(19) Евразийское патентное ведомство

(11) 034323 (13) B1

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОМУ ПАТЕНТУ

(45) Дата публикации и выдачи патента
2020.01.28

(21) Номер заявки
201890208

(22) Дата подачи заявки
2016.06.29

(51) Int. Cl. ***C07D 413/12*** (2006.01)
C07D 417/12 (2006.01)
C07D 271/113 (2006.01)
A01N 43/82 (2006.01)
A01N 43/84 (2006.01)

(54) ГЕРБИЦИДНО-АКТИВНЫЕ ПРОИЗВОДНЫЕ N-(1,3,4-ОКСАДИАЗОЛ-2-ИЛ)АРИЛКАРБОКСАМИДА

(31) **15175277.1**
(32) **2015.07.03**
(33) **EP**
(43) **2018.07.31**
(86) **PCT/EP2016/065091**
(87) **WO 2017/005564 2017.01.12**

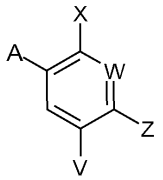
(71)(73) Заявитель и патентовладелец:
БАЙЕР КРОПСАЙЕНС АКЦИЕНГЕЗЕЛЬШАФТ (DE)

(72) Изобретатель:
Кён Арним, Вальдрафф Кристиан, Аренс Хартмут, Хайнеманн Инес, Браун Ральф, Дитрих Хансйорг, Розингер Кристофер Хью, Гатцвайлер Эльмар (DE)

(74) Представитель:
Беляева Е.Н. (BY)

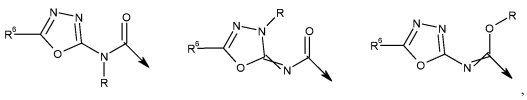
(56) WO-A1-2012126932
WO-A1-2013087577
WO-A1-2014126070

(57) Изобретение касается производных N-(1,3,4-оксадиазол-2-ил)арилкарбоксамида общей формулы (I)



(I),

в качестве гербицидов. В указанной формуле (I) W означает CY; X и Z означают независимо друг от друга, соответственно, галоген, (C_1-C_6)алкил, трифторметил; Y означает $S(O)_nR^2$; V означает водород, R^2 означает (C_1-C_6)алкил; n означает 0, 1 или 2; A означает остаток A1, A2 или A3



A1 A2 A3

R означает (C_1-C_6)алкил-OC(O)OR^{10}, R^6 означает (C_1-C_6)алкил, R^{10} означает (C_1-C_6)алкил или (C_3-C_6)циклоалкил.

034323 B1

034323 B1

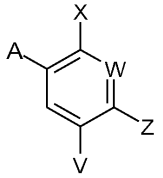
Изобретение касается технической области гербицидов, в частности гербицидов для селективных мер борьбы с сорняками и сорными травами в культурах полезных растений.

Из WO 2012126932 A1 в качестве гербицидов известны N-(1,3,4-оксадиазол-2-ил)арилкарбоксамиды. WO 2013087577 A1 описывает N-(1,3,4-оксадиазол-2-ил)арилкарбоксамиды, которые замещены на амидазоте, так же как гербициды. Из WO 2014126070 A1 известны гербицидно-активные карбоксамиды триазинона, которые замещены на амидазоте.

Задачей настоящего изобретения было получение гербицидно действующих соединений с улучшенными качествами по сравнению с соединениями, известными из уровня техники.

Было обнаружено, что определенные производные N-(1,3,4-оксадиазол-2-ил)арилкарбоксамида, которые замещены специальными остатками на оксадиазолильном остатке или на карбамоильной группе, особенно хорошо подходят в качестве гербицидов.

Таким образом, предметом настоящего изобретения является производное N-(1,3,4-оксадиазол-2-ил)арилкарбоксамида формулы (I)


(I),

,

в которой символы и индексы имеют следующие значения:

W означает CY,

X и Z означают независимо друг от друга соответственно галоген, (C_1-C_6)алкил, трифторметил,

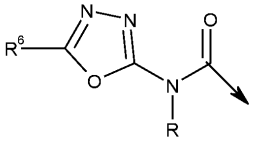
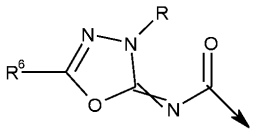
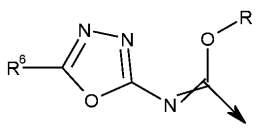
Y означает, $S(O)_nR^2$,

V означает водород,

R^2 означает (C_1-C_6)алкил,

n означает 0, 1 или 2,

A означает остаток A1, A2 или A3




,

A1 A2 A3

R означает (C_1-C_6)алкил-OC(O)OR^{10},

R^6 означает (C_1-C_6)алкил,

R^{10} означает (C_1-C_6)алкил или (C_3-C_6)циклоалкил.

Особенно предпочтительными являются соединения общей формулы (I), в которой

W означает CY,

X и Z означают независимо друг от друга соответственно хлор, метил, трифторметил,

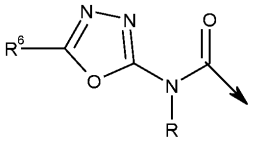
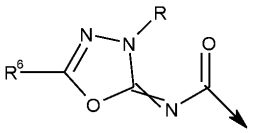
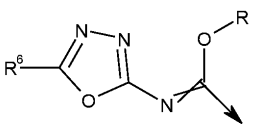
Y означает $S(O)_2R^2$,

V означает водород,

R^2 означает метил,

n означает 1 или 2,

A означает остаток A1, A2 или A3




,

A1 A2 A3

R означает CH(Me)-OC(O)OR^{10},

R^6 означает метил,

R^{10} означает метил, этил или с-гексил.

В формуле (I) и во всех последующих формулах атомы углерода могут быть неразветвленными или разветвленными. Алкильные остатки означают, например, метил, этил, н- или изопропил, н-, изо-, трет- или 2-бутил, пентил, гексил, как н-гексил, изогексил и 1,3-диметилбутил. Аналогично означает алкенил, например, аллил, 1-метилпроп-2-ен-1-ил, 2-метил-проп-2-ен-1-ил, бут-2-ен-1-ил, бут-3-ен-1-ил, 1-метил-бут-3-ен-1-ил и 1-метил-бут-2-ен-1-ил. Алкинил означает, например, пропаргил, бут-2-ин-1-ил, бут-3-ин-1-ил, 1-метил-бут-3-ин-1-ил. Кратная связь соответственно может находиться в любой позиции ненасы-

щенного остатка. Циклоалкил означает карбоциклическую ненасыщенную циклическую систему с 3-6 С-атомами, например циклопропил, циклобутил, циклопентил или циклогексил. Аналогично циклоалкенил означает моноциклическую алкенильную группу с 3-6 углеродными кольцевыми членами, например циклопропенил, циклобутенил, циклопентенил и циклогексенил, причем двойная связь может находиться в любой позиции.

Галоген означает фтор, хлор, бром или иод.

Гетероциклил означает насыщенный, частично насыщенный или полностью ненасыщенный циклический остаток, который содержит 3-6 кольцевых атомов, из которых 1-4 принадлежат группе кислорода, азота и серы, и который дополнительно может быть аннелирован с бензокольцом. Например, гетероциклил означает пиперидинил, пирролидинил, тетрагидрофуранил, дигидрофуранил и оксетанил.

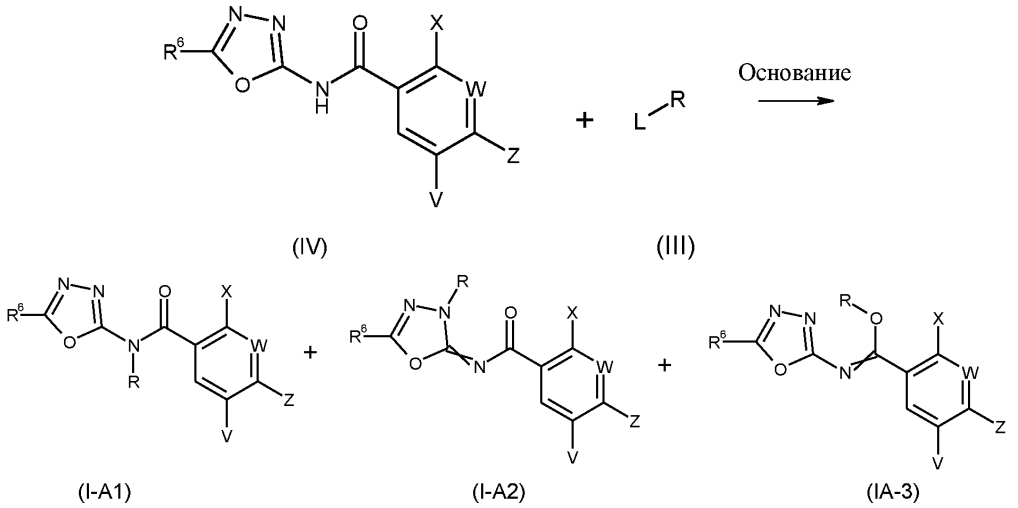
Гетероарил означает ароматический циклический остаток, который содержит 3-6 кольцевых атома, из которых 1-4 принадлежат группе кислорода, азота и серы, и который дополнительно может быть аннелирован с бензокольцом. Например, гетероарил означает бензимидазол-2-ил, фуранил, имидазолил, изоксазолил, изотиазолил, оксазолил, пиразинил, пиримидинил, пиридазинил, пиридинил, бензизоксазолил, тиазолил, пирролил, пиразолил, тиофенил, 1,2,3-оксадиазолил, 1,2,4-оксадиазолил, 1,2,5-оксадиазолил, 1,3,4-оксадиазолил, 1,2,4-триазолил, 1,2,3-триазолил, 1,2,5-триазолил, 1,3,4-триазолил, 1,2,4-триазолил, 1,2,4-тиадиазолил, 1,3,4-тиадиазолил, 1,2,3-тиадиазолил, 1,2,5-тиадиазолил, 2Н-1,2,3,4-тетразолил, 1Н-1,2,3,4-тетразолил, 1,2,3,4-оксатриазолил, 1,2,3,5-оксатриазолил, 1,2,3,4-тиатриазолил и 1,2,3,5-тиатриазолил.

Если группа неоднократно замещена остатками, то под этим следует понимать, что эта группа замещена одним или несколькими одинаковыми или различными упомянутыми остатками. Так же и по отношению к структуре циклических систем - различными атомами и элементами.

Соединения общей формулы (I) могут быть представлены в виде стереоизомеров в зависимости от их вида и соединения заместителей. Если, например, присутствует один или несколько асимметрических атомов углерода, то могут возникать энантиомеры и диастереомеры. Также возникают стереоизомеры, если n означает 1 (сульфоксиды). Стереоизомеры могут быть получены из смесей, возникших при получении, обычными методами разделения, например хроматографическим разделением. Также можно выборочно получать стереоизомеры при проведении стереоселективных реакций с использованием оптически активных исходных и/или вспомогательных веществ. Изобретение также касается всех стереоизомеров и их смесей, которые охвачены общей формулой (I), но отдельно не описаны. Соединения согласно изобретению также могут встречаться в виде геометрических изомеров (E-/Z-изомеров) по причине структуры эфиров оксима. Изобретение также касается всех E-/Z-изомеров и их смесей, которые охвачены общей формулой (I), но отдельно не описаны.

Соединения согласно изобретению можно получать, например, согласно указанному в схеме 1 методу замещением амида N-(1,3,4-оксадиазол-2-ил)арилкарбоновой кислоты (IV) соединением общей формулы (III), причем L означает исходную группу, как, например, хлор, бром, иод, мезилокси, тозилокси, трифторсульфонилокси и т.д.

Схема 1



Соединения формулы (I) согласно изобретению возникают в основном в виде смеси соединений формул (I-A1), (IA-2) и (I-A3) и могут быть изолированы с помощью простых, известных специалисту методов, таких как хроматографическое разделение, перекристаллизация.

Амиды N-(1,3,4-оксадиазол-3-ил)арилкарбоновой кислоты формулы (IV), в принципе, известны и могут быть получены, например, согласно методам, описанным в WO 2012126932 A1. Соединения формулы (III), в которых L означает ответвленную группу, как хлор, бром, иод, метилсульфонилокси, тозилокси или трифторсульфонилокси, имеются в продаже или могут быть получены с помощью известных в

литературе описанных методов.

Соединения формулы (I), которые можно синтезировать при помощи вышеописанных реакций, также можно получить сравнительным способом, причем его можно проводить вручную, частично автоматизированным или полностью автоматизированным способом. Например, также можно автоматизировать проведение реакции, регенерацию или очистку веществ или промежуточных стадий. Т.е. под этим понимают такой образ действия, который, например, описан в D. Tiebes in Combinatorial Chemistry - Synthesis, Analysis, Screening (изд. Günther Jung), изд. Wiley 1999, стр. 1-34.

Для параллельного проведения реакции и регенерации можно применять ряд имеющихся в продаже приборов, например реакционные блоки Calpyso (Caylpso reaction blocks) фирмы Barnstead International, Dubuque, Айова 52004-0797, США, или реакционные станции фирмы Radleys, Shirehill, Saffron Walden, Essex, CB 11 3AZ, Англия, или автоматизированные рабочие станции MultiPROBE фирмы Perkin Elmar, Waltham, Массачусетс 02451, США. Для параллельной регенерации соединений общей формулы (I) или промежуточных продуктов, образующихся при изготовлении, в распоряжении находится другое оборудование для хроматографии, в том числе, например, фирмы ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, США.

Упомянутое оборудование приводит к модульному способу действия, в котором отдельные этапы работы являются автоматизированными, однако между ними необходимо проводить некоторые операции вручную. Этого можно избежать при использовании частично или полностью интегрированных автоматизированных систем, в которых соответствующие автоматизированные модули обслуживаются, например, роботами. Такие автоматизированные системы можно приобрести, например, у фирмы Caliper, Hopkinton, MA 01748, США.

Отдельные или несколько этапов синтеза можно проводить с использованием поддерживаемых полимером реагентов/поглотительной смолы. В специальной литературе описан ряд протоколов исследований, например, в ChemFiles, т. 4, № 1, Polymer-Supported Scavengers and Reagents for Solution-Phase Synthesis (Sigma-Aldrich).

Кроме описанных здесь методов, соединения общей формулы (I) можно полностью или частично получать методами, поддерживаемыми твердыми фазами. Для этой цели отдельные промежуточные стадии или все промежуточные стадии синтеза, или синтез, подходящий к соответственному методу, соединяют с синтезной смолой. Методы синтеза, поддерживаемые твердыми фазами, достаточно описаны в специальной литературе, например Barry A. Bunin в "The Combinatorial Index", Verlag Academic Press, 1998 и Combinatorial Chemistry - Synthesis, Analysis, Screening (издатель Günther Jung), изд. Wiley, 1999. Применение методов синтеза, поддерживаемых твердыми фазами, которые также можно выполнять вручную или автоматически, описывает ряд известных в литературе протоколов. Реакции можно проводить, например, с помощью технологий IRORI в микрореакторах фирмы Nexus Biosystems, 12140 Community Road, Повей, CA92064, США.

Проведение отдельных или нескольких этапов синтеза можно поддерживать с помощью использования технологии микроволн как на твердой, так и на жидкой фазе. В специальной литературе описан ряд протоков исследования, например в Microwaves in Organic and Medicinal Chemistry (издатель C.O. Kappe и A. Stadler), изд. Wiley, 2005.

Согласно описанным здесь способам получают соединения формулы (I) в виде собраний веществ, названных в библиотеках. Предметом настоящего изобретения также являются библиотеки, которые содержат по меньше мере два соединения формулы (I).

Соединения формулы (I) согласно изобретению (и/или их соли), называемые вместе далее "соединения согласно изобретению", обнаруживают превосходную гербицидную активность против широкого спектра экономически важных одно- и двудольных однолетних вредных растений. Эти биологически-активные вещества также хорошо действуют на многолетние вредные растения, с которыми трудно бороться, вредные растения, дающие побеги из ризом, корневища или других зимующих органов.

Поэтому задача настоящего изобретения - способы борьбы с нежелательными растениями или регулирование роста растений, предпочтительно в культурах растений, где одно или более соединений наносят на растения (например, на растения-вредители, как одно- и двудольные сорняки или нежелательные растительные культуры), посевной материал (например, зерна, семена или органы вегетативного размножения, как клубни или черенки) или на почву, на которой растут растения (например, на посевную площадь). При этом соединения согласно изобретению можно вносить, например, перед посевом (также, при необходимости, внесением в почву), в предвсходовый или послевсходовый период. В качестве примеров можно, в частности, назвать некоторых представителей одно- и двудольных сорных растений, рост которых можно контролировать с помощью соединений согласно изобретению, не ограничиваясь при этом названиями определенных видов.

Однодольные вредные растения видов: Aegilops (эгилопс), Agropyron (пырей), Agrostis (полевица), Alopecurus (лисохвост), Apera (метлица), Avena (овес), Brachiaria, Bromus (костер), Cenchrus, Commelina (коммелина), Cynodon (свинорой), Cyperus (сыть), Dactyloctenium, Digitaria (росичка), Echinochloa (ежовник), Eleocharis (болотница), Eleusine (дагусса), Eragrostis (полевичка), Eriochloa, Festuca (овсяница), Fimbristylis, Heteranthera, Imperata, Ischaemum (бородач), Leptochloa, Lolium (плевел), Monochoria, Pani-

cum (просо), Paspalum, Phalaris (канареечник), Phleum (аржанец), Poa (мятлик), Rottboellia, Sagittaria (стрелолист), Scirpus (камыш), Setaria (щетинник), Sorghum (сорго).

Двудольные сорные растения видов: Abutilon (канатник), Amaranthus (амарант), Ambrosia (амброзия), Anoda, Anthemis (пупавка), Aphanes, Artemisia (полынь), Atriplex (лебеда), Bellis (маргаритка), Bidens (череда), Capsella (пастушья сумка), Carduus (чертополох), Cassia (кассия), Centaurea (василек), Chenopodium (марь), Cirsium (бодяк), Convolvulus (вьюнок), Datura (дурман), Desmodium (телеграфное растение), Emex, Erysimum (желтушник), Euphorbia (молочай), Galeopsis (пикульник), Galinsoga (галинсога), Galium (подмаренник), Hibiscus (бамия), Ipomoea (ипомея), Kochia (кохия), Lamium (яснотка), Lepidium (клоповник), Lindernia, Matricaria (ромашка), Mentha (мята), Mercurialis (пролесник), Mullugo, Myosotis (незабудка), Papaver (мак), Pharbitis, Plantago (подорожник), Polygonum (горец), Portulaca (портулак), Ranunculus (лютик), Raphanus (редька), Rorippa (жерушник), Rotala, Rumex (щавель), Salsola (солянка), Senecio (крестовник), Sesbania (сесбания), Sida (сида), Sinapis (сесбания), Solanum (паслен), Sonchus (осот), Sphenoclea, Stellaria (звездчатка), Taraxacum (одуванчик), Thlaspi (ярутка), Trifolium (клевер), Urtica (крапива), Veronica (вероника), Viola (фиалка), Xanthium (дурнишник).

Если соединения согласно изобретению наносят на поверхность земли перед прорастанием ростков, то рост ростков сорняков полностью прекращается или сорняки растут до стадии семядоли, однако затем их рост прекращается и в конце концов они погибают в течение 3-4 недель после начала роста.

При нанесении биологически активных веществ на зеленые части растений при послевсходовом применении после обработки наступает прекращение роста, и вредные растения на той стадии роста, на которой они находились в момент применения, или полностью погибают через определенный промежуток времени, таким образом очень рано и на продолжительный период устраняют конкуренцию в виде вредных сорных растений.

Хотя согласно изобретению соединения показывают отличную гербицидную активность против одно- и двудольных сорняков, культурные растения, экономически важные культуры, например двудольные культуры вида Arachis, Beta, Brassica, Cucumis, Cucurbita, Helianthus, Daucus, Glycine, Gossypium, Ipomoea, Lactuca, Linum, Lycopersicon, Nicotiana, Phaseolus, Pisum, Solanum, Vicia, или однодольные культуры видов Allium, Ananas, Asparagus, Avena, Hordeum, Oryza, Panicum, Saccharum, Secale, Sorghum, Triticale, Triticum, Zea, особенно Zea и Triticum, только незначительно зависят от структуры этих соединений согласно изобретению и их норм расхода или совсем не повреждаются. Поэтому данные соединения очень хорошо подходят для селективной борьбы с нежелательным ростом растений в культурах таких растений, как сельскохозяйственные полезные или декоративные растения.

Кроме того, соединения согласно изобретению (в зависимости от их соответствующей структуры и применяемого количества) обнаруживают превосходные свойства регулирования роста культурных растений. Они вмешиваются и регулируют обмен веществ растений, и это может использоваться для целенаправленного влияния на растительные компоненты и для облегчения сбора урожая, как, например, благодаря приведению в действие десикации и прекращения роста. Далее они делают возможным общее регулирование и задержку нежеланного вегетативного роста, не уничтожая при этом растения. Задержка нежеланного вегетативного роста играет во многих одно- и двудольных культурах большую роль, так, например, этим путем сокращается или полностью предотвращается их распространение.

Благодаря их гербицидным качествам и свойствам, регулирующим рост, биологически активные вещества также можно использовать для борьбы с вредными растениями в культурах растений, измененных с помощью генной инженерии или обычного мутагенеза. Трансгенные растения отличаются, как правило, особенно предпочтительными свойствами, например своей резистенцией к определенным пестицидам, прежде всего, к определенным гербицидам, резистенцией к болезням растений или их возбудителям, таким как определенные насекомые или микроорганизмы, таким как грибы, бактерии или вирусы. Другие особые свойства, как правило, касаются собранного урожая, относительно количества, качества, стабильности при хранении, состава и особых компонентов. Так известны трансгенные растения с повышенным содержанием крахмала или измененным свойством крахмала, или растения с другим составом кислоты жирного ряда в собранном урожае.

Предпочтительным является применение соединений согласно изобретению для экономически значимых трансгенных культур полезных и декоративных растений, например для таких злаковых культур, как пшеница, ячмень, рожь, овес, просо, рис и кукуруза, или также культур сахарной свеклы, хлопка, сои, рапса, картофеля, томатов, гороха и других сортов овощей. Предпочтительно можно применять соединения согласно изобретению в качестве гербицидов в культурах полезных растений, которые являются устойчивыми по отношению к фитотоксичному действию гербицидов или стали устойчивыми благодаря методам генной инженерии.

Предпочтительным является применение композиций из гербицидов и защитных средств согласно изобретению для экономически значимых трансгенных культур полезных и декоративных растений, например для таких злаковых культур, как пшеница, ячмень, рожь, овес, просо, рис, маниок и кукуруза, или также для культур сахарной свеклы, хлопка, сои, рапса, картофеля, томатов, гороха и других сортов овощей. Предпочтительно можно применять соединения согласно изобретению в качестве гербицидов в технических культурах, которые являются устойчивыми к фитотоксичному действию гербицидов или

стали устойчивыми благодаря методам генной инженерии.

Традиционные пути выращивания новых растений, которые показывают модифицированные свойства по отношению к до сих пор существующим растениям, заключаются, например, в классическом способе разведения и разведении мутантов. Альтернативно новые растения с измененными качествами могут быть получены с помощью способов генной инженерии (см., например, EP-A-0221044, EP-A-0131624). Например, были описаны в нескольких случаях

изменения с помощью методов генной инженерии культурных растений с целью модификации синтезированного в растениях крахмала (например, WO 92/11376, WO 92/14827, WO 91/19806), трансгенные культурные растения, которые устойчивы к определенным гербицидам типа глуфосината (ср., например, EP-A-0242236, EP-A-242246) или глифосата (WO 92/00377), или сульфонилмочевины (EP-A-0257993, US-A-5013659);

трансгенные культурные растения, например хлопок, со способностью вырабатывать токсины, продуцируемые бактерией Bacillus thuringiensis (БТ-токсины), которые делают растения устойчивыми к определенным вредителям (EP-A-0142924, EP-A-0193259). трансгенные культурные растения с измененным составом кислоты жирного ряда (WO 91/13972);

культурные растения, измененные с помощью методов генной инженерии, с новыми компонентами и вторичными материалами, например новыми фитоалексинами, которые служат причиной повышенной устойчивости к болезням (EP-A-309862, EP-A-0464461);

растения, измененные с помощью методов генной инженерии, со сниженным фотодыханием, что способствует повышенным урожаям и повышенной стрессоустойчивости (EP-A-0305398);

трансгенные культурные растения, которые производят фармацевтические или диагностические важные протеины (молекулярный "фарминг");

трансгенные культурные растения, которые отличаются высокой урожайностью или лучшим качеством;

трансгенные культурные растения, которые отличаются сочетанием, например, вышеупомянутых новых качеств ("стэкинг генов").

Многочисленные молекулярно-биологические технологии, с помощью которых могут производиться новые трансгенные растения с измененными качествами, в принципе, известны; см., например, I. Potrykus и G. Spangenberg (eds.) Gene Transfer to Plants, Springer Lab Manual (1995), изд. Springer Берлин, Гейдельберг; или Christou, "Trends in Plant Science" 1 (1996) 423-431).

Для генно-инженерных манипуляций такого рода молекулы нуклеиновых кислот могут доставляться в плазмиды, которые позволяют мутагенез или внесение изменений в нуклеотидную ДНК-последовательность. С помощью стандартных технологий может проводиться, например, катионный обмен, удаляться частичные последовательности или добавляться природные или синтетические последовательности. Для соединения ДНК-фрагментов друг с другом к фрагментам могут прикрепляться адаптеры или линкеры, см., например, Sambrook и др., 1989, Molecular Cloning, A Laboratory Manual, 2-е изд. Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, Нью-Йорк; или Winnacker "Gene und Klone", VCH Вайнхайм 2-е изд., 1996.

Создание клеток растений со сниженной активностью генного продукта может, например, быть достигнуто экспрессией по меньшей мере одного соответствующего антисмыслового РНК, одного смыслового РНК для извлечения РНК-интерференции или экспрессией, по меньшей мере, соответствующей созданной рибосомы, специфическим транскриптом вышеназванного генного продукта. Кроме того, могут использоваться молекулы ДНК, которые охватывают общую кодированную последовательность генного продукта, включая возможные имеющиеся фланкирующие последовательности, а также и молекулы ДНК, которые охватывают только часть кодированной последовательности, причем эта часть должна быть достаточно длинной, чтобы вызвать в клетках антисмысловой эффект. Возможно также применение ДНК-последовательностей, которые указывают высокую степень гомологии кодированных последовательностей, но не полностью идентичны.

При экспрессии молекул нуклеиновых кислот в растениях синтетический протеин может локализироваться в любом отделении растительной клетки. Но чтобы достигнуть локализации в определенном отделении, кодированная область может, например, связываться с ДНК-последовательностями, которые обеспечивают локализацию в одном определенном отделении. Такие последовательности известны специалисту (см., например, Braun и др., EMBO J. 11 (1992), 3219-3227; Wolter и др., Proc. Natl. Acad. Sci. США 85 (1988), 846-850; Sonnewald и др., Plant J. 1 (1991), 95-106). Экспрессия молекул нуклеиновых кислот также может происходить в органеллах растительных клеток.

Трансгенные растительные клетки могут регенерироваться известными способами в целые растения. У трансгенных растений может идти речь принципиально о растениях любых видов, т.е. как об однодольных, так и о двудольных.

Так трансгенные растения, имеющиеся в продаже, могут иметь измененные свойства благодаря повышенной экспрессии, подавлению или ингибированию гомологичных (=природных) генов или генной последовательности или экспрессии гетерологических (=посторонних) генов или последовательности генов.

Преимущественно в трансгенных культурах могут применяться согласно изобретению соединения, которые устойчивы к ростовым веществам, как, например, дикамба, или к гербицидам, которые сдерживают существенные растительные энзимы, как, например, ацетолактат синтаза (АДС). EPSP синтаза, глютамин синтаза (ГС) или гидроксифенилпируват диоксигеназа (ГФПДГ), или к гербицидам из группы сульфанил-мочевины, глифосата, глуфосината или бензоилоксазола и аналогичным активным действующим веществам.

При применении согласно изобретению биологически активных веществ в трансгенных культурах рядом с наблюдаемыми результатами по отношению к вредным растениям в других культурах часто возникают результаты, которые специфичны для данных трансгенных культур, например измененный или специально расширенный спектр сорняков, что может подавлять, измененное расходуемое количество, которое может использоваться для применения, предпочтительно хорошая сочетаемость с гербицидами, к которым трансгенные культуры устойчивы, а также влияние на рост и урожай трансгенных культур.

Задачей изобретения поэтому также является использование соединений согласно изобретению в качестве гербицидов для борьбы с вредными растениями в трансгенных культурных растениях.

Другое преимущество соединений согласно изобретению состоит также в незначительной токсичности по отношению к таким организмам, как насекомые, амфибии, рыбы и млекопитающие.

Согласно изобретению соединения могут использоваться в форме порошка для впрыскивания, эмульгируемых концентратов, растворов для опрыскивания, средств для распыления или гранулятов в виде других препаратов. Задачей изобретения поэтому также являются гербицидные и регулирующие рост растений средства, которые содержат соединения согласно изобретению.

Соединения согласно изобретению могут быть сформулированы различными способами в зависимости от того, какие биологические и/или химико-физические параметры заданы. Например, применяются в расчет следующие варианты смесей: порошки для опрыскивания (WP), водорастворимые порошки (SP), водорастворимые концентраты, концентраты, образующие эмульсии (EC), эмульсии (EW), как эмульсии типа "масло-в-воде" и "вода-в-масле", растворы для опрыскивания, концентраты суспензий (SC), диспергирование в масляной или водной фазе, растворы масляных эмульсий, капсульные суспензии (CS), средство для распыления (DP), протравители, грануляты для рассыпания и обработки почвы, грануляты (GR) в форме микрогранул, грануляты для рассеивания, грануляты в оболочке и грануляты для абсорбции, водно-диспергируемые грануляты (WG), водорастворимые грануляты (SG), ULV.

Эти отдельные типы композиций в принципе являются известными и описаны, например, в Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", т. 7, C, изд. Hanser Мюнхен, 4-е изд. 1986, Wade van Valkenburg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker, N.Y., 1973, K. Martens, "Spray Drying" Handbook, 3-е изд., 1979, G. Goodwin Ltd. London.

Необходимые вспомогательные средства для соединений, такие как инертные материалы, ПАВ, растворители и другие дополнительные вещества равным образом известны и описаны, например, в Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2-е изд., Darland Books, Caldwell N.J., H.V. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry", 2-е изд., J. Wiley & Sons, Нью-Йорк, C. Marsden, "Solvents Guide", 2-е изд., Interscience, Нью-Йорк 1963, McCutcheon's "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N.J., Sisley and Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., Нью-Йорк 1964, Шенфельд, "Поверхностно-активные аддукты этиленоксида", науч. изд. общ., Штутгарт 1976, Winnacker-Küchler, "Химическая технология", т. 7, C, изд. Hanser Мюнхен, 4. изд., 1986.

Порошками для распыления являются препараты, равномерно диспергируемые в воде, которые наряду с биологически активным веществом, кроме разбавителя или инертного вещества, также содержат еще ПАВы неионного и/или ионного вида (смачиватели, диспергаторы), например полиоксиэтилированные алкилфенолы, полиоксэтилированные алифатические спирты, полиоксэтилированные алифатические амины, полигликольэфир-сульфаты жирного спирта, алкансульфонаты, алкилбензолсульфонаты, лигнинсульфокислый натрий, 2,2'-динафтилметан-6,6'-дисульфокислый натрий, дибутилнафталинсульфокислый натрий или также олеолметилтауринкислый натрий. Для изготовления порошков для распыления гербицидные биологически активные вещества тонко измельчают, например, на таком обычном оборудовании, как молотковая дробилка, воздуходувная и воздухоструйная мельница и сразу или потом смешивают со вспомогательными средствами композиции.

Эмульгируемые концентраты получают при растворении биологически активного вещества в органическом растворителе, например бутаноле, циклогексаноне, диметилформамиде, ксилоле или также в высококипящих ароматических соединениях или углеводородах или смесях органического растворителя с использованием одного или нескольких ПАВ ионного и/или неионного вида (эмульгаторов). В качестве эмульгаторов, например, можно использовать, алкиларилсульфокислоты, такие соли кальция, как додецилбензолсульфонат кальция или такие неионные эмульгаторы, как полигликолевый эфир жирной кислоты, алкиларилполигликолевый эфир, полигликолевый эфир жирного спирта, продукт конденсации пропиленоксид-этиленоксида, алкилполиэфир, сорбитановый эфир, как, например, сложный эфир сорбитановой кислоты жирного ряда или сложный эфир полиоксэтиленсорбитана, как, например, сложный эфир полиоксэтиленсорбитановой кислоты жирного ряда.

Средства для опыления получают при измельчении биологически активного вещества с такими

тонко измельченными твердыми веществами, как, например, тальк, такими природными глинами, как каолин, бентонит и пирофиллит, или диатомовая земля.

Суспензионные концентраты могут иметь водную или масляную основу. Их можно получить, например, при влажном измельчении с помощью стандартных бисерных мельниц при необходимости с добавлением ПАВ, как, например, уже было названо в других типах композиций.

Эмульсии, например эмульсии типа "масло-в-воде" (EW), можно получить с помощью мешалок, коллоидных мельниц и/или статических смесителей при использовании водных органических растворителей и, при необходимости, ПАВ, как, например, уже было названо в других типах композиций.

Грануляты могут производиться путем распыления активного действующего вещества на гранулированные инертные адсорбенты или нанесением концентрата активных действующих веществ при помощи связующих веществ, например поливинилового спирта, натрия полиакриловой кислоты или также минеральных масел, на поверхность такого наполнителя, как песок, каолинит или гранулированный инертный материал. Также для изготовления гранулятов для удобрений надлежащие активные действующие вещества дробят обычным способом, при желании в смеси с удобрениями.

Водно-диспергируемые грануляты производятся, как правило, обычными способами, такими как распылительная сушка, гранулирование в кипящем слое, гранулирование дисковым гранулятором, смешивание в высокоскоростном миксере-грануляторе и экструзия без твердого инертного вещества.

О производстве дисковых гранулятов, гранулятов в кипящем слое, в экструдере и распыляемых гранулятов см., например, способ в "Spray-Drying Handbook" 3-е изд., 1979, G. Goodwin Ltd., Лондон, J.E. Browning, "Agglomeration", Chemical and Engineering 1967, стр. 147 и др., "Perry's Chemical Engineer's Handbook", 5-е изд., McGraw-Hill, Нью-Йорк 1973, стр. 8-57.

Другие подробности о композициях средств защиты растений см., например, в G.C. Klingman, "Weed Control as a Science", John Wiley and Sons, Inc., Нью-Йорк, 1961, стр. 81-96 и J.D. Freyer, S.A. Evans, "Weed Control Handbook", 5-е изд., Blackwell Scientific Publications, Оксфорд, 1968, стр. 101-103.

Агрохимические способы приготовления содержат, как правило, от 0,1-99 мас.%, особенно 0,1-95 мас.% соединений согласно изобретению.

Концентрация активных действующих веществ в порошках для опрыскивания составляет, например, от около 10 до 90 мас.% остатка к 100 мас.% состоящей из обычных компонентов смеси. В эмульгируемых концентратах концентрация биологически активного вещества может составлять примерно 1-90, предпочтительно 5-80 мас.%. Пылевидные препаративные формы содержат 1-30 мас.% биологически активного вещества, предпочтительно чаще 5-20 мас.% биологически активного вещества, распыляемые растворы содержат примерно 0,05-80, предпочтительно 2-50 мас.% биологически активного вещества. В вододиспергируемых гранулятах содержание активного компонента частично зависит от того, присутствует действующее соединение в жидком или твердом виде, и какие гранулирующие вспомогательные вещества, наполнители и т.д. используют. В диспергируемых в воде гранулятах содержание биологически активного вещества составляет, например, 1-95 мас.%, предпочтительно 10-80 мас.%.

Наряду с этим названные соединения активных действующих веществ при необходимости содержат обычные схватывающие, смачивающие, диспергирующие, эмульгирующие, проникающие, консервирующие вещества, вещества, защищающие от мороза, и растворители, наполнители, носители, красители, пеногасители, тормозные испарители и антитранспиранты и средства, влияющие на уровень pH и вязкость.

Для применения композиции, находящиеся в обычном виде, разбавляют обычным способом, например, порошки для разбрызгивания, эмульгируемые концентраты, дисперсии и вододиспергируемые грануляты разбавляют водой. Пылевидные препараты, грануляты для внесения в почву или для разбрасывания, а также распыляемые растворы перед применением обычно больше не разбавляют другими инертными веществами.

Необходимая норма расхода соединения формулы (I) меняется в зависимости от таких внешних условий, как температура, влажность, вид применяемого гербицида и т.д. Она может колебаться в широких границах, например 0,001-1,0 кг/га или более действующего вещества, однако предпочтительно она составляет 0,005-750 г/га.

Следующие примеры разъясняют изобретение.

А. Химические примеры.

1. Синтез этил-1-{[2-метил-3-(метилсульфонил)-4-(трифторметил)бензоил](5-метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил)амино}этилкарбоната (примеры в табл. № 1-145),

этил-1-[5-метил-2-{[2-метил-3-(метилсульфонил)-4-(трифторметил)бензоил]имино}-1,3,4-оксадиазол-3(2H)-ил]этилкарбоната (примеры в табл. № 4-145) и

1-[(этоксикарбонил)окси]этил-2-метил-N-(5-метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил)-3-(метилсульфонил)-4-(трифторметил)бензолкарбоксимидата (примеры в табл. № 7-145).

К раствору 1,00 г (2,752 ммоль) 2-метил-N-(5-метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил)-3-(метилсульфонил)-4-(трифторметил)бензамида в 20 мл ацетонитрила при комнатной температуре добавили 882 мг (5,78 ммоль) 1-хлорэтилэтилкарбоната и 799 мг (5,78 ммоль) карбоната калия и кипятили в течение 9 ч с обратным потоком. Реакционную смесь сгустили и затем растворили в 20 мл уксусного эфира и смешали с

20 мл воды и экстрагировали. Водную фазу еще раз дважды экстрагировали соответственно по 20 мл эфира уксусной кислоты. Объединенные органические фазы промыли насыщенным раствором NaCl, высушили и сгустили. Остаток очистили с помощью обращенно-фазовой ВЭЖХ (ацетонитрил/вода).

Соединение № 1-145.

Выход: 170 мг (12%).

^{1}H-ЯМР (400 МГц; $CDCl_3$): 7.73 ppm (d, 1H); 7.53 ppm (d, 1H), 7.05-6.92 (breit, 1H), 4.32-4.26 (m, 2H); 3.21 (s, 3H); 2.80 (s, 3H), 2.43 (s, 3H), 1.62 (d, 3H), 1.36 (t, 3H).

Соединение № 4-145.

Выход: 180 мг (12,3%).

^{1}H-ЯМР (400 МГц; $CDCl_3$): 8.04 ppm (d, 1H); 7.81 ppm (d, 1H), 6.74 (q, 1H), 4.25-4.18 (m, 2H); 3.25 (s, 3H); 2.92 (s, 3H); 2.49 (s, 3H); 1.77 (d, 3H), 1.30 (t; 3H).

Соединение № 7-145.

Выход: 110 мг (7,9%).

^{1}H-ЯМР (400 МГц; $CDCl_3$): 7.80 ppm (d, 1H); 7.54 ppm (d, 1H), 7.16 (q, 1H), 4.27 (q, 2H); 3.24 (s, 3H); 2.73 (s, 3H); 2.40 (s, 3H); 1.73 (d, 3H), 1.34 (t; 3H).

2. Синтез 1-{[2-хлор-3-(метилсульфинил)-4-(трифторметил)бензоил]-(5-метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил)амино}этилэтилкарбоната (примеры в табл. № 1-385),

этил-1-[5-метил-2-{[2-хлор-3-(метилсульфинил)-4-(трифторметил)бензоил]имино}-1,3,4-оксадиазол-3(2H)-ил]этилкарбоната (примеры в табл. № 4-385) и

1-[(этоксикарбонил)окси]этил-2-хлор-N-(5-метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил)-3-(метилсульфинил)-4-(трифторметил)бензолкарбоксимидата (примеры в табл. № 7-385).

Аналогично вышеназванному методу получения с помощью превращения 1,00 г (2,719 ммоль) 2-хлор-N-(5-метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил)-3-(метилсульфинил)-4-(трифторметил)бензамида с 871 мг (5,71 ммоль) 1-хлорэтилэтилкарбоната изолировали.

Соединение № 1-385.

Выход: 210 мг (13%).

^{1}H-ЯМР (400 МГц; $CDCl_3$): 7.70 ppm (d, 1H); 7.63 ppm (d, 1H), 7.12-6.91 (breit, 1H), 4.28 (q, 2H); 3.07 и 3.05 (2s, 3H); 2.46 (s, 3H), 1.66 и 1.64 (2d, 3H), 1.34 (t, 3H).

Соединение № 4-385.

Выход: 200 мг (13,7%).

^{1}H-ЯМР (400 МГц; $CDCl_3$): 7.96 ppm (d, 1H); 7.74 ppm (d, 1H), 6.74 (q, 1H), 4.26-4.18 (m, 2H); 3.13 (s, 3H); 2.49 (s, 3H); 1.77 (d, 3H), 1.30 (t, 3H).

Соединение № 7-385.

Выход: 130 мг (9,4%).

^{1}H-ЯМР (400 МГц; $CDCl_3$): 7.78-7.75 ppm (2d, 1H); 7.66-7.62 ppm (2d, 1H), 7.18 (2q, 1H), 4.31-4.24 (2q, 2H); 3.08 (s, 3H); 2.42 (s, 3H); 1.74 (2d, 3H), 1.34 (2t; 3H).

3. Синтез 1-{[2-хлор-3-(метилсульфинил)-4-(трифторметил)бензоил]-(5-метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил)амино}этилциклогексилкарбоната (примеры в табл. № 3-385),

1-[2-{[2-хлор-3-(метилсульфинил)-4-(трифторметил)бензоил]имино}-5-метил-1,3,4-оксадиазол-3(2H)-ил]этилциклогексилкарбоната (примеры в табл. № 6-385) и

1-{[(циклогексилокси)карбонил]окси}этил-2-хлор-N-(5-метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил)-3-(метилсульфинил)-4-(трифторметил)бензолкарбоксимидата (примеры в табл. № 9-385).

Аналогично вышеназванному методу получения с помощью превращения 1,00 г (2,719 ммоль) 2-хлор-N-(5-метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил)-3-(метилсульфинил)-4-(трифторметил)бензамида с 1180 мг (5,71 ммоль) 1-хлорэтилциклогексилкарбоната изолировали.

Соединение № 3-385.

Выход: 190 мг (10%).

^{1}H-ЯМР (400 МГц; $CDCl_3$): 7.74 ppm (d, 1H); 7.65 ppm (d, 1H), 7.21-6.89 (breit, 1H), 4.71-4.66 (m, 1H); 3.05 и 3.07 (2s, 3H); 2.48 (s, 3H), 2.00-1.88 (m, 2H), 1.80-1.71 (m, 2H), 1.70-1.20 (m, 9H).

Соединение № 6-385.

Выход: 50 мг (3,3%).

^{1}H-ЯМР (400 МГц; $CDCl_3$): 7.96 ppm (d, 1H); 7.74 ppm (d, 1H), 6.74 (q, 1H), 4.64-4.59 (m, 1H); 3.13 (s, 3H); 1.93-1.20 (m, 13H).

Соединение № 9-385.

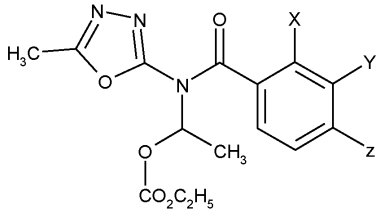
Выход: 180 мг (12%).

^{1}H-ЯМР (400 МГц; $CDCl_3$): 7.78-7.75 ppm (2d, 1H); 7.65-7.62 ppm (2d, 1H), 7.18 (2q, 1H), 4.70-4.66 (m, 1H); 3.08 (s, 3H); 2.42 (s, 3H); 1.94-1.92 (m, 2H), 1.78-1.73 (m, 5H), 1.59-1.26 (m, 6H).

Примеры, приведенные в следующих таблицах, получены или доступны аналогично вышеупомянутым методам. Соединения, названные в следующих таблицах, являются особенно предпочтительными.

Таблица 1

Соединения согласно изобретению общей формулы (I), в которой A означает A1, R^6 означает метил, R означает $CH(Me)OCO_2Et$, W означает CY и V означает водород



№	X	Y	Z	Физические параметры (^{1}H-NMR (400 MHz; $CDCl_3$):
1-96	Me	SEt	F	
1-97	Me	SOEt	F	
1-98	Me	SO_2Et	F	
1-116	Me	SMe	Cl	
1-117	Me	SOMe	Cl	
1-118	Me	SO_2Me	Cl	
1-119	Me	SEt	Cl	
1-120	Me	SOEt	Cl	
1-121	Me	SO_2Et	Cl	
1-130	Me	SMe	Br	
1-131	Me	SOMe	Br	
1-132	Me	SO_2Me	Br	
1-133	Me	SEt	Br	
1-134	Me	SOEt	Br	
1-135	Me	SO_2Et	Br	
1-136	Me	SMe	I	
1-137	Me	SOMe	I	
1-138	Me	SO_2Me	I	
1-139	Me	SEt	I	
1-140	Me	SOEt	I	
1-141	Me	SO_2Et	I	
1-143	Me	SMe	CF_3	
1-144	Me	SOMe	CF_3	

1-145	Me	SO_2Me	CF_3	7.73 ppm (d, 1H); 7.53 ppm (d, 1H), 7.05-6.92 (breit, 1H), 4.32 - 4.26 (m, 2H); 3.21 (s, 3H); 2.80 (s, 3H), 2.43 (s, 3H), 1.62 (d, 3H), 1.36 (t, 3H)
1-146	Me	SEt	CF_3	
1-147	Me	SOEt	CF_3	
1-148	Me	SO_2Et	CF_3	
1-200	Et	SMe	Cl	
1-201	Et	SO_2Me	Cl	
1-202	Et	SMe	CF_3	
1-203	Et	SO_2Me	CF_3	
1-206	iPr	SO_2Me	CF_3	
1-207	cPr	SO_2Me	CF_3	
1-234	F	SMe	CF_3	
1-235	F	SOMe	CF_3	
1-242	Cl	SMe	Cl	
1-243	Cl	SOMe	Cl	
1-244	Cl	SO_2Me	Cl	
1-384	Cl	SMe	CF_3	
1-385	Cl	S(O)Me	CF_3	7.70 ppm (d, 1H); 7.63 ppm (d, 1H), 7.12-6.91 (breit, 1H), 4.28 (q, 2H); 3.07 и 3.05 (2s, 3H); 2.46 (s, 3H), 1.66 и 1.64 (2d, 3H), 1.34 (t, 3H)
1-386	Cl	SO_2Me	CF_3	
1-388	Cl	SMe	Me	
1-389	Cl	SOMe	Me	
1-390	Cl	SO_2Me	Me	
1-416	CF_3	SMe	CF_3	
1-417	CF_3	SOMe	CF_3	
1-418	CF_3	SO_2Me	CF_3	
1-420	Me	SMe	Et	
1-421	Me	SOMe	Et	
1-422	Me	SO_2Me	Et	
1-446	Cl	SMe	CF_3	
1-447	Cl	SOMe	CF_3	
1-448	Cl	SO_2Me	CF_3	
1-449	Et	SEt	CF_3	
1-450	Et	SOEt	CF_3	
1-451	Et	SO_2Et	CF_3	

Таблица 2

Соединения согласно изобретению общей формулы (I), в которой A означает A1, R^6 означает метил, R означает $CH(Me)OCO_2Me$, W означает CY и V означает водород

Табл. 2 содержит 451 соединение (2-1 - 2-451), в которых X, Y и Z имеют значения, названные в табл. 1

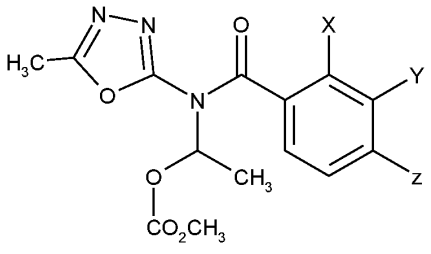


Таблица 3

Соединения согласно изобретению общей формулы (I), в которой A означает A1, R^6 означает метил, R означает $CH(Me)OCO_2$-c-гексил, W означает CY и V означает водород

Табл. 3 содержит 451 соединение (3-1 - 3-451), в которых X, Y и Z имеют значения, названные в табл. 1

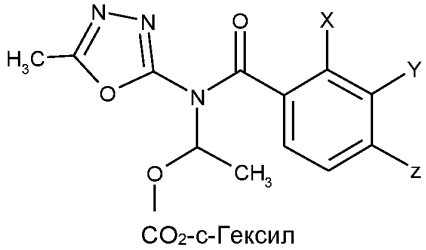


Таблица 4

Соединения согласно изобретению общей формулы (I), в которой A означает A2, R^6 означает метил, R означает $CH(Me)OCO_2Et$, W означает CY и V означает водород

Табл. 4 содержит 451 соединение (4-1 - 4-451), в которых X, Y и Z имеют значения, названные в табл. 1

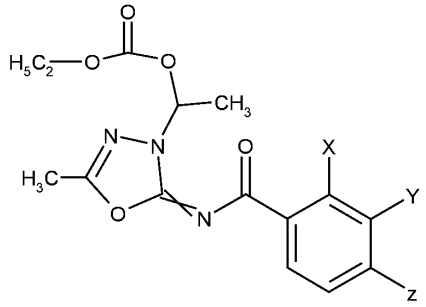


Таблица 5

Соединения согласно изобретению общей формулы (I), в которой A означает A2, R^6 означает метил, R означает $CH(Me)OCO_2Me$, W означает CY и V означает водород

Табл. 5 содержит 451 соединение (5-1 - 5-451), в которых X, Y и Z имеют значения, названные в табл. 1

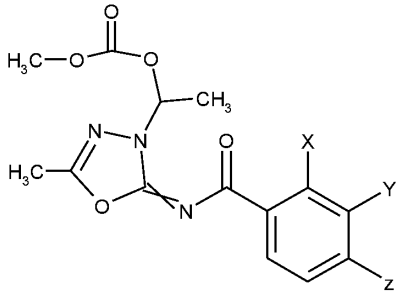


Таблица 6

Соединения согласно изобретению общей формулы (I), в которой A означает A2, R^6 означает метил, R означает $CCH(Me)OCO_2$-c-гексил, W означает CY и V означает водород

Табл. 6 содержит 451 соединение (6-1 - 6-451), в которых X, Y и Z имеют значения, названные в табл. 1

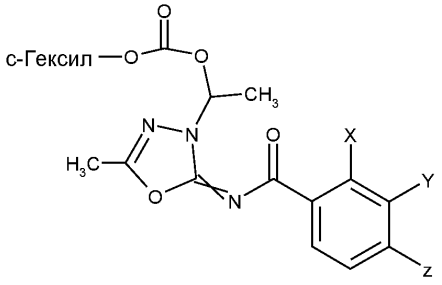


Таблица 7

Соединения согласно изобретению общей формулы (I), в которой A означает A3, R^6 означает метил, R означает $CH(Me)OCO_2Et$, W означает CY и V означает водород

Табл. 7 содержит 451 соединение (7-1 - 7-451), в которых X, Y и Z имеют значения, названные в табл. 1

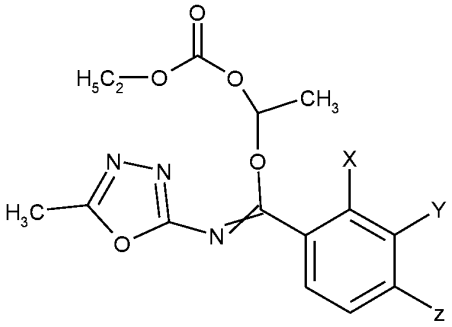


Таблица 8

Соединения согласно изобретению общей формулы (I), в которой A означает A3, R^6 означает метил, R означает $CH(Me)OCO_2Me$, W означает CY и V означает водород

Табл. 8 содержит 451 соединение (8-1 - 8-451), в которых X, Y и Z имеют значения, названные в табл. 1

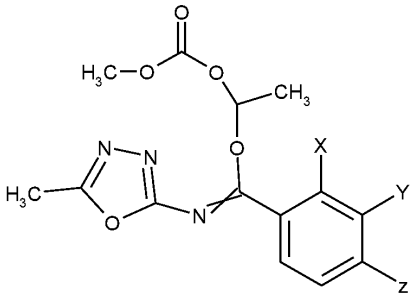
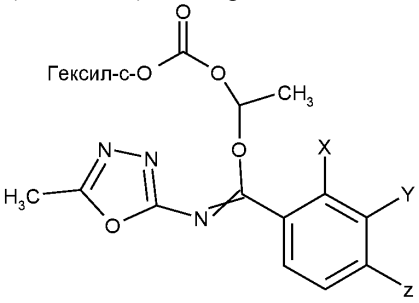


Таблица 9

Соединения согласно изобретению общей формулы (I), в которой A означает A3, R^6 означает метил, R означает $CH(Me)OCO_2$-c-гексил, W означает CY и V означает водород

Табл. 9 содержит 451 соединение (9-1 - 9-451), в которых X, Y и Z имеют значения, названные в табл. 1



Используемые сокращения означают

Et - этил, Me - метил, n-Pr - n-пропил, i-Pr - изопропил, c-Pr - циклопропил, Ph - фенил, Bn - бензил, Bu - бутил, c - цикло.

B. Примеры препаративных форм.

a) Средство для опыления получают при смешивании 10 мас.ч. соединения формулы (I) и 90 мас.ч. талька в виде инертного вещества и измельчении в ударной мельнице.

b) Легкодиспергируемый, смачиваемый в воде порошок получают при смешивании 25 мас.ч. соединения формулы (I), 64 мас.ч. каолинсодержащего кварца в качестве инертного вещества, 10 мас.ч. лигнинсульфонкислого калия и 1 мас.ч. олеоилметилтауринкислого натрия в качестве смачивающего и диспергирующего средства и измельчении в штифтовой дробилке.

c) Легкодиспергируемый в воде дисперсионный концентрат получают при смешивании 20 мас.ч. соединения формулы (I) с 6 мас.ч. алкилфенилполигликолевого эфира (Triton® X 207), 3 мас.ч. изотридеканолполигликолевого эфира (8 EO) и 71 мас.ч. парафинового минерального масла (диапазон кипения, например, примерно 255-277°C) и измельчении в терочной шаровой мельнице до дисперсности менее 5 мкм.

d) Эмульгируемый концентрат получают из 15 мас.ч. соединения формулы (I), 75 мас.ч. циклогексанона в качестве растворителя и 10 мас.ч. оксиэтилированного нонилфенола в качестве эмульгатора.

e) Диспергируемый в воде гранулят получают при смешивании 75 мас.ч. соединения формулы (I), 10 мас.ч. лигнинсульфонкислого кальция, 5 мас.ч. лаурилсульфата натрия, 3 мас.ч. поливинилового спирта и 7 мас.ч. каолина, измельчении в штифтовой дробилке и гранулировании порошка в псевдоожиженном слое с разбрызгиванием воды в качестве гранулирующей жидкости.

f) Диспергируемый в воде гранулят также получают при гомогенизировании 25 мас.ч. соединения формулы (I), 5 мас.ч. 2,2'-динафтилметан-6,6'-дисульфонкислого натрия, 2 мас.ч. олеоилметилтауринкислого натрия, 1 мас.ч. поливинилового спирта, 17 мас.ч. карбоната кальция и 50 мас.ч. воды в коллоидной мельнице и предварительном измельчении. Затем его перемалывают в бисерной мельнице, распыляют полученную таким образом суспензию в скруббере с помощью однокомпонентной насадки и высушивают.

C. Биологические примеры.

1. Влияние гербицидов на вредные растения в предвсходовый период.

Семена одно- или двудольных сорных или культурных растений раскладывают в горшки из древесного волокна в песчаную землю и укрывают землей. Затем соединения согласно изобретению, представленные в виде порошка для смачивания (WP) или эмульсионных концентратов (EC), применяют в виде водных суспензий или эмульсий с нормой расхода воды в пересчете 600-800 л/га с добавлением 0,2% смачивающего средства на поверхность обрабатываемой земли. После обработки горшки ставят в теплицу и содержат в хороших условиях для роста для экспериментальных растений. Зрительную оценку ущерба экспериментальным растениям по сравнению с необработанными контрольными растениями проводят после 3 недель начала эксперимента (гербицидное влияние в процентах (%): 100% результат = растения погибли, 0% результат = как контрольные растения. При этом соединения № 1-145, 1-385, 3-385, 4-145, 4-385, 6-385, 7-145, 7-385 и 9-385 при норме расхода 320 г/га показывают, например, соответственно по меньшей мере 80%-ное действие против Stellaria media и Veronica persica.

2. Влияние гербицидов на вредные растения в послевсходовый период.

Семена одно- или двудольных сорных или культурных растений раскладывают в горшки из древесного волокна в песчаную землю и укрывают землей и выращивают в теплице в хороших условиях для роста. 2-3 недели после посева экспериментальные растения обрабатывают на стадии первого листа. Затем соединения согласно изобретению, представленные в виде порошка для смачивания (WP) или эмульсионных концентратов (EC), распыляют в виде водных суспензий или эмульсий с нормой расхода воды в пересчете 600-800 л/га с добавлением 0,2% смачивающего средства на зеленые части растений. По истечении около 3 недель нахождения экспериментальных растений в теплице при оптимальных условиях роста действие препарата в сравнении с необработанными контрольными растениями заметно визуально (гербицидное действие в процентах (%): 100% результат = растения погибли, 0% результат = как контрольные растения. При этом соединения № 1-145, 1-385, 3-385, 4-145, 4-385, 6-385, 7-145, 7-385 и 9-385 при норме расхода 80 г/га показывают, например, соответственно по меньшей мере 80%-ное действие против Stellaria media и Amaranthus retroflexus.

3. Сравнительное испытание в предвсходовый период.

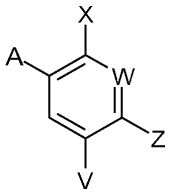
Для сравнения проверили гербицидное действие некоторых соединений согласно изобретению и структурно подобных известных соединений.

Соединение	Дозировка [г/га]	гербицидное действие против ALOMY
№ 7-385, согласно изобретению	80	90%
№ 2-360, из WO 2012/126932	*80*	*70%*
№ 3-385, согласно изобретению	80	100%
№ 2-360, из WO 2012/126932	*80*	*70%*
№ 9-385, согласно изобретению	80	90%
№ 2-360, из WO 2012/126932	*80*	*70%*
№ 1-145, согласно изобретению	80	100%
№ D-001, из WO 2013/087577	*80*	*0%*

Испытания показали на примере вредного растения Alopecurus myosuroides (ALOMY) превосходное гербицидное воздействие соединений согласно изобретению.

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Производное N-(1,3,4-оксадиазол-2-ил)арилкарбоксамида формулы (I)



(I),

в котором

W означает CY,

X и Z означают независимо друг от друга, соответственно, галоген, (C_1-C_6)алкил или трифторметил,

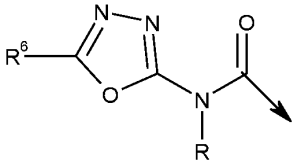
Y означает $S(O)_nR^2$,

V означает водород,

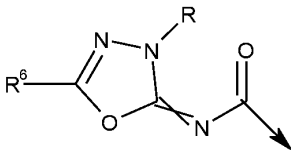
R^2 означает (C_1-C_6)алкил,

n означает 0, 1 или 2,

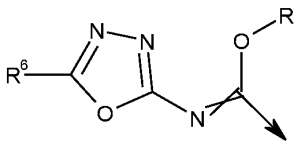
A означает остаток A1, A2 или A3



A1



A2



A3

R означает (C_1-C_6)алкил-OC(O)OR^{10},

R^6 означает (C_1-C_6)алкил,

R^{10} означает (C_1-C_6)алкил или (C_3-C_6)циклоалкил.

2. Производное N-(1,3,4-оксадиазол-2-ил)арилкарбоксамида формулы (I) по п.1, в котором

W означает CY,

X и Z означают независимо друг от друга, соответственно, хлор, метил или трифторметил,

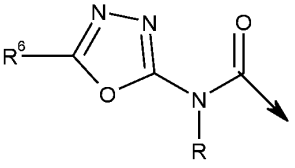
Y означает SO_2R^2,

V означает водород,

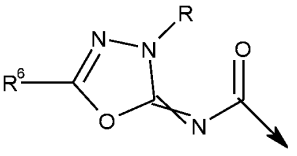
R^2 означает метил,

n означает 1 или 2,

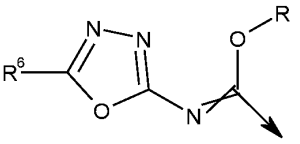
A означает остаток A1, A2 или A3



A1



A2



A3

,

R означает CH(Me)-OC(O)OR^{10},

R^6 означает метил,

R^{10} означает метил, этил или циклогексил.

3. Гербицидное средство, отличающееся гербицидно эффективным количеством по меньшей мере одного производного N-(1,3,4-оксадиазол-2-ил)арилкарбоксамида формулы (I) по п.1 или 2.

4. Гербицидное средство по п.3 в смеси с вспомогательным средством.

Евразийская патентная организация, ЕАПВ
Россия, 109012, Москва, Малый Черкасский пер., 2