



УКРАЇНА

(19) UA (11) 45329 (13) C2

(51) 6 A01N43/80, 43/707, 43/70

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ  
І НАУКИ УКРАЇНИДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ  
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ  
ВЛАСНОСТІОПИС  
ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД

(54) СПОСІБ БОРОТЬБИ З РОСТОМ БУР'ЯНІВ, ГЕРБИЦИДНА КОМПОЗИЦІЯ

1

2

(21) 96072763

(22) 06 12 1994

(24) 15 04 2002

(46) 15 04 2002, Бюл. № 4, 2002 р

(86) РСТ/ЕР94/04052, 06 12 1994

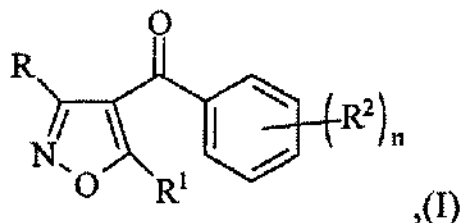
(31) 9325284 9

(32) 10 12 1993

(33) GB

(72) Гамблін Алан, GB, Нішида Такаші, GB, Це-  
заріно Владір, GB, Хеветт Річард Генрі, GB

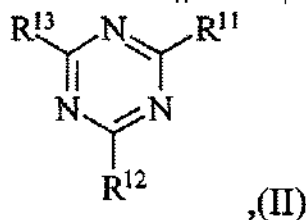
(73) РОН-ПУЛЕНК АГРИКАЛЧЕР ЛТД, GB

(56) EP, A, 0527036, 10 02 1993 EP, A, 0418175,  
20 03 1991 EP, A, 0560482, 15 09 1993(57) 1. Способ борьбы с ростом сорняков в локусе,  
который включает применение к локусу  
(а) производного 4-бензоилизоксазола формулы  
(I)

в которой

R представляет водород или  $-\text{CO}_2\text{R}^3$ , $\text{R}^1$  представляет циклопропил, $\text{R}^2$  выбран из галогена,  $-\text{S}(\text{O})_p\text{Me}$  и (1-6)C-алкила  
или галоидалкила,n выбран из числа два или три, p представляет  
нуль или два, и $\text{R}^3$  представляет (1-4)C-алкил, и

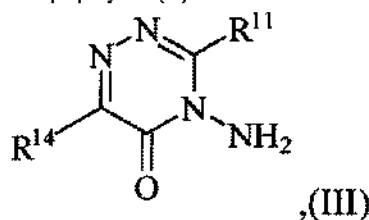
(в) триазинового гербицида

2. Способ по п. 1, в котором триазиновым герби-  
цидом является соединение формулы (II)

в которой

 $\text{R}^{11}$  представляет хлор или алкилтио, или алкокси  
с прямой или разветвленной цепью, имеющий от

одного до шести атомов углерода,

 $\text{R}^{12}$  представляет азидо, моноалкиламино, диал-  
киламино или циклоалкиламино, в котором ал-  
кильный или циклоалкильный фрагменты могут  
быть необязательно замещены одним или более  
заместителями, выбранными из циано и алкокси,  
и $\text{R}^{13}$  представляет N-алкиламино с прямой или  
разветвленной цепью, имеющий от одного до  
шести атомов углерода,  
или формулы (III)в которой  $\text{R}^{11}$  имеет значения, определенные вы-  
ше, и  $\text{R}^{14}$  представляет алкил с прямой или раз-  
ветвленной цепью, имеющий от одного до шести  
атомов углерода3. Способ по п. 2, в котором в формуле (II)  $\text{R}^{12}$   
представляет азидо, N-алкиламино с прямой или  
разветвленной цепью, имеющий от одного до че-  
тырех атомов углерода, в котором алкильный  
фрагмент необязательно замещен циано- или  
метоксигруппой4. Способ по п. 1 или 2, в котором триазиновый  
гербицид выбран из  
симазина, который представляет 6-хлор- $\text{N}^2, \text{N}^2$ -  
диэтил-1,2,3-триазин-2,4-диамин,  
цианазина, который представляет 2-(4-хлор-6-  
этиламино-1,3,5-триазин-2-иламино)-2-  
метилпропионитрил,или атразина, который представляет 6-хлор- $\text{N}^2$ -  
этил- $\text{N}^4$ -изопропил-1,3,5-триазин-2,4-диамин5. Способ по п. 4, в котором триазиновым герби-  
цидом является цианазин или атразин6. Способ по п. 1 или 2, в котором триазиновым  
гербицидом является метрибуцин, который пред-  
ставляет 4-амино-6-трет-бутил-3-метилтио-1,2,4-  
триазин-5(4H)-он7. Способ по любому из предшествующих пунктов,  
в котором в формуле (I) одна из групп  $\text{R}^2$  пред-  
ставляет  $-\text{S}(\text{O})_p\text{Me}$ , и p имеет значения, опреде-  
ленные в п. 1

(13) C2

(11) 45329

(19) UA

- 8 Способ по любому из предшествующих пунктов, в котором в формуле (I)  $n$  представляет три, и группы  $(R^2)_n$  занимают 2, 3 и 4 положения бензоильного кольца, или  $n$  представляет два, и группы  $(R^2)_n$  занимают 2 и 4 положения бензоильного кольца
- 9 Способ по любому из предшествующих пунктов, в котором в формуле (I)  $(R^2)_n$  представляет 2-SO<sub>2</sub>Me-4-CF<sub>3</sub>, 2-CF<sub>3</sub>-4-SO<sub>2</sub>Me, 2-Cl-4-SO<sub>2</sub>Me, 2-SO<sub>2</sub>Me-4-Br, 2-SO<sub>2</sub>Me-4-Cl или 2-SMe-3,4-дихлор
- 10 Способ по любому из предшествующих пунктов, в котором соединением формулы (I) является 5-циклопропил-4-(2-метилсульфонил-4-трифторметил)бензоилизоксазол
- 11 Способ по любому из пп 1-9, в котором соединением формулы (I) является этил-3-[5-циклопропил-4-(3,4-дихлор-2-метилсульфенил)-бензоилизоксазол]карбоксилат
- 12 Способ по любому из предшествующих пунктов, в котором норма расхода 4-бензоилизоксазола составляет 5-500 г на гектар и норма расхода триазинового гербицида составляет от 250 до 5000 г на гектар
- 13 Способ по любому из пп 1-12, в котором норма расхода 4-бензоилизоксазола составляет от 25

- до 150 г на гектар и норма расхода триазинового гербицида - от 500 до 1500 г на гектар
- 14 Способ по любому из предшествующих пунктов, предназначенный для подавления травянистых сорняков в посевах кукурузы
- 15 Способ по любому из предшествующих пунктов, в котором соединения применяются перед появлением всходов сорняков
- 16 Способ по п 6, в котором указанные соединения применяются после появления всходов сорняков
- 17 Гербицидная композиция, включающая (а) 4-бензоилизоксазольное производное формулы (I), определенной в п 1, и (в) триазиновый гербицид, в сочетании с гербицидно приемлемым разбавителем или носителем, и/или поверхностно-активным агентом
- 18 Гербицидная композиция по п 17, в которой соотношение (а) (в) составляет от 2:1 до 1:1000 вес/вес
- 19 Гербицидная композиция по п 17 или 18, в которой соотношение (а) (в) составляет от 1:3,3 до 1:60 вес/вес

Настоящее изобретение относится к новым гербицидным композициям, включающим смесь 1,3,5-триазиновых или 1,2,4-триазиновых гербицидов и производных 4-бензоилизоксазола, и к их использованию в сельском хозяйстве

Указанные выше соединения уже известны в технике как гербициды 1,3,5-триазиновые и 1,2,4-триазиновые гербициды (называемые здесь далее триазиновыми гербицидами) включают аметрин (N<sup>2</sup>-этил-N<sup>4</sup>-изопропил-6-метилтио-1,3,5-триазин-2,4-диамин), атразин (6-хлор-N<sup>2</sup>-этил-N<sup>4</sup>-изопропил-1,3,5-триазин-2,4-диамин), аципротрин (4-азидо-N-изопропил-6-метилтио-1,3,5-триазин-2-иламин), цианазин [2-(4-хлор-6-(этиламино)-1,3,5-триазин-2-иламино)-2-метилпропионитрил], метопротрин [N<sup>2</sup>-изопропил-N<sup>4</sup>-(3-метоксипропил)-6-метилтио-1,3,5-триазин-2,4-диамин], метрибуцин (4-амино-6-трет-бутил-3-метилтио-1,2,4-триазин-5(4H)-он), прометрин [N<sup>2</sup>, N<sup>4</sup>-ди-изопропил-6-метилтио-1,3,5-триазин-3,4-диамин], прометон (N<sup>2</sup>, N<sup>4</sup>-ди-изопропил-6-метокси-1,3,5-триазин-2,4-диамин), пропазин (6-хлор-N<sup>2</sup>, N<sup>4</sup>-ди-изопропил-1,3,5-триазин-2,4-диамин), симетрин (N<sup>2</sup>, N<sup>4</sup>-диэтил-6-метилтио-1,3,5-триазин-2,4-диамин), симазин (6-хлор-N<sup>2</sup>, N<sup>4</sup>-диэтил-1,3,5-триазин-2,4-диамин) тербутилазин (N<sup>2</sup>-трет-бутил-6-хлор-N<sup>4</sup>-этил-1,3,5-триазин-2,4-диамин), тербутрин (N<sup>2</sup>-трет-бутил-N<sup>4</sup>-этил-6-метилтио-1,3,5-триазин-2,4-диамин) и триэтазин (6-хлор-N<sup>2</sup>, N<sup>2</sup>, N<sup>4</sup>-триэтил-1,3,5-триазин-2,4-диамин) и раскрываются, например, в справочнике пестицидов "The Pesticide Manual", 9-е издание (Бритиш Кроп Протекши Каунсил) в качестве селективных гербицидов. Гербицидные 4-бензоилизоксазолы формулы 1, приведенной ниже, описываются в европейских патентных публикациях №№ 0418175, 0487357,

0527036 и 0560482

В результате исследований и экспериментирования было обнаружено, что использование триазинового гербицида в сочетании с некоторыми 4-бензоилизоксазольными производными расширяет спектр гербицидной активности без потери селективности в отношении культур. Следовательно, указанные комбинации или сочетания представляют важный технологический шаг вперед. Термин "комбинация или сочетание", используемый в данном описании, относится к "сочетанию" 4-бензоилизоксазольного гербицида и триазинового гербицида.

К удивлению, в дополнение к сказанному было обнаружено, что объединенная гербицидная активность некоторых 4-бензоилизоксазолов с триазиновыми гербицидами для борьбы с некоторыми видами сорняков, включающих *Bracharia plantaginea*, *Echinochloa crus-galli*, *Bidens pilosa*, *Cassia occidentalis*, *Ipomoea aristolochiaefolia*, *Euphorbia heterophylla*, *Setaria spp*, *Abutilon theophrasti*, *Amaranthus retroflexus*, *Ipomoea purpurea*, *Sida spinosa*, *Xanthium strumarum* и *Digitaria sanguinalis* выше, чем ожидалось, без проявления при этом неприемлемого увеличения фитотоксичности по отношению к культурам, при применении до или после появления всходов (например, в виде до- или после-всходового водного спрея), т.е. гербицидная активность 4-бензоилизоксазола с триазиновым гербицидом показала неожиданную степень синергизма, как это определено по методике Zimpel Z E, P H Schuldt и D Zamont, 1962 1 Proc NEWCC 16, 48-53 с использованием формулы

$$E = X + Y - \frac{X \cdot Y}{100}$$

где E = ожидаемый процент ингибирования роста смесью двух гербицидов A и B при определенных дозах

X = процент ингибирования роста гербицидом A при определенной дозе

Y = процент ингибирования роста гербицидом B при определенной дозе

Когда наблюдаемый процент ингибирования смесью составляет выше, чем ожидаемая величина E, по формуле, приведенной выше, сочетание является синергистическим

Замечательный синергизм некоторых сочетаний в отношении *Brachiana plantaginea*, *Echinochloa crus-galli*, *Bidens pilosa*, *Cassia occidentalis*, *Ipomoea aristolochiaefolia*, *Euphorbia heterophylla*, *Setaria spp*, *Abutilon theophrasti*, *Amaranthus retroflexus*, *Ipomoea purpurea*, *Sida spinosa*, *Xanthium strumarium* и *Digitaria sanguinalis* дает повышенную надежность в борьбе с этими конкурирующими сорняками многих видов культур, что ведет к значительному снижению количества активного ингредиента, требуемого для борьбы с сорняками

Высокий уровень подавления этих сорняков является желательным для предотвращения

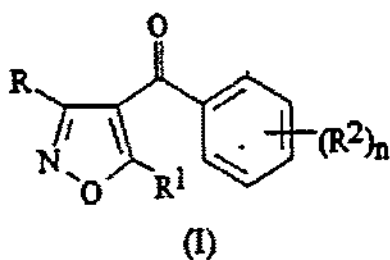
1) потери урожая в результате конкуренции с сорняками и/или трудностей в сборе урожая,

2) загрязнения культур, ведущего к трудностям хранения и очистки и

3) неприемлемого возврата семян сорняков в почву

Соответственно, настоящее изобретение предоставляет способ борьбы с ростом сорняков (т.е. нежелательной растительности) в локусе, который включает применение по отношению к локусу

(a) производного 4-бензоилизоксазола формулы I



в которой

R представляет водород или  $-\text{CO}_2\text{R}^3$ ,

$\text{R}^1$  представляет циклопропил,

$\text{R}^2$  выбран из галогена (предпочтительно хлора или брома), группы  $-\text{S}(\text{O})_p\text{Me}$  и (1-6)C-алкила или галоидалкила (предпочтительно трифторметила),

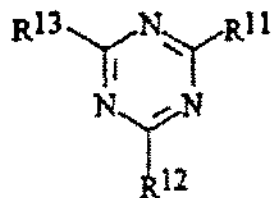
n представляет два или три, p представляет нуль, один или два, и  $\text{R}^3$  представляет (1-4)C-алкил, и

(в) триазинового гербицида

Для данной цели 4-бензоилизоксазол и триазиновый гербицид обычно используются в виде гербицидных композиций (т.е. в сочетании с гер-

бицидно приемлемым разбавителем или носителем и/или поверхностно-активным агентом), например, как описано здесь ниже

Предпочтительно триазиновым гербицидом является соединение формулы II

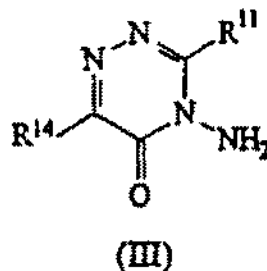


где  $\text{R}^{11}$  представляет хлор или алкилтио или алкокси с прямой или разветвленной цепью, имеющей от 1 до 6 атомов углерода,

$\text{R}^{12}$  представляет азидо, моноалкиламино, диалкиламино или циклоалкиламино, в которых алкильный или циклоалкильный фрагменты могут быть необязательно замещены одним или большим числом заместителей, выбранных из иано и алкокси, и

$\text{R}^{13}$  представляет N-алкиламино с прямой или разветвленной цепью, имеющей от 1 до 6 атомов углерода,

или формулы III



в которой  $\text{R}^{14}$  представляет алкил с прямой или разветвленной цепью, имеющей от 1 до 6 атомов углерода

Более предпочтительно  $\text{R}^{11}$  представляет хлор или метилтио, и  $\text{R}^{13}$  представляет N-алкиламино с прямой или разветвленной цепью, имеющей от 1 до 4 атомов углерода

Композиции, содержащие соединения формулы II, приведенной выше, в которой  $\text{R}^{12}$  представляет азидо, N-алкиламино с прямой или разветвленной цепью, имеющей от 1 до 4 атомов углерода (в котором алкильный фрагмент является необязательно замещенным циано или метоксигруппой) являются предпочтительными

Дополнительными предпочтительными соединениями формулы II являются соединения, в которых  $\text{R}^{13}$  представляет N-(трет-бутил)амино,  $\text{R}^{12}$  представляет N-этиламино, и  $\text{R}^{11}$  представляет хлор или метилтио, которые известны соответственно как тербутилазин и тербутрин

Предпочтительными соединениями формулы II, приведенной выше, являются соединения, в которых  $\text{R}^{11}$  представляет хлор,  $\text{R}^{13}$  представляет N-этиламино, и  $\text{R}^{12}$  представляет N-этиламино, N-(2-метилпропаннитрил)амино или N-

изопропиламино, известные соответственно как симазин, цианазин и атразин, причем наиболее предпочтительными являются цианазин и атразин

Предпочтительным соединением формулы III, приведенной выше, является соединение, в котором R<sup>11</sup> представляет метилтио, R<sup>14</sup> представляет трет-бутил, которое известно как метрибуцин

В формуле 1, приведенной выше, предпочтительно одной из групп R<sup>2</sup> является группа -S(O)<sub>n</sub>Me

В формуле 1, приведенной выше, соединения, в которых n представляет 3, и группы (R<sup>2</sup>)<sub>n</sub> занимают 2, 3 и 4-положения бензоильного кольца, или в которых n представляет 2 и группы (R<sup>2</sup>)<sub>n</sub> занимают 2 и 4-положения бензоильного кольца, являются предпочтительными

В формуле 1, представленной выше, предпочтительно (R<sup>2</sup>)<sub>n</sub> представляет 2-SO<sub>2</sub>Me-4-CF<sub>3</sub>, 2-CF<sub>3</sub>-4-SO<sub>2</sub>Me, 2-Cl-4-SO<sub>2</sub>Me, 2-SO<sub>2</sub>Me-4-Br, 2-SO<sub>2</sub>Me-4-Cl или 2-SMe-3,4-дихлор

Особенно предпочтительные соединения формулы 1 включают следующие

А 5-циклопропил-4-(2-метилсульфонил-4-трифторметил)бензоилизоксазол,

В 5-циклопропил-4-(4-метилсульфонил-2-трифторметил)бензоилизоксазол,

С 4-(2-хлор-4-метилсульфонил)бензоил-5-циклопропилизоксазол,

Д 4-(4-хлор-2-метилсульфонил)бензоил-5-циклопропилизоксазол,

Е 4-(4-бром-2-метилсульфонил)бензоил-5-циклопропилизоксазол,

Ф этил-3-[5-ЦИКлопропил-4-(3,4-дихлор-2-метилсульфенил)бензоилизоксазол]карбоксилат, и

и Е 5-циклопропил-4-(3,4-дихлор-2-метилсульфонил)бензоилизоксазол

Заглавные буквы А - G приписаны данным соединениям для ссылки на них в дальнейшем и для идентификации

Соединения А и F являются особенно предпочтительными

Применяемые количества триазинового гербицида и 4-бензоилизоксазола варьируют в зависимости от присутствующих сорняков и их популяции, от используемой композиции, времени применения, климатических и эдафических условий, и (когда они используются для борьбы с ростом сорняков на площадях произрастания культурных растений) от вида обрабатываемой культуры. Обычно с учетом этих факторов хорошие результаты дают нормы расхода от 5г до 500г 4-бензоилизоксазола и от 250г до 5000г триазинового гербицида на гектар. Однако, следует понимать, что могут использоваться и более высокие и более низкие нормы расхода в зависимости от проблем, встречающихся при подавлении сорняков

Для селективной борьбы с сорняками или подавления сорняков в локусе или на территории, зараженной сорняками, которой является площадь, которая используется, или предполагается к использованию для выращивания культур, особенно подходящими являются нормы расхода от 5г до 500г 4-бензоилизоксазола и от 250г до 5000г

триазинового гербицида на гектар, предпочтительно от 25 до 150г 4-бензоилизоксазола и от 500г до 1500г триазинового гербицида на гектар. При применении на площадях произрастания культур степень применения или норма расхода должна быть достаточной для подавления роста сорняков, не вызывая при этом существенного перманентного повреждения культуры

В соответствии с дальнейшим аспектом настоящего изобретения предоставляется способ борьбы с ростом сорняков в локусе, который включает объединенное использование

(а) 4-бензоилизоксазола формулы 1, определенной выше, и

(в) триазинового гербицида,

с помощью применения до или после появления всходов

Описанное выше объединенное использование может применяться для подавления очень широкого спектра однолетних широколистных сорняков и травянистых сорняков среди культур, таких как, например, кукуруза, посадочных культур, таких как сахарный тростник, без значительного перманентного повреждения культуры. Объединенное использование, описанное выше, дает как активность в отношении листвы, так и остаточную активность, и вследствие этого может применяться на протяжении продолжительного периода развития культур, т.е. начиная от периода до появления всходов сорняков и до всходов культур и до периода, когда сорняки и культуры уже вошли

По способу согласно данному аспекту настоящего изобретения предпочтительным является объединенное использование (а) и (в) для подавления травянистых сорняков в посевах кукурузы

Когда триазиновым гербицидом является аметрин, также предпочтительным является объединенное использование (а) и (в) для борьбы с ростом травянистых сорняков в местах выращивания сахарного тростника

Предпочтительно гербициды применяются до появления всходов сорняков. Когда соединением формулы (1) является соединение F, приведенное выше, предпочтается послевсходовое применение

По способу, описанному, выше, предпочтается объединенное использование (а) и (в) в соотношениях от 2:1 до 1:1000 (а) (в), особенно предпочтительными являются соотношения от 1:3:3 до 1:60 вес/вес

Под термином предвсходовое применение имеется в виду применение к почве, в которой присутствуют семена или сеянцы или проростки сорняков до появления всходов культуры. Термин послевсходовое применение означает применение к воздушным (наземным) или распутившимся частям сорняков, которые появились выше поверхности почвы. Под термином "лиственная активность" имеется в виду гербицидная активность, достигаемая при применении к воздушным или развившимся частям сорняков, которые появились выше поверхности почвы. Под термином "остаточная активность" подразумевается гербицидная активность, достигаемая при применении к почве,

в которой присутствуют семена или проростки сорняков перед появлением сорняков выше поверхности почвы, благодаря которой сеянцы, присутствующие во время применения, или которые прорастают из семян после применения, подавляются

В соответствии с обычной практикой смесь в емкости (чановая смесь) может приготавливаться перед использованием путем объединения отдельных препаративных форм индивидуальных гербицидных компонентов

Следующие ниже неограничивающие эксперименты иллюстрируют настоящее изобретение

Общая процедура экспериментов

Эксперимент А

Эксперименты осуществлялись до появления всходов видов сорняков на исследовательской ферме или в питомнике в Бразилии. Соединение А (приготовленное в виде препаративной формы – смачиваемого порошка) и атразин взвешивались и растворялись в воде, давая раствор, содержащий соответствующие концентрации и соотношения

активных ингредиентов

Раствор смешивался в течение 1 часа и применялся при объеме опрыска 231литр/гектар по отношению к опытному участку размером 3 на 5 метров, включающему сорняки, которые были посеяны двумя днями раньше. Опыт выполнялся в 3 повторениях. Контрольная делянка опрыскивалась раствором, не содержащим испытываемое соединение. Визуальная оценка фитотоксичности производилась через 36 дней после посева каждого вида сорняков на основе сравнения с контрольной делянкой

Таблицы, приведенные ниже, показывают наблюдаемый процент подавления сорняков при каждом сочетании, при этом цифры в скобках представляют ожидаемую величину при использовании формулы Лимпел

Пример А1

Опыты, показывающие характер синергистического биологического действия или эффекта сочетания *Bracharia plantaginea*

Соединение А				
	г (акт инг) /га	0	75	100
Атразин	0	-	77	87
	1250	10	95(79)	95(88)

Пример А2

Опыт, демонстрирующий характер синерги-

стического биологического действия сочетания на *Echinochloa crus-galli*

Соединение А				
	г (а и) /га	0	75	100
Атразин	0	-	77	88
	1250	27	95(83)	97(91)

Пример А3

Опыт, демонстрирующий характер синерги-

стического биологического действия сочетания на *Bidens pilosa*

Соединение А				
	г(а и) /га	0	75	100
Атразин	0	-	35	67
	1250	70	87(81)	95(90)

Пример А4

Опыт, демонстрирующий характер синерги-

стического биологического действия сочетания на *Cassia occidentalis*

Соединение А				
Атразин	г(а и) /га	0	75	100
	0	-	5	37
	1250	25	77(29)	85(53)

Пример А5

Опыт, демонстрирующий характер синерги-

стического биологического действия сочетания на *Ipomoea aristolochiaefolia*

Соединение А				
	г(а и) /га	0	75	100
Атразин	0	-	5	33
	1250	52	88(54)	96(68)

Пример А6

Опыт, демонстрирующий характер синерги-

стического биологического действия сочетания на *Euphorbia heterophylla*

Соединение А				
	г(а и )/га	0	75	100
Атразин	0	-	5	27
	1250	23	82(27)	87(44)

#### Эксперимент В

Эти эксперименты осуществлялись до появления всходов сорняков в исследовательском питомнике в штате Вашингтон, США Соединение В (приготовленное в форме смачиваемого порошка) и атразин (приготовленный в виде препаративной формы суспензионного концентрата) отвешивались и растворялись в воде, давая раствор, содержащий соответствующие концентрации и соотношения активных ингредиентов. Раствор смешивался в течение одного часа и применялся при объеме спрея 231 литр/гектар на опытной делянке 3 м × 5 м, включающей сорняки, которые были высеяны двумя днями ранее. Выполнялось 3 повторения. Контрольная делянка

опрыскивалась раствором, не содержащим испытываемое соединение. Через 42 дня после посева каждого из видов сорняков производилась визуальная оценка фитотоксичности на основе сравнения с контрольной делянкой.

Таблицы, приведенные ниже, показывают наблюдаемый процент подавления сорняков с помощью каждого сочетания, причем, цифры в скобках представляют ожидаемую величину с использованием формулы Лимпел.

#### Пример В1

Испытание, демонстрирующее характер синергистического биологического действия сочетания на *Setaria faberi*.

Соединение В			
	г(а и )/га	0	50
Атразин	0	-	68
	1000	87	100(96)

Со ссылкой на формулу, данную в начале описания, приведенные выше результаты ярко демонстрируют превосходную и неожиданную степень синергизма, полученного в случае сочетания согласно изобретению.

Очевидно понятно, что результаты, представленные выше, все были получены в полевых опытах. Такие опыты, в общем, представляют более точное испытание гербицидных свойств, чем испытания в теплице, где испытываемые растения защищены от изменчивых условий, которым они неизбежно подвержены в открытом поле. Вследствие изменчивости условий в полевых испытаниях обычно более трудно гарантировать четкую демонстрацию синергизма, чем в тепличном испытании. Тем не менее, гербицидные смеси, которые демонстрируют синергизм в испытаниях в теплице, должны, если они предназначены для того, чтобы быть промышленно полезными, быть способными демонстрировать синергизм в полевых испытаниях, т.е. в условиях, которые обычно преобладают, когда они используются фермерами. Результаты, полученные в приведенных выше примерах, следовательно, представляют особенно яркую демонстрацию синергизма в практических условиях.

#### Эксперимент С

Следующие ниже эксперименты осуществлялись с использованием соединения А в смесях с различными триазиновыми гербицидами (атразином и цианазином). Семена различных видов широколистных или травянистых сорняков высевались в нестерилизованную суглинистую почву в пластиковых цветочных горшках размером 7 × 7 см. Горшки увлажнялись водой и оставлялись подсушиться. Поверхность почвы затем опрыскивалась меняющимися концентрациями или индивидуального гербицида или смесей двух гербицидов (соединение А и атразин в виде технического

материала, цианазин в виде промышленно доступного препарата "Фортрол", (торговая марка), который представляет суспензионный концентрат) в различных соотношениях, растворенных в 50/50 по объему растворе ацетона и воды, с использованием трекового опрыскивателя, установленного для выпуска эквивалента 290 л/га. Гербициды использовались в виде не преобразованных в готовые препаративные формы технических материалов.

Обработанные горшки помещались беспорядочно в блоки с четырьмя повторениями на обработку для каждого вида растений.

Горшки содержались в теплице, находясь на увлажняемых капиллярных подстилках, при освещении и с поливом сверху ежедневно два раза в день.

Через две недели после обработки оценивался процент снижения роста растений по сравнению с необработанным контролем.

Средняя величина в процентах уменьшения роста растений вычислялась для каждой обработки. Зависимость доза/средняя величина ответа наносилась на график на бумаге для вычерчивания графиков Лог концентрация/вероятность, и линии проводились на глаз. Для гербицидных смесей линия доза/ответ для первого гербицида вычерчивалась для каждой дозы второго гербицида, а линия доза/ответ для второго гербицида вычерчивалась для каждой дозы первого гербицида. Дозы, дающие 90% уменьшение роста растений (величины ЛД90) читались по этим линиям и наносились на график, осями которого были дозы двух гербицидов. Линия, соединяющая эти точки, является изоболой, т.е. линией, соединяющей точки (смеси) равной активности, как описано автором P.M.L. Tammer, Neth. J. Plant Path. 70 (1964) 73-80. Вычерчивалась также линия, соединяющая величины ЛД90 индивидуальных компо-

нентов смеси Данная линия представляет теоретическую изоболу, если действие двух компонентов (т.е. эффект) является дополнительным, т.е. нет взаимодействия между ними. Изоболы, находящиеся ниже данной линии, указывают на синергизм между компонентами, в то время как линии, лежащие выше ее, указывают на антагонизм.

В таблицах, которые следует ниже, "доза"

представляет дозу в граммах на гектар используемого активного ингредиента, а цифровые значения подавления сорняков представляют процент уменьшения роста по сравнению с необработанными контрольными опытами.

Пример С1

Предвсходовая обработка *Abutilon theophrasti* различными смесями соединения А и атразина

Атразин								
	Доза г/га	0	31 25	62 5	125	250	500	1000
Соед А	0	-	25	51 25	75	87 5	93 75	100
	1	40	45	95	100	87 5	100	100
	2	46 25	62 5	77 5	75	97 5	100	100
	4	20	66 25	75	90	87 5	100	100
	8	75	68 75	62 5	81 25	93 75	100	100
	16	91 25	97 5	100	100	100	93 75	100
	32	88 75	100	97 5	100	80	100	100
	64	98 75	100	100	93 75	98 75	100	100
	128	100	100	100	93 75	100	100	91 25
	256	97 5	100	100	100	100	100	97 5

Пример С2

Предвсходовая обработка *Amaranthus*

*retroflexus* различными смесями соединения А и атразина

Атразин								
	Доза г/га	0	31 25	62 5	125	250	500	1000
Соед А	0	-	67 5	32 5	82 5	100	75	87 5
	1	42 5	57 5	95	93 75	100	97 5	100
	2	22 5	43 75	95	93 75	93 75	100	100
	4	60	72 5	95	98 75	100	87 5	95
	8	75	93 75	100	100	100	100	100
	16	75	100	97 5	100	100	96 25	100
	32	100	95	100	100	100	95	97 5
	64	100	100	98 75	100	100	100	100
	128	100	100	95	100	100	100	100
	256	98 75	100	100	100	100	100	100

Пример С3

Предвсходовая обработка *Echinochloa crus-*

*galli* различными смесями соединения А и атразина

Атразин									
	Доза г/га	0	31 25	62 5	125	250	500	1000	2000
Соед А	0	-	5	15	50	61 25	86 25	88 75	97 5
	1	0	10	41 25	30	48 75	83 75	90	95
	2	5	2 5	42 5	40	62 5	86 25	91 25	96 25
	4	0	15	40	78 75	86 25	92 25	98 75	97 5
	8	10	52 5	55	84 75	92 5	97 5	97 5	100
	16	51 25	73 75	62 5	88 75	89 75	97 5	96 67	97 5
	32	86 25	92 5	92 5	96 25	96 25	96 25	96 25	97 5
	64	95	98 75	95	96	97 5	96 25	97 25	100
	128	95	95	95	95	95	96 25	95	95
	256	95	95	95	95	97 5	95	97 5	95

Пример 4С

Предвсходовая обработка *Ipomoea purpurea*

различными смесями соединения А и атразина

Атразин									
	Доза г/га	0	31 25	62 5	125	250	500	1000	2000
Соед А	0	-	65	67 5	86 25	92 5	93 75	97 5	100
	1	28 75	26 25	85	98 5	96 25	95	82 5	97 5
	2	47 5	41 25	68 75	95	100	98 75	100	100
	4	37 5	80	92 5	88 75	98 75	92 5	97 5	100
	8	47 5	30	86 25	97 5	100	97 5	100	100

	15	45329					16		
	16	37 5	71 25	83 75	91 25	97 5	95	85	95
	32	53 75	90	95	95	97 5	100	100	92 5
	64	67 5	78 75	96 67	97 5	97 5	99 75	93 75	100
	128	70	95	100	100	100	100	95	98 75
	256	91 25	98 75	96 25	100	97 5	97 5	100	100

Пример С5

личными смесями соединения А и атразина

Предвсходовая обработка *Setaria viridis* раз-

		Атразин							
	Доза г/га	0	31 25	62 5	125	250	500	1000	2000
Соед А	0	-	6 25	10	17 5	56 25	56 25	62 5	77 5
	1	7 5	0	10	0	62 5	80	72 5	97 5
	2	5	12 5	18 75	0	12 5	62 5	85	73 75
	4	25	25	15	0	28 75	30	68 75	95
	8	60	25	47 5	43 75	45	83 75	91 25	100
	16	68 75	36 25	61 25	60	73 75	95	100	97 5
	32	85	77 5	81 25	76 25	92 5	96 25	96 25	96 25
	64	97 5	65	80	100	73 75	93 75	100	99 75
	128	86 25	97 5	85	98 75	100	100	100	100
	256	98 75	100	95	98 75	98 75	98 75	98 75	100

Пример С6

gall различными смесями соединения А и циана-  
зина

Предвсходовая обработка *Echinochloa crus-*

		Цианазин							
	Доза г/га	0	31 25	62 5	125	250	500	1000	2000
Соед А	0	-	12 25	7 5	0	62 5	63 75	90	94 75
	1	13 75	2 5	10	7 5	52 5	92 5	98 5	97 5
	2	20	13 75	2 5	17 5	48 75	92 25	97 5	95
	4	22 5	5	25	55	63 75	97 25	96 25	100
	8	37 5	53,75	52 5	63 75	86 25	99 75	98 75	98 5
	16	73 75	70	77 5	88 75	90	99 75	100	99 75
	32	91 25	91 25	91 25	98 75	94 75	99 75	99 75	100
	64	98 5	100	100	96	100	99 5	99 75	99 5
	128	100	99 75	98	98 25	100	99 75	99 5	98 25
	256	99,25	98 25	99 75	98 25	99 5	99	98 25	99 25

Пример С7

retroflexus различными смесями соединения А и  
цианазина

Предвсходовая обработка *Amaranthus*

		Цианазин							
	Доза г/га	0	31 25	62 5	125	250	500	1000	
Соед А	0	-	42 5	71 25	45	80	96 25	93 75	
	1	57 5	50	67 5	83 75	95	91 25	98 75	
	2	62 5	87 5	50	89 75	95	93 75	98 75	
	4	55	90	87 5	97 5	97 5	95	99 75	
	8	87 5	82 5	96 25	96 25	100	97 5	98 75	
	16	91 25	90	99 5	97 5	99 75	100	98 75	
	32	98 75	100	100	100	98 75	100	100	
	64	97 5	100	100	100	98 75	99 75	98 75	
	128	97 5	97 5	100	100	100	100	100	
	256	100	100	100	98 75	100	100	98 75	
	512	100	98 75	100	100	98 75	100	100	

Пример С8

различными смесями соединения А и цианазина

Предвсходовая обработка *Ipomoea purpurea*

		Цианазин							
	Доза г/га	0	31 25	62 5	125	250	500	1000	
Соед А	0	-	0	0	3 75	78 75	98 75	100	
	1	6 25	2 5	2 5	37 5	82 5	80	100	
	2	6 25	17 5	7 5	47 5	47 5	98 75	100	



	4	2 5	45	5	58 75	65	100	100
	8	6 25	36 25	28 75	52 5	72 5	98 5	99 75
	16	26 25	58 75	57 5	86 25	85	93 75	100
	32	25	52 5	70	96 25	87 5	97 5	96 25
	64	75	75	88 75	95	100	98 25	100
	128	77 5	78 75	91 25	96 25	100	98 75	100
	256	68 75	90	91 25	97 5	97 25	98 75	100
	512	96 25	92 5	92 5	97 5	100	100	100

#### Краткое описание рисунков

Фигура I представляет изоболу ЛД90, графически вычисленную по наблюдаемым величинам ("") и соответствующему графику ожидаемых дополнительных величин (прерывистая линия) для ряда смесей соединения А с атразином против вида сорняка *Absetlon theophrasti*, полученную по результатам, показанным в Таблице С1,

Фигура II представляет изоболу ЛД90, вычисленную графически по наблюдаемым величинам ("") и соответствующему графику ожидаемых дополнительных величин (прерывистая линия) для ряда смесей соединения А с атразином против вида сорняка *Amaranthus retroflexus*, полученную по результатам, показанным в Таблице С2,

Фигура III представляет изоболу ЛД90, вычисленную графически по наблюдаемым величинам ("") и соответствующему графику ожидаемых дополнительных величин (прерывистая линия) для ряда смесей соединения А с атразином против вида сорняка *Echinochloa crus-galli*, полученную по результатам, показанным в Таблице С3,

Фигура IV представляет изоболу ЛД90, графически вычисленную по наблюдаемым величинам ("") и соответствующему графику ожидаемых дополнительных величин (прерывистая линия) для ряда смесей соединения А с атразином против вида сорняка *Ipomoea purpurea*, полученную по результатам, показанным в Таблице С4,

Фигура V представляет изоболу ЛД90, графически вычисленную по наблюдаемым значениям ("") и соответствующему графику ожидаемых дополнительных величин (прерывистая линия) для ряда смесей соединения А с атразином против вида сорняка *Setaria viridis*, полученную по результатам, показанным в Таблице С5,

Фигура VI представляет изоболу ЛД90, графически вычисленную по наблюдаемым величинам ("") и соответствующему графику ожидаемых дополнительных величин (прерывистая линия) для ряда смесей соединения А с цианозином против вида сорняка *Echinochloa crus-galli*, полученную по результатам, показанным в Таблице С6,

Фигура VII представляет изоболу ЛД90, графически вычисленную на основании наблюдаемых величин ("") и соответствующего графика ожидаемых дополнительных величин (прерывистая линия) для ряда смесей соединения А с цианозином против вида сорняка *Amaranthus retroflexus*, полученную на основании результатов, показанных в Таблице С7,

Фигура VIII представляет изоболу ЛД90, графически вычисленную по наблюдаемым величинам ("") и соответствующему графику ожидаемых дополнительных величин (прерывистая линия) для ряда смесей соединения А с цианозином против вида сорняка *Ipomoea purpurea*, полученную

на основании результатов, показанных в Таблице С8

Изоболы, полученные на основе данных в примерах Д1-Д8, показанные здесь далее на фигурах I - VIII соответственно, представляли четко кривые типа III (Tammes) цитируемая работа, страница 75, Фиг. 2) характерную для синергизма

#### Эксперимент Д

Следующие эксперименты проводились для того, чтобы продемонстрировать послевсходовые свойства смесей, включающих соединение F (в виде 50% смачиваемого порошка) и метрибуцина (в виде 70% диспергируемых в воде гранул, с использованием промышленно доступной (имеющейся в продаже) препаративной формы "Сенкор", торговая марка) Два гербицида приготавливались в виде раствора, содержащего 0.1% Аграла (торговая марка) и применялись после появления всходов как по одному, так и в сочетании при ряде концентраций по отношению к травянистым и широколистным сорнякам видов сорняков, перечисленных ниже Опрыскиватель (Модель SS 8003E) и используемое давление (46фунт /кв дюйм (3,234кг/кв см)) давали объем спрея эквивалентный 290литров/га Все растения выращивались в нестерильной суглинистой почве и обрабатывались на следующих стадиях роста Широколистные сорняки

1 лист  
1-2 листа  
2+1 лист

Травянистые сорняки

3 листа  
3 листа

Обработанные растения содержались на влажной капиллярной подстилке при освещении в теплице Они поливались сверху один раз через 24 часа после обработки, и после этого орошались снизу три раза в день Эффекты обработки оценивались визуально через 14 дней после обработки Процент повреждения по сравнению с необработанными контрольными растениями регистрировался для каждого вида

Таблицы, приведенные ниже, показывают наблюдаемый процент подавления видов сорняков с помощью каждого сочетания, причем, цифры в скобках представляют ожидаемую величину с использованием формулы Лимпел

#### Результаты

##### Пример Д1

Послевсходовая обработка *Ipomoea purpurea* различными смесями соединения F и метрибуцина

Метрибуцин					
СоедF	Доза г/га	0	32	63	125

	0	-	0	0	20
	8	10	40(10)	60(10)	60(28)
	16	20	50(20)	50(20)	70(36)
	32	40	60(40)	65(40)	70(52)
	63	40	60(40)	70(40)	75(52)

## Пример Д2

Послевсходовая обработка *Sida spinosa* различными смесями соединения F и метрибуцина

## Метрибуцин

	Доза г/га	0	16	32
	0	-	20	30
Соед F	8	0	30(20)	70(30)
	16	40	70(52)	85(58)

## Пример Д3

Послевсходовая обработка *Xanthium strumarium* различными смесями соединения F и метрибуцина

## Метрибуцин

	Доза г/га	0	16	32	63	125
	0	-	10	20	40	60
Соед F	8	10	30 (19)	60 (28)	65 (46)	100 (64)

## Пример Д4

Послевсходовая обработка *Digitaria sanguinalis* различными смесями соединения F и метрибуцина

## Метрибуцин

	Доза г/га	0	16	32
	0	-	0	10
Соед F	8	10	20(10)	60(19)
	16	30	60(30)	70(37)

## Пример Д5

Послевсходовая обработка *Setaria viridis* различными смесями соединения F и метрибуцина

## Метрибуцин

	Доза г/га	0	16	32
	0	-	0	20
Соед F	8	0	40	60(20)
	16	30	60(30)	70(44)
	32	30	70(30)	80(44)
	63	45	70(45)	80(56)

Согласно дополнительному аспекту или признаку настоящего изобретения предоставляются гербицидные композиции, включающие

(а) 4-Бензоилизоксазольное производное формулы 1, описанной и определенной выше, и

(в) триазиновый гербицид, в сочетании с, и предпочтительно гомогенно диспергированные в указанных, гербицидно приемлемым разбавителем или носителем и/или поверхностно-активным агентом

Термин "гербицидная композиция" используется в широком смысле для того, чтобы включить не только композиции, которые готовы к употреблению в качестве гербицидов, но также и концентраты, которые должны разбавляться перед ис-

пользованием Предпочтительно композиции содержат от 0,05 до 90% по весу 4-бензоилизоксазола и триазинового гербицида

Если не указано иное, проценты и соотношения, приводимые в данном описании выражены по весу

Обычно используется композиция, в которой соотношение (а) (в) составляет от 2:1 до 1:1000 вес/вес, причем, особенно предпочтительными являются соотношения (а) (в) от 1:3,3 до 1:60 вес/вес

Гербицидная композиция может содержать твердые или жидкие носители и поверхностно-активные агенты (например, смачиватели, диспергирующие или эмульгирующие агенты по одному или в сочетании) Поверхностно-активные агенты, которые могут присутствовать в гербицидных композициях настоящего изобретения, могут быть веществами ионного или неионного типа, например, ими могут быть сульфорициноаты, четвертичные аммониевые производные, продукты на основе конденсатов окиси этилена с нонил- или октил-фенолами, или сложные эфиры карбоновых кислот ангидросорбитолов, которые становятся растворимыми под действием простой этерификации свободных гидроксильных групп при конденсации с окисью этилена, соли щелочных и щелочно-земельных металлов и сложных эфиров серной кислоты и сульфоновых кислот, такие как динонил- и диоктил-натриевые сульфосукцинаты, и соли щелочных и щелочно-земельных металлов и высоко-молекулярных производных сульфоновой кислоты, такие как натрий- и кальций-лигносульфонаты Примерами подходящих твердых разбавителей или носителей являются силикат алюминия, тальк, кальцинированная окись магния, кизельгур, трикальцийфосфат, порошкообразная пробка, абсорбентная угольная сажа и глины, такие как каолин и бентонит Примеры подходящих жидких разбавителей включают воду, ацетофенон, циклогексанон, изофорон, толуол, ксилол и минеральные, животные и растительные масла (эти разбавители могут использоваться по одному или в сочетании)

Гербицидные композиции согласно настоящему изобретению могут также содержать, если необходимо или желательно, общепринятые вспомогательные агенты или адъюванты, такие как адгезивы, защитные коллоиды, загустители, агенты проникновения, структуро-образующие агенты, стабилизаторы, агенты, препятствующие спеканию или слеживанию, окрашивающие агенты и ингибиторы коррозии Эти адъюванты могут также служить в качестве носителей или разбавителей

Смачивающие порошки (или порошки для опрыскивания) обычно содержат от 20 до 95% 4-бензоилизоксазола и триазинового гербицида, и они обычно содержат в дополнение к твердому носителю от 0 до 5% смачивающего агента, от 3 до 10% диспергирующего агента и, если необходимо, от 0 до 10% одного или более стабилизаторов и/или других добавок, таких как агенты проникновения или пенетрации, адгезивы, или противоспекающие агенты и красящие вещества

Водные суспензионные концентраты, которые

могут применяться при опрыскивании, приготавливаются таким образом, чтобы получался стабильный жидкий текучий продукт (с помощью тонкого размалывания), который не оседает или не выпадает в осадок, и они обычно содержат от 10 до 75% 4-бензоилизоксазола и триазинового гербицида, от 0,5 до 15% поверхностно-активных агентов, от 0,1 до 10% тиксотропных агентов, от 0 до 10% подходящих добавок, таких как пеногасители или агенты, препятствующие пенообразованию, ингибиторы коррозии, стабилизаторы и воду или органическую жидкость, в которой активное вещество является умеренно растворимым или нерастворимым. Некоторые органические твердые вещества или неорганические соли могут растворяться для того, чтобы способствовать предотвращению седиментации, или в качестве антифриза для воды.

Предпочтительными гербицидными композициями согласно настоящему изобретению являются смачивающие порошки и вододиспергируемые гранулы.

Гербицидные композиции согласно настоящему изобретению могут также включать 4-бензоилизоксазол и триазиновый гербицид в сочетании с одним или более других пестицидно-активных соединений, и предпочтительно гомогенно диспергированы в них, и, если желательно, с одним или более совместимых с ними пестицидно-приемлемых разбавителей и носителей. Предпочтительные гербицидные композиции согласно настоящему изобретению представляют композиции, которые включают 4-бензоилизоксазол и триазиновый гербицид в сочетании с другими гербицидами.

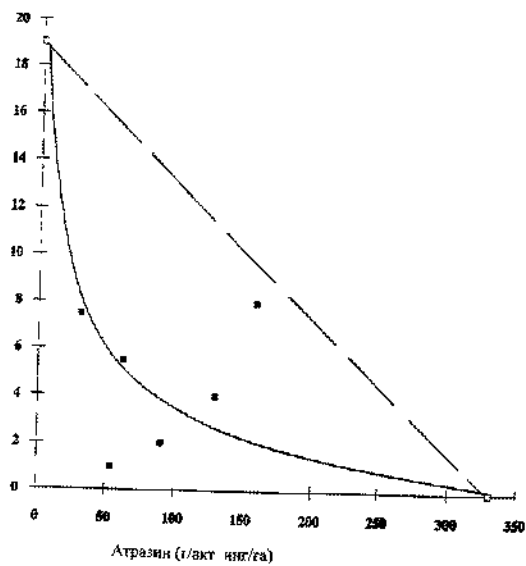
Композиции изобретения могут изготавливаться в виде производственного изделия, включающего 4-бензоилизоксазол и триазиновый гербицид и необязательно другие пестицидно-активные соединения, как описаны здесь выше, и, предпочтительно, гербицидная композиция описанная здесь выше, и предпочтительно гербицидный концентрат, который должен разбавляться перед употреблением, включающий 4-бензоилизоксазол и триазиновый гербицид, находясь внутри контейнера для указанных 4-бензоилизоксазола и триазинового гербицида, или для указанной гербицидной композиции, и к указанному выше контейнеру приложены инструкции, предписывающие способ, которым указанный 4-бензоилизоксазол и триазин или гербицидная

композиция, содержащаяся в нем, должны использоваться для подавления роста сорняков. Контейнеры обычно бывают типов, обычно используемых для хранения химических веществ и концентрированных гербицидных композиций, которые являются твердыми или жидкими при нормальных температурах окружающей среды, например, в виде консервных банок и емкостей из пластиковых материалов или металла (которые могут быть внутри покрыты лаком), бутылок из стекла и пластиковых материалов, и, когда содержимое контейнера является твердым, например, как гербицидные композиции в виде гранул, контейнерами могут быть ящики, например, из картона, пластических материалов, металла, или мешки. Контейнеры обычно имеют достаточную емкость для того, чтобы содержать количество активных ингредиентов или гербицидных композиций, достаточное для обработки, по крайней мере, одного гектара земли, для подавления роста сорняков в ней, но не превышают размер, который удобен для общепринятых способов обращения с ними. Инструкции, связанные физически с контейнером, например, печатаются непосредственно на контейнере или на этикетке или ярлыке, прикрепленных к нему. Руководства обычно указывают, что содержимое контейнера, после разбавления, если оно необходимо, предназначено для применения для подавления роста сорняков при нормах расхода от 5 до 500 г 4-бензоилизоксазола и от 250 г до 500 г триазинового гербицида на гектар по способу и для цели, описанных здесь выше.

Согласно следующему признаку настоящего изобретения предоставляется продукт, включающий (а) 4-бензоилизоксазол формулы 1, приведенной выше, и (в) триазиновый гербицид, в виде объединенного препарата для одновременно раздельного или последовательного использования при подавлении роста сорняков в локусе.

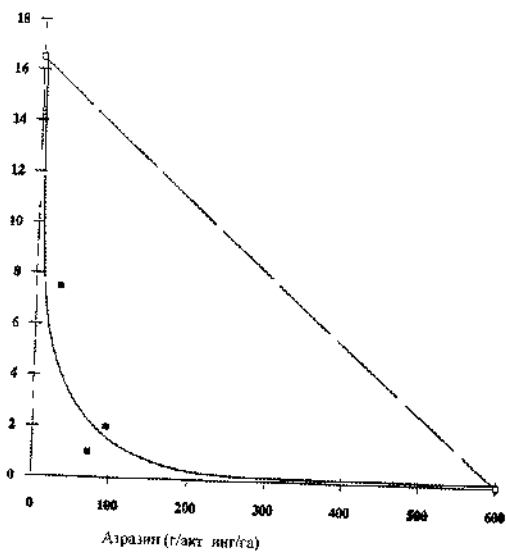
Хотя данное изобретение описано здесь в виде разнообразных предпочтительных воплощений, специалист в данной области понимает, что могут производиться различные модификации, замены, что-то может опускаться, что-то изменяться, без отклонения от сути изобретения. Соответственно, имеется в виду, что объем настоящего изобретения ограничивается только объемом следующих далее пунктов формулы изобретения, включая и эквивалентные признаки.

Соединение А (акт инг/га)



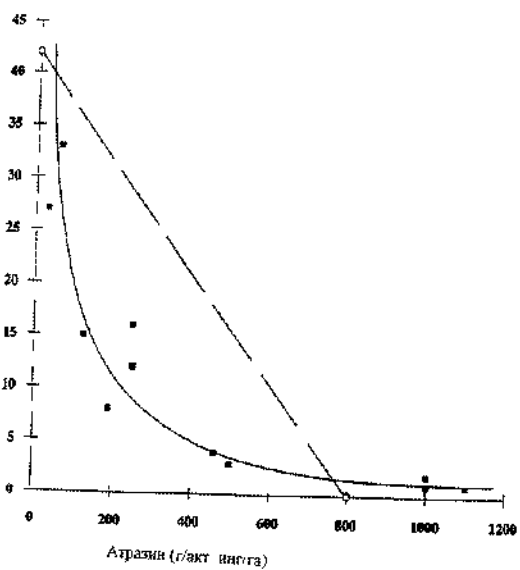
Фиг. 1

Соединение А (акт инг/га)



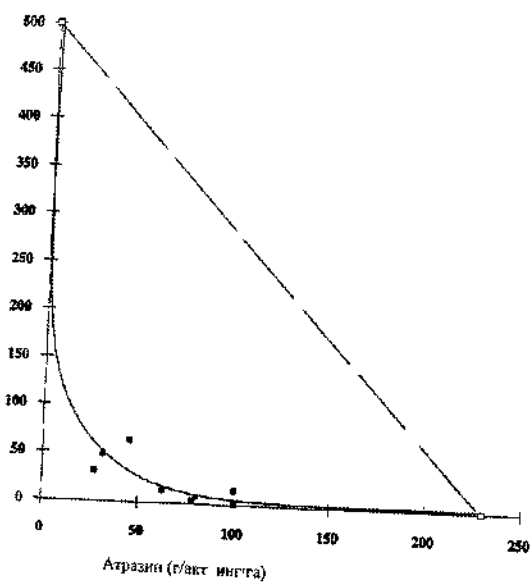
Фиг. 2

Соединение А (акт инг/га)



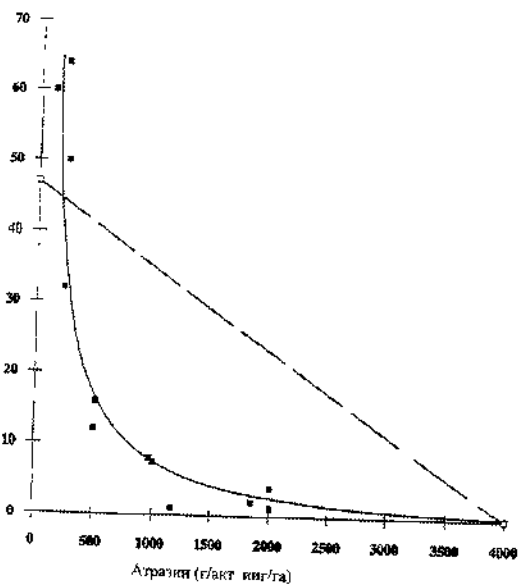
Фиг. 3

Соединение А (акт инг/га)



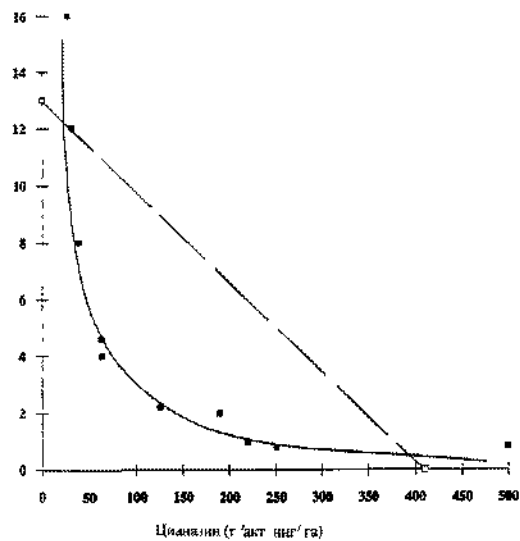
Фиг. 4

Соединение А (акт инт/га)



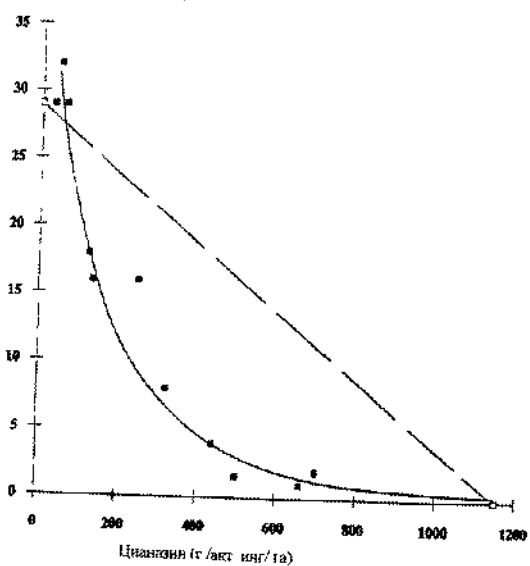
Фиг. 5

Соединение А (акт инт/га)



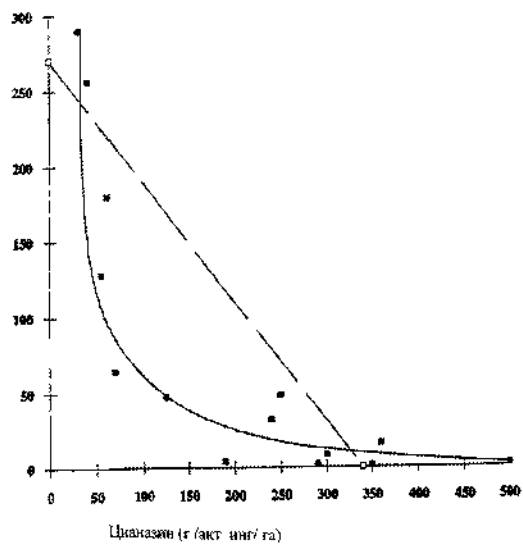
Фиг. 7

Соединение А (акт инт/га)



Фиг. 6

Соединение А (акт инт/га)



Фиг. 8

ДП «Український інститут промислової власності» (Укрпатент)

вул. Сім'ї Хохлових, 15, м. Київ, 04119, Україна

(044) 456 – 20 – 90

ТОВ «Міжнародний науковий комітет»

вул. Артема, 77, м. Київ, 04050, Україна

(044) 216 – 32 – 71