



УКРАЇНА

(19) UA (11) 76123 (13) C2

(51) МПК (2006)

A01N 41/10 (2006.01)

A01N 43/707 (2006.01)

A01N 43/70 (2006.01)

A01N 43/68 (2006.01)

A01P 13/00

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

## (54) СПОСІБ РЕГУЛЮВАННЯ РОСТУ БУР'ЯНІВ ТА ГЕРБІЦИДНА КОМПОЗИЦІЯ

1

(21) 2003043507

(22) 17.09.2001

(24) 17.07.2006

(86) РСТ/ЕР01/10695, 17.09.2001

(31) 0022932.8

(32) 18.09.2000

(33) GB

(46) 17.07.2006, Бюл. № 7, 2006 р.

(72) Пеллетт Кен, GB, Слетер Ешли, GB

(73) БАЕР КРОПСАЄНС С.А., FR

(56) WO 9613163, A, 09.05.1996

WO 0016627, A, 30.03.2000

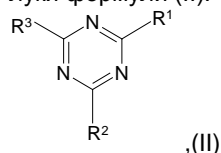
WO 9528839, A, 02.11.1995

(57) 1. Спосіб регулювання росту бур'янів на певній ділянці, що включає внесення на згадану ділянку:

(а) 2-(2'-нітро-4'-метилсульфонілбензоїл)-1,3-циклогександіону або його агрономічно прийнятної солі, або комплексу з металом; і

(б) триазинового гербіциду, за винятком атразину, у поєднанні з гербіцидно прийнятним розріджувачем або носієм, і/або поверхнево-активною речовиною.

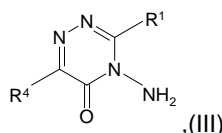
2. Спосіб за п.1, де триазиновим гербіцидом є сполуки формули (II):



де

R<sup>1</sup> означає хлор або лінійну, або розгалужену алкілтіо- або алкоксигрупу з 1-6 атомами вуглецю;R<sup>2</sup> означає азидогрупу, моноалкіламіногрупу, діалкіламіногрупу або циклоалкіламіногрупу, в яких алкільна або циклоалкільна частини можуть бути заміщені одним або декількома замісниками, вибраними з ціаногрупи й алкоксигрупи; іR<sup>3</sup> означає лінійну або розгалужену N-алкіламіногрупу з 1-6 атомами вуглецю; або формули (III):

2



де

R<sup>1</sup> має наведене вище значення, іR<sup>4</sup> означає лінійний або розгалужений алкіл, що містить 1-6 атомів вуглецю.3. Спосіб за п.2, де у формулі (II) R<sup>2</sup> означає азидогрупу, лінійну або розгалужену N-алкіламіногрупу, що містить 1-4 атоми вуглецю (де алкільна частина може бути заміщена ціаногрупою або метоксигрупою).4. Спосіб за пп.1 або 2, в якому триазиновий гербіцид вибирають із симазину, яким є 6-хлор-N<sup>2</sup>, N<sup>4</sup>-діетил-1,3,5-триазин-2,4-діамін; і ціаназину, яким є 2-(4-хлор-етиламіно-1,3,5-триазин-2-іламіно)-2-метил-пропіонітрил.

5. Спосіб за п.4, де триазиновим гербіцидом є ціаназин.

6. Спосіб за пп.1 або 2, в якому триазиновим гербіцидом є метрибузин, яким є 4-аміно-6-трет-бутил-3-метилтіо-1,2,4-триазин-5(4H)-он.

7. Спосіб за будь-яким з попередніх пунктів, в якому норма витрати бензоїлциклогександіону складає 5-500 г на гектар і норма витрати триазинового гербіциду складає 250-5000 г на гектар.

8. Спосіб за будь-яким з попередніх пунктів, в якому норма витрати бензоїлциклогександіону складає 25-150 г на гектар, і норма витрати триазинового гербіциду складає від 500г до 1500г на гектар.

9. Спосіб за будь-яким з попередніх пунктів для регулювання росту трав'янистих бур'янів у посівах кукурудзи.

10. Спосіб за будь-яким з попередніх пунктів, в якому сполуки застосовують до появи бур'янів.

11. Гербіцидна композиція, що включає:

(а) 2-(2'-нітро-4'-метилсульфонілбензоїл)-1,3-циклогександіон або його агрономічно прийнятні сіль або комплекс із металом; і

(б) триазиновий гербіцид, за винятком атразину; у

(13) C2

(11) 76123

(19) UA

поєднанні з гербіцидно прийнятним розріджувачем або носієм і/або поверхнево-активною речовиною.  
12. Гербіцидна композиція за п.11, де співвідношення (а):(б) складає від 2:1 до 1:1000

мас./мас.

13. Гербіцидна композиція за п.11 або п.12, де співвідношення (а):(б) складає від 1:4 до 1:60мас./мас.

Даний винахід стосується нових гербіцидних композицій, що включають суміш бензоїлциклогексану і гербіцидно активних похідних 1,3,5-триазину або 1,2,4-триазинону. Він стосується також застосування композиції як такої та способу боротьби з бур'янами.

Згадані вище сполуки уже відомі фахівцям як гербіциди. 1,3,5-Триазинові і 1,2,4-триазинонові гербіциди (в подальшому називаються як триазинові гербіциди) добре відомі в цій області техніки і включають аметрин ( $N^2$ -етил- $N^4$ -ізопропіл-6-метилтіо-1,3,5-триазин-2,4-діамін), атразин (6-хлор- $N^2$ -етил- $N^4$ -ізопропіл-1,3,5-триазин-2,4-діамін), азіпротрин (4-азидо- $N$ -ізопропіл-6-метилтіо-1,3,5-триазин-2-іламін), ціаназин [2-(4-хлор-6-(етиламіно)-1,3,5-триазин-2-іламіно)-2-метилпропіонітрил], метопротрин [ $N^2$ -ізопропіл- $N^4$ -(3-метоксипропіл)-6-метилтіо-1,3,5-триазин-2,4-діамін], метрибузин (4-аміно-6-трет-бутил-3-метилтіо-1,2,4-триазин-5(4H)-он), прометрин ( $N^2$ , $N^4$ -діізопропіл-6-метилтіо-1,3,5-триазин-2,4-діамін), прометон ( $N^2$ , $N^4$ -діізопропіл-6-метокси-1,3,5-триазин-2,4-діамін), пропазин (6-хлор- $N^2$ , $N^4$ -діізопропіл-1,3,5-триазин-2,4-діамін), симетрин ( $N^2$ , $N^4$ -діетил-6-метилтіо-1,3,5-триазин-2,4-діамін), симазин (6-хлор- $N^2$ , $N^4$ -діетил-1,3,5-триазин-2,4-діамін), тербутилазин ( $N^2$ -трет-бутил-6-хлор- $N^4$ -етил-1,3,5-триазин-2,4-діамін), тербутрин ( $N^2$ -трет-бутил- $N^4$ -етил-6-метилтіо-1,3,5-триазин-2,4-діамін) і триетазин (6-хлор- $N^2$ , $N^2$ , $N^4$ -триетил-1,3,5-триазин-2,4-діамін) і описані як селективні гербіциди, наприклад, у «Посібнику з пестицидів», видання 12, 2000р. (Брітш Кроп Протекши Каунсил) і ранніх виданнях. Гербіциди на основі 4-бензоїлїзоксазолів формули (I), наведеної нижче, розкриваються [в заявках на Європейські патенти 0418175, 0487357, 0527036 і 0560482].

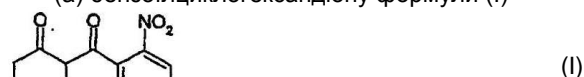
Гербіцидно активні бензоїлциклогександіони розкриті в літературі, наприклад, [у заявці на Європейський патент 0186118]. Зокрема, [патент США 5506196] розкриває 2-(2'-нітро-4'-метилсульфонілбензоїл)-1,3-циклогександіон.

Виявлено, що застосування триазинових гербіцидів у комбінації з деякими похідними бензоїлциклогександіону розширює спектр гербіцидної активності без втрати селективності по відношенню до сільськогосподарських культур. Тому згадані комбінації являють собою значний технічний прогрес. Термін «комбінація», використовуваний у даному описі, стосується комбінації бензоїлциклогександіонового гербіциду і триазинового гербіциду.

Винахід стосується також гербіцидної композиції, що дозволяє використовувати низькі дози триазинових гербіцидів стосовно навколишнього середовища, не знижуючи (і переважно підвищуючи) рівень боротьби з бур'янами.

Даний винахід стосується способу регулювання росту бур'янів (тобто небажаної рослинності) на певній ділянці, що включає нанесення на цю ділянку гербіцидно ефективної кількості:

(а) бензоїлциклогександіону формули (I)



яка означає 2-(2'-нітро-4'-метилсульфонілбензоїл)-1,3-циклогександіон або його агрономічно прийнятні сіль або комплекс із металом; і

(б) триазинового гербіциду, за винятком атразину.

Триазиновий гербіцид і бензоїлциклогександіон зазвичай застосовують у вигляді гербіцидних композицій (тобто в сполученні із сумісними розріджувачами або носіями і/або поверхнево-активними речовинами, що придатні для використання в гербіцидних композиціях), наприклад, як описано нижче.

Переважно триазиновим гербіцидом є сполуки формули (II):



де  $R^1$  означає хлор або лінійну або розгалужену алкілтіо- або алкоксигрупу з 1-6 атомами вуглецю;

$R^2$  означає азидогрупу, моноалкіламіногрупу, діалкіламіногрупу або циклоалкіламіногрупу, у яких алкільна або циклоалкільна частини можуть бути заміщені одним або декількома замісниками, вибраними з ціаногрупи й алкоксигрупи; і

$R^3$  означає лінійну або розгалужену N-алкіламіногрупу з 1-6 атомами вуглецю;

або формули (III)



де  $R^1$  має наведені вище значення, і

$R$  означає лінійний або розгалужений алкіл, що містить 1-6 атомів вуглецю.

Більш переважно,  $R^1$  означає хлор або метилтіогрупу, і  $R^3$  означає лінійну або розгалужену N-алкіламіногрупу, що містить 1-4 атоми вуглецю.

Переважними є композиції, що містять сполуки наведеної вище формули (II), де  $R^2$  означає азидогрупу, лінійну або розгалужену N-алкіламіногрупу, що містить 1-4 атома вуглецю (де алкільна частина може бути заміщена ціаногрупою або метоксигрупою).

Іншими переважними сполуками наведеної вище формули (II) є такі, у яких  $R^3$  означає N-(трет-бутил)аміногрупу,  $R^2$  означає N-етиламіногрупу, і  $R^1$  означає хлор або метилтіогрупу, що, відповідно, відомі як тербутилазин і тербутрин.

Переважними сполуками наведеної вище формули (II) є такі, у яких  $R^1$  означає хлор,  $R^3$  означає N-етиламіногрупу і  $R^2$  означає N-етиламіногрупу або N-(2-метилпропаннітрил)аміногрупу, відповідно, відомі як симазин і ціаназин; найбільш переважною сполукою є ціаназин.

Перевага надається сполуці наведеної вище формули (III), в якій  $R^1$  означає метилтіогрупу,  $R^4$  означає трет-бутил, відомої як метрибузин.

Кількості застосовуваних триазинового гербіциду і бензоїлциклогександіону змінюються в залежності від наявних бур'янів і їхньої популяції, застосовуваних композицій, часу застосування, кліматичних і ґрунтових умов і (при застосуванні для регулювання росту бур'янів на площах вирощування сільськогосподарських культур) культури, що підлягає обробці. Як правило, приймаючи до уваги ці фактори, норми витрати 5-500 г бензоїлциклогександіону і 250-5000 г триазинового гербіциду на гектар дають гарні результати. Однак, зрозуміло, що можна застосовувати більш високі або більш низькі внесені кількості в залежності від виникаючих проблем при боротьбі з бур'янами.

З метою селективної боротьби з бур'янами на зарослій бур'янами ділянці, що є площею, що використовується або яка повинна бути використана для вирощування сільськогосподарських культур, норми витрати 5-500 г бензоїлциклогександіону і 250-5000 г триазинового гербіциду на гектар є особливо придатними, переважно 25-150 г бензоїлциклогександіону і 500-1500 г триазинового гербіциду на гектар. При нанесенні на площу для вирощування сільськогосподарських культур кількості, що вноситься, повинна бути достатньою для регулювання росту бур'янів, не викликаючи істотного довгострокового ушкодження сільськогосподарської культури.

Комбіноване застосування, описане вище, може бути використане для боротьби з дуже широким спектром однолітніх широколистих і трав'янистих бур'янів у сільськогосподарських культурах, наприклад, кукурудзи, і на плантаціях цукрової тростини, без істотного довгострокового ушкодження сільськогосподарської культури. Комбіноване застосування, описане вище, передбачає як листяну, так і залишкову активність і, отже, може застосовуватися протягом тривалого періоду розвитку сільськогосподарської культури, тобто до появи сходів бур'янів і сільськогосподарських культур і після періоду їхньої появи.

Згідно зі способом, відповідно до цієї відмітної ознаки даного винаходу, комбіноване застосування (а) і (б) для боротьби з бур'янами в посівах кукурудзи є переважним.

У тому випадку, коли триазиновим гербіцидом є аметрин, комбіноване застосування (а) і (б) для боротьби з бур'янами на плантаціях цукрової тростини також є переважним.

Згідно зі способом, описаним вище, переваж-

ним є комбіноване застосування (а) і (б) при співвідношеннях (а):(б) від 2:1 до 1:1000 мас/мас, причому особливо переважним є співвідношення від 1:3 до 1:60 мас/мас, (або від 1:3,3 до 1:60 мас/мас).

Під терміном «передсходове застосування» мається на увазі внесення гербіциду в ґрунт, у якому насіння або проростки бур'янів присутні до появи сільськогосподарської культури. Під терміном «післясходове застосування» мається на увазі нанесення гербіциду на надземну або зовнішню частини бур'янів, що з'явилися над поверхнею ґрунту. Під терміном «листяна активність» розуміється гербіцидна активність, що проявляється при нанесенні на надземну або зовнішню частини бур'янів, що з'явилися над поверхнею ґрунту. Під терміном «залишкова активність» мається на увазі гербіцидна активність, що виявляється при нанесенні на ґрунт, у якому знаходяться насіння або проростки бур'янів, перед появою бур'янів над поверхнею ґрунту, за допомогою чого регулюють ріст проростків, що присутні під час внесення гербіциду або які проростають після його внесення з насінням, що знаходяться в ґрунті.

Згідно з даним винаходом переважним є передпосівне або передсходове внесення, і найбільше переважним є передсходове внесення бензоїлциклогександіону і триазинового гербіциду.

Комбінацію бензоїлциклогександіону і триазинового гербіциду переважно застосовують на площі, що використовується або повинна бути використана, для вирощування сільськогосподарської культури, наприклад, кукурудзи, цукрової тростини, або плантаційних культур. Переважною сільськогосподарською культурою є кукурудза.

Відповідно до звичайної практики резервуарна суміш може бути виготовлена перед використанням шляхом комбінації окремих форм індивідуальних гербіцидних компонентів.

Даний винахід пояснюється наступними, не обмежувачими його обсягу охорони, прикладами.

#### Приклад 1

Насіння різних видів широколистих і трав'янистих бур'янів висівали в нестерилізований мулистий суглинковий ґрунт. Потім поверхню ґрунту обприскували розчинами в суміші ацетону і води з різними концентраціями або індивідуального гербіциду, або суміші двох гербіцидів у різних пропорціях. Згаданими насіннями є *Amaranthus retroflexus*, *Setaria viridis*, *Setaria faberi* і *Echinochloa crus-galli*.

Через два тижні після обробки оцінювали відсоток зниження росту рослини в порівнянні з необробленим контролем.

Здійснювали спостереження за ураженням одного або декількох видів бур'янів за допомогою комбінацій згідно з даним винаходом.

#### Приклад 2

Насіння різних видів бур'янів, перерахованих у прикладі 1, висівали і вирощували до стадії 1-3 листів. Здійснювали післясходові застосування при використанні розчинів у суміші ацетону і води з різними концентраціями або індивідуальним гербіцидом, або сумішей двох гербіцидів у різних пропорціях.

Через два тижні після обробки оцінювали відсоток зниження росту рослини в порівнянні з нео-

бробленим контролем.

Здійснювали спостереження за поразкою одного або декількох видів бур'янів за допомогою комбінацій дійсного винаходу.

Відповідно до іншої відмітної ознаки даного винаходу передбачаються гербіцидні композиції, що включають:

(а) 2-(2'-нітро-4'-метилсульфонілбензоїл)-1,3-циклогександіон або його агрономічно прийнятні сіль або комплекс з металом; і

(б) триазиновий гербіцид, за винятком атразину;

у поєднанні з прийнятним для гербіцидів розріджувачем або носієм і/або поверхнево-активною речовиною і переважно гомогенно диспергованими в них.

Термін «гербіцидна композиція», використовуваний у широкому змісті, включає не тільки композиції, що готові для застосування як гербіциди, але також концентрати, що перед використанням повинні бути розведені. Переважно, композиції містять 0,05-90 мас.% бензоїлциклогександіону і триазинового гербіциду.

Якщо не зазначено інакше, відсотки і співвідношення, що приводяться в даному описі, є масовими.

Як правило, застосовують композицію, у якій співвідношення (а):(б) складає від 1:6000 до 64:1 мас/мас, причому співвідношення від 1:600 до 4:1 мас/мас, (або від 1:600 до 3,41:1 мас/мас.) переважні; співвідношення від 1:100 до 2:1 мас/мас. (або від 1:100 до 1,33:1 мас/мас.) надзвичайно переважні, і співвідношення від 1:20 до 1:1 мас/мас, (або від 1:20 до 1:1,33 мас/мас.) особливо переважні.

Гербіцидна композиція може містити тверді і рідкі носії і поверхнево-активні речовини (наприклад, змочувачі, диспергатори або емульгатори, індивідуально або в комбінації). Поверхнево-активні речовини, що можуть бути присутні у гербіцидних композиціях даного винаходу, можуть бути іонного і неіонного типів, наприклад, сульфорицинолеати, четвертинні амонієві похідні, продукти на основі конденсатів етиленоксиду з нонил- або октилфенолами, або ефіри карбонових кислот і ангіросорбів, що переводять у розчинний стан шляхом утворення простих ефірів за рахунок реакції конденсації вільних гідроксильних з етиленоксидом, солі лужних і лужноземельних металів ефірів сірчаної кислоти і сульфонових кислот, такі, як диноніл- і діоктилсульфосукцинати натрію, і солі лужних і лужноземельних металів високомолекулярних похідних сульфонових кислот, такі, як лігносульфонати натрію і кальцію. Прикладами відповідних твердих розріджувачів або носіїв є силікат алюмінію, тальк, оксид магнію, кізельгур, трикальційфосфат, корковий порошок, сажа, що абсорбує і глини, такі, як каолін і бентоніт. Приклади відповідних рідких розріджувачів включають воду, ацетофенон, циклогексанон, ізофорон, толуол, ксилол і мінеральні, тваринні і рослинні олії (ці розріджувачі можуть застосовуватися індивідуально або в комбінації).

Гербіцидні композиції даного винаходу при необхідності можуть містити також звичайні добавки, такі, як адгезиви, захисні колоїди, загущувачі, що

сприяють penetрації компоненти, стабілізатори, комплексоутворювачі, що перешкоджають грудкуванню агенти, барвники й інгібітори корозії. Дані добавки можуть також служити носіями або розріджувачами.

Порошки, що змочуються, (або порошки для розпилення) звичайно містять 20-95% бензоїлциклогександіону і триазинового гербіциду, і в додавання до твердого носія вони звичайно містять 0-5% змочувача, 3-10% диспергатора і при необхідності 0-10% одного або декількох стабілізаторів і/або інших добавок, таких, як агенти, що сприяють penetрації, адгезиви або перешкоджають грудкуванню агенти і барвники.

Водні суспензійні концентрати, що наносять розпиленням, готують таким чином, щоб одержати стійкий рідкий продукт (шляхом тонкого помелу), що не дає осаду, і вони звичайно містять 10-75% бензоїлциклогександіону і триазинового гербіциду, 0,5-15% поверхнево-активних речовин, 0,1-10, % тиксотропних речовин, 0-10% прийнятних добавок, таких, як піногасники, інгібітори корозії, стабілізатори і вода або органічна рідина, у якій активна речовина помірно розчинна або нерозчинна. Можуть додаватися деякі органічні тверді речовини або неорганічні солі, щоб сприяти попередженню седиментації або як антифриз для води.

Переважними гербіцидними композиціями даного винаходу є порошки, що змочуються, або гранули, що диспергуються у воді.

Гербіцидні композиції даного винаходу можуть також включати бензоїлциклогександіон і триазиновий гербіцид у сполученні з одним або більше іншими пестицидно активними сполуками і, при необхідності, з одним або більше пестицидно сумісними з розріджувачами і носіями і переважно гомогенно диспергованими в них. Переважними гербіцидними композиціями даного винаходу є такі, котрі містять бензоїлциклогександіон і триазиновий гербіцид у поєднанні з іншими гербіцидами.

Композиції згідно з винаходом можуть бути отримані у виді промислового продукту, що включає бензоїлциклогександіон і триазиновий гербіцид і, можливо, інші активні пестициди, як описані вище, і переважно, гербіцидну композицію, як описана вище, і переважно гербіцидний концентрат, що може бути розведений перед застосуванням, що включає бензоїлциклогександіон і триазиновий гербіцид, у резервуарі для згаданих вище бензоїлциклогександіона і триазинового гербіциду або згаданої гербіцидної композиції, і інструкції, прикладені безпосередньо до згаданого вище резервуару з указівкою способу, за допомогою якого згадані вище бензоїлциклогександіон і триазиновий гербіцид або гербіцидна композиція, яка містить їх повинні застосовуватися для регулювання росту бур'янів. Звичайно резервуари можуть бути типів, традиційно використовуваних для збереження хімічних речовин концентрованих гербіцидних композицій, які є тверді або рідкі при нормальній температурі навколишнього середовища, як, наприклад, банки і бочки з пластикових матеріалів або металу (які усередині можуть бути покриті лаком), бутілі зі скла і пластикових матеріалів; і якщо вміст резервуара є твердим, як, наприклад,

гранульована гербіцидна композиція, то коробки, наприклад, з картону, пластикового матеріалу, металу, або мішки. Звичайно резервуари повинні мати достатню ємність, щоб вміщати кількості активних інгредієнтів або гербіцидних композицій, достатні для обробки принаймні одного гектара ґрунту з метою регулювання росту там бур'янів, але не перевищуючий розмір, який придатний для звичайних способів маніпулювання. Інструкції повинні бути прикладені безпосередньо до резервуару, наприклад, надруковані безпосередньо на ньому або на етикетці або бирці, прикріпленої до нього. В інструкціях звичайно вказують, що вміст резервуара після розведення, якщо це необхідно, повинен бути застосований для регулювання росту бур'янів при нормах витрати 0,5-512г бензоїлциклогександіона і 8-3000г триазинового гербіциду на гектар вищеописаним способом і для цілей, згаданих вище.

Спосіб, [описаний у патенті США 5006158], може бути використаний для одержання бензоїл-

циклогександіону формули (I).

Відповідно до подальшої відмітної ознаки дійсного винаходу, вона відноситься до продукту, що включає:

(а) 2-(2'-нітро-4'-метилсульфонілбензоїл)-1,3-циклогександіон або його агрономічно прийнятні сіль або комплекс із металом; і

(б) триазиновий гербіцид, за винятком атразину;

як комбінований препарат для одночасного, роздільного або послідовного застосування для регулювання росту бур'янів на певній ділянці.

Незважаючи на описані у винаході різні переважні варіанти втілення, фахівець повинний брати до уваги, що можуть бути здійснені різні модифікації, заміни, виключення і зміни, не відхиляючись від сутності винаходу. Відповідно, мають на увазі, що обсяг дійсного винаходу охоплюється пунктами формули винаходу, включаючи їх еквіваленти.