



УКРАЇНА

(19) UA

(11) 46700

(13) C2

(51) 6 A01N25/32,37/22

МІНІСТЕРСТВО ОСВІТИ  
І НАУКИ УКРАЇНИДЕРЖАВНИЙ ДЕПАРТАМЕНТ  
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ  
ВЛАСНОСТІОПИС  
ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД(54) ГЕРБИЦИДНИЙ ПРЕПАРАТ СЕЛЕКТИВНОЇ ДІЇ ТА СПОСІБ СЕЛЕКТИВНОЇ БОРОТЬБИ З БУР'ЯНАМИ  
ТА ТРАВАМИ

1

2

(21) 95062613

(22) 01 06 1995

(24) 17 06 2002

(31) 1758/94-0

(32) 03 06 1994

(33) CH

(31) 2253/94-8

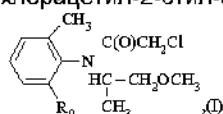
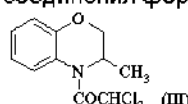
(32) 14 07 1994

(33) CH

(46) 17 06 2002, Бюл. № 6, 2002 р

(72) Глок Ютта, DE, Худетц Манфред, DE

(73) NOVARTIS AG, CH

(56) FR, A, 2514611 EP, A, 0077755 CR WOR-  
THING "The Pesticide Manual, 9th edition" 1991,  
THE BRITISH CROP PROTECTION COUNCIL, UK,  
Seite 61, Absatz 5(57) 1 Гербицидный препарат для селективного  
контроля за сорняками в посевах культурных рас-  
тений, содержащий действующее начало наряду с  
инертными носителями и добавками, отличаю-  
щийся тем, что в качестве действующего начала  
содержит гербицидно эффективное количество  
 $\alpha$ RS, 1'S(-)-N-(1'-метил-2'-метокси-этил)-N-  
хлорацетил-2-этил-6-метиланилина формулы (I)где R<sub>0</sub>-этил,  
и противогербицидно эффективное количество  
соединения формулы (III)2 Способ селективной борьбы с сорняками и тра-  
вами при возделывании полезных растений, пре-  
дусматривающий обработку культур или их посе-  
вных площадей одновременно или независимо  
друг от друга эффективным количеством гербици-  
да и противогербицидно эффективным количе-  
ством антидота, отличающийся тем, что в качестве  
гербицида используют соединение формулы (I) по  
п 1, а в качестве антидота - соединение формулы  
(III) по п 13 Способ по п 2, отличающийся тем, что соеди-  
нение формулы (I) по п 1 используют в количест-  
ве 0,1-4кг/га и соединение формулы (III) по п 1 - в  
количестве 0,005-0,5кг/га4 Способ по п 2, отличающийся тем, что его  
используют при возделывании кукурузы

Настоящее изобретение относится к герби-  
цидному препарату избирательного действия для  
борьбы с травами и сорняками при возделывании  
культурных растений, в частности при возделыва-  
нии кукурузы, содержащему гербицид и антагони-  
стическое средство (антидот) и предохраняющему  
полезные растения, а не сорняки от фитотоксиче-  
ского действия гербицида, а также к применению  
этого препарата или комбинации гербицид / анти-  
дот для борьбы с сорняками в посевах полезных  
культур

При использовании гербицидов в значитель-  
ной степени могут повреждаться также культур-

ные растения, что бывает обусловлено, например,  
дозировкой того или иного гербицида и типом его  
применения, видом культурных растений, особен-  
ностями почвы и климатическими условиями, как  
продолжительность светового дня, температура и  
количество выпадаемых осадков

Для решения этой и других аналогичных про-  
блем уже предлагались различные вещества для  
использования их в качестве антидотов, которые  
способны нейтрализовать вредное воздействие  
гербицида на культурное растение, т.е. защитить  
его от этого воздействия и в то же время практи-  
чески не снизить гербицидный эффект по отноше-

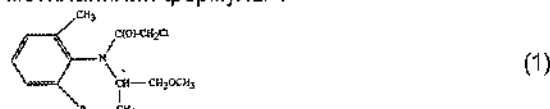
(13) C2

(11) 46700

(19) UA

нию к сорнякам, против которых оно направлено. При этом было обнаружено, что предложенные до настоящего времени антидоты как по отношению к культурным растениям, так и по отношению к гербициду и частично в зависимости от типа применения во многих случаях по своему действию узко специфичны, иными словами, определенный антидот пригоден лишь для одного определенного культурного растения и для соответствующего гербицида, относящегося к определенному классу веществ.

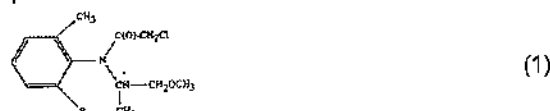
Было обнаружено, что некоторые хлор- и дихлорацетамиды могут эффективно использоваться для защиты культурных растений от фитотоксического действия соединения  $\alpha\text{RS},1'\text{S}(-)\text{N}-(1'-\text{метил}-2'-\text{метоксиэтил})-\text{N}-\text{хлорацетил}-2\text{-этил}-6\text{-метиланилин}$  формулы 1



где  $\text{R}_0$  обозначает метил или этил

Тем самым согласно изобретению предлагается гербицидный препарат избирательного действия, отличающийся тем, что наряду с обычными вспомогательными инертными веществами, используемыми для изготовления соответствующих препаративных форм, таких, как наполнители, растворители и смачивающие агенты, он содержит в качестве действующего вещества смесь из

а) соответствующего, обладающего гербицидным действием количества соединения формулы 1



где  $\text{R}_0$  обозначает метил или этил, и

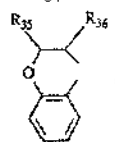
б) соответствующего, обладающего противогербицидным действием количества соединения формулы 2



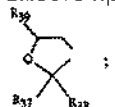
где R представляет собой остаток формулы



в которой  $\text{R}_{33}$  и  $\text{R}_{34}$  независимо друг от друга обозначают  $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-алкил}$  либо  $\text{C}_2\text{-C}_6\text{-алкенил}$ , или  $\text{R}_{33}$  и  $\text{R}_{34}$  оба вместе представляют собой



$\text{R}_{35}$  и  $\text{R}_{36}$  независимо друг от друга обозначают водород либо  $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-алкил}$ , или  $\text{R}_{33}$  и  $\text{R}_{34}$  оба вместе представляют собой

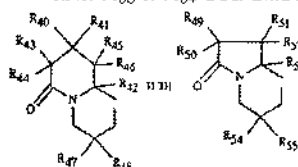


$\text{R}_{37}$  и  $\text{R}_{38}$  независимо друг от друга обозначают  $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкил}$ , или  $\text{R}_{37}$  и  $\text{R}_{38}$  оба вместе представляют собой  $-(\text{CH}_2)_5-$ .

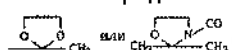
$\text{R}_{39}$  обозначает водород,  $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкил}$  либо



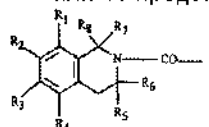
или  $\text{R}_{33}$  и  $\text{R}_{34}$  оба вместе представляют собой



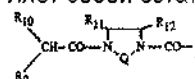
и  $\text{R}_{40}$ ,  $\text{R}_{41}$ ,  $\text{R}_{42}$ ,  $\text{R}_{43}$ ,  $\text{R}_{44}$ ,  $\text{R}_{45}$ ,  $\text{R}_{46}$ ,  $\text{R}_{47}$ ,  $\text{R}_{48}$ ,  $\text{R}_{49}$ ,  $\text{R}_{50}$ ,  $\text{R}_{51}$ ,  $\text{R}_{52}$ ,  $\text{R}_{53}$ ,  $\text{R}_{54}$  и  $\text{R}_{55}$  независимо друг от друга обозначают водород либо  $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкил}$ , или R представляет собой остаток формулы



или R представляет собой остаток формулы

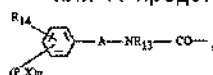


где  $\text{R}_1$ ,  $\text{R}_2$ ,  $\text{R}_3$  и  $\text{R}_4$  независимо друг от друга обозначают водород,  $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкил}$ ,  $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкоксигруппу}$  или  $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-галлоалкил}$ ,  $\text{R}_5$ ,  $\text{R}_6$ ,  $\text{R}_7$  и  $\text{R}_8$  независимо друг от друга обозначают водород,  $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкил}$  либо  $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-галлоалкил}$ , или R представляет собой остаток формулы



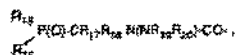
где  $\text{R}_9$  обозначает  $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкил}$  либо галоген,  $\text{R}_{10}$  обозначает галоген,  $\text{R}_{11}$  и  $\text{R}_{12}$  независимо друг от друга обозначают водород или  $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкил}$ , и Q обозначает  $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкилен}$  либо замещенный алкилом  $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкилен}$ ,

или R представляет собой остаток формулы

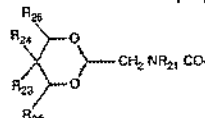


где  $\text{R}_{14}$  обозначает водород, галоген,  $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкил}$ , диоксиметил,  $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкокси}$ ,  $\text{C}_2\text{-C}_4\text{-алкенилокси}$ ,  $\text{C}_2\text{-C}_4\text{-алкинилокси}$  или циано- $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкил}$ , R обозначает  $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкил}$ ,  $\text{C}_2\text{-C}_4\text{-алкенил}$ ,  $\text{C}_2\text{-C}_4\text{-алкинил}$ ,  $\text{C}_3\text{-C}_8\text{-циклоалкил}$ ,  $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкокси-}\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкил}$ ,  $\text{C}_2\text{-C}_4\text{-алкенокси-}\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкил}$ ,  $\text{C}_2\text{-C}_4\text{-алкенокси-}\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкил}$ ,  $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкилтио-}\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкил}$ ,  $\text{C}_2\text{-C}_4\text{-алкенилтио-}\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкил}$ ,  $\text{C}_2\text{-C}_4\text{-алкинилтио-}\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкил}$ ,  $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкилсульфинил-}\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкил}$ ,  $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкилсульфонил-}\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкил}$ , галоген- $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкил}$ , циано- $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкил}$ , 2,2-ди- $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкокси-}\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкил}$ , 1,3-диоксолан-2-ил- $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкил}$ , 1,3-диоксолан-4-ил- $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкил}$ , 2,2-ди- $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкил-}1,3\text{-диоксолан-4-ил-}\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкил}$ , 1,3-диоксан-2-ил- $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкил}$ , 2-бензпиранил- $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкил}$ ,  $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкоксикарбонил}$  либо  $\text{C}_2\text{-C}_4\text{-алкенилоксикарбонил}$  или тетрагидрофур-фурил- $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкил}$ , группа R-X также обозначает галоген- $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкил}$ , X обозначает O, S, SO либо  $\text{SO}_2$ , n обозначает 1, 2 либо 3, A обозначает  $\text{C}_1\text{-C}_8\text{-углеводородный радикал}$  или  $\text{C}_1\text{-C}_8\text{-углеводородный радикал}$ , замещенный на алкоксигруппу, алкилтио, фтор, циано либо галогеналкил, и  $\text{R}_{13}$  обозначает водород,  $\text{C}_1\text{-C}_5\text{-углеводородный радикал}$  или  $\text{C}_1\text{-C}_5\text{-углеводородный радикал}$ , замещенный на алкоксигруппу, полиалкоксигруппу, галоген, циано либо трифторметил,  $\text{C}_3\text{-C}_8\text{-циклоалкил}$ ,  $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-алкил-}\text{C}_3\text{-}$

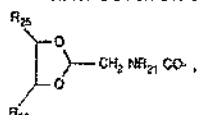
C<sub>3</sub>-циклоалкил, ди-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, 1,3-диоксопан-2-ил-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, 1,3-диоксопан-4-ил-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, 1,3-диоксан-2-ил-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, фурил-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, тетрагидрофурил-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил или представляет собой остаток формулы -NHCO<sub>2</sub>R<sub>01</sub>, -CH<sub>2</sub>CO<sub>2</sub>R<sub>01</sub>, -CH(CH<sub>3</sub>)CO<sub>2</sub>R<sub>01</sub> либо -CH(R<sub>02</sub>)-C(R<sub>03</sub>) = NOR<sub>04</sub>, где R<sub>01</sub> обозначает метил, этил, пропил, изопропил либо аллил, R<sub>02</sub> и R<sub>03</sub> обозначают каждый соответственно водород либо C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил и R<sub>04</sub> обозначает водород, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-алкенил либо C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-алкинил, или R представляет собой остаток формулы (H<sub>5</sub>C<sub>2</sub>O)<sub>2</sub>P(O)CH<sub>2</sub>NHCO-



где R<sub>15</sub> и R<sub>16</sub> независимо друг от друга обозначают гидроксильную группу, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, арил, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-алкенилокси, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-алкинилокси, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-галогеналкокси, C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-алкоксиалкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-цианоалкокси, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-фенилалкокси либо арилоксигруппу или арилоксигруппу, замещенную на галоген, циано, нитро либо C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкокси, R<sub>17</sub> обозначает водород, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил либо фенил или фенил, замещенный на галоген, циано, нитро либо C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкоксигруппу, R<sub>18</sub> обозначает водород либо C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, R<sub>19</sub> обозначает водород или представляет собой остаток формулы -COCX<sub>1</sub>X<sub>2</sub>-R<sub>06</sub> либо замещенный на галоген алкенильный остаток с числом атомов углерода 2 - 4 в алкенильном фрагменте, где X<sub>1</sub> и X<sub>2</sub> независимо друг от друга обозначают водород либо галоген, или представляет собой остаток формулы -COOR<sub>07</sub> либо -COR<sub>08</sub> или C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкильный, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-алкенильный либо C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-фенилалкильный остаток, который может быть замещен в фенильном кольце на галоген, циано, нитро либо C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкоксигруппу, и R<sub>20</sub> обозначает водород, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-алкенил либо C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-алкинил, R<sub>06</sub> обозначает водород, галоген либо C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-алкил, R<sub>07</sub> обозначает C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-фенилалкил или C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-фенилалкил, замещенный в фенильном фрагменте на галоген, циано, нитро либо C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкоксигруппу, и R<sub>08</sub> обозначает C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-алкенил, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-алкинил, фенил, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-фенилалкил или C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-фенилалкил, замещенный в фенильном фрагменте на галоген, циано, нитро либо C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкоксигруппу, или R представляет собой остаток формулы



или остаток формулы



где R<sub>21</sub> обозначает метил, этил, пропил, 1-метилэтил, 2-пропенил, 2-бутенил, 1,1-диметил-2-пропенил, 2-пропинил либо 2-метил-2-пропинил, и R<sub>22</sub>, R<sub>23</sub>, R<sub>24</sub> и R<sub>25</sub> независимо друг от друга обозначают водород либо метил, и Y обозначает хлор, или Y обозначает водород, если R представляет собой остаток формулы (H<sub>5</sub>C<sub>2</sub>O)<sub>2</sub>P(O)CH<sub>2</sub>NHCO-

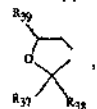
Названные в связи с соединениями формулы 2 алкильные остатки могут быть линейными или разветвленными и представлять собой метил, этил, пропил, бутил, пентил и гексил, а также их разветвленные изомеры. Соответствующие алкенильные остатки являются производными выше-названных алкильных остатков. В качестве арилокси рассматриваются прежде всего фенил- и нафтилокси. Под углеводородными радикалами имеются в виду одновалентные либо двухвалентные, насыщенные либо ненасыщенные линейные либо разветвленные или насыщенные либо ненасыщенные циклические радикалы из углерода и водорода, как, например, алкил, циклоалкил, алкенил, алкинил, циклоалкенил и фенил.

Предметом настоящего изобретения является далее применение препарата по изобретению для борьбы с сорняками и травами в посевах полезных растений, в частности в посевах кукурузы.

Предпочтительными для применения в препарате согласно изобретению соединениями формулы 2 являются те из них, в которых R представляет собой остаток формулы



где R<sub>33</sub> и R<sub>34</sub> оба вместе представляют собой



R<sub>37</sub> и R<sub>38</sub> независимо друг от друга обозначают C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, или R<sub>37</sub> и R<sub>38</sub> оба вместе обозначают -(CH<sub>2</sub>)<sub>5</sub>-, и R<sub>39</sub> обозначает водород, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил или



Примеры особенно предпочтительных соединений формулы 2 представлены в нижеследующих таблицах 1 и 2

Таблица 1. Соединения формулы II

Соед. №	R <sub>33</sub>	R <sub>34</sub>	R <sub>33</sub> + R <sub>34</sub>	(B)
1 001	CH <sub>3</sub> -CH=CH-	CH <sub>2</sub> =CH-CH <sub>2</sub> -		
1 002	-	-		
1 003	-	-		
1 004	-	-		
1 005	-	-		
1 006	-	-		
1 007	-	-		

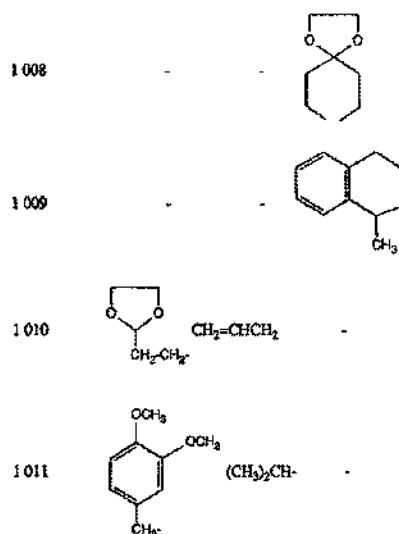
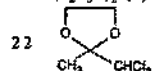
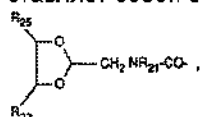


Таблица 2 Соединения формулы II

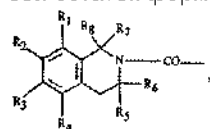
21  $(C_2H_5O)_2P(O)-CH_2-NHCO-CH_2-Cl$ 

Другую группу предпочтительных соединений формулы 2 образуют те из них, в которых R представляет собой остаток формулы



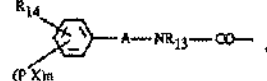
где R<sub>21</sub> обозначает метил, этил, пропил, 2-пропенил либо 2-бутенил, а R<sub>22</sub> и R<sub>25</sub> являются водородом. Среди названных особенно предпочтительно соединение, где R<sub>21</sub> обозначает 2-пропенил.

К предпочтительным относятся также соединения формулы 2, в которой R представляет собой остаток формулы



где R<sub>1</sub>-R<sub>8</sub> независимо друг от друга обозначают водород или C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил. Прежде всего имеются в виду такие соединения, где R<sub>1</sub>-R<sub>7</sub> обозначают водород, а R<sub>8</sub> является метилом.

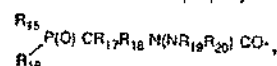
В другой группе особо предпочтительных соединений R представляет собой остаток формулы



где R<sub>14</sub> обозначает водород, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил либо C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкоксигруппу, R обозначает C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-алкенил либо C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-алкинил, X обозначает O либо S, n обозначает 1, A представляет собой C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-углеводородный радикал и R<sub>13</sub> обозначает водород или представляет собой C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub>-углеводородный радикал. Особенно предпочтительными среди названных являются те соединения формулы 2, в которых R<sub>14</sub> обозначает C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкоксигруппу, R обозначает C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, X является O, A обозначает C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкилен и R<sub>13</sub> обозначает C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил. Особый интерес представляет

соединение с R<sub>14</sub>, обозначающим метокси, R, обозначающим метил, A, обозначающим метилен, и R<sub>13</sub>, обозначающим i-пропил.

Другая группа предпочтительных соединений формулы 2 отличается тем, что R представляет собой остаток формулы



где R<sub>15</sub> и R<sub>16</sub> независимо друг от друга обозначают гидроксильную группу, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил либо C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкоксигруппу, R<sub>17</sub> и R<sub>18</sub> независимо друг от друга обозначают водород либо C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, и R<sub>19</sub> является водородом или представляет собой остаток формулы -COOR<sub>07</sub>, где R<sub>07</sub> обозначает C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, и R<sub>20</sub> обозначает водород либо C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил. Особенно предпочтительны значения R<sub>15</sub> и R<sub>16</sub> в качестве C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкоксигруппы, R<sub>17</sub> и R<sub>18</sub> в качестве водорода, R<sub>19</sub> в качестве остатка формулы -COOR<sub>07</sub>, где R<sub>07</sub> обозначает C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-алкил, и R<sub>20</sub> в качестве водорода. Наиболее важную роль играет соединение, в котором R<sub>15</sub> и R<sub>16</sub> обозначают i-пропилокси, а R<sub>19</sub> представляет собой -COOC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>.

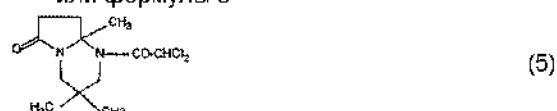
Особо следует выделить средства, отличающиеся тем, что в качестве соединения формулы 2 они содержат соединение формулы 3



или формулы 4



или формулы 5



Применяемое согласно изобретению соединение формулы 1 и его получение описаны, например, в патенте США US-A-5002606. Используемые в препаратах по изобретению соединения формулы 2 и их получение известны из ряда публикаций, как, например, патенты США A-4971618, US-A-3959304, USA-4256481, US-A-4708735, US-A-4846880, европейские заявки EP-A-149974, EP-A-304409, EP-A-31686, EP-A-54278, EP-A-23305, EP-A-143078, EP-A-163607, EP-A-126710, а также патентная заявка Германии DE-A-2948535.

Изобретение относится также к способу избирательной борьбы с сорняками при возделывании полезных культур, состоящему в том, что полезные растения, их посадочно-посевной материал, как семена или черенки, или же их посевные площади одновременно либо независимо друг от друга обрабатывают соответствующим, обладающим гербицидным действием количеством соединения формулы 1 и соответствующим, обладающим противогербицидным действием количеством соединения формулы 2.

Среди культурных растений, которые благодаря соединениям формулы 2 могут быть защищены от вредного воздействия упомянутого выше

гербицида, в первую очередь следует назвать те из них, которые играют важную роль в пищевом или текстильном секторе, например, сахарный тростник и прежде всего просо и кукуруза, а также рис и другие виды зерновых, как пшеница, рожь, ячмень и овес

Среди сорняков, с которыми ведется борьба, можно назвать как однодольные, так и двудольные растения

Под посевными площадями имеются в виду почвенные ареалы с уже растущими на них культурными растениями или засеянные семенами этих растений, равно как и площади, предназначенные для возделывания этих культур

Антидот формулы 2 в зависимости от цели применения может предназначаться для предварительной обработки посевного материала (протравливание семян или черенков) или для внесения в почву до либо после сева. Указанный антидот может применяться либо сам по себе, либо вместе с гербицидом также для предвсходовой или послевсходовой обработки растений. Поэтому обработку растений или посевного материала антидотом можно проводить в принципе независимо от времени обработки гербицидом. Но обработку растений гербицидом и антидотом можно осуществлять также одновременно, используя для этого, например, смесь из одной емкости

Соотношение между используемым количеством антидота и гербицида в значительной степени зависит от типа применения. Так, при обработке полей, осуществляемой либо смесью антидота и гербицида из одной емкости, либо обоими компонентами раздельно, соотношение антидот / гербицид составляет, как правило, от 1 : 100 до 1 : 1, предпочтительно 1 : 50 – 1 : 10

При полевой обработке количество антидота на 1 га составляет, как правило, 0,001 - 5,0 кг/га, предпочтительно 0,001 - 0,5 кг/га. Количество гербицида выбирают преимущественно в пределах от 0,001 до 10 кг/га, предпочтительно однако от 0,005 до 5 кг/га

Препараты по изобретению могут применяться во всех распространенных в сельском хозяйстве методах, как, например, предвсходовая или послевсходовая обработка, протравливание семян и т. д.

При протравливании семян количество антидота на 1 кг семян составляет, как правило, 0,001 - 10 г, предпочтительно 0,05 - 2 г. Если антидот применяют в жидком виде, проводя обработку до высева в период набухания семян, то целесообразно использовать растворы антидота, содержащие действующее вещество в концентрации от 1 до 10 000, предпочтительно от 100 до 1000 част./млн

Для получения готовых для практического применения препаративных форм, как, например, эмульсионные концентраты, пасты для намазывания, растворы для непосредственного разбрызгивания и разбавляемые растворы, разбавленные эмульсии, порошки для опрыскивания, растворимые порошки, опылывающие средства, гранулаты или микрокапсулы, соединения формулы 2 или комбинации из соединений формулы 2 и гербицидов формулы 1 целесообразно с помощью обыч-

ных вспомогательных средств, широко используемых в технологии изготовления препаративных форм, перерабатывать в соответствующие композиции

Вышеперечисленные композиции приготавливают по известной методике, например, путем тщательного перемешивания и / или измельчения действующих веществ с соответствующими добавками, как, например, растворители, твердые наполнители и т. д. Кроме того, при получении композиций могут использоваться дополнительно поверхностно-активные соединения (так называемые тензиды)

В качестве растворителей можно рекомендовать ароматические углеводороды, предпочтительно фракции C<sub>8</sub>-C<sub>12</sub>, как, например, ксилоловые смеси или замещенные нафталины, эфиры фталевой кислоты, как дибутил- либо диоктилфталат, алифатические углеводороды, как циклогексан или парафины, спирты и гликоли, а также их простые и сложные эфиры, как этанол, этиленгликоль, этиленгликольмонометиловый либо - этиловый эфир, кетоны, как циклогексанон, сильно полярные растворители, как N-метил-2-пирролидон, диметилсульфоксид либо диметилформамид, а также при определенных условиях эпоксициклические растительные масла, как эпоксициклическое масло кокосового ореха либо соевое масло, или вода

В качестве наполнителей, например, для препаратов для опылывания и диспергируемых порошков, используют преимущественно муку горных пород, как кальцит, тальк, каолин, монтмориллонит или аттапульгит. Для улучшения физических свойств могут добавляться также высокодисперсные кремневая кислота либо высокодисперсные, обладающие абсорбционной способностью полимеризаты. В качестве зернистых адсорбционных наполнителей для гранулятов могут использоваться пористые типы, как, например пемза, кирпичная крошка, сепиолит или бентонит, в качестве несорбционных наполнителей могут рассматриваться, например, кальцит или песок. Кроме вышеперечисленных, может применяться большое число других, предварительно гранулированных материалов неорганического либо органического происхождения, в частности доломит или измельченные остатки растений

В качестве поверхностно-активных соединений в зависимости от вида антидота и при определенных условиях также и от гербицида могут рассматриваться неионогенные, катионоактивные и / или анионоактивные тензиды, обладающие хорошими эмульгирующими, диспергирующими и смачивающими свойствами. Под тензидами следует понимать также смеси поверхностно-активных веществ

В качестве анионных тензидов могут выступать как так называемые водорастворимые мыла, так и водорастворимые синтетические поверхностно-активные соединения

В качестве вышеназванных мыл можно назвать соли щелочных и щелочноземельных металлов или при определенных условиях замещенные аммониевые соли высших жирных кислот (C<sub>10</sub>-C<sub>22</sub>), как, например, натриевые и калиевые

соли масляной либо стеариновой кислоты, или смесей натуральных жирных кислот, которые можно получать, например, из масла кокосового ореха или топленого животного сала. Далее следует упомянуть также метилтауриновые соли жирных кислот.

Чаще, однако, применяют так называемые синтетические тензиды, прежде всего жирные сульфонаты, жирные сульфаты, сульфонируемые производные бензимидазола или алкиларилсульфонаты.

Жирные сульфонаты или жирные сульфаты представлены, как правило, в виде солей щелочных и щелочноземельных металлов или при определенных условиях в виде замещенных солей аммония и имеют алкильный остаток с числом С-атомов 8 - 22, причем алкил включает в себя также алкильный фрагмент ацильных остатков, например, натриевую или калиевую соль лигнинсульфокислоты, эфира додецилсерной кислоты или полученной из натуральных жирных кислот смеси из жирных спиртов и сульфатов. Сюда же относятся также соли эфиров серной кислоты и сульфокислот адуктов реакции жирного спирта и этиленоксида. Сульфонируемые производные бензимидазола содержат предпочтительно 2-сульфокислотные группы и остаток жирной кислоты с числом С-атомов 8 - 22. Алкиларилсульфонаты представляют собой, например, натриевые, калиевые или триэтаноламинные соли додецилбензолсульфокислоты, дибутилнафталинсульфокислоты или же продукта конденсации нафталинсульфокислоты и формальдегида.

Далее можно назвать также соответствующие фосфаты, как, например, соли эфира фосфорной кислоты адукта реакции р-нонилфенола и (4 - 14)-этиленоксида или фосфолипиды.

Применение в качестве неионных поверхностно-активных веществ могут находить в первую очередь производные полигликолевого эфира алифатических либо циклоалифатических спиртов, насыщенных либо ненасыщенных жирных кислот и алкилфенолов, которые могут содержать от 3 до 30 гликольэфирных групп и 8 - 20 атомов углерода в (алифатическом) углеводородном остатке и 6 - 18 атомов углерода в алкильном остатке алкилфенолов.

Другими пригодными для использования в указанных целях поверхностно-активными веществами являются водорастворимые, содержащие 20 - 250 этиленгликольэфирных групп и 10 - 100 пропиленгликольэфирных групп адукты полиэтиленоксида, а также полипропиленгликоль, этилендиаминополипропиленгликоль и алкилполипропиленгликоль с числом атомов углерода 1 - 10 в алкильной цепи. Названные соединения содержат обычно на каждую пропилен-гликолевую единицу 1 - 5 этиленгликолевых единиц.

В качестве примеров неионных поверхностно-активных веществ следует упомянуть также нонилфенолполиэтоксигликолы, полигликолевый эфир касторового масла, адукты реакции полипропилена и полиэтиленоксида, трибутилфеноксиполиэтоксигликолы, полиэтиленгликоль и октилфеноксиполиэтоксигликолы.

Далее можно назвать также эфиры жирных

кислот полиоксиэтиленсорбитана, как полиоксиэтиленсорбитан-триолеат.

При использовании катионных поверхностно-активных веществ речь идет прежде всего о четвертичных солях аммония, содержащих в качестве N-заместителя по крайней мере один алкильный остаток с числом С-атомов 8 - 22 и имеющих в качестве других заместителей низшие, при определенных условиях галогенированные алкильные, бензильные либо низшие гидроксиалкильные остатки. Соли представлены предпочтительно в виде галогенидов, метилсульфатов или этилсульфатов, как, например, хлорид стеарилтриметиламмония либо бромид бензилди-(2-хлорэтил)-этиламмония.

Применяемые в технологии приготовления композиций поверхностно-активные вещества, которые могут использоваться также в препаратах по изобретению, описаны в частности в следующих публикациях: "Mc Cutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual", изд-во MC Publishing Corp., Ridgewood, Нью-Джерси, 1981, Stache, H., "Tensid-Taschenbuch", изд-во Carl Hanser Verlag, Мюнхен / Бена, 1981, и J. Ash, "Encyclopedia of Surfactants", том I - III, изд-во Chemical Publishing Co., Нью-Йорк, 1980-81.

Агрохимические композиции содержат, как правило, 0,1 - 99 мас. %, прежде всего 0,1 - 95 мас. % действующего вещества формулы 2 или смеси действующих веществ антидот / гербицид, 1 - 99,9 мас. %, прежде всего 5 - 99,8 мас. % твердого либо жидкого вспомогательного вещества и 0 - 25 мас. %, прежде всего 0,1 - 25 мас. % поверхностно-активного вещества.

В то время как торговля предлагает преимущественно концентрированные средства, конечный потребитель применяет их в разбавленном виде.

Для получения специальных эффектов препараты могут содержать также другие добавки, как стабилизаторы, пеногасители, регуляторы вязкости, связующие вещества, адгезивы, а также удобрения или же какие-либо другие действующие вещества, как, например, имеющиеся в продаже хлорацетанилиды, как фронтир, метазахлор, ацетохлор, алахлор, метолахлор или бутахлор.

Для применения соединений формулы 2 или содержащих эти соединения препаратов в целях защиты культурных растений от вредного действия гербицида формулы 1 используются различные методы и различная технология, как, например, следующие:

#### 1 Протравливание семян

а) Протравливание семян с помощью приготовленного в виде порошка для опрыскивания действующего вещества формулы 2, осуществляемое путем встряхивания в емкости до равномерного распределения по поверхности семян (сухое протравливание). При этом применяют приблизительно 1 - 500 г действующего вещества формулы 2 (4 г - 2 кг порошка для опрыскивания) на 100 кг семян.

б) Протравливание семян эмульсионным концентратом из действующего вещества формулы 2 по методу а) (мокрое протравливание).

в) Протравливание, осуществляемое погруже-

нием, семян в раствор из 100 - 1000 част/млн действующего вещества формулы 2 в течение 1 - 72 часов и при определенных условиях последующей сушкой семян (протравливание погружением)

Протравливание семян или обработка пророщенного сеянца относятся по своей сути к предпочтительным методам, так как в этом случае обработка действующим веществом полностью направлена на одну определенную культуру. Как правило, антидот применяют в количестве 1 - 1000г, предпочтительно 5 - 250г на 100кг семян, причем в зависимости от методики, позволяющей производить добавку других действующих веществ или микроэлементов, указанная концентрация не является предельной и может варьироваться как в ту, так и в другую сторону (повторное протравливание)

#### 2 Обработка смесью из одной емкости

В этих случаях применяют жидкую смесь из антидота и гербицида (количественное соотношение обоих компонентов выбирают в пределах от 10 : 1 до 1 : 100), причем количество гербицида составляет 0,01 - 10кг на 1га. Обработку такой смесью проводят до или после посева

#### 3 Обработка по посевной борозде

Антидот в виде эмульсионного концентрата, порошка для опрыскивания или в виде гранулята вносят в открытую засеянную борозду, а затем после заделывания борозды обычным способом осуществляют предвсходовую обработку гербицидом

4 Контролируемое выделение действующего вещества. Действующее вещество формулы И наносят в виде раствора на минеральные гранулированные наполнители или на полимеризованные грануляты (мочевина/формальдегид) и затем оставляют сохнуть. При определенных условиях грануляты могут покрываться оболочкой (грануляты в оболочке), которая обеспечивает возможность дозированного выделения действующего вещества через определенные интервалы времени

Механизм действия препаратов по изобретению поясняется на нижеследующих примерах

Примеры препаративных форм из смесей соединения формулы 1 и антидота формулы 2 (% = массовые проценты)

Ф1 Эмульсионные концентраты	а)	б)	в)	г)
Смесь из активных веществ	5%	10%	25%	50%
Са-додецилбензолсульфонат	6%	8%	6%	8%
Полигликолевый эфир касторового масла (36 молей ОЭ)	4%	-	4%	4%
Октилфенол-полигликолевый эфир (7 - 8 молей ОЭ)	-	4%	-	2%
Циклогексанон	-	-	10%	20%
Смесь из ароматических углеводородов C <sub>9</sub> -C <sub>12</sub>	85%	78%	55%	16%

Из таких концентратов разбавлением водой могут быть получены эмульсии в любой необходимой концентрации

Ф2 Растворы	а)	б)	в)	г)
Смесь из действующих ве-	5%	10%	50%	90%

ществ

Дипропиленгликоль-метиповый эфир	-	20%	20%	-
Полиэтиленгликоль MG 400	20%	10%	-	-
N-метил-2-пирролидон	-	-	30%	10%
Смесь из ароматических углеводородов C <sub>9</sub> -C <sub>12</sub>	75%	60%	-	-

Эти растворы могут применяться в виде мельчайших капель

Ф3 Порошки для опрыскивания	а)	б)	в)	г)
Смесь из действующих веществ	5%	25%	50%	80%
Na - лигнинсульфонат	4%	-	3%	-
Na - лаурилсульфат	2%	3%	-	4%
Na - диизобутилнафталин-сульфонат	-	6%	5%	6%
Октилфенол-полигликолевый эфир (7-8 молей ОЭ)	-	1%	2%	-
Высокодисперсная кремневая кислота	1	3%	5%	10%
Каолин	88%	62%	35%	-

Действующее вещество тщательно перемешивают с добавками, после чего измельчают в соответствующей мельнице. Таким путем получают порошки для опрыскивания, из которых разбавлением водой могут быть получены суспензии в любой необходимой концентрации

Ф4 Грануляты в оболочке	а)	б)	в)
Смесь из действующих веществ	0,1%	5%	15%
Высокодисперсная кремневая кислота	0,9%	2%	2%
Неорганический наполнитель (Ø 0,1 - 1мм) как, например, CaCO <sub>3</sub> или SiO <sub>2</sub>	99,0%	93%	83%

Действующее вещество растворяют в хлористом метиле, напыскивают на наполнитель, после чего растворитель выпаривают в вакууме

Ф5 Грануляты в оболочке	а)	б)	в)
Смесь из действующих веществ	0,1%	5%	15%
Полиэтиленгликоль MG 200	1,0%	2%	3
Высокодисперсная кремневая кислота	0,9%	1%	2%
Неорганический наполнитель (Ø 0,1 - 1мм) как, например, CaCO <sub>3</sub> или SiO <sub>2</sub>	98,0%	92%	80%

Тонко измельченное действующее вещество равномерно наносят в смесителе на увлажненный полиэтиленгликолем наполнитель. Таким путем получают беспыльные грануляты в оболочке

Ф6 Экструдированные грануляты	а)	б)	в)	г)
Смесь из действующих веществ	0,1%	3%	5%	15%
Na - лигнинсульфонат	1,5%	2%	3%	4%
Карбоксиметилцеллюлоза	1,4%	2%	2%	2%
Каолин	97,0%	93%	90%	79%

Действующее вещество перемешивают с добавками, измельчают и увлажняют водой. Затем эту смесь экструдуют, после чего сушат в воздушном потоке

Ф7 Препараты для опыливания	а)	б)	в)
Смесь из действующих ве-	0,1%	1%	5%

ществ				
Тальк	39,9%	49%	35%	
Каолин	60,0%	50%	60%	

Готовый для использования препарат для опыливания получают путем перемешивания действующего вещества с наполнителями и измельчения с помощью соответствующей мельницы

Ф8 Суспензионные концентраты	а)	б)	в)	г)
Смесь из действующих веществ	3%	10%	25%	50%
Этиленгликоль	5%	5%	5%	5%
Нонилфенол-полиглицерольный эфир (15 молей ОЭ)	-	1%	2%	
Na-лигнинсульфонат	3%	3%	4%	5%
Карбоксиметилцеллюлоза	1%	1%	1%	1%
37%-ный водный раствор формальдегида	0,2%	0,2%	0,2%	0,2%
Эмульсия из силиконового масла	0,8%	0,8%	0,8%	0,8%
Вода	87%	79%	62%	38%

Тонко измельченное действующее вещество тщательно перемешивают с добавками. Таким путем получают суспензионный концентрат, из которого разбавлением водой могут быть получены суспензии в любой требуемой концентрации.

Пример 1. Предварительное фитотоксическое действие гербицидов формулы 1 и смесей из гербицида и антидота формулы 2 на кукурузу.

В пластмассовые горшочки с обычной землей высевают кукурузу. Сразу же после посева производят опрыскивание испытуемыми субстанциями в виде водной суспензии (из расчета 500 л воды на 1 га). Названную суспензию приготавливают из одной из вышеприведенных композиций Ф1 - Ф8. Применяемое количество гербицида формулы 1

составляет 4000, 3000 и 2000 г/га. Соотношение между антидотом №1 006 (см. таблицу 1) и гербицидом составляет 1 : 18, 1 : 24 и 1 : 30. Затем опытные растения помещают в теплицу, где выращивают их в оптимальных условиях. Через 22 дня, в течение которых проводится эксперимент, определяют фитотоксическое действие гербицида на кукурузу (фитотоксичность в %).

а) Применяемое количество гербицида 4000 г/га

Соотношение гербицид / антидот	Фитотоксичность в %
без антидота	65
18 : 1	20
24 : 1	20
30 : 1	15

б) Применяемое количество гербицида 3000 г/га

Соотношение гербицид / антидот	Фитотоксичность в %
без антидота	55
18 : 1	0
24 : 1	0
30 : 1	0

в) Применяемое количество гербицида 2000 г/га

Соотношение гербицид / антидот	Фитотоксичность в %
без антидота	25
18 : 1	0
24 : 1	0
30 : 1	0

Приведенные результаты показывают, что с помощью соединений формулы 2 повреждения культурных растений, обусловленные применением гербицида, удается существенно снизить.