



УКРАЇНА

(19) UA (11) 78063 (13) C2

(51) МПК (2006)

A01N 25/00

A01N 25/04

A01N 35/06 (2007.01)

A01N 41/10 (2007.01)

A01N 41/04 (2007.01)

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

(54) ГЕРБІЦИДНА КОМПОЗИЦІЯ ТА СПОСІБ БОРОТЬБИ З БУР'ЯНАМИ

1

2

(21) а200500284

(22) 04.06.2003

(24) 15.02.2007

(86) РСТ/GB03/02428, 04.06.2003

(31) 0213638.0

(32) 13.06.2002

(33) GB

(46) 15.02.2007, Бюл. № 2, 2007 р.

(72) Пайпер Кетрін Джулія, GB, Сток Девід, GB,  
Холл Гевін Джон, GB, Саттон Пітер Бернард, GB

(73) СІНГЕНТА ЛІМІТЕД, GB

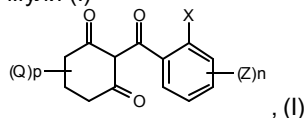
(56) WO 0143550, A2, 21.06.2006

WO 0219823, A2, 14.03.2002

WO 0221919, A1, 21.03.2002

(57) 1. Гербіцидна композиція, що включає:

і) 2-(заміщений бензоіл)-1,3-циклогександіон форми (I)



де X являє собою атом галогену, алкіл з нерозгалуженим або розгалуженим ланцюгом або алкоксильну групу, що містить до шести атомів вуглецю, які є необов'язково заміщеними однією або більше групами -OR<sup>1</sup> або одним або більше атомами галогену, або групу, вибрану з нітро, ціано, -CO<sub>2</sub>R<sup>2</sup>, -S(O)<sub>m</sub>R<sup>1</sup>, -O(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>OR<sup>1</sup>, -COR<sup>2</sup>, -NR<sup>2</sup>R<sup>3</sup>, -SO<sub>2</sub>NR<sup>2</sup>R<sup>3</sup>, -CONR<sup>2</sup>R<sup>3</sup>, -CSNR<sup>2</sup>R<sup>3</sup> та -OSO<sub>2</sub>R<sup>4</sup>, R<sup>1</sup> являє собою алкільну групу з нерозгалуженим або розгалуженим ланцюгом, яка містить до шести атомів вуглецю, які є необов'язково заміщеними одним або більше атомами галогену, R<sup>2</sup> та R<sup>3</sup> кожний незалежно являє собою атом водню або алкільну групу з нерозгалуженим або нерозгалуженим ланцюгом, яка містить до шести атомів вуглецю, які є необов'язково заміщеними одним або більше атомами галогену, R<sup>4</sup> являє собою алкільну, алкенільну або алкінільну групи з нерозгалуженим або розгалуженим ланцюгом, які містять до шести атомів вуглецю, що є необов'язково заміщеними одним або більше атомами галогену, або циклоалкільну групу, що міс-

тить від трьох до шести атомів вуглецю, кожний Z незалежно являє собою гало, нітро, ціано, S(O)<sub>m</sub>R<sup>5</sup>, OS(O)<sub>m</sub>R<sup>5</sup>, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)галоалкіл, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)галоалкокси, карбокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілкарбонілокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкоксикарбоніл, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілкарбоніл, аміно, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіламіно, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)діалкіламіно, що має незалежно визначену кількість атомів вуглецю у кожній алкільній групі, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкілкарбоніламіно, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкоксикарбоніламіно, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіламінокарбоніламіно, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)діалкіламінокарбоніламіно, який незалежно має визначену кількість вуглецевих атомів у кожній алкільній групі, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкоксикарбонілокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіламінокарбонілокси, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)діалкілкарбонілокси, фенілкарбоніл, заміщений фенілкарбоніл, фенілкарбонілокси, заміщений фенілкарбонілокси, фенілкарбоніламіно, заміщений фенілкарбоніламіно, фенокси або заміщений фенокси,

R<sup>5</sup> являє собою ціано, -COR<sup>6</sup>, -CO<sub>2</sub>R<sup>6</sup> або -S(O)<sub>m</sub>R<sup>7</sup>,

R<sup>6</sup> являє собою водень або алкільну групу з нерозгалуженим або розгалуженим ланцюгом, яка містить до шести атомів вуглецю,

R<sup>7</sup> являє собою (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)алкіл, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)галоалкіл, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)ціаноалкіл, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)циклоалкіл, необов'язково заміщений галогеном, ціано або (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілом, або феніл, необов'язково заміщений одним-трьома однаковими або різними замісниками, вибраними з галогену, нітро, ціано, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)галоалкілу, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкілу, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкокси або -S(O)<sub>m</sub>R<sup>8</sup>, R<sup>8</sup> представляє собою (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкіл,

кожний Q незалежно являє собою (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкіл або -CO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>, де R<sup>9</sup> являє собою (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)алкіл,

m дорівнює 0, 1 або 2,

n дорівнює 0 або є цілим числом від 1 до 4,

g дорівнює 1, 2 або 3, та

r дорівнює 0 або є цілим числом від 1 до 6, та

ii) органічну фосфатну, фосфонатну або фосфінатну допоміжну речовину у концентрації менше ніж 0,5 об. %, яку додано до резервуара для розпилення як допоміжну речовину, яку додано до резе-

(13) C2

(11) 78063

(19) UA

рвуара, що містить суміш, або коли додано у склад композиції, яка містить гербіцид, для одержання концентрації у резервуарі для розпилення, яка є меншою, ніж 0,5 об. %.

2. Гербіцидна композиція за п.1, в якій X являє собою хлор, бром, нітро, ціано, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкіл, -CF<sub>3</sub>, -S(O)<sub>m</sub>R<sup>1</sup> або -OR<sup>1</sup>.

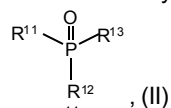
3. Гербіцидна композиція за будь-яким з пп.1 або 2, в якій Z являє собою незалежно хлор, бром, нітро, ціано, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>алкіл, -CF<sub>3</sub>, -OR<sup>1</sup>, OS(O)<sub>m</sub>R<sup>5</sup> або -S(O)<sub>m</sub>R<sup>5</sup>.

4. Гербіцидна композиція за будь-яким з пп.1-3, де n дорівнює 1 або 2.

5. Гербіцидна композиція за будь-яким з пп.1-4, де r дорівнює 0.

6. Гербіцидна композиція за будь-яким з пп.1-5, в якій сполука формули (I) вибрана з групи, яка складається з 2-(2'-нітро-4'-метилсульфонілбензоїл)-1,3-циклогександіону, 2-(2'-нітро-4'-метилсульфонілоксибензоїл)-1,3-циклогександіону, 2-(2'-хлор-4'-метилсульфонілбензоїл)-1,3-циклогександіону, 4,4-диметил-2-(4-метансульфоніл-2-нітробензоїл)-1,3-циклогександіону, 2-(2-хлор-3-етокси-4-метансульфонілбензоїл)-5-метил-1,3-циклогександіону та 2-(2-хлор-3-етокси-4-етансульфонілбензоїл)-5-метил-1,3-циклогександіону.

7. Гербіцидна композиція за будь-яким з пп.1-6, в якій фосфатна, фосфонатна або фосфінатна допоміжна сполука являє собою сполуку формули II



де R<sup>11</sup> являє собою алкоксигрупу, що містить від 4 до 20 атомів вуглецю або групу -[OCH<sub>2</sub>CHR<sup>14</sup>]<sub>t</sub>-OR<sup>15</sup>, в якій R<sup>14</sup> являє собою водень, метил або етил, t має значення від 0 до 50, а R<sup>15</sup> являє собою водень або алکیلну групу, що містить від 1 до 20

атомів вуглецю,

R<sup>12</sup> та R<sup>13</sup> незалежно представляють собою:

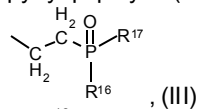
алکیلну або алкенільну групу, що містить від 4 до 20 вуглецевих атомів,

необов'язково заміщений феніл,

алкоксильну групу, що містить від 4 до 20 вуглецевих атомів,

групу -[OCH<sub>2</sub>CHR<sup>14</sup>]<sub>t</sub>-OR<sup>15</sup>,

групу формули (III)



де R<sup>16</sup> являє собою алкоксильну групу, що містить від 4 до 20 вуглецевих атомів або групу -[OCH<sub>2</sub>CHR<sup>14</sup>]<sub>t</sub>-OR<sup>15</sup>, а R<sup>17</sup> являє собою алکیلну групу, що містить від 4 до 20 вуглецевих атомів, необов'язково заміщений фенілом, алкоксильною групою, що містить від 4 до 20 вуглецевих атомів, або групою -[OCH<sub>2</sub>CHR<sup>14</sup>]<sub>t</sub>-OR<sup>15</sup>, та де t має значення від 0 до 10.

8. Гербіцидна композиція за п.7, в якій сполука формули (II) являє собою фосфат, в якому R<sup>11</sup>, R<sup>12</sup> та R<sup>13</sup> представляють собою алкоксильні групи.

9. Гербіцидна композиція за п.7, в якій сполука формули (II) являє собою фосфонат, в якому R<sup>11</sup> та R<sup>12</sup> обидва незалежно являють собою алкоксильні групи, а R<sup>13</sup> являє собою алкіл, алкеніл або необов'язково заміщену фенільну групу.

10. Гербіцидна композиція за п.7, в якій сполука формули (II) являє собою фосфінат, в якому R<sup>11</sup> являє собою алкоксильну групу, а R<sup>12</sup> та R<sup>13</sup> обидва незалежно являють собою алکیلну, алкенільну або необов'язково заміщену фенільну групу.

11. Спосіб боротьби з бур'янами, шляхом застосування до локусу, що містить бур'яни, гербіцидно ефективною кількістю композиції за будь-яким з пп.1-10.

Даний винахід відноситься до гербіцидної композиції, до її одержання та застосування. Зокрема, він відноситься до гербіцидної композиції, що демонструє поліпшену активність у порівнянні з композиціями рівня техніки.

Захист сільськогосподарських культур від бур'янів та іншої рослинності що інгібує ріст сільськогосподарських культур, представляє собою проблему, яка постійно існує у сільському господарстві. Для того, щоб вирішити цю проблему, дослідники у галузі синтетичної хімії створили значну кількість хімічних засобів та хімічних композицій, що є ефективними у боротьбі з таким небажаним ростом. Хімічні гербіциди багатьох типів були описані в літературі, їх велика кількість знаходиться у комерційному використанні. Комерційні гербіциди та деякі з них, що ще знаходяться на стадії розвитку, [описані у Pesticide Manual, 12-е видання, опубліковано в 2000 British Crop Protection Council].

Багато гербіцидів пошкоджують культурні рослини. Боротьба з бур'янами у культурі, що росте, таким чином, вимагає застосування так званих

"селективних" гербіцидів, які вибрані для того, щоб знищувати бур'яни, залишаючи при цьому непошкодженими сільськогосподарські культури. Декілька селективних гербіцидів є селективними у такій мірі, що знищують усі бур'яни та зовсім не зачіпають сільськогосподарські культури. На практиці застосування найбільш селективних гербіцидів насправді підтримує баланс між застосуванням достатньої кількості гербіциду для прийнятної боротьби з більшістю бур'янів та спричиненням тільки мінімального пошкодження сільськогосподарської культури.

Один важливий клас селективних гербіцидів представляє собою 2-(заміщений бензоїл)-1,3-циклогександіонові сполуки, що розкриті, серед інших [у патентах США №4,780,127, 4,938,796, 5,006,158 та 5,089,046] та посиленнях, що введені у ці заявки. Особливо бажаним 2-(заміщений бензоїл)-1,3-циклогександіоном є мезотрон, хімічна назва 2-(2-нітро-4-метилсульфонілбензоїл)-1,3-циклогександіон. Він відомий, головним чином, для застосування при проведенні селективної боротьби з бур'янами у посівах кукурудзи (маїсу) перед

тим, як сходи з'являються на поверхні ґрунту (перед сходовою обробкою), а також після цього (після сходової обробки).

[EP 0579052] розкриває агент для обробки, що містить принаймні один біоцид та активатор, який може бути, зокрема, фосфатом. [Патент США №2 927 014] розкриває застосування ряду органічних сполук фосфонату та фосфінату як гербіцидів. [WO 93/04585] розкриває гербіцидну композицію, що включає принаймні один фосфонат або фосфінат та принаймні одну сполуку, вибрану з фенмедифаму, десмедифаму, метамітрону, ленацилу, етофумезату та хлоридазону. [WO 94/18837] розкриває застосування специфічного фосфонату, біс(2-етилгексил)-2-етилгексилфосфонату, як допоміжної речовини для поліпшення біологічної поведінки вказаних гербіцидів. Проте, специфічне застосування фосфонату та фосфінату для поліпшення ефективності 2-(заміщений бензоїл)-1,3-циклогександіонової сполуки є повністю несподіваним.

Згідно з цим даний винахід забезпечує гербіцидну композицію, що включає:

i) 2-(заміщений бензоїл)-1,3-циклогександіон формули (I)



де X представляє собою атом галогену; алкіл з нерозгалуженим або розгалуженим ланцюгом або алкоксильну групу, що містить до шести атомів вуглецю, які є необов'язково заміщеними однією або більше групами  $-OR^1$  або одним або більше атомами галогену; або групу, вибрану з нітро, ціано,  $-CO_2R^2$ ,  $-S(O)_mR^1$ ,  $-O(CH_2)_tOR^1$ ,  $-COR^2$ ,  $-NR^2R^3$ ,  $-SO_2NR^2R^3$ ,  $-CONR^2R^3$ ,  $-CSNR^2R^3$  та  $-OSO_2R^4$ ;

$R^1$  представляє собою алкільну групу з нерозгалуженим або розгалуженим ланцюгом, яка містить до шести атомів вуглецю, які є необов'язково заміщеними одним або більше атомами галогену;

$R^2$  та  $R^3$  кожний незалежно представляє собою атом водню; або алкільну групу з нерозгалуженим або розгалуженим ланцюгом, яка містить до шести атомів вуглецю, які є необов'язково заміщеними одним або більше атомами галогену;

$R^4$  представляє собою алкільну, алкенільну або алкінільну групу з нерозгалуженим або розгалуженим ланцюгом, які містять до шести атомів вуглецю, що є необов'язково заміщеними одним або більше атомами галогену; або циклоалкільну групу, що містить від трьох до шести атомів вуглецю;

кожний Z незалежно представляє собою гало, нітро, ціано,  $S(O)_mR^5$ ,  $OS(O)_mR^5$ ,  $(C_1-C_6)$ алкіл,  $(C_1-C_6)$ алкокси,  $(C_1-C_6)$ галоалкіл,  $(C_1-C_6)$ галоалкокси, карбокси,  $(C_1-C_6)$ алкілкарбонілокси,  $(C_1-C_6)$ алкоксикарбоніл,  $(C_1-C_6)$ алкілкарбоніл, аміно,  $(C_1-C_6)$ алкіламіно,  $(C_1-C_6)$ діалкіламіно, що має незалежно встановлену кількість атомів вуглецю у кожній алкільній групі,  $(C_1-C_6)$ алкілкарбоніламіно,  $(C_1-C_6)$ алкоксикарбоніламіно,  $(C_1-C_6)$ алкіламінокарбоніламіно,  $(C_1-C_6)$ діалкіламінокарбоніламіно, який незалежно має встановлену кількість вуглецевих атомів у кожній алкільній групі,  $(C_1-C_6)$ алкоксикарбонілокси,  $(C_1-$

$C_6)$ алкіламінокарбонілокси,  $(C_1-C_6)$ діалкілкарбонілокси, фенілкарбоніл, заміщений фенілкарбоніл, фенілкарбонілокси, заміщений фенілкарбонілокси, фенілкарбоніламіно, заміщений фенілкарбоніламіно, фенокси або заміщений фенокси;

$R^5$  представляє собою ціано,  $-COR^6$ ,  $-CO_2R^6$  або  $-S(O)_mR^7$ ;

$R^6$  представляє собою водень або алкільну групу з нерозгалуженим або розгалуженим ланцюгом, яка містить до шести атомів вуглецю;

$R^7$  представляє собою  $(C_1-C_6)$ алкіл,  $(C_1-C_6)$ галоалкіл,  $(C_1-C_6)$ ціаноалкіл,  $(C_3-C_8)$ циклоалкіл, необов'язково заміщений галогеном, ціано або  $(C_1-C_4)$ алкілом; або феніл, необов'язково заміщений одним або трьома однаковими або різними замісниками, вибраними з галогену, нітро, ціано,  $(C_1-C_4)$ галоалкілу,  $(C_1-C_4)$ алкілу,  $(C_1-C_4)$ алкокси або  $-S(O)_mR^8$ ;

$R^8$  представляє собою  $(C_1-C_4)$ алкіл;

кожний Q незалежно представляє собою  $(C_1-C_4)$ алкіл або  $-CO_2R^9$ , де  $R^9$  представляє собою  $(C_1-C_4)$ алкіл;

m дорівнює 0, 1 або 2;

n дорівнює 0 або є цілим числом від 1 до 4;

t дорівнює 1, 2 або 3; та

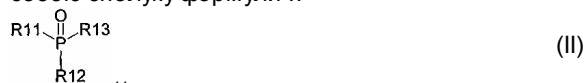
p дорівнює 0 або є цілим числом від 1 до 6; та

ii) органічну фосфатну, фосфонатну або фосфінатну допоміжну речовину у концентрації менше, ніж 0,5об.% при додаванні до резервуару для розпилення як допоміжної речовини, що додається до резервуару, що містить суміш, або коли вводиться у склад композиції, яка містить гербіцид, для одержання концентрації у резервуарі для розпилення, яка є меншою, ніж 0,5об.%.

Прийнятим є, коли X представляє собою хлор, бром, нітро, ціано,  $C_1-C_4$ алкіл,  $-CF_3$ ,  $-S(O)_mR^1$  або  $-OR^1$ ; кожний Z незалежно представляє собою хлор, бром, нітро, ціано,  $C_1-C_4$ алкіл,  $-CF_3$ ,  $OR^1$ ,  $-OS(O)_mR^5$  або  $-S(O)_mR^5$ ; n дорівнює 1 або 2; p дорівнює 0.

Бажано, коли 2-(заміщений бензоїл)-1,3-циклогександіон формули (I) вибраний з групи, яка включає 2-(2'нітро-4'-метилсульфонілбензоїл)-1,3-циклогександіон, 2-(2'нітро-4'-метилсульфонілоксибензоїл)-1,3-циклогександіон, 2-(2'-хлор-4'-метилсульфонілбензоїл)-1,3-циклогександіон, 4,4-диметил-2-{4-метансульфоніл-2-нітробензоїл}-1,3-циклогександіон, 2-(2-хлор-3-етокси-4-метансульфонілбензоїл)-5-метил-1,3-циклогександіону та 2-(2-хлор-3-етокси-4-етансульфонілбензоїл)-5-метил-1,3-циклогександіон.

Прийнято, коли фосфатна, фосфонатна або фосфінатна допоміжна речовина представляє собою сполуку формули II



де  $R^{11}$  представляє собою алкоксильну групу, що містить від 4 до 20 атомів вуглецю або групу  $-[OCH_2CHR^{14}]_t-OR^{15}$ , в якій  $R^{14}$  представляє собою водень, метил або етил, t має значення від 0 до 50, а  $R^{15}$  представляє собою водень або алкільну групу, що містить від 1 до 20 атомів вуглецю; а  $R^{12}$

та  $R^{13}$  незалежно представляють собою (i) алкільну або алкенільну групу, що містить від 4 до 20 вуглецевих атомів; (ii) необов'язково заміщений феніл; (iii) алкоксильну групу, що містить від 4 до 20 вуглецевих атомів або (iv) групу  $-\text{[OCH}_2\text{CHR}^{14}]_t\text{-OR}^{15}$ , як визначено в даній заявці; або (v) групу формули (III)



де  $R^{16}$  представляє собою алкоксильну групу, що містить від 4 до 20 вуглецевих атомів або групу  $-\text{[OCH}_2\text{CHR}^{14}]_t\text{-OR}^{15}$ , як визначено в даній заявці, а  $R^{17}$  представляє собою алкільну групу, що містить від 4 до 20 вуглецевих атомів, необов'язково заміщених фенілом, алкоксильною групою, що містить від 4 до 20 вуглецевих атомів або групою  $-\text{[OCH}_2\text{CHR}^{14}]_t\text{-OR}^{15}$ , як визначено у даній заявці; та де  $t$  має значення від 0 до десяти.

Термін "алкіл", як використовується у даній заявці, включаючи ті випадки, коли він використовується у виразах, таких як "алкокси", включає алкільні групи з лінійним або розгалуженим ланцюгом. Необов'язкові замісники, які можуть бути присутніми в необов'язково заміщених фенільних групах, включають  $\text{C}_{1-4}$  алкіл та галоген.

У першому втіленні винаходу забезпечується гербіцидна композиція, що включає 2-(заміщений бензоіл)-1,3-циклогександіон формули (I), як визначено в даній заявці вище, та фосфат формули (II), де  $R^{11}$ ,  $R^{12}$  та  $R^{13}$  усі незалежно представляють собою алкоксильні групи.

У другому втіленні винаходу забезпечується гербіцидна композиція, що включає 2-(заміщений бензоіл)-1,3-циклогександіон формули (I), як визначено в даній заявці вище, та фосфонат формули (II), де  $R^{11}$  та  $R^{12}$  обидва представляють собою незалежно алкоксильні групи, а  $R^{13}$  представляє собою алкіл, алкеніл або необов'язково заміщену фенільну групу.

У третьому втіленні винаходу забезпечується гербіцидна композиція, яка включає 2-(заміщений бензоіл)-1,3-циклогександіон формули (I), як визначено в даній заявці вище, та фосфінат формули (II), де  $R^{11}$  представляє собою алкоксильну групу, а  $R^{12}$  та  $R^{13}$  обидва незалежно представляють собою алкіл, алкеніл або необов'язково заміщену фенільну групу.

Необов'язкове алкоксилування естерних груп представлено групою  $-\text{[OCH}_2\text{CHR}^{14}]_t\text{-OR}^{15}$ , як визначено в даній заявці. Бажано, щоб значення  $t$  складало від 0 до 10 та більш бажано від 0 до 5. Якщо наявний інтервал ступенів алкоксилування, то  $t$  може представляти собою середнє значення і при цьому необов'язково є цілим числом. Подібно до цього, може мати місце змішане алкоксилування так, що у групі  $-\text{[OCH}_2\text{CHR}^{14}]_t$  присутні різні значення  $R^{14}$ . Бажано, щоб  $R^{15}$  представляв собою алкільну групу, що містить від 1 до 8 вуглецевих атомів. Якщо  $t$  дорівнює 0, то група  $-\text{[OCH}_2\text{CHR}^{14}]_t\text{-OR}^{15}$  перетворюється в алкокси, а коли  $t$  дорівнює 0, то група  $-\text{OR}^{15}$  переважно представляє собою алкокси, що містить від 4 до 20 вуглецевих атомів.

Коли сполука формули (II) представляє собою фосфат, то бажано, щоб кожна група  $R^{11}$ ,  $R^{12}$  та  $R^{13}$  представляла собою алкоксигрупу, що містить

від 4 до 10 вуглецевих атомів. Особливо бажано, щоб кожний з  $R^{11}$ ,  $R^{12}$  та  $R^{13}$  містив від 4 до 8 вуглецевих атомів. Бажані фосфати представляють собою три(2-етилгексил)фосфат та трибутилфосфат.

Коли сполука формули (II) представляє собою фосфонат, то бажано, щоб кожна група  $R^{11}$  та  $R^{12}$  представляла собою алкоксильну групу, що містить від 4 до 10 вуглецевих атомів, а  $R^{13}$  представляв собою алкільну групу, що містить від 4 до 10 вуглецевих атомів. Прийнятні фосфонати розкриті [в WO 98/00021], даний винахід також включає еквіваленти, коли релевантна довжина алкільного ланцюга є нижчою, ніж та, що розкрита [в WO 98/00021]. Особливо бажано, щоб кожний з  $R^{11}$ ,  $R^{12}$  та  $R^{13}$  містив від 4 до 8 вуглецевих атомів. Бажані фосфонати представляють собою біс-(2-етилгексил)-2-етилгексилфосфонат, біс-(2-етилгексил)-2-етилгексилфосфонат, та біс-бутилбутилфосфонат, зокрема, біс-(2-етилгексил)-2-етилгексилфосфонат.

Коли сполука формули (II) представляє собою фосфінат, то бажано, щоб  $R^{11}$  представляв собою алкоксильну групу, що містить від 4 до 10 вуглецевих атомів, а  $R^{12}$  та  $R^{13}$  обидва представляли собою алкільні групи, що містять від 4 до 10 вуглецевих атомів. Особливо бажано, щоб кожний  $R^{11}$ ,  $R^{12}$  та  $R^{13}$  містив від 4 до 8 вуглецевих атомів. Прийнятні фосфінати розкриті [в WO 98/00021], даний винахід також включає еквіваленти, в яких релевантна довжина алкільного ланцюга є нижчою, ніж та, що [описана в WO 98/00021].

Прийнятним є, якщо концентрація фосфату, фосфонату або фосфінату у резервуарі для розпилення знаходиться в межах від 0,01% до 0,49%, бажано в інтервалі від 0,025% до 0,49%, більш переважно від 0,05% до 0,48%, та найбільш бажано в інтервалі від 0,05% до 0,2%.

В контексті даного винаходу термін "гербіцидна композиція" призначений для позначення композицій концентрованого преміксу та до розведених композицій резервуарних сумішей.

Гербіцидні композиції згідно з даним винаходом можуть бути створені як преміксні концентрати, які розводять, розчиняють або диспергують у воді незадовго перед застосуванням. У даному винаході концентрат звичайно включає від 30 до 950 г/л 2-(заміщений бензоіл)-1,3-циклогександіону формули (I), бажано від 100 до 800 г/л, найбільш бажано від 150 до 500 г/л. Фосфатну, фосфонатну або фосфінатну допоміжну речовину додавали до композиції концентрату у ваговому співвідношенні гербіциду та фосфату, фосфонату або фосфінату від 25:1 та 1:25, зокрема, 10:1 та 1:10, більш бажано 1:5 та 5:1. Крім того, один або більше додаткових інгредієнтів, наприклад, другий гербіцид, можуть додаватися до композиції концентрату.

Альтернативно, гербіцидні композиції згідно з даним винаходом представляють собою розведені у резервуарі композиції для розпилення. Резервуарні композиції для розпилення можуть бути одержані шляхом розведення концентрату префіксу, як описано вище, до концентрації, яка необхідна, та додання будь-яких інших допоміжних речовин, які є необхідними. Альтернативно, резервуарна композиція для розпилення може бути одержана

шляхом розведення композиції концентрату, що включає тільки 2-(заміщений бензоїл)-1,3-циклогександіон формули (I) до необхідної концентрації, та послідовного додання необхідної кількості фосфату, фосфонату або фосфінату разом з будь-якими іншими необхідними допоміжними речовинами. Допоміжні речовини, звичайно, застосовують як частку від об'єму для розпилення, який застосовується на гектар. Об'єм води на гектар, звичайно, складає приблизно 200 літрів/га, але може варіювати від 50 і вище, ніж 3000, для спеціального застосування. Допоміжні речовини номінально застосовують при об'ємах від 0,05% до 1,0% об'єму, що розпилюється, на гектар. Якщо взяти 200л/га як середнє значення, то типові значення об'єму допоміжної речовини будуть, таким чином, знаходитися у межах від 100г (0,05%) до 2000г (1,0%). Типові кількості гербіциду коливаються в межах від 10г/га до 1кг. Таким чином, середній спеціаліст у даній галузі буде передбачувати співвідношення, які охоплюють такі типові кількості застосування як для активної, так і для допоміжної речовини. Такі співвідношення безпосередньо пов'язані зі співвідношенням (ваговим) сполуки формули (I) та сполуки формули (II), яке складає від 50:1 до 1:400. Бажано, щоб вагове співвідношення сполуки формули (I) та сполуки формули (II) складало від 25:1 до 1:25, та особливо від 10:1 до 1:10, та більш бажано від 1:5 до 5:1.

Якщо гербіцидна композиція згідно з винаходом представляє собою концентрат префіксу, то вона може бути створена у вигляді гранул, у вигляді порошків, здатних до змочування, суспензійних концентратів, концентратів, здатних до емульгування, гранульованих композицій, порошків або пудр, рідких композицій, розчинів, суспензій або емульсій. Такі композиції можуть містити від приблизно 0,5% до приблизно 95% або більше за вагою активного інгредієнту. Оптимальна кількість для будь-якої даної сполуки буде залежати від складу композиції, застосовуваного оснащення та природи рослин, з якими проводиться боротьба.

Порошки, здатні до змочування, знаходяться у формі тонкоподрібнених частинок, які легко диспергуються у воді або інших рідких носіях. Частинок містять активний інгредієнт, який знаходиться у твердому матриксі. Типові тверді матрикиси включають валяльну глину, каолінову глину, кремнезем та інші органічні та неорганічні тверді речовини, які легко змочуються. Порошки, які здатні змочуватися, звичайно, містять приблизно від приблизно 5% до приблизно 95% активного інгредієнту плюс невелика кількість змочувального, диспергуючого або емульгуючого агенту. Якщо рідкі сполуки формули II створені як сухі продукти, такі, як WP (або WG), то для композицій цього типу ставиться вимога абсорбувати/адсорбувати такі сполуки у/на прийнятних носіях.

Суспензійні концентрати є високо концентрованими суспензіями твердого гербіциду у рідкому носії, такому, як вода або олія.

Концентрати, здатні до емульгування, представляють собою гомогенні рідкі композиції, які диспергуються у воді або іншій рідині та можуть повністю складатися з активної сполуки з рідким або твердим емульгуючим агентом, або можуть

містити рідкий носій, такий, як ксилен, важкі ароматичні бензини, ізофорон та інші нелеткі органічні розчинники. При використанні ці концентрати диспергують у воді або іншій рідині та, звичайно, застосовують для обприскування площі, яка повинна оброблятися. Кількість активного інгредієнту може коливатися в межах від приблизно 0,5% до приблизно 95% концентрату.

Гранульовані композиції включають як екструдати, так і відносно великі частинки, при цьому вони, звичайно, застосовуються без розведення для обробки площі, для якої є бажано пригнічення рослинності. Типові носії для гранульованих композицій включають пісок, валяльну глину, атапульїтну глину, бентонітову глину, монморилонітову глину, вермикуліт, перліт та інші органічні або неорганічні матеріали, які абсорбують активну сполуку або які можуть бути вкриті активною сполукою. Гранульовані композиції, звичайно, містять від приблизно 5% до приблизно 25% активних інгредієнтів, які можуть включати поверхнево-активні агенти, такі, як важкі ароматичні бензини, керозен та інші фракції нафти, або рослинні олії; та/або склеювальні речовини, такі, як декстрини, клей або синтетичні смоли. Гранули, що здатні до емульгування у воді, можуть бути одержані за допомогою прийнятних засобів, які є добре відомими спеціалістами у даній галузі.

Порошки є сумішами активного інгредієнту, що вільні від рідин та містять тонко подрібнені тверді речовини, такі, як тальк, глини, борошно та інші органічні та неорганічні тверді речовини, що діють як диспергатори та носії.

Композиції, які відповідають за одержання змішаних продуктів, є особливо важливими, оскільки сполуку формули II, звичайно, застосовують в олії (або розчиненими в органічному розчиннику), при цьому похідні 2-(заміщений бензоїл)-1,3-циклогександіону формули (I) будуть у значній мірі нерозчинними у воді і, таким чином, найбільш легко їх можна одержувати як дисперсію у воді (або в олії). Таким чином, дисперсії багаточисленних фаз є прийнятними як композиції вибору.

Інші корисні композиції для гербіцидного застосування включають прості розчини активного інгредієнта у розчиннику, в якому він повністю розчиняється у бажаній концентрації, такі, як ацетон, алкілвані нафталіни, ксилен та інші органічні розчинники. Аерозолі під тиском, в яких дисперговано активний інгредієнт у тонко подрібненій формі в результаті випарювання диспергатора з низькою точкою кипіння, також можуть використовуватися.

Багато таких композицій включають змочувальні, диспергуючі або емульгуючі агенти. Приклади алкільних та алкіларильних сульфонатів та сульфатів та їх солі; багатоатомні спирти; поліетоксильовані спирти; естери та жирні аміни. Ці агенти, у разі використання, звичайно, включаються у кількості від 0,1 до 15% від ваги композиції.

Інші прийнятні допоміжні речовини представляють собою масляні концентрати (COC), які добре відомі для гербіцидів, та суміші мінеральних масел та неіонних сурфактантів, які є доступними, наприклад, як AGRI-DEX, PENETRATOR, та PENETRATOR PLUS, які одержують від Helena Chemical Company, HER-BMAX, який одержують

від UAP, ES CROP OIL PLUS, який одержують від Gromark, та CROP OIL PLUS, який одержують від Wilfarm, (83% парафінового масла, 17% емульгаторного сурфактанту). Інші можливі допоміжні речовини включають сечовину нітрат амонію, добриво, метильовану олію з насіння та сульфат амонію.

Кожна з вказаних композицій може бути одержана як упаковка, що містить гербіцид разом з іншими інгредієнтами композиції (інші активні інгредієнти, розріджувачі, емульгатори, сурфактанти, тощо). Композиції можуть також бути одержані за допомогою способу перемішування у резервуарі, при якому інгредієнти одержують окремо та поєднують їх у місті вирощування.

Композиції згідно з даним винаходом були продемонстровані як такі, що є особливо ефективними для боротьби з бур'янами, зокрема, при порівнянні з відповідною сполукою формули (I) при відсутності фосфату, фосфонату, фосфінату. Згідно з цим подальший аспект винаходу забезпечує спосіб боротьби з бур'янами, при цьому вказаний спосіб включає застосування гербіцидної кількості композиції згідно з винаходом до місця вирощування бур'янів.

Композиція згідно з винаходом може використовуватися проти великої кількості агрономічно важливих бур'янів, *Stellaria*, *Nasturtium*, *Agrostis*, *Digitaria*, *Avena*, *Setaria*, *Sinapis*, *Lolium*, *Solanum*, *Phaseolus*, *Echinochloa*, *Scirpus*, *Monochoria*, *Sagittaria*, *Bromus*, *Alopecurus*, *Sorghum halepense*,

*Rottboellia*, *Cyperus*, *Abutilon*, *Sida*, *Xanthium*, *Amaranthus*, *Chenopodium*, *Ipomoea*, *Chrysanthemum*, *Galium*, *Viola*, та *Veronica*. Для цілей даного винаходу термін „бур'яни" включає небажані види рослин, таких, як ті, що самовільно висіваються.

Боротьба означає знищення, пошкодження або інгібування росту бур'янів.

Термін „локус" призначений для включення ґрунту, насіння та проростків, а також зрілих рослин.

Переваги даного винаходу спостерігаються, коли композиція застосовується для знищення бур'янів у сільськогосподарській культурі, що вирощується, такий, як маїс (кукурудза). Перевага винаходу спостерігається при післясходовій обробці, але передсходова обробка також є можливою.

Даний винахід ілюструється наступним прикладом, в якому усі частини та проценти є ваговими, якщо інше не вказано.

#### Приклад 1

Оцінювали активність ряду композицій згідно з даним винаходом. Бур'янами були *Echinochloa crus-galli* (ECHCG), *Amaranthus tamariscinus* (AMARE), *Ipomoea hederacea* (IPOHE), *Polygonum convolvulus* (POLCO), *Xanthium strumarium*, (XANST), ????? (DIGSA), ????? (VIOAJR.) та ????? (BRAPL). Результати приведені у Таблиці. Продукти розпилювали у межах г/га (див. таблицю) в 200 л/га об'єму води та оцінювали через 21 день на біоефективність. Активність виражали як процент знижених бур'янів.

Таблиця

Порівняння активності мезотріонової кислоти разом зі стандартними допоміжними речовинами та активності мезотріонової кислоти разом зі сполукою формули (II)

Обробка	Кількість мезотріону г/га	ECHCG	XANST	AMARE	IPHE	POLCO	VIOAR	BRAPL	DIGSA
Мезотріонова кислота + 0,5% MSO	10		84	53	58	55			
	20	13	92	58	78	67			
	40	70	92	88	83	84			
	80	75	96	90	77	95			
	160	97	98	89	80	96			
	320	99							
Мезотріонова кислота + 1% СОС	10	73			63	20	53		
	20	80			80	50	73	10	95
	40	91			78	50	91	17,5	97
	80	90			92	90	96	60	100
	160							93,5	100
	320								
Мезотріонова кислота + 1%СОС + 2,5%UAN	10	47 80	88		35	55	35	50 70	75 88
	20 40	98	88 94		55 70	58 88	73 90	85,5	100
	80	100	96		80	97	96	95	100
	160	100	97		78	98			100
	320								
Мезотріонова кислота + 0,5% трибутилфосфату	10		96	84	70	82			
	20	45	96	88	84	70			
	40	55	96	90	80	88			
	80	88	99	97	78	99			
	160	95	98	95	87	99			
	320	99							
Мезотріонова кислота + 0,5% бис(2-етилгексил)-2-етилгексил фосфонату	10		98		68	80			
	20	93	96		75	97			100
	40	100	98		83	97			100
	80	100	99		85	98			100
	160	100	99		94	98			100
	320	100							100

Продовження таблиці

Мезотріонов а кислота + 0,075% біс(2-етилгексил)- 2-етилгексил фосфонату	10 20 40 80 160 320	88 79 93 94			63 75 89 93	65 73 78 77	33 73 85 97	28 40 78 88	98 100 100 100
Мезотріонов а кислота + 0,2% біс(2-етилгексил)-2- етилгексил фосфонату	10 20 40 80 160 320	83 96 95 95			80 78 90 90	63 90 88 89	53 99 95 95	57,5 75 98,5 94,5	100 100 100 100
Мезотріонов а кислота + 0,075% три(2- етилгексил)фосфонату	10 20 40 80 160 320	80 95 94 95			55 83 80 90	33 75 87 94	50 87 85	48 73 83 100	96 100 100 100
Мезотріонов а кислота + 0,2% три(2- етилгексил)фосфонату	10 20 40 80 160 320	91 95 96 97			65 73 90 92	55 80 97 94	68 78 93 95	48 73 83 100	100 100 100 100