



УКРАЇНА

(19) UA

(11) 55406

(13) C2

(51) 7 A01N43/80//A01N43/80,43:10,37:22

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

(54) ГЕРБІЦИДНА СИНЕРГІЧНА КОМПОЗИЦІЯ І СПОСІБ БОРОТЬБИ З БУР'ЯНАМИ

1

2

(21) 98094869

(22) 03 03 1997

(24) 15 04 2003

(46) 15 04 2003, Бюл. № 4, 2003 р.

(86) PCT/EP97/01055, 03 03 1997

(31) 692/96

(32) 15 03 1996

(33) CH

(72) Рюегг Віллі, CH

(73) НОВАРТИС АГ, CH

(56) WO 9603877 A, 15 02 1996

EP 0614606 A, 14 09 1994

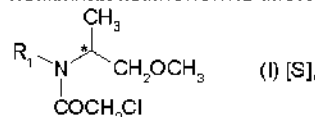
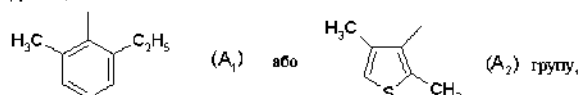
US 5002606 A, 26 03 1991

US 5457085 A, 10 10 1995

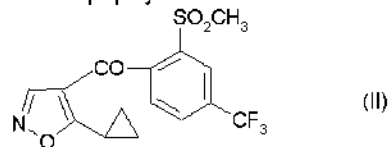
EP 0685157 A, 06 12 1995

EP 0616770 A, 28 09 1994

(57) 1 Гербіцидна синергічна композиція, яка відрізняється тим, що крім традиційних інертних допоміжних компонентів містить сполуку формули I

де R₁ являє собою

і синергічно ефективну кількість активного компонента формули II

2 Гербіцидна композиція за п. 1, яка відрізняється тим, що містить сполуку формули I, де R₁ являє собою групу A₁

3 Гербіцидна композиція за п. 1, яка відрізняється тим, що вагове співвідношення компонента формули I і компонента формули II становить від 1:100 до 100:1

4 Спосіб боротьби з небажаною рослинністю серед сільськогосподарських культурних рослин, який відрізняється тим, що передбачає обробку культурної рослини або місця її висаджування ефективною кількістю гербіцидної композиції за п. 1

5 Спосіб за п. 4, який відрізняється тим, що культурними рослинами є злакові культури, рапс, цукрові буряки, цукрова тростина, зелені насадження, рис, кукурудза або соєві боби

6 Спосіб за п. 4, який відрізняється тим, що передбачає обробку сільськогосподарських культурних рослин згаданою композицією при нормах застосування від 0,05 до 4 кг сумарної кількості активного компонента на гектар

7 Композиція за п. 1, яка відрізняється тим, що окрім сполук формул I та II містить беноксакор

8 Спосіб за п. 4, який відрізняється тим, що передбачає обробку культурної рослини або місця її висаджування сполукою формули I і сполукою формули II окремо

9 Спосіб за п. 4, який відрізняється тим, що передбачає обробку культурної рослини або місця її висаджування сполукою формули I разом з беноксакором і сполукою формули II окремо

Цей винахід стосується нової гербіцидної синергічної композиції, яка складається з гербіцидів, придатних для вибіркової боротьби з бур'янами у сільськогосподарських рослинних культурах, перш за все в культурах злакових, в кукурудзі, рисі, рапсі, цукрових буряках, цукровій тростині, зелених

насадженнях, бавовні та соєвих бобах

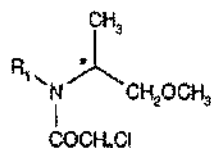
Винахід також стосується способу боротьби з бур'янами, які зустрічаються в сільськогосподарських рослинних культурах, і застосування для цього згаданої вище нової композиції

Сполуки формули I

(13) C2

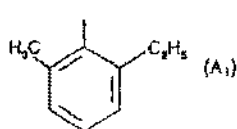
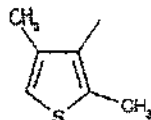
(11) 55406

(19) UA



(I) [S],

де R₁ являє собою

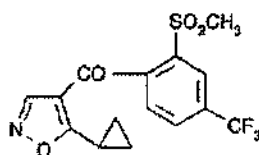
(A₁)(A₂)

або

групу,

відзначаються гербіцидною активністю, як описано, в числі інших, в патентних заявках US-A-5002606 та US-A-5457085

Наступна сполука формули II

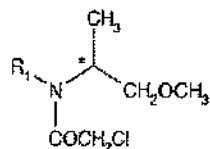


(II)

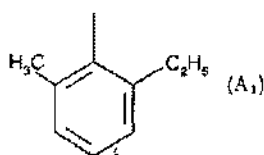
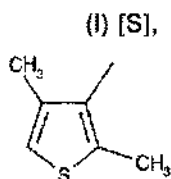
є також відомою як гербіцид з результатів Brighton Crop Protection Conference - Weeds - 1995, Proceedings Volume 1, сторінки 35 - 42, та з іншої літератури. Синергичні суміші сполук формули II з рацематами формули I описані в WO 96/03877

Несподівано виявилось, що синергичний ефект, який дозволяє без нанесення жодної істотної шкоди культурним рослинам боротися - як до, так і після проростання насіння - з більшістю бур'янів, що найчастіше зустрічаються у сільськогосподарських рослинних культурах, спостерігається при будь-якому співвідношенні кількості двох активних компонентів, тобто активного компонента формули I та активного компонента формули II

Таким чином, автори цього винаходу пропонують нову синергичну композицію для селективної боротьби з бур'янами, яка разом з традиційними інертними допоміжними фармацевтичними агентами містить, з одного боку, як активний компонент сполуку формули I

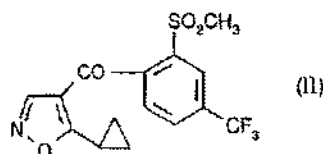


де R₁ являє собою

(A₁)(A₂)

(II) [S],

а з другого боку - синергичне ефективну кількість активного компонента формули II або групи,



(II)

причому кожний з компонентів доповнює другий

Сполуки формули I являють собою оптичні ізомери aRS,1'S(-)-N-(1'-метил-2'-метоксietил)-N-хлороацетил-2-етил-6-метиланіліну та (1S,aRS)-2-хлоро-N-(2,4-диметил-3-тієніл)-N-(2-метокси-1-метилетил)ацетаміду

Великою несподіванкою виявилось також і те, що сполучення активного компонента формули I з активним компонентом формули II справляє більш істотну додаткову дію на шкідників, ніж очікувалося взагалі, і, таким чином, підвищує ефективність обох активних компонентів принаймні у двох аспектах

З одного боку, при окремому застосуванні сполук I та II їх норму можна зменшувати до тих пір, доки зберігається ефективність зазначених сполук. З другого - боку, нове сполучення дозволяє досягти значних результатів у боротьбі з бур'янами у тих випадках, коли низькі норми застосування сполук у вигляді окремих засобів більш не забезпечують бажаної ефективності в сільському господарстві. Наслідком цього є значне розширення спектра дії проти бур'янів і додаткове збільшення способів обробки культурних рослин, що стає неминучим та необхідним у разі непередбаченого перевищення норм застосування гербіциду. Крім того, нова композиція забезпечує більш гнучкий спосіб обробки рослинних культур із збереженням високої ефективності боротьби з бур'янами, що ростуть поміж культурних рослин.

Нові гербіцидні композиції використовують у боротьбі проти великої кількості найбільш шкідливих для сільського господарства бур'янів, включаючи Stellaria, Agrostis, Digitaria, Avena, Setaria, Sinapis, Lolium, Solanum, Echinochloa, Scirpus, Monochoria, Sagittaria, Bromus, Alopecurus, Sorghum halepense, Rottboellia, Cyperus, Abutilon, Sida, Xanthium, Amaranthus, Chenopodium, Ipomoea, Chrysanthemum, Galium, Viola та Veronica

Нові композиції є придатними для всіх відомих у агротехніці стандартних способів застосування гербіцидів як до проростання, так і після проростання насіння, а також для способу, що полягає у щільному покритті насіння

Нову гербіцидну композицію можна застосовувати головним чином для боротьби з бур'янами, які найчастіше зустрічаються в сільськогосподарських рослинних культурах, перш за все в зернових злакових культурах, рапсі, на плантаціях цукрових буряків, цукрової тростини, зелених насаджень, в рисі, кукурудзі та соєвих бобах, а також для неселективної боротьби з бур'янами. Але найкраще застосовувати нову композицію для обробки кукурудзи та соєвих бобів

Під сільськогосподарськими культурами у кон-

тексті цього винаходу слід розуміти, крім того, такі сорти культур, що їх було виведено стійкими до окремих гербіцидів або класів гербіцидів за допомогою традиційних технологій селекції та способів генної інженерії

Нова гербіцидна композиція містить активний компонент формули I та активний компонент формули II у будь-якому співвідношенні, але завжди з суттєвою перевагою по кількості одного компонента над іншим. Співвідношення кількості активного компонента формули I і компонента формули II змінюється в діапазоні від 1:100 до 100:1, переважно від 1:10 до 10:1.

Найбільш ефективними синергчними гербіцидними композиціями виявилися комбінації сполуки формули I, де R_1 являє собою групу A_1 , зі сполукою формули II.

Нові композиції сполук формул I та II додатково можуть містити запобіжник побічної дії, зокрема беноксакор (Benoxacor). Беноксакор є відомим, в числі інших, з Pesticide Manual, 9th ed., British Crop Protection Council, p. 61. Беноксакор як запобіжник побічної дії призначається для захисту власне культурних рослин від гербіцидної активності сполук формули I, зокрема від дії такої сполуки формули I, де R_1 являє собою групу A_1 .

Якщо нова композиція містить запобіжник побічної дії, вагове співвідношення кількості гербіциду формули I (зокрема такого варіанту сполуки формули I, де R_1 являє собою групу A_1) і запобіжника побічної дії складає оптимально від 5:1 до 40:1, зокрема 20:1.

В залежності від ситуації для захисту культурних рослин від шкідливої дії гербіцидів формули I можуть також застосовуватися інші технології та способи використання запобіжників побічної дії або композицій, що містять їх, зокрема такі:

i) Покриття насіння

а) Покриття насіння здатним до зволоження порошкоподібним консервантом шляхом зтрушування у посудині до однорідного розподілення запобіжника побічної дії на поверхні насіння (суха обробка) з використанням від 1 до 500г активного компонента формули II (від 4г до 2кг здатного до зволоження порошку на 100кг насіння).

б) Покриття насіння емульгованим концентратом запобіжника побічної дії згаданим способом а) (волога обробка замість сухої).

в) Покриття шляхом занурення насіння в суміш, що містить 100 - 1000млн¹ запобіжника побічної дії, на 1 - 72 години, запишаючи насіння зволоженням або потім висушуючи його (просочування насіння).

Покриття насіння або обробка молодих паростків або сходів є найбільш переважними способами застосування цих препаратів, оскільки така обробка з використанням запобіжника побічної дії повністю спрямована на цільову агрокультуру. Звичайно використовують від 1 до 1000г, переважно від 5 до 250г, антидоту з розрахунку на 100кг насіння. Проте, в залежності від способу застосування, який додатково дає можливість користуватися іншими активними компонентами або мікроживними речовинами, іноді допускаються відхилення від вказаних граничних значень концентрації у той чи інший бік (повторне покриття).

ii) Застосування суміші

Використовують рідкий препарат суміші антидоту і гербіциду (зворотне співвідношення від 10:1 до 1:100), витрата гербіциду на одиницю площі становить від 0,05 до 4,0кг/га. Таку суміш застосовують до або після висівання.

iii) Спосіб застосування в борозні

Запобіжник побічної дії, виготовлений у вигляді емульгованого концентрату, зволоженого порошку або гранул, застосовують у відкритій борозні, в яку висівають насіння. Після засипання борозни перед появою сходів звичайними способами застосовують гербіцид.

iv) Контрольоване виділення запобіжника побічної дії

Розчином запобіжника побічної дії обробляють субстрати мінеральних гранулятив або полімеризовані грануляти (сечовина/формальдегід), які після цього висушують. Додатково використовують спосіб покриття (покривні грануляти), що дає можливість здійснювати контрольоване виділення запобіжника побічної дії впродовж конкретного періоду часу.

Норма застосування може змінюватися в широкому діапазоні значень і залежить від природи ґрунту, характеру застосування (до або після появи сходів, з використанням насіння з покриттям, в посівній борозні, без обробки ґрунту тощо), типу рослин, які обробляють, знищеного бур'яну, переважаючих кліматичних умов, а також від інших факторів, які визначаються способом застосування гербіциду і типом цільової агрокультури. Норма застосування комбінації гербіцидів звичайно становить від 0,05 до 4кг/га, переважно від 0,5 до 4кг/га.

Композицію сполук формули I та формули II застосовують і в немодифікованому вигляді, тобто у тому вигляді, який був одержаний в результаті синтезу, але найчастіше її обробляють звичайними способами з використанням відомих у фармакології технологій, перш за все - з використанням розчинників, твердих носіїв або сурфактантів до одержання, наприклад, емульгованих концентратів, готових розпилюваних або розбавлених розчинів, зволоженого порошків, розчинних порошків, дуетів, гранул або мікрокапсул. В залежності від типу одержаної композиції вибирають способи її застосування, наприклад розпилювання, дисперговане розпилювання, посипання, зволоження, розсіювання або поливання, які повинні відповідати поставленим задачам та домінуючим зовнішнім умовам.

Препарати, тобто композиції, що містять активні компоненти формул I та II і - при необхідності - один чи декілька допоміжних фармацевтичних агентів, приготують відомими способами, наприклад шляхом гомогенізації та/або розтирання активного компонента із зазначеними допоміжними фармацевтичними агентами, як правило з розчинниками або твердими носіями. Для приготування цих засобів додатково використовують поверхнево-активні сполуки (сурфактанти).

Прийнятними розчинниками звичайно є ароматичні вуглеводні, переважно фракції, що містять від 8 до 12 атомів вуглецю, наприклад суміші ксилену або заміщуваних нафталінів, фталати,

наприклад дибутил фталат або діоктил фталат, аліфатичні вуглеводні, наприклад циклогексан або парафіни, спирти і піколі, а також їхні ефіри та естери, наприклад етанол, етиленгліколь, 2-метоксіетанол чи 2-етоксіетанол, кетони, наприклад циклогексанон, сильно поляризовані розчинники, наприклад N-метил-2-піролідон, диметилсульфоксид або N,N-диметилформамід, а також рослинні олії або епоксидовані рослинні олії, наприклад епоксидована кокосова олія або соєва олія, або вода

До твердих носіїв, які переважно використовують для приготування дуетів і диспергованих порошків, звичайно належать природні мінеральні наповнювачі, наприклад кальцит, тальк, каолін, монтмориллоніт або атапульгіт. Для покращення фізичних властивостей також додають дрібнодисперсну кремнієву кислоту або дрібнодисперсні абсорбуючі полімери. Прийнятними гранульованими адсорбційними носіями є носії порового типу, до яких належать пемза, біта цегла, сепіоліт або бентоніт, до прийнятних несорбуючих носіїв належать такі матеріали, як, наприклад, кальцит чи пісок. Крім того, застосовують численні прегранульовані матеріали неорганічного та органічного походження, зокрема доломіт або подрібнені залишки деревини.

В залежності від типу потрібного активного компонента формули I до прийнятних поверхнево-активних сполук належать безіонні, катіонні та/або аніонні сурфактанти або суміші сурфактантів з високою здатністю до емульгування, диспергування і зволоження.

Прийнятними аніонними сурфактантами є водорозчинні мила, а також водорозчинні синтетичні поверхнево-активні сполуки.

Прийнятними милами є солі лужних металів, солі лужноземельних металів, солі амонію або заміщувані солі амонію вищих жирних кислот (C_{10} - C_{22}), наприклад натрієві чи кальцієві солі олеїнової або стеаринової кислоти, або суміші природних жирних кислот, які отримують, в числі інших, з кокосової олії або твердого тваринного жиру. Додатковими прийнятними милами є також метилтауринові солі жирних кислот.

Більш часто, однак, застосовують так звані синтетичні сурфактанти, зокрема сульфонати жирних кислот, сульфати жирних кислот, сульфоновані похідні бензоїмідазолу або алкіларилсульфонати.

Сульфонати або сульфати жирних спиртів звичайно застосовують у формі солей лужних металів, солей лужноземельних металів, солей амонію або заміщуваних солей амонію, і вони містять C_8 - C_{22} алкільний радикал, який також включає алкільну складову ацильних радикалів, наприклад натрієва або кальцієва сіль лігніосульфонової кислоти, додецилсульфат або суміш сульфатів жирних спиртів, одержаних з природних жирних кислот. Ці сполуки також включають солі адуктів сульфованого і сульфонованого жирного спирту/етиленоксиду. Сульфоновані похідні бензімідазолу переважно містять дві сульфонової кислотні групи і один радикал жирної кислоти, що містить від 8 до 22 атомів вуглецю. Ілюстративними прикладами алкіларилсульфонатів є натрієві, кальціє-

ві або триетиламінові солі додецилбензолсульфонової кислоти, дибутилнафталінсульфонової кислоти або конденсату нафталінсульфонової кислоти і формальдегіду.

Відповідні фосфати, перш за все естери солей фосфорної кислоти п-нонілфенол-(4-14)етиленоксиду або фосфоліпіди також є прийнятними для цілей цього винаходу.

До безіонних сурфактантів переважно належать полігліколь-ефірні похідні аліфатичних або циклоаліфатичних спиртів або насичених чи ненасичених жирних кислот і алкілфенолів, зазначені похідні містять від 3 до 30 гліколь-ефірних груп і від 8 до 20 атомів вуглецю у вуглеводневій (аліфатичній) складовій, і від 6 до 18 атомів вуглецю в алкільній складовій алкілфенолів.

Додатковими прийнятними безіонними сурфактантами є водорозчинні поліадукти поліетиленоксиду з поліпропіленгліколем, етилендіамінополіпропіленгліколем і алкілполіпропіленгліколем, що містять від 1 до 10 атомів вуглецю в алкільному ланцюгу, ці поліадукти містять від 20 до 250 груп ефіру етиленгліколю та від 10 до 100 груп ефіру пропіленгліколю. Ці сполуки звичайно містять від 1 до 5 одиниць етиленгліколю на одиницю пропіленгліколю.

Ілюстративними прикладами безіонних сурфактантів є нонілфенольні поліетоксилати, поліетоксильована касторова олія, поліадукти поліпропілену і поліетиленоксиду, трибутилфенолполіетоксил, поліетиленгліколь і октилфенолполіетоксилат.

Естери жирних кислот поліоксетиленсорбітану є також прийнятними безіонними сурфактантами, перш за все тріолеат поліоксетиленсорбітану.

До катіонних сурфактантів переважно належать четвертинні солі амонію, які мають як N-замісник принаймні один алкільний радикал C_8 - C_{22} і як додаткові замісники - незаміщуваний або галогенізований нижчий алкіл, бензил або гідроксинаижчі алкільні радикали. Солі використовують переважно у формі галідів, метилсульфатів або етилсульфатів, наприклад стеариловий хлорид триметиламонію або бензиловий бромід біс(2-хлоретил)етиламонію.

Сурфактанти, які традиційно застосовуються в агротехнічній галузі, описані, в числі інших, в "Mc Cutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual" MC Publishing Corp., Ridgewood New Jersey, 1981, Stache, H., "Tensid-Taschenbuch", Carl Hanser Verlag, München/Wien, 1981, та M and J Ash, "Encyclopedia of Surfactants", Vol I-III, Chemical Publishing Co., New York, 1980-81.

Гербіцидні препарати звичайно містять від 0,1 до 99% за вагою, переважно від 0,1 до 95% за вагою, активного компонента у вигляді суміші сполуки формули I зі сполукою формули II, від 1 до 99,9% за вагою твердих або рідких допоміжних компонентів, і від 0 до 25% за вагою, переважно від 0,1 до 25% за вагою, сурфактанту.

Оскільки більш економічно виготовляти комерційні продукти у формі концентратів, кінцевий споживач звичайно має розводити засоби до потрібної концентрації.

Композиції можуть також містити додаткові компоненти, наприклад стабілізатори, рослинні олії або епоксидовані рослинні олії (епоксидована

кокосова олія, олія з насіння рапсу або соєва олія), агенти, що запобігають утворенню піни, наприклад силіконова олія, консерванти, агенти, що регулюють в'язкість, зв'язувачі, речовини для підвищення клейкості, а також добрива або інші активні компоненти

Засобами, яким віддають перевагу, є такі, що містять (%=відсоток за вагою)

Емульговані концентрати

суміш сполук від 1 до 90%, переважно від 5 до 20%
сурфактант від 1 до 30%, переважно від 10 до 20%
рідкий носій від 5 до 94%, переважно від 70 до 85%

Дусти

суміш сполук від 0,1 до 10%, переважно від 0,1 до 5%
твердий носій від 99,9 до 90%, переважно від 99,9 до 99%

Концентрати суспензії

суміш сполук від 5 до 75%, переважно 10 до 50%
вода від 94 до 24%, переважно від 88 до 30%
сурфактант від 1 до 40%, переважно від 2 до 30%

Зволожувані порошки

суміш сполук від 0,5 до 90%, переважно від 1 до 80%
сурфактант від 0,5 до 20%, переважно від 1 до 15%
твердий носій від 5 до 95%, переважно від 15 до 90%

Грануляти

суміш сполук 0,1 до 30%, переважно від 0,1 до 15%
твердий носій від 99,5 до 70%, переважно від 97 до 85%

Винахід проілюстровано нижче Прикладами, що не обмежують об'єму винаходу

Приклади рецептур для приготування суміші гербіцидів формул I та II
(% = відсоток за вагою)

F1 Емульговані концентрати	а)	б)	в)	г)
суміш сполук	5%	10%	25%	50%
додecilбензолсульфонат кальцію	6%	8%	6%	8%
поліетоксильована касторова олія	4%	-	4%	4%
(36моль ЕО) октилфенол поліетоксилат	-	4%	-	2%
(7 – 8моль ЕО) циклогексанон	-	-	10%	20%
суміш ароматичних вуглеводнів C ₉ -C ₁₂	85%	78%	55%	16%

Емульсії будь-якої бажаної концентрації приготують шляхом розведення концентратів водою

F2 Розчини	а)	б)	в)	г)
суміш сполук	5%	10%	50%	90%
1 -метокси-3-(3-метокси-пропокси)пропан	-	20%	20%	-
поліетиленгліколь MG 400	20%	10%	-	-
N-метил-2-піролідон	-	-	30%	-
10% суміш ароматичних вуглеводнів C ₉ -C ₁₂	75%	60%		

Розчини придатні для використання у вигляді мікрокраплин

F3 Зволожувані порошки	а)	б)	в)	г)
суміш сполук	5%	25%	50%	80%
лігнінсульфонат натрію	4%	-	3%	-
лаурил сульфат натрію	2%	3%	-	4%
дізобутилнафталінсульфонат натрію	-	6%	5%	6%
Октилфенолполіетоксилат (7 – 8моль ЕО)	-	1%	2%	-
дрібнодисперсна кремнієва кислота	1%	3%	5%	10%
каолін	88%	62%	35%	-

Сполуку інтенсивно перемішують з допоміжними агентами, і цю суміш добре перетирають у відповідному млині з одержанням зволожуваних порошків, які розбавляють водою з одержанням суспензій будь-якої бажаної концентрації

F4 Покриті оболонкою грануляти	а)	б)	в)
суміш сполук	0,1%	5%	15%
дрібнодисперсна кремнієва кислота	0,9%	2%	2%
неорганічний носій (АЕ 0,1 - 1мм) наприклад, CaCO ₃ або SiO ₂	99,0%	93%	83%

Сполуку розчиняють у метилехлориді, розчин напильють на носій, а розчинник видаляють вакуумним способом

F5 Покриті оболонкою грануляти	а)	б)	в)
суміш сполук	0,1%	5%	15%
поліетиленгліколь MG 200	1,0%	2%	3%
дрібнодисперсна кремнієва кислота	0,9%	1%	2%
неорганічний носій, (АЕ 0,1 - 1мм) наприклад, CaCO ₃ або SiO ₂	98,0%	92%	80%

Тонко перетерту сполуку рівномірно змішують в міксері з носієм, зволоженим поліетиленгліколем. У такий спосіб отримують покриті оболонкою грануляти, позбавлені частинок пилу

F6 Формовані пресуванням	а)	б)	в)	г)
--------------------------	----	----	----	----

грануляти				
суміш сполук	0,1%	3%	5%	15%
лігнінсульфонат натрію	1,5%	2%	3%	4%
карбоксиметилцелюлоза	1,4%	2%	2%	2%
каолін	97,0%	93%	90%	79%

Сполуку змішують з допоміжними агентами і отриману суміш зволожують водою. Гранули формують пресуванням, після чого висушують гарячим повітрям.

F7 Дуети	а)	б)	в)
суміш сполук	0,1%	1%	5%
тапък	39,9%	49%	35%
каолін	60,0%	50%	60%

Підготовлені до використання дуети одержують шляхом змішування сполуки з носіями за допомогою відповідного млина.

F8 Концентрати суспензій	а)	б)	в)	г)
суміш сполук	3%	10%	25%	50%
етиленгліколь	5%	5%	5%	5%
нонлфенол поліетоксилат (15моль ЕО)	-	1%	2%	-
лігнінсульфонат натрію	3%	3%	4%	5%
карбоксиметилцелюлоза	1%	1%	1%	1%
37%-ий водний розчин формальдегіду	0,2%	0,2%	0,2%	0,2%
емульсія сіпіконоволі, %	0,8%	0,8%	0,8%	0,8%
вода	87%	79%	62%	38%

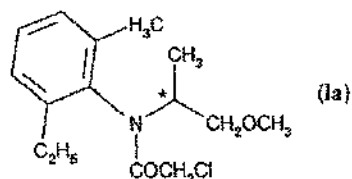
Тонко перетерту сполуку добре перемішують з допоміжними агентами до утворення однорідної маси, одержуючи концентрат суспензії, з якого шляхом розведення водою приготують суспензії будь-якої бажаної концентрації.

Часто більш доцільним є приготування активного компонента формули I та компонента формули II окремо, з подальшим змішуванням їх у відповідній ємкості з водою (у заданій пропорції) безпосередньо перед застосуванням.

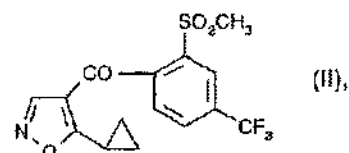
Приклади біологічної активності

Приклад Н1. У цьому тесті порівнювали дію композиції цього винаходу, що містить як активні компоненти енантіомер aRS,1'S(-)-N-(1'-метил-2'-

метоксietил)-N-хлороацетил-2-етил-6-метиланілін формули Ia

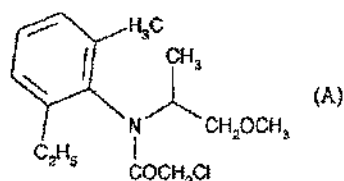


та сполуку формули II



з композицією, відомою з Research

Disclosure, квітень 1995/271, № 37242, що містить рацемічну сполуку N-(1'-метил-2'-метоксietил)-N-хлороацетил-2-етил-6-метиланілін формули A



і зазначену вище сполуку формули II

Застосування гербіцидів перед проростанням насіння кукурудзи. Бур'яни, що належать до однодольних і дводольних, та культурну рослину (кукурудзу Р3737) висівали у пластикові горщики зі звичайним ґрунтом. Одразу ж після висівання ґрунт обробляли тестованими речовинами у вигляді водної суспензії (500л води/га). Норми застосування для сполуки формули Ia або для її рацемату становили 1000, 500 та 250г/га, а норма застосування для сполуки формули II становила 120г/га. Тестовані рослини даці вирощували у теплиці в оптимальних умовах. Результати дослідження оцінювали через 4 тижні (у % ефективності 100%=рослини пов'яли, 0%=не спостерігалось фототоксичного ефекту). Результати наведено у Таблиці Б1.

Таблиця Б1

Активність гербіцидів на кукурудзяному полі

Рослини	Нова композиція			Композиція відомого рівня техніки		
	1000r/га Ia+120r/га II	500r/га Ia+120r/га II	250r/га Ia+120r/га II	1000r/га A+120r/га II	500r/га A+120r/га II	250r/га A+120r/га II
Кукурудза	10	5	0	20	10	5
Abutilon theophrasti	100	100	100	100	100	100
Amaranthus retroflexus	100	100	100	100	100	100

Таблиця Б1 (продовження)

Рослини	Нова композиція			Композиція відомого рівня техніки		
	1000r/ra Ia+120r/ra II	500r/ra Ia+120r/ra II	250r/ra Ia+120r/ra II	1000r/ra A+120r/ra II	500r/ra A+120r/ra II	250r/ra A+120r/ra II
<i>Euphorbia heterophylla</i>	100	98	98	95	95	95
<i>Panicum miliaceum</i>	100	100	100	100	100	100
<i>Setaria faberi</i>	100	100	100	100	100	100
<i>Sorghum bicolor</i>	100	100	100	100	100	100
<i>Xanthium canadense</i>	95	95	90	90	90	90

В Таблиці Б1 показано, що композиція цього винаходу має переваги щодо гербіцидної активності проти бур'янів видів *Euphorbia heterophylla* та *Xanthium canadense*. Було з'ясовано, що причиною цьому є підвищена гербіцидна активність енантіомера формули Ia у порівнянні з активністю рацемату формули A. Проте несподівано було виявлено, що - незважаючи на таку підвищену активність - шкідливий вплив нової композиції власне на кукурудзу зменшився на 50% у порівнянні з композицією відомого рівня техніки. При нормі застосування 250г/га сполуки формули Ia не спостерігали навіть жодного шкідливого впливу на культурні рослини, у той час як шкідливий вплив композиції відомого рівня техніки при тій

самій нормі застосування сягає вже 5%. Краща захищеність кукурудзи від шкідливого впливу при застосуванні саме нової композиції має надзвичайно велике практичне значення для сільськогосподарства. З урахуванням того, що нова композиція містить більш активний енантіомер у порівнянні з рацематом відомого рівня техніки, отриманий рівень захищеності є цілковитою несподіванкою. З погляду на цей факт під час гербіцидної обробки кукурудзи є значно менш небезпечним, ніж у випадку застосування рацемічної композиції.

Приблизно рівноцінні результати отримано для суміші сполуки формули I, де A являє собою A₂, зі сполукою формули II.