УКРАЇНА

(19) UA (11) 130893 (13) C2

(51) МПК (2026.01)
C07D 237/16 (2006.01)
A01N 43/58 (2006.01)
A01P 13/00

НАЦІОНАЛЬНИЙ ОРГАН ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ ВЛАСНОСТІ
ДЕРЖАВНА ОРГАНІЗАЦІЯ "УКРАЇНСЬКИЙ НАЦІОНАЛЬНИЙ ОФІС ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ ВЛАСНОСТІ ТА ІННОВАЦІЙ"

(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД

(21) Номер заявки: **a 2022 04025**

(22) Дата подання заявки: **31.03.2021**

(24) Дата, з якої є чинними права інтелектуальної власності: **11.06.2026**

(31) Номер попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції: **63/003,888**

(32) Дата подання попередньої заявки відповідно до Паризької конвенції: **01.04.2020**

(33) Код держави-учасниці Паризької конвенції, до якої подано попередню заявку: **US**

(41) Публікація відомостей про заявку: **05.04.2023, Бюл.№ 14**

(46) Публікація відомостей про державну реєстрацію: **10.06.2026, Бюл.№ 23**

(86) Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору PCT **PCT/US2021/025240, 31.03.2021**

(72) Винахідник(и):
Селбі Томас Пол (US),
Дебергх Джон Роббінс (US),
Стівенсон Томас Мартін (US),
МакКанн Стефен Фредерік (US)

(73) Володілець (володільці):
ЕФЕМСІ КОРПОРЕЙШН,
2929 Walnut Street Philadelphia, PA 19104, United States of America (US)

(74) Представник:
Мамуня Олександр Сергійович, реєстр. №357

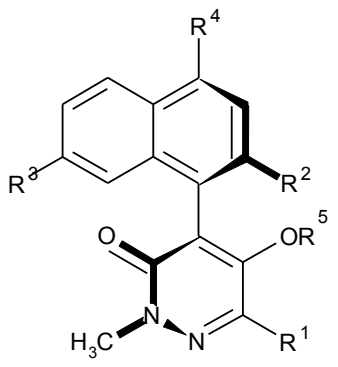
(56) Перелік документів, взятих до уваги експертизою:
WO 2015/168010 A1, 05.11.2015
ZASK ARIE et al. Biological Stereoselectivity of Atropisomeric Naturall Products and Drugs: BIOLOGICALSTEREOSELECTIVITY OF ATROPISOMERIC NATURAL PRODUCTS AND DRUGS// CHIRALITY, vol. 25, no. 5, 01.05.2013, pages 265-274

UA 130893 C2

(54) АТРОПОІЗОМЕРИ ПІРИДАЗИНОНОВИХ ПОХІДНИХ ЯК ГЕРБІЦИДИ

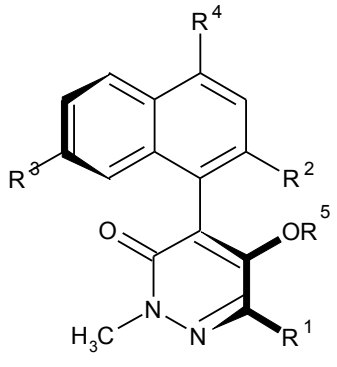
(57) Реферат:

Винахід стосується атропоізомерів піридазинонових похідних сполуки формули 1a та формули 1b, де R^1, R^2, R^3, R^4 та R^5 є такими, як визначено у формулі винаходу. Також розкрита композиція, яка містить сполуку формули 1a або 1b, та спосіб здійснення контролю небажаної рослинності, за яким небажану рослинність або її середовища зростання приводять в контакт з ефективною кількістю сполуки формули 1a або 1b або її композиції.



1a

та



1b

Галузь техніки, до якої належить винахід

Даний винахід стосується стереоізомерів деяких піридазинонових похідних, їхніх N-оксидів, солей та композицій і способів їх застосування для здійснення контролю небажаної рослинності. Більш конкретно даний винахід стосується атропоізомерів деяких піридазинонових похідних, їхніх N-оксидів, солей та композицій і способів їх застосування як гербіцидів.

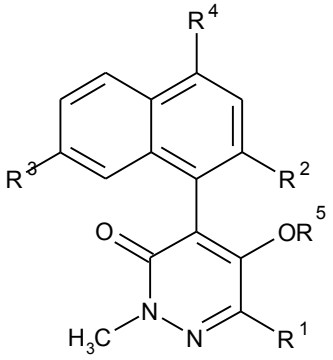
Передумови винаходу

Контроль небажаної рослинності є надзвичайно важливим для досягнення високої ефективності сільськогосподарської культури. Дуже бажано досягти селективного контролю росту бур'янів, особливо в таких корисних сільськогосподарських культурах, як, серед іншого, рис, соя, цукровий буряк, маїс, картопля, пшениця, ячмінь, томат і плантаційні сільськогосподарські культури. Безконтрольний ріст бур'янів у таких корисних сільськогосподарських культурах може зумовлювати значне зниження продуктивності та тим самим призводити до підвищення вартості для споживача. Контроль небажаної рослинності на територіях, що не засіваються, також є важливим. Багато продуктів є комерційно доступними для таких цілей, але продовжує існувати необхідність у нових сполуках, які є більш ефективними, менш дорогими, менш токсичними, більш безпечними стосовно навколишнього середовища або які характеризуються іншими місцями прикладання дії.

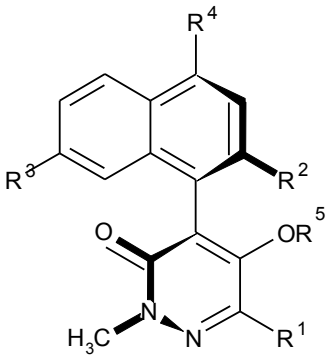
У WO 2015/168010 та WO 2017/074988 розкриті гербіцидні піридазинони та синтетичні проміжні сполуки, які застосовують для одержання гербіцидних піридазинонів.

Суть винаходу

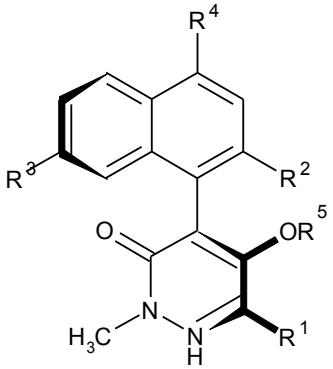
Даний винахід передбачає оптично активні атропоізомери піридазинонових похідних сполуки формули 1a та формули 1b, їхні N-оксиди або солі; при цьому сполука формули 1 являє собою рацемічну суміш атропоізомеру формули 1a та атропоізомеру формули 1b,



1 (рацемат 1a та 1b)



1a



1b

де

R^1 являє собою CH_3 або галоген;

R^2 являє собою CH_3, CH_2CH_3, галоген, трифторметил або дифторметокси;

R^3 являє собою H, CH_3 або галоген;

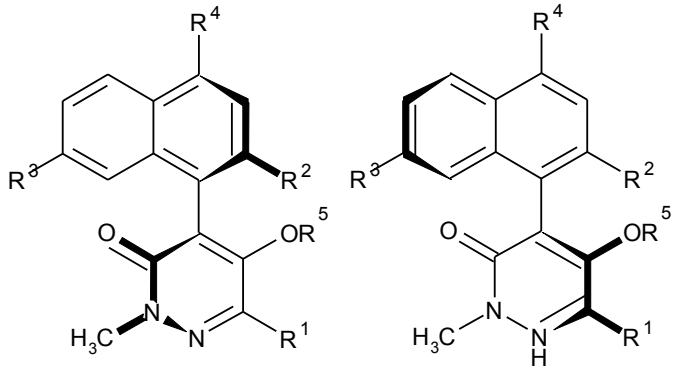
R^4 являє собою H, CH_3 або галоген;

R^5 являє собою H, C_1-C_4алкілкарбоніл, C_1-C_4алкоксикарбоніл або C_1-C_4алкілкарбоксиметил;

де

атропоізомер формули 1a або 1b, його N-оксид або сіль наявні в надлишку відносно його відповідного енантіомеру або його N-оксиду або солі.

В іншому аспекті даний винахід передбачає спосіб одержання сполуки формули 1a або 1b;



1a 1b

де

R^1 являє собою CH_3 або галоген;

R^2 являє собою CH_3, CH_2CH_3, галоген, трифторметил або дифторметокси;

R^3 являє собою H, CH_3 або галоген;

R^4 являє собою H, CH_3 або галоген;

R^5 являє собою H, C_1-C_4алкілкарбоніл, C_1-C_4алкоксикарбоніл або C_1-C_4алкілкарбоксиметил;

при цьому спосіб включає:

1) завантаження рацемічної суміші сполуки формули 1, що містить атропоізомери формул 1a й 1b, у хроматографічну колонку з хіральним наповнювачем та елюювання за допомогою рухомої фази;

2) виділення двох окремих фракцій із різними значеннями часу утримування, причому однієї, що містить атропоізомер із позитивним знаком обертання площини поляризації світла $[\alpha]_1$ (+), та однієї, що містить атропоізомер із негативним знаком обертання площини поляризації світла $[\alpha]_1$ (-).

Докладний опис винаходу

Застосовувані в даному документі терміни “передбачає”, “що передбачає”, “включає”, “що включає”, “має”, “що має”, “містить”, “що містить”, “що характеризується” або будь-які інші їхні варіації призначені для охоплення невиключного включення з урахуванням будь-якого явно вказаного обмеження. Наприклад, процес або спосіб, які передбачають перелік елементів, не обов’язково обмежені тільки цими елементами, а можуть включати інші елементи, явно не перелічені або не властиві такій композиції, процесу або способу.

Перехідна фраза “що складається з” виключає будь-який незазначений елемент, стадію або інгредієнт. Якщо згадана фраза наявна у пункті формули винаходу, вона буде обмежувати включення до пункту формули винаходу матеріалів, відмінних від тих, які вказані, за винятком домішок, зазвичай пов’язаних із ними. Якщо фраза “що складається з” з’являється у формулюванні відмітної частини формули винаходу, а не безпосередньо після обмежувальної частини, вона обмежує тільки елемент, наведений у цьому формулюванні; інші елементи загалом не виключаються з пункту формули винаходу.

Перехідна фраза “що по суті складається з” використовується для визначення способу або методу, які включають матеріали, стадії, ознаки, компоненти або елементи на додаток до тих, які буквально розкриті, за умови, що такі додаткові матеріали, стадії, ознаки, компоненти або елементи суттєво не впливають на основну(-і) і нову(-і) характеристику(-и) винаходу. Термін “що по суті складається з” є проміжним варіантом між “що містить” і “що складається з”.

При цьому, якщо заявники визначили винахід або його частину за допомогою необмежувального терміна, такого як “що містить”, слід чітко розуміти, що (якщо не вказано інше) цей опис необхідно інтерпретувати як такий, що також описує даний винахід із застосуванням термінів “що по суті складається з” або “що складається з”.

Крім того, якщо явно не вказане інше, “або” стосується такого “або”, що включає, а не такого “або”, що виключає. Наприклад, умова A або B задовольняється будь-чим із наступного: A є істинним (або наявним), а B є хибним (або не наявним), A є хибним (або не наявним), а B є істинним (або наявним), та обидва A та B є істинними (або наявними).

Також елемент або компонент за даним винаходом у формі однини розглядається як необмежувальний щодо кількості представлень (тобто появ) елемента або компонента. Отже, форму однини слід вважати такою, що включає один або щонайменше один елемент або компонент, при цьому форма однини елемента або компонента також включає форму множини, якщо кількість явно не передбачає форму однини.

Термін “C_1-C_4алкіл” включає алкіл із прямим або розгалуженим ланцюгом, що містить від одного до чотирьох атомів вуглецю, наприклад, метил, етил, н-пропіл, ізопропіл або різні ізомери бутилу. Застосовуваний у даному документі термін “галоген” включає фтор, хлор, бром або йод. Термін “C_1-C_4алкілкарбоніл”, застосовуваний у даному документі, стосується C_1-C_4алкілу, зв’язаного за допомогою карбонілу. Термін “C_1-C_4алкоксикарбоніл” стосується “C_1-C_4алкоксигрупи, зв’язаної за допомогою карбонілу. Термін “C_1-C_4алкілкарбоксиметил” стосується (C_1-C_4алкіл)C=O групи, зв’язаної за допомогою -CH_2- групи.

Сполуки формули 1a та формули 1b, як правило, можуть незалежно існувати в різних твердих формах. Отже, сполука формули 1a та формули 1b включає всі кристалічні та некристалічні форми сполук, які вони представляють. Некристалічні форми включають варіанти здійснення, які являють собою тверді речовини, такі як види воску і смоли, а також варіанти здійснення, які являють собою рідини, такі як розчини і розплави. Кристалічні форми включають варіанти здійснення, які представляють по суті монокристалічний тип, і варіанти здійснення, які є сумішшю поліморфів (тобто різних кристалічних типів). Термін “поліморф” стосується конкретної кристалічної форми хімічної сполуки, яка може кристалізуватися в різні кристалічні форми, при цьому такі форми характеризуються різним групуванням та/або конформаціями молекул у кристалічній решітці. Хоча поліморфи можуть мати однаковий хімічний склад, вони також можуть відрізнятися за складом унаслідок наявності або відсутності співкристалізованої води або інших молекул, які можуть бути слабко або сильно зв’язані в решітці. Поліморфи можуть відрізнятися за хімічними, фізичними та біологічними властивостями, такими як кристалічна форма, густина, твердість, колір, хімічна стабільність, точка плавлення, гігроскопічність, здатність до суспендування, швидкість розчинення та біологічна доступність.

Фахівець у цій галузі техніки зрозуміє, що поліморф сполуки формули 1a та формули 1b може виявляти сприятливі ефекти (наприклад, придатність для одержання застосовних складів, покращена біологічна ефективність) порівняно з іншим поліморфом або сумішшю поліморфів тієї самої сполуки формули 1a та формули 1b. Одержання і виділення конкретного поліморфу сполуки формули 1a та формули 1b можна досягти за допомогою способів, відомих фахівцям у цій галузі техніки, у тому числі, наприклад, кристалізації із застосуванням вибраних розчинників та температур. Для вичерпного розгляду поліморфізму див. R. Hilfiker, Ed., Polymorphism in the Pharmaceutical Industry, Wiley-VCH, Weinheim, 2006.

Ілюстративні процедури одержання N-оксидів включають окиснення гетероциклів і третинних амінів за допомогою пероксикислот, таких як пероцтова і м-хлорпербензойна кислота (MCPBA), пероксиду водню, алкілгідропероксидів, таких як трет-бутилгідропероксид, перборату натрію і діоксиранів, таких як диметилдіоксиран. Такі способи одержання N-оксидів були змістовно описані і розглянуті в літературі, див., наприклад, T. L. Gilchrist у Comprehensive Organic Synthesis, том 7, с. 748-750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler і B. Stanovnik у Comprehensive Heterocyclic Chemistry, том 3, с. 18-20, A. J. Boulton і A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M. R. Grimmett і B. R. T. Keene в Advances in Heterocyclic Chemistry, том 43, с. 149-161, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler і B. Stanovnik в Advances in Heterocyclic Chemistry, том 9, с. 285-291, A. R. Katritzky і A. J. Boulton, Eds., Academic Press і G. W. H. Cheeseman і E. S. G. Werstiuk в Advances in Heterocyclic Chemistry, том 22, с. 390-392, A. R. Katritzky і A. J. Boulton, Eds., Academic Press. Проте фахівець у цій галузі техніки зрозуміє, що не всі азотовмісні гетероцикли здатні утворювати N-оксиди, оскільки для атома азоту потрібна доступна неподілена пара для окиснення в оксид; фахівець у цій галузі техніки відрізнить ті азотовмісні гетероцикли, які здатні утворювати N-оксиди.

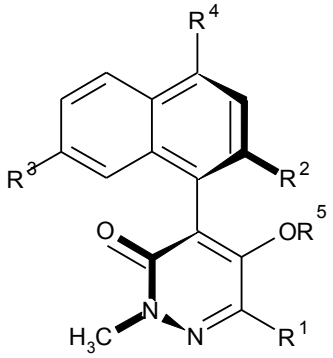
Сполуки за даним винаходом можуть існувати у вигляді одного або декількох стереоізомерів. Різні стереоізомери включають енантіомери, діастереомери, атропоізомери і геометричні ізомери. Стереоізомери являють собою ізомери ідентичного складу, але з відмінною конфігурацією їхніх атомів у просторі та включають енантіомери, діастереомери, цис-транс-ізомери (також відомі як геометричні ізомери) й атропоізомери. Атропоізомери утворюються внаслідок обмеженого обертання навколо одинарних зв’язків, де обертальний бар’єр є досить високим, щоб дозволяти виділення ізомерних сполук. Фахівець у цій галузі техніки зрозуміє, що один атропоізомер може бути більш активним і/або може проявляти сприятливі ефекти, коли є збагаченим (тобто наявним у надлишку) відносно іншого(-их) атропоізомеру(-ів) або відокремленим від іншого(-их) атропоізомеру(-ів). Сполуки за даним

винаходом можуть знаходитись у вигляді суміші атропоізомерів, окремого атропоізомеру або у вигляді оптично активної форми, необов'язково один атропоізомер наявний у надлишку відносно його відповідного енантіомеру.

Зокрема, сполуки за даним винаходом містять атропоізомер, який є більш активним, ніж інший атропоізомер.

Деякі необмежувальні варіанти здійснення даного винаходу (де сполука формули 1a та формули 1b також включає її N-оксиди або солі):

Варіант здійснення A1. Оптично активна сполука, що містить (або складається з) атропоізомер сполуки формули 1a або його N-оксид або сіль, яка наявна в надлишку відносно її відповідного енантіомеру формули 1b або його N-оксиду або солі.



1a

Варіант здійснення A2. Сполука за варіантом здійснення A1, де R^1 являє собою CH_3.

Варіант здійснення A3. Сполука за варіантом здійснення A1, де R^1 являє собою галоген.

Варіант здійснення A4. Сполука за варіантом здійснення A3, де R^1 являє собою Cl, F або Br.

Варіант здійснення A5. Сполука за варіантом здійснення A4, де R^1 являє собою Cl або CH_3.

Варіант здійснення A6. Сполука за варіантом здійснення A5, де R^1 являє собою Cl.

Варіант здійснення A7. Сполука за будь-яким із варіантів здійснення A1-A6, де R^2 являє собою CH_3, CH_2CH_3, галоген або дифторметокси.

Варіант здійснення A8. Сполука за варіантом здійснення A7, де R^2 являє собою CH_3, CH_2CH_3, Cl або дифторметокси.

Варіант здійснення A9. Сполука за варіантом здійснення A8, де R^2 являє собою CH_3 або дифторметокси.

Варіант здійснення A10. Сполука за варіантом здійснення A9, де R^2 являє собою CH_3.

Варіант здійснення A11. Сполука за будь-яким із варіантів здійснення A1-A10, де R^3 являє собою H або CH_3.

Варіант здійснення A12. Сполука за варіантом здійснення A11, де R^3 являє собою H.

Варіант здійснення A13. Сполука за варіантом здійснення A12, де R^3 являє собою CH_3.

Варіант здійснення A14. Сполука за будь-яким із варіантів здійснення A1-A13, де R^4 являє собою H, CH_3 або Cl.

Варіант здійснення A15. Сполука за варіантом здійснення A14, де R^4 являє собою Cl.

Варіант здійснення A16. Сполука за варіантом здійснення A14, де R^4 являє собою CH_3.

Варіант здійснення A17. Сполука за варіантом здійснення A14, де R^4 являє собою H.

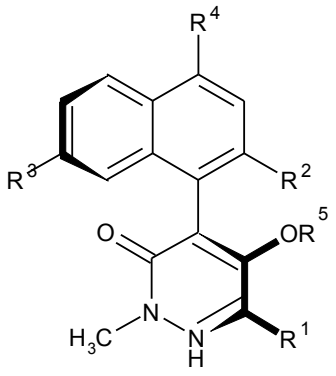
Варіант здійснення A18. Сполука за будь-яким із варіантів здійснення A1-A17, де R^5 являє собою H, C_3алкілкарбоніл, C_3алкоксикарбоніл або C_3алкілкарбоксиметил.

Варіант здійснення A19. Сполука за варіантом здійснення A18, де R^5 являє собою H або C_3алкілкарбоніл.

Варіант здійснення A20. Сполука за варіантом здійснення A18, де R^5 являє собою H або -$(C{=}O)CH_2CH_3$.

Варіант здійснення A21. Сполука за варіантом здійснення A20, де R^5 являє собою H.

Варіант здійснення AA1. Оптично активна сполука, що складається з атропоізомеру сполуки формули 1b або його N-оксиду або солі, яка наявна в надлишку відносно її відповідного енантіомеру формули 1a або його N-оксиду або солі.



1b

Варіант здійснення АА2. Сполука за варіантом здійснення АА1, де R^1 являє собою CH_3.

Варіант здійснення АА3. Сполука за варіантом здійснення АА1, де R^1 являє собою галоген.

Варіант здійснення АА4. Сполука за варіантом здійснення АА3, де R^1 являє собою Cl, F або Br.

Варіант здійснення АА5. Сполука за варіантом здійснення АА4, де R^1 являє собою Cl або F.

Варіант здійснення АА6. Сполука за варіантом здійснення А5, де R^1 являє собою Cl.

Варіант здійснення АА7. Сполука за будь-яким із варіантів здійснення АА1-АА6, де R^2 являє собою CH_3, CH_2CH_3, галоген або дифторметокси.

Варіант здійснення АА8. Сполука за варіантом здійснення АА7, де R^2 являє собою CH_3, CH_2CH_3, Cl або дифторметокси.

Варіант здійснення АА9. Сполука за варіантом здійснення АА8, де R^2 являє собою CH_3 або дифторметокси.

Варіант здійснення АА10. Сполука за варіантом здійснення АА9, де R^2 являє собою CH_3.

Варіант здійснення АА11. Сполука за будь-яким із варіантів здійснення АА1-АА10, де R^3 являє собою H або CH_3.

Варіант здійснення АА12. Сполука за варіантом здійснення АА11, де R^3 являє собою H.

Варіант здійснення АА13. Сполука за варіантом здійснення АА12, де R^3 являє собою CH_3.

Варіант здійснення АА14. Сполука за будь-яким із варіантів здійснення АА1-АА13, де R^4 являє собою H, CH_3 або Cl.

Варіант здійснення АА15. Сполука за варіантом здійснення АА14, де R^4 являє собою Cl.

Варіант здійснення АА16. Сполука за варіантом здійснення АА14, де R^4 являє собою CH_3.

Варіант здійснення АА17. Сполука за варіантом здійснення АА14, де R^4 являє собою H.

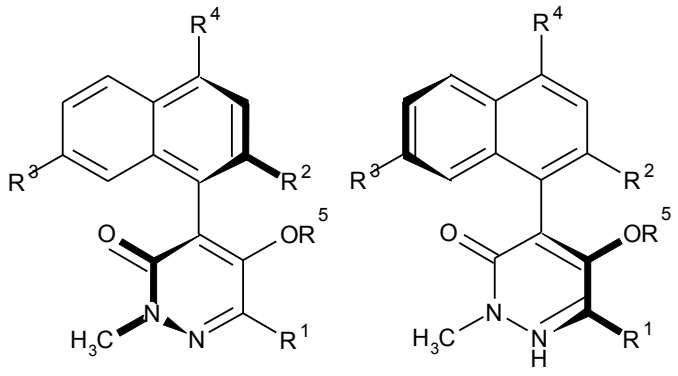
Варіант здійснення АА18. Сполука за будь-яким із варіантів здійснення АА1-АА17, де R^5 являє собою H, C_3алкілкарбоніл, C_3алкоксикарбоніл або C_3алкілкарбоксиметил.

Варіант здійснення АА19. Сполука за варіантом здійснення АА18, де R^5 являє собою H або C_3алкілкарбоніл.

Варіант здійснення АА20. Сполука за варіантом здійснення АА18, де R^5 являє собою H або -$(C{=}O)CH_2CH_3$.

Варіант здійснення АА21. Сполука за варіантом здійснення АА20, де R^5 являє собою H.

Варіант здійснення В1. Спосіб, описаний у розділі “Суть винаходу”, для одержання сполуки формули 1a або 1b.



1a 1b

Варіант здійснення B2. Спосіб за варіантом здійснення B1, де R^1 являє собою CH_3.

Варіант здійснення B3. Спосіб за варіантом здійснення B1, де R^1 являє собою галоген.

Варіант здійснення B4. Спосіб за варіантом здійснення B3, де R^1 являє собою Cl, F або Br.

Варіант здійснення B5. Спосіб за варіантом здійснення B4, де R^1 являє собою Cl або F.

Варіант здійснення B6. Спосіб за варіантом здійснення B5, де R^1 являє собою Cl.

Варіант здійснення B7. Спосіб за будь-яким із варіантів здійснення B1-B6, де R^2 являє собою CH_3, CH_2CH_3, галоген або дифторметокси.

Варіант здійснення B8. Спосіб за варіантом здійснення B7, де R^2 являє собою CH_3, CH_2CH_3, Cl або дифторметокси.

Варіант здійснення B9. Спосіб за варіантом здійснення B8, де R^2 являє собою CH_3 або дифторметокси.

Варіант здійснення B10. Спосіб за варіантом здійснення B9, де R^2 являє собою CH_3.

Варіант здійснення B11. Спосіб за будь-яким із варіантів здійснення B1-B10, де R^3 являє собою H або CH_3.

Варіант здійснення B12. Спосіб за варіантом здійснення B11, де R^3 являє собою H.

Варіант здійснення B13. Спосіб за варіантом здійснення B11, де R^3 являє собою CH_3.

Варіант здійснення B14. Спосіб за будь-яким із варіантів здійснення B1-B13, де R^4 являє собою H, CH_3 або Cl.

Варіант здійснення B15. Спосіб за варіантом здійснення B14, де R^4 являє собою Cl.

Варіант здійснення B16. Спосіб за варіантом здійснення B14, де R^4 являє собою CH_3.

Варіант здійснення B17. Спосіб за варіантом здійснення B14, де R^4 являє собою H.

Варіант здійснення B18. Спосіб за будь-яким із варіантів здійснення B1-B17, де R^5 являє собою H, C_3алкілкарбоніл, C_3алкоксикарбоніл або C_3алкілкарбоксиметил.

Варіант здійснення B19. Спосіб за варіантом здійснення B18, де R^5 являє собою H або C_3алкілкарбоніл.

Варіант здійснення B20. Спосіб за варіантом здійснення B18, де R^5 являє собою H або -$(C{=}O)CH_2CH_3$.

Варіант здійснення B21. Спосіб за варіантом здійснення B20, де R^5 являє собою H.

Варіант здійснення B22. Спосіб за варіантом здійснення B1, де хроматографія з хіральним наповнювачем являє собою надкритичну флюїдну хроматографію (SFC).

Варіант здійснення B23. Спосіб за варіантом здійснення B1, де рухома фаза являє собою діоксид вуглецю.

Варіант здійснення C1. Сполука за будь-яким із варіантів здійснення A1-AA21, де сполука є гербіцидно більш активною, ніж її відповідний атропоізомер.

Варіант здійснення C2. Сполука за варіантом здійснення C1, де сполука є більш активною під час застосування на травах, ніж її відповідний атропоізомер.

Наведені вище варіанти здійснення або будь-який варіант здійснення в даному документі можуть бути поєднані будь-яким чином. Даний винахід також стосується способу здійснення контролю небажаної рослинності, що включає застосування щодо ділянки рослинності гербіцидно ефективних кількостей або сполуки формули 1a, або формули 1b (наприклад, у вигляді композиції, описаної у даному документі). Як варіанти здійснення, що стосуються способів застосування, варто відзначити такі, до яких включені сполуки за варіантами здійснення, описаними вище. Сполуки за даним винаходом, зокрема, застосовуються для селективного контролю бур'янів у сільськогосподарських культурах, таких як пшениця, ячмінь, маїс, соя, соняшник, бавовник, олійний ріпак і рис, і сільськогосподарських культурах

спеціального призначення, таких як цукрова тростина, цитрусові, плодові та горіхоплідні сільськогосподарські культури.

Також як варіанти здійснення слід відзначити гербіцидні композиції за даним винаходом, що містять сполуки за варіантами здійснення, описаними вище.

Даний винахід також включає гербіцидну суміш, яка містить (a) сполуку, вибрану з формули 1a та формули 1b, їхніх N-оксидів і солей, і (b) щонайменше один додатковий активний інгредієнт, вибраний із (b1) інгібіторів фотосистеми II, (b2) інгібіторів синтази ацетогідроксикислот (AHAS), (b3) інгібіторів ацетил-CoA-карбоксилази (ACCази), (b4) імітаторів ауксину, (b5) інгібіторів 5-енол-пірувілшикімат-3-фосфатсинтази (EPSP), (b6) диверторів електронів фотосистеми I, (b7) інгібіторів протопорфіриногеноксидази (PPO), (b8) інгібіторів глутамінсинтетази (GS), (b9) інгібіторів елонгази жирних кислот із дуже довгим ланцюгом (VLCFA), (b10) інгібіторів транспорту ауксину, (b11) інгібіторів фітоєндесатурази (PDS), (b12) інгібіторів 4-гідроксифеніл-піруватдіоксигенази (HPPD), (b13) інгібіторів гомогентизатсоланезилтрансферази (HST), (b14) інгібіторів біосинтезу целюлози, (b15) інших гербіцидів, у тому числі засобів, що переривають мітоз, органічних сполук, які містять миш'як, асуламу, бромобутиду, цинметиліну, кумілурону, дазомету, дифензоквату, димрону, етобензаніду, флуренолу, фосаміну, фосамін-амонію, гідантоцидину, метаму, метилдимрону, олеїнової кислоти, оксазикломефону, пеларгонової кислоти і пірибутикарбу, (b16) антидотів гербіцидів і солей сполук (b1)-(b16).

"Інгібітори фотосистеми II" (b1) являють собою хімічні сполуки, які зв'язуються з білком D-1 у ділянці зв'язування Q_B і тим самим блокують транспорт електронів від Q_A до Q_B в мембранах тилакоїдів хлоропластів. Електрони, пропускання яких через фотосистему II було стримане, проходять через ряд реакцій з утворенням токсичних сполук, які руйнують клітинні мембрани і зумовлюють набухання хлоропластів, протікання мембран і, зрештою, руйнування клітин. Q_B-ділянка зв'язування містить три різні сайти зв'язування: сайт зв'язування A зв'язує триазини, такі як атразин, триазинони, такі як гексазинон, та урацили, такі як бромацил, сайт зв'язування B зв'язує фенілсечовини, такі як діурон, і сайт зв'язування C зв'язує бензотіадіазоли, такі як бентазон, нітрили, такі як бромоксиніл, і феніл-піридазини, такі як піридат. Приклади інгібіторів фотосистеми II включають аметрин, амікарбазон, атразин, бентазон, бромацил, бромофеноксим, бромоксиніл, хлорбромурон, хлоридазон, хлоротолурон, хлороксурон, кумілурон, ціаназин, даїмурон, десмедифам, десметрин, димефурон, диметаметрин, діурон, етидимурон, фенурон, флуометурон, гексазинон, іоксиніл, ізопротурон, ізоурон, ленацил, лінурон, метамітрон, метабензтіазурон, метобромурон, метоксурон, метрибузин, монолінурон, небурон, пентанохлор, фенмедифам, прометон, прометрин, пропаніл, пропазин, піридафол, піридат, сидурон, симазин, симетрин, тебутіурон, тербацил, тербуметон, тербутилазин, тербутрин і триетазин.

"Інгібітори AHAS" (b2) являють собою хімічні сполуки, які інгібують синтазу ацетогідроксикислот (AHAS), також відому як ацетолактатсинтаза (ALS), й, отже, знищують рослини шляхом інгібування утворення аліфатичних амінокислот із розгалуженим ланцюгом, таких як валін, лейцин та ізолейцин, які потрібні для синтезу білка й росту клітин. Приклади інгібіторів AHAS включають амідосульфурон, азимсульфурон, бенсульфурон-метил, біспірибак натрію, клорансулам-метил, хлоримурон-етил, хлорсульфурон, циносульфурон, циклосульфамурон, диклосулам, етаметсульфурон-метил, етоксисульфурон, флазасульфурон, флорасулам, флукарбазон натрію, флуметсулам, флупірсульфурон-метил, флупірсульфурон натрію, форамсульфурон, галосульфурон-метил, імазаметабенз-метил, імазамокс, імазапік, імазапір, імазаквін, імазетапір, імазосульфурон, йодосульфурон-метил (у тому числі натрієву сіль), іофенсульфурон (2-йод-N-[[(4-метокси-6-метил-1,3,5-триазин-2-іл)аміно]карбоніл]бензолсульфонамід), мезосульфурон-метил, метазосульфурон (3-хлор-4-(5,6-дигідро-5-метил-1,4,2-діоксазин-3-іл)-N-[[(4,6-диметокси-2-піримідиніл)аміно]карбоніл]-1-метил-1H-піразол-5-сульфонамід), метосулам, метсульфурон-метил, нікосульфурон, оксасульфурон, пеноксулам, примісульфурон-метил, пропоксикарбазон натрію, пропірисульфурон (2-хлор-N-[[(4,6-диметокси-2-піримідиніл)аміно]карбоніл]-6-пропілімідазо[1,2-b]піридазин-3-сульфонамід), просульфурон, піразосульфурон-етил, пірибензоксим, пірифталід, піримінобак-метил, піритіобак-натрій, римсульфурон, сульфометурон-метил, сульфосульфурон, тієнкарбазон, тифенсульфурон-метил, триафамон (N-[2-[(4,6-диметокси-1,3,5-триазин-2-іл)карбоніл]-6-фторфеніл]-1,1-дифтор-N-метилметансульфонамід), триасульфурон, трибенурон-метил, трифлоксисульфурон (у тому числі натрієву сіль), трифлусульфурон-метил і тритосульфурон.

"Інгібітори ACCази" (b3) являють собою хімічні сполуки, які інгібують фермент ацетил-CoA-карбоксилазу, який відповідає за каталіз ранньої стадії в синтезі ліпідів і жирних кислот у рослин. Ліпіди є важливими компонентами клітинних мембран, і без них не можуть

утворюватися нові клітини. Інгібування ацетил-CoA-карбоксилази та подальша недостатність утворення ліпідів призводять до втрати цілісності клітинної мембрани, особливо у ділянках активного росту, таких як меристеми. Зрештою припиняється ріст пагонів і кореневищ, і меристеми пагонів і бруньки кореневищ починають відмирати. Приклади інгібіторів АССази включають алоксидим, бутроксидим, клетодим, клодинафоп, циклоксидим, цигалофоп, диклофоп, феноксапроп, флуазифоп, галоксифоп, піноксаден, профоксидим, пропаквізафоп, квізалофоп, сетоксидим, тепралоксидим і тралкоксидим, у тому числі розділені форми, такі як феноксапроп-П, флуазифоп-П, галоксифоп-П і квізалофоп-П, й естерні форми, такі як клодинафоп-пропаргіл, цигалофоп-бутил, диклофоп-метил і феноксапроп-П-етил.

Ауксин являє собою рослинний гормон, який контролює ріст у багатьох тканинах рослин. “Імітатори ауксину” (b4) являють собою хімічні сполуки, що імітують гормон росту рослин ауксин, тим самим спричиняють неконтрольований і безладний ріст, що призводить до загибелі рослин у сприйнятливих видів. Приклади імітаторів ауксину включають аміноциклопірахлор (6-аміно-5-хлор-2-циклопропіл-4-піримідинкарбонова кислота), і її метиловий та етиловий естери, і її натрієві та калієві солі, амінопіралід, беназолін-етил, хлорамбен, клацифос, кломепроп, клопіралід, дикамбу, 2,4-D, 2,4-DB, дихлорпроп, флуроксипір, галауксифен (4-аміно-3-хлор-6-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифеніл)-2-піридинкарбонова кислота), галауксифен-метил (метил-4-аміно-3-хлор-6-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифеніл)-2-піридинкарбоксилат), MCPA, MCPB, мекопроп, піклорам, квінклорак, квінмерак, 2,3,6-TBA, триклопір і метил-4-аміно-3-хлор-6-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифеніл)-5-фтор-2-піридинкарбоксилат.

“Інгібітори синтази EPSP” (b5) являють собою хімічні сполуки, які інгібують фермент 5-енол-пірувілшикімат-3-фосфатсинтазу, який задіяний у синтезі ароматичних амінокислот, таких як тирозин, триптофан і фенілаланін. Гербіциди на основі інгібіторів EPSP легко поглинаються через надземну частину рослини і переносяться у флоему до точок росту. Гліфосат є порівняно неселективним гербіцидом, що впливає на післясходовий період і належить до цієї групи. Гліфосат включає естери і солі, такі як амонієва, ізопропіламонієва, калієва, натрієва (у тому числі сесквінатрієва) і тримесієва (альтернативно називається сульфосатом).

“Дивертори електронів фотосистеми I” (b6) являють собою хімічні сполуки, які приймають електрони з фотосистеми I і через декілька циклів утворюють гідроксильні радикали. Такі радикали є надзвичайно реакційноздатними і легко руйнують ненасичені ліпіди, у тому числі жирні кислоти мембран та хлорофіл. Це порушує цілісність клітинних мембран, отже, клітини і органели “протікають”, що призводить до швидкого в’янення листя, і зневоднення, і зрештою до смерті рослини. Приклади цього інгібітора фотосинтезу другого типу включають дикват і паракват.

“Інгібітори PPO” (b7) являють собою хімічні сполуки, які інгібують фермент протопорфіриногеноксидазу, що швидко призводить до утворення високореакційноздатних сполук у рослинах, які розривають клітинні мембрани, зумовлюючи витікання клітинних рідин. Приклади інгібіторів PPO включають ацифлуорфен натрію, азафенідин, бензфендизон, біфенокс, бутафенацил, карфентразон, карфентразон-етил, хлометоксифен, цинідон-етил, флуазолат, флуфенпір-етил, флуміклорак-пентил, флуміоксазин, флуороглікофен-етил, флутіацет-метил, фомесафен, галосафен, лактофен, оксадіаргіл, оксадіазон, оксифлуорфен, пентоксазон, профлуазол, піраклоніл, пірафлуфен-етил, сафлуфенацил, сульфентразон, тидіазимін, трифлудимоксазин (дигідро-1,5-диметил-6-тіоксо-3-[2,2,7-трифтор-3,4-дигідро-3-оксо-4-(2-пропін-1-іл)-2H-1,4-бензоксазин-6-іл]-1,3,5-триазин-2,4(1H,3H)-діон) і тіафенацил (метил-N-[2-[[2-хлор-5-[3,6-дигідро-3-метил-2,6-діоксо-4-(трифторметил)-1(2H)-піримідиніл]-4-фторфеніл]тіо]-1-оксопропіл]-β-аланінат).

“Інгібітори GS” (b8) являють собою хімічні сполуки, які інгібують активність ферменту глутамінсинтетази, який застосовується у рослин для перетворення аміаку на глутамін. Отже, аміак накопичується, і зменшуються рівні глутаміну. Пошкодження рослин, ймовірно, виникає внаслідок об’єднаних ефектів токсичності аміаку та дефіциту амінокислот, необхідних для інших метаболічних процесів. Інгібітори GS включають глюфосинат і його естери та солі, такі як глюфосинат амонію, й інші фосфінотрицинові похідні, глюфосинат-П ((2S)-2-аміно-4-(гідроксиметилфосфініл)бутанова кислота) і біланафос.

“Інгібітори елонгази VLCFA” (b9) являють собою гербіциди, що характеризуються великою кількістю хімічних структур, які інгібують елонгазу. Елонгаза являє собою один із ферментів, розташованих у хлоропластах або поруч із ними, які залучені в біосинтез VLCFA. У рослин жирні кислоти з дуже довгим ланцюгом є основними складовими гідрофобних полімерів, які попереджають зневоднення на поверхні листя і забезпечують стабільність пилковому зерну. Такі гербіциди включають ацетохлор, алахлор, анілофос, бутахлор, кафенстрол, диметахлор, диметенамід, дифенамід, феноксасульфон (3-[[(2,5-дихлор-4-етоксифеніл)метил]сульфоніл]-

4,5-дигідро-5,5-диметилізоксазол), фентразамід, флуфенацет, інданофан, мефенацет, метазахлор, метолахлор, напроанілід, напропамід, напропамід-М ((2R)-N,N-діетил-2-(1-нафталінілокси)пропанамід), петоксамід, піперофос, претилахлор, пропахлор, пропізохлор, піроксасульфон і тенілхлор, зокрема розділені форми, такі як S-метолахлор, і хлорацетаміди й оксиацетаміди.

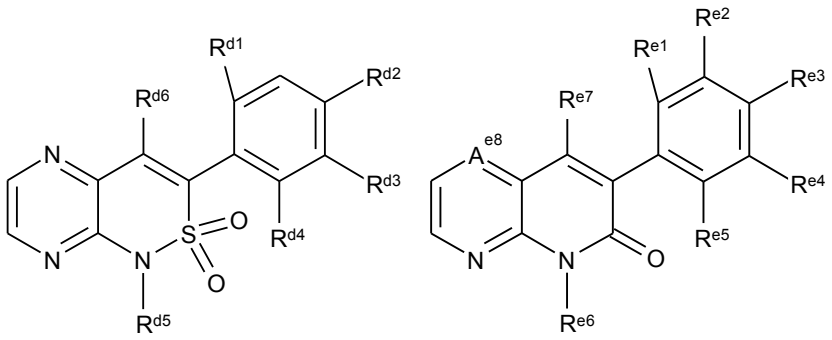
“Інгібітори транспорту ауксину” (b10) являють собою хімічні речовини, які інгібують транспорт ауксину в рослин, як, наприклад, шляхом зв’язування з білком-переносником ауксину. Приклади інгібіторів транспорту ауксину включають дифлуфензопір, напталам (також відомий як N-(1-нафтил)фталамінова кислота і 2-[(1-нафталініламіно)карбоніл]бензойна кислота).

“Інгібітори PDS” (b11) являють собою хімічні сполуки, які інгібують шлях біосинтезу каротиноїдів на стадії фітоєндесатурази. Приклади інгібіторів PDS включають бефлубутамід, S-бефлубутамід, дифлуфенікан, флуридон, флурохлоридон, флуртамон, норфлурзон і піколінафен.

“Інгібітори HPPD” (b12) являють собою хімічні речовини, які інгібують біосинтез під час синтезу 4-гідроксифеніл-піруватдіоксигенази. Приклади інгібіторів HPPD включають бензобіциклон, бензофенап, біциклопірон (4-гідрокси-3-[[2-[(2-метоксиетокси)метил]-6-(трифторметил)-3-піридиніл]карбоніл]біцикло[3.2.1]окт-3-ен-2-он), фенквінотрион (2-[[8-хлор-3,4-дигідро-4-(4-метоксифеніл)-3-оксо-2-хіноксалініл]карбоніл]-1,3-циклогександіон), ізоксахлортол, ізоксафлутол, мезотрион, пірасульфотол, піразолінат, піразоксифен, сулькотрион, тефурилтрион, темботрион, толпіралат (1-[[1-етил-4-[3-(2-метоксиетокси)-2-метил-4-(метилсульфоніл)бензоїл]-1H-піразол-5-іл]окси]етилметилкарбонат), топрамезон, 5-хлор-3-[(2-гідрокси-6-оксо-1-циклогексен-1-іл)карбоніл]-1-(4-метоксифеніл)-2(1H)-хіноксалінон, 4-(2,6-діетил-4-метилфеніл)-5-гідрокси-2,6-диметил-3(2H)-піридазинон, 4-(4-фторфеніл)-6-[(2-гідрокси-6-оксо-1-циклогексен-1-іл)карбоніл]-2-метил-1,2,4-триазин-3,5(2H,4H)-діон, 5-[(2-гідрокси-6-оксо-1-циклогексен-1-іл)карбоніл]-2-(3-метоксифеніл)-3-(3-метоксипропіл)-4(3H)-піримідинон, 2-метил-N-(4-метил-1,2,5-оксадіазол-3-іл)-3-(метилсульфініл)-4-(трифторметил)бензамід і 2-метил-3-(метилсульфоніл)-N-(1-метил-1H-тетразол-5-іл)-4-(трифторметил)бензамід.

“Інгібітори HST” (b13) порушують здатність рослини перетворювати гомогентизат на 2-метил-6-соланіл-1,4-бензохінон, тим самим порушуючи біосинтез каротиноїдів. Приклади інгібіторів HST включають циклопіриморат (6-хлор-3-(2-циклопропіл-6-метилфенокси)-4-піридазиніл-4-морфолінкарбоксилат), галоксидин, піриклор, 3-(2-хлор-3,6-дифторфеніл)-4-гідрокси-1-метил-1,5-нафтиридин-2(1H)-он, 7-(3,5-дихлор-4-піридиніл)-5-(2,2-дифторетил)-8-гідроксипіридо[2,3-b]піразин-6(5H)-он і 4-(2,6-діетил-4-метилфеніл)-5-гідрокси-2,6-диметил-3(2H)-піридазинон.

Інгібітори HST також включають сполуки формул A і B,

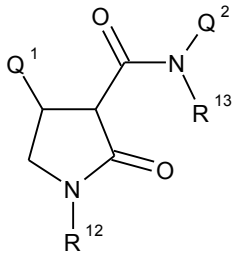


A B

де R^{d1} являє собою H, Cl або CF_3; R^{d2} являє собою H, Cl або Br; R^{d3} являє собою H або Cl; R^{d4} являє собою H, Cl або CF_3; R^{d5} являє собою CH_3, CH_2CH_3 або CH_2CHF_2; і R^{d6} являє собою OH або -OC(=O)-ізо-Pr; і R^{e1} являє собою H, F, Cl, CH_3 або CH_2CH_3; R^{e2} являє собою H або CF_3; R^{e3} являє собою H, CH_3 або CH_2CH_3; R^{e4} являє собою H, F або Br; R^{e5} являє собою Cl, CH_3, CF_3, OCF_3 або CH_2CH_3; R^{e6} являє собою H, CH_3, CH_2CHF_2 або C≡CH; R^{e7} являє собою OH, -OC(=O)Et, -OC(=O)-ізо-Pr або -OC(=O)-трет-Bu; й A^{e8} являє собою N або CH.

“Інгібітори біосинтезу целюлози” (b14) інгібують біосинтез целюлози у певних рослин. Вони найбільш ефективні, коли застосовуються на передсходовій стадії або на ранній післясходовій стадії щодо молодих або швидкорослих рослин. Приклади інгібіторів біосинтезу целюлози включають хлортіамід, дихлобеніл, флупоксам, індазифлам (N^2-[(1R,2S)-2,3-дигідро-2,6-диметил-1H-інден-1-іл]-6-(1-фторетил)-1,3,5-триазин-2,4-діамін), ізоксабен і триазифлам.

“Інші гербіциди” (b15) включають гербіциди, які діють за допомогою різних механізмів дії, такі як засоби, що переривають мітоз (наприклад, фламмроп-М-метил і фламмроп-М-ізопропіл), органічні сполуки, які містять миш’як (наприклад, DSMA і MSMA), інгібітори 7,8-дигідроптероатсинтази, інгібітори синтезу ізопреноїдів хлоропласта та інгібітори біосинтезу клітинної стінки. Інші гербіциди включають такі гербіциди, які мають невідомі механізми дії, або не потрапляють у конкретну категорію, наведену в (b1)-(b14), або діють за допомогою комбінації механізмів дії, перелічених вище. Приклади інших гербіцидів включають аклоніфен, асулам, амітрол, бромобутид, цинметилін, кломазон, кумілурон, даїмурон, димесульфазет (№ CAS 1215111-77-5), дифензокват, епірифенацил (№ CAS 353292-31-6), етобензанід, флуометурон, флуренол, фосамін, фосамін-амоній, дазомет, димрон, іпфенкарбазон (1-(2,4-дихлорфеніл)-N-(2,4-дифторфеніл)-1,5-дигідро-N-(1-метилетил)-5-оксо-4H-1,2,4-триазол-4-карбоксамід), метам, метилдимрон, олеїнову кислоту, оксазикломефон, пеларгонову кислоту, пірибутикарб, тетфлупіролімет і 5-[[(2,6-дифторфеніл)метокси]метил]-4,5-дигідро-5-метил-3-(3-метил-2-тієніл)ізоксазол. “Інші гербіциди” (b15) також включають сполуку формули (b15A),



(b15A)

де

R^{12} являє собою H, C_1-C_6алкіл, C_1-C_6галогеналкіл або C_4-C_8циклоалкіл;

R^{13} являє собою H, C_1-C_6алкіл або C_1-C_6алкокси;

Q^1 являє собою необов’язково заміщену кільцеву систему, вибрану із групи, що складається з фенілу, тієнілу, піридинілу, бензодіоксолілу, нафтилу, нафталінілу, бензофуранілу, фуранілу, бензотіофенілу та піразолілу, де в разі заміщення вказана кільцева система заміщена за допомогою 1-3 R^{14};

Q^2 являє собою необов’язково заміщену кільцеву систему, вибрану із групи, що складається з фенілу, піридинілу, бензодіоксолілу, піридинонілу, тіадіазолілу, тіазолілу та оксазолілу, де в разі заміщення вказана кільцева система заміщена за допомогою 1-3 R^{15};

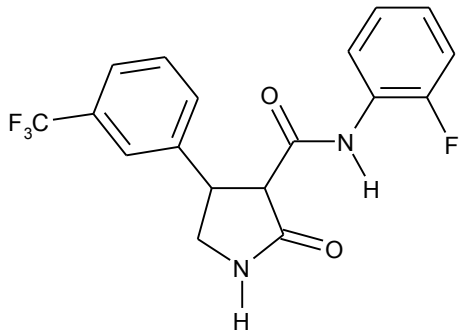
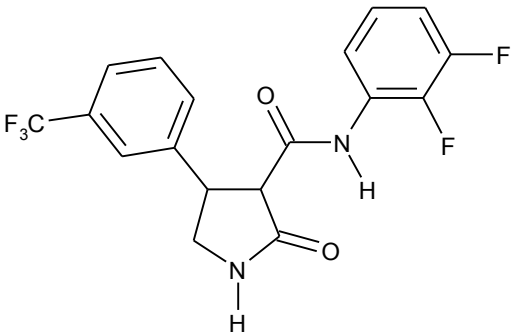
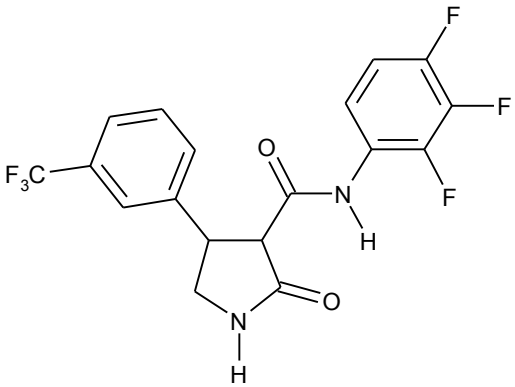
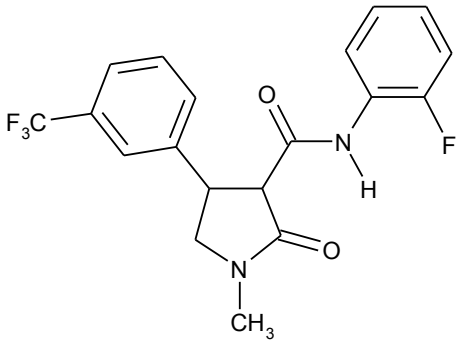
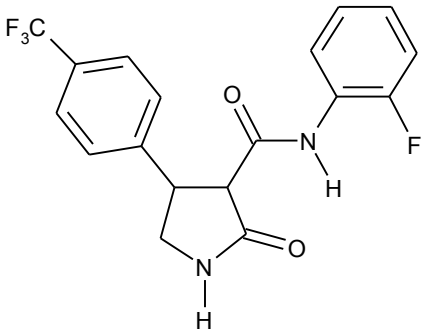
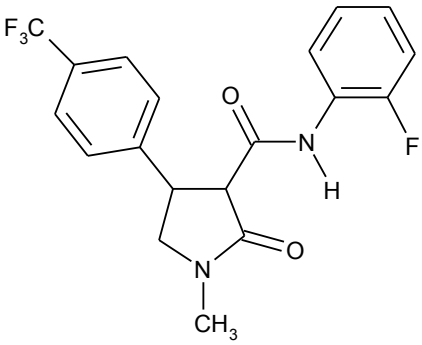
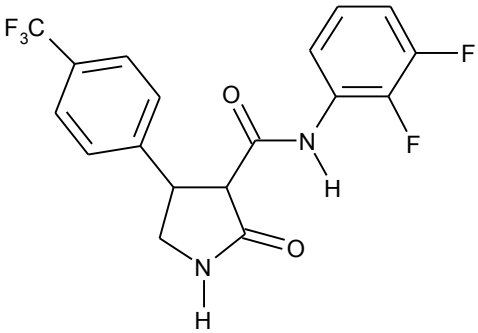
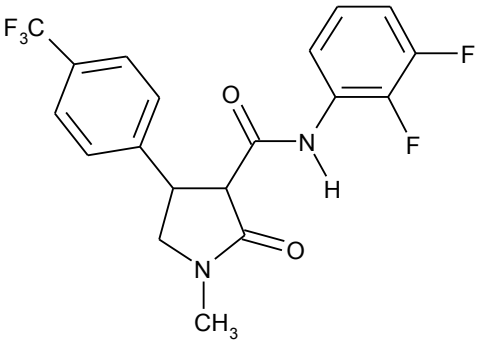
кожний R^{14} незалежно являє собою галоген, C_1-C_6алкіл, C_1-C_6галогеналкіл, C_1-C_6алкокси, C_1-C_6галогеналкокси, C_3-C_8циклоалкіл, ціано, C_1-C_6алкілтіо, C_1-C_6алкілсульфініл, C_1-C_6алкілсульфоніл, SF_5, NHR^{17} або феніл, необов’язково заміщений за допомогою 1-3 R^{16}, або піразоліл, необов’язково заміщений за допомогою 1-3 R^{16};

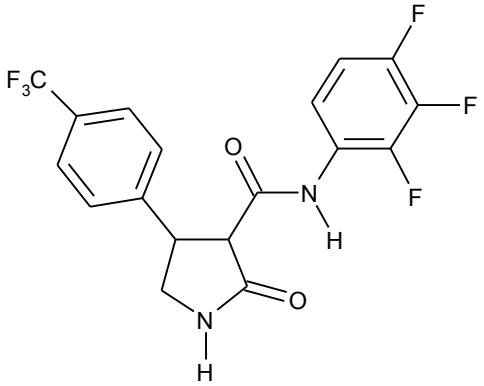
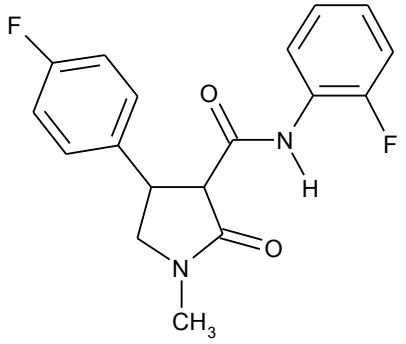
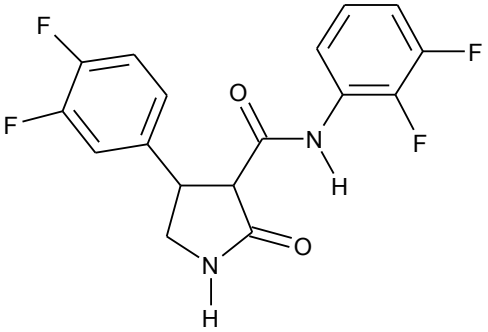
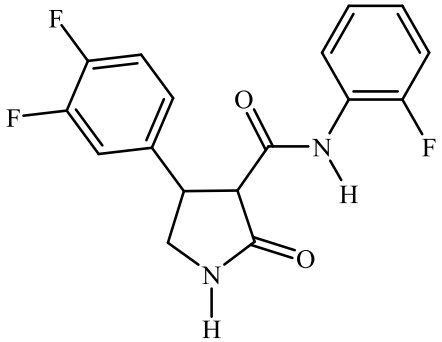
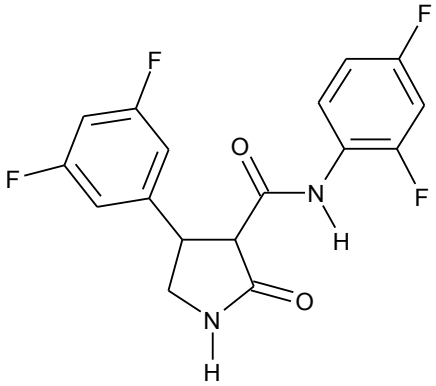
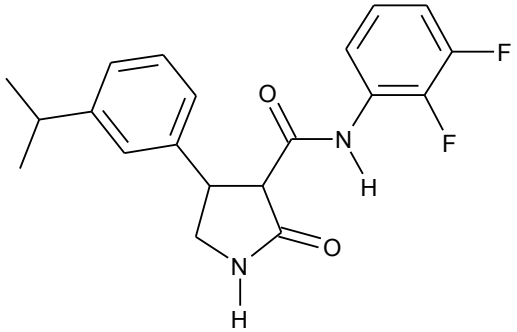
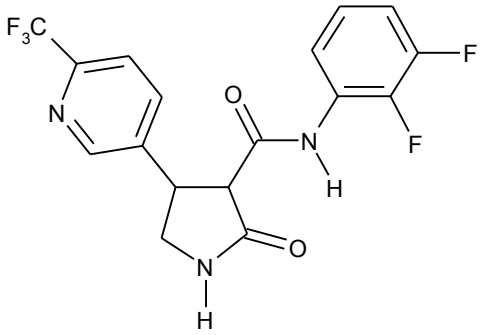
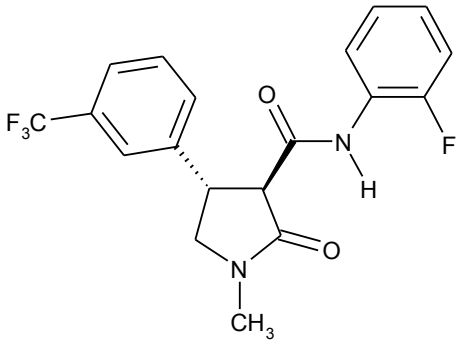
кожний R^{15} незалежно являє собою галоген, C_1-C_6алкіл, C_1-C_6галогеналкіл, C_1-C_6алкокси, C_1-C_6галогеналкокси, ціано, нітро, C_1-C_6алкілтіо, C_1-C_6алкілсульфініл, C_1-C_6алкілсульфоніл;

кожний R^{16} незалежно являє собою галоген, C_1-C_6алкіл або C_1-C_6галогеналкіл;

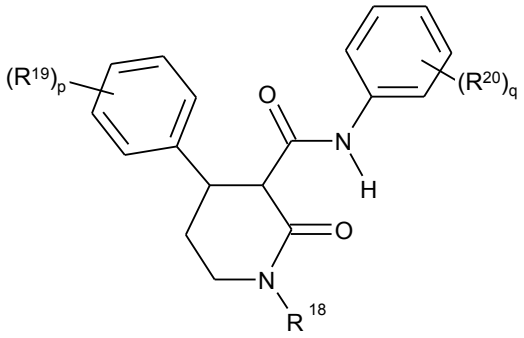
R^{17} являє собою C_1-C_4алкоксикарбоніл.

В одному варіанті здійснення, де “інші гербіциди” (b15) також включають сполуку формули (b15A), переважно R^{12} являє собою H або C_1-C_6алкіл; більш переважно R^{12} являє собою H або метил. Переважно R^{13} являє собою H. Переважно Q^1 являє собою або фенільне кільце, або піридинільне кільце, кожне кільце заміщене за допомогою 1-3 R^{14}; більш переважно Q^1 являє собою фенільне кільце, заміщене за допомогою 1-2 R^{14}. Переважно Q^2 являє собою фенільне кільце, заміщене за допомогою 1-3 R^{15}; більш переважно Q^2 являє собою фенільне кільце, заміщене за допомогою 1-2 R^{15}. Переважно кожний R^{14} незалежно являє собою галоген, C_1-C_4алкіл, C_1-C_3галогеналкіл, C_1-C_3алкокси або C_1-C_3галогеналкокси; більш переважно кожний R^{14} незалежно являє собою хлор, фтор, бром, C_1-C_2галогеналкіл, C_1-C_2галогеналкокси або C_1-C_2алкокси. Переважно кожний R^{15} незалежно являє собою галоген, C_1-C_4алкіл, C_1-C_3галогеналкокси; більш переважно кожний R^{15} незалежно являє собою хлор, фтор, бром, C_1-C_2галогеналкіл, C_1-C_2галогеналкокси або C_1-C_2алкокси. Особливо переважно “інші гербіциди” (b15) включають будь-яке з наступних (b15A-1)-(b15A-16):

	
(b15A-1)	(b15A-2)
	
(b15A-3)	(b15A-4)
	
(b15A-5)	(b15A-6)
	
(b15A-7)	(b15A-8)

	
(b15A-9)	(b15A-10)
	
(b15A-11)	(b15A-12)
	
(b15A-13)	(b15A-14)
	
(b15A-15)	(b15A-16).

“Інші гербіциди” (b15) також включають сполуку формули (b15B),



(b15B)

де

R^{18} являє собою H, C_1-C_6алкіл, C_1-C_6галогеналкіл або C_4-C_8циклоалкіл;

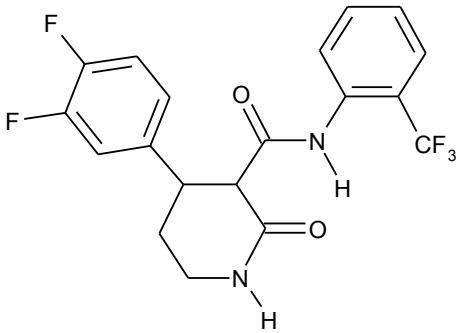
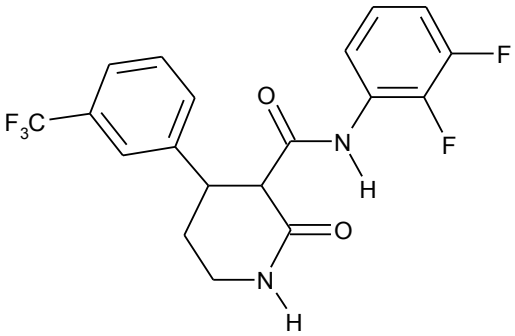
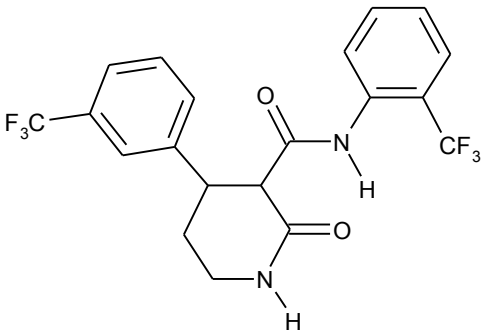
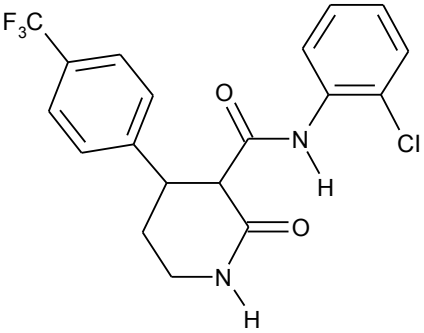
кожний R^{19} незалежно являє собою галоген, C_1-C_6галогеналкіл або C_1-C_6галогеналкокси;

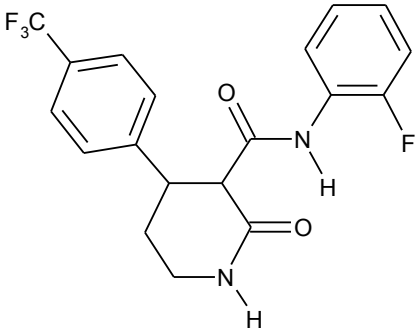
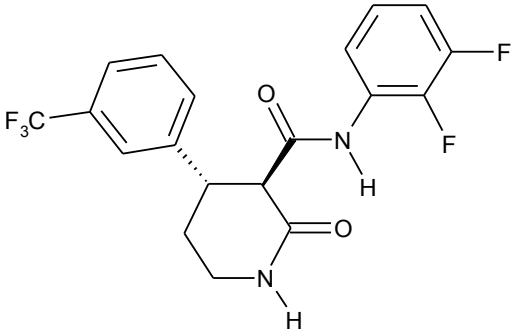
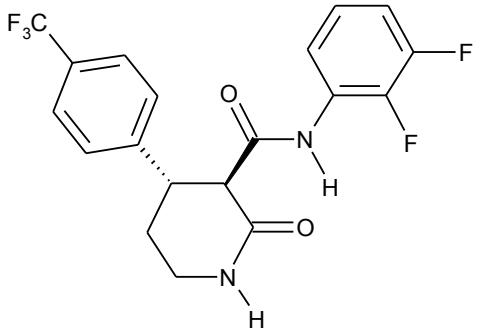
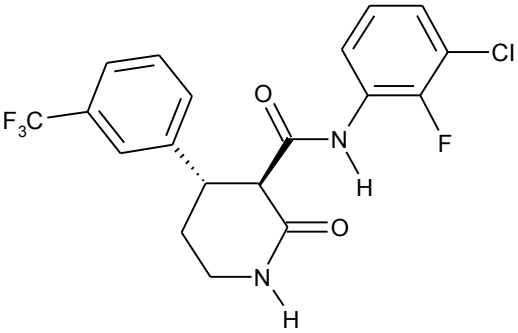
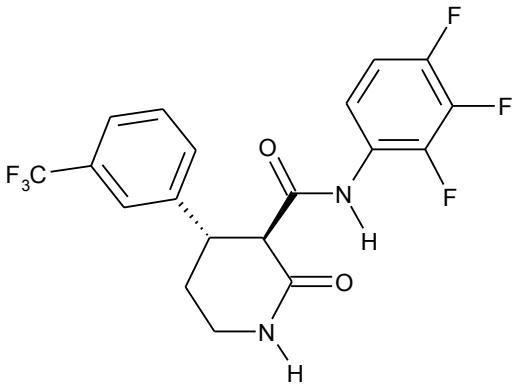
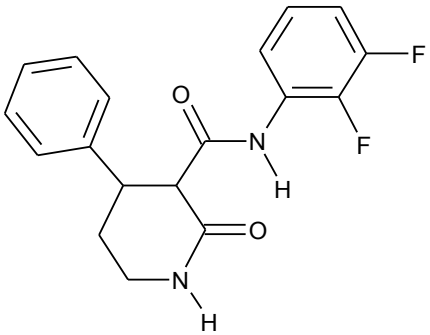
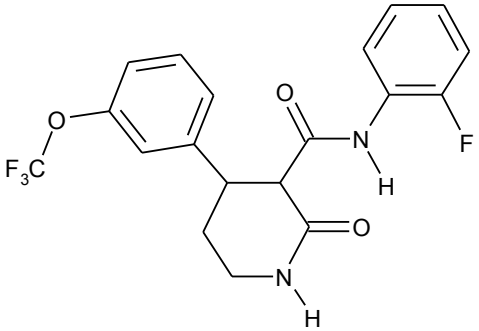
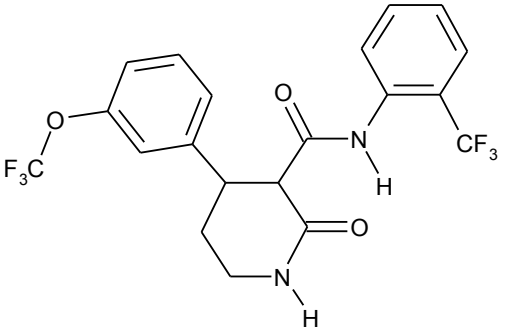
p являє собою ціле число 0, 1, 2 або 3;

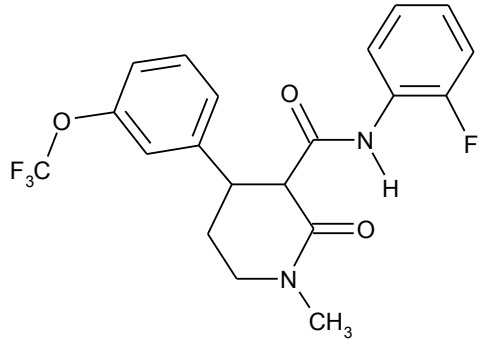
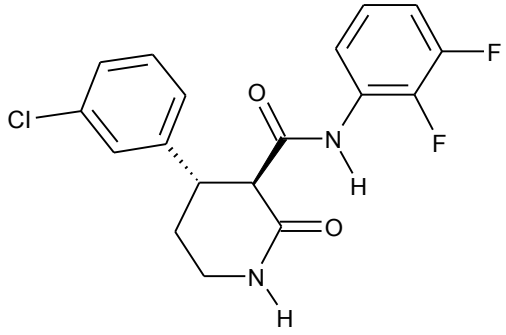
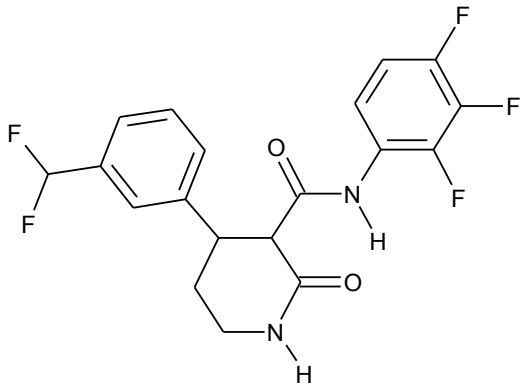
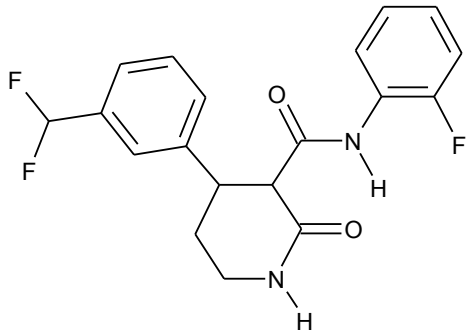
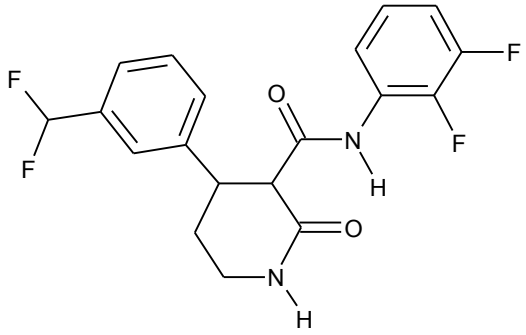
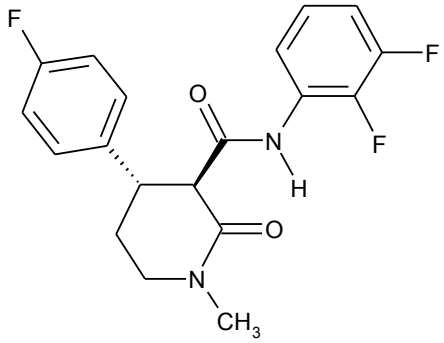
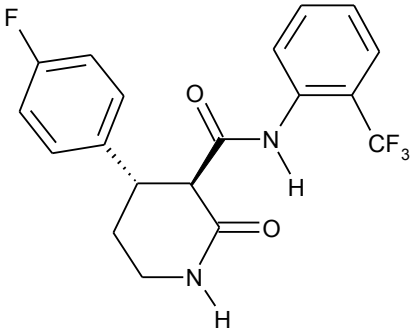
кожний R^{20} незалежно являє собою галоген, C_1-C_6галогеналкіл або C_1-C_6галогеналкокси; та

q являє собою ціле число 0, 1, 2 або 3.

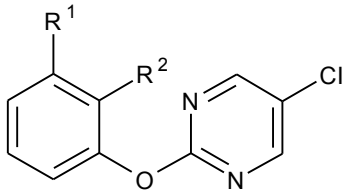
В одному варіанті здійснення, де “інші гербіциди” (b15) також включають сполуку формули (b15B), переважно R^{18} являє собою H, метил, етил або пропіл; більш переважно R^{18} являє собою H або метил; найбільш переважно R^{18} являє собою H. Переважно кожний R^{19} незалежно являє собою хлор, фтор, C_1-C_3галогеналкіл або C_1-C_3галогеналкокси; більш переважно кожний R^{19} незалежно являє собою хлор, фтор, C_1фторалкіл (тобто фторметил, дифторметил або трифторметил) або C_1фторалкокси (тобто трифторметокси, дифторметокси або фторметокси). Переважно кожний R^{20} незалежно являє собою хлор, фтор, C_1галогеналкіл або C_1галогеналкокси; більш переважно кожний R^{20} незалежно являє собою хлор, фтор, C_1фторалкіл (тобто фторметил, дифторметил або трифторметил) або C_1фторалкокси (тобто трифторметокси, дифторметокси або фторметокси). Особливо переважно “інші гербіциди” (b15) включають будь-яке з наступних (b15B-1)-(b15B-19):

	
(b15B-1)	(b15B-2)
	
(b15B-3)	(b15B-4)

	
(b15B-5)	(b15B-6)
	
(b15B-7)	(b15B-8)
	
(b15B-9)	(b15B-10)
	
(b15B-11)	(b15B-12)

	
(b15B-13)	(b15B-14)
	
(b15B-15)	(b15B-16)
	
(b15B-17)	(b15B-18)
	
(b15B-19)	.

В іншому варіанті здійснення “інші гербіциди” (b15) також включають сполуку формули (b15C),



(b15C)

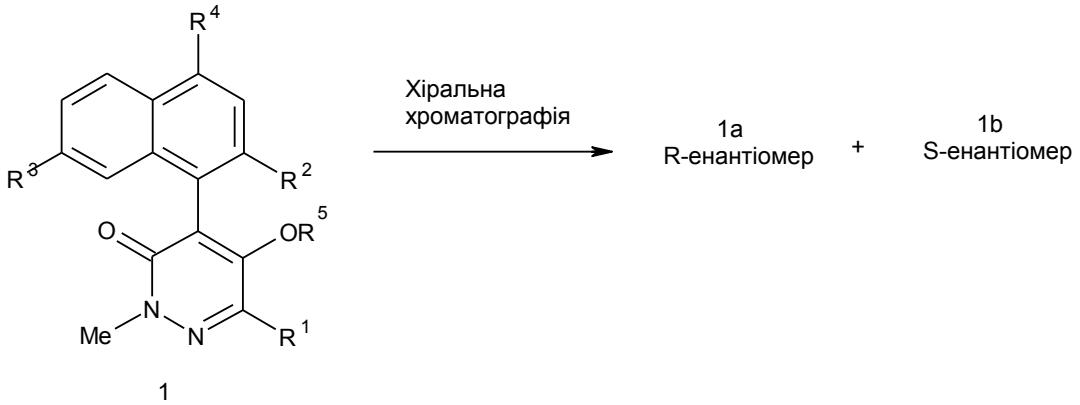
де R^1 являє собою Cl, Br або CN; та R^2 являє собою $C(=O)CH_2CH_2CF_3$, $CH_2CH_2CH_2CH_2CF_3$ або 3-CHF_2-ізоксазол-5-іл. Конкретні приклади включають сполуку формули (b15C), вибрану з (b15C1) 5-хлор-2-[3-хлор-2-[3-(дифторметил)-5-ізоксазоліл]фенокси]-піримідину та (b15C2) 1-[2-хлор-6-[(5-хлор-2-піримідиніл)окси]феніл]-4,4,4-трифтор-1-бутанону.

“Антидоти гербіцидів” (b16) являють собою речовини, що додаються в гербіцидний склад для усунення або зниження фітотоксичних ефектів гербіциду щодо певних сільськогосподарських культур. Такі сполуки захищають сільськогосподарські культури від пошкодження гербіцидами, але, як правило, не попереджають контроль гербіцидом небажаної рослинності. Приклади антидотів гербіцидів включають без обмеження беноксакор, клоквінтосет-мексил, кумілурон, ціометриніл, ципросульфамід, даїмурон, дихлормід, дициклонон, діетолат, димепіперат, фенхлоразол-етил, фенклорим, флуразол, флуксофенім, фурилазол, ізоксадифен-етил, мефенпір-діетил, мефенат, метоксифенон, нафталіновий ангідрид, оксабетриніл, N-(амінокарбоніл)-2-метилбензолсульфонамід і N-(амінокарбоніл)-2-фторбензолсульфонамід, 1-бром-4-[(хлорметил)сульфоніл]бензол, 2-(дихлорметил)-2-метил-1,3-діоксолан (MG 191), 4-(дихлорацетил)-1-окса-4-азоспіро[4.5]декан (MON 4660), 2,2-дихлор-1-(2,2,5-триметил-3-оксазолідиніл)-етанон і 2-метокси-N-[[4-[[(метиламіно)карбоніл]аміно]феніл]сульфоніл]-бензамід.

Для кращого контролю небажаної рослинності (наприклад, нижчої норми застосування, наприклад, унаслідок ефектів, більших за адитивні, ширшого спектра контрольованих бур’янів або посиленої безпеки щодо сільськогосподарських культур) або для попередження розвитку стійких бур’янів переважними є суміші сполуки за даним винаходом із гербіцидом, вибраним із групи, яка складається з атразину, азимсульфурону, бефлубутаміду, S-бефлубутаміду, бензізотіазолінону, карфентразон-етилу, хлоримурон-етилу, хлорсульфурон-метилу, кломазону, клопіраліду калію, клорансулам-метилу, 2-[(2,4-дихлор-6-оксо-1-циклогексен-1-іл)карбоніл]-2-метил-1,2,4-триазин-3,5-(2H,4H)-діону, флупірсульфурон-метилу, флутіацет-метилу, фомесафену, імазетапіру, ленацилу, мезотриону, метрибузину, метсульфурон-метилу, петоксаміду, піклораму, піроксасульфону, квінклораку, римсульфурону, S-метолахлору, сульфентразону, тифенсульфурон-метилу, трифлусульфурон-метилу і трибенурон-метилу.

Заміщені енантіомери формули 1a (R) та формули 1b (S) можуть бути виділені з рацематів формули 1 за допомогою хроматографії з хіральним наповнювачем (див. схему 1). Рацемати формули 1 можуть бути одержані за допомогою способів, описаних у WO 2015168010. Абсолютна стереохімія може бути віднесена до показаної гетеробіарильної структури відповідно до встановлених правил номенклатури, встановлених у цій галузі техніки. Фахівцю в цій галузі техніки буде очевидно, що два енантіомери, які входять до складу рацемату, також можна назвати атропоізомерами через обмежене обертання нафталінового та піридазинонового кілець цієї гетеробіарильної кільцевої системи. Обмеження обертання фіксує два кільця у встановленій стереоорієнтації, що дозволяє асиметрію. При заміщенні нафталіну в орто-положенні до зв’язку, з’єднаного з піридазиноном, обидва атропоізомери є стійкими до рацемізації завдяки обертанню кільця за температур, що становлять загалом нижче від 100°C.

Схема 1



1

Рацемат (R і S)

Приклад розділення 1

1,8 г зразка рацемату 2 завантажували на хіральний наповнювач для надкритичної флюїдної хроматографії (SFC) з використанням діоксиду вуглецю як надкритичної флюїдної рухомої фази або з необов'язковим співрозчинником, таким як метанол або ацетонітрил. Використовувані принципи аналогічні принципам стандартної нехіральної високоефективної рідинної хроматографії (HPLC). Одержували дві фракції. Перший елюат позначали як енантіомер 2a (580 мг), а другий позначали як енантіомер 2b (600 мг). Обертання площин поляризації світла для 2a та 2b становило + 47,34 [20°C, c = 0,4 (метанол)] та -58,29 [20°C, c = 0,4 (метанол)] відповідно. Енантіомерний надлишок (е. н.) обох зразків, визначений за допомогою хіральної HPLC, становив більш ніж 95%.

Схема 2

2

Рацемат
(R і S-енантіомери)

На фігурі 1 (аналітична хіральна HPLC SFC хроматограма енантіомеру 2a (2A)) показана хіральна хроматограма для 2a, яка характеризується часом утримання 2,03 хвилини, що додатково підтверджує енантіомерну відповідність.

На фігурі 2 (аналітична хіральна HPLC SFC хроматограма енантіомеру 2b (2B)) показана хіральна хроматограма для 2b, яка характеризується часом утримання 3,24 хвилини, що додатково підтверджує енантіомерну відповідність.

Без додаткового уточнення вважається, що фахівець у цій галузі техніки із застосуванням попереднього опису може здійснити на практиці даний винахід у його найбільш повній мірі. Наступні необмежувальні приклади ілюструють даний винахід.

Сполука формули 1a та формули 1b загалом буде застосовуватися як гербіцидний активний інгредієнт у композиції, тобто складі, із щонайменше одним додатковим компонентом, вибраним із групи, що складається з поверхнево-активних речовин, твердих розріджувачів і рідких розріджувачів. У деяких варіантах здійснення додатковий компонент може слугувати носієм. Інгредієнти складу або композиції вибирають так, щоб вони відповідали фізичним властивостям активного інгредієнта, механізму нанесення і факторам навколишнього середовища, таким як

тип ґрунту, вологість та температура.

Застосовувані склади включають як рідкі, так і тверді композиції, що містять сполуку формули 1a та формули 1b. Рідкі композиції включають розчини (у тому числі здатні до емульгування концентрати), суспензії, емульсії (у тому числі мікроемульсії, емульсії типу “масло-у-воді”, плинні концентрати і/або суспоемульсії) тощо, які необов’язково можна робити густішими з утворенням гелів. Загальні типи водних рідких композицій являють собою розчинний концентрат, концентрат суспензії, капсульну суспензію, концентровану емульсію, мікроемульсію, емульсію типу “масло-у-воді”, плинний концентрат і суспоемульсію. Загальні типи неводних рідких композицій являють собою концентрат, здатний до емульгування, концентрат, здатний до мікроемульгування, концентрат, здатний до диспергування, і масляну дисперсію.

Загальні типи твердих композицій являють собою пилоподібні препарати, порошки, гранули, пелети, прильовані препарати, пастилки, таблетки, наповнені плівки (у тому числі покриття для насіння) тощо, які можуть бути здатними до диспергування у воді (“змочуваними”) або водорозчинними. Плівки і покриття, утворені з плівкоутворювальних розчинів або плинних суспензій, зокрема, є застосовними для обробки насіння. Активний інгредієнт може бути (мікро)інкапсульованим і додатково складеним у суспензію або твердий склад; альтернативно весь склад активного інгредієнта може бути інкапсульований (або “покритий”). Інкапсуляція здатна контролювати або сповільнювати вивільнення активного інгредієнта. У здатній до емульгування гранулі об’єднані переваги як складу, що являє собою здатний до емульгування концентрат, так і сухого гранульованого складу. Композиції з високою концентрацією загалом застосовуються як проміжні продукти для подальшого складання.

Здатні до розпилення склади, як правило, розбавляють у придатному середовищі перед розпиленням. Такі рідкі та тверді склади складають так, щоб вони легко розбавлялися в середовищі у вигляді спрею, зазвичай воді, але іноді в іншому придатному середовищі, такому як ароматичний або парафіновий вуглеводень або рослинна олія. Об’єми спрею можуть знаходитись у діапазоні від приблизно одного до декількох тисяч літрів на гектар, але більш переважно знаходяться в діапазоні від приблизно десяти до декількох сотень літрів на гектар. Здатні до розпилення склади можна змішати в баку з водою або іншим придатним середовищем для позакореневої обробки під час застосування щодо повітря або землі або для застосування щодо середовища зростання рослини. Рідкі та сухі склади можна вносити у певній кількості безпосередньо у системи крапельного зрошення або вносити у певній кількості у борозну під час висаджування.

Склади, як правило, будуть містити ефективні кількості активного інгредієнта, розріджувача та поверхнево-активної речовини в межах наступних приблизних діапазонів, сума яких становить не більше ніж 100 відсотків за вагою.

		Відсоток за вагою	
	Активний інгредієнт	Розріджувач	Поверхнево-активна речовина
Здатні до диспергування у воді і водорозчинні гранули, таблетки і порошки	0,001-90	0-99,999	0-15
Масляні дисперсії, суспензії, емульсії, розчини (у тому числі здатні до емульгування концентрати)	1-50	40-99	0-50
Пилоподібні препарати	1-25	70-99	0-5
Гранули і пелети	0,001-99	5-99,999	0-15
Композиції з високою концентрацією	90-99	0-10	0-2

Тверді розріджувачі включають, наприклад, глини, такі як бентоніт, монтморилоніт, атапульгіт і каолін, гіпс, целюлозу, діоксид титану, оксид цинку, крохмаль, декстрин, цукри (наприклад, лактозу, сахарозу), діоксид кремнію, тальк, слюду, діатомову землю, сечовину, карбонат кальцію, карбонат і бікарбонат натрію та сульфат натрію. Типові тверді розріджувачі описані у Watkins et al., Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers, 2nd Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jersey.

Рідкі розріджувачі включають, наприклад, воду, N,N-диметилалканаміди (наприклад, N,N-диметилформамід), лімонен, диметилсульфоксид, N-алкілпіролідони (наприклад, N-

метилпіролідинон), алкілфосфати (наприклад, триетилфосфат), етиленгліколь, триетиленгліколь, пропіленгліколь, дипропіленгліколь, поліпропіленгліколь, пропіленкарбонат, бутиленкарбонат, парафіни (наприклад, білі мінеральні масла, нормальні парафіни, ізопарафіни), алкілбензоли, алкілнафталіни, гліцерин, триацетат гліцерину, сорбіт, ароматичні вуглеводні, деароматизовані аліфатичні вуглеводні, алкілбензоли, алкілнафталіни, кетони, такі як циклогексанон, 2-гептанон, ізофорон і 4-гідрокси-4-метил-2-пентанон, ацетати, такі як ізоамілацетат, гексилацетат, гептилацетат, октилацетат, нонілацетат, тридецилацетат та ізоборнілацетат, інші естери, такі як алкіловані естери лактату, двохосновні естери, алкіл- і арилбензоати і γ-бутиролактон, і спирти, які можуть бути лінійні, розгалужені, насичені або ненасичені, такі як метанол, етанол, н-пропанол, ізопропіловий спирт, н-бутанол, ізобутиловий спирт, н-гексанол, 2-етилгексанол, н-октанол, деканол, ізодециловий спирт, ізооктадеканол, цетиловий спирт, лауриловий спирт, тридециловий спирт, олеїловий спирт, циклогексанол, тетрагідрофурфуриловий спирт, діацетоновий спирт, крезол і бензиловий спирт. Рідкі розріджувачі також включають естери гліцерину і насичених і ненасичених жирних кислот (як правило,

C_6-C_{22}), такі як олії з насіння і плодів рослин (наприклад, олії оливи, рицини, насіння льону, кунжуту, кукурудзи (маїсу), арахісу, соняшника, виноградної кісточки, сафлору, насіння бавовнику, сої, насіння ріпаку, кокоса та ядра кокосового горіха), жири тваринного походження (наприклад, яловичий жир, свинячий жир, топлений свинячий жир, жир печінки тріски, риб'ячий жир) та їх суміші. Рідкі розріджувачі також включають алкіловані жирні кислоти (наприклад, метильовані, етильовані, бутильовані), де жирні кислоти можна одержувати шляхом здійснення гідролізу естерів гліцерину з рослинних і тваринних джерел і можна очищати за допомогою перегонки. Типові рідкі розріджувачі описані у Marsden, Solvents Guide, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950.

Тверді та рідкі композиції за даним винаходом часто містять одну або декілька поверхнево-активних речовин. У разі додавання в рідину поверхнево-активні речовини (також відомі як "поверхнево-активні засоби") загалом змінюють, найчастіше знижують поверхневий натяг рідини. Залежно від природи гідрофільних та ліпофільних груп у молекулі поверхнево-активної речовини, поверхнево-активні речовини можна застосовувати як змочувальні засоби, диспергувальні речовини, емульгатори або антиспінювальні засоби.

Поверхнево-активні речовини можна класифікувати як неіоногенні, аніонні або катіонні. Неіоногенні поверхнево-активні речовини, застосовні в композиціях за даним винаходом, включають без обмеження алкоксилати спиртів, такі як алкоксилати спиртів на основі природних і синтетичних спиртів (які можуть бути розгалуженими або лінійними) й одержані зі спиртів і етиленоксиду, пропіленоксиду, бутиленоксиду або їх сумішей; етоксилати амінів, алканоламіди й етоксильовані алканоламіди; алкоксильовані тригліцериди, такі як етоксильовані соєва, рицинова і ріпакова олії; алкоксилати алкілфенолів, такі як етоксилати октилфенолу, етоксилати нонілфенолу, етоксилати динонілфенолу й етоксилати додецилфенолу (одержані з фенолів і етиленоксиду, пропіленоксиду, бутиленоксиду або їх сумішей); блок-полімери, одержані з етиленоксиду або пропіленоксиду, і блок-полімери зворотного типу, де кінцеві блоки одержані із пропіленоксиду; етоксильовані жирні кислоти; етоксильовані естери жирних кислот і масла; етоксильовані метилові естери; етоксильований тристирилфенол (у тому числі одержані з етиленоксиду, пропіленоксиду, бутиленоксиду або їх сумішей); естери жирних кислот, естери гліцерину, похідні на основі ланоліну, поліетоксильовані естери, такі як поліетоксильовані естери сорбітану і жирних кислот, поліетоксильовані естери сорбіту і жирних кислот і поліетоксильовані естери гліцерину і жирних кислот; інші похідні сорбітану, такі як естери сорбітану; полімерні поверхнево-активні речовини, такі як статистичні співполімери, блок-співполімери, алкідні смоли PEG (поліетиленгліколю), прищеплені або гребнеподібні полімери і зіркоподібні полімери; поліетиленгліколі (PEG); естери поліетиленгліколю і жирних кислот; поверхнево-активні речовини на основі силікону і похідні цукрів, такі як естери сахарози, алкілполіглікозиди й алкілполісахариди.

Застосовні аніонні поверхнево-активні речовини включають без обмеження алкіларилсульфонові кислоти і їхні солі; карбоксильовані етоксилати спирту або алкілфенолу; похідні дифенілсульфонату; лігнін і похідні лігніну, такі як лігносульфонати; малеїнову або бурштинову кислоти або їхні ангідриди; олефінсульфонати; фосфатні естери, такі як фосфатні естери алкоксилатів спиртів, фосфатні естери алкоксилатів алкілфенолів і фосфатні естери етоксилатів стирилфенолу; поверхнево-активні речовини на основі білків; похідні саркозину; сульфат етеру стирилфенолу; сульфати і сульфонати масел і жирних кислот; сульфати і сульфонати етоксильованих алкілфенолів; сульфати спиртів; сульфати етоксильованих спиртів; сульфонати амінів та амідів, такі як N,N-алкілтаурати; сульфонати бензолу, кумолу, толуолу,

ксилолу і додецил- і тридецилбензолів; сульфонати конденсованих нафталінів; сульфонати нафталіну й алкілнафталіну; сульфонати фракціонованого нафтопродукту; сульфосукцинамати і сульфосукцинати і їхні похідні, такі як солі діалкілсульфосукцинату.

Застосовні катіонні поверхнево-активні речовини включають без обмеження аміди й етоксильовані аміди; аміни, такі як N-алкілпропандіаміни, трипропілентриаміни і дипропілентетраміни, й етоксильовані аміни, етоксильовані діаміни і пропоксильовані аміни (одержані з амінів і етиленоксиду, пропіленоксиду, бутиленоксиду або їх сумішей); солі амінів, такі як аміноацетати, і солі діамінів; солі четвертинного амонію, такі як четвертинні солі, етоксильовані четвертинні солі і дичетвертинні солі, й оксиди амінів, такі як оксиди алкілдиметиламіну й оксиди біс-(2-гідроксиетил)-алкіламіну.

Також застосовними для композицій за даним винаходом є суміші неіоногенних та аніонних поверхнево-активних речовин або суміші неіоногенних та катіонних поверхнево-активних речовин. Неіоногенні, аніонні і катіонні поверхнево-активні речовини і варіанти їхнього рекомендованого застосування розкриті в різних опублікованих джерелах, у тому числі McCutcheon's Emulsifiers and Detergents, щорічних американських та міжнародних виданнях, опублікованих McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; Sisely and Wood, Encyclopedia of Surface Active Agents, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964 та A. S. Davidson and B. Milwidsky, Synthetic Detergents, Seventh Edition, John Wiley and Sons, New York, 1987.

Композиції за даним винаходом також можуть містити допоміжні речовини і добавки для складання, відомі фахівцям у цій галузі техніки як допоміжні засоби для складання (деякі з яких можна розглядати як такі, що функціонують як тверді розріджувачі, рідкі розріджувачі або поверхнево-активні речовини). Такі допоміжні речовини і добавки для складання можуть забезпечувати контроль: pH (буфери), піноутворення під час обробки (протиспінювачі, такі як поліорганосилоксани), осадження активних інгредієнтів (суспендувальні засоби), в'язкості (тиксотропні загусники), росту мікроорганізмів у контейнері (протимікробні речовини), заморожування продукту (антифризи), кольору (дисперсії барвника/пігменту), вимивання (плівкоутворювачі або зв'язувальні речовини), випаровування (сповільнювачі випаровування) та інших властивостей складу. Плівкоутворювачі включають, наприклад, полівінілацетати, співполімери полівінілацетату, співполімер полівінілпіролідону та вінілацетату, полівінілові спирти, співполімери полівінілового спирту та види воску. Приклади допоміжних речовин і добавок для складання включають ті, які перелічені в McCutcheon's Volume 2: Functional Materials, щорічних міжнародних і північноамериканських виданнях, що публікуються McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co., і публікації згідно з PCT WO 03/024222.

Сполуку формули 1a та формули 1b і будь-які інші активні інгредієнти, як правило, включають у композиції за даним винаходом шляхом розчинення активного інгредієнта в розчиннику або шляхом подрібнення в рідкому або сухому розріджувачі. Розчини, у тому числі здатні до емульгування концентрати, можна одержувати шляхом простого змішування інгредієнтів. Якщо розчинник у рідкій композиції, призначеній для застосування як здатний до емульгування концентрат, є незмішуваним із водою, то, як правило, додають емульгатор для емульгування розчинника, що містить активний інгредієнт, після розбавлення водою. Зависі активного інгредієнта з діаметрами частинок, що становлять не більше ніж 2000 мкм, можна розмелювати вологим способом із застосуванням млинів із середовищем з одержанням частинок із середніми діаметрами нижче від 3 мкм. Водні зависі можна перетворювати на готові концентрати суспензії (див., наприклад, патент США № 3060084) або додатково обробляти шляхом висушування розпилюванням з утворенням гранул, здатних до диспергування у воді. Для сухих складів зазвичай потрібні способи сухого розмелювання, за допомогою яких одержують середні діаметри частинок, що знаходяться в діапазоні від 2 до 10 мкм. Пилоподібні препарати і порошки можна одержувати шляхом змішування і зазвичай подрібнення (як, наприклад, за допомогою молоткового млина або струменевого млина). Гранули й пелети можна одержувати за допомогою розпилення активного матеріалу поверх попередньо сформованих гранульованих носіїв або за допомогою методик агломерування. Див. Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, December 4, 1967, с. 147-48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, сторінки 8-57 і далі, і WO 91/13546. Пелети можна одержувати, як описано в патенті США № 4172714. Здатні до диспергування у воді і водорозчинні гранули можна одержувати, як проінформовано в патентах США № 4144050, № 3920442 і в патенті Німеччини № 3246493. Таблетки можна одержувати, як проінформовано в патентах США № 5180587, № 5232701 і № 5208030. Плівки можна одержувати, як проінформовано в патенті Великої Британії № 2095558 і патенті США № 3299566.

Для додаткової інформації, яка стосується галузі складання, див. T. S. Woods, “The Formulator’s Toolbox-Product Forms for Modern Agriculture” у Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge, T. Brooks and T. R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, с. 120-133. Див. також патент США № 3235361, від ст. 6, рядка 16, до ст. 7, рядка 19, і приклади 10-41; патент США № 3309192, від ст. 5, рядка 43, до ст. 7, рядка 62, і приклади 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138-140, 162-164, 166, 167 і 169-182; патент США № 2891855, від ст. 3, рядка 66, до ст. 5, рядка 17, і приклади 1-4; Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, с. 81-96; Hance et al., Weed Control Handbook, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989 і Developments in formulation technology, PJB Publications, Richmond, UK, 2000.

У наступних прикладах усі частки у відсотках наведені за вагою, і всі склади одержані традиційними шляхами. Номер сполуки, тобто “спол. №”, стосується сполук у таблиці 1. Без додаткового уточнення вважається, що фахівець у цій галузі техніки із застосуванням попереднього опису може здійснити на практиці даний винахід у його найбільш повній мірі. Наступні приклади, отже, слід розглядати як лише ілюстративні і як такі, що абсолютно не обмежують винахід будь-яким чином. Частки у відсотках наведені за вагою, крім випадків, де вказано інше.

Приклад A

Концентрат із високою концентрацією	
Сполука формули 1a або формули 1b	98,5 %
Аерогель на основі діоксиду кремнію	0,5 %
Синтетичний аморфний дрібнодисперсний діоксид кремнію	1,0 %

Приклад B

Змочуваний порошок	
Сполука формули 1a або формули 1b	65,0 %
Поліетиленгліколевий етер додецилфенолу	2,0 %
Лігнінсульфонат натрію	4,0 %
Алюмосилікат натрію	6,0 %
Монтморилоніт (кальцинований)	23,0 %

Приклад C

Гранула	
Сполука формули 1a або формули 1b	10,0 %
Атапульгітові гранули (нелетка речовина, 0,71/0,30 мм; сита № 25-50 згідно зі стандартом США)	90,0 %

Приклад D

Екструдована пелета	
Сполука формули 1a або формули 1b	25,0 %
Безводний сульфат натрію	10,0 %
Неочищений лігнінсульфонат кальцію	5,0 %
Алкілнафталінсульфонат натрію	1,0 %
Кальцієвий/магнієвий бентоніт	59,0 %

Приклад E

Здатний до емульгування концентрат

Сполука формули 1a або формули 1b	10,0 %
Гексаолеат поліоксиетиленсорбіту	20,0 %
Метиловий естер C_6-C_{10}жирної кислоти	70,0 %

Приклад F

Мікроемульсія

Сполука формули 1a або формули 1b	5,0 %
Співполімер полівінілпіролідону і вінілацетату	30,0 %
Алкілполіглікозид	30,0 %
Гліцерилмоноолеат	15,0 %
Вода	20,0 %

Приклад G

Концентрат суспензії

Сполука формули 1a або формули 1b	35 %
Блок-співполімер бутилполіоксиетилену і поліпропілену	4,0 %
Співполімер стеаринової кислоти і поліетиленгліколю	1,0 %
Стирол-акриловий полімер	1,0 %
Ксантанова камедь	0,1 %
Пропіленгліколь	5,0 %
Протиспінювальний засіб на основі силікону	0,1 %
1,2-Бензізотіазолін-3-он	0,1 %
Вода	53,7 %

Приклад H

Емульсія у воді

Сполука формули 1a або формули 1b	10,0 %
Блок-співполімер бутилполіоксиетилену і поліпропілену	4,0 %
Співполімер стеаринової кислоти і поліетиленгліколю	1,0 %
Стирол-акриловий полімер	1,0 %
Ксантанова камедь	0,1 %
Пропіленгліколь	5,0 %
Протиспінювальний засіб на основі силікону	0,1 %
1,2-Бензізотіазолін-3-он	0,1 %
Ароматичний вуглеводень на основі нафтопродуктів	20,0
Вода	58,7 %

Приклад I

Масляна дисперсія

Сполука формули 1a або формули 1b	25 %
Гексаолеат поліоксиетиленсорбіту	15 %
Органічно модифікована бентонітова глина	2,5 %
Метиловий естер жирної кислоти	57,5 %

Також розкриті наведені вище приклади від A до I, де “сполука формули 1a або формули 1b”

замінена за допомогою “сполуки формули 2 (енантіомер 2A) або формули 2 (енантіомер 2B)”, сполуки формули 3 (енантіомер 3A) або формули 3 (енантіомер 3B), “сполуки формули 4 (енантіомер 4A) або формули 4 (енантіомер 4B)” або “сполуки формули 5 (енантіомер 5A) або формули 5 (енантіомер 5B)”.

Результати випробувань указують на те, що певні сполуки формули 1a або формули 1b являють собою активні передсходові та/або післясходові гербіциди та/або регулятори росту рослин. Сполуки формули 1a або формули 1b загалом демонструють найвищу активність для контролю бур’янів на післясходовій стадії (тобто під час застосування після появи сходів бур’янів із ґрунту) та контролю бур’янів на передсходовій стадії (тобто під час застосування до появи сходів бур’янів із ґрунту). Багато з них характеризуються практичною застосовністю для контролю бур’янів широкого спектра на перед- і/або післясходовій стадіях на територіях, де необхідний повний контроль усієї рослинності, як, наприклад, біля резервуарів для зберігання палива, індустріальних складських ділянок, місць паркування, автокінотеатрів, аеродромів, берегів річок, зрошувальних систем та інших каналів для пропуску води, біля рекламних щитів та автодорожніх і залізничних структур. Багато зі сполук за даним винаходом є застосовними для селективного контролю трав і широколистих бур’янів у межах змішаного комплексу сільськогосподарських культур/бур’янів на основі селективного метаболізму у сільськогосподарських культур відносно бур’янів, або на основі селективної дії в ділянці фізіологічного інгібування у сільськогосподарських культур та бур’янів, або на основі селективного розміщення на або у навколишньому середовищі змішаного комплексу сільськогосподарських культур та бур’янів. Фахівець у цій галузі техніки зрозуміє, що переважну комбінацію таких факторів селективності в рамках сполуки або групи сполук можна легко визначити шляхом проведення звичайних біологічних та/або біохімічних аналізів.

Сполуки формули 1a або формули 1b можуть демонструвати толерантність щодо важливих агрономічних сільськогосподарських культур, у тому числі без обмеження люцерни, ячменю, бавовнику, пшениці, ріпаку, видів цукрового буряка, кукурудзи (маїсу), сорго, видів сої, рису, видів вівса, видів арахісу, овочів, томата, картоплі, багаторічних плантаційних сільськогосподарських культур, у тому числі кавового дерева, дерева какао, олійної пальми, каучуконосних рослин, цукрової тростини, цитрусових рослин, видів винограду, плодових дерев, горіхоплідних дерев, бананового дерева, плантана, ананаса, видів хмелю, чайного куща і лісових рослин, таких як евкаліпт і хвойні рослини (наприклад, сосна ладанна), і видів дернових рослин (наприклад, тонконога лучного, трави святого Августина, костриці очеретяної і свинорию пальчастого). Сполуки за цим винаходом можна застосовувати в або на сільськогосподарських культурах, генетично трансформованих або виведених для набуття стійкості до гербіцидів, експресії білків, токсичних для безхребетних шкідників (таких як токсин Bacillus thuringiensis), і/або експресії інших застосовних ознак. Фахівець у цій галузі техніки зрозуміє, що не всі сполуки рівноцінно ефективні щодо всіх бур’янів. Альтернативно сполуки, що заявляються, є застосовними для зміни росту рослини.

Оскільки сполуки за даним винаходом характеризуються як передсходовою, так і післясходовою гербіцидною активністю зі здійсненням контролю небажаної рослинності шляхом знищення або пошкодження рослинності або зниження її росту, сполуки можна практично застосовувати за допомогою різних способів, що передбачають приведення гербіцидно ефективної кількості сполуки за даним винаходом або композиції, що містить указану сполуку і щонайменше одне з поверхнево-активної речовини, твердого розріджувача або рідкого розріджувача, у контакт із надземною частиною або іншою частиною небажаної рослинності або із середовищем зростання небажаної рослинності, таким як ґрунт або вода, в якому росте небажана рослинність або яке оточує насінину або іншу частину для розмноження небажаної рослинності.

Гербіцидно ефективна кількість сполуки формули 1a або формули 1b визначається низкою факторів. Такі фактори включають вибраний склад, спосіб застосування, кількість і тип наявної рослинності, умови вирощування тощо. Загалом гербіцидно ефективна кількість сполук за даним винаходом становить від приблизно 0,001 до 20 кг/га з переважним діапазоном, що становить від приблизно 0,004 до 1 кг/га. Фахівець у цій галузі техніки може легко визначити гербіцидно ефективну кількість, необхідну для бажаного рівня контролю бур’янів.

В одному звичайному варіанті здійснення сполуку формули 1a або формули 1b застосовують, як правило, у складеній композиції щодо ділянки, що містить бажану рослинність (наприклад, сільськогосподарські культури) і небажану рослинність (тобто бур’яни), обидві з яких можуть являти собою насіння, сходи та/або рослини на більш пізній стадії, у контакті із середовищем зростання (наприклад, ґрунтом). У цій ділянці композицію, що містить сполуку за даним винаходом, можна безпосередньо застосовувати щодо рослини або її частини, зокрема

небажаної рослинності, та/або щодо середовища зростання в контакті з рослиною.

Різновиди і сорти рослин бажаної рослинності на ділянці, обробленій сполукою за даним винаходом, можуть бути одержані звичайними способами розмноження та селекції або методами генної інженерії. Генетично модифікованими рослинами (трансгенними рослинами) є такі, в яких гетерологічний ген (трансген) стабільно інтегрований у геном рослини. Трансген, зумовлений його конкретним положенням у геномі рослини, називається подією трансформації або трансгенним об'єктом.

Хоча, як правило, сполуки за даним винаходом застосовують для контролю небажаної рослинності, контакт бажаної рослинності в оброблюваній ділянці зі сполуками за даним винаходом може зумовити нададитивні або синергетичні ефекти з генетичними ознаками в бажаної рослинності, в тому числі ознаками, включеними за допомогою генетичної модифікації. Наприклад, стійкість до травоїдних шкідників-комах або захворювань рослин, толерантність до біотичних/абіотичних стресових факторів або стабільність під час зберігання можуть бути більшими, ніж очікувані внаслідок генетичних ознак у бажаної рослинності.

Сполуки за даним винаходом також можна змішувати з однією або декількома іншими біологічно активними сполуками або засобами, у тому числі гербіцидами, антидотами гербіцидів, фунгіцидами, інсектицидами, нематоцидами, бактерицидами, акарицидами, регуляторами росту, такими як інгібітори линяння комах і стимулятори коренеутворення, хімічними стерилізаторами, хімічними сигнальними речовинами, репелентами, атрактантами, феромонами, стимуляторами поїдання, поживними речовинами для рослин, іншими біологічно активними сполуками або ентомопатогенними бактеріями, вірусом або грибами, з утворенням багатокомпонентного пестициду, який забезпечує ще більш широкий спектр захисту в галузі сільського господарства. Суміші сполук за даним винаходом з іншими гербіцидами можуть розширювати спектр активності щодо додаткових видів бур'янів та пригнічувати поширення будь-яких стійких біотипів. Отже, даний винахід також стосується композиції, яка містить сполуку формули 1a та/або формули 1b (у гербіцидно ефективній кількості) і щонайменше одну додаткову біологічно активну сполуку або засіб (у біологічно ефективній кількості) і може додатково містити щонайменше одне з поверхнево-активної речовини, твердого розріджувача або рідкого розріджувача. Інші біологічно активні сполуки або засоби можна складати у композиції, що містять щонайменше одне з поверхнево-активної речовини, твердого або рідкого розріджувача. У випадку сумішей за даним винаходом одну або декілька інших біологічно активних сполук або засобів можна складати разом зі сполукою формули 1a або формули 1b з утворенням попередньої суміші, або одну або декілька інших біологічно активних сполук або засобів можна складати окремо від сполуки формули 1a або формули 1b та об'єднувати склади перед застосуванням (наприклад, у резервуарі обприскувача) або альтернативно застосовувати послідовно.

Загальні джерела, що стосуються захисних засобів, які застосовуються в галузі сільського господарства (тобто гербіцидів, антидотів гербіцидів, інсектицидів, фунгіцидів, нематоцидів, акарицидів та біологічних засобів), включають The Pesticide Manual, 13th Edition, C. D. S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2003 і The BioPesticide Manual, 2nd Edition, L. G. Copping, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2001.

Для варіантів здійснення, де застосовують один або декілька таких різних партнерів для змішування, партнери для змішування, як правило, застосовують у кількостях, аналогічних кількостям, загальноприйнятим у разі, коли партнери для змішування застосовують окремо. Конкретніше у сумішах активні інгредієнти часто застосовують у нормі внесення, що становить від половини до повної норми внесення, зазначеної на маркуванні продуктів для застосування активного інгредієнта окремо. Такі кількості перелічені у джерелах, таких як The Pesticide Manual і The BioPesticide Manual. Вагове співвідношення таких різних партнерів для змішування (загалом) і сполуки формули 1a або формули 1b, як правило, становить від приблизно 1:3000 до приблизно 3000:1. Варто відзначити вагові співвідношення від приблизно 1:300 до приблизно 300:1 (наприклад, співвідношення від приблизно 1:30 до 30:1). Фахівець у цій галузі техніки може легко визначити шляхом простого експериментування біологічно ефективні кількості активних інгредієнтів, необхідних для бажаного спектра біологічної активності. Буде очевидно, що включення таких додаткових компонентів може розширювати спектр контрольованих бур'янів за межі спектра, що контролюється сполукою формули 1a або формули 1b окремо.

Варто відзначити композицію, що містить сполуку за даним винаходом (у гербіцидно ефективній кількості), щонайменше один додатковий активний інгредієнт, вибраний із групи, яка складається з інших гербіцидів та антидотів гербіцидів (в ефективній кількості), і щонайменше один компонент, вибраний із групи, яка складається з поверхнево-активних речовин, твердих розріджувачів і рідких розріджувачів.

У таблиці А1 перелічені конкретні комбінації компонента (a) з компонентом (b), що є ілюстраціями сумішей, композицій та способів за даним винаходом. Сполука № А (тобто “спол. №” означає “номер сполуки”) у стовпчику “Компонент (a)” визначена в таблиці індексів. У другому стовпчику таблиці А1 наведена конкретна сполука, що являє собою компонент (b) (наприклад, “2,4-D” в першому рядку). У третьому, четвертому і п’ятому стовпчиках таблиці А1 перелічені діапазони вагових співвідношень для норм, за яких сполуку, що являє собою компонент (a), як правило, застосовують для сільськогосподарської культури, що вирощується на полях, відносно таких для компонента (b) (тобто (a):(b)). Отже, наприклад, у першому рядку таблиці А1 конкретно розкрита комбінація компонента (a) (тобто сполука № А у таблиці індексів) з 2,4-D, як правило, застосовувана у ваговому співвідношенні 1:192-6:1. Решту рядків таблиці А1 слід тлумачити подібним чином.

Таблиця А1

Компонент (a) (сполука №)	Компонент (b)	Типове вагове співвідношення	Більш типове вагове співвідношення	Найбільш типове вагове співвідношення
2 (енантіомер А)	2,4-D	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
2 (енантіомер А)	Ацетохлор	1:768-2:1	1:256-1:2	1:96-1:11
2 (енантіомер А)	Ацифлуорфен	1:96-12:1	1:32-4:1	1:12-1:2
2 (енантіомер А)	Аклоніфен	1:857-2:1	1:285-1:3	1:107-1:12
2 (енантіомер А)	Алахлор	1:768-2:1	1:256-1:2	1:96-1:11
2 (енантіомер А)	Аметрин	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
2 (енантіомер А)	Амікарбазон	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
2 (енантіомер А)	Амідосульфурон	1:6-168:1	1:2-56:1	1:1-11:1
2 (енантіомер А)	Аміноциклопірахлор	1:48-24:1	1:16-8:1	1:6-2:1
2 (енантіомер А)	Амінопіралід	1:20-56:1	1:6-19:1	1:2-4:1
2 (енантіомер А)	Амітрол	1:768-2:1	1:256-1:2	1:96-1:11
2 (енантіомер А)	Анілофос	1:96-12:1	1:32-4:1	1:12-1:2
2 (енантіомер А)	Асулам	1:960-2:1	1:320-1:3	1:120-1:14
2 (енантіомер А)	Атразин	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
2 (енантіомер А)	Азимсульфурон	1:6-168:1	1:2-56:1	1:1-11:1
2 (енантіомер А)	Бефлубутамід	1:342-4:1	1:114-2:1	1:42-1:5
2 (енантіомер А)	S-бефлубутамід	1:171-4:0,5	1:57-2:0,5	1:21-1:2,5
2 (енантіомер А)	Бенфуресат	1:617-2:1	1:205-1:2	1:77-1:9
2 (енантіомер А)	Бенсульфурон-метил	1:25-45:1	1:8-15:1	1:3-3:1
2 (енантіомер А)	Бентазон	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
2 (енантіомер А)	Бензобіциклон	1:85-14:1	1:28-5:1	1:10-1:2
2 (енантіомер А)	Бензофенап	1:257-5:1	1:85-2:1	1:32-1:4
2 (енантіомер А)	Біциклопірон	1:42-27:1	1:14-9:1	1:5-2:1
2 (енантіомер А)	Біфенокс	1:257-5:1	1:85-2:1	1:32-1:4
2 (енантіомер А)	Біспірибак-натрій	1:10-112:1	1:3-38:1	1:1-7:1
2 (енантіомер А)	Бікслозон	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
2 (енантіомер А)	Бромацил	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
2 (енантіомер А)	Бромобутид	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
2 (енантіомер А)	Бромоксиніл	1:96-12:1	1:32-4:1	1:12-1:2
2 (енантіомер А)	Бутахлор	1:768-2:1	1:256-1:2	1:96-1:11
2 (енантіомер А)	Бутафенацил	1:42-27:1	1:14-9:1	1:5-2:1
2 (енантіомер А)	Бутилат	1:1542-1:2	1:514-1:5	1:192-1:22
2 (енантіомер А)	Карфенстрол	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
2 (енантіомер А)	Карфентразон-етил	1:128-9:1	1:42-3:1	1:16-1:2
2 (енантіомер А)	Хлоримурон-етил	1:8-135:1	1:2-45:1	1:1-9:1
2 (енантіомер А)	Хлоротолурон	1:768-2:1	1:256-1:2	1:96-1:11
2 (енантіомер А)	Хлорсульфурон	1:6-168:1	1:2-56:1	1:1-11:1
2 (енантіомер А)	Цинкосульфурон	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
2 (енантіомер А)	Цинідон-етил	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
2 (енантіомер А)	Цинметилін	1:34-34:1	1:11-12:1	1:4-3:1
2 (енантіомер А)	Клацифос	1:34-34:1	1:11-12:1	1:4-3:1

Таблиця А1 (продовження)

Компонент (a) (сполука №)	Компонент (b)	Типове вагове співвідношення	Більш типове вагове співвідношення	Найбільш типове вагове співвідношення
2 (енантіомер А)	Клетодим	1:48-24:1	1:16-8:1	1:6-2:1
2 (енантіомер А)	Клодинафоп-пропаргіл	1:20-56:1	1:6-19:1	1:2-4:1
2 (енантіомер А)	Кломазон	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
2 (енантіомер А)	Кломепроп	1:171-7:1	1:57-3:1	1:21-1:3
2 (енантіомер А)	Клопіралід	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
2 (енантіомер А)	Клорансулам-метил	1:12-96:1	1:4-32:1	1:1-6:1
2 (енантіомер А)	Кумілурон	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
2 (енантіомер А)	Ціаназин	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
2 (енантіомер А)	Циклопіриморат	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
2 (енантіомер А)	Циклосульфамурон	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
2 (енантіомер А)	Циклоксидим	1:96-12:1	1:32-4:1	1:12-1:2
2 (енантіомер А)	Цигалофоп	1:25-45:1	1:8-15:1	1:3-3:1
2 (енантіомер А)	Даїмурон	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
2 (енантіомер А)	Десмедифам	1:322-4:1	1:107-2:1	1:40-1:5
2 (енантіомер А)	Дикамба	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
2 (енантіомер А)	Дихлобеніл	1:1371-1:2	1:457-1:4	1:171-1:20
2 (енантіомер А)	Дихлорпроп	1:925-2:1	1:308-1:3	1:115-1:13
2 (енантіомер А)	Диклофоп-метил	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
2 (енантіомер А)	Диклосулам	1:10-112:1	1:3-38:1	1:1-7:1
2 (енантіомер А)	Дифензокват	1:288-4:1	1:96-2:1	1:36-1:4
2 (енантіомер А)	Дифлуфенікан	1:857-2:1	1:285-1:3	1:107-1:12
2 (енантіомер А)	Дифлуфензопір	1:12-96:1	1:4-32:1	1:1-6:1
2 (енантіомер А)	Диметахлор	1:768-2:1	1:256-1:2	1:96-1:11
2 (енантіомер А)	Диметаметрин	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
2 (енантіомер А)	Диметенамід-П	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
2 (енантіомер А)	Дитіопір	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
2 (енантіомер А)	Діурон	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
2 (енантіомер А)	ЕРТС	1:768-2:1	1:256-1:2	1:96-1:11
2 (енантіомер А)	Еспрокарб	1:1371-1:2	1:457-1:4	1:171-1:20
2 (енантіомер А)	Еталфлуралін	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
2 (енантіомер А)	Етаметсульфурон-метил	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
2 (енантіомер А)	Етоксифен	1:8-135:1	1:2-45:1	1:1-9:1
2 (енантіомер А)	Етоксисульфурон	1:20-56:1	1:6-19:1	1:2-4:1
2 (енантіомер А)	Етобензанід	1:257-5:1	1:85-2:1	1:32-1:4
2 (енантіомер А)	Феноксапроп-етил	1:120-10:1	1:40-4:1	1:15-1:2
2 (енантіомер А)	Феноксасульфон	1:85-14:1	1:28-5:1	1:10-1:2
2 (енантіомер А)	Фенквінотрион	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
2 (енантіомер А)	Фентразамід	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
2 (енантіомер А)	Флазасульфурон	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
2 (енантіомер А)	Флорасулам	1:2-420:1	1:1-140:1	2:1-27:1
2 (енантіомер А)	Флуазифоп-бутил	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
2 (енантіомер А)	Флукарбазон	1:8-135:1	1:2-45:1	1:1-9:1
2 (енантіомер А)	Флусетосульфурон	1:8-135:1	1:2-45:1	1:1-9:1
2 (енантіомер А)	Флуфенацет	1:257-5:1	1:85-2:1	1:32-1:4
2 (енантіомер А)	Флуметсулам	1:24-48:1	1:8-16:1	1:3-3:1
2 (енантіомер А)	Флуміклорак-пентил	1:10-112:1	1:3-38:1	1:1-7:1
2 (енантіомер А)	Флуміоксазин	1:25-45:1	1:8-15:1	1:3-3:1
2 (енантіомер А)	Флуометурон	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
2 (енантіомер А)	Флупірсульфурон-метил	1:3-336:1	1:1-112:1	2:1-21:1

Таблиця A1 (продовження)

Компонент (a) (сполука №)	Компонент (b)	Типове вагове співвідношення	Більш типове вагове співвідношення	Найбільш типове вагове співвідношення
2 (енантіомер A)	Флуридон	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
2 (енантіомер A)	Флуроксипір	1:96-12:1	1:32-4:1	1:12-1:2
2 (енантіомер A)	Флуртамон	1:857-2:1	1:285-1:3	1:107-1:12
2 (енантіомер A)	Флутіацет-метил	1:48-42:1	1:16-14:1	1:3-3:1
2 (енантіомер A)	Фомесафен	1:96-12:1	1:32-4:1	1:12-1:2
2 (енантіомер A)	Форамсульфурон	1:13-84:1	1:4-28:1	1:1-6:1
2 (енантіомер A)	Глюфосинат	1:288-4:1	1:96-2:1	1:36-1:4
2 (енантіомер A)	Гліфосат	1:288-4:1	1:96-2:1	1:36-1:4
2 (енантіомер A)	Галосульфурон-метил	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
2 (енантіомер A)	Галауксифен	1:20-56:1	1:6-19:1	1:2-4:1
2 (енантіомер A)	Галауксифен-метил	1:20-56:1	1:6-19:1	1:2-4:1
2 (енантіомер A)	Галоксифоп-метил	1:34-34:1	1:11-12:1	1:4-3:1
2 (енантіомер A)	Гексазинон	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
2 (енантіомер A)	Гідантоцидин	1:1100-16:1	1:385-8:1	1:144-4:1
2 (енантіомер A)	Імазамокс	1:13-84:1	1:4-28:1	1:1-6:1
2 (енантіомер A)	Імазапік	1:20-56:1	1:6-19:1	1:2-4:1
2 (енантіомер A)	Імазапір	1:85-14:1	1:28-5:1	1:10-1:2
2 (енантіомер A)	Імазаквін	1:34-34:1	1:11-12:1	1:4-3:1
2 (енантіомер A)	Імазетабенз-метил	1:171-7:1	1:57-3:1	1:21-1:3
2 (енантіомер A)	Імазетапір	1:24-48:1	1:8-16:1	1:3-3:1
2 (енантіомер A)	Імазосульфурон	1:27-42:1	1:9-14:1	1:3-3:1
2 (енантіомер A)	Інданофан	1:342-4:1	1:114-2:1	1:42-1:5
2 (енантіомер A)	Індазифлам	1:25-45:1	1:8-15:1	1:3-3:1
2 (енантіомер A)	Йодосульфурон-метил	1:3-336:1	1:1-112:1	2:1-21:1
2 (енантіомер A)	Іоксиніл	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
2 (енантіомер A)	Іпфенкарбазон	1:85-14:1	1:28-5:1	1:10-1:2
2 (енантіомер A)	Ізопротурон	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
2 (енантіомер A)	Ізоксабен	1:288-4:1	1:96-2:1	1:36-1:4
2 (енантіомер A)	Ізоксафлутол	1:60-20:1	1:20-7:1	1:7-2:1
2 (енантіомер A)	Лактофен	1:42-27:1	1:14-9:1	1:5-2:1
2 (енантіомер A)	Ленацил	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
2 (енантіомер A)	Лінурон	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
2 (енантіомер A)	MCPA	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
2 (енантіомер A)	MCPB	1:288-4:1	1:96-2:1	1:36-1:4
2 (енантіомер A)	Мекопроп	1:768-2:1	1:256-1:2	1:96-1:11
2 (енантіомер A)	Мефенацет	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
2 (енантіомер A)	Мефлуїдид	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
2 (енантіомер A)	Мезосульфурон-метил	1:5-224:1	1:1-75:1	1:1-14:1
2 (енантіомер A)	Мезотрион	1:42-27:1	1:14-9:1	1:5-2:1
2 (енантіомер A)	Метаміфоп	1:42-27:1	1:14-9:1	1:5-2:1
2 (енантіомер A)	Метазахлор	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
2 (енантіомер A)	Метазосульфурон	1:25-45:1	1:8-15:1	1:3-3:1
2 (енантіомер A)	Метабензтіазурон	1:768-2:1	1:256-1:2	1:96-1:11
2 (енантіомер A)	Метолахлор	1:768-2:1	1:256-1:2	1:96-1:11
2 (енантіомер A)	Метосулам	1:8-135:1	1:2-45:1	1:1-9:1
2 (енантіомер A)	Метрибузин	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
2 (енантіомер A)	Метсульфурон-метил	1:2-560:1	1:1-187:1	3:1-35:1
2 (енантіомер A)	Молінат	1:1028-2:1	1:342-1:3	1:128-1:15
2 (енантіомер A)	Напропамід	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6

Таблиця А1 (продовження)

Компонент (a) (сполука №)	Компонент (b)	Типове вагове співвідношення	Більш типове вагове співвідношення	Найбільш типове вагове співвідношення
2 (енантіомер А)	Напропамід-М	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
2 (енантіомер А)	Напталам	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
2 (енантіомер А)	Нікосульфурон	1:12-96:1	1:4-32:1	1:1-6:1
2 (енантіомер А)	Норфлуразон	1:1152-1:1	1:384-1:3	1:144-1:16
2 (енантіомер А)	Орбенкарб	1:1371-1:2	1:457-1:4	1:171-1:20
2 (енантіомер А)	Ортосульфамурон	1:20-56:1	1:6-19:1	1:2-4:1
2 (енантіомер А)	Оризалін	1:514-3:1	1:171-1:2	1:64-1:8
2 (енантіомер А)	Оксадіаргіл	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
2 (енантіомер А)	Оксадіазон	1:548-3:1	1:182-1:2	1:68-1:8
2 (енантіомер А)	Оксасульфурон	1:27-42:1	1:9-14:1	1:3-3:1
2 (енантіомер А)	Оксазикломефон	1:42-27:1	1:14-9:1	1:5-2:1
2 (енантіомер А)	Оксифлуорфен	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
2 (енантіомер А)	Паракват	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
2 (енантіомер А)	Пендиметалін	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
2 (енантіомер А)	Пеноксулам	1:10-112:1	1:3-38:1	1:1-7:1
2 (енантіомер А)	Пентоксамід	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
2 (енантіомер А)	Пентоксазон	1:102-12:1	1:34-4:1	1:12-1:2
2 (енантіомер А)	Фенмедифам	1:102-12:1	1:34-4:1	1:12-1:2
2 (енантіомер А)	Піклорам	1:96-12:1	1:32-4:1	1:12-1:2
2 (енантіомер А)	Піколінафен	1:34-34:1	1:11-12:1	1:4-3:1
2 (енантіомер А)	Піноксаден	1:25-45:1	1:8-15:1	1:3-3:1
2 (енантіомер А)	Претилахлор	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
2 (енантіомер А)	Примісульфурон-метил	1:8-135:1	1:2-45:1	1:1-9:1
2 (енантіомер А)	Продіамін	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
2 (енантіомер А)	Профоксидим	1:42-27:1	1:14-9:1	1:5-2:1
2 (енантіомер А)	Прометрин	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
2 (енантіомер А)	Пропахлор	1:1152-1:1	1:384-1:3	1:144-1:16
2 (енантіомер А)	Пропаніл	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
2 (енантіомер А)	Пропаквізафоп	1:48-24:1	1:16-8:1	1:6-2:1
2 (енантіомер А)	Пропоксикарбазон	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
2 (енантіомер А)	Пропірисульфурон	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
2 (енантіомер А)	Пропізамід	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
2 (енантіомер А)	Просульфокарб	1:1200-1:2	1:400-1:4	1:150-1:17
2 (енантіомер А)	Просульфурон	1:6-168:1	1:2-56:1	1:1-11:1
2 (енантіомер А)	Піраклоніл	1:42-27:1	1:14-9:1	1:5-2:1
2 (енантіомер А)	Пірафлуфен-етил	1:5-224:1	1:1-75:1	1:1-14:1
2 (енантіомер А)	Пірасульфотол	1:13-84:1	1:4-28:1	1:1-6:1
2 (енантіомер А)	Піразолінат	1:857-2:1	1:285-1:3	1:107-1:12
2 (енантіомер А)	Піразосульфурон-етил	1:10-112:1	1:3-38:1	1:1-7:1
2 (енантіомер А)	Піразоксифен	1:5-224:1	1:1-75:1	1:1-14:1
2 (енантіомер А)	Пірибензоксим	1:10-112:1	1:3-38:1	1:1-7:1
2 (енантіомер А)	Пірибутикарб	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
2 (енантіомер А)	Піридат	1:288-4:1	1:96-2:1	1:36-1:4
2 (енантіомер А)	Пірифталід	1:10-112:1	1:3-38:1	1:1-7:1
2 (енантіомер А)	Піримінобак-метил	1:20-56:1	1:6-19:1	1:2-4:1
2 (енантіомер А)	Піримісульфан	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
2 (енантіомер А)	Піритіобак	1:24-48:1	1:8-16:1	1:3-3:1
2 (енантіомер А)	Піроксасульфон	1:85-14:1	1:28-5:1	1:10-1:2
2 (енантіомер А)	Піроксулам	1:5-224:1	1:1-75:1	1:1-14:1
2 (енантіомер А)	Квінклорак	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3

Таблиця А1 (продовження)

Компонент (a) (сполука №)	Компонент (b)	Типове вагове співвідношення	Більш типове вагове співвідношення	Найбільш типове вагове співвідношення
2 (енантіомер А)	Квізалофоп-етил	1:42-27:1	1:14-9:1	1:5-2:1
2 (енантіомер А)	Римсульфурон	1:13-84:1	1:4-28:1	1:1-6:1
2 (енантіомер А)	Сафлуфенацил	1:25-45:1	1:8-15:1	1:3-3:1
2 (енантіомер А)	Сетоксидим	1:96-12:1	1:32-4:1	1:12-1:2
2 (енантіомер А)	Симазин	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
2 (енантіомер А)	Сулькотрион	1:120-10:1	1:40-4:1	1:15-1:2
2 (енантіомер А)	Сульфентразон	1:147-8:1	1:49-3:1	1:18-1:3
2 (енантіомер А)	Сульфометурон-метил	1:34-34:1	1:11-12:1	1:4-3:1
2 (енантіомер А)	Сульфосульфурон	1:8-135:1	1:2-45:1	1:1-9:1
2 (енантіомер А)	Тебутіурон	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
2 (енантіомер А)	Тефурилтрион	1:42-27:1	1:14-9:1	1:5-2:1
2 (енантіомер А)	Темботрион	1:31-37:1	1:10-13:1	1:3-3:1
2 (енантіомер А)	Тепралоксидим	1:25-45:1	1:8-15:1	1:3-3:1
2 (енантіомер А)	Тербацил	1:288-4:1	1:96-2:1	1:36-1:4
2 (енантіомер А)	Тербутилазин	1:857-2:1	1:285-1:3	1:107-1:12
2 (енантіомер А)	Тербутрин	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
2 (енантіомер А)	Тенілхлор	1:85-14:1	1:28-5:1	1:10-1:2
2 (енантіомер А)	Тіазопір	1:384-3:1	1:128-1:1	1:48-1:6
2 (енантіомер А)	Тієнкарбазон	1:3-336:1	1:1-112:1	2:1-21:1
2 (енантіомер А)	Тифенсульфурон-метил	1:5-224:1	1:1-75:1	1:1-14:1
2 (енантіомер А)	Тіафенацил	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
2 (енантіомер А)	Тіобенкарб	1:768-2:1	1:256-1:2	1:96-1:11
2 (енантіомер А)	Толпіралат	1:31-37:1	1:10-13:1	1:3-3:1
2 (енантіомер А)	Топрамзон	1:6-168:1	1:2-56:1	1:1-11:1
2 (енантіомер А)	Тралкоксидим	1:68-17:1	1:22-6:1	1:8-2:1
2 (енантіомер А)	Триафамон	1:2-420:1	1:1-140:1	2:1-27:1
2 (енантіомер А)	Триалат	1:768-2:1	1:256-1:2	1:96-1:11
2 (енантіомер А)	Триасульфурон	1:5-224:1	1:1-75:1	1:1-14:1
2 (енантіомер А)	Триазифлам	1:171-7:1	1:57-3:1	1:21-1:3
2 (енантіомер А)	Трибенурон-метил	1:3-336:1	1:1-112:1	2:1-21:1
2 (енантіомер А)	Триклопір	1:192-6:1	1:64-2:1	1:24-1:3
2 (енантіомер А)	Трифлоксисульфурон	1:2-420:1	1:1-140:1	2:1-27:1
2 (енантіомер А)	Трифлудимоксазин	1:25-45:1	1:8-15:1	1:3-3:1
2 (енантіомер А)	Трифлуралін	1:288-4:1	1:96-2:1	1:36-1:4
2 (енантіомер А)	Трифлусульфурон-метил	1:17-68:1	1:5-23:1	1:2-5:1
2 (енантіомер А)	Тритосульфурон	1:13-84:1	1:4-28:1	1:1-6:1

Таблиця А2 побудована так само, як таблиця А1 вище, з тією різницею, що записи під заголовком стовпчика “Компонент (a) (сполука №)” замінені відповідним записом у стовпчику “Компонент (a)”, показаним нижче. Сполука № в стовпчику “Компонент (a)” визначена в таблиці індексів 1. Таким чином, наприклад, у таблиці А2 в усіх записах під заголовком стовпчика “Компонент (a)” міститься “2 (енантіомер В)” (сполука № 2, вказана в таблиці індексів 1), і перший рядок під заголовками стовпчиків у таблиці А2 конкретно розкриває суміш сполуки № 2 (енантіомер В) з 2,4-D.

Таблиця А2

Номер таблиці	Записи в стовпчику "Компонент (a)”
А2	2 (енантіомер 2В)
А3	3 (енантіомер 3А)

Таблиця А2 (продовження)

Номер таблиці	Записи в стовпчику "Компонент (а)”
А4	3 (енантіомер 3В)
А5	4 (енантіомер 4А)
А6	4 (енантіомер 4В)
А7	5 (енантіомер 5В)
А8	5 (енантіомер 5А)

У деяких випадках комбінації сполуки за даним винаходом з іншими біологічно активними (зокрема, гербіцидними) сполуками або засобами (тобто активними інгредієнтами) можуть зумовлювати більший, ніж адитивний (тобто синергетичний), ефект щодо бур’янів і/або менший, ніж адитивний, ефект (тобто запобіжний) щодо сільськогосподарських культур або інших бажаних рослин. Зниження кількості активних інгредієнтів, що вивільняються у навколишнє середовище із забезпеченням ефективного контролю шкідників, завжди є бажаним. Можливість застосовувати більші кількості активних інгредієнтів з одержанням більш ефективного контролю бур’янів без надмірного пошкодження сільськогосподарських культур також є бажаною. Якщо виникає синергетичний ефект гербіцидних активних інгредієнтів щодо бур’янів за норм застосування, що забезпечують з агрономічного погляду задовільні рівні контролю бур’янів, то такі комбінації можуть бути переважними для зниження ціни виробництва сільськогосподарських культур та зменшення навантаження на навколишнє середовище. Якщо виникає запобіжний ефект гербіцидних активних інгредієнтів щодо сільськогосподарських культур, то такі комбінації можуть бути переважними для підвищення захисту сільськогосподарських культур шляхом зниження конкуренції з бур’янами.

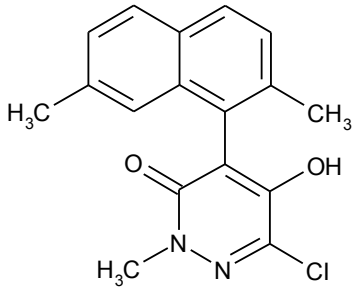
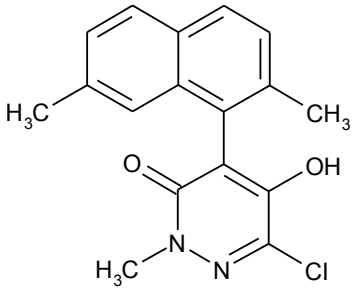
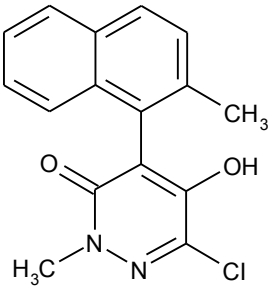
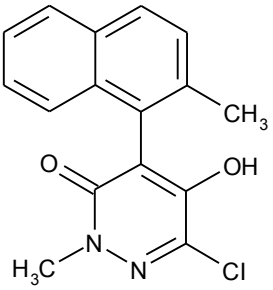
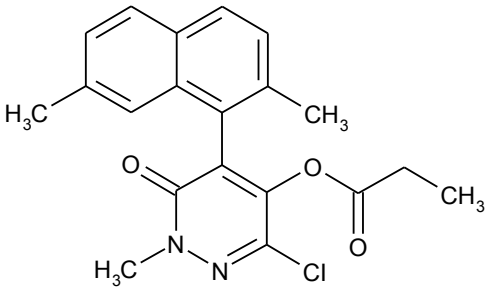
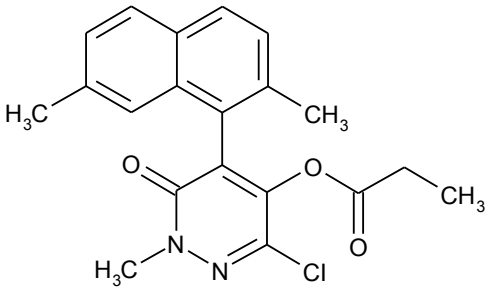
Варто відзначити комбінацію сполуки за даним винаходом із щонайменше одним іншим гербіцидним активним інгредієнтом. Окремо варто відзначити таку комбінацію, де інший гербіцидний активний інгредієнт характеризується місцем прикладання дії, відмінним від такої сполуки за даним винаходом. У деяких випадках комбінація із щонайменше одним іншим гербіцидним активним інгредієнтом, що характеризується аналогічним спектром контролю, але відмінним місцем прикладання дії, зокрема, буде переважною для регулювання стійкості. Таким чином, композиція за даним винаходом може додатково містити (у гербіцидно ефективній кількості) щонайменше один додатковий гербіцидний активний інгредієнт, що характеризується аналогічним спектром контролю, але відмінним місцем прикладання дії.

Сполуки за даним винаходом також можна застосовувати в комбінації з антидотами гербіцидів, такими як алідохлор, беноксакор, клоквінтосет-мексил, кумілурон, ціометриніл, ципросульфонамід, даїмурон, дихлормід, дициклонон, діетолат, димепіперат, фенхлоразол-етил, фенклорим, флуразол, флуксофенім, фурилазол, ізоксадифен-етил, мефенпір-діетил, мефенат, нафталіновий ангідрид метоксифенону (1,8-нафталіновий ангідрид), оксабетриніл, N-(амінокарбоніл)-2-метилбензолсульфонамід, N-(амінокарбоніл)-2-фторбензолсульфонамід, 1-бром-4-[(хлорметил)сульфоніл]бензол (BCS), 4-(дихлорацетил)-1-окса-4-азоспіро[4.5]декан (MON 4660), 2-(дихлорметил)-2-метил-1,3-діоксолан (MG 191), етил-1,6-дигідро-1-(2-метоксифеніл)-6-оксо-2-феніл-5-піримідинкарбоксилат, 2-гідрокси-N,N-диметил-6-(трифторметил)піридин-3-карбоксамід, 1-(3,4-диметилфеніл)-l,6-дигідро-6-оксо-2-феніл-5-піримідинкарбоксилат, 2,2-дихлор-1-(2,2,5-триметил-3-оксазолідиніл)-етанон і 2-метокси-N-[[4-[[(метиламіно)карбоніл]аміно]феніл]сульфоніл]-бензамід, із підвищенням безпеки щодо певних сільськогосподарських культур. Ефективні з погляду забезпечення ефекту антидоту кількості антидотів гербіцидів можна застосовувати в той самий час, що і сполуки за даним винаходом, або застосовувати як засоби для обробки насіння. Отже, один аспект даного винаходу стосується гербіцидної суміші, що містить сполуку за даним винаходом та ефективну з погляду забезпечення ефекту антидоту кількість антидоту гербіциду. Обробка насіння є особливо застосовною для селективного контролю бур’янів, оскільки вона фізично обмежує забезпечення ефекту антидоту рослинами сільськогосподарських культур. Отже, особливо застосовний варіант здійснення даного винаходу являє собою спосіб здійснення селективного контролю росту небажаної рослинності у сільськогосподарської культури, що включає приведення ділянки із сільськогосподарською культурою в контакт із гербіцидно ефективною кількістю сполуки за даним винаходом, де насінину, з якої вирощується сільськогосподарська культура, обробляють ефективною з погляду забезпечення ефекту антидоту кількістю антидоту. Ефективні з погляду забезпечення ефекту антидоту кількості антидотів можуть бути легко визначені фахівцем у цій галузі техніки шляхом простого експериментування.

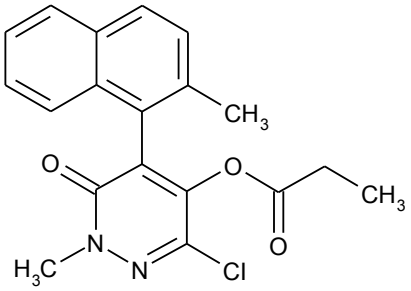
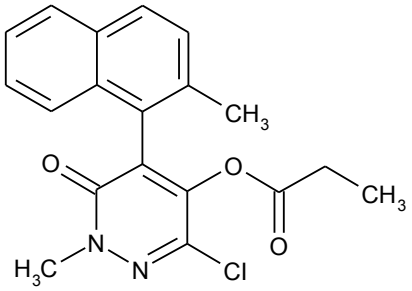
Сполуки за даним винаходом також можна змішувати з (1) полінуклеотидами, включаючи без обмеження ДНК, РНК і/або хімічно модифіковані нуклеотиди, що впливають на кількість конкретної мішені за допомогою регуляції за типом негативного зв'язку, інтерференції, пригнічення або сайленсингу генетично одержуваного транскрипту, що чинить гербіцидний ефект; або (2) полінуклеотидами, включаючи без обмеження ДНК, РНК і/або хімічно модифіковані нуклеотиди, що впливають на кількість конкретної мішені за допомогою регуляції за типом негативного зв'язку, інтерференції, пригнічення або сайленсингу генетично одержуваного транскрипту, що чинить запобіжний ефект.

Наступний тест А демонструє ефективність контролю, що забезпечується ілюстративними сполуками за даним винаходом щодо ілюстративних бур'янів, однак контроль бур'янів, що надається цими сполуками, не обмежений цими видами. Див. таблицю індексів 1 для описів сполук.

Таблиця індексів 1

	
2 (енантіомер 2A) (-) стереоізомер	2 (енантіомер 2B) (+) стереоізомер
	
3 (енантіомер 3A)	3 (енантіомер 3B)
	
4 (енантіомер 4A) (-) стереоізомер	4 (енантіомер 4B) (+) стереоізомер

Таблиця індексів 1 (продовження)

	
5 (енантіомер 5A) (-) стереоізомер	5 (енантіомер 5B) (+) стереоізомер

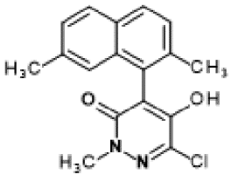
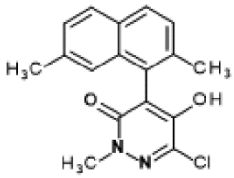
Випробування A

Насіння видів рослин, вибраних із плоскухи звичайної (BYG, Echinochloa crus-galli), кохії віничної (KOC, Kochia scoparia), амброзії полинолистої (звичайної амброзії полинолистої, Ambrosia elatior), пажитниці багатоквіткової (RGI, Lolium multiflorum), мишію Фабера (FTI, Setaria faberii), мишію зеленого (Setaria viridis) та щириці звичайної (PWR, Amaranthus retroflexus), висаджували в суміш глинистого ґрунту та піску й обробляли на передсходовій стадії шляхом прямого розпилення на ґрунт із використанням випробовуваних хімічних сполук, складених у суміші нефітотоксичних розчинників, яка включала поверхнево-активну речовину.

Водночас рослини, вибрані з таких видів бур'янів і також пшениці (WWT, Triticum aestivum), кукурудзи (CPI, Zea mays), лисохвосту польового (BKG, Alopecurus myosuroides) та підмаренника (GAL, підмаренника чіпкого, Galium aparine), висаджували в горщики, що містять ту саму суміш глинистого ґрунту та піску, й обробляли на післясходовій стадії випробуваними хімічними сполуками, складеними подібним чином. Висота рослин становила від 2 до 10 см, та вони були на стадії одного-двох листків для післясходової обробки. Оброблені рослини та необроблені контролі витримували в теплиці протягом приблизно 10 днів, після чого всі оброблені рослини порівнювали з необробленими контролями і візуально оцінювали на наявність пошкоджень. Оцінки відповіді рослин, узагальнені в таблицях 1-4, представлені на основі шкали від 0 до 100, де 0 означає відсутність ефекту, а 100 означає повний контроль. Штрих (-) у відповіді означає відсутність результату тесту. За рейтингами йде буква, що означає симптомологію, де S означає альбінізм, C означає хлороз, G означає пригнічення росту та E означає появу сходів.

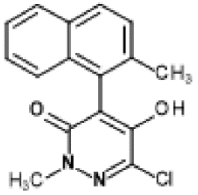
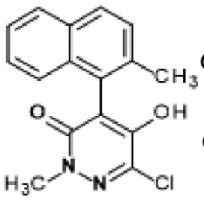
Таблиця 1

Післясходова (POST) та передсходова (PRE) активність енантіомерів, що містять рацемат 2, при внесенні 125 та 31 грам/гектар

	Внесення	Норма г а. і./га	Сільськогосподарські культури		Дводольні бур'яни				Однодольні бур'яни			
			CPI	WWT	GAL	KOC	PWR	RWC	BKG	RGI	BYG	FTI
 **2** ***Енантіомер А***	ПІСЛЯСХОДОВЕ	125	30 G	0	100 C	80 S	100 C	90 S	20 S	40 S	30 C	60 S
		31	10 G	0	100 C	60 S	100 C	90 S	0	30 S	20 C	30 S
	ПЕРЕДСХОДОВЕ	125				80 S	100 C			20 G	50 G	40 S
		31				10 C	100 C			20 G	0	20 S
 **2** ***Енантіомер В***	ПІСЛЯСХОДОВЕ	125	30 G	30 S	90 C	70 S	100 C	100 C	40 S	100 C	90 C	90 S
		31	0	0	100 C	60 S	100 C	100 C	30 C	100 C	80 C	80 S
	ПЕРЕДСХОДОВЕ	125				90 C	100 C			100 S	100 C	100 C
		31				0	100 C			80 S	90 S	100 C

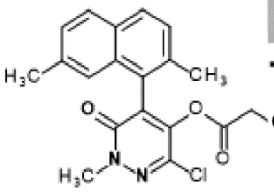
Таблиця 2

Післясходова (POST) та передсходова (PRE) активність енантіомерів, що містять рацемат 3, при внесенні 125 та 31 грам/гектар

	Внесе-ння	Норма г а. і/га	Сільськогосподарські культури			Дводольні бур'яни				Однодольні бур'яни		
			CPI	WWT	GAL	KOC	PWR	RWC	BKG	RGI	BYG	FTI
 **3** ***Енантіомер А***	ПІСЛЯ-СХОДОВЕ	125	10 G	0	100 C	90 S	100 C	100 C	0	40 S	60 S	60 S
		31	0	0	90 C	80 S	90 C	60 C	0	10 S	20 S	20 S
	ПЕРЕД-СХОДОВЕ	125				90 G	100 E	100 E		80 S	50 S	80 S
		31				20 S	90 C	50 S		10 S	10 S	10 S
	ПІСЛЯ-СХОДОВЕ	125	20 G	10 S	100 C	90 S	100 C	100 C	20 S	80 S	50 S	50 S
		31	10 G	0	100 C	60 S	100 C	90 C	10 S	30 G	10 S	20 S
	ПЕРЕД-СХОДОВЕ	125				100 S	100 E	100 E		50 S	50 S	70 S
		31				70 S	100 C	80 S		10 S	20 G	20 S
 **3** ***Енантіомер В***	ПІСЛЯ-СХОДОВЕ	125	20 S	30 S	100 C	90 S	100 C	90 S	20 S	100 S	90 S	90 S
		31	10 C	0	100 C	50 S	100 C	100 C	0	100 S	70 S	70 S
	ПЕРЕД-СХОДОВЕ	125				90 S	100 E	100 E		100 C	90 S	100 C
		31				10 S	90 C	80 S		100 C	80 S	90 S
	ПІСЛЯ-СХОДОВЕ	1000	50 S	90 S	100 C	100 C	100 C	90 S	80 S	100 S	90 S	100 S
		125	10 G	30 S	100 C	90 S	100 C	100 C	20 G	100 S	90 C	90 S
		31	10 G	0	100 C	80 S	100 C	100 C	0	90 S	60 S	90 S
	ПЕРЕД-СХОДОВЕ	1000				100 C	100 C	100 E		100 S	100 C	100 C
		125				80 S	100 E	100 E		90 S	100 C	100 C
		31				10 S	90 C	100 E		40 S	80 S	80 S

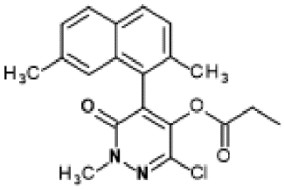
Таблиця 3

Післясходова (POST) та передсходова (PRE) активність енантіомерів, що містять рацемат 4, при внесенні 125 та 31 грам/гектар



4

Енантіомер A



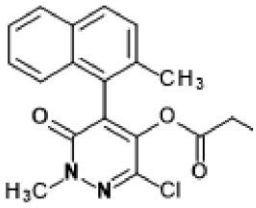
4

Енантіомер B

Внесення	Норма г а.і./га	Сільськогосподарські культури		Дводольні бур'яни				Однодольні бур'яни			
		CPI	WWT	GAL	KOC	PWR	RWC	BKG	RGI	BYG	FTI
ПІСЛЯСХОДОВЕ	125	0	0	100 C	60 S	100 C	90 S	10 C	20 C	30 C	30 S
	31	0	0	80 S	50 S	90 S	80 S	10 C	10 C	0	0
ПЕРЕДСХОДОВЕ	125				50 S	90 C			10 C	0	10 S
	31				10 C	90 C			0	0	0
ПІСЛЯСХОДОВЕ	125	10 S	20 S	100 C	50 S	100 C	100 C	70 S	90 C	90 S	90 S
	31	10 G	0	100 C	50 S	100 C	90 S	20 S	80 C	70 S	80 S
ПЕРЕДСХОДОВЕ	125				70 S	100 C			90 S	100 C	100 C
	31				10 C	100 C			80 S	100 C	100 C

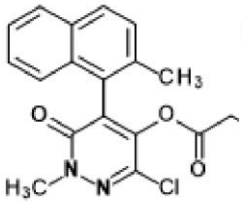
Таблиця 4

Післясходова (POST) та передсходова (PRE) активність енантіомерів, що містять рацемат 5, при внесенні 125 та 31 грам/гектар



5

Енантіомер A



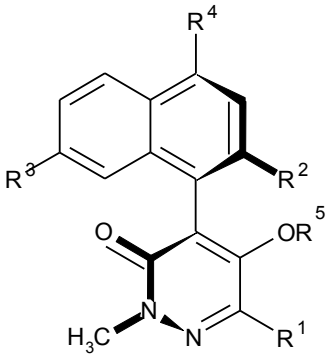
5

Енантіомер B

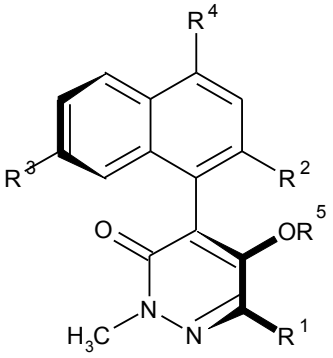
Внесення	Норма г а.і./га	Сільськогосподарські культури		Дводольні бур'яни				Однодольні бур'яни			
		CPI	WWT	GAL	KOC	PWR	RWC	BKG	RGI	BYG	FTI
ПІСЛЯСХОДОВЕ	125	10 S	0	100 S	80 S	90 S	90 S	0	70 C	30 S	20 S
	125	0	0	100 S	70 S	90 S	90 S	30 S	80 S	20 S	30 S
	62	0	0	100 S	80 S	90 S	90 S	0	50 S	0	10 S
	31	0	0	90 S	70 S	90 S	90 S	0	20 G	0	10 S
	31	0	0	90 S	70 S	90 S	90 S	0	20 S	10 S	10 S
	16	0	0	90 S	70 S	80 S	80 S	0	10 S	0	10 C
ПЕРЕДСХОДОВЕ	125				80 S	100 E	100 C		30 S	0	10 C
	125				80 S	100 C	90 C		20 S	10 S	60 S
	62				70 S	90 C	90 C		0	0	0
	31				20 S	60 C	20 S		0	0	0
	31				30 G	100 C	20 C		0	0	10 S
	16				10 C	10 C	0		0	0	0
ПІСЛЯСХОДОВЕ	125	20 S	50 S	100 S	80 S	100 S	100 S	50 S	90 C	80 S	90 S
	125	30 C	50 S	100 S	90 S	100 S	90 S	80 S	100 C	90 S	90 S
	62	0	10 S	100 S	70 S	90 S	90 S	40 S	80 C	40 S	60 S
	31	0	0	90 S	70 S	90 S	90 S	30 G	70 C	30 S	60 S
	31	40 C	20 G	100 S	70 S	90 S	90 S	50 S	80 C	80 S	50 S
	16	0	0	90 S	50 S	90 S	90 S	20 S	40 C	30 S	20 S
ПЕРЕДСХОДОВЕ	125				70 S	100 E	100 C		30 S	80 S	100 C
	125				50 S	100 E	90 C		90 S	80 C	90 S
	62				50 S	60 G	70 S		10 S	0	30 S
	31				60 S	30 G	70 S		0	10 S	20 S
	31				10 C	100 E	50 S		30 S	30 S	80 S
	16				10 C	0	20 S		0	0	0

ФОРМУЛА ВИНАХОДУ

1. Оптично активна сполука, вибрана з атропоізомерів формули 1a та формули 1b:



1a ,



1b ,

де

R^1 являє собою Cl;

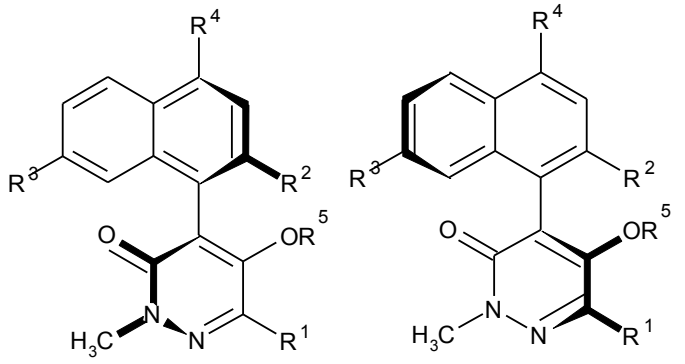
R^2 являє собою CH_3;

R^3 являє собою CH_3 або H;

R^4 являє собою H;
R^5 являє собою H, та
де
атропоізомер формули 1a або 1b має значення обертання із позитивним знаком (+) і є наявним в надлишку відносно його відповідного енантіомера.

2. Сполука за п. 1, яка складається з атропоізомера формули 1a або 1b, який має значення обертання із позитивним знаком (+).

3. Спосіб одержання сполуки формули 1a або 1b:



1a , 1b ,

де
R^1 являє собою Cl;
R^2 являє собою CH_3;
R^3 являє собою CH_3 або H;
R^4 являє собою H;
R^5 являє собою H;
при цьому спосіб включає:

1) завантаження рацемічної суміші сполуки формули 1, що містить атропоізомери формул 1a й 1b, у колонку надкритичної флюїдної хроматографії з хіральним наповнювачем та елюювання за допомогою рухомої фази, яка містить діоксид вуглецю;

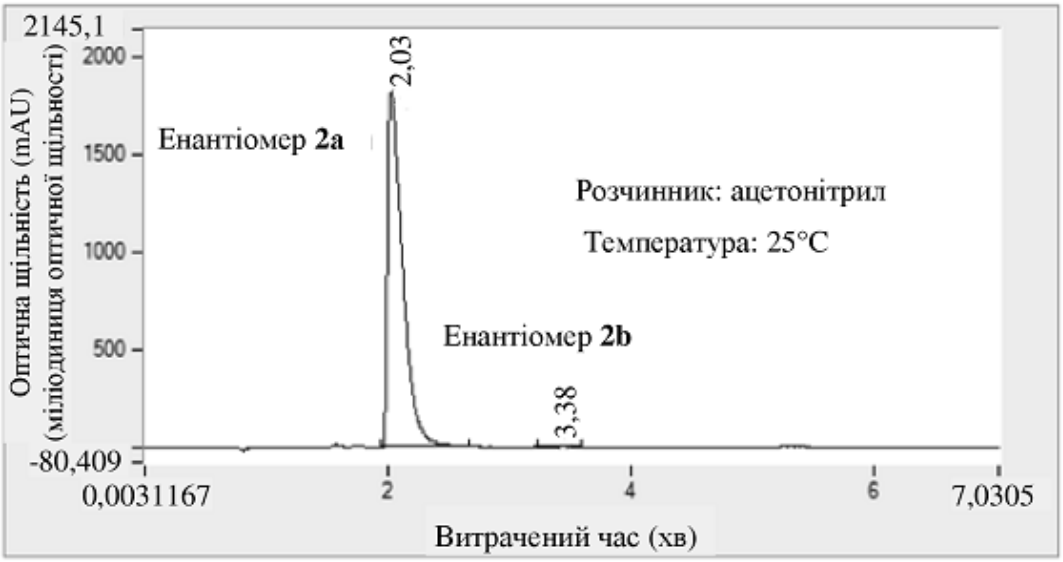
2) виділення двох окремих фракцій із різними значеннями часу утримування, причому однієї, що містить атропоізомер із позитивним знаком обертання площини поляризації світла $[\alpha]_1$ (+), та однієї, що містить атропоізомер із негативним знаком обертання площини поляризації світла $[\alpha]_1$ (-).

4. Гербіцидна композиція, яка містить сполуку за п. 1 або 2 і щонайменше один компонент, вибраний із групи, яка складається з поверхнево-активних речовин, твердих розріджувачів і рідких розріджувачів.

5. Гербіцидна композиція, яка містить сполуку за п. 1 або 2, додатковий активний інгредієнт, вибраний з атразину, азимсульфурону, бефлубутаміду, S-бефлубутаміду, бензізотіазолінону, карфентразон-етилу, хлоримурон-етилу, хлорсульфурон-метилу, кломазону, калієвої солі клопіраліду, клорансулям-метилу, 2-[(2,4-дихлоро-6-оксо-1-циклогексен-1-іл)карбоніл]-2-метил-1,2,4-триазин-3,5-(2H,4H)-діону, флупірсульфурон-метилу, флутіацет-метилу, фомесафену, імазетапіру, ленацилу, мезотріону, метрибузину, метсульфурон-метилу, петооксаміду, піклораму, піроксасульфону, квінклораку, римсульфурону, S-метолахлору, сульфентразону, тифенсульфурон-метилу, трифлусульфурон-метилу та трибенурон-метилу, і компонент, вибраний із групи, яка складається з поверхнево-активних речовин, твердих розріджувачів і рідких розріджувачів.

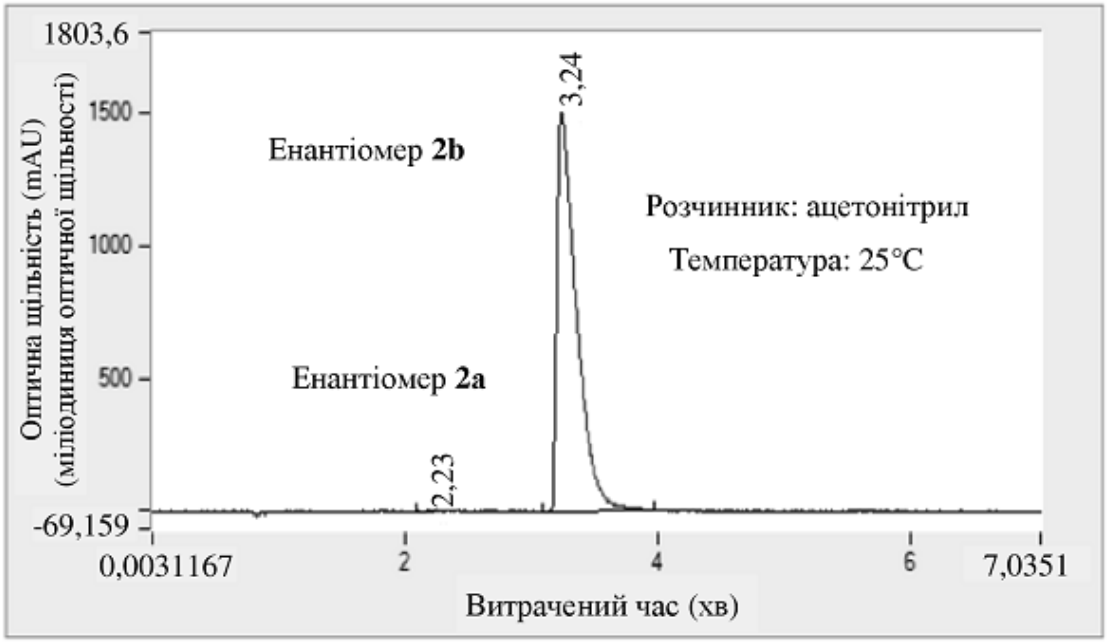
6. Гербіцидна суміш, яка містить (a) сполуку за п. 1 або 2 та (b) додатковий активний інгредієнт, вибраний з атразину, азимсульфурону, бефлубутаміду, S-бефлубутаміду, бензізотіазолінону, карфентразон-етилу, хлоримурон-етилу, хлорсульфурон-метилу, кломазону, калієвої солі клопіраліду, клорансулям-метилу, 2-[(2,4-дихлоро-6-оксо-1-циклогексен-1-іл)карбоніл]-2-метил-1,2,4-триазин-3,5-(2H,4H)-діону, флупірсульфурон-метилу, флутіацет-метилу, фомесафену, імазетапіру, ленацилу, мезотріону, метрибузину, метсульфурон-метилу, петооксаміду, піклораму, піроксасульфону, квінклораку, римсульфурону, S-метолахлору, сульфентразону, тифенсульфурон-метилу, трифлусульфурон-метилу.

7. Спосіб здійснення контролю росту небажаної рослинності, за яким рослинність або її середовища зростання приводять в контакт із гербіцидно ефективною кількістю сполуки за п. 1 або 2.



Аналітична хіральна HPLC SFC хроматограма енантіомеру 2a (2A)

Фіг. 1



Аналітична хіральна HPLC SFC хроматограма 2b (2B)

Фіг. 2

Комп'ютерна верстка А. Крижанівський

ДО "Український національний офіс інтелектуальної власності та інновацій", вул. Дмитра Годзенка, 1, м. Київ – 42, 01601