агента (сполука № 2-1, зазначені вище контрольні сполуки 1 і 2) становила 250 г/га. Після нанесення за допомогою шлангового насоса ґрунт піддали додатковому по краплинному змочуванню водою зі швидкістю 400 мл/га протягом приблизно 3 годин. Після змочування стовпчик залишили вистояватись на 1 добу, після чого стовпчик рівномірно розділили у вертикальному напрямі і кожний рядок засіяли насінням сорго (*Sorghum bicolor* Moench) (var.: Lucky Sorgo). На 14 день після засівання стан росту рослини спостерігали візуально через трьохсантиметрові інтервали від точки нанесення агента і у відповідності з цим оцінювали зародження і ступень росту шляхом визначення коефіцієнта інгібування росту (%) в межах від 0 % (еквівалент необробленої площі) до 100 % (повне знищення) в результаті чого були отримані результати, представлені в таблиці 17.

Таблиця 17

Глибина від обробленої поверхні, см	Коефіцієнт інгібування росту сорго, %									
	0-3	3-6	6-9	9-12	12-15	15-18	18-21	21-24	24-27	27-30
Сполука № 2-1	70	19	10	5	3	3	2	1	0	0
Контрольна сполука № 1	58	58	58	60	53	35	28	30	28	15
Контрольна сполука №2	48	45	47	43	58	55	61	63	35	8

- Як впливає з наведених вище результатів, коефіцієнти інгібування росту, обумовлені дією контрольних сполук № 1 і № 2, спостерігаються на глибинах, які перевищують глибину для відповідного коефіцієнта, обумовленого дією сполуки № 2-1. Таким чином, є очевидним, що разом з контрольними сполуками № 1 і № 2 активний інгредієнт переносився на більшу глибину. У той же час сполука № 2-1 залишалась у неглибокій частині ґрунту (у шарі товщиною від 0 до 9 см). З урахуванням цих результатів сполука № 2-1 вважається сполукою, яка має чудові характеристики і яка майже не переміщується в нижні шари від місця нанесення в результаті, наприклад, дощу або розприскування води, завдяки чому можливість впливу на оточуюче середовище, такого як, наприклад, забруднення підземних вод, є надзвичайно низькою у порівнянні з контрольними сполуками № 1 і № 2.
- Нижче представлений опис прикладів готових для застосування форм у відповідності до даного винаходу.

ПРИКЛАД ГОТОВОЇ ФОРМИ 1

- | | |
|--|---------------------|
| (1) Сполука у відповідності до даного винаходу | 75 масових частин |
| (2) Gegeron T-77 (торговельне найменування, виробник: Rhone-Poulenc) | 14,5 масових частин |
| (3) NaCl | 10 масових частин |
| (4) Декстрин | 0,5 масових частин. |

- Зазначені вище компоненти поміщають у високошвидкісний перемішувач гранулятор, змішують з 20 % мас. води, гранулюють і просушують, в результаті чого одержують гранули, які диспергуються у воді.

ПРИКЛАД ГОТОВОЇ ФОРМИ 2

- | | |
|---|--------------------|
| (1) Каолін | 78 масових частин |
| (2) Laveline FAN (торговельне найменування, виробник: DAI-ICHI KOGYO SEIYAKU CO., LTD.) | 2 масових частини |
| (3) Sorpol 5039 (торговельне найменування, виробник: TOHO Chemical Industry Co., LTD.) | 5 масових частин |
| (4) Carplex (торговельне найменування, виробник: DSL Japan Co., LTD.) | 15 масових частин. |
- Суміш зазначених вище компонентів (1) - (4) і сполуку у відповідності до даного винаходу змішують при масовому співвідношенні компонентів 9:1, в результаті чого одержують змочувальний порошок.

5 ПРИКЛАД ГОТОВОЇ ФОРМИ 3

- | | |
|--|--------------------|
| (1) Hi-Filler No. 10 (торговельне найменування, виробник: Matsumura Sangyo Co., LTD.) | 33 масових частини |
| (2) Sorpol 5050 (торговельне найменування, виробник: TOHO Chemical Industry Co., LTD.) | 3 масових частини |
| (3) Sorpol 5073 (торговельне найменування, виробник: TOHO Chemical Industry Co., LTD.) | 4 масових частини |
| (4) Сполука у відповідності до даного винаходу | 60 масових частин. |
- Зазначені вище сполуки (1) - (4) змішують, в результаті чого одержують змочувальний порошок.

ПРИКЛАД ГОТОВОЇ ФОРМИ 4

- | | |
|---|----------------------|
| (1) Сполука у відповідності до даного винаходу | 4 масових частини |
| (2) Бентоніт | 30 масових частин |
| (3) Карбонат кальцію | 61,5 масових частин |
| (4) Toxanon GR-3IA (торговельне найменування, виробник: Sanyo Chemical Co., LTD.) | 3 масових частини |
| (5) Лігнінсульфонат кальцію | 1,5 масових частини. |

- 10 Змелений компонент (1) і компоненти (2) і (3) заздалегідь змішують, після чого до них підмішують компоненти (4) і (5) і воду. Суміш екструдують і гранулюють з подальшими просушуванням і просіванням, в результаті чого одержують гранули.

ПРИКЛАД ГОТОВОЇ ФОРМИ 5

- | | |
|--|-------------------|
| (1) Сполука у відповідності до даного винаходу | 30 масових частин |
| (2) Zieclite (торговельне найменування, виробник: Zieclite Co., LTD.) | 60 масових частин |
| (3) New Kalgen WG-1 (торговельне найменування, виробник: TAKEMOTO OIL & FAT CO., LTD.) | 5 масових частин |
| (4) New Kalgen FS-7 (торговельне найменування, виробник: TAKEMOTO OIL & FAT CO., LTD.) | 5 масових частин. |

- 15 Компоненти (1), (2) і (3) змішують і пропускають через пульверизатор, а потім до них додають компонент (4). Суміш ретельно перемішують, а потім екструдують і гранулюють з подальшими просушуванням і просіванням, в результаті чого одержують гранули, які диспергуються у воді.

ПРИКЛАД ГОТОВОЇ ФОРМИ 6

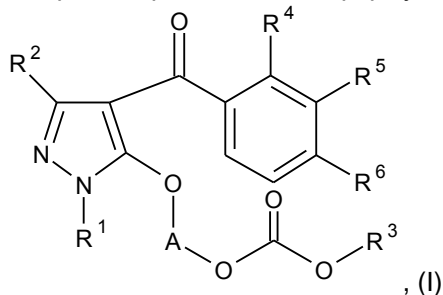
- | | |
|--|--------------------|
| (1) Сполука у відповідності до даного винаходу | 28 масових частин |
| (2) Soprophor FL (торговельне найменування, виробник: Rhone-Poulenc) | 2 масових частини |
| (3) Sorpol 335 (торговельне найменування, виробник: TOHO Chemical Industry Co., LTD.) | 1 масова частина |
| (4) IP solvent 1620 (торговельне найменування, виробник: Idemitsu Petrochemical Co., LTD.) | 32 масових частини |
| (5) Етиленгліколь | 6 масових частин |
| (6) Вода | 31 масова частина. |

Зазначені вище компоненти (1) - (6) змішують і подрібнюють з використанням методу вологого помелу (Duno-mill), в результаті чого одержують концентрат емульсії на водній основі.

- 20 Повні розкриття патентної заявки Японії № 2008-132190, поданої 20 травня 2008 р., і патентної заявки Японії № 2009-003467, поданої 9 січня 2009 р., включаючи описи, формули винаходів і реферати, інкорпоровані в дану заявку шляхом посилання у всій їхній повноті.

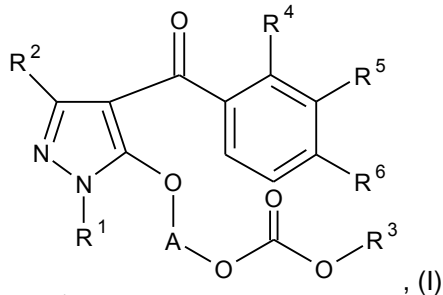
ФОРМУЛА ВИНАХОДУ

1. Піразол представлений формулою (I) або його сіль:



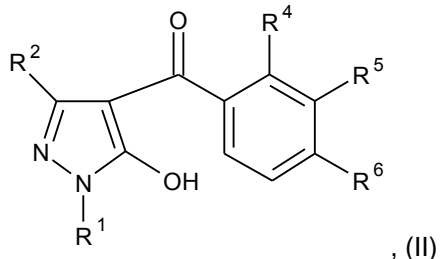
де R¹ являє собою етил,
R² являє собою водень,
R³ являє собою метил,
R⁴ являє собою метил,
R⁵ являє собою 2-метоксіетокси,
R⁶ являє собою метилсульфоніл,
А являє собою -CH(CH₃)-.

2. Спосіб одержання піразолу, представленого формулою (I), або його солі:

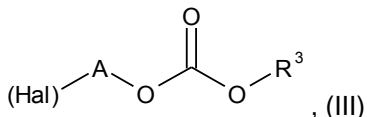


де R¹ являє собою етил,
R² являє собою водень,
R³ являє собою метил,
R⁴ являє собою метил,
R⁵ являє собою 2-метоксіетокси,
R⁶ являє собою метилсульфоніл,
А являє собою -CH(CH₃)-,

в якому піддають взаємодії піразол, представлений формулою (II), або його сіль:



де R¹, R², R⁴, R⁵, R⁶ є такими, як зазначено вище, з сполукою, представленою формулою (III):



де Hal являє собою галоген, R³ та А є такими, як визначено вище.

3. Гербіцидна композиція, що містить піразол, представлений формулою (I), або його сіль, як визначено в п. 1, як активний інгредієнт і допоміжну(і) речовину(и).

4. Спосіб боротьби з небажаними рослинами або інгібування їх росту, в якому небажані рослини або місце їх росту обробляють гербіцидно ефективною кількістю піразолу, представленого формулою (I), або його сіллю як визначено в п. 1.

Комп'ютерна верстка Л. Литвиненко

Державна служба інтелектуальної власності України, вул. Урицького, 45, м. Київ, МСП, 03680, Україна

ДП "Український інститут промислової власності", вул. Глазунова, 1, м. Київ – 42, 01601