



УКРАЇНА

(19) UA

(11) 44797

(13) C2

(51) 6 A01N41/10, 41/04

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

(54) СИНЕРГІЧНА ГЕРБІЦИДНА КОМПОЗИЦІЯ ТА СПОСІБ БОРОТЬБИ З НЕБАЖАНОЮ РОСЛИННІСТЮ

1

2

(21) 98020874

(22) 11 07 1996

(24) 15 03 2002

(46) 15 03 2002, Бюл. № 3, 2002 р

(86) PCT/GB96/01673, 11 07 1996

(31) 08/504,267

(32) 19 07 1995

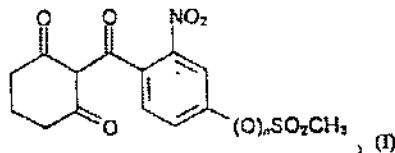
(33) US

(72) Шріббс Джон Мартін, US

(73) ЗЕНЕКА ЛІМІТЕД, GB

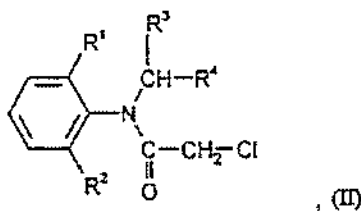
(56) WO, A, 9105469, 02 05 1991 DE, A, 4216880,  
25 11 1993

(57) 1 Синергічна гербіцидна композиція, що містить гербіцидно активну кількість суміші (А) циклогександіону за формулою (I)



де n=0 або 1, і

(B) хлорацетанлідну за формулою (II)



де зазначена сполука за формулою (II) є ацетох-

лором, алахлором або метолахлором

2 Синергічна гербіцидна композиція за п 1, де сполука (А) є 2-(2'-нітро-4'-метилсульфонілбензоіл)-1,3-циклогександіоном

3 Синергічна гербіцидна композиція за п 2, де компонент (В) є ацетохлором

4 Синергічна гербіцидна композиція за п 1, де масове співвідношення компонента (А) до компонента (В) складає від 32 1 до 1 20

5 Синергічна гербіцидна композиція за п 4, де масове співвідношення компонента (А) до компонента (В) складає від 8 1 до 1 15

6 Синергічна гербіцидна композиція за п 5, де масове співвідношення компонента (А) до компонента (В) складає від 4 1 до 1 10

7 Спосіб боротьби з небажаною рослинністю, який відрізняється тим, що наносять на локус такої рослинності гербіцидно ефективну кількість синергічної композиції за одним з пунктів 1-6

8 Спосіб за п 7, в якому загальна кількість компонентів (А) і (В), нанесених на локус небажаної рослинності, складає 0,005 кг/га-5,0 кг/га

9 Спосіб за п 8, в якому загальна кількість компонентів (А) і (В), нанесених на локус небажаної рослинності, складає 0,5 кг/га-3,0 кг/га

10 Спосіб за п 7, в якому загальна кількість компонентів (А) і (В), нанесених на локус небажаної рослинності, складає принаймні 1,0 кг/га, а кількість компонента (А), нанесеного на локус небажаної рослинності, складає принаймні 0,04 кг/га

Винахід стосується синергічної гербіцидної композиції, яка містить (А) гербіцидну циклогександіонову сполуку і (В) гербіцидну хлорацетанлідінову сполуку разом з агротехнічне прийнятним носієм. Винахід стосується також способу боротьби з небажаною рослинністю, зокрема в посівах корисних культур, і застосування синергічної композиції.

Захист корисних сільськогосподарських культур від бур'янів та іншої рослинності, яка перешкоджає росту корисних культур, є постійним завдан-

ням у сільському господарстві. Для вирішення цього завдання дослідники в галузі синтетичної хімії розробили велику кількість хімічних речовин і препаратів, ефективних у боротьбі з такою небажаною рослинністю. В літературі описані різні типи хімічних гербіцидів, багато з яких знайшли промислове застосування.

У деяких випадках гербіцидно-активні інгредієнти виявились більш ефективними в комбінаціях, а не поодинокі, це явище зветься "синергізмом". Згідно визначення, поданого в [Herbicide Handbook

(13) C2

(11) 44797

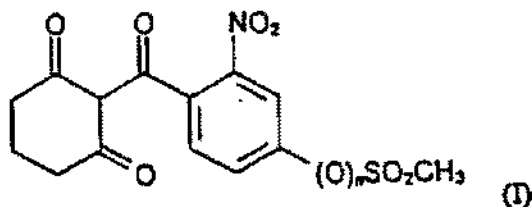
(19) UA

of the Weed Science Society of America, Seventh Edition, 1994, p. 318], "синергізм - це взаємодія двох і більше факторів, яка твориться таким чином, що ефект від сумісної дії цих факторів стає більшим, ніж ефект, що очікується від кожного з них поодиночки". Даний винахід базується на встановленні того факту, що певні циклогександіони і хлорацетаніліди, які є вже відомими поодиночки як ефективні гербіциди, виявляють синергичний ефект при їх сумісному застосуванні.

Гербіцидні сполуки, які утворюють синергичну композицію за даним винаходом, самі по собі відомі по своїй дії на ріст рослин. Гербіцидна циклогександіонова сполука 2-(2'-нітро-4'-метилсульфонілбензоїл)-1,3-циклогександіон (NMSC) і гербіцидна циклогександіонова сполука 2-(2'-нітро-4'-метилсульфонілоксибензоїл)-1,3-циклогександіон (NMSOC) описані в патенті США 5089048 (Lee et al.). Хлорацетаніліди є відомим класом сполук, які мають гербіцидну активність. Ряд гербіцидних хлорацетанілідів описаний в (Herbicide Handbook of the Weed Science Society of America, Seventh Edition, 1994), включно 2-хлор-N-(етоксиметил)-N-(2-етил-6-метилфеніл)ацетамід (АЦЕТОХЛОР), 2-хлор-N-(2,6-диетилфеніл)-N-(метоксиметил)ацетамід (АЛАХЛОР), N-(бутоксиметил)-2-хлор-N-(2,6-диетилфеніл)ацетамід (БУТАХЛОР), 2-хлор-N-(2-етил-6-метилфеніл)-N-(2-метокси-1-метилетил)ацетамід (МЕТОЛАХЛОР) і 2-хлор-N-(1-метилетил)-N-фенілацетамід (ПРОПАХЛОР). Багато з цих гербіцидних хлорацетанілідів є промисловими продуктами.

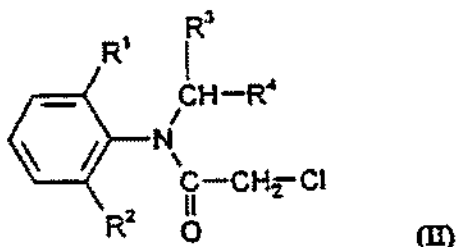
Суть винаходу

Даний винахід стосується синергичної гербіцидної композиції, яка містить (А) циклогександіонову сполуку за формулою (I)



де  $n = 0$  або  $1$ ,

і (В) хлорацетанілідову сполуку за формулою (II)



де  $R^1$  - водень, метил або етил,  $R^2$  - водень або етил,  $R^3$  - водень або метил,  $R^4$  - метил, метокси, метоксиметил, етоксид, або буюксид. Винахід стосується також способу боротьби з ростом небажаної рослинності, особливо в посівах корисних культур, з застосуванням цієї синергичної композиції.

Спектр дії сполук за формулами (I) і (II), тобто спектр видів бур'янів, ріст яких пригнічується відповідними сполуками, є широким і комплементарним. Сполуки за формулою (I) пригнічують ріст найшироколистіших та деяких інших бур'янів, а сполуки за формулою (II) пригнічують ріст основних бур'янів і деяких або небагатьох широколистяних бур'янів. Спектри дії індивідуальних сполук, що описуються вищевказаними загальними формулами, в деякій мірі відрізняються один від одного. Проте, несподівано було встановлено, що комбінація сполук за формулою (I) зі сполукою за формулою (II) виявляє синергичний ефект в боротьбі з ростом портулаку городного *Portulaca Oleracea* (POROL) у дозах, в яких ні сполука за формулою (I), ні сполука за формулою (II) поодиночки не дозволяє боротися з цим видом бур'янів. POROL є широколистим бур'яном, розповсюдженим на півдні США і пандемічним в цілому світі, внаслідок чого боротьба з ним у посівах корисних культур, особливо зернових, є дуже актуальною.

Синергична композиція за винаходом забезпечує ряд переваг порівняно з застосуванням поодиноких сполук за формулами (I) і (II). По-перше, дози застосування поодиноких сполук можуть бути значно зменшені при збереженні високого рівня гербіцидної ефективності. По-друге, синергична композиція має значно ширший спектр дії щодо бур'янів, ніж кожна зі сполук поодиночки, зрештою, синергична композиція спроможна здійснювати боротьбу з бур'янами при низьких дозах, де поодинокі сполуки є неефективними.

Докладний опис винаходу

Синергичні гербіцидні композиції за винаходом містять (А) сполуку за формулою (I) і (В) сполуку за формулою (II), формули (I) і (II) описані вище, і агротехнічно прийнятний носій. У кращому варіанті здійснення винаходу сполука (А) є NMSC, а сполука (В) є ацетохлором, алахлором або метлахлором, причому більш прийнятним є ацетохлор.

Синергична композиція містить ефективну кількість суміші компонента (А) і компонента (В). Вжитий у даному опису термін "гербіцид" означає сполуку, яка дозволяє здійснювати боротьбу з небажаними рослинами або змінювати їхній ріст. Термін "гербіцидно ефективна кількість" означає кількість такої сполуки або суміші таких сполук, яка дозволяє здійснювати боротьбу з небажаними рослинами або змінювати їх ріст. До поняття боротьби або зміни росту входять також всі відхилення від природного розвитку, наприклад загибель, затримання, опік листя, альбінізм, карликовість і под. Термін "рослини" стосується усіх фізичних частин рослин, включаючи насіння, саджанці, пагонці, коріння, бульби, стовбури, стеблини, листя і плоди.

В композиціях за винаходом масове співвідношення компонента (А) до компонента (В), при якому гербіцидний ефект є синергичним, знаходиться у межах приблизно від 32:1 до 1:20. Краще, якщо масове співвідношення компонента (А) до компонента (В) складає приблизно від 8:1 до 1:15, причому особливо прийнятним є масове співвідношення приблизно від 4:1 до 1:10.

Доза, з якою вживається синергична композиція за винаходом, залежить від конкретного типу

бур'яну, з яким ведеться боротьба, належного ступеня регулювання росту і часу та способу застосування. В загальному випадку композиції за винаходом можна застосовувати в дозах приблизно від 0,005 кг/га до 5,0 кг/га в розрахунку до загальної кількості активної речовини (компонент А + компонент В) в композиції. Кращою є доза приблизно від 0,5 кг/га до 3,0 кг/га. В особливо прийнятному варіанті здійснення винаходу синергічна композиція містить компоненти (А) і (В) у кількостях, достатніх для забезпечення дози принаймні 1,0 кг/га, де доза компонента (А) складає принаймні 0,04 кг/га.

Композиції за винаходом є придатними до вживання їх у якості гербіцидів, які виявляють синергічну активність в боротьбі з небажаною рослинністю. Склад композицій вибирають тими ж методами, що й для звичайних гербіцидних композицій. Сполуки можуть наноситися поодиночки або в комбінаціях у вигляді частини двокомпонентної гербіцидної системи.

Об'єктом застосування композиції є локус, де потрібно регулювати ріст небажаної рослинності. Термін "локус" означає ґрунт, насіння і саджанці, а також розвинуті рослини.

На практиці композицію за винаходом можна наносити різними, відомими фахівцям методами в різних концентраціях. Композиція придатна для боротьби з ростом небажаної рослинності при застосуванні її шляхом допрорісного або післяпрорісного нанесення на потрібний локус. Композиції за винаходом є особливо ефективними при допрорісному застосуванні.

На практиці композицію застосовують у вигляді препаратів, які містять різні добавки і носії, що є відомими або використовуються в промисловості для полегшення диспергування. Вибір препаратної форми і способу нанесення для будь-якої з даних сполук може вплинути на її активність, у зв'язку з чим цей вибір повинен бути зроблений відповідним чином. Композиції за винаходом можуть вживатися у вигляді гранул, змочуваних порошків, придатних до емульгування концентратів, порошків або дуєтів у вигляді плинних препаратів, розчинів, суспензій або емульсій, або у вигляді форм з регульованим виділенням, таких, наприклад, як мікрокапсули. Ці препаратні форми можуть містити мінімум 0,5% (мас.) і максимум 95% (мас.) або більше активної речовини. Оптимальна кількість для кожної сполуки залежить від її складу, обладнання для її нанесення і природи рослин, з якими ведеться боротьба.

Змочувані порошки знаходяться у вигляді дрібнодисперсних часток, які легко диспергуються у воді або інших рідинних носіях. Частки містять активну речовину, яка утримується в твердій матриці. Типовими твердими матрицями є фуллерова земля, каолін, кремнезем та інші легкозмочувані органічні або неорганічні тверді матеріали. Змочувані порошки зазвичай містять приблизно 5 - 95% активної речовини разом з невеликою кількістю змочуючого, диспергуючого або емульгуючого агента.

Придатні до емульгування концентрати - то є рідинні композиції, що диспергуються у воді або іншій рідині і можуть складатися цілком із активної речовини в комбінації з рідинним або твердим

емульгуючим агентом, або можуть містити також рідинний носій, такий як ксилол, тяжка ароматична нафта, ізофорон та інші нелеткі органічні розчинники. При використанні ці концентрати диспергуються у воді або іншій рідині і, зазвичай, наносять у вигляді лаку на поверхню, що піддається обробці. Кількість активної речовини може коливатися приблизно від 0,5% до 95% концентрату.

Гранульовані композиції містять як екструдати, так і порівняно великі частки, і зазвичай вживаються без розрідження на площі, де потрібно подати рослинність. У якості типових носіїв для гранульованих препаратів можуть вживатися пісок, фуллерова земля, аттапульгтова глина, бентонітові глини, монтморілонтові глини, вермікулит, перліт та інші органічні або неорганічні матеріали, які абсорбують активні речовини або на які може бути нанесена дана речовина. Гранульовані препарати зазвичай містять приблизно 5 - 25% активних інгредієнтів, які можуть містити поверхнево-активні агенти, такі як важкі ароматичні нафти, керосин та інші нафтові фракції, або рослинні масла, і/або добавки, які підвищують липкість, такі як декстрини, клей або синтетичні смоли.

Дуети являють собою плинні суміші активної речовини з дрібнодисперсними твердими речовинами, наприклад, тальком, глинами, борошном та іншими органічними і неорганічними твердими речовинами, які виконують роль диспергаторів і носіїв.

Мікрокапсули зазвичай являють собою краплі або гранули активної речовини, капсульовані в інертний пористий оболонці, яка забезпечує виділення ядра до навколишнього середовища з контрольованою швидкістю. Інкапсульовані краплі зазвичай мають діаметр 1 - 50 мкм. Інкапсульована рідина зазвичай складає приблизно 50 - 95% маси капсули і, крім активної речовини, може включати у себе також розчинник. Інкапсульовані гранули зазвичай є пористими, мають пористі мембрани, які герметизують відкриті пори гранул і утримують активні речовини в рідинній формі в порах гранул. Гранули зазвичай мають діаметр від 1 мм до 1 см, краще від 1 мм до 2 мм. Гранули одержують шляхом екструзії, агломерації або гранулювання, або мають природне походження. Прикладами таких матеріалів є вермікулит, спечена глина, каолін, аттапульгтова глина, деревне борошно і гранульоване вугілля. Матеріалами оболонки або мембрани можуть бути природний і синтетичний каучук, целюлозні матеріали, стиролбутадієнові співполімери, поліакрилонітрили, поліакрилати, поліефіри, поліаміди, полісечовини, поліуретани і кантати крохмалю.

Препараторними формами, придатними до нанесення гербіцидів, можуть бути також прості розчини активної речовини в розчиннику, в якому вона є повністю розчинною в бажаній концентрації, тобто такому як ацетон, алкільовані нафталіни, ксилол та інші органічні розчинники. Можна також вживати розпилювачі, в яких активна речовина диспергується у дрібнодисперсному вигляді внаслідок випарювання низькокиплячого розчинника.

Багато з цих препаратів включають у себе змочуючі, диспергуючі або емульгуючі агенти.

Прикладами таких агентів можуть бути алкил- і алкиларилсульфонати і сульфати та їхні солі, багатоатомні спирти, поліетоксильовані спирти, складні ефіри і жирні аміни. Вміст цих агентів зазвичай становить від 0,1% до 15% маси композиції.

Кожна з вищеописаних препаратних форм може бути одержана в упаковці, яка містить гербіцид разом з іншими інгредієнтами композиції (розчинниками, емульгаторами, поверхнево-активними речовинами та ін.). Препарати можуть бути також одержані методом змішування в ємності, коли інгредієнти одержують окремо і об'єднують на ділянці росту культури.

Ці препарати можна наносити на оброблювані площі звичайними методами. Наприклад, дусти і рідинні композиції можна наносити за допомогою розпилювачів, щиток, вручну. Препарати можна наносити за допомогою літаків у вигляді пилу, або лаку, або шляхом ґнгової подачі. Для зміни росту або боротьби з ростом проростаючого насіння, або кльчиків, що з'являються, дустові й рідинні препарати можна розподілити в ґрунті на глибину принаймні півдюйма (1,27 см), або наносити тільки на поверхню ґрунту шляхом розпилення або розбризкування. Препарати також можна добавляти в іригаційну воду. Це дозволяє досягти проникнення препаратів в ґрунт разом з іригаційною водою. Дустові композиції, гранульовані композиції або рідинні препарати, нанесені на поверхню ґрунту, можуть бути розподілені у ньому звичайними методами, наприклад, за допомогою дискового знаряддя, вигладжуванням поверхні або розмішуванням поверхні ґрунту.

Важливим фактором, впливаючим на користь конкретного гербіциду, є селективність останнього щодо культур. В деяких випадках корисна культура є сприйнятливою до дії гербіциду. Для того щоб бути ефективним, гербіцид повинен викликати щонайменше пошкодження (а краще не викликати ніяких пошкоджень) корисної культури, завдаючи в той же час максимальної шкоди бур'янам, заражуючим місце росту культур. Відомо, що хлорацетанілідні сполуки за формулою (II) можуть при порівняно високих дозах завдати небажаної шкоди деяким корисним культурам, особливо зерновим. Відомо, що для збереження корисних аспектів застосування гербіцидів і зведення до мінімуму пошкодження корисних культур хлорацетанілідні гербіциди застосовуються в комбінації з антидотами. Вжитий тут термін "антидот" стосується сполуки, яка впливає на селективність гербіциду, тобто постійну гербіцидну фітотоксичність щодо бур'янів і знижену фітотоксичність або її відсутність щодо корисних рослин. Термін "антидотно ефективна кількість" означає кількість антидоту, яка в деякій мірі протидіє фітотоксичному відгуку корисної культури на дію гербіциду. Якщо це потрібно або бажано у випадку конкретного застосування або конкретної культури, композиція за винаходом може містити антидотно ефективну кількість антидоту для сполуки (B). Фахівцям у даній галузі відомі антидоти, придатні до застосування разом з хлорацетанілідними сполуками за формулою (II), що дозволяє їм легко визначити антидотно ефективну кількість для будь-якої спо-

луки і будь-якого застосування.

Далі, в синергичні гербіцидні композиції за винаходом можуть вводитися інші біоцидно активні інгредієнти або сполуки. Наприклад, композиції можуть для розширення спектра їхньої дії містити, крім компонентів (A) і (B), інсектициди, фунгіциди, бактерициди, акарициди, нематоциди.

Поданий нижче приклад наведено тільки для ілюстрації винаходу. Цей приклад не слід розглядати як такий, що відображає усі проведені випробування, і він ніяким чином не обмежує об'єм винаходу. Як відомо фахівцям, при проведенні випробувань гербіцидів велика кількість факторів, які не легко контролювати, можуть впливати на результати окремих випробувань і робити їх невідтворюваними. Наприклад, результати можуть змінюватися залежно від умов навколишнього середовища, таких як кількість сонячного світла і води, тип ґрунту, pH ґрунту, температура і вологість, та інших факторів. На результати випробувань можуть також впливати глибина посадки, доза окремого гербіциду і суміші гербіцидів, доза антидоту, співвідношення окремих гербіцидів один до одного і/або, до антидоту, а також природа самих культур і бур'янів. Для різних культур результати можуть змінюватися.

#### Приклад

До алюмінієвих ящиків з супинистим ґрунтом об'ємом 1 л висівали насіння наступних шести різних видів бур'янів курячого проса *Echinochloa crusgalli* (ECHCG), елевзини індійської *Eleusine indica* (ELEIN), проса південного *Panicum miliaceum* (PANMI), росички кров'яної *Digitaria sanguinalis* (DIGSA), віль'янки широколистої *Bracharia platyphylla* (BRAPP) і POROL. Глибина посіву коливалася від 0,5 см до 1,5 см, а густина - від 3 до 25 рослин на борозну, залежно від виду рослини. До пластикових чашок об'ємом 400 мл, які містили супісок, висівали насіння іпомеї п'ятилисної *Ipomoea hederacea* (IPOHE).

Препарати NMSC і ацетохлору, що диспергуються у воді, наносили на поверхню ґрунту за планом повної факторіальної обробки по сім (7) доз кожного NMSC вживали для обробки неглибоких ящиків і чашок дозами 0, 5, 10, 20, 40, 80 і 160 г/га. Ацетохлор вживали для обробки чашок дозами 0, 50, 100, 200, 400, 800 і 1600 г/га, а також для обробки ящиків дозами 0, 5, 10, 20, 40, 80 і 160 г/га. Після нанесення препаратів ящики і чашки ставили до теплиці і витримували в добрих для забезпечення розвитку рослин умовах.

Ступінь пошкодження бур'янів оцінювали візуально через 25 днів після обробки і виражали у відсотках. Ця величина відбиває загальну шкоду, спричинену рослинам внаслідок всіх факторів, у тому числі пригнічення сходів, зупинку росту, невирний розвиток, хлороз та інші види пошкодження рослин. Ранг ступеню ураження коливався від 0 до 100%, де 0 означає відсутність ураження, а 100% - повну загибель рослини.

Поєднання NMSC з ацетохлором було ефективним по відношенню до випробуваних видів бур'янів при застосуванні в різних дозах. Комбінації NMSC і ацетохлору дали різні результати щодо PANMI, ECHCG, DIGSA, ELEIN, BRAPP і IPOHE, виявляючи антагонізм, аддитивність і синергізм.

або потенціальний синергзм при різних кількостях. Проте було встановлено, що комбінація NMSC і ацетохлору вказує дуже велику синергічну дію до бур'яну POROL у дозах, при яких жодна з цих сполук поодиноці цю рослину не уражує.

Нижче, в Табл. 1 представлені результати описаних випробувань щодо допрорісної обробки POROL комбінацією NMSC з ацетохлором. У цій таблиці також показано розрахований за методом Колбі (S R Colby, "Calculating Synergistic and Antagonistic Responce of Herbicide Combinations" WEEDS 15(1) 20-23, 1967), очікуваний ступінь ура-

ження рослин POROL комбінацією NMSC і ацетохлору. Метод Колбі відображає прямий підхід до вимірювання синергічної активності двох гербіцидів. Згідно методу Колбі:

$$E = X + Y - (XY / 100),$$

де E - прогнозований ступінь ураження бур'яну комбінацією першого гербіциду H1 і другого гербіциду H2 при дозі  $p + q$  г/га, X - ступінь ураження за допомогою H1 при дозі  $p$  г/га, виражений у відсотках, Y - ступінь ураження бур'яну за допомогою H2 при дозі  $q$  г/га, виражений у відсотках.

Таблиця 1

Ураження бур'яну POROL за допомогою комбінації NMSC з ацетохлором

	Ацетохлор, г/га													
	0		5		10		20		40		80		160	
NMSC, г/га	A <sup>1</sup>	E <sup>2</sup>	A	E	A	E	A	E	A	E	A	E	A	E
0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	12	12	45	45
5	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	17	12	45	45
10	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	17	12	70	45
20	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	22	12	33	45
40	0	0	0	0	0	0	0	0	5	0	77	12	88	45
80	5	5	0	5	83	5	60	5	77	5	100	16	100	48
160	5	5	55	5	47	5	62	5	72	5	100	16	100	48

<sup>1</sup>Фактичний ступінь ураження бур'яну, в %

<sup>2</sup>Очікуваний ступінь ураження бур'яну, в %

Результати, наведені в Табл. 1, демонструють синергічну гербіцидну активність композиції за винаходом.

Хоч даний винахід описаний з посиланням на

кращі варіанти і приклади його здійснення, об'єм винаходу ними не обмежується. Для фахівця очевидно, що даний винахід не виключає його модифікацій і адаптації у рамках, окреслених поданою нижче його формулою.