

(19)



**Евразийское
патентное
ведомство**

(21) **202392519** (13) **A1**

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОЙ ЗАЯВКЕ

(43) Дата публикации заявки
2023.11.09

(51) Int. Cl. *C07D 271/113* (2006.01)
A01N 43/82 (2006.01)

(22) Дата подачи заявки
2022.03.09

**(54) ХИРАЛЬНЫЕ АМИДЫ N-(1,3,4-ОКСАДИАЗОЛ-2-ИЛ)ФЕНИЛКАРБОНОВОЙ
КИСЛОТЫ И ИХ ПРИМЕНЕНИЕ В КАЧЕСТВЕ ГЕРБИЦИДОВ**

(31) 21162218.8

(32) 2021.03.12

(33) EP

(86) PCT/EP2022/056017

(87) WO 2022/189495 2022.09.15

(71) Заявитель:
БАЙЕР АКЦИЕНГЕЗЕЛЬШАФТ
(DE)

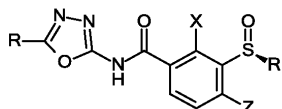
(72) Изобретатель:

Кён Арним, Вальдрафф Кристиан,
Аренс Хартмут, Браун Ральф, Якоби
Харальд, Розингер Кристофер Хью,
Гатцвайлер Эльмар, Диттген Ян,
Болленбах-Валь Биргит, Асмус
Элизабет (DE)

(74) Представитель:

Веселицкий М.Б., Кузенкова Н.В.,
Каксис Р.А., Белоусов Ю.В., Куликов
А.В., Кузнецова Е.В., Соколов Р.А.,
Кузнецова Т.В. (RU)

(57) Описаны хиральные амиды N-(1,3,4-оксадiazол-2-ил)фенилкарбонической кислоты общей формулы (I) и их применение в качестве гербицидов



В этой формуле (I) X, Z, R и R' представляют собой радикалы, такие как алкил, циклоалкил и галоген.

202392519

A1

A1

202392519

ХИРАЛЬНЫЕ АМИДЫ N-(1,3,4-ОКСАДИАЗОЛ-2-ИЛ)ФЕНИЛКАРБОНОВОЙ КИСЛОТЫ И ИХ ПРИМЕНЕНИЕ В КАЧЕСТВЕ ГЕРБИЦИДОВ

5

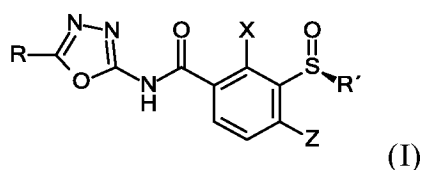
Изобретение относится к области гербицидов, в частности, к области гербицидов для выборочной борьбы с сорняками и сорными травами в культурах полезных растений.

В документах WO 2012/126932 A1 и WO 2018/202535 A1 описываются гербицидно активные бензоиламиды, существенно отличающиеся друг от друга характером N-связанного гетероциклического заместителя и заместителей на фенильном кольце. Среди веществ, описываемых в обоих документах, отмечены (1,3,4-оксадиазол-2-ил)фенилкарбоксамиды, несущие разные алкилсульфинильные радикалы в 3-й позиции фенильного кольца, без указания стереохимии этих хиральных алкилсульфинильных радикалов.

Однако бензоиламиды, известные из приведенных выше документов, часто имеют неблагоприятный профиль в отношении их биологических свойств, таких как гербицидное действие, переносимость для культурных растений, токсикологические и экотоксикологические свойства.

Цель настоящего изобретения состоит в обеспечении альтернативных гербицидно активных ингредиентов. Этой цели достигают благодаря описанным ниже (1,3,4-оксадиазол-2-ил)фенилкарбоксамидам в соответствии с изобретением, которые несут хиральный алкилсульфинильный радикал со стереохимически определенной конфигурацией в 3-й позиции фенильного кольца.

Настоящее изобретение обеспечивает N-(1,3,4-оксадиазол-2-ил)фенилкарбоксамиды или их соли, имеющие абсолютную конфигурацию, указанную в формуле (I)



где заместители определяются следующим образом:

R является водородом или метилом,

X является Cl или метилом,

R' является метилом или c-Pr,

Z является CF₃ или CHF₂.

- Соединения в соответствии с изобретением представляют собой соединения общей формулы (I), которые, согласно правилам Кана – Ингольда – Прелонга, находятся в S-конфигурации при условии, что R' обладает меньшим приоритетом, чем фенильное кольцо. Это касается, например, соединений общей формулы (I), в которых R' является метилом или циклопропилем. Другие соединения в соответствии с изобретением представляют собой соединения общей формулы (I), которые, согласно правилам Кана – Ингольда – Прелонга, находятся в R-конфигурации при условии, что R' обладает большим приоритетом, чем фенильное кольцо.

Предпочтение отдают соединениям с I-1 по I-16:

№	R	X	R'	Z
I-1	H	Cl	Me	CF ₃
I-2	H	Cl	Me	CHF ₂
I-3	H	Me	Me	CF ₃
I-4	Me	Cl	c-Pr	CF ₃
I-5	Me	Cl	Me	CF ₃
I-6	Me	Cl	Me	CHF ₂
I-7	H	Me	Me	CHF ₂
I-8	H	Me	c-Pr	CF ₃
I-9	H	Me	c-Pr	CHF ₂
I-10	H	Cl	c-Pr	CF ₃
I-11	H	Cl	c-Pr	CHF ₂
I-12	Me	Cl	c-Pr	CHF ₂
I-13	Me	Me	Me	CF ₃
I-14	Me	Me	Me	CHF ₂
I-15	Me	Me	c-Pr	CF ₃
I-16	Me	Me	c-Pr	CHF ₂

- Особенное предпочтение отдают соединениям с I-1 по I-5:

№	R	X	R'	Z
I-1	H	Cl	Me	CF ₃
I-2	H	Cl	Me	CHF ₂
I-3	H	Me	Me	CF ₃
I-4	Me	Cl	c-Pr	CF ₃
I-5	Me	Cl	Me	CF ₃

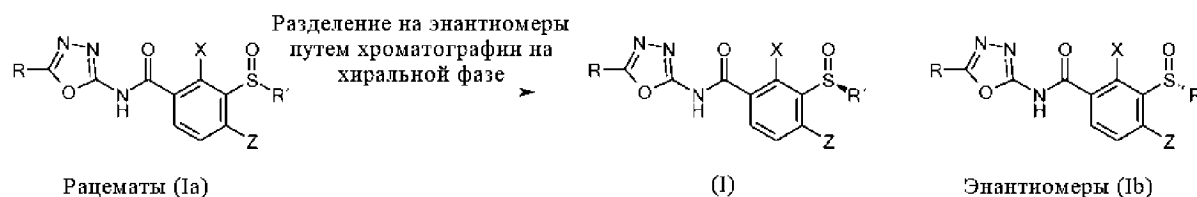
Наибольшее предпочтение отдают соединениям I-4 и I-5:

№	R	X	R'	Z
I-4	Me	Cl	c-Pr	CF ₃
I-5	Me	Cl	Me	CF ₃

Во всех указанных далее формулах заместители и символы имеют такое же значение, как описано в формуле (I), если нет иного определения.

Соединения общей формулы (I) согласно изобретению получают, например, путем хроматографического разделения на энантиомеры рацемических N-(1,3,4-оксадиазол-2-ил)фенилкарбоксамидов (Ia), как указано в Схеме 1.

Схема 1:



Рацемические N-(1,3,4-оксадиазол-2-ил)фенил карбоксамиды (Ia) в принципе известны, и их получают, например, с применением способов, описанных в документах WO 2012/126932 или WO 2018/202535.

Соединения формулы (I) согласно изобретению обладают отличной гербицидной активностью против широкого спектра одно- и двусемядольных однолетних вредных растений, наносящих значительный экономический ущерб.

Таким образом, настоящее изобретение также обеспечивает способ борьбы с нежелательными растениями или регулирования роста растений, предпочтительно в растительных культурах, согласно которому одно или несколько соединений согласно изобретению наносят на растения (например, вредные растения, такие как односемядольные или двусемядольные сорняки или нежелательные культурные растения), семена (например зерно, семена или вегетативные отростки, такие как клубни или побеги с луковицами) или площадь, на которой растут растения (например, культивируемую площадь). Соединения в соответствии с изобретением распространяют, например, перед севом (в соответствующих случаях также путем внесения в почву), перед прорастанием или после прорастания. Конкретные примеры некоторых представителей односемядольных и двусемядольных сорняков, для борьбы с которыми применяют соединения в соответствии с изобретением, представлены ниже, хотя список перечисленных для примера конкретных видов не является ограничивающим.

Односемядольные вредные растения следующих родов: Aegilops, Agropyron, Agrostis, Alopecurus, Apera, Avena, Brachiaria, Bromus, Cenchrus,

Commelina, Cynodon, Cyperus, Dactyloctenium, Digitaria, Echinochloa, Eleocharis, Eleusine, Eragrostis, Eriochloa, Festuca, Fimbristylis, Heteranthera, Imperata, Ischaemum, Leptochloa, Lolium, Monochoria, Panicum, Paspalum, Phalaris, Phleum, Poa, Rottboellia, Sagittaria, Scirpus, Setaria, Sorghum.

5 Двусемядольные сорняки следующих родов: Abutilon, Amaranthus, Ambrosia, Anoda, Anthemis, Aphanes, Artemisia, Atriplex, Bellis, Bidens, Capsella, Carduus, Cassia, Centaurea, Chenopodium, Cirsium, Convolvulus, Datura, Desmodium, Emex, Erysimum, Euphorbia, Galeopsis, Galinsoga, Galium, Hibiscus, Ipomoea, Kochia, Lamium, Lepidium, Lindernia, Matricaria, Mentha, Mercurialis,
10 Mullugo, Myosotis, Papaver, Pharbitis, Plantago, Polygonum, Portulaca, Ranunculus, Raphanus, Rorippa, Rotala, Rumex, Salsola, Senecio, Sesbania, Sida, Sinapis, Solanum, Sonchus, Sphenoclea, Stellaria, Taraxacum, Thlaspi, Trifolium, Urtica, Veronica, Viola, Xanthium.

Нанесение соединений в соответствии с изобретением на поверхность
15 почвы перед прорастанием либо обеспечивает полное предотвращение прорастания семян, либо препятствует росту сорняков до достижения стадии формирования семядолей, а затем рост прекращается.

Если активные ингредиенты наносят после прорастания на зеленые части растений, рост прекращается после обработки, и вредные растения остаются на
20 стадии роста во время нанесения или полностью погибают через некоторое время, поскольку таким образом способность к конкуренции сорняков, вредных для культурных растений, очень рано и надолго устраняется.

Соединения в соответствии с изобретением могут быть селективными в культурах полезных растений, а также могут применяться в качестве гербицидов
25 сплошного действия.

Благодаря их гербицидным и регулирующим рост растений свойствам, активные ингредиенты также применимы для борьбы с вредными растениями в культурах генетически модифицированных растений, которые уже известны или еще только ожидают разработки. В целом трансгенные растения
30 характеризуются конкретными благоприятными свойствами, например резистентностью к некоторым активным ингредиентам, применяемым в сельском хозяйстве, в частности, некоторым гербицидам, устойчивостью к болезням растений или патогенам болезней растений, таким как некоторые насекомые или микроорганизмы, такие как грибки, бактерии или вирусы. Другие

конкретные характеристики касаются, например, собранного материала в отношении количества, качества, стабильности при хранении, состава и конкретных составляющих. Например, известны трансгенные растения с повышенным содержанием крахмала или измененным качеством крахмала, или с измененным составом жирных кислот в собранном материале. Кроме того, конкретные свойства состоят в переносимости или резистентности к факторам абиотического стресса, например, жаре, холоду, засухе, засоленности и ультрафиолетовому излучению.

Предпочтение отдают применению соединений формулы (I) согласно изобретению для экономически важных трансгенных культур полезных и декоративных растений.

Соединения формулы (I) применяют в качестве гербицидов в культурах полезных растений с природной или приобретенной в результате генной инженерии резистентностью к фитотоксическому воздействию гербицидов.

Традиционные способы получения новых растений, которые обладают модифицированными свойствами по сравнению с существующими растениями, состоят, например, в традиционных способах культивирования и генерирования мутантов. В альтернативном варианте новые растения с измененными свойствами получают при помощи рекомбинантных способов (см., например, документы EP 0221044, EP 0131624). Например, было описано несколько случаев генетических модификаций культурных растений с целью модифицирования крахмала, синтезируемого в растениях (например, документы WO 92/011376 A, WO 92/014827 A, WO 91/019806 A), трансгенных культурных растений, которые резистентны к некоторым гербицидам глюфосинатного типа (ср., например, документы EP 0242236 A, EP 0242246 A) или глифосатного типа (документ WO 92/000377 A) или сульфонилмочевинного типа (документы EP 0257993 A, US 5,013,659) или к комбинациям или смесям этих гербицидов через “пакетирование генов”, таких как трансгенные культурные растения, например, кукуруза или соя под торговым названием или обозначением Optimum™ GATM (устойчивые к глифосату ALS).

- трансгенные культурные растения, например хлопок, способные продуцировать токсины *Bacillus thuringiensis* (Bt-токсины), что делает растения резистентными к конкретным вредителям (документы EP 0142924 A, EP 0193259 A),

- трансгенные культурные растения, имеющие модифицированный состав жирных кислот (документ WO 91/013972 A),
- генетически модифицированные культурные растения, имеющие новые составляющие или вторичные метаболиты, например, новые фитоалексины, вызывающие повышение резистентности к болезням (документы ЕР 0309862 А, ЕР 0464461 А),
- генетически модифицированные растения, имеющие сниженную фотореспирацию, которые обладают повышенной урожайностью и повышенной устойчивостью к стрессу (документ ЕР 0305398 А),
- трансгенные культурные растения, продуцирующие фармацевтически или диагностически важные белки (молекулярный "фарминг"),
- трансгенные культурные растения, характеризующиеся повышенной урожайностью или улучшенным качеством,
- трансгенные культурные растения, отличающиеся комбинацией, например, вышеупомянутых новых свойств ("пакетирование генов").

Многочисленные технологии молекулярной биологии, применяемые для производства новых трансгенных растений с модифицированными свойствами, в принципе, известны; см., например, I. Potrykus and G. Spangenberg (eds), *Gene Transfer to Plants*, Springer Lab Manual (1995), Springer Verlag Berlin, Heidelberg, или Christou, "Trends in Plant Science" 1 (1996) 423 - 431).

Для таких генетических манипуляций в плазмиды путем рекомбинации последовательностей ДНК вводят молекулы нуклеиновых кислот, позволяющие осуществлять мутагенез или изменение последовательности. С применением стандартных способов возможны, например, замены оснований, удаление части последовательностей или добавление природных или синтетических последовательностей. Для соединения фрагментов ДНК друг с другом существует возможность добавления к фрагментам адаптеров или линкеров; см., например, Sambrook et al., 1989, *Molecular Cloning, A Laboratory Manual*, 2nd ed., Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY; или Winnacker "Gene und Klone" [Genes and Clones], VCH Weinheim, 2nd edition, 1996.

Например, генерирования растительных клеток со сниженной активностью генного продукта достигают путем экспрессии по меньшей мере одной соответствующей антисмысловой РНК, смысловой РНК для достижения эффекта косупрессии, или путем экспрессии по меньшей мере одного соответствующим

образом построенного рибозима, специфически расщепляющего транскрипты вышеупомянутого генного продукта. Для этого в первую очередь существует возможность использования молекул ДНК, включающих полную кодирующую последовательность генного продукта, включая любые фланкирующие последовательности, которые могут присутствовать, а также молекулы ДНК, которые включают только части кодирующей последовательности, и в этом случае необходимо, чтобы эти части имели достаточную длину для антисмыслового влияния в клетках. Также возможно использование последовательностей ДНК, имеющих высокую степень гомологии с кодирующими последовательностями генного продукта, но не являются полностью идентичными им.

При экспрессии молекул нуклеиновых кислот в растениях синтезированный белок может быть локализован в любом нужном компартменте растительной клетки. Однако для достижения локализации в конкретном компартменте существует возможность, например, соединения кодирующей области с последовательностями ДНК, обеспечивающими локализацию в конкретном компартмент. Такие последовательности известны специалистам в данной области (см., например, Braun et al., EMBO J. 11 (1992), 3219 - 3227; Wolter et al., Proc. Natl. Acad. Sci. USA 85 (1988), 846 - 850; Sonnewald et al., Plant J. 1 (1991), 95 - 106). Молекулы нуклеиновых кислот также могут быть экспрессированы в органеллах растительных клеток.

Клетки трансгенных растений могут быть регенерированы с применением известных технологий для получения целых растений. В принципе, трансгенными растениями могут быть растения любого нужного вида растений, то есть, не обязательно только односемядольными, но и двусемядольными растениями. Таким способом получают трансгенные растения, обладающие свойствами, измененными путем сверхэкспрессии, подавления или ингибирования гомологичных (= природных) генов или генных последовательностей или экспрессии гетерологичных (= чужеродных) генов или генных последовательностей.

Соединения (I) согласно изобретению предпочтительно применяют в трансгенных культурах, которые резистентны к регуляторам роста, например 2,4-D, дикамбе, или к гербицидам, которые ингибируют незаменимые растительные ферменты, например ацетолактатсинтазы (ALS), EPSP-синтазы,

глутаминсинтазы (GS) или гидроксифенилпируватдиоксигеназы (HPPD), или к гербицидам из группы сульфонилмочевин, глифосатов, глюфосинатов или бензоилизоксазолов и аналогичных активных ингредиентов, или к любым нужным комбинациям этих активных ингредиентов.

5 Соединения в соответствии с изобретением особенно предпочтительно применяют с трансгенными культурными растениями, которые резистентны к комбинации глифосатов и глюфосинатов, глифосатов и сульфонилмочевин или имидазолинов. Наиболее предпочтительно соединения в соответствии с изобретением применяют в трансгенных культурных растениях, таких как, 10 например, кукуруза или соя под торговым названием или обозначением Optimum™ GAT™ (устойчивые к глифосату ALS).

При применении активных ингредиентов согласно изобретению в трансгенных культурах имеет место не только воздействие на вредные растения, наблюдаемые в других культурах, но часто также воздействие, специфичное к 15 применению в конкретной трансгенной культуре например, измененный или специфически расширенный спектр контролируемых сорняков, измененная применяемая норма внесения, предпочтительно улучшенная сочетаемость с гербицидами, к которым резистентна трансгенная культура, и влияние на рост и урожайность трансгенных культурных растений.

20 Таким образом, изобретение также касается применения соединений формулы (I) согласно изобретению в качестве гербицидов для борьбы с вредными растениями в трансгенных культурных растениях.

Соединения в соответствии с изобретением применяют в форме смачиваемых порошков, эмульгируемых концентратов, распыляемых растворов, 25 напыляемых продуктов или гранул в традиционных композициях. Таким образом, изобретение также обеспечивает гербицидные и регулирующие рост растений композиции, которые включают соединения в соответствии с изобретением.

Соединения в соответствии с изобретением рецепируют разными 30 способами в соответствии с необходимыми биологическими и/или физико-химическими параметрами. К возможным композициям относятся, например: смачиваемые порошки (WP), водорастворимые порошки (SP), водорастворимые концентраты, эмульгируемые концентраты (EC), эмульсии (EW), такие как эмульсии типа масло в воде и вода в масле, распыляемые растворы, концентраты

суспензий (SC), дисперсии на масляной или водной основе, смешивающиеся с маслом растворы, капсульные суспензии (CS), напыляемые продукты (DP), удобрения, гранулы для разбрасывания и внесения в почву, гранулы (GR) в форме микрогранул, распыляемых гранул, гранулы для абсорбции и адсорбции, вододиспергируемые гранулы (WG), водорастворимые гранулы (SG), композиции ULV, микрокапсулы и воски. Эти отдельные типы композиций в принципе известны и описаны, например, в публикациях: Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie" [Chemical Technology], Volume 7, C. Hanser Verlag Munich, 4th Ed. 1986, Wade van Valkenburg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker, N.Y., 1973, K. Martens, "Spray Drying" Handbook, 3rd Ed. 1979, G. Goodwin Ltd. London.

Необходимые для рецептуры вспомогательные вещества, такие как инертные материалы, поверхностно-активные вещества, растворители и другие добавки, также известны и описаны, например, в публикациях: Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2nd ed., Darland Books, Caldwell N.J., H.v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry", 2nd ed., J. Wiley & Sons, N.Y., C. Marsden, "Solvents Guide", 2nd ed., Interscience, N.Y. 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., N.Y. 1964, Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte" [Interface-active Ethylene Oxide Adducts], Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976, Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Volume 7, C. Hanser Verlag Munich, 4th ed. 1986.

На основе этих композиций также возможно производство комбинаций с другими активными ингредиентами, например, инсектицидами, акарицидами, гербицидами, фунгицидами, а также с антидотами, удобрениями и/или регуляторами роста, например, в форме готовой композиции или баковой смеси.

Смачиваемые порошки представляют собой композиции, равномерно диспергируемые в воде, которые, в дополнение к активному ингредиенту и помимо разбавителя или инертного вещества, также включают поверхностно-активные вещества ионного с и/или неионного типа (смачивающий агент, диспергатор), например, полиэтоксилированные алкилфенолы, полиэтоксилированные жирные спирты, полиэтоксилированные жирные амины, сульфаты полигликолевых эфиров жирных спиртов, алкансульфонаты,

алкилбензолсульфонаты, лигносульфонат натрия, 2,2'-динафтилметан-6,6'-дисульфонат натрия, дибутилнафталинсульфонат натрия или другой олеоилметилтаурат натрия. Для изготовления смачиваемых порошков активные гербицидные ингредиенты тонко измельчают, например, в традиционных устройствах, таких как молотковые мельницы, воздуходувные мельницы и воздухоструйные мельницы, одновременно или последовательно смешивают с дополнительными компонентами для рецептирования.

Эмульгируемые концентраты изготавливают путем растворения активного ингредиента в органическом растворителе, например, бутаноле, циклогексаноне, диметилформамиде, ксилоле или других относительно высококипящих ароматических соединениях или углеводородах или смесях органических растворителей с добавлением одного или нескольких ионных и/или неионных поверхностно-активных веществ (эмульгаторов). Примерами приемлемых для применения эмульгаторов являются: алкиларилсульфонатные соли кальция, такие как додецилбензолсульфонат кальция, или неионные эмульгаторы, такие как полигликолевые сложные эфиры жирных кислот, алкиларилполигликолевые эфиры, полигликолевые эфиры жирных спиртов, продукты конденсации пропиленоксида / этиленоксида, алкилполиэфиры, сложные эфиры сорбита, например, сложные эфиры сорбита и жирных кислот или сложные эфиры сорбита и полиоксиэтилена, например, сложные эфиры полиоксиэтиленсорбита и жирной кислоты.

Напыляемые продукты получают путем перемалывания активного ингредиента с тонкоизмельченными твердыми веществами, например, тальком, природными глинами, такими как каолин, бентонит и пирофиллит, или диатомитом.

Концентраты суспензий могут быть на водной или масляной основе. Их изготавливают, например, путем мокрого размолла при помощи коммерческих шаровых мельниц и необязательного добавления поверхностно-активных веществ, как было перечислено выше, например, для других типов композиций.

Эмульсии, например, эмульсии типа масло в воде (EW), изготавливают, например, при помощи мешалок, коллоидных мельниц и/или статических смесителей, используя водные органические растворители и, необязательно, поверхностно-активные вещества, как уже было перечислено выше, например, для других типов композиций.

Гранулы изготавливают либо путем напыления активного ингредиента на гранулированный инертный материал, способный к адсорбции, или путем нанесения концентратов активного ингредиента на поверхность веществ-носителей, таких как песок, каолиниты или гранулированный инертный материал, при помощи адгезивов, например, поливинилового спирта, полиакрилата натрия или других минеральных масел. Подходящие активные ингредиенты также могут быть гранулированы с применением традиционного для производства гранулированных удобрений способа, в случае необходимости – в виде смеси с удобрениями.

Вододиспергируемые гранулы изготавливают в целом с применением традиционных процессов, таких как сушка распылением, грануляция в псевдооживленном слое, грануляция на сушильной сковороде, смешивание при помощи высокоскоростных смесителей и экструзия без твердого инертного материала.

Процессы производства гранул на сушильной сковороде, в псевдооживленном слое, путем экструзии и распыления описаны, например, в публикациях "Spray-Drying Handbook" 3rd ed. 1979, G. Goodwin Ltd., London, J.E. Browning, "Agglomeration", Chemical and Engineering 1967, pages 147 ff.; "Perry's Chemical Engineer's Handbook", 5th Ed., McGraw-Hill, New York 1973, pp. 8 - 57.

Другие детали, касающиеся рецептирования композиций для защиты растений, описаны, например, в публикациях G.C. Klingman, "Weed Control as a Science", John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pages 81 - 96 and J.D. Freyer, S.A. Evans, "Weed Control Handbook", 5th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, pages 101 - 103.

Агрохимические композиции в целом содержат от 0,1 % до 99 % по массе, в частности, от 0,1 % до 95 % по массе, соединений в соответствии с изобретением. В смачиваемых порошках концентрация активного ингредиента составляет, например, приблизительно от 10 % до 90 % по массе, а остальная часть до 100 % по массе состоит из традиционных составляющих композиции. В эмульгируемых концентратах концентрация активного ингредиента может составлять приблизительно от 1 % до 90 %, предпочтительно от 5 % до 80 % по массе. Композиции в форме дустов включают от 1 % до 30 % по массе активного ингредиента, предпочтительно от 5 % до 20 % по массе активного ингредиента; распыляемые растворы содержат приблизительно от 0,05 % до 80 % по массе,

предпочтительно от 2 % до 50 % по массе активного ингредиента. В случае вододиспергируемых гранул содержание активного ингредиента частично зависит от того, присутствует ли активный ингредиент в жидкой или твердой форме, и от того, какие используют вспомогательные вещества для грануляции, наполнители и т. п. В вододиспергируемых гранулах содержание активного ингредиента составляет, например, от 1 % до 95 % по массе, предпочтительно от 10 % до 80 % по массе.

Кроме того, упомянутые композиции активного ингредиента необязательно включают соответствующие традиционные клейкие вещества, смачивающие вещества, диспергаторы, эмульгаторы, проникающие агенты, консерванты, морозостойкие добавки и растворители, наполнители, носители и красители, противовспенивающие агенты, ингибиторы испарения и агенты, влияющие на уровень pH и вязкость.

На основе этих композиций также возможно изготовление комбинаций с другими пестицидно-активными веществами, например инсектицидами, акарицидами, гербицидами, фунгицидами, а также с антидотами, удобрениями и/или регуляторами роста, например, в форме готовой композиции или баковой смеси.

Для применения композиции в коммерчески реализуемой форме, в соответствующих случаях, растворяют традиционным способом, например, в случае смачиваемых порошков, эмульгируемых концентратов, дисперсий и вододиспергируемых гранул с водой. Композиции дустового типа, гранулы для внесения в почву или гранулы для разбрасывания и распыляемые растворы перед применением обычно дополнительно не растворяют другими инертными веществами.

Требуемая норма внесения соединений формулы (I) колеблется в зависимости от внешних условий, включая, помимо прочего, температуру, влажность и тип применяемого гербицида. Она может колебаться в широких пределах, например, от 0,001 до 10,0 кг/га или более активного вещества, но предпочтительно от 0,005 до 5 кг/га, более предпочтительно в диапазоне от 0,01 до 1,5 кг/га, более предпочтительно в диапазоне от 0,05 до 1 кг/га. Это касается применения как до прорастания, так и после прорастания.

Носитель представляет собой природное или синтетическое, органическое или неорганическое вещество, с которым активные ингредиенты смешивают или

комбинируют для улучшенной применимости, в частности, для нанесения на растения или части растений или семена. Носитель, который может быть твердым или жидким, в целом является инертным и должен быть подходящим для применения в сельском хозяйстве.

5 Подходящими для применения твердыми или жидкими носителями являются: например, соли аммония и природные минеральные порошки, такие как каолины, глины, тальк, мел, кварц, аттапульгит, монтмориллонит или диатомит, и синтетические минеральные порошки, такие как мелкодисперсный кремнезем, глинозем и природные или синтетические силикаты, смолы, воски,
10 твердые удобрения, вода, спирты, в частности, бутанол, органические растворители, минеральные и растительные масла и их производные. Также возможно применение смесей таких носителей. Применимыми твердыми носителями для гранул являются: например, измельченные и фракционированные природные горные породы, такие как кальцит, мрамор,
15 пемза, сепиолит, доломит, и синтетические гранулы неорганических и органических порошков, а также гранулы органического материала, такого как опилки, кокосовая шелуха, стержни кукурузных початков и черешки табачных листьев.

 Подходящими сжиженными газообразными агентами для снижения
20 удельного веса или носителями являются жидкости, газообразные при стандартной температуре и при атмосферном давлении, например, аэрозольные вытеснители, такие как галогенизированные углеводороды, а также бутан, пропан, азот и диоксид углерода.

 При рецептировании возможно применение агентов, придающих липкость, таких как карбоксиметилцеллюлоза, природные и синтетические полимеры в
25 форме порошков, гранул или латексов, таких как гуммиарабик, поливиниловый спирт и поливинилацетат, или природных фосфолипидов, таких как цефалины и лецитины, и синтетических фосфолипидов. Другими добавками могут быть минеральные и растительные масла.

30 Если в качестве агент для снижения удельного веса применяют воду, также возможно применение, например, органических растворителей в качестве дополнительных растворителей. Применимыми жидкими растворителями главным образом являются: ароматические соединения, такие как ксилол, толуол или алкилнафталины, хлорированные ароматические соединения или

хлорированные алифатические углеводороды, такие как хлорбензолы, хлорэтилены или дихлорметан, алифатические углеводороды, такие как циклогексан или парафины, например фракции минеральных масел, минеральные и растительные масла, спирты, такие как бутанол или гликоль, и их эфиры и сложные эфиры, кетоны, такие как ацетон, метилэтилкетон, метилизобутилкетон или циклогексанон, сильнополярные растворители, такие как диметилформамид и диметилсульфоксид, а также вода.

Композиции согласно изобретению дополнительно могут включать другие компоненты, например, поверхностно-активные вещества. Подходящими для применения поверхностно-активными веществами являются эмульгаторы и/или пенообразователи, диспергаторы или смачивающие агенты, имеющие ионные или неионные свойства, или смеси этих поверхностно-активных веществ. Их примерами являются соли полиакриловой кислоты, соли лигносульфоновой кислоты, соли фенолсульфоновой кислоты или нафталинсульфоновой кислоты, поликонденсаты этиленоксида с жирными спиртами или с жирными кислотами или с жирными аминами, замещенные фенолы (предпочтительно алкилфенолы или арилфенолы), соли сложных эфиров сульфоянтарной кислоты, производные таурина (предпочтительно алкилтаураты), фосфорные сложные эфиры полиэтиоксилированных спиртов или фенолов, сложные эфиры жирных кислот с полиолами и производные соединений, содержащих сульфаты, сульфонаты и фосфаты, например алкиларилполигликолевые эфиры, алкилсульфонаты, алкилсульфаты, арилсульфонаты, гидролизаты белков, лигносульфитные отработанные растворы и метилцеллюлоза. Присутствие поверхностно-активного вещества необходимо, если один из активных ингредиентов и/или один из инертных носителей является нерастворимым в воде, и нанесение осуществляют в воде. пропорция поверхностно-активных веществ составляет от 5 до 40 процентов по массе композиции согласно изобретению. Возможно применение красителей, таких как неорганические пигменты, например, оксид железа, оксид титана и берлинская лазурь, и органических красителей, таких как ализариновые красители, азокрасители и металлофталоцианины, и микроудобрений, таких как соли железа, марганца, бора, меди, кобальта, молибдена и цинка.

В соответствующих случаях возможно присутствие и других дополнительных компонентов, например, защитных коллоидов, связующих

веществ, адгезивов, загустителей, тиксотропных веществ, проникающих агентов, стабилизаторов, многовалентных хелатирующих веществ, комплексообразователей. В целом активные ингредиенты комбинируют с любыми твердыми или жидкими добавками, традиционно применяемыми с

5 целью рецептирования. В целом композиции и рецептуры согласно изобретению содержат от 0,05 % до 99 % по массе, от 0,01 % до 98 % по массе, предпочтительно от 0,1 % до 95 % по массе, более предпочтительно от 0,5 % до 90 %, активного ингредиента, наиболее предпочтительно – от 10 до 70

10 процентов по массе. Активные ингредиенты или композиции согласно изобретению применяют сами по себе или, в зависимости от их соответствующих физических и/или химических свойств, в форме их композиций или приготовленных из них форм применения, таких как аэрозоли, капсульные суспензии, распыляемые в виде холодного тумана концентраты,

15 распыляемые в виде теплого тумана концентраты, инкапсулированные гранулы, тонкие гранулы, текучие концентраты для обработки семян, готовые к применению растворы, распыляемые в виде дустов порошки, эмульгируемые концентраты, эмульсии типа масло в воде, эмульсии типа вода в масле, макрогранулы, микрогранулы, диспергируемые в масле порошки,

20 смешивающиеся с маслом текучие концентраты, смешивающиеся с маслом жидкости, пены, пасты, покрытые пестицидами семена, концентраты суспензий, концентраты суспоземulsion, растворимые концентраты, суспензии, распыляемые порошки, растворимые порошки, дусты и гранулы, водорастворимые гранулы или таблетки, водорастворимые порошки для

25 обработки семян, смачиваемые порошки, природные продукты и синтетические вещества, пропитанные активным ингредиентом, а также микроинкапсуляции в полимерные вещества и в материалы покрытия семян, а также распыляемые в виде холодного тумана и распыляемые в виде теплого тумана композиции ULV.

Упомянутые композиции изготавливают известными способами, например, путем смешивания активных ингредиентов с по меньшей мере одним

30 традиционным агентом для снижения удельного веса, растворителем или разбавителем, эмульгатором, диспергатором и/или связующим веществом или фиксатором, смачивающим агентом, водоотталкивающим веществом, необязательно сиккативом и УФ-стабилизаторами и необязательно красителями и пигментами, противовспенивающими агентами, консервантами, вторичными

загустителями, агентами, придающими липкость, гиббереллинами и другими вспомогательными веществами для обработки.

Композиции согласно изобретению включают не только рецептуры, уже готовые к применению, которые поддаются нанесению при помощи
5 соответствующего устройства на растение или семена, но и реализуемые на рынке концентраты, подлежащие перед применением разведению водой.

Активные ингредиенты согласно изобретению могут присутствовать как таковые или в их рецептурах (согласно коммерческим стандартам), или же в формах применения, приготовленных из этих рецептур в форме смеси с другими
10 (известными) активными ингредиентами, такими как инсектициды, аттрактанты, стерилизаторы, бактерициды, акарициды, нематициды, фунгициды, регуляторы роста, гербициды, удобрения, антитоксиканты или химические сигнальные вещества.

Обработку растений и частей растений активными ингредиентами или композициями в соответствии с изобретением выполняют непосредственно или
15 путем воздействия на их окружение, естественную среду или складское пространство с применением традиционных способов обработки, например, путем погружения, опрыскивания, напыления, орошения, испарения, опыления, мелкокапельного опрыскивания, разбрасывания, покрытия пеной, нанесения кистью, распространения по поверхности, полива (пропитывания), капельного
20 орошения и, в случае материала для размножения, в особенности в случае семян, также путем обработки семян, влажной обработки семян, обработки суспензией, инкрустации, покрытия одним или несколькими составами и т. п. Также возможно распространение активных ингредиентов с применением способа внесения в сверхмалом объеме или впрыскивания композиции активного
25 ингредиента или самого активного ингредиента в почву.

Одним из преимуществ настоящего изобретения является то, что конкретные системные свойства активных ингредиентов согласно изобретению и композиций означают, что обработка семян этими активными ингредиентами и композициями защищает не только сами семена, но и получаемые в результате
30 прорастания растения от фитопатогенных грибов. Таким образом, отпадает необходимость в непосредственной обработке культуры во время сева или вскоре после него.

Также преимуществом считается то, что активные ингредиенты или композиции согласно изобретению конкретно могут применяться для

трансгенных семян, и в этом случае растение, выращиваемое из этих семян, способно экспрессировать белок, действующий против вредителей. Обработка таких семян активными ингредиентами или композициями согласно изобретению только путем экспрессии белка, например, инсектицидного белка, в результате способна обеспечивать борьбу с конкретными вредителями. В этом случае неожиданно была обнаружена возможность дополнительного синергетического эффекта, что дополнительно повышает эффективность защиты от вредителей.

Композиции согласно изобретению являются подходящими для защиты семян любого сорта растений, применяемого в сельском хозяйстве, в тепличном хозяйстве, в лесоводстве, в садоводстве и виноградарстве. Это, в частности, семена злаков (таких как пшеница, ячмень, рожь, тритикале, сорго/просо и овес), кукуруза, хлопок, соя, рис, картофель, подсолнечник, фасоль, кофе, свекла (например, сахарная свекла и кормовая свекла), арахис, масличный рапс, мак, оливки, кокос, какао, сахарный тростник, табак, овощи (такие как томаты, огурцы, лук и салат), дерновые травы и декоративные растения (см. также ниже). Особенно важна обработка семян злаков (таких как пшеница, ячмень, рожь, тритикале и овес), кукуруза и рис.

Также, как описано ниже, обработка трансгенных семян активными ингредиентами или композициями согласно изобретению имеет особое значение. Это касается семян растений, содержащих по меньшей мере один гетерологичный ген, который обеспечивает возможность экспрессии полипептида или белка, обладающего инсектицидными свойствами. Гетерологичный ген в трансгенных семенах может быть взят, например, из микроорганизмов видов *Bacillus*, *Rhizobium*, *Pseudomonas*, *Serratia*, *Trichoderma*, *Clavibacter*, *Glomus* или *Gliocladium*. Этот гетерологичный ген предпочтительно взят из видов *Bacillus* sp., и в этом случае генный продукт эффективен против мотылька кукурузного и/или западного кукурузного жука. Гетерологичный ген более предпочтительно взят из *Bacillus thuringiensis*.

В контексте настоящего изобретения композицию согласно изобретению наносят на семена отдельно или в подходящей рецептуре. Предпочтительно семена обрабатывают в состоянии, в котором они достаточно устойчивы для того, чтобы не подвергаться повреждению во процессе обработки. В целом семена могут быть обработаны в любое время между сбором и севом. Как

правило, используют семена, отделенные от растения и освобожденные от початков, скорлупы, стеблей, кожуры, рылец или мякоти плодов. Например, возможно использование семян, которые были собраны, очищены и высушены до влагосодержания менее 15 % по массе. В альтернативном варианте также
5 возможно использование семян, которые после сушки, например, были обработаны водой, а затем вновь высушены.

В целом при обработке семян следует гарантировать, чтобы количество композиции согласно изобретению и/или других добавок, наносимых на семена, было выбрано таким образом, чтобы это не препятствовало прорастанию семян,
10 и чтобы вырастающие из них растения не подвергались повреждению. Особенно это должно быть гарантировано в случае, когда активные ингредиенты, могут демонстрировать фитотоксический эффект при определенных нормах внесения.

Композиции согласно изобретению наносят непосредственно, т. е., без содержания каких бы то ни было других компонентов и без разведения. В целом
15 предпочтение отдают нанесению композиций на семена в форме подходящей рецептуры. Подходящие рецептуры и способы обработки семян известны специалистам в данной области и описаны, например, в следующих документах: US 4,272,417 A, US 4,245,432 A, US 4,808,430, US 5,876,739, US 2003/0176428 A1, WO 2002/080675 A1, WO 2002/028186 A2.

20 Активные ингредиенты, применимые в соответствии с изобретением, рецептируют в традиционные композиции для протравки семян, такие как растворы, эмульсии, суспензии, порошки, пены, гидросмеси или другие композиции для семян, а также композиции ULV.

Эти композиции изготавливают известным способом путем смешивания
25 активных ингредиентов с традиционными добавками, например, традиционными агентами для снижения удельного веса и растворителями или разбавителями, красителями, смачивающими агентами, диспергаторами, эмульгаторами, противовспенивающими агентами, консервантами, вторичными загустителями, адгезивами, гиббереллинами, а также водой.

30 Красителями, присутствующими в композициях для протравки семян, применимыми в соответствии с изобретением, являются все красители, традиционно используемые с этими целями. Возможно применение пигментов, умеренно растворимых в воде, или красителей, растворимых в воде. Примерами

являются красители, известные под названиями Rhodamine B, C.I. Pigment Red 112 и C.I. Solvent Red 1.

Подходящими для применения смачивающими агентами, которые могут присутствовать в композиции для протравки семян, применимыми в соответствии с изобретением, являются все вещества, способствующие смачиванию, которые традиционно применяют для рецептирования агрохимически активных ингредиентов. Предпочтение отдают применению алкилнафталинсульфонатов, таких как диизопропил- или диизобутилнафталинсульфонаты.

Подходящими диспергаторами и/или эмульгаторами, которые могут присутствовать в композициях для протравки семян, применимых в соответствии с изобретением, являются все неионные, анионные и катионные диспергаторы, традиционные для рецептирования агрохимически активных ингредиентов. Предпочтение отдают применению неионных или анионных диспергаторов или смесей неионных или анионных диспергаторов. Особенно подходящими неионными диспергаторами являются блок-полимеры этиленоксида / пропиленоксида, алкилфенол-полигликолевые эфиры и тристририлфенол-полигликолевые эфиры и их фосфатные или сульфатные производные. Особенно подходящими анионными диспергаторами являются лигносульфонаты, соли полиакриловой кислоты и конденсаты арилсульфоната-формальдегида.

Противовспенивающими агентами, присутствующими в композициях для протравки семян, применимыми в соответствии с изобретением, являются все подавляющие пенообразование вещества, традиционные для рецептирования агрохимически активных ингредиентов. Предпочтение отдают применению силиконовых противовспенивающих агентов и стеарата магния.

Консервантами, присутствующими в композиции для протравки семян, применимыми в соответствии с изобретением, являются все вещества, используемые с этими целями в агрохимических композициях. Примерами являются дихлорофен и полуформаль бензилового спирта.

Вторичными загустителями, присутствующими в композициях для протравки семян, применимыми в соответствии с изобретением, являются все вещества, используемые с этими целями в агрохимических композициях. Предпочтительными примерами являются производные целлюлозы,

производные акриловой кислоты, ксантан, модифицированные глины и мелкодисперсный кремнезем.

5 Подходящими для применения клейкими веществами, присутствующими в композициях для протравки семян, применимыми в соответствии с изобретением, являются все традиционные связующие вещества, используемые в продуктах для протравки семян. Предпочтительными примерами являются поливинилпирролидон, поливинилацетат, поливиниловый спирт и тилоза.

10 Композиции для протравки семян, применимые в соответствии с изобретением, используют либо непосредственно, либо после предварительного растворения в воде, для обработки широкого спектра различных семян, включая семена трансгенных растений. В этом случае дополнительный синергетический эффект также возможен при взаимодействии с веществами, образуемыми путем экспрессии.

15 Для обработки семян композициями для протравки семян, применимыми в соответствии с изобретением, или составами, приготавливаемыми из них путем добавления воды, подходящим для применения оборудованием являются все смесительные устройства традиционно применяемые для протравки семян. В частности, процедура протравки семян состоит в помещении семян в смеситель, добавлении конкретного нужного количества композиций для протравки семян, 20 либо без подготовки, либо после предварительного разведения водой, и их смешивании, пока композиция равномерно не распределится по семенам. В соответствующих случаях, после этого осуществляют операцию сушки.

25 Активные ингредиенты согласно изобретению, при надлежащей совместимости с растениями, благоприятной гомеотермной токсичности и хорошей экологической совместимости, являются подходящими для защиты растений и органов растений, для повышения урожайности и для улучшения качества собранного урожая. Предпочтительно их применяют в качестве агентов для защиты культур. Они активны против видов, чувствительных и резистентных в нормальных условиях, а также против всех конкретных стадий 30 развития.

Представленные ниже примеры поясняют изобретение.

А. Химические примеры

Описание хирального разделения

Соединения в соответствии с изобретением получали путем сепарации при помощи хиральной сверхкритической жидкостной хроматографии (SFC) соответствующих рацематов (Ia). Сепарацию энантиомеров осуществляли с применением устройства Sepiatec SFC 100. Для примера условия для сепарации, ведущей к образованию S-энантиомеров I-1, I-2, I-3, I-4, I-5 и I-6 описаны ниже.

Энантиомерную чистоту отделенных энантиомеров определяли при помощи системы аналитической SFC (Aquity UPC² от Waters). В описанных ниже примерах она указана как энантиомерный избыток (э. и.). Значения оптического вращения определяли на поляриметре от Krüss.

S-конфигурацию соединений I-1 и I-5 подтверждали путем рентгеноструктурного анализа монокристаллов.

15 Приготовление 2-хлор-N-(1,3,4-оксадиазол-2-ил)-3-[(S)-метилсульфинил]-4-(трифторметил)бензамид **I-1**

Используемый рацемат:	2-хлор-N-(1,3,4-оксадиазол-2-ил)-3-[(rac)-метилсульфинил]-4-(трифторметил)бензамид (Ia-1)
Хиральная колонка:	Chiracel OX-H для SFC; 250 x 20 мм; 5 мкм (Chiracel Technologies Europe)
Инъекция:	0,5 мл/инъекцию раствора 850 мг рацемата Ia-1 в 19 мл ацетонитрила
Расход:	80 мл/мин
Элюент:	CO ₂ / MeOH = 85 / 15
Пик:	4,30 – 4,80 мин (S-энантиомер I-1)
Анализ:	S-энантиомер I-1; Колонка SFC: Chiracel OX-3 для SFC от Chiral Technologies Europe (0,3 см x 10 см; 3 мкм) Расход = 2 мл/мин.; CO ₂ / MeOH = 90 / 10 Время удержания: 1,95 мин. 94 % э. и. Оптическое вращение: - 64 ° (MeOH) Абсолютную конфигурацию подтверждали путем рентгеноструктурного анализа монокристаллов. См. Фигуру 1.

Приготовление 2-хлор-N-(1,3,4-оксадиазол-2-ил)-3-[(S)-метилсульфинил]-4-(дифторметил)бензамида **I-2**

Используемый рацемат:	2-хлор-N-(1,3,4-оксадиазол-2-ил)-3-[(rac)-метилсульфинил]-4-(дифторметил)бензамид (Ia-2)
Хиральная колонка:	Lux ^R 5 мкм Amylose 1; 250 x 21,2 мм (Phenomenex)
Инъекция:	0,5 мл/инъекцию раствора 675 мг рацемата Ia-2 в 17 мл ацетонитрила

Расход: 80 мл/мин
 Элюент: $\text{CO}_2 / \text{MeOH} = 75 / 25$
 Пик: 1,80 – 2,80 мин (S-энантиомер I-2)

Анализ: S-энантиомер I-2
 Колонка SFC: Lux Amylose 1 от Phenomenex. (0,3 см x 150 мм; 3 мкм)
 Расход = 2 мл/мин.; $\text{CO}_2 / \text{MeOH} = 90 / 10$
 Время удержания: 1,91 мин
 >99 % э. и.
 Оптическое вращение: -194° (CHCl_3)
 Абсолютную конфигурацию определяли по аналогии с I-1 и I-5.

Приготовление 2-метил-N-(1,3,4-оксадиазол-2-ил)-3-[(S)-метилсульфинил]-4-(трифторметил)бензамида **I-3**

Используемый рацемат: 2-метил-N-(1,3,4-оксадиазол-2-ил)-3-[(rac)-метилсульфинил]-4-(трифторметил)бензамид Ia-3
 Хиральная колонка: Chiracel OX-H для SFC; 250 x 20 мм; 5 мкм (Chiracel Technologies Europe)
 Инъекция: 0,3 мл/инъекцию раствора 1,73 мг рацемата Ia-3 в 35 мл ацетонитрила
 Расход: 80 мл/мин
 Элюент: $\text{CO}_2 / \text{MeOH} = 85 / 15$
 Пик: 4,70 – 5,25 мин (S-энантиомер I-3)

Анализ: S-энантиомер I-3
 Колонка SFC: Chiracel OX-3 для SFC от Chiral Technologies Europe. (0,3 см x 10 см; 3 мкм)
 Расход = 2 мл/мин. ($\text{CO}_2 / \text{MeOH} = 90 / 10$)
 Время удержания: 1,73 мин
 >99 % э. и.
 Оптическое вращение: -86° (MeOH)
 Абсолютную конфигурацию определяли по аналогии с I-1 и I-5.

5 Приготовление 2-хлор-N-(5-метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил)-3-[(S)-циклопропилсульфинил]-4-(трифторметил)бензамида **I-4**

Используемый рацемат: 2-хлор-N-(5-метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил)-3-[(rac)-циклопропилсульфинил]-4-(трифторметил)бензамид Ia-4
 Хиральная колонка: Chiralpak AZH для SFC; 250 x 20 мм; 5 мкм (Chiracel Technologies Europe)
 Инъекция: 0,5 мл/инъекцию раствора 139 мг рацемата Ia-4 в 5 мл ацетонитрила
 Расход: 80 мл/мин
 Элюент: $\text{CO}_2 / \text{MeOH} = 85 / 15$
 Пик: 10,00 – 13,50 мин (S-энантиомер I-4)

Анализ: S-энантиомер I-4
 Колонка SFC: Chiracel AZ-3 для SFC от Chiral Technologies Europe (0,3 см x 10 см; 3 мкм)
 Расход = 2 мл/мин. ($\text{CO}_2 / \text{MeOH} = 90 / 10$)
 Время удержания: 2,22 мин.

>99 % э. и.

Оптическое вращение: - 43 ° (CHCl₃)

Абсолютную конфигурацию определяли по аналогии с I-1 и I-5.

Приготовление 2-хлор-N-(5-метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил)-3-[(S)-метилсульфинил]-4-(трифторметил)бензамида **I-5**

Используемый рацемат: 2-хлор-N-(5-метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил)-3-[(rac)-метилсульфинил]-4-(трифторметил)бензамид 1a-5
 Хиральная колонка: Lux^R 5 мкм Amylose-1; 250 x 21,2 мин (Phenomenex)
 Инъекция: 0,6 мл/инъекцию раствора 100 мг рацемата 1a-5 в 2 мл метанола
 Расход: 80 мл/мин
 Элюент: CO₂ / MeOH = 90 / 10
 Пик: 4,60 – 6,37 мин (S-энантиомер I-5)

Анализ: S-энантиомер I-5
 Колонка SFC: Chiracel OX-3 для SFC от Chiral Technologies Europe (0,3 см x 10 см; 3 мкм)
 Расход = 2 мл/мин. (CO₂ / MeOH = 90 / 10)
 Время удержания: 1,79 мин
 >99 % э. и.
 Оптическое вращение: - 69 ° (MeOH)
 Абсолютную конфигурацию подтверждали путем рентгеноструктурного анализа монокристаллов. См. Фигуру 2.

5 Приготовление 2-хлор-N-(5-метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил)-3-[(S)-метилсульфинил]-4-(дифторметил)бензамида **I-6**

Используемый рацемат: 2-хлор-N-(5-метил-1,3,4-оксадиазол-2-ил)-3-[(rac)-метилсульфинил]-4-(дифторметил)бензамид 1a-6
 Хиральная колонка: Chiracel OX-H для SFC; 250 x 20 мм; 5 мкм (Chiracel Technologies Europe)
 Инъекция: 0,5 мл/инъекцию раствора 730 мг рацемата 1a-6 в 18 мл ацетонитрила
 Расход: 80 мл/мин
 Элюент: CO₂ / MeOH = 80 / 20
 Пик: 3,45 – 4,00 мин; S-энантиомер

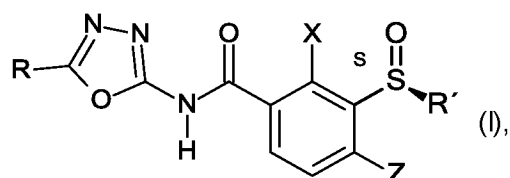
Анализ: S-энантиомер I-6
 Колонка SFC: Chiracel OX-3 для SFC от Chiral Technologies Europe (0,3 см x 10 см; 3 мкм)
 Расход = 2 мл/мин. CO₂ / MeOH = 90 / 10
 Время удержания: 1,83 мин.
 >99 % э. и.
 Оптическое вращение: - 178 ° (CHCl₃)
 Абсолютную конфигурацию определяли по аналогии с I-1 и I-5.

Применяемые сокращения означают:

Me = метил

c-Pr = циклопропил

Таблица 1: Соединения общей формулы (I) согласно изобретению, в которых R, X, Z и R' имеют определение, данное в Таблице 1.



5

№	R	X	R'	Z	Оптическое вращение
I-1	H	Cl	Me	CF ₃	(-)-65 ° (MeOH)
I-2	H	Cl	Me	CHF ₂	(-)-194 ° (CHCl ₃)
I-3	H	Me	Me	CF ₃	(-)-86 ° (MeOH)
I-4	Me	Cl	c-Pr	CF ₃	(-)-43 ° (CHCl ₃)
I-5	Me	Cl	Me	CF ₃	(-)-69 ° (MeOH)
I-6	Me	Cl	Me	CHF ₂	(-)-178 ° (CHCl ₃)

Б. Примеры рецептов

10

а) Продукт для распыления получают путем смешивания 10 массовых частей соединения формулы (I) и/или его соли и 90 массовых частей талька в качестве инертного вещества и измельчения смеси в молотковой мельнице.

15

б) Легко диспергируемый в воде смачиваемый порошок получают путем смешивания 25 массовых частей соединения формулы (I) и/или его соли, 64 массовых частей содержащего каолин кварца в качестве инертного вещества, 10 массовых частей лигносульфоната калия и 1 массовой части олеилметилтаурата натрия в качестве смачивающего агента и диспергатора и измельчения смеси на дезинтеграторе.

20

в) Концентрат легко диспергируемой в воде дисперсии получают путем смешивания 20 массовых частей соединения формулы (I) и/или его соли с 6 массовыми частями алкилфенолполигликолевого эфира (®Triton X 207), 3 массовыми частями изотридеканолполигликолевого эфира (8 EO) и 71 массовой частью парафинового минерального масла (диапазон кипения, например приблизительно от 255 до более 277 °C)

и измельчения смеси в фрикционной шаровой мельнице до степени измельчения менее 5 микрон.

- 5 г) Эмульгируемый концентрат получают из 15 массовых частей соединения формулы (I) и/или его соли, 75 массовых частей циклогексанона в качестве растворителя и 10 массовых частей этоксилированного нонилфенола в качестве эмульгатора.
- 10 д) Вододиспергируемые гранулы получают путем смешивания 75 массовых частей соединения формулы (I) и/или его соли, 10 массовых частей лигносульфоната кальция, 5 массовых частей лаурилсульфата натрия, 3 массовых частей поливинилового спирта и 7 массовых частей каолина, измельчение смеси на дезинтеграторе и гранулирование порошка в псевдооживленном слое путем разбрызгивания воды в качестве гранулирующей жидкости.
- 15 е) Вододиспергируемые гранулы также получают путем гомогенизации и предварительного измельчения в коллоидной мельнице, 25 массовых частей соединения формулы (I) и/или его соли, 5 массовых частей 2,2'-динафтилметан-6,6'-дисульфоната натрия
- 20 2 массовых частей олеилметилтаурата натрия, 1 массовой части поливинилового спирта, 17 массовых частей карбоната кальция и 50 массовых частей воды, С последующим измельчением смеси в шаровой мельнице и тонким распылением полученной в результате суспензии в распылительной колонне при помощи однофазной насадки.
- 25

В. Биологические примеры

Сокращения, применяемые для вредных растений, означают:

ABUTH	<i>Abutilon theophrasti</i>	ALOMY	<i>Alopecurus myosuroides</i>
AVEFA	<i>Avena fatua</i>	AMARE	<i>Amaranthus retroflexus</i>
CYPES	<i>Cyperus esculentus</i>	DIGSA	<i>Digitaria sanguinalis</i>
ECHCG	<i>Echinochloa crus-galli</i>	HORMU	<i>Hordeum murinum</i>
LOLMU	<i>Lolium multiflorum</i>	LOLRI	<i>Lolium rigidum</i>
MATIN	<i>Matricaria inodora</i>	PHBPU	<i>Pharbitis purpurea</i>
POLCO	<i>Polygonum convolvulus</i>	SETVI	<i>Setaria viridis</i>

STEME	Stellaria media	VERPE	Veronica persica
VIOTR	Viola tricolor		
BRSNW	Brassica napus (озимый масличный рапс)	GLXMA	Glycine max (соя)
ORYZA	Oryza sativa (рис)	TRZAS	Triticum aestiva (пшеница мягкая)
ZEAMX	Zea mays (кукуруза)		

1. Довсходовое гербицидное действие против вредных растений

Семена односемядольных и двусемядольных сорняков и культурные растения выкладывают на песчаную суглинистую почву в древесноволокнистых горшках и покрывают почвой. Соединения в соответствии с изобретением, рецептурированные в форме смачиваемых порошков (WP или концентратов эмульсий (EC)), затем наносят на поверхность покрывающей почвы в форме водной суспензии или эмульсии при норме полива, эквивалентной 600 - 800 л/га, с добавлением 0,2 % смачивающего агента. После обработки горшки помещают в теплицу и содержат в надлежащих условиях роста для испытуемых растений. Повреждения испытуемых растений оценивают визуально после трехнедельного периода испытания путем сравнения с необработанными контрольными растениями (гербицидная активность в процентах (%): 100 % активности = растения погибли, 0 % активности = так же, как и контрольные растения).

Многочисленные соединения в соответствии с изобретением продемонстрировали очень хорошее действие против множества растений, наносящих значительный вред. Представленные ниже таблицы в качестве пояснения иллюстрируют послевсходовое гербицидное действие соединений в соответствии с изобретением, с указанием гербицидной активности в процентах.

20

Таблица 1a: Довсходовое действие при 20 г/га против ALOMY в %

№ примера	Доза [г/га]	ALOMY
I-4	20	80

Таблица 1b: Довсходовое действие при 80 г/га против ALOMY в %

№ примера	Доза [г/га]	ALOMY
I-5	80	80
I-1	80	80
I-4	80	100
I-6	80	100
I-2	80	90

Таблица 2а: Довсходовое действие при 20 г/га против AMARE в %

№ примера	Доза [г/га]	AMARE
I-5	20	90
I-1	20	100
I-3	20	100
I-4	20	100
I-6	20	90
I-2	20	100

Таблица 2b: Довсходовое действие при 80 г/га против AMARE в %

№ примера	Доза [г/га]	AMARE
I-5	80	100
I-1	80	100
I-3	80	100
I-4	80	100
I-6	80	100
I-2	80	100

5 Таблица 3: Довсходовое действие при 80 г/га против AVEFA в %

№ примера	Доза [г/га]	AVEFA
I-5	80	80
I-1	80	80
I-4	80	90
I-6	80	100
I-2	80	100

Таблица 4а: Довсходовое действие при 20 г/га против DIGSA в %

№ примера	Доза [г/га]	DIGSA
I-3	20	100
I-4	20	100
I-6	20	100

Таблица 4b: Довсходовое действие при 80 г/га против DIGSA в %

№ примера	Доза [г/га]	DIGSA
I-3	80	100
I-4	80	100
I-6	80	100

10

Таблица 5а: Довсходовое действие при 5 г/га против ECHCG в %

№ примера	Доза [г/га]	ECHCG
I-1	5	90

Таблица 5b: Довсходовое действие при 20 г/га против ECHCG в %

№ примера	Доза [г/га]	ECHCG
I-5	20	100

I-1	20	100
I-3	20	90
I-6	20	90
I-2	20	100

Таблица 5с: Довсходовое действие при 80 г/га против ECHCG в %

№ примера	Доза [г/га]	ECHCG
I-5	80	100
I-1	80	100
I-3	80	100
I-4	80	100
I-6	80	100
I-2	80	100

Таблица 6: Довсходовое действие при 80 г/га против LOLRI в %

№ примера	Доза [г/га]	LOLRI
I-4	80	80
I-2	80	90

5

Таблица 7а: Довсходовое действие при 20 г/га против MATIN в %

№ примера	Доза [г/га]	MATIN
I-5	20	80
I-1	20	100
I-4	20	80
I-6	20	90
I-2	20	100

Таблица 7b: Довсходовое действие при 80 г/га против MATIN в %

№ примера	Доза [г/га]	MATIN
I-5	80	100
I-1	80	100
I-3	80	90
I-4	80	100
I-6	80	90
I-2	80	100

10

Таблица 8: Довсходовое действие при 80 г/га против PHBPU в %

№ примера	Доза [г/га]	PHBPU
I-5	80	100
I-1	80	100

Таблица 9: Довсходовое действие при 80 г/га против POLCO в %

№ примера	Доза [г/га]	POLCO
I-1	80	80
I-4	80	80
I-2	80	90

Таблица 10а: Довсходовое действие при 5 г/га против SETVI в %

№ примера	Доза [г/га]	SETVI
I-5	5	80

Таблица 10b: Довсходовое действие при 20 г/га против SETVI в %

№ примера	Доза [г/га]	SETVI
I-5	20	100
I-1	20	80
I-4	20	100
I-6	20	90
I-2	20	100

5

Таблица 10с: Довсходовое действие при 80 г/га против SETVI в %

№ примера	Доза [г/га]	SETVI
I-5	80	100
I-1	80	100
I-3	80	90
I-4	80	100
I-6	80	100
I-2	80	100

Таблица 11а: Довсходовое действие при 20 г/га против STEME в %

№ примера	Доза [г/га]	STEME
I-3	20	80

10

Таблица 11b: Довсходовое действие при 80 г/га против STEME в %

№ примера	Доза [г/га]	STEME
I-3	80	100

Таблица 12а: Довсходовое действие при 20 г/га против VERPE в %

№ примера	Доза [г/га]	VERPE
I-5	20	80
I-6	20	90
I-2	20	80

Таблица 12b: Довсходовое действие при 80 г/га против VERPE в %

№ примера	Доза [г/га]	VERPE
I-5	80	100
I-4	80	100
I-6	80	100
I-2	80	80

15

Таблица 13а: Довсходовое действие при 20 г/га против VIOTR в %

№ примера	Доза [г/га]	VIOTR
I-1	20	100
I-3	20	90
I-4	20	100
I-6	20	100
I-2	20	100

Таблица 13b: Довсходовое действие при 80 г/га против VIOTR в %

№ примера	Доза [г/га]	VIOTR
I-5	80	100
I-1	80	100
I-3	80	100
I-4	80	100
I-6	80	100
I-2	80	100

2. Послевсходовое гербицидное действие против вредных растений

5 Семена односемядольных и двусемядольных сорняков и культурных растений выкладывают на песчаную суглинистую почву в древесноволокнистых горшках, покрывают почвой и культивируют в теплице в надлежащих условиях для роста. Через 2 - 3 недели после высевания испытываемые растения обрабатывают на стадии одного листа. Соединения в соответствии с

10 изобретением, рецептированные в форме смачиваемых порошков (WP) или концентратов эмульсий (EC), затем разбрызгивают на зеленые части растений в форме водных суспензий или эмульсий при норме полива, равной 600 - 800 л/га, с добавлением 0,2 % смачивающего агента. После оставления испытываемых растений в теплице в оптимальных для роста условиях приблизительно на 3

15 недели действие композиций визуально оценивают по сравнению с необработанными контрольными растениями (гербицидное действие в процентах (%): 100 % активности = растения погибли, 0 % активности = так же, как и контрольные растения). Многочисленные соединения в соответствии с изобретением продемонстрировали очень хорошее действие против множества

20 растений, наносящих значительный вред. Представленные ниже таблицы в качестве пояснения иллюстрируют послевсходовое гербицидное действие соединений в соответствии с изобретением, с указанием гербицидной активности в процентах.

Таблица 14a: Послевсходовое действие при 1,25 г/га против AMARE в %

№ примера	Доза [г/га]	AMARE
I-1	1,25	100

Таблица 14b: Послевсходовое действие при 5 г/га против AMARE в %

№ примера	Доза [г/га]	AMARE
I-5	5	100
I-1	5	100
I-3	5	90
I-4	5	100
I-6	5	90
I-2	5	100

Таблица 14с: Послевсходовое действие при 20 г/га против AMARE в %

№ примера	Доза [г/га]	AMARE
I-5	20	100
I-1	20	100
I-3	20	90
I-4	20	100
I-6	20	100
I-2	20	100

5

Таблица 15: Послевсходовое действие при 20 г/га против AVEFA в %

№ примера	Доза [г/га]	AVEFA
I-1	20	80

Таблица 16a: Послевсходовое действие при 5 г/га против DIGSA в %

№ примера	Доза [г/га]	DIGSA
I-3	5	90
I-4	5	90
I-6	5	90

10

Таблица 16b: Послевсходовое действие при 20 г/га против DIGSA в %

№ примера	Доза [г/га]	DIGSA
I-3	20	90
I-4	20	100
I-6	20	90

Таблица 17a: Послевсходовое действие при 5 г/га против ECHCG в %

№ примера	Доза [г/га]	ECHCG
I-5	5	90
I-1	5	100
I-3	5	80
I-2	5	90

Таблица 17b: Послевсходовое действие при 20 г/га против ECHCG в %

№ примера	Доза [г/га]	ECHCG
-----------	-------------	-------

I-5	20	100
I-1	20	100
I-3	20	90
I-4	20	90
I-6	20	100
I-2	20	90

Таблица 18а: Послевсходовое действие при 5 г/га против MATIN в %

№ примера	Доза [г/га]	MATIN
I-5	5	80
I-1	5	80
I-2	5	90

Таблица 18b: Послевсходовое действие при 20 г/га против MATIN в %

№ примера	Доза [г/га]	MATIN
I-5	20	90
I-1	20	90
I-3	20	80
I-4	20	80
I-2	20	90

5

Таблица 19а: Послевсходовое действие при 5 г/га против PHBPU в %

№ примера	Доза [г/га]	PHBPU
I-1	5	100
I-3	5	80

Таблица 19b: Послевсходовое действие при 20 г/га против PHBPU в %

№ примера	Доза [г/га]	PHBPU
I-5	20	90
I-1	20	100
I-3	20	80
I-6	20	90
I-2	20	90

10

Таблица 20: Послевсходовое действие при 20 г/га против POLCO в %

№ примера	Доза [г/га]	POLCO
I-1	20	80
I-2	20	80

Таблица 21а: Послевсходовое действие при 5 г/га против SETVI в %

№ примера	Доза [г/га]	SETVI
I-5	5	80
I-1	5	80
I-4	5	100
I-6	5	100
I-2	5	90

Таблица 21b: Послевсходовое действие при 20 г/га против SETVI в %

№ примера	Доза [г/га]	SETVI
I-5	20	100
I-1	20	100
I-3	20	90
I-4	20	100
I-6	20	100
I-2	20	90

Таблица 22: Послевсходовое действие при 20 г/га против STEME в %

№ примера	Доза [г/га]	STEME
I-3	20	80

5

Таблица 23a: Послевсходовое действие при 5 г/га против VERPE в %

№ примера	Доза [г/га]	VERPE
I-6	5	90
I-2	5	90

Таблица 23b: Послевсходовое действие при 20 г/га против VERPE в %

№ примера	Доза [г/га]	VERPE
I-5	20	90
I-1	20	90
I-6	20	90
I-2	20	100

10 Таблица 24a: Послевсходовое действие при 1,25 г/га против VIOTR в %

№ примера	Доза [г/га]	VIOTR
I-1	1,25	90

Таблица 24b: Послевсходовое действие при 5 г/га против VIOTR в %

№ примера	Доза [г/га]	VIOTR
I-5	5	100
I-1	5	100
I-6	5	80
I-2	5	90

Таблица 24c: Послевсходовое действие при 20 г/га против VIOTR в %

№ примера	Доза [г/га]	VIOTR
I-5	20	100
I-1	20	100
I-3	20	90
I-6	20	100
I-2	20	100

Сравнительные эксперименты

В представленных ниже экспериментах гербицидное действие соединений в соответствии с изобретением и соответствующих известных ближайших
 5 рацемических соединений из документов WO2012126932 и WO2018202535 сравнивали при вышеуказанных условиях с применением довсходового и послевсходового способа. Номера примеров, указанные в таблицах, относятся к соединениям, раскрываемым в соответствующих документах.

Таблица 25:

10 Довсходовое гербицидное действие / вред для культурных растений

№ примера:	Доза (г а. и. / га)	Вред для	
		ZEAMX	
I-1, согласно изобретению	320	0	
1-360, из WO2012126932	320	20	

№ примера:	Доза (г а. и. / га)	Вред для	
		ORYZA	TRZAS
I-1, согласно изобретению	80	80	30
1-360, из WO2012126932	80	100	80

№ примера:	Доза (г а. и. / га)	Вред для	
		TRZAS	
I-2, согласно изобретению	20	20	
Рацемат, известный из WO2018202535	20	70	

№ примера:	Доза (г а. и. / га)	Вред для	
		GLXMA	TRZAS
I-2, согласно изобретению	80	30	70
Рацемат, известный из WO2018202535	80	80	100

№ примера:	Доза (г а. и. / га)	Вред для		
		GLXMA	ZEAMX	TRZAS
I-3, согласно изобретению	80	50	0	30
1-144 из WO2012126932	80	80	30	90

15

№ примера:	Доза (г а. и. / га)	Вред для		
		BRSNW	ZEAMX	TRZAS
I-3, согласно изобретению	20	70	0	0
1-144 из WO2012126932	20	100	20	50

№ примера:	Доза (г а. и. / га)	Вред для	
		GLXMA	ZEAMX
I-4, согласно изобретению	80	80	50

Рацемат, известный из WO2012126932	80	100	70
------------------------------------	----	-----	----

№ примера:	Доза (г а. и. / га)	Вред для
		GLXMA
I-4, согласно изобретению	20	40
Рацемат, известный из WO2012126932	20	60

№ примера:	Доза (г а. и. / га)	Гербицидное действие против		
		ALOMY	AVEFA	LOLRI
I-4, согласно изобретению	20	80	30	50
Рацемат, известный из WO2012126932	20	0	0	0

№ примера:	Доза (г а. и. / га)	Гербицидное действие против
		ZEAMX
I-5, согласно изобретению	320	40
2-360, из WO2012126932	320	60

№ примера:	Доза (г а. и. / га)	Гербицидное действие против	
		STEME	POLCO
I-5, согласно изобретению	320	100	80
2-360, из WO2012126932	320	70	20

5

№ примера:	Доза (г а. и. / га)	Гербицидное действие против	
		STEME	VERPE
I-5, согласно изобретению	80	100	100
2-360, из WO2012126932	80	70	10

№ примера:	Доза (г а. и. / га)	Гербицидное действие против			
		ALOMY	AVEFA	CYPES	MATIN
I-5, согласно изобретению	20	60	90	90	90
2-360, из WO2012126932	20	30	0	70	70

№ примера:	Доза (г а. и. / га)	Гербицидное действие против		
		SETVI	STEME	VERPE
I-5, согласно изобретению	20	100	100	30
2-360, из WO2012126932	20	50	0	0

№ примера:	Доза (г а. и. / га)	Вред для
		ZEAMX
I-6, согласно изобретению	80	20
7-48 из WO2018202535	80	50

№ примера:	Доза (г а. и. / га)	Вред для
		BRSNW
I-6, согласно изобретению	20	40
7-48 из WO2018202535	20	80

10

Таблица 26:

Послевсходовое гербицидное действие / вред для культурных растений

№ примера:	Доза (г а. и. / га)	Вред для		
		ORYZA	ZEAMX	TRZAS
I-1, согласно изобретению	80	70	0	60
1-360, из WO2012126932	80	100	20	100

№ примера:	Доза (г а. и. / га)	Вред для		
		ZEAMX		
I-1, согласно изобретению	80	0		
1-360, из WO2012126932	80	20		

№ примера:	Доза (г а. и. / га)	Вред для		
		ORYZA		
I-2, согласно изобретению	5	0		
Рацемат, известный из WO2018202535	5	60		

5

I-2, Послевсходовое действие

№ примера:	Доза (г а. и. / га)	Гербицидное действие против		
		ECHCG		
I-2, согласно изобретению	5	90		
Рацемат, известный из WO2018202535	5	70		

№ примера:	Доза (г а. и. / га)	Вред для		
		ORYZA	TRZAS	
I-3, согласно изобретению	5	30	20	
1-144 из WO2012126932	5	60	40	

№ примера:	Доза (г а. и. / га)	Вред для		
		TRZAS		
I-3, согласно изобретению	20	30		
1-144 из WO2012126932	20	50		

№ примера:	Доза (г а. и. / га)	Вред для		
		BRSNW	ZEAMX	TRZAS
I-4, согласно изобретению	20	80	0	20
Рацемат, известный из WO2012126932	20	100	20	40

10

№ примера:	Доза (г а. и. / га)	Гербицидное действие против		
		LOLRI	DIGSA	
I-4, согласно изобретению	20	60	100	
Рацемат, известный из WO2012126932	20	30	80	

№ примера:	Доза (г а. и. / га)	Гербицидное действие против		
		VERPE		
I-4, согласно изобретению	5	60		

Рацемат, известный из WO2012126932	5	40
------------------------------------	---	----

№ примера:	Доза (г а. и. / га)	Вред для
		ZEAMX
I-5, согласно изобретению	20	0
2-360, из WO2012126932	20	20

№ примера:	Доза (г а. и. / га)	Гербицидное действие против		
		SETVI	STEME	VERPE
I-5, согласно изобретению	5	100	80	40
2-360, из WO2012126932	5	80	0	20

№ примера:	Доза (г а. и. / га)	Гербицидное действие против
		CYPES
I-5, согласно изобретению	20	80
2-360, из WO2012126932	20	50

5 I-6 РО селективность

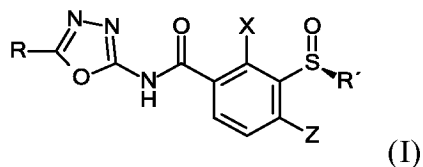
№ примера:	Доза (г а. и. / га)	Вред для	
		GLXMA	TRZAS
I-6, согласно изобретению	5	40	20
7-48 из WO2018202535	5	60	40

№ примера:	Доза (г а. и. / га)	Гербицидное действие против	
		ECHCG	VIOTR
I-6, согласно изобретению	20	100	100
7-48 из WO2018202535	20	80	80

№ примера:	Доза (г а. и. / га)	Гербицидное действие против	
		SETVI	VIOTR
I-6, согласно изобретению	5	100	80
7-48 из WO2018202535	5	80	60

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. N-(1,3,4-оксадиазол-2-ил)фенилкарбоксамиды или их соли, имеющие абсолютную конфигурацию, указанную в формуле (I)



где заместители определяются следующим образом:

R является водородом или метилом,

X является Cl или метилом,

R' является метилом или c-Pr,

Z является CF₃ или CHF₂.

2. N-(1,3,4-оксадиазол-2-ил)фенилкарбоксамиды с I-1 по I-16 по п. 1:

№	R	X	R'	Z
I-1	H	Cl	Me	CF ₃
I-2	H	Cl	Me	CHF ₂
I-3	H	Me	Me	CF ₃
I-4	Me	Cl	c-Pr	CF ₃
I-5	Me	Cl	Me	CF ₃
I-6	Me	Cl	Me	CHF ₂
I-7	H	Me	Me	CHF ₂
I-8	H	Me	c-Pr	CF ₃
I-9	H	Me	c-Pr	CHF ₂
I-10	H	Cl	c-Pr	CF ₃
I-11	H	Cl	c-Pr	CHF ₂
I-12	Me	Cl	c-Pr	CHF ₂
I-13	Me	Me	Me	CF ₃
I-14	Me	Me	Me	CHF ₂
I-15	Me	Me	c-Pr	CF ₃
I-16	Me	Me	c-Pr	CHF ₂

3. N-(1,3,4-оксадиазол-2-ил)фенилкарбоксамиды с I-1 по I-5 по пп. 1 или 2:

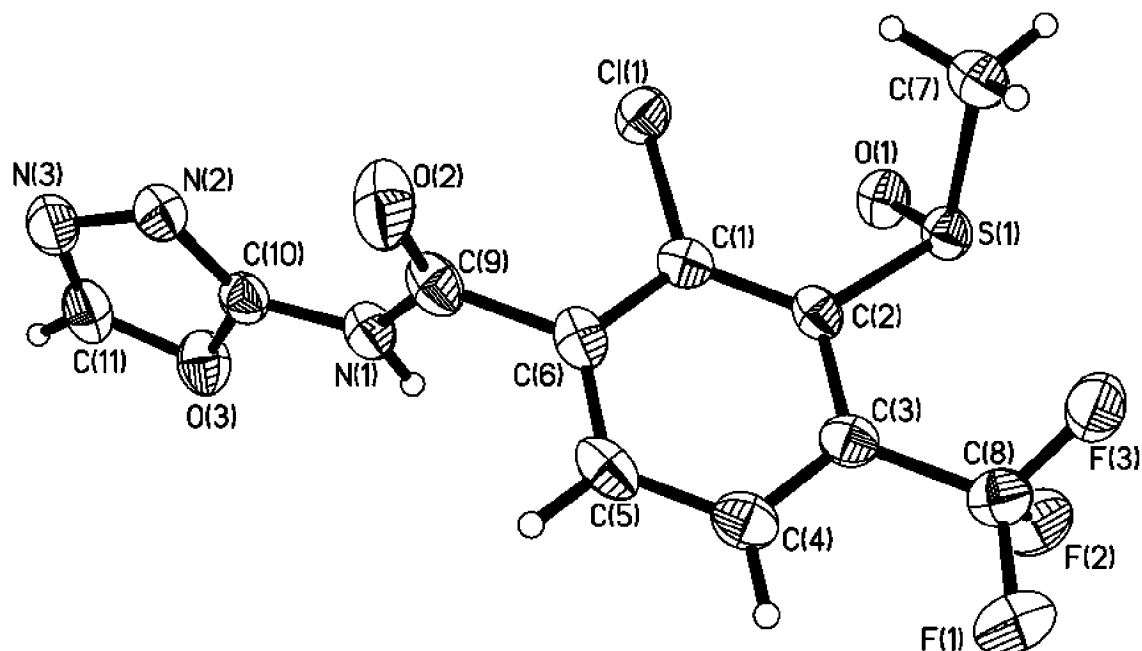
№	R	X	R'	Z
I-1	H	Cl	Me	CF ₃
I-2	H	Cl	Me	CHF ₂
I-3	H	Me	Me	CF ₃
I-4	Me	Cl	c-Pr	CF ₃
I-5	Me	Cl	Me	CF ₃

4. N-(1,3,4-оксадиазол-2-ил)фенилкарбоксамиды I-4 или I-5 по одному из пунктов с 1 по 3:

№	R	X	R'	Z
I-4	Me	Cl	c-Pr	CF ₃
I-5	Me	Cl	Me	CF ₃

5. N-(1,3,4-оксадиазол-2-ил)фенилкарбоксамиды по одному из пунктов с 1 по 4 с энантиомерным избытком (э. и.) по меньшей мере 94 %.
6. N-(1,3,4-оксадиазол-2-ил)фенилкарбоксамиды по одному из пунктов с 1 по 5 с энантиомерным избытком (э. и.) по меньшей мере 99 %.
10. 7. Гербицидная композиция, включающая по меньшей мере одно соединение по одному из пунктов с 1 по 6, смешанное с необходимыми для рецептуры вспомогательными веществами.
15. 8. Гербицидная композиция по одному из пунктов с 1 по 6, включающая по меньшей мере одно дополнительное пестицидно-активное вещество из группы, состоящей из инсектицидов, акарицидов, гербицидов, фунгицидов, антидотов и регуляторов роста.
20. 9. Способ борьбы с нежелательными растениями, характеризующийся тем, что эффективное количество по меньшей мере одного соединения формулы (I) по одному из пунктов с 1 по 6 или гербицидной композиции по пп. 7 или 8 наносят на растения или на участок с нежелательной растительностью.
25. 10. Применение соединений формулы (I) по одному из пунктов с 1 по 6 или гербицидных композиций по пп. 7 или 8 для борьбы с нежелательными растениями.
30. 11. Применение по п. 10, отличающееся тем, что соединения формулы (I) используют для борьбы с нежелательными растениями в культурах полезных растений.

12. Применение по п. 11, отличающееся тем, что полезные растения представляют собой трансгенные полезные растения.

Фигура 1: Ортер-диаграмма (50 %) I-1

Общие детали:

Кристаллизация: из смеси толуола / изопропилацетата и пентана (1:4) при комнатной температуре (медленное испарение)

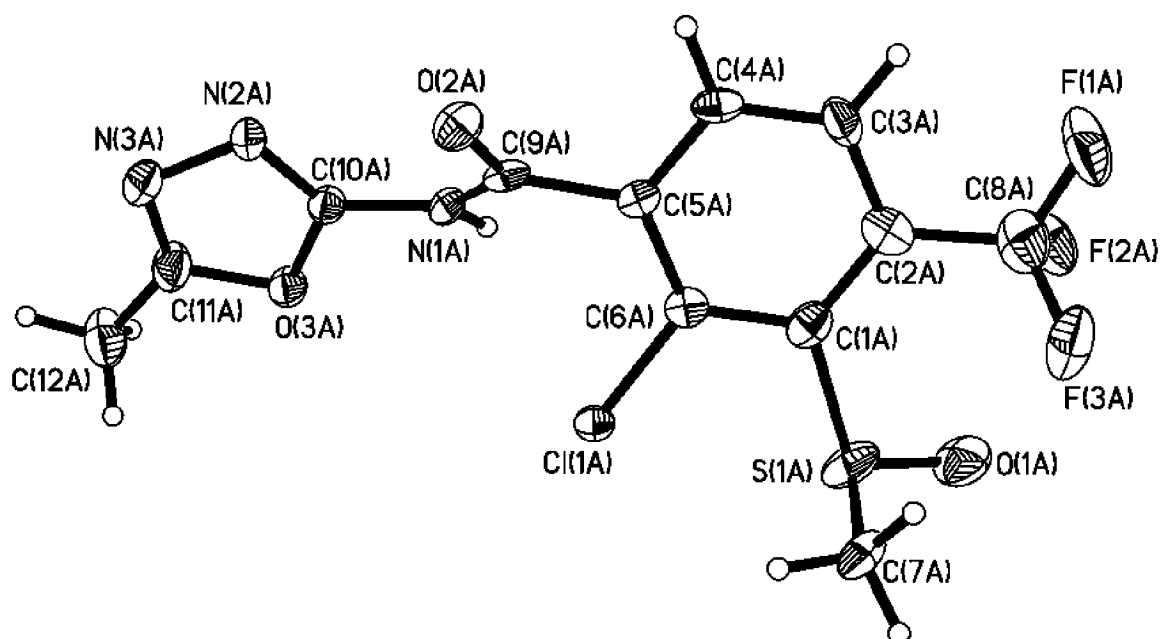
Анализируемый кристалл: бесцветные игольчатые кристаллы, 0,18 x 0,06 x 0,04 мм³

Вещество № I-1

Комментарий: абсолютная конфигурация поддавалась четкому определению.

Хиральность: S(S1) согласно Фигуре 1

Фигура 2: Ортер-диаграмма (50 %) I-5



Общие детали:

Кристаллизация: из смеси метилацетата и пентана (1:4) при комнатной температуре (медленное испарение)

Анализируемый кристалл: бесцветный кусок, 0,08 x 0,06 x 0,04 мм³

Вещество № I-5

Комментарий: абсолютная конфигурация поддавалась четкому определению.

Хиральность: S(S1) согласно Фигуре 2