

(19)



**Евразийское
патентное
ведомство**

(11) **025517**(13) **B1**

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОМУ ПАТЕНТУ

(45) Дата публикации и выдачи патента
2016.12.30

(21) Номер заявки
201401205

(22) Дата подачи заявки
2013.04.30

(51) Int. Cl. **C07D 401/12** (2006.01)
C07D 249/14 (2006.01)
A01N 43/40 (2006.01)

(54) СОЛИ N-(ТЕТРАЗОЛ-5-ИЛ)- И N-(ТРИАЗОЛ-5-ИЛ)АРИЛКАРБОКСАМИДА И СПОСОБ ИХ ПРИМЕНЕНИЯ В КАЧЕСТВЕ ГЕРБИЦИДОВ

(31) 12166621.8

(32) 2012.05.03

(33) EP

(43) 2015.04.30

(86) PCT/EP2013/058964

(87) WO 2013/164331 2013.11.07

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

(72) Изобретатель:
**Браун Ральф, Дёрнер-Рипинг Зимон,
Аренс Хартмут, Вальдрафф Кристиан,
Кён Арнин, Дитрих Хансйёрг,
Гатцвайлер Эльмар, Розингер
Кристофер Хью (DE)**

(74) Представитель:
**Веселицкая И.А., Кузенкова Н.В.,
Веселицкий М.Б., Каксис Р.А.,
Белоусов Ю.В., Куликов А.В.,
Кузнецова Е.В., Соколов Р.А.,
Кузнецова Т.В. (RU)**

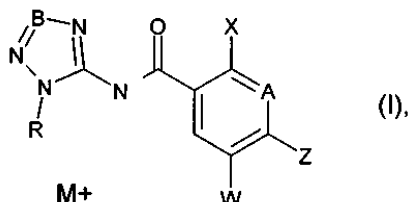
(56) WO-A1-2012028579

WO-A1-2004101532

WERMUTH C. G. ET AL.: "Handbook of Pharmaceutical Salts passage", 1 January 2002 (2002-01-01), HANDBOOK OF PHARMACEUTICAL SALTS: PROPERTIES, SELECTION, AND USE, ZURICH: VERL. HELVETICA CHIMICA ACTA; WEINHEIM [U.A.]: WILEY-VCH, DE, p. 1-7, XP002421267, ISBN: 978-3-906390-26-0, the whole document

BERGE S. M. ET AL.: "PHARMACEUTICALS SALTS", JOURNAL OF PHARMACEUTICAL SCIENCES, AMERICAN PHARMACEUTICAL ASSOCIATION, WASHINGTON, US, vol. 66, no. 1, 1 January 1977 (1977-01-01), p. 1-19, XP000562636, ISSN: 0022-3549, DOI: 10.1002/JPS.2600660104, the whole document

(57) Соли N-(тетразол-5-ил)- и N-(триазол-5-ил)арилкарбоксамидов общей формулы (I) описывают как гербициды.



В этой формуле (I) W, X, Z и R представляют собой, например, радикалы, такие как водород, органические радикалы, такие как алкил, и другие радикалы, такие как галоген. А и В, каждый, представляет собой азот или углерод. M^+ представляет собой катион.

025517 B1

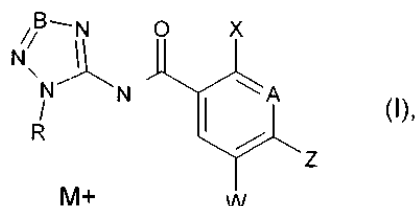
025517 B1

Изобретение относится к технической области гербицидов, в частности к гербицидам для селективной борьбы с широколиственными сорняками и сорными травами в культурах полезных растений.

WO 2012/028579 A1 раскрывает N-(тетразол-5-ил)- и N-(триазол-5-ил)бензамиды в качестве гербицидов. Заявки EP 11176378 и EP 11187669 более раннего приоритета и неопубликованной на дату приоритета настоящей спецификации раскрывают N-(тетразол-5-ил)- и N-(триазол-5-ил)арилкарбоксамиды в качестве гербицидов. Тем не менее, эти активные соединения не всегда достаточно активны в отношении вредных растений и/или некоторые из них не являются достаточно совместимыми с некоторыми важными культурными растениями, такими как зерновые виды, кукуруза или рис.

Соответственно, задачей настоящего изобретения является обеспечение дополнительно гербицидно-активных соединений. Эта цель достигается с помощью солей в соответствии с изобретением, описанных ниже, N-(тетразол-5-ил)- и N-(триазол-5-ил)арилкарбоксамидов.

Соответственно, настоящее изобретение обеспечивает соли N-(тетразол-5-ил)- и N-(триазол-5-ил)арилкарбоксамидов формулы (I)



где A представляет собой CY;

B представляет собой N или CH;

X представляет собой галоген, (C₁-C₆)алкил, OR¹, S(O)_nR² или (C₁-C₆)алкил-OR¹;

Y представляет собой водород, S(O)_nR² или (C₁-C₆)алкил-OR¹;

Z представляет собой галоген-(C₁-C₆)алкил или S(O)_nR², или

Z представляет собой (C₁-C₆)алкил, если Y представляет собой S(O)_nR² радикал;

W представляет собой водород;

R представляет собой (C₁-C₈)алкил;

R представляет собой (C₁-C₆)алкил;

R представляет собой (C₁-C₆)алкил;

M⁺ представляет собой ион натрия, ион тетрапропиламмония или ион N-(2-гидроксиэт-1-ил)-N,N,N-триметиламмония;

n представляет собой 0, 1 или 2.

В формуле (I) и всех формулах, которые следуют, алкильные радикалы, которые имеют больше чем два атома углерода, могут быть прямоцепочечными или разветвленными. Алкильные радикалы представляют собой, например, метил, этил, н- или изопропил, н-, изо-, трет- или 2-бутил, пентилы, гексилы, такие как н-гексил, изогексил и 1,3-диметилбутил.

Галоген представляет собой фтор, хлор, бром или йод.

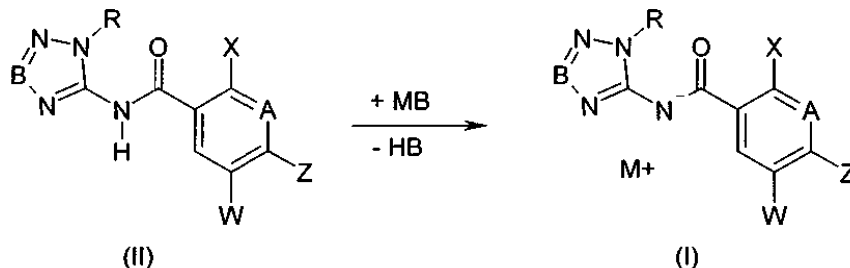
Когда группа является полизамещенной с помощью радикалов, это означает, что эта группа замещена одним или несколькими одинаковыми или различными радикалами из упомянутых. Это относится аналогичным образом к образованию кольцевых систем различными атомами и элементами. В то же время, объем формулы изобретения исключает эти соединения, известные специалистам в данной области техники, из-за химической нестабильности в стандартных условиях.

Определение катионов M⁺ следует понимать таким образом, что соли формулы (I) согласно изобретению присутствуют в форме нейтрального заряда. В случае моновалентных катионов, это означает, что противоион, который присутствует, представляет собой один анион. В случае поливалентных катионов, например ди- или трехвалентных катионов, присутствующие противоионы представляют собой два или три аниона.

В зависимости от природы заместителей и способа, которым они присоединены, соединения общей формулы (I) могут присутствовать в виде стереоизомеров. Если, например, один или более асимметрических атомов углерода присутствуют, там могут быть энантиомеры и диастереомеры. Стереоиомеры аналогично появляются, когда n равно 1 (сульфоксиды). Стереоиомеры могут быть получены из смесей, полученных при подготовке обычными методами разделения, например с помощью хроматографических процессов разделения. Кроме того, возможно селективное получение стереоиомеров с помощью стереоселективных реакций с использованием оптически активных исходных материалов и/или вспомогательных веществ. Изобретение также относится ко всем стереоиомерам и их смесям, которые, охватываются общей формулой (I), но которые не определены специально. Из-за структуры оксима эфира, соединения согласно изобретению могут также возникать в виде геометрических изомеров (E/Z изомеры). Изобретение также относится ко всем E/Z-изомерам и их смесям, которые, охватываются общей формулой (I), но которые не определены специально.

Во всех формулах, указанных далее, заместители и символы имеют такое же значение, как описано в формуле (I), если не указано иное.

Соединения согласно настоящему изобретению могут быть получены, например, способом, указанным на схеме путем с депротонирования с N-(тетразол-5-ил)- и N-(триазол-5-ил)бензамида и никотинамида (II), с помощью пригодной основной формулы M^+B^- (см. схему), где B^- , например гидрид, гидрокси- или алкокси анионы, такие как метокси, этокси, н-пропокси, изопропокси, н-бутокси или трет-бутокси.



N-(тетразол-5-ил)- и N-(триазол-5-ил)бензамиды формулы (II) могут быть получены, например, способами, описанными в WO 2012/028579 A1, EP 11176378 и EP 11187669.

Коллекции соединений формулы (I), которые могут быть синтезированы с помощью вышеуказанных реакций могут быть также получены параллельным образом, где этот случай может быть выполнен ручным, частично автоматизированным или полностью автоматизированным способом. Возможны, например для автоматизированного проведения реакции, обработка или очистка продуктов и/или промежуточных продуктов. В целом, следует понимать это как процедуру, как описано, например, D. Tiebes в *Combinatorial Chemistry - Synthesis, Analysis, Screening* (editor Gunther Jung), Wiley, 1999, стр. 1-34.

Для параллельного проведения реакции и обработки, можно использовать ряд коммерчески доступных инструментов, например реакционные блоки Calypso от Barnstead International, Dubuque, Iowa 52004-0797, USA или реакционные станции от Radleys, Shirehill, Saffron Walden, Essex, CB11 3AZ, England, или MultiPROBE Automated Workstations от PerkinElmer, Waltham, Massachusetts 02451, USA. Для параллельной очистки соединения общей формулы (I) или промежуточных соединений, которые появляются в процессе подготовки, доступные аппараты включают аппараты хроматографии, например от ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, USA.

Аппараты детализировано приводят к модульной процедуре, где отдельные этапы работы автоматизированные, но ручные операции должны осуществляться между рабочими этапами. Этого можно избежать, используя частично или полностью интегрированные системы автоматизации, где соответствующие модули автоматизации регулируют, например с помощью роботов. Системы автоматизации этого типа могут быть получены, например, от Caliper, Hopkinton, MA 01748, USA.

Реализация отдельных или нескольких стадий синтеза может поддерживаться путем использования реагентов на полимерной подложке/поглощительных смол. Специальная литература описывает ряд экспериментальных протоколов, например в *ChemFiles*, Vol. 4, № 1, *Polymer-Supported Scavengers and Reagents for Solution-Phase Synthesis* (Sigma-Aldrich).

Кроме описанных здесь способов получение соединений общей формулы (I) может иметь место полностью или частично твердофазными методами. Для этой цели отдельные промежуточные соединения или все промежуточные соединения в синтезе или адаптированной для синтеза соответствующей процедуре привязаны к синтезированной смоле. Твердофазные методы синтеза адекватно описаны в технической литературе, например Barry A. Bunin в *"The Combinatorial Index"*, Academic Press, 1998 и *Combinatorial Chemistry - Synthesis, Analysis, Screening* (editor Gunther Jung), Wiley, 1999. Способ применения твердофазных методов синтеза дает ряд протоколов, которые известны из литературы и которые в свою очередь могут быть выполнены вручную или в автоматическом режиме. Реакции могут быть выполнены, например, с помощью технологии IRORI в микрореакторах из Nexus Biosystems, 12140 Community Road, Poway, CA92064, USA.

Как в твердой, так и в жидкой фазе отдельные или несколько стадий синтеза могут поддерживаться путем использования микроволновой технологии. Специальная литература описывает ряд экспериментальных протоколов, например в *Microwaves in Organic and Medicinal Chemistry* (editor C. O. Kappe and A. Stadler), Wiley, 2005.

Получение способами, описанными здесь, дает соединения формулы (I) в виде коллекций веществ, называемых библиотеками. Настоящее изобретение также предоставляет библиотеки, содержащие по меньшей мере два соединения формулы (I).

Соединения формулы (I), в соответствии с изобретением имеют превосходную гербицидную активность против широкого спектра экономически важных одно- и двудольных ежегодных сорных растений. Активные соединения также хорошо борются против многолетних сорных растений, с которыми трудно бороться и которые производят побеги из корневищ, корневых запасов или других многолетних органов.

Настоящее изобретение, следовательно, также относится к способу борьбы с нежелательными растениями или для регулирования роста растений, предпочтительно в культурах полезных растений, где одно или более соединения(я) в соответствии с настоящим изобретением применяют к растениям (например, сорным растениям, таким как однодольных или двудольных сорняки или нежелательные культурные растения), семенам (например, зернам, семенам или вегетативным росткам, таким как клубни или части побегов с почками) или местам, где растут растения (например, посевной площади). Соединения согласно изобретению могут быть использованы, например, до посева (при необходимости также включение в почву), до появления или после появления всходов. Конкретные примеры некоторых представителей из однодольных и двудольных сорных растений, с которыми можно бороться с помощью соединений согласно изобретению представляют собой следующие, но перечень не предназначен, чтобы наложить ограничение на определенные виды.

Однодольные сорные растения рода: *Aegilops*, *Agropyron*, *Agrostis*, *Alopecurus*, *Apera*, *Avena*, *Bra-chiaria*, *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*.

Двудольные сорные растения рода: *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*, *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*.

Когда соединения согласно настоящему изобретению наносят на поверхность почвы перед прорастанием - это либо полностью предотвращает саженцы сорняков от прорастания, или сорняки растут, пока они не достигли стадии семядоли, но затем прекращают расти и в конечном итоге, по прошествии трех-четырех недель, полностью отмирают.

Если активные соединения применяются после появления всходов к зеленым частям растений, рост прекращается после обработки, и вредные растения остаются на стадии роста на момент применения, или они умирают полностью по истечении определенного времени, так что при этом способе борьбы сорняки, которые вредны для культурных растений, устраняются очень рано в долговременным образом.

Несмотря на то, что соединения согласно изобретению проявляют превосходную гербицидную активность против однодольных и двудольных сорняков, сельскохозяйственных культур экономически важных культур, например двудольных культур рода *Arachis*, *Beta*, *Brassica*, *Cucumis*, *Cucurbita*, *Helianthus*, *Daucus*, *Glycine*, *Gossypium*, *Ipomoea*, *Lactuca*, *Linum*, *Lycopersicon*, *Nicotiana*, *Phaseolus*, *Pisum*, *Solanum*, *Vicia*, или однодольных культур рода *Allium*, *Ananas*, *Asparagus*, *Avena*, *Hordeum*, *Oryza*, *Panicum*, *Saccharum*, *Secale*, *Sorghum*, *Triticale*, *Triticum*, *Zea*, в частности *Zea* и *Triticum*, повреждены лишь в незначительной степени, или совсем не повреждены, в зависимости от структуры соответствующего соединения в соответствии с изобретением и его расходом. По этим причинам, соединения согласно настоящему изобретению являются очень пригодными для селективной борьбы с нежелательным ростом растений в культурах полезных растений, таких как сельскохозяйственно-полезные растения или декоративные растения.

Кроме того, соединения согласно настоящему изобретению (в зависимости от их конкретной структуры и используемого расхода) имели выдающиеся регулирующие рост эффекты на культурные растения. Они вмешиваются, чтобы регулировать обмен веществ растения, и таким образом, могут быть использованы для контролируемого воздействия на составляющие растений и для облегчения сбора урожая, например вызывая усыхание и задержку роста. Кроме того, они также пригодны для общей борьбы и торможения нежелательного вегетативного роста, не убивая растения. Подавление вегетативного роста играет важную роль для многих однодольных и двудольных культур, так как, например, это может уменьшить или полностью предотвратить полегание.

В силу своих гербицидной и регулирующих рост растений свойств, активные соединения также могут быть использованы для борьбы с сорными растениями в культурах генетически модифицированных растений или растений, модифицированных с помощью обычного мутагенеза. В общем, трансгенные растения отмечают за специальные выгодные свойства, например за сопротивляемость некоторым пестицидам, в частности некоторым гербицидам, сопротивляемость к болезням растений или организмам, которые вызывают болезни растений, таким как некоторые насекомые или микроорганизмы, таким как грибы, бактерии или вирусы. Другие особые свойства относятся, например, к растительному материалу в отношении к количеству, качеству, хранению и композиции, и конкретным составляющим. Например, известны трансгенные растения с повышенным содержанием крахмала или измененным качеством крахмала, или тех, которые отличаются составом жирных кислот в растительном материале.

Предпочтительно по отношению к трансгенным культурам использование соединений в соответствии с настоящим изобретением в экономически важных трансгенных культурах полезных растений и декоративных растений, например зерновых, таких как пшеница, ячмень, рожь, овес, просо/сорго, рис

маниока и кукуруза, или остальных культурах сахарной свеклы, хлопка, сои, рапса, картофеля, томата, гороха и других овощей. Предпочтительным является использование соединений в соответствии с изобретением в качестве гербицидов в культурах полезных растений, которые устойчивы, или были сделаны устойчивыми рекомбинантными способами, к фитотоксическим эффектам гербицидов.

Предпочтительно использование соединений в соответствии с настоящим изобретением в экономически важных трансгенных культурах полезных растений и декоративных растений, например зерновых, таких как пшеница, ячмень, рожь, овес, просо/сорго, рис маниока и кукуруза, или остальных культурах сахарной свеклы, хлопка, сои, рапса, картофеля, томата, гороха и других овощей. Предпочтительным является использование соединений в соответствии с изобретением в качестве гербицидов в культурах полезных растений, которые устойчивы или были сделаны устойчивыми рекомбинантными способами, к фитотоксическим эффектам гербицидов.

Обычные способы получения новых растений, которые обладают модифицированными свойствами по сравнению с растениями, которые имеются на сегодняшний день заключаются, например, в традиционных методах селекции и генерирования мутантов. Кроме того, новые растения с измененными свойствами могут быть получены с помощью рекомбинантных методов (см, например, EP-A-0221044, EP-A-0131624). Например, было много описаний

рекомбинантных модификаций культурных растений с целью модификации крахмала, синтезируемого в растениях (например, WO 92/11376, WO 92/14827, WO 91/19806);

трансгенных культурных растений, которые устойчивы, в частности, к гербицидам типа глюфосината (см., например, EP-A-0242236, EP-A-242246) или типа глифосата (WO 92/00377) или типа сульфониломочевины (EP-A-0257993, US-A-5013659);

трансгенных культурных растений, например хлопок, со способностью производить токсины *Bacillus Thuringiensis* (Bt токсины), которые делают растения, устойчивые к определенным вредителям (EP-A-0142924, EP-A-01 93259);

трансгенных культурных растений с модифицированным составом жирных кислот (WO 91/13972);

генетически модифицированных сельскохозяйственных растений с новыми составляющими или вторичными метаболитами, например новых фитоалексинами, которые вызывают повышенную устойчивость к болезни (EP-A-309862, EP-A-0464461);

генетически модифицированных растений с пониженным фотодыханием, которые имеют более высокие урожаи и более высокую устойчивость к стрессу (EP-A-0305398);

трансгенных культурных растений, которые производят фармацевтически или диагностически важные белки ("молекулярный фарминг");

трансгенных культурных растений, которые имеют более высокие урожаи или лучшее качество;

трансгенных культурных растений, которые отличаются сочетанием, например, вышеуказанных новых свойств ("стэкинг генов").

Большое количество молекулярно-биологических методов, с помощью которых новые трансгенные растения с измененными свойствами могут быть получены в принципе известны; см, например, I. Potrykus и 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 рекомбинантных манипуляций, молекулы нуклеиновых кислот, которые позволяют мутагенез или изменение последовательности за счет рекомбинации последовательностей ДНК могут быть введены в плазмиды. С помощью стандартных методов, можно, например, провести базовые обмены, удалить части последовательностей или добавить природные или синтетические последовательности. Для присоединения фрагментов ДНК друг к другу, адаптеры или линкеры могут быть присоединены к фрагментам; 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 и Clones], VCH Weinheim, 2nd edition, 1996.

Например, генерация клеток растений с пониженной активностью генного продукта может быть достигнута путем экспрессии по меньшей мере одной соответствующей антиполярной РНК, полярной РНК для достижения эффекта косупрессии или путем экспрессии по меньшей мере одного соответствующим образом конструированного рибозима, который специфически расщепляет транскрипты вышеупомянутого продукта гена. С этой целью, можно, во-первых, использовать молекулы ДНК, которые охватывают всю кодирующую последовательность генного продукта, включая любые фланкирующие последовательности, которые могут присутствовать, и также молекулы ДНК, которые охватывают только части кодирующей последовательности, при этом необходимо этим частям быть достаточно длинными, чтобы иметь эффект антиполярности в клетках. Использование ДНК-последовательностей, которые имеют высокую степень гомологии к кодирующим последовательностям генного продукта, но не полностью совпадает с ними, также возможно.

При экспрессии молекул нуклеиновой кислоты в растениях синтезированный белок может быть локализован в любой желательной части растительной клетки. Тем не менее, для того чтобы достичь локализации в конкретной части, можно, например, присоединить кодирующую область к ДНК-последовательностям, которые обеспечивают локализацию в определенной части. Такие последователь-

ности известны специалистам в данной области техники (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 нуклеиновой кислоты могут быть также выражены в органеллах клеток растений.

Трансгенные растительные клетки могут быть регенерированы с помощью известных методик, чтобы дать целые растения. В принципе, трансгенные растения могут быть растениями любого желаемого вида растений, т.е. как однодольными, так и двудольными растениями.

Например, можно получить трансгенные растения, свойства которых изменяются при избыточной экспрессии, подавлении или ингибировании гомологических (= природных) генов или генных последовательностей, или экспрессии гетерологичных (= чужеродных) генов или генных последовательностей.

Предпочтительно соединения согласно настоящему изобретению могут быть использованы в трансгенных культурах, устойчивых к регуляторам роста, например дикамбе, или к гербицидам, которые ингибируют ферменты, необходимые растениям, например ацетолактат синтазы (ALS), EPSP-синтазы, глутамин-синтазы (GS) или гидроксифенилпируват диоксигеназы (HPPD), или к гербицидам из группы сульфонилмочевин, глифосатов, глюфосинатов или бензоилизоксазолов и аналогичных активных соединений.

При применении активных соединений в соответствии с изобретением к трансгенным культурам, появляются не только эффекты в отношении вредных растений, наблюдаемые в других культурах, но часто и эффекты, которые являются специфическими для применения к конкретной трансгенной культуре, например измененный или специально расширенный спектр сорняков, с которыми можно бороться, измененные нормы расхода, которые могут быть использованы для применения, предпочтительно хорошая сочетаемость с гербицидами, к которым трансгенная культура устойчива, и влияющие на рост и урожайность трансгенных культурных растений.

Таким образом, изобретение также относится к применению соединений в соответствии с изобретением в качестве гербицидов для борьбы с вредными растениями у трансгенных культурных растений.

По сравнению с их соответствующими кислотами, соединения согласно изобретению обладают более высокой растворимостью в воде и, следовательно, например, более выгодными свойствами композиции. Они являются высоко пригодными для приготовления составов на водной основе.

Соединения согласно настоящему изобретению могут быть применены в форме смачиваемых порошков, эмульгируемых концентратов, распыляемых растворов, пылеобразных продуктов или гранул в обычных составах. Таким образом, изобретение также обеспечивает гербицидные и регулирующие рост растений композиции, которые включают соединения согласно изобретению.

Соединения согласно изобретению могут быть приготовлены различными способами, в зависимости от биологических и/или физико-химических необходимых параметров. Примеры возможных составов, включают: смачиваемые порошки (WP), водорастворимые порошки (SP), водорастворимые концентраты, эмульгируемые концентраты (EC), эмульсии (EW), такие как масло-в-воде и вода-в-масле эмульсии, растворы для опрыскивания, концентраты суспензий (SC), дисперсии на водной или масляной основе, масло-вмешиваемые растворы, капсулированные суспензии (CS), пылеобразные продукты (DP), продукты для протравливания семян, гранулаты для разбрасывания и применения к почве, гранулы (GR) в виде микрогранул, распыляемых гранул, гранул с покрытием и гранул адсорбции, диспергируемые в воде гранулы (WG), водорастворимые гранулы (SG), ULV-составы, микрокапсулы и воски. Эти отдельные типы препаратов в принципе известны и описаны, например, в: 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 лекарственные вспомогательные вещества, такие как инертные материалы, поверхностно-активные вещества, растворители и дополнительные добавки, также известны и описаны, например, в: 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; Schonfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte" [Interface-active Ethylene Oxide Adducts], Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie" [Chemical Engineering], volume 7, C. Hanser Verlag Munich, 4th ed. 1986.

На основе этих препаратов, также можно готовить комбинации с другими пестицидно активными соединениями, такими как, например, инсектициды, акарициды, гербициды, фунгициды, и также с защитными веществами, удобрениями и/или регуляторами роста, например в виде готового препарата или в виде баковой смеси. Пригодными антидотами являются, например, мефенпир-диэтил, ципросульфамид, изоксадифен-этил, клохинтоцет-мексил и дихлормид.

Смачиваемыми порошками являются препараты, которые можно диспергировать в воде равномерно и, в дополнение к активному соединению отдельно от разбавителя или инертного вещества, и также содержат поверхностно-активные вещества ионного и/или неионного типа (смачиватели, диспергаторы), например полиоксиэтилированные алкилфенолы, полиоксиэтилированные жирные спирты, полиокси-

этилированные жирные амины, полигликольэфирсульфаты жирных спиртов, алкансульфонаты, алкилбензолсульфонаты, натрийлигносульфонат, натрий 2,2-динафтилметан-6,6'-дисульфат, натрий дибутилнафталенсульфонат или еще олеилметилтаурат натрия. Для получения смачиваемых порошков, гербицидно-активные соединения тонко измельчают, например, в обычном устройстве, таком как молотковые мельницы, вентиляторные мельницы и воздушно-струйные мельницы, и одновременно или затем смешивают со вспомогательными веществами.

Эмульсионные концентраты получают растворением активного соединения в органическом растворителе, например бутаноле, циклогексаноне, диметилформамиде, ксилоле, или других с относительно высокой температурой кипения ароматических веществах или углеводородах или смесях органических растворителей, с добавлением одного или нескольких ионных и/или неионных поверхностно-активных веществ (эмульгаторы). Эмульгаторы, которые являются используемыми могут, например, представлять собой: кальций алкиларилсульфонаты, такие как додецилбензолсульфонат кальция, или неионные эмульгаторы, такие как полигликолевые эфиры жирных кислот, алкиларильные полигликолевые эфиры жирных спиртов, полигликолевые эфиры, продукты конденсации пропилен оксида-этилен оксида, алкиловые полиэфиры, сложные эфиры сорбита, например сложные эфиры сорбита и жирных кислот, или сложные эфиры сорбита и полиоксиэтилена, например сложные эфиры жирных кислот и полиоксиэтилensorбита.

Пылеобразные вещества получают измельчением активного вещества с тонко распределенными твердыми веществами, например тальк, природные глины, такие как каолин, бентонит и пирофиллит, или кизельгур.

Концентраты суспензий могут быть на водной или масляной основе. Они могут быть получены, например, путем мокрого помола при помощи коммерческих шаровых мельниц с дополнительным добавлением поверхностно-активных веществ, как уже перечисленных выше, например для других типов препаратов.

Эмульсии, например масло-в-воде (EW), могут быть получены, например, с помощью мешалок, коллоидных мельниц и/или статических смесителей с использованием водных органических растворителей и при необходимости поверхностно-активных веществ, как уже указано выше, например для других типов препаратов.

Гранулы могут быть получены либо путем распыления активного вещества на адсорбционный гранулированный инертный материал или путем применения концентратов активного соединения к поверхности носителей, таких как песок, каолиниты или гранулированный инертный материал, с помощью клеев, например поливинилового спирта, полиакрилатов натрия или других минеральных масел. Пригодные активные соединения могут быть также гранулированы в соответствии с обычными методами для производства гранулированных удобрений - при желании в качестве смеси с удобрениями.

Гранулы, диспергируемые в воде, получают обычно путем обычных процессов, таких как сушка распылением, грануляция в псевдоожиженном слое, гранулирования в чане, смешивание с помощью высокоскоростных смесителей и экструзия без твердого инертного материала.

Для получения гранул из чана, гранул псевдоожиженного слоя, гранул экструдера и гранул распыления, см., например, методики В "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, p. 8-57.

Для получения более подробной информации о разработке средств защиты растений см., например, G.C. Klingman, "Weed Control as a Science", John Wiley и Sons, Inc., New York, 1961, pages 81-96 и J.D. Freyer, S.A. Evans, "Weed Control Handbook", 5th ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, p. 101-103.

Агрохимические препараты содержат, как правило, от 0.1 до 99 мас.%, предпочтительно от 0.1 до 95 мас.% соединений в соответствии с изобретением.

В смачиваемых порошках, концентрация активного соединения составляет, например, приблизительно от 10 до 90 мас.%, остальное до 100 мас.%, состоящая из обычных компонентов состава. В эмульгируемых концентратах, концентрация активного соединения может составлять приблизительно от 1 до 90% и предпочтительно от 5 до 80 мас.%. Композиции в виде пыли содержат от 1 до 30 мас.% активного вещества, предпочтительно, как правило, от 5 до 20 мас.% активного соединения; растворы для опрыскивания содержат приблизительно от 0.05 до 80% и предпочтительно от 2 до 50 мас.% активного соединения. В случае диспергируемых в воде гранул, содержание активного вещества зависит отчасти от того, активное соединение присутствует в жидкой или твердой форме, и какие вспомогатели гранулирования, наполнители и т.д. используются. В гранулах диспергируемых в воде, содержание активного вещества составляет, например, от 1 и 95 мас.%, предпочтительно между 10 и 80 мас.%.

Кроме того, указанные активные составы соединений необязательно содержат соответствующие обычные прилипатели, смачивающие агенты, диспергаторы, эмульгаторы, способствующие проникновению вещества, консерванты, антифризы и растворители, наполнители, носители и красители, пеногасители, ингибиторы испарения и агенты, которые влияют на pH и вязкость.

На основе этих составов, также можно производить комбинации с другими пестицидно активными соединениями, такими как, например, инсектициды, акарициды, гербициды, фунгициды, и также с за-

щитными веществами, удобрениями и/или регуляторами роста, например в виде готового состава или в виде баковой смеси.

Для применения препараты в коммерческой форме являются, в случае необходимости, разбавленными обычным способом, например, в случае смачиваемых порошков, эмульгируемых концентратов, дисперсии и диспергируемых в воде гранул с водой. Препараты в виде пыли, гранул для применения к почве или гранул для посева и растворы для опрыскивания обычно не разбавляют дополнительно другими инертными веществами перед применением.

Требуемая норма применения соединений формулы (I) изменяется в зависимости от внешних условий, включая температуру, влажность и тип используемого гербицида. Она может варьироваться в широких пределах, например от 0.001 и 1.0 кг/га или более активное вещество, но предпочтительно составляет от 0.005 и 750 г/га.

Приведенные ниже примеры иллюстрируют изобретение.

А. Химические примеры.

Синтез соли 2-метилсульфонил-4-трифторметил-N-(1-метилтетразол-5-ил)бензамида натрия (№ 1-2).

0.105 мл (0.57 ммоль) раствора метоксида натрия (30% в метаноле) добавляли к 200 мг (0.57 ммоль) 2-метилсульфонил-4-трифторметил-N-(1-метилтетразол-5-ил)бензамида в 5 мл метанола, и смесь концентрировали досуха. Это обеспечило 210 мг кристаллов (колич. выход).

Примеры, приведенные в нижеследующих таблицах, были подготовлены аналогичным образом с вышеуказанными методами или могут быть получены аналогичным образом с вышеуказанными методами. Соединения, перечисленные ниже в таблицах, являются особенно предпочтительными.

Используемые сокращения означают:

Et = этил;

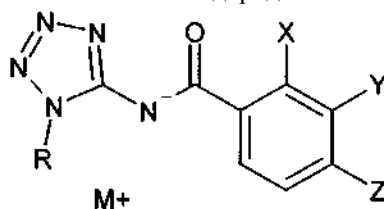
Me = метил;

Pr = Pr;

c-Pr = c-пропил.

Таблица 1

Соединения общей формулы (I), где А представляет собой СУ, В представляет собой N и W представляет собой водород



№	R	X	Y	Z	M ⁺	Физические данные (¹ H-ЯМР, ДМСО-d ₆ , 400 МГц)
1-1	Me	Cl	H	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-2	Me	SO ₂ Me	H	CF ₃	Na ⁺	8.13 (d,1H), 8.04 (dd,1H), 7.94 (d,1H), 3.74 (s,1H), 3.61 (s,3H)
1-3	Me	SO ₂ Me	H	CF ₃	Pr ₄ N ⁺	8.12 (d,1H), 8.04 (dd,1H), 7.92 (d,1H), 3.75 (s,3H), 3.61 (s,3H), 3.12 (m,8H), 1.61 (m,8H), 0.89 (t,12H)
1-4	Me	SO ₂ Me	H	CF ₃	Me ₃ N(C ₂ H ₄ OH) ⁺	8.12 (d,1H), 8.03 (dd,1H), 7.92 (d,1H), 5.30 (bs,1H), 3.82 (m,2H), 3.75 (s,3H), 3.61 (s,3H), 3.39 (m,2H), 3.10 (s,9H)
1-5	Me	Me	SMe	CF ₃	Na ⁺	
1-6	MeOC ₂ H ₄	Me	SMe	CF ₃	Na ⁺	
1-7	Me	Me	SOMe	CF ₃	Na ⁺	7.65 (d,1H), 7.63 (d,1H), 3.69 (s,3H), 3.16 (s,3H), 2.52 (s,3H)
1-8	Me	Me	SOMe	CF ₃	Me ₃ N(C ₂ H ₄ OH) ⁺	7.64 (d,1H), 7.62 (d,1H), 3.82 (m,2H), 3.69 (s,3H), 3.33 (m,2H), 3.10 (s,9H), 2.99 (s,3H), 2.52 (s,3H)
1-9	Et	Me	SOMe	CF ₃	Na ⁺	
1-10	Me	Me	SO ₂ Me	CF ₃	Na ⁺	
1-11	Et	Me	SO ₂ Me	CF ₃	Na ⁺	7.81 (d,1H), 7.74 (d,1H), 4.09 (q,2H), 3.16 (s,3H), 2.52 (s,3H), 1.32 (t,3H)
1-12	Et	Me	SO ₂ Me	CF ₃	Me ₃ N(C ₂ H ₄ OH) ⁺	7.79 (d,1H), 7.71 (d,1H), 4.08 (q,2H), 3.82 (m,2H), 3.34 (m,2H), 3.34 (s,3H), 3.10 (s,9H), 2.52 (s,3H), 1.32 (t,3H)
1-13	Pr	Me	SO ₂ Me	CF ₃	Na ⁺	7.80 (d,1H), 7.71 (d,1H), 4.03 (t,2H), 3.16 (s,3H), 2.52 (s,3H), 1.74 (m,2H), 0.84 (t,3H)

1-14	Pr	Me	SO ₂ Me	CF ₃	Me ₃ N(C ₂ H ₄ OH) ⁺	7.79 (d,1H), 7.69 (d,1H), 4.03 (t,2H), 3.82 (m,2H), 3.36 (m,2H), 3.34 (s,3H), 3.10 (s,9H), 2.52 (s,3H), 1.74 (m,2H), 0.84 (t,3H)
1-15	MeOC ₂ H ₄	Me	SO ₂ Me	CF ₃	Na ⁺	
1-16	Me	Me	SEt	CF ₃	Na ⁺	
1-17	Et	Me	SEt	CF ₃	Na ⁺	
1-18	Me	Me	SOEt	CF ₃	Na ⁺	
1-19	Et	Me	SOEt	CF ₃	Na ⁺	
1-20	Me	Me	SO ₂ Et	CF ₃	Na ⁺	
1-21	Et	Me	SO ₂ Et	CF ₃	Na ⁺	
1-22	Me	Me	SMe	CN	Na ⁺	
1-23	Me	Me	SOMe	CN	Na ⁺	
1-24	Me	Me	SO ₂ Me	CN	Na ⁺	
1-25	Me	Me	SMe	Cl	Na ⁺	
1-26	Me	Me	SOMe	Cl	Na ⁺	
1-27	Me	Me	SO ₂ Me	Cl	Na ⁺	
1-28	Me	Me	SEt	Cl	Na ⁺	
1-29	Me	Me	SOEt	Cl	Na ⁺	
1-30	Et	Me	SOEt	Cl	Na ⁺	
1-31	Me	Me	SO ₂ Et	Cl	Na ⁺	
1-32	Me	Me	SMe	Br	Na ⁺	
1-33	Me	Me	SEt	Br	Na ⁺	
1-34	Me	Me	4,5-дигидро- 1,2-оксазол-3- ил	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-35	Et	Me	4,5-дигидро- 1,2-оксазол-3- ил	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-36	Me	Me	пиразол-1-ил	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-37	Et	Me	пиразол-1-ил	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-38	Me	Me	OMe	SO ₂ Me	Na ⁺	7.59 (d, 1H), 7.45 (d, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.67 (s, 3H), 3.16 (s, 3H), 2.42 (s, 3H)
1-39	Me	Me	SMe	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-40	Me	Me	SOMe	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-41	Me	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-42	Et	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-43	Me	Me	SEt	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-44	Me	Me	SOEt	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-45	Me	Me	SO ₂ Et	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-46	Et	Me	SO ₂ Et	SO ₂ Me	Na ⁺	

1-47	Me	Me	SCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-48	Me	Me	SOCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-49	Me	Me	SO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-50	Me	Et	SMe	CF ₃	Na ⁺	
1-51	Me	Et	SOMe	CF ₃	Na ⁺	
1-52	Me	Et	SO ₂ Me	CF ₃	Na ⁺	
1-53	Me	Et	SEt	CF ₃	Na ⁺	
1-54	Me	Et	SOEt	CF ₃	Na ⁺	
1-55	Me	Et	SO ₂ Et	CF ₃	Na ⁺	
1-56	Me	Et	SMe	Cl	Na ⁺	
1-57	Et	Et	SMe	Cl	Na ⁺	
1-58	Me	Et	SOMe	Cl	Na ⁺	
1-59	Me	Et	SEt	Cl	Na ⁺	
1-60	Me	Et	SOEt	Cl	Na ⁺	
1-61	Me	Et	SO ₂ Et	Cl	Na ⁺	
1-62	Me	Et	SMe	Br	Na ⁺	
1-63	Me	Et	SO ₂ Me	Br	Na ⁺	
1-64	Me	Pr	SMe	CF ₃	Na ⁺	
1-65	Me	Pr	SOMe	CF ₃	Na ⁺	
1-66	Me	c-Pr	SMe	CF ₃	Na ⁺	
1-67	Me	c-Pr	SOMe	CF ₃	Na ⁺	
1-68	Me	c-Pr	SO ₂ Me	CF ₃	Na ⁺	
1-69	Me	CH ₂ OMe	SMe	CF ₃	Na ⁺	
1-70	Me	CH ₂ OMe	SOMe	CF ₃	Na ⁺	
1-71	Me	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	CF ₃	Na ⁺	
1-72	Me	CH ₂ OMe	SEt	CF ₃	Na ⁺	
1-73	Me	CH ₂ OMe	SOEt	CF ₃	Na ⁺	
1-74	Me	CH ₂ OMe	SO ₂ Et	CF ₃	Na ⁺	
1-75	Me	CH ₂ OMe	SMe	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-76	Me	CH ₂ OMe	SOMe	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-77	Me	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-78	Me	OMe	SMe	CF ₃	Na ⁺	7.54 (d,1H), 7.43 (d,1H), 3.95 (s,3H), 3.69 (s,3H), 2.38 (s,3H)
1-79	Me	OMe	SMe	CF ₃	Me ₃ N(C ₂ H ₄ OH) ⁺	7.52 (d,1H), 7.42 (d,1H), 3.96 (s,3H), 3.82 (m,2H), 3.68 (s,3H), 3.37 (m,2H), 3.10 (s,9H), 2.38 (s,3H)
1-80	Me	OMe	SOMe	CF ₃	Na ⁺	7.78 (d,1H), 7.51 (d,1H), 3.99 (s,3H), 3.70 (s,3H), 3.04 (s,3H)

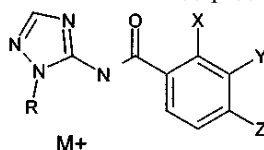
1-81	Me	OMe	SOMe	CF ₃	Me ₃ N(C ₂ H ₄ OH) ⁺	7.76 (d, 1H), 7.50 (d, 1H), 4.00 (s, 3H), 3.82 (m, 2H), 3.69 (s, 3H), 3.39 (m, 2H), 3.10 (s, 9H), 3.03 (s, 3H)
1-82	Me	OMe	SO ₂ Me	CF ₃	Na ⁺	
1-83	Me	OMe	SO ₂ Me	CF ₃	Me ₃ N(C ₂ H ₄ OH) ⁺	
1-84	Me	OMe	SMe	CHF ₂	Na ⁺	7.52 (d, 1H), 7.30 (t, 1H), 7.29 (d, 1H), 3.94 (s, 3H), 3.67 (s, 3H), 2.36 (s, 3H)
1-85	Me	OMe	SMe	CHF ₂	Pr ₄ N ⁺	7.51 (d, 1H), 7.30 (t, 1H), 7.29 (d, 1H), 3.94 (s, 3H), 3.67 (s, 3H), 3.12 (m, 8H), 2.36 (s, 3H), 1.61 (m, 8H), 0.90 (t, 12H)
1-86	Me	OMe	SMe	CHF ₂	Me ₃ N(C ₂ H ₄ OH) ⁺	7.51 (d, 1H), 7.30 (t, 1H), 7.29 (d, 1H), 3.94 (s, 3H), 3.84 (m, 2H), 3.67 (s, 3H), 3.34 (m, 2H), 3.11 (s, 9H), 2.36 (s, 3H)
1-87	Et	OMe	SMe	CHF ₂	Na ⁺	7.50 (d, 1H), 7.30 (t, 1H), 7.29 (d, 1H), 4.09 (q, 2H), 3.94 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 1.33 (t, 3H)
1-88	Et	OMe	SMe	CHF ₂	Pr ₄ N ⁺	7.49 (d, 1H), 7.30 (t, 1H), 7.29 (d, 1H), 4.08 (q, 2H), 3.94 (s, 3H), 3.12 (m, 8H), 2.35 (s, 3H), 1.61 (m, 8H), 1.33 (t, 3H), 0.90 (t, 12H)
1-89	Et	OMe	SMe	CHF ₂	Me ₃ N(C ₂ H ₄ OH) ⁺	7.49 (d, 1H), 7.30 (t, 1H), 7.29 (d, 1H), 4.08 (q, 2H), 3.94 (s, 3H), 3.84 (m, 2H), 3.36 (m, 2H), 3.10 (s, 9H), 2.35 (s, 3H), 1.33 (t, 3H)
1-90	Me	OMe	SOMe	CHF ₂	Na ⁺	8.02 (t, 1H), 7.76 (d, 1H), 7.48 (d, 1H), 3.93 (s, 3H), 3.67 (s, 3H), 2.93 (s, 3H)
1-91	Me	OMe	SOMe	CHF ₂	Pr ₄ N ⁺	8.01 (t, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.48 (d, 1H), 3.93 (s, 3H), 3.66 (s, 3H), 3.12 (m, 8H), 2.93 (s, 3H), 1.61 (m, 8H), 0.90 (t, 12H)
1-92	Me	OMe	SOMe	CHF ₂	Me ₃ N(C ₂ H ₄ OH) ⁺	8.01 (t, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.48 (d, 1H), 3.93 (s, 3H), 3.83 (m, 2H), 3.66 (s, 3H), 3.39 (m, 2H), 3.10 (s, 9H), 2.93 (s, 3H)
1-93	Et	OMe	SOMe	CHF ₂	Na ⁺	

1-94	Et	OMe	SOMe	CHF ₂	Pr ₄ N ⁺	
1-95	Et	OMe	SOMe	CHF ₂	Me ₃ N(C ₂ H ₄ OH) ⁺	
1-96	Me	OMe	SO ₂ Me	CHF ₂	Na ⁺	
1-97	Me	OMe	SO ₂ Me	CHF ₂	Pr ₄ N ⁺	
1-98	Me	OMe	SO ₂ Me	CHF ₂	Me ₃ N(C ₂ H ₄ OH) ⁺	
1-99	Et	OMe	SO ₂ Me	CHF ₂	Na ⁺	
1-100	Et	OMe	SO ₂ Me	CHF ₂	Pr ₄ N ⁺	
1-101	Et	OMe	SO ₂ Me	CHF ₂	Me ₃ N(C ₂ H ₄ OH) ⁺	
1-102	Me	OMe	SEt	CF ₃	Na ⁺	
1-103	Me	OMe	SOEt	CF ₃	Na ⁺	
1-104	Me	OMe	SO ₂ Et	CF ₃	Na ⁺	
1-105	Me	Cl	SMe	H	Na ⁺	
1-106	Me	Cl	SO ₂ Me	Me	Na ⁺	7.67 (d, 1H), 7.41 (d, 1H), 3.81 (s, 3H), 3.40 (s, 3H), 2.69 (s, 3H)
1-107	Me	Cl	SO ₂ Et	Me	Na ⁺	
1-108	Me	Cl	SMe	CF ₃	Na ⁺	
1-109	Me	Cl	SOMe	CF ₃	Na ⁺	
1-110	Me	Cl	SO ₂ Me	CF ₃	Na ⁺	
1-111	Me	Cl	OC ₂ H ₄ OMe	Cl	Na ⁺	
1-112	Me	Cl	SMe	Cl	Na ⁺	
1-113	Et	Cl	SMe	Cl	Na ⁺	
1-114	Me	Cl	SOMe	Cl	Na ⁺	
1-115	Et	Cl	SOMe	Cl	Na ⁺	
1-116	Me	Cl	SO ₂ Me	Cl	Na ⁺	
1-117	Et	Cl	SO ₂ Me	Cl	Na ⁺	
1-118	Me	Cl	SEt	Cl	Na ⁺	
1-119	Me	Cl	SOEt	Cl	Na ⁺	
1-120	Me	Cl	SO ₂ Et	Cl	Na ⁺	
1-121	Me	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	Na ⁺	7.90 (d, 1H), 7.60 (d, 1H), 4.96 (s, 2H), 3.69 (s, 3H), 3.40 (s, 3H), 3.29 (s, 3H)
1-122	Me	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	K ⁺	7.90 (d, 1H), 7.60 (d, 1H), 4.96 (s, 2H), 3.69 (s, 3H), 3.40 (s, 3H), 3.29 (s, 3H)
1-123	Me	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	Pr ₄ N ⁺	7.90 (d, 1H); 7.60 (d, 1H); 4.96 (s, 2H); 3.70 (s, 3H); 3.40 (s, 3H); 3.28 (s, 3H); 3.12 (m, 8H); 1.61 (m, 8H); 0.90 (t, 12H)

1-124	Me	Cl	CH ₂ OMe	SO ₂ Me	Me ₃ N(C ₂ H ₄ OH) ⁺	7.90 (d, 1H); 7.60 (d, 1H); 5.52 (br s, 1H); 4.96 (s, 2H); 3.83 (m, 2H); 3.70 (s, 3H); 3.40 (s, 3H); 3.40 (m, 2H); 3.29 (s, 3H); 3.10 (s, 9H)
1-125	Me	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-126	Et	Cl	CH ₂ OCH ₂ CF ₃	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-127	Me	Cl	CH ₂ OC ₂ H ₄ OMe	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-128	Me	Cl	4,5-дигидро-1,2-оксазол-3-ил	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-129	Me	Cl	4,5-дигидро-1,2-оксазол-3-ил	SO ₂ Et	Na ⁺	
1-130	Me	Cl	5-метоксиметил-4,5-дигидро-1,2-оксазол-3-ил	SO ₂ Et	Na ⁺	
1-131	Me	Cl	OMe	SO ₂ Me	Na ⁺	7.71 (d, 1H), 7.42 (d, 1H), 3.96 (s, 3H), 3.69 (s, 3H), 3.16 (s, 3H)
1-132	Me	Cl	OMe	SO ₂ Et		
1-133	Me	Cl	OEt	SO ₂ Me	Na ⁺	7.71 (d, 1H), 7.41 (d, 1H), 4.19 (q, 2H), 3.69 (s, 3H), 3.16 (s, 3H), 1.43 (t, 3H)
1-134	Me	Cl	OEt	SO ₂ Et	Na ⁺	
1-135	Me	Cl	OPr	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-136	Me	Cl	OPr	SO ₂ Et	Na ⁺	
1-137	Me	Cl	Oi-Bu	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-138	Me	Cl	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Me	Na ⁺	7.71 (d, 1H), 7.41 (d, 1H), 3.97 (d, 2H), 3.69 (s, 3H), 3.16 (s, 3H), 1.30-1.42 (m, 1H), 0.58-0.65 (m, 2H), 0.40-0.45 (m, 2H)
1-139	Me	Cl	OCH ₂ c-Pr	SO ₂ Et	Na ⁺	
1-140	Me	Cl	OC ₂ H ₄ OMe	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-141	Me	Cl	O(CH ₂) ₃ OMe	SO ₂ Me	Na ⁺	7.72 (d, 1H), 7.42 (d, 1H), 4.19 (t, 2H), 3.69 (s, 3H), 3.55 (t, 2H), 3.32 (s, 3H), 3.31 (s, 3H), 2.07 (quin, 2H)
1-142	Me	Cl	SMe	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-143	Me	Cl	SOMe	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-144	Me	Cl	SO ₂ Me	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-145	Me	Cl	SEt	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-146	Me	Cl	SOEt	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-147	Me	Cl	SO ₂ Et	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-148	Me	Cl	SCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-149	Me	Cl	SOCH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	Na ⁺	
1-150	Me	Cl	SO ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	SO ₂ Me	Na ⁺	

Таблица 2

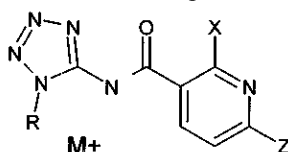
Соединения общей формулы (1), где А представляет собой СУ, В представляет собой СН и W представляет собой водород



№	R	X	Y	Z	M ⁺	Физические данные (¹ H-ЯМР, ДМСО-d ₆ 400 МГц)
2-1	Me	Me	SO ₂ Me	CF ₃	Na ⁺	
2-2	Me	Me	4,5-дигидро-1,2-оксазол-3-ил	SO ₂ Me	Na ⁺	
2-3	Me	Me	пиразол-1-ил	SO ₂ Me	Na ⁺	
2-4	Me	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Me	Na ⁺	
2-5	Me	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Me	Na ⁺	8.07 (d,1H), 7.77 (d,1H), 7.43 (s,1H), 3.52 (s,6H), 3.50 (s,3H), 2.51 (s,3H)
2-6	Me	Me	SO ₂ Me	SO ₂ Me	Me ₃ N(C ₂ H ₄ OH) ⁺	8.04 (d,1H), 7.71 (d,1H), 7.36 (s,1H), 3.83 (m,2H), 3.52 (s,3H), 3.50 (s,3H), 3.48 (s,3H), 3.39 (m,2H), 3.10 (s,9H), 2.53 (s,3H)
2-7	Me	Cl	SO ₂ Me	Cl	Na ⁺	
2-8	Me	Cl	4,5-дигидро-1,2-оксазол-3-ил	SO ₂ Me	Na ⁺	
2-9	Me	Cl	4,5-дигидро-1,2-оксазол-3-ил	SO ₂ Et	Na ⁺	
2-10	Me	Cl	OC ₂ H ₄ OMe	SO ₂ Me	Na ⁺	

Таблица 3

Соединения общей формулы (I), где А представляет собой N и В представляет собой N и W представляет собой водород



№	R	X	Z	M ⁺	Физические данные (¹ H-ЯМР, ДМСО-d ₆ 400 МГц)
3-1	Me	Me	CF ₃	Na ⁺	8.18 (d,1H), 7.66 (d,1H), 3.68 (s,3H), 2.73 (s,3H)
3-2	Me	Me	CF ₃	Pr ₄ N ⁺	8.15 (d,1H), 7.64 (d,1H), 3.66 (s,3H), 3.12 (m,8H), 2.72 (s,3H), 1.61 (m,8H), 0.89 (t,12H)
3-3	Me	Me	CF ₃	Me ₃ N(C ₂ H ₄ OH) ⁺	8.15 (d,1H), 7.64 (d,1H), 3.85 (m,2H), 3.67 (s,3H), 3.27 (m,2H), 3.12 (s,9H), 2.72 (s,3H)
3-4	Me	CH ₂ OMe	CF ₃	Na ⁺	8.29 (d,1H), 7.78 (d,1H), 4.93 (s,2H), 3.69 (s,3H), 3.29 (s,3H)
3-5	Me	CH ₂ OMe	CF ₃	Me ₃ N(C ₂ H ₄ OH) ⁺	8.27 (d,1H), 7.77 (d,1H), 4.92 (s,2H), 3.83 (m,2H), 3.68 (s,3H), 3.38 (m,2H), 3.30 (s,3H), 3.10 (s,9H)
3-6	Et	CH ₂ OMe	CF ₃	Na ⁺	
3-7	Me	CH ₂ OC ₂ H ₄ OMe	CF ₃	Na ⁺	
3-8	Et	CH ₂ OC ₂ H ₄ OMe	CF ₃	Na ⁺	
3-9	Me	CH ₂ OCH ₂ c-Pr	CF ₃	Na ⁺	
3-10	Me	Cl	CF ₃	Me ₃ N(C ₂ H ₄ OH) ⁺	8.14 (d,1H), 7.88 (d,1H), 3.83 (m,2H), 3.70 (s,3H), 3.39 (m,2H), 3.10 (s,9H)
3-11	Me	Cl	CF ₃	Na ⁺	
3-12	Me	Br	CF ₃	Na ⁺	
3-13	Me	SO ₂ Me	CF ₃	Na ⁺	

Б. Примеры композиций.

а) Пылеобразное вещество получают путем смешивания 10 мас.ч. соединения формулы (I) и/или его соли и 90 мас.ч. талька в качестве инертного вещества и измельчения смеси в молотковой мельнице;

б) легко диспергируемый в воде, смачиваемый порошок получают смешиванием 25 мас.ч. соединения формулы (I) и/или его соли, 64 мас.ч. каолин-содержащего кварца в качестве инертного вещества, 10 мас.ч. лигносульфоната калия и 1 мас.ч. олеилметилтаурата натрия в качестве смачивающего агента и диспергирующего агента, и измельчения смеси в стержневой мельнице;

в) легко диспергируемый в воде концентрат дисперсии получают смешиванием 20 мас.ч. соедине-

ния формулы (I), и/или его соли с 6 мас.ч. алкилфенольного полигликолевого эфира (®Triton X 207), 3 мас.ч. изотридеканолполигликолевого эфира (8 EO) и 71 мас.ч. парафинового минерального масла (диапазон кипения, например, около 255 до выше 277°C), и измельчения смеси в шаровой мельнице до тонкости менее 5 мкм;

г) эмульгируемый концентрат получают из 15 мас.ч. соединения формулы (I) и/или его соли, 75 мас.ч. циклогексанона как растворителя и 10 мас.ч. этоксилированного нонилфенола в качестве эмульгатора;

д) гранулы, диспергируемые в воде, получают путем смешивания

75 мас.ч. соединения формулы (I) и/или его солей;

10 мас.ч. лигносульфоната кальция;

5 мас.ч. лаурилсульфата натрия;

3 мас.ч. поливинилового спирта;

7 мас.ч. каолина;

перемалывания в стержневой мельнице и гранулирования порошка в псевдоожиженном слое путем распыления воды в качестве гранулирующей жидкости;

е) гранулы, диспергируемые в воде, получают также путем гомогенизации и предварительного размалывания

25 мас.ч. соединения формулы (I) и/или его солей;

5 мас.ч. натрий 2,2'-динафтилметан-6,6'-дисульфоната;

2 мас.ч. натрий олеилметилтаурата;

1 часть по массе поливинилового спирта;

17 мас.ч. карбоната кальция;

50 мас.ч. воды

в коллоидной мельнице, а затем измельчения смеси в шаровой мельнице и распыления и сушкой полученной суспензии в распылительной башне посредством однофазного сопла.

В. Биологические примеры.

1. Предвсходовое гербицидное действие против сорных растений.

Семена однодольных и двудольных сорных растений и культурных растений помещали в древесноволокнистые горшки в супесь и засыпали грунтом. Соединения согласно изобретению, полученные в виде смачиваемых порошков (WP) или, в виде эмульсионных концентратов (EC), затем применяли в водной суспензии или эмульсии с нормой растраты воды от 600 до 800 л/га (в пересчете) с добавлением 0.2% увлажняющего агента к поверхности покрывающего грунта. После обработки горшки помещали в теплицу и выдерживали в хороших условиях роста для испытуемых растений. Повреждение тестируемых растений оценивали визуально после испытательного срока в 3 недели по сравнению с необработанными контрольными растениями (гербицидное действие в процентах (%): 100% эффективности = растения погибли, 0% эффективности = как контрольные растения).

Так, например, соединения № 1-2, 1-3, 1-4, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-78, 1-79, 1-80, 1-84, 1-86, 1-87, 1-89, 1-91, 1-92, 1-121, 1-122, 1-123, 1-124, 1-131, 1-133, 1-138, 1-141, 2-06, 3-04, 3-05, 3-10 имеют в каждом случае эффективность по меньшей мере 80% против *Echinochloa crus galli*, *Setaria viridis*, *Abutilon theophrasti*, *Amaranthus retroflexus*, *Matricaria inodora*, *Stellaria media*, *Viola tricolor* и *Veronica persica* при норме применения 320 г/га.

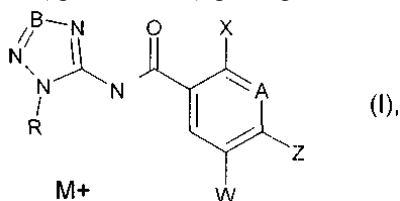
2. Послевсходовое гербицидное действие против сорных растений.

Семена однодольных и двудольных сорняков и культурных растений помещали в супесь в древесноволокнистых горшках, покрывали почвой и выращивали в теплице при хороших условиях для роста. От 2 до 3 недель после посева испытуемые растения обрабатывали на стадии одного листа. Соединения согласно изобретению, изготовленные в виде смачиваемых порошков (WP) или в виде концентратов эмульсии (EC), затем распыляются в водной суспензии или эмульсии с нормой растраты воды от 600 до 800 л/га (в пересчете) с добавлением 0.2% увлажняющего агента на зеленые части растений. После того как испытуемые растения были оставлены стоять в теплице в оптимальных условиях роста в течение примерно 3 недель, эффективность составов оценивали визуально по сравнению с необработанными контрольными растениями (гербицидное действие в процентах (%): 100% эффективности = растения погибли, 0% эффективности = как контрольные растения).

Так, например, соединения № 1-02, 1-03, 1-04, 1-07, 1-08, 1-11, 1-12, 1-13, 1-14, 1-36, 1-38, 1-78, 1-79, 1-80, 1-81, 1-84, 1-85, 1-86, 1-87, 1-88, 1-89, 1-91, 1-106, 1-121, 1-122, 1-123, 1-124, 1-131, 1-133, 1-138, 1-141 и 2-06 имеют в каждом случае эффективность по меньшей мере 80% против *Echinochloa crus galli*, *Matricaria inodora*, *Pharbitis purpureum*, *Stellaria media* и *Veronica persica* при норме применения 80 г/га.

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

1. Соль N-(тетразол-5-ил)- или N-(триазол-5-ил)арилкарбоксамида формулы (I)



где А представляет собой СY;

В представляет собой N или CH;

X представляет собой галоген, (C₁-C₆)алкил, OR¹, S(O)_nR² или (C₁-C₆)алкил-OR¹;

Y представляет собой водород, S(O)_nR² или (C₁-C₆)алкил-OR¹;

Z представляет собой галоген(C₁-C₆)алкил или S(O)_nR², или

W представляет собой (C₁-C₆)алкил, если Y представляет собой S(O)_nR² радикал;

R представляет собой (C₁-C₈)алкил;

R¹ представляет собой (C₁-C₆)алкил;

R² представляет собой (C₁-C₆)алкил;

M⁺ представляет собой ион натрия, ион тетрапропиламмония или ион N-(2-гидроксиэт-1-ил)-N,N,N-триметиламмония;

n представляет собой 0, 1 или 2.

2. Гербицидная композиция, которая отличается гербицидно-эффективным количеством по меньшей мере одного соединения формулы (I), как указано в п.1.

3. Гербицидная композиция по п.2 в смеси со вспомогательными веществами.

4. Гербицидная композиция по п.2 или 3, которая содержит по меньшей мере одно дополнительное пестицидно активное вещество из группы инсектицидов, акарицидов, гербицидов, фунгицидов, антидотов и регуляторов роста.

5. Гербицидная композиция по п.4, содержащая защитное вещество.

6. Гербицидная композиция по п.5, включающая ципросульфамид, клохинтоцет-мексил, мефенпир-диэтил или изоксадифен-этил.

7. Гербицидная композиция по любому из пп.4-6, включающая дополнительно гербицид.

8. Способ борьбы с нежелательными растениями, который отличается тем, что эффективное количество по меньшей мере одного соединения формулы (I) по п.1 или гербицидной композиции по любому из пп.2-7 применяют к растению или к месту нежелательной растительности.

9. Применение соединения формулы (I) по п.1 или содержащей его гербицидной композиции по любому из пп.2-7 для борьбы с нежелательными растениями.

10. Применение по п.9, которое отличается тем, что соединения формулы (I) используются для борьбы с нежелательными растениями в культурах полезных растений.

11. Применение по п.10, которое отличается тем, что полезные растения представляют собой трансгенные полезные растения.



Евразийская патентная организация, ЕАПВ

Россия, 109012, Москва, Малый Черкасский пер., 2