

(19)



Евразийское
патентное
ведомство

(11) 044046

(13) B1

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОМУ ПАТЕНТУ

(45) Дата публикации и выдачи патента
2023.07.19

(51) Int. Cl. A01N 43/40 (2006.01)
A01N 43/54 (2006.01)

(21) Номер заявки
201992666

(22) Дата подачи заявки
2018.05.04

(54) 4-АМИНО-6-(ГЕТЕРОЦИКЛИЧЕСКИЕ)ПИКОЛИНАТЫ И 6-АМИНО-2-(ГЕТЕРОЦИКЛИЧЕСКИЕ)ПИРИМИДИН-4-КАРБОКСИЛАТЫ И ИХ ПРИМЕНЕНИЕ В КАЧЕСТВЕ ГЕРБИЦИДОВ

(31) 62/504,148

(56) WO-A1-2014151005
US-A1-20150005165
US-A-4044140
US-A-4877897

(32) 2017.05.10

(33) US

(43) 2020.03.19

(86) PCT/US2018/031004

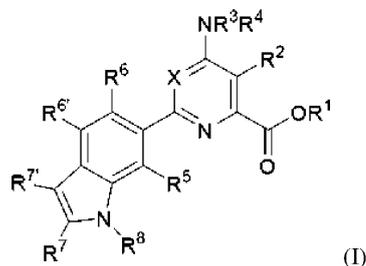
(87) WO 2018/208582 2018.11.15

(71)(73) Заявитель и патентовладелец:
КОРТЕВА АГРИСАЙЕНС ЭлЭлСи
(US)

(72) Изобретатель:
Кистер Джереми, Сачиви Норберт М.,
Эпп Джеффри Б., Рот Джошуа (US)

(74) Представитель:
Медведев В.Н. (RU)

(57) Представлены 4-амино-6-(гетероциклические)пиколиникаты и их производные; 6-амино-2-(гетероциклические)пиримидин-4-карбоксилаты и их производные; и способы применения таковых в качестве гербицидов.



044046 B1

044046 B1

Перекрестная ссылка на родственные заявки

Настоящая заявка испрашивает приоритет согласно предварительной заявке на патент США № 62/504148, поданной 10 мая 2017 г., полное раскрытие которой явным образом включено в данный документ посредством ссылки.

Область техники изобретения

Настоящее изобретение включает гербицидные соединения, композиции, содержащие таковые, и способы контроля нежелательной растительности с помощью таких соединений и композиций.

Уровень техники

Появление нежелательной растительности, например сорняков, является постоянной проблемой, с которой сталкиваются фермеры в отношении сельскохозяйственных культур, пастбищ и других посадок. Сорняки конкурируют с сельскохозяйственными культурами и отрицательно влияют на урожайность сельскохозяйственных культур. Применение химических гербицидов является важным инструментом при контроле нежелательной растительности. Нежелательная растительность, представляющая собой кохию и мак самосейку, в частности, является проблематичной на полях для сельскохозяйственных культур (например, пшеницы, ячменя, кукурузы, овса, канолы и сахарной свеклы), пастбищах, обочинах дорог, пустошах и откосах каналов.

Например, кохия (*Kochia scolaria*) представляет собой рано всходящий летний однолетний вид, обычно встречающийся в западной части Соединенных Штатов и Канады. Она представляет собой травянистое двудольное растение и является представителем семейства Chenopodiaceae. Кохия была привезена в Северную Америку из Европы в качестве декоративного растения ввиду своего красного цвета поздним летом и осенью. Кохия (*Kochia scolaria* (L.) Schrad.) является одним из самых трудно искореняемых однолетних широколиственных сорняков на полях для сельскохозяйственных культур, пастбищах, обочинах дорог, пустошах и откосах каналов на территории Северных Великих равнин (NGP). Если ее не контролировать на ранней стадии, кохия вызывает сильное уменьшение урожайности (до 60%) сельскохозяйственных культур, включая пшеницу, ячмень, кукурузу и сахарную свеклу, и может быть основным проблемным сорняком при использовании химического пара.

Семена характеризуются практически отсутствием состояния покоя и большинство (>90%) семян, лежащих на поверхности почвы или вблизи нее, в условиях нулевой обработки почвы прорастают в начале весны с двумя-тремя периодами появления всходов в течение лета. Кохия демонстрирует быстрый рост и цветет поздним летом. Сорняк способен к самоопылению и перекрестному опылению и размножается семенами. Одно растение, представляющее собой кохию, способно производить до 50000 семян, которые могут распространяться с помощью ветра, воды, загрязняющих веществ в сене, сельскохозяйственного оборудования или с помощью транспортных средств, используемых в сельском хозяйстве. После созревания растение отламывается у основания стебля и "катится" по местности под воздействием преобладающего ветра, что представляет собой уникальный и быстрый механизм распространения семени. Кроме того, кохия хорошо приспособлена к условиям воздействия засухи, солей, тепла и холода.

Гербициды, которые применяли в попытке контроля кохии, включают гербициды, ингибирующие ацетолактатсинтазу (ALS), флуороксипир, дикамбу и глифосат. Флуороксипир и дикамба представляют собой селективные гербициды, которые могут контролировать широколиственные сорняки и, как правило, не повреждать травы. (2-Дихлорфенокси)уксусная кислота (2,4-D), которую часто применяют для контроля кохии, не является эффективной.

Глифосат (такой как Roundup®, зарегистрированный знак Monsanto Technology LLC, общества с ограниченной ответственностью в штате Делавэр, или другие подобные дженерики) является неселективным гербицидом широкого спектра действия, применяемым для контроля сорняка. Однако различные факторы, касающиеся применения глифосата в течение более десяти лет для контактного контроля сорняка перед посевом в химическом пару и для видов применения на стадии плодоношения в отношении сельскохозяйственных культур Roundup Ready® (также зарегистрированный знак Monsanto Technology LLC), привели к развитию сорняков, устойчивых к глифосату (в настоящее время 24 вида в Соединенных Штатах), включая кохию. Например, биотипы кохии, устойчивые к триазинам, ауксином, ALS-гербицидам и глифосату, были хорошо задокументированы.

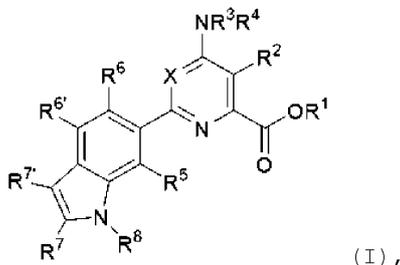
Дикий мак или мак самосейка (*Paraver rhoeas*) является одним из наиболее проблемных сорняков, представляющих собой двудольное растение, в озимых зерновых культурах в областях южной Европы, которые имеют средиземноморский климат. Дикий мак является конкурентным сорняком, который широко известен своей способностью уменьшать урожайность зерновых культур. Способность данного вида проникать, расти и сохраняться на полях зерновых культур может быть объяснена образованием стойкого семенного фонда, продолжительного периода прорастания и высокой семенной продуктивности. Контроль мака становится серьезной и возрастающей проблемой для производителей зерновых культур и контролирующих органов в Европе из-за распространения устойчивых к гербицидам биотипов мака. О популяциях *P. rhoeas*, устойчивых к гербицидам на основе сульфонилмочевины или/и ауксиновым гербицидам, сообщалось в Бельгии, Дании, Франции, Германии, Греции, Италии, Испании, Швеции и Великобритании. Некоторые популяции *P. rhoeas*, устойчивые к гербицидам, ингибирующим фотосистему II

(PSII), были обнаружены в Польше. Распространение устойчивых к гербицидам биотипов *P. thoeas* является угрозой для прибыльности систем производства зерновых культур.

Таким образом, остается потребность в новых химических гербицидах, которые обеспечивают более широкий спектр контроля сорняка, селективность, минимальное повреждение сельскохозяйственных культур, стабильность при хранении, легкость эксплуатации, более высокую активность по отношению к сорнякам, и/или средствах для устранения устойчивости к гербицидам, которая развилась в отношении традиционных гербицидов.

Краткое описание изобретения

В данном документе предусмотрены соединения формулы (I)



где X представляет собой CY;

Y представляет собой галоген;

R¹ представляет собой C₃-C₁₂алкинил или C₁-C₃алкил, замещенный CN;

R² представляет собой галоген или группу формулы -CR¹⁷=CR¹⁸-SiR¹⁹R²⁰R²¹, где R¹⁷ представляет собой водород, F или Cl; R¹⁸ представляет собой водород, F, Cl, C₁-C₄алкил или C₁-C₄галогеналкил; и R¹⁹, R²⁰ и R²¹ независимо представляют собой C₁-C₁₀алкил, C₃-C₆циклоалкил, фенил, C₁-C₁₀алкокси или OH;

R³ и R⁴ независимо представляют собой водород, C₁-C₆триалкилсиллил, C₁-C₆диалкилфосфонил;

R⁵ представляет собой галоген;

R⁶ и R^{6'} представляют собой водород;

R⁷ и R^{7'} представляют собой водород;

R⁸ представляет собой водород, C₁-C₆триалкилсиллил,

или его приемлемая с точки зрения сельского хозяйства соль.

Также предусмотрены способы контроля нежелательной растительности, включающие обеспечение соединения формулы (I); и

(a) нанесение на нежелательную растительность или область, граничащую с нежелательной растительностью; или

(b) предвсходное внесение в почву или воду гербицидно эффективного количества по меньшей мере одного соединения формулы (I) или приемлемого с точки зрения сельского хозяйства его производного.

Подробное описание

Определения.

В контексте данного документа подразумевается, что гербицид и гербицидный активный ингредиент могут включать соединение, которое контролирует нежелательную растительность при применении в подходящем количестве.

В контексте данного документа контроль или осуществление контроля нежелательной растительности подразумевает уничтожение, или предотвращение появления растительности, или оказание какого-либо другого неблагоприятного модифицирующего эффекта в отношении растительности, например отклонения от естественного роста или развития, регуляции, потерю влаги, задержку развития и т.п.

В контексте данного документа подразумевается, что гербицидно эффективное или достаточное для контроля растительности количество может включать количество гербицидного активного ингредиента, применение которого обеспечивает контроль соответствующей нежелательной растительности.

В контексте данного документа подразумевается, что применение гербицида или гербицидной композиции может включать его доставку непосредственно к целевой растительности, или месту ее произрастания, или территории, где необходим контроль нежелательной растительности. Иллюстративные способы применения включают без ограничения предвсходное приведение в контакт почвы или воды, после всходное приведение в контакт нежелательной растительности или области, граничащей с нежелательной растительностью.

В контексте данного документа растения и растительность могут включать без ограничения полежащие семена, проросшие семена, всходящие проростки, растения, развивающиеся из вегетативных черенков, незрелую растительность и сформированную растительность.

В контексте данного документа подразумевается, что незрелая растительность может включать небольшие вегетирующие растения до наступления репродуктивной стадии, и зрелая растительность относится к вегетирующим растениям во время и после завершения репродуктивной стадии.

В контексте данного документа, если не указано иное, ацил относится к формулу, C_1 - C_3 алкилкарбонилу и C_1 - C_3 галогеналкилкарбонилу. C_1 - C_6 ацил относится к формулу, C_1 - C_3 алкилкарбонилу и C_1 - C_3 галогеналкилкарбонилу (всего группа содержит от 1 до 6 атомов углерода).

В контексте данного документа алкил относится к насыщенным углеводородным фрагментам с прямой цепью или насыщенным углеводородным фрагментам с разветвленной цепью. Если не указано иное, подразумеваются C_1 - C_{10} алкильные группы. Примеры включают метил, этил, пропил, 1-метилэтил, бутил, 1-метилпропил, 2-метилпропил, 1,1-диметилэтил, пентил, 1-метилбутил, 2-метилбутил, 3-метилбутил, 2,2-диметилпропил, 1-этилпропил, гексил, 1,1-диметилпропил, 1,2-диметилпропил, 1-метилпентил, 2-метилпентил, 3-метилпентил, 4-метилпентил, 1,1-диметилбутил, 1,2-диметилбутил, 1,3-диметилбутил, 2,2-диметилбутил, 2,3-диметилбутил, 3,3-диметилбутил, 1-этилбутил, 2-этилбутил, 1,1,2-триметилпропил, 1,2,2-триметилпропил, 1-этил-1-метилпропил и 1-этил-2-метилпропил.

В контексте данного документа галогеналкил относится к алкильным группам с прямой цепью или разветвленной цепью, причем в этих группах атомы водорода могут быть частично или полностью замещены атомами галогена. Если не указано иное, подразумеваются группы C_1 - C_8 . Примеры включают хлорметил, бромметил, дихлорметил, трихлорметил, фторметил, дифторметил, трифторметил, хлорфторметил, дихлорфторметил, хлордифторметил, 1-хлорэтил, 1-бромэтил, 1-фторэтил, 2-фторэтил, 2,2-дифторэтил, 2,2,2-трифторэтил, 2-хлор-2-фторэтил, 2-хлор-2-дифторэтил, 2,2-дихлор-2-фторэтил, 2,2,2-трихлорэтил, пентафторэтил и 1,1,1-трифторпроп-2-ил.

В контексте данного документа алкенил относится к ненасыщенным углеводородным фрагментам с прямой цепью или углеводородным фрагментам с разветвленной цепью, содержащим двойную связь. Если не указано иное, подразумевается C_2 - C_8 алкенил. Алкенильные группы могут содержать более одной ненасыщенной связи. Примеры включают этенил, 1-пропенил, 2-пропенил, 1-метилэтенил, 1-бутенил, 2-бутенил, 3-бутенил, 1-метил-1-пропенил, 2-метил-1-пропенил, 1-метил-2-пропенил, 2-метил-2-пропенил, 1-пентенил, 2-пентенил, 3-пентенил, 4-пентенил, 1-метил-1-бутенил, 2-метил-1-бутенил, 3-метил-1-бутенил, 1-метил-2-бутенил, 2-метил-2-бутенил, 3-метил-2-бутенил, 1-метил-3-бутенил, 2-метил-3-бутенил, 3-метил-3-бутенил, 1,1-диметил-2-пропенил, 1,2-диметил-1-пропенил, 1,2-диметил-2-пропенил, 1-этил-1-пропенил, 1-этил-2-пропенил, 1-гексенил, 2-гексенил, 3-гексенил, 4-гексенил, 5-гексенил, 1-метил-1-пентенил, 2-метил-1-пентенил, 3-метил-1-пентенил, 4-метил-1-пентенил, 1-метил-2-пентенил, 2-метил-2-пентенил, 3-метил-2-пентенил, 4-метил-2-пентенил, 1-метил-3-пентенил, 2-метил-3-пентенил, 3-метил-3-пентенил, 4-метил-3-пентенил, 1-метил-4-пентенил, 2-метил-4-пентенил, 3-метил-4-пентенил, 4-метил-4-пентенил, 1,1-диметил-2-бутенил, 1,1-диметил-3-бутенил, 1,2-диметил-1-бутенил, 1,2-диметил-2-бутенил, 1,2-диметил-3-бутенил, 1,3-диметил-1-бутенил, 1,3-диметил-2-бутенил, 1,3-диметил-3-бутенил, 2,2-диметил-3-бутенил, 2,3-диметил-1-бутенил, 2,3-диметил-2-бутенил, 2,3-диметил-3-бутенил, 3,3-диметил-1-бутенил, 3,3-диметил-2-бутенил, 1-этил-1-бутенил, 1-этил-2-бутенил, 1-этил-3-бутенил, 2-этил-1-бутенил, 2-этил-2-бутенил, 2-этил-3-бутенил, 1,1,2-триметил-2-пропенил, 1-этил-1-метил-2-пропенил, 1-этил-2-метил-1-пропенил и 1-этил-2-метил-2-пропенил. Винил относится к группе, имеющей структуру $-CH=CH_2$; 1-пропенил относится к группе со структурой $-CH=CH-CH_3$; и 2-пропенил относится к группе со структурой $-CH_2-CH=CH_2$.

В контексте данного документа алкинил представляет собой углеводородные фрагменты с прямой цепью или углеводородные фрагменты с разветвленной цепью, содержащие тройную связь. Если не указано иное, подразумеваются C_2 - C_8 алкинильные группы. Алкинильные группы могут содержать более одной ненасыщенной связи. Примеры включают C_2 - C_6 алкинил, такой как этинил, 1-пропинил, 2-пропинил (или пропаргил), 1-бутинил, 2-бутинил, 3-бутинил, 1-метил-2-пропинил, 1-пентинил, 2-пентинил, 3-пентинил, 4-пентинил, 3-метил-1-бутинил, 1-метил-2-бутинил, 1-метил-3-бутинил, 2-метил-3-бутинил, 1,1-диметил-2-пропинил, 1-этил-2-пропинил, 1-гексинил, 2-гексинил, 3-гексинил, 4-гексинил, 5-гексинил, 3-метил-1-пентинил, 4-метил-1-пентинил, 1-метил-2-пентинил, 4-метил-2-пентинил, 1-метил-3-пентинил, 2-метил-3-пентинил, 1-метил-4-пентинил, 2-метил-4-пентинил, 3-метил-4-пентинил, 1,1-диметил-2-бутинил, 1,1-диметил-3-бутинил, 1,2-диметил-3-бутинил, 2,2-диметил-3-бутинил, 3,3-диметил-1-бутинил, 1-этил-2-бутинил, 1-этил-3-бутинил, 2-этил-3-бутинил и 1-этил-1-метил-2-пропинил.

В контексте данного документа алкокси относится к группе формулы $R-O-$, где R представляет собой алкил, как определено выше. Если не указано иное, подразумеваются алкоксигруппы, где R представляет собой C_1 - C_8 алкильную группу. Примеры включают метокси, этокси, пропокси, 1-метилэтокси, бутокси, 1-метилпропокси, 2-метилпропокси, 1,1-диметилэтокси, пентокси, 1-метилбутилокси, 2-метилбутокси, 3-метилбутокси, 2,2-диметилпропокси, 1-этилпропокси, гексокси, 1,1-диметилпропокси, 1,2-диметилпропокси, 1-метилпентокси, 2-метилпентокси, 3-метилпентокси, 4-метилпентокси, 1,1-диметилбутокси, 1,2-диметилбутокси, 1,3-диметилбутокси, 2,2-диметилбутокси, 2,3-диметилбутокси, 3,3-диметилбутокси, 1-этилбутокси, 2-этилбутокси, 1,1,2-триметилпропокси, 1,2,2-триметилпропокси, 1-этил-1-метилпропокси и 1-этил-2-метилпропокси.

В контексте данного документа галогеналкокси относится к группе формулы $R-O-$, где R представляет собой галогеналкил, как определено выше. Если не указано иное, подразумеваются галогеналкоксигруппы, где R представляет собой C_1 - C_8 алкильную группу. Примеры включают хлорметокси, бромметокси, дихлорметокси, трихлорметокси, фторметокси, дифторметокси, трифторметокси, хлорфторметок-

си, дихлорфторметокси, хлордифторметокси, 1-хлорэтоксид, 1-бромэтоксид, 1-фторэтоксид, 2-фторэтоксид, 2,2-дифторэтоксид, 2,2,2-трифторэтоксид, 2-хлор-2-фторэтоксид, 2-хлор-2,2-дифторэтоксид, 2,2-дихлор-2-фторэтоксид, 2,2,2-трихлорэтоксид, пентафторэтоксид и 1,1,1-трифторпроп-2-оксид.

В контексте данного документа алкилтио относится к группе формулы R-S-, где R представляет собой алкил, как определено выше. Если не указано иное, подразумеваются алкилтиогруппы, где R представляет собой C₁-C₈алкильную группу. Примеры включают метилтио, этилтио, пропилтио, 1-метилэтилтио, бутилтио, 1-метилпропилтио, 2-метилпропилтио, 1,1-диметилэтилтио, пентилтио, 1-метилбутилтио, 2-метилбутилтио, 3-метилбутилтио, 2,2-диметилпропилтио, 1-этилпропилтио, гексилтио, 1,1-диметилпропилтио, 1,2-диметилпропилтио, 1-метилпентилтио, 2-метилпентилтио, 3-метилпентилтио, 4-метилпентилтио, 1,1-диметилбутилтио, 1,2-диметилбутилтио, 1,3-диметилбутилтио, 2,2-диметилбутилтио, 2,3-диметилбутилтио, 3,3-диметилбутилтио, 1-этилбутилтио, 2-этилбутилтио, 1,1,2-триметилпропилтио, 1,2,2-триметилпропилтио, 1-этил-1-метилпропилтио и 1-этил-2-метилпропилтио.

В контексте данного документа галогеналкилтио относится к алкилтиогруппе, как определено выше, где атомы углерода частично или полностью замещены атомами галогена. Если не указано иное, подразумеваются галогеналкилтиогруппы, где R представляет собой C₁-C₈алкильную группу. Примеры включают хлорметилтио, бромметилтио, дихлорметилтио, трихлорметилтио, фторметилтио, дифторметилтио, трифторметилтио, хлорфторметилтио, дихлорфторметилтио, хлордифторметилтио, 1-хлорэтилтио, 1-бромэтилтио, 1-фторэтилтио, 2-фторэтилтио, 2,2-дифторэтилтио, 2,2,2-трифторэтилтио, 2-хлор-2-фторэтилтио, 2-хлор-2,2-дифторэтилтио, 2,2-дихлор-2-фторэтилтио, 2,2,2-трихлорэтилтио, пентафторэтилтио и 1,1,1-трифторпроп-2-илтио.

В контексте данного документа арил, а также производные термины, такие как арилокси, относятся к фенильной, инданильной или нафтильной группе, причем фенил является предпочтительным. Термин гетероарил, а также производные термины, такие как гетероарилокси, относятся к 5- или 6-членному ароматическому кольцу, содержащему один или более гетероатомов, а именно N, O или S; причем эти ароматические и гетероароматические кольца могут быть конденсированы с другими ароматическими и/или гетероароматическими системами. Арильные или гетероарильные заместители могут быть незамещенными или замещенными одним или более заместителями, выбранными из галогена, гидрокси, нитро, циано, формила, C₁-C₆алкила, C₂-C₆алкенила, C₂-C₆алкинила, C₁-C₆алкокси, C₁-C₆галогеналкила, C₁-C₆галогеналкокси, C₁-C₆ацила, C₁-C₆алкилтио, C₁-C₆алкилсульфинила, C₁-C₆алкилсульфонила, C₁-C₆алкоксикарбонила, C₁-C₆карбамоила, гидроксикарбонила, C₁-C₆алкилкарбонила, аминокарбонила, C₁-C₆алкиламиникарбонила, C₁-C₆диалкиламиникарбонила, при условии, что заместители являются стериически совместимыми и удовлетворяются правила химического связывания и энергии деформации. Предпочтительные заместители включают галоген, C₁-C₂алкил и C₁-C₂галогеналкил.

В контексте данного документа алкилкарбонил относится к алкильной группе, связанной с карбонильной группой. C₁-C₃алкилкарбонил и C₁-C₃галогеналкилкарбонил относятся к группам, где C₁-C₃алкильная группа связана с карбонильной группой (всего группа содержит от 2 до 4 атомов углерода).

В контексте данного документа алкоксикарбонил относится к группе формулы , где R представляет собой алкил.

В контексте данного документа арилалкил относится к алкильной группе, замещенной арильной группой. C₇-C₁₀арилалкил относится к группе, где общее число атомов углерода в группе составляет от 7 до 10.

В контексте данного документа алкиламино относится к аминогруппе, замещенной одним или двумя алкильными группами, которые могут быть одинаковыми или различными.

В контексте данного документа галогеналкиламино относится к алкиламиногруппе, где атомы углерода в алкиле частично или полностью замещены атомами галогена.

В контексте данного документа C₁-C₆алкиламиникарбонил относится к группе формулы RNHC(O)-, где R представляет собой C₁-C₆алкил, и C₁-C₆диалкиламиникарбонил относится к группе формулы R₂NC(O)-, где каждый R независимо представляет собой C₁-C₆алкил.

В контексте данного документа алкилкарбамил относится к карбамильной группе, замещенной по атому азота алкильной группой.

В контексте данного документа алкилсульфонил относится к группе формулы , где R представляет собой алкил.

В контексте данного документа карбамил (также называемый карбамоилом и аминокарбонилом)

относится к группе формулы .



В контексте данного документа диалкилфосфонил относится к группе формулы $\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{—P—OR} \\ | \\ \text{OR} \end{array}$, где R независимо представляет собой алкил в каждом случае.

В контексте данного документа C₁-C₆триалкилсилил относится к группе формулы -SiR₃, где каждый R независимо представляет собой C₁-C₆алкильную группу (всего группа содержит от 3 до 18 атомов углерода).

В контексте данного документа Me относится к метильной группе; OMe относится к метоксигруппе; i-Pr относится к изопропильной группе.

В контексте данного документа термин галоген, включая производные термины, такие как галогено, относится к фтору, хлору, бром и йоду.

В контексте данного документа приемлемые с точки зрения сельского хозяйства соли и сложные эфиры относятся к солям и сложным эфирам, которые проявляют гербицидную активность, или которые преобразуются или могут быть преобразованы в растениях, воде или почве в упоминаемый гербицид. Иллюстративные приемлемые с точки зрения сельского хозяйства сложные эфиры представляют собой те, которые подвергаются ли могут быть подвергнуты гидролизу, окислению, метаболизированию или преобразованы каким-либо иным способом, например, в растениях, воде или почве в соответствующую карбоновую кислоту, которая в зависимости от pH может быть в диссоциированной или недиссоциированной форме.

Иллюстративные сложные эфиры включают те, которые получены из C₁-C₁₂алкил-, C₃-C₁₂алкенил-, C₃-C₁₂алкинил- или C₇-C₁₀арилзамещенных алкиловых спиртов, таких как метиловый спирт, изопропильный спирт, 1-бутанол, 2-этилгексанол, бутоксиэтанол, метоксипропанол, аллиловый спирт, пропаргиловый спирт, циклогексанол или незамещенных или замещенных бензиловых спиртов. Бензиловые спирты могут быть замещены 1-3 заместителями, независимо выбранными из галогена, C₁-C₄алкила или C₁-C₄алкокси. Сложные эфиры можно получить

путем сочетания кислот со спиртом с применением любого количества подходящих активирующих средств, таких как те, которые применяются для образования пептидных связей, таких как дициклогексилкарбодиимид (DCC) или карбонилдиимидазол (CDI);

путем осуществления реакции кислот с алкилирующими средствами, такими как замещенные или незамещенные алкилгалогениды, замещенные или незамещенные алкинилгалогениды, замещенные или незамещенные цианоалкилгалогениды (например, цианометилацетат, такой как цианометил-2-бромацетат) или замещенные или незамещенные алкилсульфонаты, в присутствии основания, такого как триэтиламин или карбонат лития;

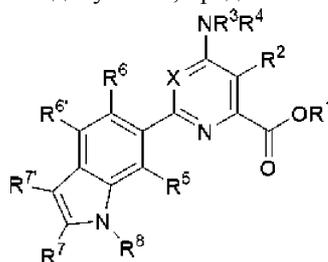
путем осуществления реакции соответствующего хлорангидрида кислоты с подходящим спиртом;

путем осуществления реакции соответствующей кислоты с подходящим спиртом в присутствии кислотного катализатора или с помощью реакции перэтерификации.

Соединения формулы (I) включают N-оксиды. N-оксиды пиридина можно получать путем окисления соответствующих пиридинов. Подходящие способы окисления описаны, например, в Houben-Weyl, Methoden der organischen Chemie [Methods in organic chemistry], расширенные и последующие тома к 4-му изданию, том E 7b, с. 565 f.

Соединения.

Соединения, описанные в данном документе, представляют собой соединения формулы (I)



где X представляет собой CY;

Y представляет собой галоген;

R¹ представляет собой C₃-C₁₂алкинил или C₁-C₃алкил, замещенный CN;

R² представляет собой галоген или группу формулы -CR¹⁷=CR¹⁸-SiR¹⁹R²⁰R²¹, где R¹⁷ представляет собой водород, F или Cl; R¹⁸ представляет собой водород, F, Cl, C₁-C₄алкил или C₁-C₄галогеналкил; и R¹⁹, R²⁰ и R²¹ независимо представляют собой C₁-C₁₀алкил, C₃-C₆циклоалкил, фенил, C₁-C₁₀алкокси или OH;

R³ и R⁴ независимо представляют собой водород, C₁-C₆триалкилсилил, C₁-C₆диалкилфосфонил;

R⁵ представляет собой галоген;

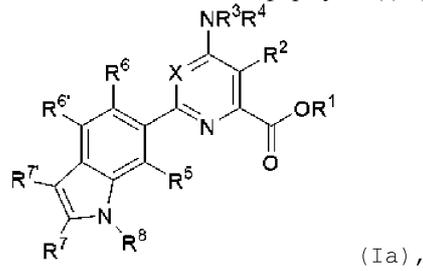
R⁶ и R^{6'} представляют собой водород;

R⁷ и R^{7'} представляют собой водород;

R⁸ представляет собой водород, C₁-C₆триалкилсилил,

или его приемлемая с точки зрения сельского хозяйства соль.

В некоторых вариантах осуществления соединение формулы (I) представляет собой



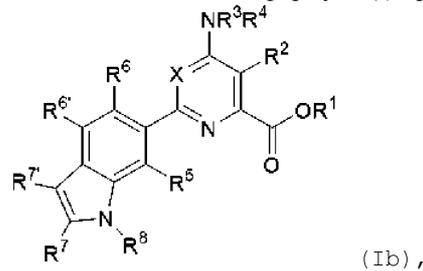
где X представляет собой CF, CCl или CBr;

R² представляет собой хлор;

R³ и R⁴ представляют собой водород,

или приемлемую с точки зрения сельского хозяйства соль.

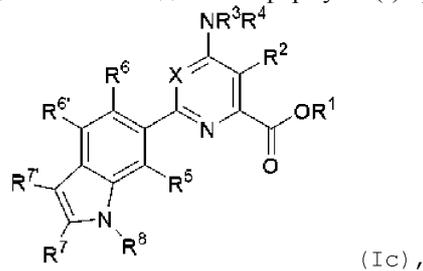
В некоторых вариантах осуществления соединение формулы (I) представляет собой



где R² представляет собой галоген;

R⁵ представляет собой F.

В некоторых вариантах осуществления соединение формулы (I) представляет собой



где R² представляет собой хлор;

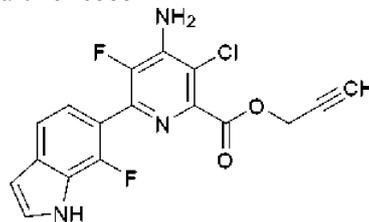
R³ и R⁴ представляют собой водород; и

X представляет собой CF.

В некоторых вариантах осуществления

R¹ представляет собой пропаргил; и

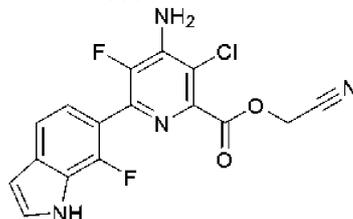
соединение формулы (I) представляет собой



В некоторых вариантах осуществления

R¹ представляет собой цианометил; и

соединение формулы (I) представляет собой



III. Способы получения.

Процедуры синтеза 4-амино-6-(гетероциклических)пиколиновых кислот, где X представляет собой СН или CF и R¹ представляет собой Н, и 6-амино-2-(гетероциклических)пиримидинкарбоновых кислот, где X представляет собой N и R¹ представляет собой Н, описаны в патенте США № 9637505, выданном Eckelbarger et al., который включен посредством ссылки в данный документ во всей своей полноте.

Процедуры синтеза соединений формулы (I), где R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R^{6'}, R⁷, R^{7'} и R⁸ являются таковыми, как определено выше, показаны на схеме 1.

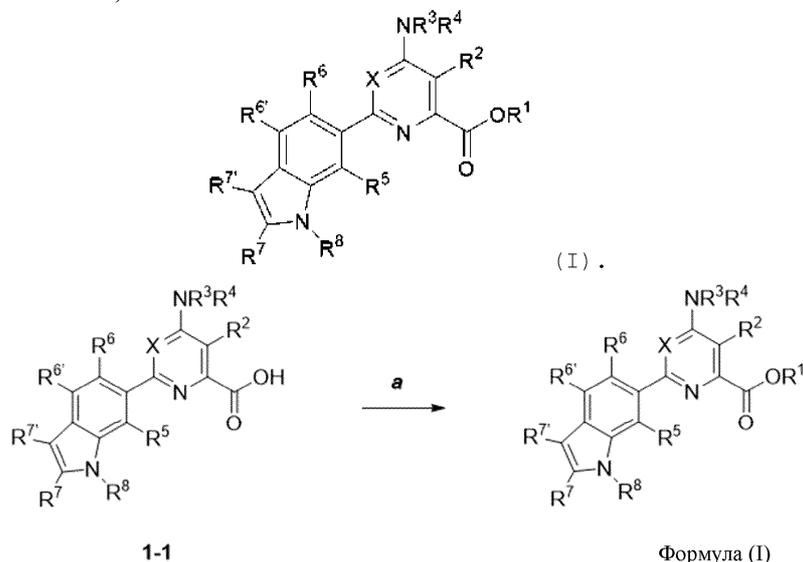


Схема 1

Кислоты 1-1 можно преобразовать в соединения формулы (I) посредством эстерификации (схема 1, стадия а). Сложные эфиры можно получать путем сочетания кислот со спиртом с применением любого количества подходящих активирующих средств, таких как те, которые применяются для образования пептидных связей, включая дициклогексилкарбодиимид (DCC) или карбонилдиимдазол (CDI); путем осуществления реакции кислот с алкилирующими средствами, такими как замещенные или незамещенные алкилгалогениды, замещенные или незамещенные алкилгалогениды, замещенные или незамещенные цианоалкилгалогениды или замещенные или незамещенные алкилсульфонаты, в присутствии основания, такого как триэтиламин или карбонат лития или калия; путем осуществления реакции соответствующего хлорангидрида кислоты с подходящим спиртом; или путем осуществления реакции соответствующей кислоты с подходящим спиртом в присутствии кислотного катализатора. Реакции можно проводить в полярных апротонных растворителях, таких как диметилсульфоксид, N,N-диметилформамид, дихлорметан или 1,2-дихлорэтан.

IV. Смеси.

В некоторых вариантах осуществления соединения, композиции и способы, предусмотренные в данном документе, применяют в сочетании с одним или более другими гербицидами для контроля более широкого разнообразия нежелательной растительности. В случае применения совместно с другими гербицидами соединения, описанные в данном документе, можно составлять с другим гербицидом или гербицидами, смешивать в баке с другим гербицидом или гербицидами или применять последовательно с другим гербицидом или гербицидами. Некоторые из гербицидов, которые можно применять совместно с соединениями по настоящему изобретению, включают без ограничения 4-CPA; 4-CPB; 4-CPD; 2,4-D; холиновую соль 2,4-D, сложные эфиры и амины 2,4-D; 2,4-DB; 3,4-DA; 3,4-DB; 2,4-DEB; 2,4-DEP; 3,4-DP; 2,3,6-TBA; 2,4,5-T; 2,4,5-TB; ацетохлор, ацифлуорфен, аклонифен, акролеин, алахлор, аллидохлор, аллоксидим, аллиловый спирт, алорак, аметридон, аметрин, амибузин, амикарбазон, амидосульфурон, аминоклопирахлор, аминокпиралид, амипрофос-метил, амитрол, сульфамат аммония, анилофос, анизурон, асулам, атратон, атразин, азафенидин, азимсульфурон, азипротрин, барбан, ВСПС, бифлутамид, беназолин, бенкарбазон, бенфлуралин, бенфуресат, бенсульфурон-метил, бенсулид, бентиокарб, бентазон-натрий, бензадокс, бензфендизон, бензипрам, бензобициклон, бензофенап, бензофлуор, бензоилпроп, бензтиазурон, бициклопирон, бифенокс, биланафос, биспирибак-натрий, боракс, бромацил, бромобонил, бромобутид, бромфеноксим, бромоксинил, бромпиразон, бутахлор, бутафенацил, бутаифос, бутенахлор, бутидазол, бутиурон, бутралин, бутроксидим, бутурон, бутилат, какодиловую кислоту, кафенстрол, хлорат кальция, цианамид кальция, камбендихлор, карбасулам, карбетамид, карбоксазол, карфентразон-этил, CDEA, СЕРС, хлометоксифен, хлорамбен, хлоранокрил, хлоразифоп, хлоразин, хлорбромурон, хлорбуфам, хлоретурон, хлорфенак, хлорфенпроп, хлорфлуразол, хлорфлуренол, хлоридазон, хлоримурон, хлорнитрофен, хлоропон, хлоротолурон, хлороксурон, хлороксинил, хлорпрокарб, хлорпрофам, хлоросульфурон, хлортал, хлортиамид, цинидон-этил, цинметилин, цианосульфурон, цисанилид, клацифос,

клетодим, клиодинат, клодинафоп-пропаргил, клофоп, кломазон, кломепроп, клопроп, клопроксидим, клопиралид, клорансулам-метил, СМА, сульфат меди, СРМФ, СРРС, кредазин, крезол, кумилурон, цианатрин, цианазин, циклоат, циклопиранил, циклопириморат, циклосульфамурон, циклоксидим, циклу-рон, цигалофоп-бутил, циперкват, ципразин, ципразол, ципромид, даимурон, далапон, дазомет, делахлор, десмедифам, десметрин, диаллат, дикамбу, дихлобензил, дихлоральмочевину, дихлормат, дихлорпроп, дихлорпроп-Р, диклофоп, диклосулам, диэтамкват, диэтатил, дифенопентен, дифеноксурон, дифензокват, дифлуфеникан, дифлуфензопир, димефурун, димепиперат, диметахлор, диметаметрин, диметенамид, диметенамид-Р, димексано, димидазон, динитрамин, динофенат, динопроп, диносам, диносеб, динотерб, дифенамид, дипропетрин, дикват, дисул, дитиопир, диурон, DMPA, DNOC, DSMA, EBER, эглиназин, эндотал, эпроназ, ЕРТС, эрбон, эспрокарб, эталфлуралин, этбензамид, этаметсульфурун, этидимурон, этиолат, этобензамид, этобензамид, этофумезат, этоксифен, этокисульфурон, этинофен, этнипромид, этобензанид, EXD, фенасулам, фенопроп, феноксапроп, феноксапроп-Р-этил, феноксапроп-Р-этил+изоксадифен-этил, феноксасульфон, фенквинотрион, фентеракол, фентиапроп, фентразамид, фену-рон, сульфат железа, флампроп, флампроп-М, флазасульфурон, флорасулам, флорпирауксифен-бензил, флуазифоп, флуазифоп-Р-бутил, флуазолат, флукарбазон, флусетосульфурон, флухлоралин, флуфенацет, флуфеникан, флуфенпир-этил, флуметсулам, флумезин, флумиклорак-пентил, флумиоксазин, флумипро-пин, флуометурон, флуородифен, флуорогликофен, флуоромидин, флуоронитрофен, флуотиурон, флу-поксам, флупропацил, флупропанат, флупирсульфурун, флуридон, флуорохлоридон, флуороксибир, флу-рамон, флутиацет, фомесафен, форамсульфурун, фосамин, фурилоксифен, глюфосинат, глюфосинат-аммоний, глифосат, галосафен, галосульфурон-метил, галоксидин, галоксифоп-метил, галоксифоп-Р-метил, галауксифен-метил, гексахлорацетон, гексафлуурат, гексазион, имазаметабенз, имазамокс, имаза-пик, имазапир, имазаквин, имазетапир, имазосульфурон, инданофан, индазифлам, иодобонил, йодметан, йодосульфурон, иофенсульфурун, иоксинил, ипазин, ипфенкарбазон, ипримидам, изокарбамид, изоцил, изометиозин, изонорурон, изополинат, изопропалин, изопротурон, изоурон, изоксабен, изоксахлортол, изоксафлютол, изоксапирифоп, карбутилат, кетоспирадокс, лактофен, ланкотрион, ленацил, линурон, МАА, МАМА, сложные эфиры и амины МСРА, МСРА-тиоэтил, МСРВ, мекопроп, мекопроп-Р, медино-терб, мефенацет, мефлуидид, мезопразин, мезосульфурон, мезотрион, метам, метаифоп, метамитрон, метазахлор, метазосульфурон, метфлуразон, метабензтиазурон, металпропалин, метазол, метиобенкарб, метиозолин, метиурон, метометон, метопротрин, метилбромид, метилизотиоцианат, метилдимрон, мето-бензурун, метобромурон, метолахлор, метосулам, метоксурон, метрибузин, метсульфурун, молинат, мо-налид, монисоурон, монохлоруксусную кислоту, монолинурун, монурон, морфамкват, MSMA, напроа-нилид, напропамид, напропамид-М, напталам, небурон, никосульфурон, нипираклофен, нитралин, нит-рофен, нитрофлуорфен, норфлуразон, норурон, ОСН, орбенкарб, орто-дихлорбензол, ортосульфамурон, оризалин, оксадиаргил, оксадиазон, оксапиразон, оксасульфурон, оксазикаломефон, оксифлуорфен, пара-флуфен-этил, парафлурун, паракват, пебулат, пеларгоновую кислоту, пендиметалин, пеноксулам, пента-хлорфенол, пентанохлор, пентоксазон, перфлуидон, петоксамид, фенизофам, фенмедифам, фенмедифам-этил, фенобензурун, ацетат фенилртути, пихлорам, николинафен, пиноксаден, пиперофос, арсенит калия, азид калия, цианат калия, претилахлор, примисульфурон-метил, проциазин, продамин, профлуазол, профлуралин, профоксидим, проглиназин, прогексадион-кальций, прометон, прометрин, пропахлор, пропанил, пропаквизафоп, пропазин, профам, пропизохлор, пропоксикарбазон, пропирисульфурун, про-пизамид, просульфалин, просульфокарб, просульфурон, проксан, принахлор, пиданон, пираклонил, пи-рафлуфен, пирасульфотол, пиразогил, пиразолинат, пиразосульфурон-этил, пиразоксифен, пирибензок-сим, пирибутикарб, пирихлор, пиридафол, пиридат, пирифталид, пириминобак, пиримисульфам, пири-тиобак-метил, пироксасульфон, пироксулам, квинкларак, квинмерак, квинокламин, квинонамид, квиза-лофоп, квизалофоп-Р-этил, родетанил, римсульфурун, сафлуфенацил, S-метолахлор, себутилазин, секбу-метон, сетоксидим, сидурон, симазин, симетон, симетрин, SMA, арсенит натрия, азид натрия, хлорат на-трия, сулькотрион, сульфаллат, сульфентразон, сульфометурон, сульфосат, сульфосульфурон, серную кислоту, сулгликапин, свеп, ТСА, тебутам, тебутиурон, тефурилтрион, темботрион, тепралоксидим, тер-бацил, тербукарб, тербухлор, тербуметон, тербутилазин, тербутрин, тетрафлурун, тенилхлор, тиазифлу-рон, тиазопир, тидиазимин, тидиазурун, тиенкарбазон-метил, тифенсульфурун, тиобенкарб, тиафенацил, тиокарбазил, тиоклорим, толпиралат, топрамезон, тралкоксидим, триафамон, триаллат, триасульфурон, триазифлам, трибенурон, трикамбу, сложные эфиры и амины трихлопира, тридифан, триэтазин, триф-локсисульфурон, трифлудимоксазин, трифлуралин, трифлусульфурон, трифоп, трифопсим, тригидро-ситриазин, триметурон, трипропиндан, тритак, тритосульфурон, вернолат и ксилахлор. Партнера(ов) по смешиванию можно составлять в виде свободной кислоты или основания или в виде соли или сложного эфира, как определено выше.

Соединения и композиции, описанные в данном документе, как правило, можно применять в ком-бинации с известными антидотами гербицидов, такими как беноксакор, бентиокарб, брассинолид, кло-квинтосет (например, мексил), циометринил, даимурон, дихлормид, дициклонон, димепиперат, дисульфо-тон, фенхлоразол-этил, фенклорим, флуразол, флуоксифенин, фурилазол, гарпиновые белки, изоксади-фен-этил, мефенпир-диэтил, 2-дихлорметил-2-метил-1,3-диоксолан, также известный как MG 191, ди-хлорацетил-1-окса-4-азаспиро(4,5)-декан, также известный как MON 4660, нафталиновый ангидрид (NA),

оксабетринил, (R,S)-3-дихлорацетил-2,2,5-триметилксазолидин, также известный как R29148, метками-фен, амиды N-фенилсульфонилбензойной кислоты или их смеси, чтобы повысить их селективность.

В некоторых вариантах осуществления соединения, предусмотренные в данном документе, можно применять в смесях, содержащих гербицидно эффективное количество соединения вместе с по меньшей мере одним приемлемым с точки зрения сельского хозяйства вспомогательным веществом или носителем. Иллюстративные вспомогательные вещества или носители включают те, которые не являются фитотоксичными или существенно фитотоксичными в отношении ценных сельскохозяйственных культур, например, в концентрациях, используемых при применении композиций для селективного контроля сорняка в присутствии сельскохозяйственных культур, и/или не вступают или в значительной степени не вступают в химические реакции с соединениями, предусмотренными в данном документе, или другими ингредиентами композиции. Такие смеси могут быть разработаны для применения непосредственно в отношении сорняков или мест их произрастания или могут представлять собой концентраты или составы, которые перед применением разбавляют дополнительными носителями и вспомогательными веществами. Они могут быть в форме твердых веществ, таких как, например, пылевидные препараты, гранулы, диспергируемые в воде гранулы или смачиваемые порошки, или жидкостей, таких как, например, эмульгируемые концентраты, растворы, эмульсии или суспензии. Также они могут предусматриваться в форме премикса или баковой смеси.

Приемлемые с точки зрения сельского хозяйства вспомогательные вещества и носители, которые являются пригодными при получении гербицидных смесей по настоящему изобретению, широко известны специалистам в данной области техники. Некоторые из этих вспомогательных веществ включают без ограничения масляный концентрат для сельскохозяйственных культур (минеральное масло (85%) + эмульгаторы (15%)); нонилфенолэтоксилат; четвертичную аммониевую соль бензилкокоалкилдиметила; смесь нефтяного углеводорода, сложных алкиловых эфиров, органической кислоты и анионного поверхностно-активного вещества; C₉-C₁₁алкилполигликозид; этоксилат фосфорной кислоты и спирта; этоксилат натурального первичного спирта (C₁₂-C₁₆); ди-втор-бутилфенол блок-сополимер EO-PO; полисилоксан с концевой метильной группой; этоксилат нонилфенола+мочевина-аммониевый нитрат; эмульгированное метилированное масло семян; этоксилат тридецилового спирта (синтетического) (8EO); этоксилат таллового амина (15 EO); PEG(400) диолеат-99.

Жидкие носители, которые можно применять, включают воду и органические растворители. Иллюстративные органические растворители включают без ограничения нефтяные фракции или углеводороды, такие как минеральное масло, ароматические растворители, парафиновые масла и т.п.; растительные масла, такие как соевое масло, рапсовое масло, оливковое масло, касторовое масло, подсолнечное масло, кокосовое масло, кукурузное масло, хлопковое масло, льняное масло, пальмовое масло, арахисовое масло, сафлоровое масло, кунжутное масло, тунговое масло и т.п.; сложные эфиры указанных выше растительных масел; сложные эфиры моноспиртов или двухосновных, трехосновных или других низших полиспиртов (содержащих 4-6-гидрокси), такие как 2-этилгексилстеарат, н-бутилолеат, изопропилмири-стат, диолеат пропиленгликоля, диоктилсукцинат, дибутиладипат, диоктилфталат и т.п.; сложные эфиры моно-, ди- и поликарбонатовых кислот и т.п. Конкретные органические растворители включают толуол, ксилол, лигроин, масляно вспомогательное средство, ацетон, метилэтилкетон, циклогексанон, трихлорэтилен, перхлорэтилен, этилацетат, амилацетат, бутилацетат, монометиловый эфир пропиленгликоля и монометиловый эфир диэтиленгликоля, метиловый спирт, этиловый спирт, изопропиловый спирт, амиловый спирт, этиленгликоль, пропиленгликоль, глицерин, N-метил-2-пирролидинон, N,N-диметилалкиламида, диметилсульфоксид, жидкие удобрения и т.п. В некоторых вариантах осуществления вода является носителем для разбавления концентратов.

Подходящие твердые носители включают тальк, пиррофиллитовую глину, диоксид кремния, аттапульгитовую глину, каолиновую глину, кизельгур, мел, диатомовую землю, известь, карбонат кальция, бентонитовую глину, фуллерову землю, шелуху семян хлопчатника, пшеничную муку, соевую муку, пемзу, древесную муку, муку из ореховой скорлупы, лигнин и т.п. Подходящие твердые носители также могут включать комбинации вышеуказанных твердых носителей.

В некоторых вариантах осуществления одно или более поверхностно-активных средств применяют в композициях по настоящему изобретению. Такие поверхностно-активные средства в некоторых вариантах осуществления применяют как в твердых, так и в жидких композициях, например, в тех, которые предназначены для разбавления носителем перед применением. Поверхностно-активные средства могут быть анионными, катионными или неионогенными по природе и могут применяться в качестве эмульгирующих средств, смачивающих средств, суспендирующих средств или для других целей. Поверхностно-активные вещества, традиционно применяемые в области составления, и которые также можно применять в составах по настоящему изобретению, описаны, среди прочего, в McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual, MC Publishing Corp., Ridgewood, New Jersey, 1998 и в Encyclopedia of Surfactants, vol. I-III, Chemical Publishing Co., New York, 1980-81. Типичные поверхностно-активные средства включают соли алкилсульфатов, такие как лаурилсульфат диэтаноламмония; соли алкиларилсульфатов, такие как додецилбензолсульфонат кальция; продукты присоединения алкиленоксидов и алкилфенолов, такие как этоксилат нонилфенола-C₁₈; продукты присоединения алкиленоксидов и спиртов, такие как этоксилат

тридецилового спирта-С₁₆; мыла, такие как стеарат натрия; солей алкилнафталинсульфонатов, такие как дибутилнафталинсульфонат натрия; сложные диалкиловые эфиры солей сульфосукцината, такие как ди(2-этилгексил)сульфосукцинат натрия; сложные эфиры сорбита, такие как олеат сорбита; четвертичные амины, такие как хлорид лаурилтриметиламмония; сложные полиэтиленгликолевые эфиры жирных кислот, такие как стеарат полиэтиленгликоля; блок-сополимеры этиленоксида и пропиленоксида; соли сложных эфиров моно- и диалкилфосфатов; растительные масла или масла из семян, такие как соевое масло, рапсовое/каноловое масло, оливковое масло, касторовое масло, подсолнечное масло, кокосовое масло, кукурузное масло, хлопковое масло, льняное масло, пальмовое масло, арахисовое масло, сафлоровое масло, кунжутное масло, тунговое масло и т.п.; и сложные эфиры вышеуказанных растительных масел, например, метиловые сложные эфиры.

Часто некоторые из этих материалов, такие как растительные масла или масла из семян и их сложные эфиры, можно применять взаимозаменяемо в качестве сельскохозяйственного вспомогательного вещества, в качестве жидкого носителя или в качестве поверхностно-активного средства.

Другие вспомогательные вещества, обычно применяемые в сельскохозяйственных композициях, включают средства, улучшающие совместимость, противовспениватели, связывающие средства, нейтрализующие средства и буферы, ингибиторы коррозии, красители, отдушки, средства, улучшающие распределение, добавки, улучшающие проникновение, средства, способствующие слипанию, диспергирующие средства, загустители, средства, снижающие температуру замерзания, антимикробные средства и т.п. Композиции также могут содержать другие совместимые компоненты, например, другие гербициды, регуляторы роста растений, фунгициды, инсектициды и т.п. и могут быть составлены с носителями на основе жидких удобрений или твердых дисперсных удобрений, таких как нитрат аммония, мочевины и т.п.

Концентрация активных ингредиентов в гербицидных композициях по настоящему изобретению, как правило, составляет от приблизительно 0,001 процента по весу до приблизительно 98 процентов по весу. Часто применяют концентрации от приблизительно 0,01 процента по весу до приблизительно 90 процентов по весу. В композициях, разработанных для применения в качестве концентратов, активный ингредиент, как правило, присутствует в концентрации от приблизительно 5 процентов по весу до приблизительно 98 процентов по весу, предпочтительно от приблизительно 10 процентов по весу до приблизительно 90 процентов по весу. Перед применением такие композиции, как правило, разбавляют инертным носителем, таким как вода. Разбавленные композиции, обычно применяемые в отношении сорняков или мест произрастания сорняков, как правило, содержат от приблизительно 0,0001 процента по весу до приблизительно 1 процента по весу активного ингредиента и предпочтительно содержат от приблизительно 0,001 процента по весу до приблизительно 0,05 процента по весу.

В контексте данного документа модификатор "приблизительно", применяемый по отношению к количеству, включает в себя указанное значение и имеет значение, определяемое контекстом (например, он включает по меньшей мере долю погрешности, связанную с измерением конкретной величины). При использовании в контексте диапазона модификатор "приблизительно" следует также рассматривать как раскрытие диапазона, определенного абсолютными значениями двух конечных точек. Например, диапазон "от приблизительно 2 до приблизительно 4" также раскрывает диапазон "от 2 до 4".

V. Способы применения.

Композиции по настоящему изобретению можно применять в отношении сорняков или мест их произрастания посредством применения традиционных наземных или авиационных опрыскивателей, опрыскивателей и разбрасывателей гранул путем добавления к оросительной или паводковой воде и с помощью других традиционных средств, известных специалистам в данной области техники.

В некоторых вариантах осуществления соединения по настоящему изобретению и композиции, описанные в данном документе, применяются в качестве послевсходового применения, предвсходового применения, применения в воде в отношении затопленных рисовых полей или водоемов (например, прудов, озер и потоков) или контактного применения.

В некоторых вариантах осуществления соединения и композиции, предусмотренные в данном документе, применяют для контроля сорняков в сельскохозяйственных культурах, включая без ограничения цитрусовые, яблоки, каучук, пальмовое масло, лесное хозяйство, рис с посевом семян в грунт, с посевом семян в воду и рассадный рис, пшеницу, ячмень, овес, рожь, сорго, кукурузу/маис, пастбища, луга, выгоны, землю под паром, газон, древесные и виноградные сады, водные среды или пропашную культуру, а также несельскохозяйственные установки, например, объект контроля растительности в промышленных зонах или полосах отвода. В некоторых вариантах осуществления соединения и композиции применяют для контроля древесных растений, широколиственных и злаковых сорняков или осок.

В некоторых вариантах осуществления соединения и композиции, предусмотренные в данном документе, применяют для контроля нежелательной растительности в рисе. В некоторых вариантах осуществления нежелательная растительность представляет собой *Brachiaria platyphylla* (Groseb.) Nash (ветвянка широколистная, BRAPP), *Digitaria sanguinalis* (L.) Scop. (росичка кроваво-красная, DIGSA), *Echinochloa crus-galli* (L.) P. Beauv. (ежовник обыкновенный, ECHCG), *Echinochloa colonum* (L.) LINK (ежовник крестьянский, ECHCO), *Echinochloa oryzoides* (Ard.) Fritsch (ежовник рисовидный, ECHOR), *Echinochloa oryzicola* (Vasinger) Vasinger (ежовник бородчатый, ECHPH), *Ischaemum rugosum* Salisb. (исхемум, IS-

CRU), *Leptochloa chinensis* (L.) Nees (тонкоколосник китайский, LEFCH), *Leptochloa fascicularis* (Lam.) Gray (тонкоколосник пучковатый, LEFFA), *Leptochloa panicoides* (Presl.) Hitchc. (тонкоколосник амазонский, LEFPA), *Panicum dichotomiflorum* (L.) Michx. (просо раздвоенноцветковое, PANDI), *Paspalum dilatatum* Poir. (паспалум расширенный, PASDI), *Cyperus difformis* L. (сыть разнородная, CYPDI), *Cyperus esculentus* L. (сыть съедобная, CYPES), *Cyperus iria* L. (сыть ирия, CYPPIR), *Cyperus rotundus* L. (сыть круглая, CYPRO), виды *Eleocharis* (ELOSS), *Fimbristylis miliacea* (L.) Vahl (фимбристилис, FIMMI), *Schoenoplectus juncoides* Roxb. (японский камыш, SPCJU), *Schoenoplectus maritimus* L. (клубнекамыш морской, SCPMA), *Schoenoplectus mucronatus* L. (схеноплект остроконечный, SCPMU), виды *Aeschynomene* (вид бобовых, AESSS), *Alternanthera philoxeroides* (Mart.) Griseb. (альтернантера филоксероидная, ALRPH), *Alisma plantago-aquatica* L. (частуха обыкновенная, ALSPA), виды *Amaranthus*, (разновидности щирицы и амаранты, AMASS), *Ammannia coccinea* Rottb. (амманья пурпурная, AMMCO), *Eclipta alba* (L.) Hassk. (эклипта белая, ECLAL), *Heteranthera limosa* (Sw.) Willd./Vahl (гетерантера илистая, HETLI), *Heteranthera reniformis* R. & P. (гетерантера почковидная, HETRE), *Lpromoea hederacea* (L.) Jacq. (ипомея плосковидная, IPOHE), *Lindernia dubia* (L.) Pennell (линдерния сомнительная, LIDDU), *Monochoria korsakowii* Regel & Maack (монохория, MOOKA), *Monochoria vaginalis* (Burm. F.) C. Presl ex Kuhn, (монохория, MOOVA), *Murdannia nudiflora* (L.) Brenan (мурдания узлоцветковая, MUDNU), *Polygonum pensylvanicum* L., (горец пенсильванский, POLPY), *Polygonum persicaria* L. (горец почечуйный, POLPE), *Polygonum hydropiperoides* Michx. (POLHP, горец перечновидный), *Rotala indica* (Willd.) Koehne (ротала индийская, ROTIN), виды *Sagittaria*, (стрелолист, SAGSS), *Sesbania exaltata* (Raf.) Cory/Rydb. Ex Hill (сесбания рослая, SEBEX) или *Sphenoclea zeylanica* Gaertn. (сфенокля цейлонская, SPDZE).

В некоторых вариантах осуществления соединения и композиции, предусмотренные в данном документе, применяют для контроля нежелательной растительности в зерновых культурах. В некоторых вариантах осуществления нежелательная растительность представляет собой *Alopecurus myosuroides* Huds. (лисохвост мышехвостниковидный, ALOMY), *Apera spica-venti* (L.) Beauv. (метлица обыкновенная, APESV), *Avena fatua* L. (овес пустой, AVEFA), *Bromus tectorum* L. (костер кровельный, BROTE), *Lolium multiflorum* Lam. (плевел многоцветковый, LOLMU), *Phalaris minor* Retz. (канареечник малый, PKAMI), *Poa annua* L. (мятлик однолетний, POAAN), *Setaria pumila* (Poir.) Roemer & J.A. Schultes (щетинник низкий, SETLU), *Setaria viridis* (L.) Beauv. (щетинник зеленый, SETVI), *Cirsium arvense* (L.) Scop. (бодяк полевой, CIRARj), *Galium aparine* L. (подмаренник цепкий, GALAP), *Kochia scoparia* (L.) Schrad. (кохия, KCHSC), *Lamium purpureum* L. (ясотка пурпурная, LAMPU), *Matricaria recutita* L. (ромашка аптечная, MATCH), *Matricaria matricarioides* (Less.) Porter (ромашка пахучая, MATMT), *Papaver rhoeas* L. (мак самосейка, PAPRH), *Polygonum convolvulus* L. (горец вьюнковый, POLCO), *Salsola tragus* L. (солянка русская, SASKR), *Stellaria media* (L.) Vill. (звездчатка средняя, STEME), *Veronica persica* Poir. (вероника персидская, VERPE), *Viola arvensis* Murr. (фиалка полевая, VIOAR) или *Viola tricolor* L. (фиалка трехцветная, VIOTR).

В некоторых вариантах осуществления соединения и композиции, предусмотренные в данном документе, применяют для контроля нежелательной растительности на выгонах и пастбищах. В некоторых вариантах осуществления нежелательная растительность представляет собой *Ambrosia artemisiifolia* L. (амброзия полыннолистная, AMBEL), *Cassia obtusifolia* (сenna туполистная, CASOB), *Centaurea maculosa* auct. non Lam. (василек пятнистый, CENMA), *Cirsium arvense* (L.) Scop. (бодяк полевой, CIRAR), *Convolvulus arvensis* L. (вьюнок полевой, CONAR), *Euphorbia esula* L. (молочай острый, EPHEs), *Lactuca serriola* L./Torn. (латук дикий, LACSE), *Plantago lanceolata* L. (подорожник ланцетолистный, PLALA), *Rumex obtusifolius* L. (щавель туполистный, RUMOB), *Sida spinosa* L. (грудинка колючая, SIDSP), *Sinapis arvensis* L. (горчица полевая, SINAR), *Sonchus arvensis* L. (осот полевой, SONAR), виды *Solidago* (золотарник, SOOSS), *Taraxacum officinale* G.H. Weber ex Wiggers (одуванчик обыкновенный, TAROF), *Trifolium repens* L. (клевер ползучий, TRFRE) или *Urtica dioica* L. (крапива двудомная, URTDI).

В некоторых вариантах осуществления соединения и композиции, предусмотренные в данном документе, применяют для контроля нежелательной растительности, которая встречается в пропашных культурах. В некоторых вариантах осуществления нежелательная растительность представляет собой *Alopecurus myosuroides* Huds. (лисохвост мышехвостниковидный, ALOMY), *Avena fatua* L. (овес пустой, AVEFA), *Brachiaria platyphylla* (Groseb.) Nash (ветвянка широколистная, BRAPP), *Digitaria sanguinalis* (L.) Scop. (росичка кроваво-красная, DIGSA), *Echinochloa crus-galli* (L.) P. Beauv. (ежовник обыкновенный, ECHCG), *Echinochloa colonum* (L.) Link (ежовник крестьянский, ECHCO), *Lolium multiflorum* Lam. (плевел многоцветковый, LOLMU), *Panicum dichotomiflorum* Michx. (просо раздвоенноцветковое, PANDI), *Panicum miliaceum* L. (просо обыкновенное, PANMI), *Setaria faberi* Herrm. (щетинник Фабера, SETFA), *Setaria viridis* (L.) Beauv. (щетинник зеленый, SETVI), *Sorghum halepense* (L.) Pers. (сорго алеппское, SORHA), *Sorghum bicolor* (L.) Moench ssp. *Arundinaceum* (сорго травянистое, SORVU), *Cyperus esculentus* L. (сыть съедобная, CYPES), *Cyperus rotundus* L. (сыть круглая, CYPRO), *Abutilon theophrasti* Medik. (канатник Теофраста, ABUTH), виды *Amaranthus* (разновидности щирицы и амаранты, AMASS), *Ambrosia artemisiifolia* L. (амброзия полыннолистная, AMBEL), *Ambrosia psilostachya* DC. (амброзия голометельчатая, AMBPS), *Ambrosia trifida* L. (амброзия трехраздельная, AMBTR), *Asclepias syriaca* L. (ваточник сирийский, ASCSY), *Chenopodium album* L. (марь белая, CHEAL), *Cirsium arvense* (L.) Scop. (бодяк

полевой, CIRAR), *Commelina benghalensis* L. (коммелина бенгальская, COMBE), *Datura stramonium* L. (дурман обыкновенный, DATST), *Daucus carota* L. (морковь дикая, DAUCA), *Euphorbia heterophylla* L. (молочай разнолистный, ERHHL), *Erigeron bonariensis* L. (мелколепестник буэносайресский, ERIBO), *Erigeron canadensis* L. (мелколепестник канадский, ERICA), *Helianthus annuus* L. (подсолнечник однолетний, HELAN), *Jacquemontia tamnifolia* (L.) Griseb. (джакемонтия тамнифолия, IAQTA), *Ipomoea hederacea* (L.) Jacq. (ипомея плющевидная, IPOHE), *Ipomoea lacunosa* L. (ипомея ямчатая, IPOLA), *Lactuca serriola* L./Torn. (латук дикий, LACSE), *Portulaca oleracea* L. (портулак огородный, POROL), *Sida spinosa* L. (грудинка колючая, SIDSP), *Sinapis arvensis* L. (горчица полевая, SINAR), *Solanum ptychanthum* Dunal (паслен черный восточный, SOLPT) или *Xanthium strumarium* L. (дурнишник обыкновенный, XANST).

В некоторых вариантах осуществления нормы внесения, составляющие от приблизительно 1 грамм/гектар (г/га) до приблизительно 4000 г/га, используются в послевсходовых операциях. В некоторых вариантах осуществления нормы, составляющие от приблизительно 1 г/га до приблизительно 4000 г/га, используются в предвсходовых операциях.

Соединения, композиции и способы, описанные в данном документе, применяются для контроля нежелательной растительности в выносливых по отношению к ингибитору синтазы 5-енолпирувилшикимат-3-фосфата (EPSP) (например, выносливых по отношению к глифосату), выносливых по отношению к ингибитору глутаминсинтазы (например, выносливых по отношению к глюфосинату), выносливых по отношению к синтетическому ауксину (например, выносливых по отношению к дикамбе, выносливых по отношению к феноксиауксину, выносливых по отношению к пиридилоксиауксину), выносливых по отношению к ингибитору транспорта ауксина, выносливых по отношению к ингибитору ацетил-СоА-карбоксилазы (АССазы) (например, выносливых по отношению к арилоксифеноксипропионату), выносливых по отношению к ингибиторам ацетолактатсинтазы (ALS) или синтазы ацетогидроксикислот (АНАС) (например, выносливых по отношению к имидазолинону, выносливых по отношению к сульфонилмочевине, выносливых по отношению к пиримидинилтиобензоату, выносливых по отношению к триазолопиримидину, выносливых по отношению к сульфониламинокарбонилтриазолинону), выносливых по отношению к ингибитору 4-гидроксифенилпируватдиоксигеназы (HPPD), выносливых по отношению к ингибитору протопорфириногенаоксидазы (PPO), выносливых по отношению к ингибитору фотосистемы (PS) II (например, выносливых по отношению к триазину и выносливых по отношению к бромоксинилу) сельскохозяйственных культур (таких как без ограничения соя, хлопок, канола/масличный рапс, рис, злаки, кукуруза, травяные растения и т.д.), например, в сочетании с ингибиторами синтазы EPSP (например, глифосат), ингибиторами глутаминсинтазы (например, глюфосинат), синтетическими ауксинами (например, дикамба, феноксиауксины, пиридилоксиауксины), ингибиторами АССазы (например, арилоксифеноксипропионаты), ингибиторами ALS (например, имидазолиноны, сульфонилмочевины, пиримидинилтиобензоаты, триазолопиримидины и сульфониламинокарбонилтриазолиноны), ингибиторами HPPD, ингибиторами PPO и ингибиторами PS II (например, триазины и бромоксинил). Композиции и способы можно применять в контроле нежелательной растительности в сельскохозяйственных культурах, обладающих множественными или пакетированными признаками, которые придают выносливость по отношению к множеству химических веществ и/или ингибиторов с несколькими механизмами действия.

Соединения и композиции, предусмотренные в данном документе, также можно применять для контроля устойчивых или выносливых по отношению к гербицидам сорняков. Иллюстративные устойчивые или выносливые сорняки включают без ограничения биотипы, устойчивые или выносливые к ингибиторам ALS (или АНАС), ингибиторам PS II, ингибиторам АССазы, синтетическим ауксинам, ингибиторам PS I, ингибиторам синтазы EPSP, ингибиторам сборки микротрубочек, ингибиторам синтеза липидов, ингибиторам PPO, ингибиторам биосинтеза каротиноидов, ингибиторам жирных кислот с очень длинной цепью (VLCFA), ингибиторам фитоендесатуразы (PDS), ингибиторам глутаминсинтазы, ингибиторам HPPD, ингибиторам митоза, ингибиторам биосинтеза целлюлозы, гербицидам с несколькими механизмами действия, таким как квинкlorак, и неклассифицированным гербицидам, таким как ариламинопропионовые кислоты, дифензокват, эндоталл и мышьякорганические соединения. Иллюстративные устойчивые или выносливые сорняки включают без ограничения биотипы, обладающие устойчивостью или выносливостью по отношению к нескольким гербицидам, нескольким классам химических веществ и гербицидам с несколькими механизмами действия.

Описанные варианты осуществления и следующие примеры предназначены только для иллюстративных целей и не должны ограничивать объем формулы изобретения. Другие модификации, применения или комбинации в отношении композиций, описанных в данном документе, будут очевидны для среднего специалиста в данной области техники без отступления от сути и объема заявленного объекта изобретения.

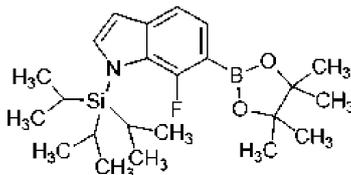
Примеры

Пример 1. Получение 7-фтор-1-(триизопропилсилил)-1H-индола (1).



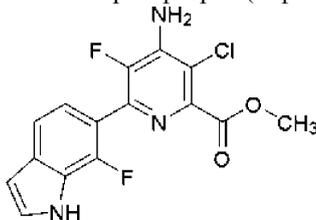
Указанное в заголовке соединение получали в соответствии с процедурой из литературного источника Das, A. et al., *Org. Lett.*, 2017, 19, 5794-5797, который включен в данный документ посредством ссылки во всей своей полноте.

Пример 2. Получение 7-фтор-6-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)-1-(триизопропилсилил)-1H-индола (2).



Указанное в заголовке соединение получали, как в получении 50, примере предшественника 3 в публикации заявки на выдачу патента США № 2014/0274695.

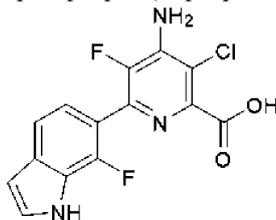
Пример 3. Получение метил-4-амино-3-хлор-5-фтор-6-(7-фтор-1H-индол-6-ил)пиколината (3).



Указанное в заголовке соединение можно получать, как описано в примере 1 в публикации заявки на выдачу патента США № 2014/0274695. В качестве альтернативы его можно получать следующим образом.

В трехгорлую колбу объемом 3 литра (л), оснащенную магнитной мешалкой, конденсатором, датчиком внутренней температуры и атмосферой азота, добавляли метил-4-амино-3,6-дихлор-5-фторпиколинат (полученный, как в Fields et al., *Tetrahedron Letters* 2010, 51, 79-81; 75 грамм (г), 314 миллимолей (ммоль)) и 7-фтор-6-(4,4,5,5-тетраметил-1,3,2-диоксаборолан-2-ил)-1-(триизопропилсилил)-1H-индол (175 г, 377 ммоль). Последовательно добавляли ацетонитрил (CH_3CN ; 1255 миллилитров (мл)) и 2 молярный (М) раствор фосфата калия (314 мл, 628 ммоль). Смесь затем вакуумировали и снова заполняли азотом (3×) перед добавлением дихлорида бис-(трифенилфосфин)палладия (11,12 г, 15,69 ммоль). Колбу вакуумировали и снова заполняли (3×) и смесь нагревали при 65°C. Через 3 часа (ч) добавляли фторид калия (74,4 г, 1255 ммоль) и нагревание продолжали в течение дополнительных 16 ч. Обеспечивали охлаждение реакционной смеси до комнатной температуры и фильтровали через целит. Фазы разделяли и растворитель удаляли при пониженном давлении. Остаток растирали с гексаном и твердое вещество собирали путем фильтрации и промывали с помощью гексана. Полученное твердое вещество обрабатывали с помощью дихлорметана (CH_2Cl_2), фильтровали, ополаскивали с помощью небольшого количества CH_2Cl_2 и высушивали в вакууме при 50°C. Указанное в заголовке соединение выделяли в виде грязно-белого твердого вещества (73,5 г, 69%) .

Пример 4. Получение 4-амино-3-хлор-5-фтор-6-(7-фтор-1H-индол-6-ил)пиколиновой кислоты (4).

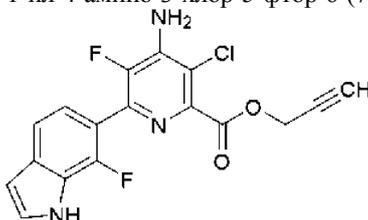


Указанное в заголовке соединение может быть получено, как в примере 12 в публикации заявки на выдачу патента США № 2014/0274695 или следующим образом.

Метил-4-амино-3-хлор-5-фтор-6-(7-фтор-1H-индол-6-ил)пиколинат (288 миллиграмм (мг), 0,853 ммоль) растворяли в тетрагидрофуране (THF; 2,0 мл), метаноле (CH_3OH ; 2,0 мл) и воде (1,0 мл). Добавляли гидрат гидроксида лития (100 мг, 2,383 ммоль). Обеспечивали перемешивание реакционной смеси при ком-

натной температуре в течение ночи. Реакционную смесь концентрировали до сухого состояния. Полученное твердое вещество разбавляли с помощью воды и подкисляли суспензию (pH~3). Суспензию экстрагировали с помощью этилацетата (EtOAc; 3×). Объединенные органические экстракты промывали с помощью насыщенного водного хлорида натрия (NaCl), высушивали над сульфатом магния (MgSO₄), фильтровали и концентрировали. Указанное в заголовке соединение выделяли в виде грязно-белого твердого вещества (256 мг, 93%).

Пример 5. Получение проп-2-ин-1-ил-4-амино-3-хлор-5-фтор-6-(7-фтор-1H-индол-6-ил)пиколината (5).



Смесь 4-амино-3-хлор-5-фтор-6-(7-фтор-1H-индол-6-ил)пиколиновой кислоты (1,5 г, 4,63 ммоль), карбоната калия (0,833 г, 6,02 ммоль) и 3-бромпропина (0,549 мл, 5,10 ммоль) в N,N-диметилформамиде (DMF; 18,5 мл) перемешивали при комнатной температуре в течение 4 ч. Реакционную смесь выливали в полунасыщенный водный раствор бикарбоната натрия (NaHCO₃) и экстрагировали с помощью EtOAc (2×). Объединенные органические экстракты высушивали над MgSO₄, фильтровали и концентрировали. Остаток очищали посредством автоматизированной колоночной флэш-хроматографии (силикагель, градиент гексан/EtOAc). К полученному маслу добавляли минимальное для инициации кристаллизации количество CH₂Cl₂. Для облегчения дальнейшей кристаллизации применяли обработку ультразвуком. Затем добавляли гексан для дополнительного осаждения продукта. Твердое вещество фильтровали, промывали с помощью гексана (2×) и высушивали in vacuo. Указанное в заголовке соединение выделяли в виде белого твердого вещества (1,33 г, 79%):

Т. пл. 140-142°C;

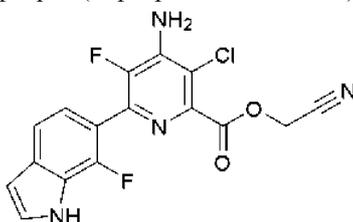
¹H ЯМР (400 МГц, CDCl₃) δ 8,49 (s, 1H), 7,49 (dd, J=8,3, 0,7 Гц, 1H), 7,32-7,27 (m, 2H), 6,61 (td, J=3,3, 2,1 Гц, 1H), 4,97 (d, J=2,5 Гц, 2H), 4,91 (s, 2H), 2,53 (t, J=2,5 Гц, 1H);

¹⁹F ЯМР (376 МГц, CDCl₃) δ -135,47, -135,55, -137,23, -137,32;

ESIMS масса/заряд 362 ([M+H]⁺).

Следующее соединение синтезировали, как в примере 5.

Цианометил-4-амино-3-хлор-5-фтор-6-(7-фтор-1H-индол-6-ил)пиколинат (6).



Указанное в заголовке соединение выделяли в виде белого твердого вещества (730 мг, 65%):

Т. пл. 139-140°C;

¹H ЯМР (300 МГц, DMSO-d₆) δ 11,83 (s, 1H), 7,52 (d, J=3,1 Гц, 1H), 7,47 (d, J=8,2 Гц, 1H), 7,13-7,03 (m, 3H), 6,59 (t, J=3,2 Гц, 1H), 5,29 (s, 2H);

ESIMS масса/заряд 363 ([M+H]⁺).

Пример 6. Оценка послевсходовой гербицидной активности в теплице.

Семена необходимых видов исследуемого растения высаживали в смесь для посадки Sun Gro MetroMix® 306, которая, как правило, характеризуется значением pH, составляющим от 6,0 до 6,8, и содержанием органического вещества, составляющим приблизительно 30%, в пластиковые горшки с площадью поверхности, составляющей 103,2 квадратного сантиметра (см²). При необходимости обеспечения хорошего прорастания и здоровых растений, применяли обработку фунгицидом и/или другую химическую или физическую обработку. Растения выращивали в течение 7-36 дней в теплице с приблизительно 14-часовым фотопериодом, который поддерживали при приблизительно 18°C во время дня и 17°C во время ночи. Регулярно добавляли питательные вещества и воду и при необходимости обеспечивали дополнительное освещение с помощью потолочных металлогалогенных 1000-ваттных ламп. Растения использовали для испытаний, когда они достигли второй или третьей стадии настоящего листа.

Аликвоту составленного соединения 5 (100 грамм эквивалента кислоты на литр (г экв. к./л); эмульгируемого концентрата (ЕС)), соединения 6 (100 г экв. к./л; ЕС) или соединения 7 (100 г экв. к./л; ЕС) помещали в стеклянный флакон объемом 25 мл и разбавляли в объеме 1,25% (объем на объем (об./об.)) водного эстрифицированного рапсового масла Astigob В с получением исходного раствора. Концентрированные исходные растворы разбавляли с помощью водной смеси 1,25% об./об. водного эстрифициро-

ванного рапсового масла Astirob В с обеспечением подходящих норм внесения. Требуемые количества соединений основаны на 12 мл объема внесения при норме, составляющей 187 литров на гектар (л/га). Составленные соединения наносили на растительный материал с помощью машины для опрыскивания с нисходящей струей Mandel, оснащенной соплами 8002E, откалиброванными для обеспечения 187 л/га на площади применения, составляющей 0,503 квадратного метра (м²), при высоте распыления, составляющей 18 дюймов (43 сантиметра (см)) выше среднего полога растения. Контрольные растения опрыскивали таким же образом с помощью холостого растворителя.

Обработанные растения и контрольные растения помещали в теплицу, как описано выше, и поливали с помощью подпочвенного орошения для предупреждения вымывания исследуемых соединений. Через 20-22 дней определяли визуально состояние исследуемых растений по сравнению с контрольными растениями и оценивали по шкале от 0 до 100%, где 0 соответствует отсутствию поражений и 100 соответствует полному уничтожению. Состояние исследуемых растений сравнивали с таковым контрольных растений, что определяли визуально и оценивали по шкале от 0 до 100%, где 0 соответствует отсутствию поражений и 100 соответствует полному уничтожению.

Контроль сорняков оценивали визуально (в виде процентов (%)) визуального контроля) с интервалами, указанными в таблицах. Указанные значения являются средними значениями. Средние значения, за которыми следует одна и та же буква в таблицах, существенно не отличаются (P=0,5, новый MRT Дункана). Данные обобщены в табл. 1.

Пример 7. Оценка послевсходового гербицидного действия в полевых испытаниях в Канаде.

Полевые испытания проводили в Канаде (в Эллерсли, Альберта; Ниску, Альберта и Хэнли, Саскачеван) для оценки эффективности соединения 5, соединения 6 и соединения 7. Испытания разрабатывали по рандомизированной полноблочной испытательной схеме с четырьмя повторностями. Испытания проводили на яровой пшенице с естественной популяцией сорняка с размерами участков, составляющими 2-3 метра (м) на 8-10 м (ширина × длина). Сельскохозяйственные культуры выращивали с применением обычных агротехнических приемов для удобрения, посева и поддержания для обеспечения хорошего роста сельскохозяйственной культуры.

Все обработки гербицидом применяли после появления всходов с применениями, осуществляемыми в отношении сельскохозяйственных культур при BBCH (фенологических стадиях развития растений) от 14 до 22 стадии роста. Гербициды применяли с помощью ранцевого или установленного на велосипеде опрыскивателей с применением диоксида углерода (CO₂) в качестве газа-вытеснителя. В опрыскивателях использовали распыляющие наконечники плоскоструйной форсунки с подачей воздуха, откалиброванные для обеспечения равномерного характера распределения, который обеспечивал тщательное покрытие листы с применением объема для опрыскивания, составляющего 100 л/га. Все обработки применяли с метилированным маслом из семян (MSO) при 1,25% об./об. Фитотоксичность в отношении сорняков оценивали визуально через некоторые интервалы времени после применения в виде процента общего показателя контроля по сравнению с необработанным контрольным участком. Как правило, оценивали четыре повторности для каждой обработки. Все результаты обработки представляют собой средние значения четырех повторностей.

Обработки гербицидом.

Соединение 5, соединение 6 и соединение 7 применяли в виде составов эмульгируемых концентратов (ЕС) при 100 г экв. к./л ЕС соответственно.

Результаты приведены в табл. 2-4.

Пример 8. Оценка послевсходового гербицидного действия в полевых испытаниях в Испании и Германии.

Полевые испытания проводили в Испании (Баньярес и Граньон) и Германии (Билефельд) для оценки эффективности соединения 5, соединения 6 и соединения 7. Испытания разрабатывали по рандомизированной полноблочной испытательной схеме с количеством повторностей в диапазоне от трех до четырех. Испытания проводили на озимой пшенице с естественной популяцией сорняков с размерами участков, составляющими 2-2,5/6-8 м (ширина × длина). Сельскохозяйственные культуры выращивали с применением обычных агротехнических приемов для удобрения, посева и поддержания для обеспечения хорошего роста сельскохозяйственной культуры.

Все обработки гербицидом применяли после появления всходов с применениями, осуществляемыми в отношении сельскохозяйственных культур при BBCH от 21 до 23 стадии роста. Гербициды применяли с помощью ранцевого или установленного на велосипеде опрыскивателей с применением воздуха в качестве газа-вытеснителя. В опрыскивателях использовали распыляющие наконечники плоскоструйной форсунки с подачей воздуха, откалиброванные для обеспечения равномерного характера распределения, который обеспечивал тщательное покрытие листы с применением объема для опрыскивания, составляющего 200 л/га. Все обработки применяли с метилированным маслом из семян (MSO) при 1,25% об./об. Фитотоксичность в отношении сорняков оценивали визуально через некоторые интервалы времени после применения в виде процента общего показателя контроля по сравнению с необработанным контрольным участком. Как правило, оценивали от трех до четырех повторностей для каждой обработки.

Все результаты обработки представляют собой средние значения трех или четырех повторностей.

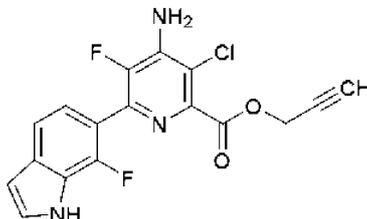
Обработки гербицидом.

Соединение 5, соединение 6 и соединение 7 применяли в виде составов эмульгируемых концентратов (ЕС) при 100 г экв. к./л ЕС соответственно.

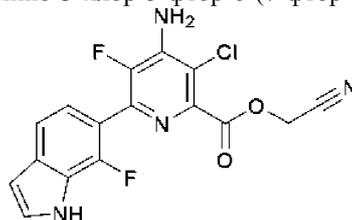
Результаты приведены в табл. 5-8.

В табл. 1-8 используются следующие сокращения.

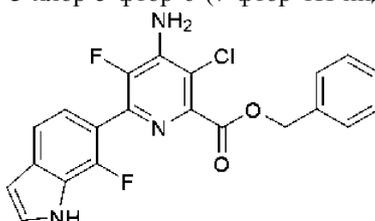
Соединение 5=проп-2-ин-1-ил-4-амино-3-хлор-5-фтор-6-(7-фтор-1Н-индол-6-ил)пиколинат.



Соединение 6=цианометил-4-амино-3-хлор-5-фтор-6-(7-фтор-1Н-индол-6-ил)пиколинат.



Соединение 7=бензил-4-амино-3-хлор-5-фтор-6-(7-фтор-1Н-индол-6-ил)пиколинат.



ANTAR=*Anthemis arvensis* (пупавка полевая)

CENCY=*Centaurea cyanus* (василек синий)

CHEAL=*Chenopodium album* L. (марь белая)

CIRAR=*Cirsium arvense* (L.) Scop. (бодяк полевой)

FUMOF=*Fumaria officinalis* (дымянка лекарственная)

KCHSC=*Kochia scoparia* (L.) Schrad. (кохия)

MATCH=*Matricaria recutita* L. (ромашка аптечная)

MATIN=*Matricaria inodora* (ромашка непахучая)

PAPRH=*Papaver rhoeas* L. (мак самосейка)

Res-PAPRH=*Papaver rhoeas* L. (мак самосейка), который является устойчивым к трибенурону и тифенсульфурону (механизм действия ALS – ацетолактатсинтазы) и 2,4-D

POLCO=*Polygonum convolvulus* L. (горец вьюнковый)

SINAR=*Sinapis arvensis* L. (горчица полевая)

STEME=*Stellaria media* (L.) Vill. (звездчатка средняя)

VERHE=*Veronica hederifolia* (вероника плющелистная)

VERSS=*Veronica* spp (вероника)

г экв. к./га=грамм эквивалента кислоты на гектар

LSD=наименьшая существенная разница

DAAA=дни после применения А

Таблица 1

Процент (%) визуального контроля основных сорняков с помощью гербицидных соединений в условиях теплицы

		Процент (%) визуального контроля 21-28 DAAA					
Соединение	Норма (г экв. к./га)	KCHSC	PAPRH	Res- PAPRH	SINAR	VERSS	ANTAR
7 (бензиловый эфир)	10	65	85	92,5	90	72,5	99,3
5 (пропаргиловый эфир)	10	76,7	95	87,5	89	77,5	100
6 (цианометилловый эфир)	10	73,3	100	95	90	86,3	100
7	20	73,3	100	92,5	94	67,5	99,3
5	20	82,7	100	100	96,7	80,8	83,3
6	20	84,3	100	100	96	86,5	98,3
		Процент (%) визуального контроля 21-28 DAAA					
Соединение	Норма (г экв. к./га)	CHEAL	CIRAR	MATCH	MATIN	POLCO	
7	10	92,5	30	57	100	97,5	
5	10	97,5	56,7	54,2	100	100	
6	10	100	50	57	98,3	98,3	
7	20	95	46,7	50,5	100	98,8	
5	20	100	58,3	68,9	100	100	
6	20	100	58,3	64	100	100	

Таблица 2

Процент (%) визуального контроля основных сорняков с помощью гербицидных соединений в полевых условиях в Ханли, Саскачеван, Канада (66 дней после применения А (66DAAA))

		Процент (%) визуального контроля 66DAAA		
Соединение	Норма (г экв. к./га)	KCHSC	CHEAL	POLCO
7	10	45	95,5	46,3
6	10	62	95	47,5
7	20	72	98,5	63,3
6	20	81,5	98,3	68,8
7	40	78,8	98,8	70
6	40	92,5	99	85,8

Таблица 3

Процент (%) визуального контроля основных сорняков
с помощью гербицидных соединений в полевых условиях в
Ниску, Альберта, Канада (28-51 день после применения А (28-51DAAA))

Соединение	Норма (г экв. к./га)	Процент (%) визуального контроля		
		STEME	CHEAL	STEME
		28DAAA	51DAAA	51DAAA
7	10	76,7	98	76,3
6	10	99	98	87,5
5	10	88	98	88,3
7	20	76,7	98	80
6	20	96	98	87,8
5	20	96	96,8	92,5
7	40	99	98	85,8
6	40	99	98	94,5
5	40	99	97,3	93,8

Таблица 4

Процент (%) визуального контроля основных сорняков
с помощью гербицидных соединений в полевых условиях в
Эллерсли, Альберта, Канада (51 день после применения А (51DAAA))

Соединение	Норма (г экв. к./га)	Процент (%) визуального контроля		
		POLCO	CHEAL	STEME
		51DAAA	51DAAA	51DAAA
7	10	79	94,8	73,3
6	10	90,3	96,8	83,8
5	10	76,3	98	66,3
7	20	92,8	98	80,8
6	20	84,5	98	75,8
5	20	91	98	83,3
7	40	96,8	98	83,3
6	40	87	98	90

Таблица 5

Процент (%) визуального контроля основных сорняков
с помощью гербицидных соединений в полевых условиях в
Граньоне, Испания (34-84 дня после применения А (34-84DAAA))

Соединение	Норма (г экв. к./га)	Процент (%) визуального контроля	
		PAPRH 84DAAA	VERHE 34DAAA
7	5	59,3	51,7
5	5	66,7	60
6	5	68,7	55
7	10	68,3	58,3
5	10	78,3	77
6	10	81	77,7
7	20	80,3	79,3
5	20	90,7	85
6	20	90	86

Таблица 6

Процент (%) визуального контроля основных сорняков
с помощью гербицидных соединений в полевых условиях в
Баньяресе, Испания (66-83 дня после применения А (66-83DAAA))

Соединение	Норма (г экв. к./га)	Процент (%) визуального контроля		
		PAPRH 66DAAA	VERHE 66DAAA	FUMOF 83DAAA
7	5	53,3	50	26,7
5	5	57,7	60	41,7
6	5	60	60	41,7
7	10	62,7	56	45
5	10	70	77,7	65
6	10	75	81,7	69,3
7	20	75	70	58,3
5	20	90	91	93,3
6	20	91	91	96

Таблица 7

Процент (%) визуального контроля основных сорняков
с помощью гербицидных соединений в полевых условиях в
Граньоне, Испания (48-68 дня после применения А (48-68DAAA))

Соединение	Норма (г экв. к./га)	Процент (%) визуального контроля	
		PAPRH 68DAAA	SINAR 48DAAA
7	5	45	73,3
5	5	58,3	85
6	5	55	82,7
7	10	60	80,7
5	10	72,7	94,8
6	10	69,3	95
7	20	74,3	89,3
5	20	79,3	95
6	20	85,3	95,2

Таблица 8

Процент (%) визуального контроля основных сорняков
с помощью гербицидных соединений в полевых условиях в
Билефельде, Германия (85 дней после применения А (85DAAA))

Соединение	Норма (г экв. к./га)	Процент (%) визуального контроля	
		PAPRH 85DAAA	CENCY 85DAAA
7	5	66,3	32,5
5	5	92,5	65
6	5	94,5	60
7	10	78,8	53,8
5	10	97,3	87,5
6	10	97,3	92,5
7	20	80	62,5
5	20	98,8	95
6	20	99,8	97

Как можно видеть из вышеуказанных результатов, соединения по настоящему изобретению формулы (I) обладают гербицидной активностью. Как также можно видеть из вышеуказанных результатов, соединение 5 и соединение 6 продемонстрировали превосходную гербицидную активность по сравнению с соединением 7. Эти новые химические гербициды обеспечивают более широкий спектр контроля сорняков, более высокую активность по отношению к сорнякам и обеспечивают способ борьбы с сорняками, которые развили устойчивость к гербицидам, традиционно используемым для их контроля.

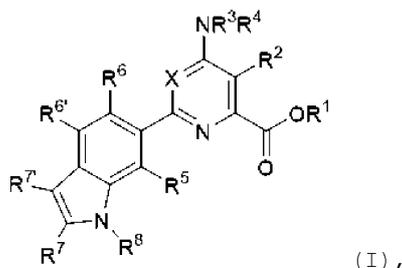
Хотя настоящее изобретение было описано как имеющее иллюстративные аспекты или варианты осуществления, настоящее изобретение можно дополнительно модифицировать в пределах сущности и объема настоящего изобретения. Следовательно, подразумевается, что настоящая заявка охватывает любые изменения, варианты применения или адаптации настоящего изобретения с применением его общих принципов. Кроме того, подразумевается, что настоящая заявка охватывает такие отступления от настоящего изобретения, которые соответствуют известным или общепринятым практикам в области техники, к которой относится настоящее изобретение.

Полезьа, преимущества, решения проблем и любые элементы, которые могут привести к тому, что какая-либо польза, преимущество или решение возникают или становятся более выраженными, не должны рассматриваться как важные, требуемые или существенные признаки или элементы. Соответственно объем должен быть ограничен ничем иным, как приложенной формулой изобретения, в которой ссылка на элемент в единственном числе не означает "один и только один", если это не указано явно, а означает "один или более". Более того, если фраза, аналогичная "по меньшей мере один из А, В или С" используется в формуле изобретения, предполагается, что фраза должна интерпретироваться как означающая, что А сам по себе может присутствовать в варианте осуществления, В сам по себе может присутствовать в варианте осуществления, С сам по себе может присутствовать в варианте осуществления или что любая комбинация элементов А, В или С может присутствовать в одном варианте осуществления; например, А и В, А и С, В и С или А, В, и С.

В подробном описании в данном документе ссылки на "один вариант осуществления", "вариант осуществления", "иллюстративный вариант осуществления" и т.д. указывают на то, что описанный вариант осуществления может включать конкретный признак, структуру или характеристику, но не каждый вариант осуществления обязательно может включать конкретный признак, структуру или характеристику. Более того, такие фразы не обязательно относятся к одному и тому же варианту осуществления. Кроме того, если конкретный признак, структура или характеристика описаны в связи с вариантом осуществления, предполагается, что в пределах знаний специалиста в данной области техники с пользой настоящего изобретения повлиять на такие признак, структуру или характеристику в связи с другими вариантами осуществления, явно они описаны или нет.

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Соединение формулы (I)



где X представляет собой СУ;

Y представляет собой галоген;

R¹ представляет собой C₃-C₁₂алкинил или C₁-C₃алкил, замещенный CN;

R² представляет собой галоген или группу формулы -CR¹⁷=CR¹⁸-SiR¹⁹R²⁰R²¹, где R¹⁷ представляет собой водород, F или Cl; R¹⁸ представляет собой водород, F, Cl, C₁-C₄алкил или C₁-C₄галогеналкил; и R¹⁹, R²⁰ и R²¹ независимо представляют собой C₁-C₁₀алкил, C₃-C₆циклоалкил, фенил, C₁-C₁₀алкокси или OH;

R³ и R⁴ независимо представляют собой водород, C₁-C₆триалкилсиллил, C₁-C₆диалкилфосфонил;

R⁵ представляет собой галоген;

R⁶ и R^{6'} представляют собой водород;

R⁷ и R^{7'} представляют собой водород;

R⁸ представляет собой водород, C₁-C₆триалкилсиллил,

или его приемлемая с точки зрения сельского хозяйства соль.

2. Соединение по п.1,

где X представляет собой CF;

R¹ представляет собой C₃-C₁₂алкинил или C₁-C₃алкил, замещенный CN;

R² представляет собой хлор;

R³ и R⁴ представляют собой водород;

R⁸ представляет собой водород,

или его приемлемая с точки зрения сельского хозяйства соль.

3. Соединение по п.1,

где X представляет собой CF;

R¹ представляет собой C₃-C₁₂алкинил или C₁-C₃алкил, замещенный CN;

R² представляет собой галоген;

R³ и R⁴ представляют собой водород;

R⁸ представляет собой водород, C₁-C₆триалкилсиллил.

4. Соединение по п.3, где R² представляет собой галоген.

5. Соединение по п.4, где R² представляет собой Cl.

6. Соединение по п.3, где R³ и R⁴ представляют собой водород.

7. Соединение по п.3, где R⁵ представляет собой F.

8. Соединение по п.3,
где R^2 представляет собой галоген;
 R^5 представляет F.
9. Соединение по п.8, где R^2 представляет собой хлор.
10. Соединение по п.8, где R^3 и R^4 представляют собой водород.
11. Соединение по п.9, где R^3 и R^4 представляют собой водород.
12. Соединение по п.3,
где R^2 представляет собой хлор; и
 R^3 и R^4 представляют собой водород.
13. Соединение по п.3, где соединение представляет собой проп-2-ин-1-ил-4-амино-3-хлор-5-фтор-6-(7-фтор-1H-индол-6-ил)пиколинат.
14. Соединение по п.3, где соединение представляет собой цианометил-4-амино-3-хлор-5-фтор-6-(7-фтор-1H-индол-6-ил)пиколинат.
15. Гербицидная композиция, содержащая соединение по п.1 и приемлемые с точки зрения сельского хозяйства вспомогательное вещество или носитель.
16. Способ контроля нежелательной растительности, включающий нанесение соединения по п.1 на нежелательную растительность или на место ее произрастания.
17. Способ контроля нежелательной растительности, включающий нанесение композиции по п.15 на нежелательную растительность или на место ее произрастания.

