

Даний винахід відноситься до способу придушення росту бур'янів шляхом поступового нанесення на поверхневий шар середовища для вирощування, або вивільнення в ньому, гербіциду на основі бензоїлізоксазолу, та до композицій для застосування в способі.

Застосування ізоксазолів для боротьби з бур'янами описано в європейських патентних публікаціях №№0418175, 0487357, 0527036 та 0560482. Гербіцидна активність дикетонітрилів (ДКН), що можуть бути утворені з ізоксазолів, також описана в європейських патентних публікаціях №№0213892, 0496630 та 0496631 та міжнародній публікації №WO 95/25099. Після нанесення гербіцидів на основі ізоксазолу, вони можуть розкладатися до діонів, зокрема до сполук дикетонітрилу (ДКН). Це перетворення, як правило, є необоротним. Сполуки ДКН звичайно також є гербіцидами. Вони, як правило, більш розчинні у воді, чим гербіциди на основі ізоксазолу, та можуть проникати в ґрунтовий профіль після дощу.

Було виявлено, що модифікуванню шляху, яким наносять гербіциди на основі ізоксазолу, відношення ізоксазолу до ДКН в середовищі для вирощування, такому як ґрунт, може бути змінено на користь ізоксазолу, тобто збільшення відношення ізоксазолу до ДКН.

Було виявлено, що підтримуючи відношення ізоксазолу до ДКН на користь ізоксазолу в поверхневому шарі ґрунту, наприклад під час періоду від нанесення ізоксазолу до укорінення культури, можна забезпечити поліпшений контроль за бур'янами. Більш того, вибірковість стосовно культури може бути поліпшена, та ризик вимивання та вилучування може бути знижений.

Мета даного винаходу - забезпечити спосіб нанесення та/або композицію, що зменшують переміщення (розповзання) ізоксазолу та ДКН через ґрунт та утримують сполуки в ґрунті, оточуючому, переважно безпосередньо оточуючому, точку нанесення ізоксазолу.

Інша мета даного винаходу - забезпечити спосіб та/або композицію, які забезпечують доставку більш низьких індивідуальних рівнів доз гербіцидів на основі ізоксазолу при збереженні (а іноді й вдосконаленні) гербіцидної ефективності.

Додатковою метою даного винаходу є забезпечення композиції, що містить ізоксазол, з поліпшеною активністю у відношенні видів бур'янів та/або поліпшеною вибірковістю стосовно сільськогосподарських культур.

Мети винаходу можуть бути досягнуті в цілому або частково даним винаходом.

Відомо, що ізоксазоли привносять свою гербіцидну активність у рослини шляхом перетворення в сполуки ДКН. Тому можна припустити, що було б вигідно наносити ізоксазол таким способом, який прискорює його перетворення в ДКН або сприяє цьому. Заявники знайшли, що істина в протилежному.

Даний винахід пропонує спосіб придушення росту бур'янів в осередку у твердому середовищі для вирощування, що включає обробку осередку композицією, яка містить гербіцид на основі ізоксазолу, щоб забезпечити поступову або послідовну доставку або вивільнення гербіциду на основі ізоксазолу в поверхневий шар середовища.

Середовище для вирощування включає компост, але переважно є ґрунтом.

Осередком переважно є місце вирощування культури, наприклад, де культуру сіють та культивують.

Поверхневим шаром, як правило, є шар від поверхні до глибини 10см, переважно до глибини 5см, більш переважно до глибини 3см.

Відповідно до особливості винаходу, спосіб включає нанесення на осередок, наприклад, де культуру сіють та культивують, послідовних малих доз гербіцидів на основі ізоксазолу. Наприклад, нормальне дозування може бути розділене на два або більше, наприклад 2-5, звичайно рівних порцій та нанесене з тимчасовими інтервалами, кожне нанесення після першого здійснюють, наприклад, через 1-4 дні, переважно через 1 день після попереднього.

Відповідно до додаткової ознаки винаходу спосіб включає обробку осередку композицією з уповільненим вивільненням, яка містить гербіцид на основі ізоксазолу.

Композиція з уповільненим вивільненням, що є особливістю винаходу, може представляти, наприклад, інкапсульовану композицію, яка містить ізоксазол як такий або містить його композицію. Композиції з уповільненим вивільненням можуть бути отримані відомими способами.

Інкапсульований продукт може мати тверду зовнішню оболонку, яка містить інертний матеріал, який звичайно не має істотної гербіцидної активності.

Інкапсульований ізоксазол відповідно до даного винаходу може містити гранули, які містять похідне ізоксазолу формули (I), кожна з таких гранул інкапсульована твердою плівкою, яка містить інертний матеріал, який сам по собі не має істотної гербіцидної активності.

Переважно інертним матеріалом є водорозчинний полімерний матеріал, модифікований обробкою для додання йому власне кажучи нерозчинності у воді.

Розчинні матеріали, що можуть бути використані, включають: складний кополіефір; полівініловий спирт; поліакрилат; полікарбоксилат; желатин; полісульфонат, наприклад полістирил-полісульфони, білок, поліетиленоксид; модифікований або немодифікований крохмаль; целюлозу, наприклад карбоксиметилцелюлозу; декстран, мальтозу, алкіл-, гідроксиалкіл-, карбоксиалкіл-целюлозу; простий полівініловий ефір; полі(2,4-діетил-6-тріазолетилен); полі(вінілсульфонову кислоту), поліангідрид, низькомолекулярний сечовино-формальдегідний полімер, низькомолекулярний меламіно-формальдегідний полімер, поліметакрилат, наприклад полі(алкілціаноакрилат), полі(ізобутилціаноакрилат), полі(2-гідроксиетилметакрилат), поліакрилову кислоту або її гомолог; низькомолекулярні амфіфілі; низькомолекулярні полімерні амфіфілі; полімолочну кислоту; глютамінову кислоту; дендримери (зверхрозгалужені полімери); фосфоліпіди, наприклад дистеароїлфосфатидилхолін, діолеїлфосфатидилетаноламін, дипальмітоїлфосфатидилхолін, дипальмітоїлфосфатидилгліцерин, фосфатидилетаноламін, фосфатидилінозит, ліпопротеїн, напівтверді полі(ортоєфір)полікарбоксилати, гідрогелі. Матеріали можуть бути у формі, наприклад, твердих ліпідних нано/мікросфер, мікросфер зі складного поліефіру, нанокапсул, ніосом, ліпосом, полімерних міцел. Олія може бути використана для полегшення одержання емульсії з малими розмірами часток та для інгібування агрегації.

Переважно, водорозчинним матеріалом є складний кополієфір, наприклад герол, що є кополімером, наприклад, 5-сульфо-мононатрієвої солі 1,3-бензолдикарбонової кислоти, полімер з 1,3-бензолдикарбоновою кислотою, 1,4-бензолдикарбоновою кислотою, 1,2-етандіолом, 2,2'-[1,2-етандіілбіс(окси)]біс[етанолом] та 2,2'-оксибіс[етанолом]. Водорозчинні матеріали можуть бути різними по молекулярній масі та можуть включати олігомери.

Інертний водорозчинний полімер звичайно осаджують шляхом об'єднання (шляхом комплексоутворення або змішування) з матеріалом, що сам по собі не солюбілізує вищевказаний водорозчинний полімер. Матеріали, що викликають осадження полімеру, включають розчинні солі лужноземельних металів (наприклад кальцію). Об'єднання може бути модульоване доведенням рН водного розчину полімеру, що солюбілізує іони (зазначеної лужноземельної сполуки), що викликають осадження несолюбілізованого на той момент полімеру, щоб інкапсулюють частки активного матеріалу. рН може бути доведений за допомогою, наприклад, оцтової кислоти. Осадження також може бути індуковане шляхом підбору розчинника або розчинників без необхідності об'єднання з іншим матеріалом.

Розмір гранул активного матеріалу похідного ізоксазолу формули (I) складає звичайно від 0,1 до 50мкм, переважно від 1 до 20мкм.

Товщина покриття з матеріалу, що інкапсулює, складає звичайно від 0,1 до 50мкм, переважно від 1 до 20мкм.

Гранули інкапсульованого похідного 4-бензоїлізоксазолу формули (I), відповідно до даного винаходу, можуть бути, наприклад, у порошкоподібному стані або в рідкій або твердій сполуці, які містяться всередині основи (чи носія для нанесення).

Композиції даного винаходу поліпшують вивільнення гербіциду на ділянці в ґрунті, на який їх наносять, та переміщення в результаті впливу дощової води або поливу зменшується. Забезпечується помітне поліпшення спадної трансміграції активного інгредієнту з ділянки безпосереднього нанесення (зона, заражена насіннями бур'яну) через ґрунтовий профіль.

Композиції даного винаходу забезпечують спосіб регулювання вивільнення гербіциду в діапазоні типів ґрунтів та едафічних умов шляхом модифікації співвідношень ізоксазол:матеріал носія.

Застосування композицій даного винаходу дозволяє більш ефективно використовувати гербіцид, що утримується на ділянці застосування на ґрунті, наприклад у зоні, зараженій насіннями бур'яну; таким чином, кількість гербіциду, який наносять, може бути зменшена. Крім того, гербіцид утримується на ділянці зони, зараженій насіннями бур'яну, протягом більш тривалого періоду часу, чим звичайний.

Локалізація гербіциду в зоні, зараженій насіннями бур'яну, поліпшує вибірковість стосовно видів сільськогосподарських культур, наприклад кукурудзи.

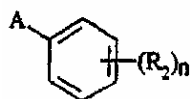
Композиції даного винаходу забезпечують спосіб зниження швидкості вивільнення гербіцидів, таких як ізоксазоли, у ґрунті, сповільнюючи тим самим загальну швидкість розкладання. Інкапсулювання в матричному носії підвищує стабільність гербіцидів, тому що вони захищені від компонентів, які можуть промотувати розкладання, таких як волога або мікробна активність.

Під терміном "нанесення перед проростанням" мається на увазі нанесення на ґрунт, в якому присутні насіння або сходи бур'янів, до появи сходів культури. Один приклад нанесення перед проростанням відомий як "передпосівна обробка" (ППО) ("pre-plant incorporated"), де гербіцид вводять у ґрунт перед посівом культури. Інший приклад, коли гербіцид наносять на поверхню ґрунту після висівання культури. Під терміном "листяна активність" мається на увазі гербіцидна активність, вироблена нанесенням на повітряні або відкриті для впливу частини бур'янів, які з'явилися над поверхнею ґрунту.

Як правило, норма нанесення гербіцидів на основі 4-бензоїлізоксазолу формули (I) у композиціях даного винаходу складає від 0,005кг до 0,5кг гербіцидно активної сполуки, переважно від 0,015кг до 0,2кг гербіцидно активної сполуки, більш переважно від 0,02кг до 0,12кг гербіцидно активної сполуки, ще більш переважно від 0,05кг до 0,09кг гербіцидно активної сполуки на гектар. Коли використовують послідовні малі дози гербіциду на основі ізоксазолу, як описано раніше, зазначені вище норми нанесення можуть бути розділені.

Спосіб по винаходу звичайно застосовують в осередку перед проростанням бур'янів та культурної рослини. Переважно осередок спочатку культивують та/або обробляють, щоб видалити існуючі бур'яни. Наприклад, може бути використаний гербіцид, що щент спалює, такий як гліфозат.

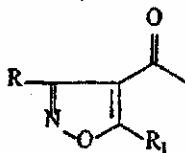
Приклади гербіцидів, рухливість яких у ґрунті контролюється композиціями даного винаходу, включають похідні 4-бензоїлізоксазолу загальної формули (I):



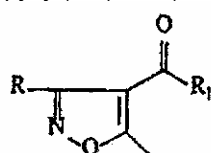
(I)

де:

A представляє групу (A-1) або (A-2):



(A-1)



(A-2)

де:

R представляє атом водню або атом галогену; пряму або розгалужену алкільну, або алкенільну, або

алкінільну групу, яка містить аж до шести атомів вуглецю, що необов'язково заміщена одним або більше атомами галогену; циклоалкільну групу, яка містить від 3 до 6 атомів вуглецю, необов'язково заміщену однієї або більше групами R^5 , одним або більше атомами галогену або групою $-CO_2R^3$, або групу, обрану з $-CO_2R^3$, $-COR^5$, ціано, нітро, $-CONR^3R^4$ та $-S(O)_kR^{13}$;

R^1 представляє алкільну, алкенільну або алкінільну групу, пряму або розгалужену, яка містить аж до шести атомів вуглецю, що необов'язково заміщена одним або більше атомами галогену, або циклоалкільну групу, що містить від трьох до шести атомів вуглецю, необов'язково заміщену однієї або більше групами R^5 або одним або більше атомами галогену;

R^2 представляє атом галогену; пряму або розгалужену алкільну, алкенільну або алкінільну групу, що містить аж до шести атомів вуглецю, яка необов'язково заміщена одним або більше атомами галогену; пряму або розгалужену алкільну групу, що містить аж до шести атомів вуглецю, яка необов'язково заміщена однієї або більше групами $-OR^5$, або групу, обрану з нітро, ціано, $-CO_2R^5$, $-S(O)_pR^6$, $-O(CH_2)_mOR^5$, $-COR^5$, $-NR^{11}R^{12}$, $-N(R^8)SO_2R^7$, $-N(R^8)CO_2R^7$, $-OR^5$, $-OSO_2R^7$, $-SO_2NR^3R^4$, $-CONR^3R^4$, $-CSNR^3R^4$, $-(CR^9R^{10})_t-S(O)_qR^7$ та $-SF_5$; або дві групи R^2 на сусідніх атомах вуглецю фенільного кільця можуть разом з атомами вуглецю, до яких вони приєднані, утворювати 5-7-членне насичене або ненасичене гетероциклічне кільце, яке містить у кільці аж до трьох гетероатомів, обраних з азоту, кисню та сірки, причому це кільце необов'язково заміщене однієї або більше групами, обраними з галогену, нітро, $-S(O)_pR^{13}$, C_{1-4} -алкілу, C_{1-4} -алкокси, C_{1-4} -галогеналкілу, C_{1-4} -галогеналкокси, $=O$ (або його 5- або 6-членного циклічного ацетала) та $=NOR^3$, зрозуміло, що атом сірки, коли він присутній у кільці, може бути у формі групи $-SO-$ або $-SO_2-$;

n представляє ціле число від одного до п'яти; коли n більше, ніж один, групи R^2 можуть бути однаковими або різними;

R^3 та R^4 , кожен незалежно, представляють атом водню або пряму або розгалужену алкільну групу, яка містить аж до шести атомів вуглецю, що необов'язково заміщена одним або більше атомами галогену;

R^5 представляє пряму або розгалужену алкільну групу, яка містить аж до шести атомів вуглецю, що необов'язково заміщена одним або більше атомами галогену; або пряму або розгалужену алкенільну або алкінільну групу, яка містить від двох до шести (переважно від трьох до шести) атомів вуглецю, що необов'язково заміщена одним або більше атомами галогену;

R^6 та R^7 , які можуть бути однаковими або різними, кожен представляє R^5 або феніл, необов'язково заміщений від однієї до п'яти групами, які можуть бути однаковими або різними, обраними з атома галогену, прямої або розгалуженої алкільної групи, яка містить аж до шести атомів вуглецю, що необов'язково заміщена одним або більше атомами галогену, нітро, ціано, $-CO_2R^5$, $-S(O)_pR^{13}$, $-NR^{11}NR^{12}$, $-OR^5$ та $-CONR^3R^4$;

R^8 , R^9 та R^{10} , кожний, представляють атом водню або R^6 ;

R^{11} та R^{12} , кожний, представляють водень або R^5 ;

R^{13} представляє пряму або розгалужену алкільну групу, яка містить аж до шести атомів вуглецю, що необов'язково заміщена одним або більше атомами галогену;

k , p та q незалежно представляють величини нуль, один або два;

m представляє один, два або три;

t представляє ціле число від одного до чотирьох, коли t більше, ніж один, групи R^9 та R^{10} можуть бути однаковими та різними;

або її сільськогосподарсько прийнятну сіль або комплекс металу.

У деяких випадках, групи $R-R^{13}$ можуть давати оптичні та/або стереоізомери. Усі такі форми охоплюються даним винаходом.

Під терміном "сільськогосподарсько прийнятні солі" маються на увазі солі, катіони або аніони яких відомі та прийнятні в області техніки для формування солей для застосування в сільському господарстві або садівництві. Переважно, солі є водорозчинними. Придатні кислотнo-адитивні солі, утворені сполуками формули (I), які містять аміногрупи, включають солі з неорганічними кислотами, наприклад гідрохлориди, сульфати, фосфати та нітрати, та солі з органічними кислотами, наприклад з оцтовою кислотою. Підходящими солями, утвореними сполуками формули (I), що є кислотними, тобто сполуками, що містять одну або більше карбоксигруп, з основами, включають солі лужних металів (наприклад натрію та калію), солі лужноземельних металів (наприклад кальцію та магнію), солі амонію та аміну (наприклад діетаноламіну, триетаноламіну, октиламіну, діоктилметиламіну та морфоліну).

В описі, якщо не зазначено інакше, "галоген" означає атом фтору, хлору, бром або йоду.

Сполуки формули (I), де A представляє $(A-1)$, є переважними.

Фенільне кільце сполук формули (I) є переважно 2,4-дизамещеним, 2,3-дизамещеним або 2,3,4-тризамещеним.

Сполуки формули (I), де R представляє водень або $-CO_2R^3$, де R^3 представляє пряму або розгалужену алкільну групу, яка містить аж до трьох атомів вуглецю; та R представляє циклопропіл, є переважними.

Сполуки формули (I), де R^2 представляє атом галогену; пряму або розгалужену алкільну групу, яка містить аж до трьох атомів вуглецю, що необов'язково заміщена одним або більше атомами галогену; $-S(O)_pR^6$, $-OR^5$ або $-CH_2S(O)_qR^7$; де R^5 , R^6 та R^7 , кожний, є однаковими або різними, необов'язково галогенованими метильними або етильними групами, є переважними.

Переважним класом сполук формули (I), де A представляє $(A-1)$, є сполуки, де:

R представляє водень або $-CO_2Et$;

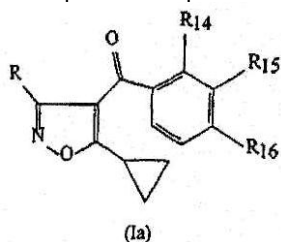
R представляє циклопропіл;

та дві групи R^2 на сусідніх атомах вуглецю фенільного кільця можуть разом з атомами вуглецю, до яких вони приєднані, об'єднуватися з утворенням 5- або 6-членного насиченого або ненасиченого гетероциклічного кільця, яке конденсується по положеннях 2,3 або 3,4 бензоїльного кільця; де гетероциклічне кільце містить два гетероатоми, обраних із сірки та кисню, які знаходяться в положеннях 2 та 3 або 3 та 4 бензоїльного кільця, та де замісником у положенні 4 бензоїльного кільця є галоген або $S(O)_pMe$, або замісником у положенні 2 бензоїльного кільця є метил, $S(O)_pMe$ або $-CH_2S(O)_qMe$, відповідно, та, необов'язково, гетероциклічне кільце

може бути заміщеним одним або більше атомами галогену.

Більш переважним класом сполук формули (I) є сполуки, де A представляє (A-1); R представляє водень або $-\text{CO}_2\text{Et}$; R^1 представляє циклопропіл; R^2 представляє атом галогену або групу, обрану з $-\text{CF}_3$, Me, Et, $-\text{SfO}_p\text{Me}$, $-\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_q\text{Me}$ та необов'язково галогенованого метокси або етокси, та η означає два або три.

Ще більш переважним класом сполук формули (I) є сполуки, які мають формулу (Ia):



де:

R представляє водень або CO_2Et ;

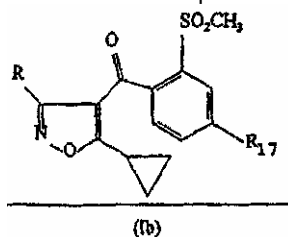
R^{14} вибирають з $-\text{S}(\text{O})_p\text{Me}$, Me, Et, атома хлору, броду або фтору, метокси, етокси та $-\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_q\text{Me}$;

R^{15} вибирають з атома водню, атома хлору, броду або фтору, метокси, етокси та $-\text{S}(\text{O})_p\text{Me}$, та

R^{16} вибирають з атома водню, атома хлору, броду або фтору, метокси та $-\text{CF}_3$;

та де щонайменше один з R^{15} та R^{16} є іншим, чим водень.

Особливо переважний клас сполук формули (I) має формулу (Ib):



де:

R^{17} представляє хлор, бром або трифторметил; та R представляє водень або $-\text{CO}_2\text{Et}$.

Наступні сполуки формули (I) є, серед інших, найбільш переважних для застосування в даному винаході:

5-циклопропіл-4-[2-хлор-3-етокси-4-(етилсульфоніл)бензоїл]ізоксазол;

4-(4-хлор-2-метилсульфонілбензот)-5-циклопропілізоксазол;

5-циклопропіл-4-(2-метилсульфоніл-4-трифторметилбензоїл)ізоксазол;

4-(4-бром-2-метилсульфонілбензоїл)-5-циклопропілізоксазол;

5-циклопропіл-4-[4-фтор-3-метокси-2-(метилсульфоніл)бензоїл]-ізоксазол;

4-(4-бром-2-метилсульфонілметилбензоїл)-5-циклопропілізоксазол;

етил-5-циклопропіл-4-(2-метилсульфоніл-4-трифторметилбензоїл) ізоксазол-3-карбоксилат;

5-циклопропіл-4-(2-метилсульфоніл-4-трифторметилбензоїл)-3-метилтіоізоксазол.

Найбільш переважною сполукою є 5-циклопропіл-4-(2-метилсульфоніл-4-трифторметилбензоїл)ізоксазол (ізоксафлутол).

Методи одержання ізоксазолів формули (I) такі, як описано в європейських патентних публікаціях №№0418175, 0487357, 0527036 та 0560482.

Спосіб винаходу може бути застосований на генетично модифікованих культурах.

Під генетично модифікованою культурою маються на увазі такі культури, яким надано толерантність стосовно гербіцидів шляхом звичайних способів посіву та культивування або методами генної інженерії.

Відповідно до додаткової ознаки даного винаходу, пропонуються композиції, що підходять для гербіцидного застосування в способі по винаходу, що містять один або більш 4-бензоїлізоксазолів формули (I) або їх сільськогосподарсько прийнятні солі або комплекси металів (які можуть бути інкапсульовані, як описано вище), у сполученні із, та переважно гомогенно дисперговані з одним або більше сумісними сільськогосподарсько прийнятними розріджувачами або носіями та/або поверхнево-активними речовинами [тобто розріджувачами або носіями та/або поверхнево-активними речовинами того типу, що звичайно прийняті в даній області як придатні для застосування в гербіцидних композиціях та які сумісні зі сполуками формули (I)]. Термін "гомогено дисперговані" використовують, щоб охопити композиції, у яких сполуки формули (I) розчинені в інших компонентах. Термін "гербіцидні композиції" використовується в широкому змісті, щоб охопити не тільки композиції, що придатні для застосування як гербіциди, але також концентрати, які повинні бути розведені перед застосуванням. Переважно композиції містять від 0,05 до 90% по масі однієї або більше сполук формули (I).

Гербіцидні композиції можуть містити як розріджувач або носій, так і поверхнево-активну речовину (наприклад яка змочує, диспергує або емульгує). Поверхнево-активні речовини, що можуть бути присутнім у гербіцидних композиціях даного винаходу, можуть бути іонного або неіонного типів, наприклад сульфоринолеати, похідні четвертинного амонію, продукти на основі конденсатів етиленоксиду з алкіл- та поліарилфенолами, наприклад ноніл- або октил-феноли, тристирилфеноли, конденсати етиленоксиду зі спиртами або складні ефіри карбонових кислот будь-яких гідросорбітів, яким надана розчинність шляхом етерифікації вільних гідроксигруп шляхом конденсації з етиленоксидом, солі лужних та лужноземельних металів складних ефірів сірчаної кислоти та сульфонових кислот, такі як диноніл- та діоктилсульфосукцинати натрію та солі лужних та лужноземельних металів високомолекулярних похідних сульфонові кислоти, такі як лігносульфонати натрію та кальцію й алкілбензолсульфонати натрію та кальцію.

Підходящі, гербіцидні композиції відповідно до даного винаходу можуть містити аж до 10% по масі, наприклад від 0,05% до 10% по масі, поверхнево-активної речовини, але, при необхідності, гербіцидні композиції відповідно до даного винаходу можуть містити більш високі частки поверхнево-активної речовини, наприклад аж до 15% по масі в рідких емульгованих суспензійних концентратах та аж до 25% по масі в рідких водорозчинних концентратах.

Прикладами придатних твердих розріджувачів або носіїв є силікат алюмінію, мікротонкий діоксид кремнію, тальк, крейда, кальцинована магнезія, кізельгур, трикальцій-фосфат, порошкоподібна пробка, адсорбуюча вуглецева сажа та глини, такі як каолін, аттапульгіт, діатомова земля, слюда, оксид алюмінію, оксид титану та бентоніт. Тверді композиції (які можуть бути в вигляді дуетів, гранул або порошків, що змочуються) переважно одержують подрібненням сполук формули (I) із твердими розріджувачами або просоченням твердих розріджувачів або носіїв розчинами сполук формули (I) у легких розчинниках, випаровуванням розчинників і, якщо необхідно, подрібненням продуктів для того, щоб одержати порошки. Гранульовані сполуки можуть бути отримані шляхом абсорбції сполук формули (I), розчинених у придатних розчинниках (які, якщо бажано, можуть бути леткими), на твердих розріджувачах або носіях у гранульованій формі і, якщо бажано, випаровуванням розчинників, або шляхом гранулювання композицій у порошкоподібній формі, отриманих як зазначено вище. Тверді гербіцидні композиції, порошки, що особливо змочуються, та гранули, можуть містити змочувальні або диспергуючі агенти (наприклад зазначених вище типів), які, коли вони тверді, можуть також служити як розріджувачі або носії.

Рідкі композиції відповідно до винаходу можуть бути в вигляді водних, органічних або водно-органічних розчинів, суспензій та емульсій, що можуть включати поверхнево-активну речовину. Придатні рідкі розріджувачі для введення в рідкі композиції включають воду, гліколи, прості ефіри гліколю, тетрагідрофуриловий спирт, ацетофенон, циклогексанон, ізофорон, алкілпіролідони, бутилолактон, хлорований толуол, ксилол, мінеральні, тваринні та рослинні олії, етерифіцированні рослинні олії та легкі ароматичні та нафтеніві фракції нафти (і суміші зазначених розріджувачів). Поверхнево-активні речовини, що можуть бути присутніми у рідких композиціях, можуть бути іонними або неіонними (наприклад зазначених вище типів) та можуть, коли вони рідкі, служити також як розріджувачі або носії.

Порошки, диспергуємі гранули та рідкі композиції в вигляді концентратів можуть бути розведені водою або іншими придатними розріджувачами, наприклад мінеральними або рослинними оліями, особливо у випадку рідких концентратів, де розріджувачем або носієм є олія, щоб одержати композиції, готові для застосування.

Коли бажано, рідкі композиції сполук формули (I) можуть бути використані в вигляді самоемульгуючихся концентратів, що містять активні речовини, розчинені в емульгаторах або в розчинниках, що містять емульгатори, сумісні з активними речовинами, просте додавання таких: концентратів до води дає композиції, які готові для застосування.

Рідкі концентрати, в яких розріджувачем або носієм є олія, можуть бути використані без додаткового розведення з використанням технології електростатичного розпилення.

Гербіцидні композиції відповідно до даного винаходу можуть також містити, якщо бажано, звичайні ад'юванти, такі як адгезиви, захисні колоїди, загусники, агенти, що сприяють проникненню, агенти, що сприяють розподілу, стабілізатори, буфери, зв'язуючі агенти, агенти проти злежування, речовини, що забарвлюють, й інгібітори корозії. Зазначені ад'юванти можуть також служити як носії або розріджувачі.

Якщо не обговорено інакше, наступні процентні частки дані по масі. Переважними гербіцидними композиціями відповідно до даного винаходу є інкапсульовані препарати, які містять вододиспергуючі гранули, що містять від 1 до 90%, наприклад 25-75% однієї або більше сполук формули (I), від 1 до 15%, наприклад 2-10%, поверхнево-активної речовини та від 5 до 95%, наприклад 20-60%, твердого розріджувача, наприклад глини, гранульовані з додаванням води для одержання пасти та потім висушування;

водні суспензійні концентрати, що містять від 5 до 70% однієї або більше сполук формули (I), від 2 до 10% поверхнево-активної речовини, від 0,1 до 5% загусника та від 15 до 87,9% води;

порошки, що змочуються, які містять від 5 до 90% однієї або більше сполук формули (I), від 2 до 10% поверхнево-активної речовини та від 8 до 88% твердого розріджувача або носія;

водорозчинні або вододиспергуючі порошки, що містять від 5 до 90% однієї або більше сполук формули (I), від 2 до 40% карбонату натрію та від 0 до 88% твердого розріджувача;

рідкі водорозчинні концентрати, що містять від 5 до 50%, наприклад 10-30%, однієї або більше сполук формули (I), від 0 до 25% поверхнево-активної речовини та від 10 до 90%, наприклад 45-85%, що змішується з водою розчинника, наприклад триетиленгліколю, або суміші розчиннику, що змішується з водою, та води;

рідкі емульгуючі суспензійні концентрати, що містять від 5 до 70% однієї або більше сполук формули (I), від 5 до 15% поверхнево-активної речовини, від 0,1 до 5% загусника та від 10 до 84% органічного розчинника, наприклад мінеральної олії; і

емульгуючі концентрати, що містять від 0,05 до 90%, та переважно від 1 до 60%, однієї або більше сполук формули (I), від 0,01 до 10%, та переважно від 39 до 98,99% органічного розчинника.

Вододиспергуючі гранули, які містять ізоксазоли формули (I), уявна щільність яких складає 0,25 - 0,75, мають розмір часток звичайно 10-2000мкм, переважно 300-1500мкм.

Гербіцидні композиції відповідно до даного винаходу можуть також містити сполуки формули (I) у сполученні з, та переважно гомогенно дисперговані в, одним або більше іншими пестицидно активними сполуками і, якщо бажано, з одним або більше сумісними з пестицидами або розріджувачами носіями, поверхнево-активними речовинами та звичайними ад'ювантами, як описано раніше.

Приклади інших пестицидно активних сполук, що можуть бути включені в, або використані в сполученні з, гербіцидні композиції даного винаходу, включають гербіциди, наприклад, для розширення діапазону видів бур'янів, що придушуються, наприклад ацетохлор, алахлор [2-хлор-2,6'-діетил-N-(метоксиметил)ацетанілід], атразин [2-хлор-4-етиламіно-6-ізопропіламіно-1,3,5-тріазин], бромоксиніл [3,5-дибром-4-гідроксibenзонітрил], хлортолурун [N'-(3-хлор-4-метилфент)-N,N-диметилсечовина], ціаназин [2-хлор-4-(1-ціано-1-метилетиламіно)-6-етиламіно-1,3,5-тріазин], 2,4-D[2,4-дихлорфеноксиоцтова кислота], дикамба [3,6-дихлор-2-метоксибензойна

кислота], дифензокват [солі 1,2-діетил-3,5-дифенілпіразолію], диметанамід, флампропметил [метил-N-2-(N-бензоїл-3-хлор-4-фтораніліно)пропіонат], флуфенацет, флуометрон [N'-(3-трифторметилфеніл)-N,N-диметилсечовина], гліфозат, глюфозинат, ізопротурон [N'-(4-ізопрофільфеніл)-N,N-диметилсечовина], метолахлор, метрибузин, інсектициди, наприклад синтетичний піретроїд, наприклад перметрин та циперметрин, фіпроніл та фунгіциди, наприклад карбамати, наприклад метил-N-(1-бутил-карбамоїлбензимидазол-2-іл)карбамат, та тріазолі, наприклад 1-(4-хлорфенокси)-3,3-диметил-1-(1,2,4-тріазол-1-іл)бутан-2-он.

Пестицидно активні сполуки й інші біологічно активні матеріали, що можуть бути включені в, або використані в сполученні з, гербіцидні композиції даного винаходу, наприклад ті, котрі зазначені вище, та ті, котрі є кислотами, можуть бути використані, якщо бажано, у формі звичайних похідних, наприклад солей лужних металів та амінів та складних ефірів.

Наступні приклади ілюструють гербіцидні композиції, що можуть бути використані в даному винаході. Активний інгредієнт, зазначений у наступних прикладах, відноситься до сполуки загальної формули (I).

ПРИКЛАД С1

Емульгуємий концентрат одержують з:

активного інгредієнту	20% мас/об.
N-метилпіролідінону (NMP)	25% мас/об.
додецилбензолсульфонату кальцію (CaDDBS)	4% мас/об.
конденсату нонілфенолу, етиленоксиду, пропіленоксиду (NPEOPO)	4% мас/об.
ароматичного розчиннику	до 100 об'ємів

шляхом перемішування NMP, активного інгредієнту (сполуки I), CaDDBS, NPEOPO та ароматичного розчиннику до утворення прозорого розчину та доведення до об'єму ароматичним розчинником.

ПРИКЛАД С2

Порошок, що змочується, одержують з:

активного інгредієнту	50% мас/мас.
додецилбензолсульфонату натрію	3% мас/мас.
метил-олеїл-таурату натрію	5% мас/мас.
полікарбоксилату натрію	1% мас/мас.
мікротонкого діоксиду кремнію	3% мас/мас.
каоліну	38% мас/мас.

шляхом перемішування зазначених інгредієнтів разом та подрібнення суміші в повітряно-струминному млині.

ПРИКЛАД С3

Суспензійний концентрат одержують з:

активного інгредієнту	50% мас/об.
антифризу (пропіленгліколь)	5% мас/об.
Етоксильованого тристирилфенолфосфату	0,5% мас/об.
9 моль етоксилату нонілфенолу	0,05% мас/об.
полікарбоксилату натрію	0,02% мас/об.
аттапульгіту	1,5% мас/об.
пінопридушувача	0,003% мас/об.
води	до 100 об'ємів

шляхом перемішування зазначених інгредієнтів разом та розмелювання в кульовому млині.

ПРИКЛАД С4

Вододиспергуючі гранули одержують з:

активного інгредієнту	50% мас/мас.
додецилбензолсульфонату натрію	3% мас/мас.
метил-олеїл-таурату натрію	5% мас/мас.
полікарбоксилату натрію	1% мас/мас.
зв'язуючого (лігносульфонату натрію)	8% мас/мас.
каоліну	30% мас/мас.
мікротонкого діоксиду кремнію	3% мас/мас.

шляхом перемішування зазначених інгредієнтів разом, подрібнення суміші в повітряно-струминному млині та гранулювання шляхом додавання води в придатній установці для гранулювання (наприклад, сушарці з псевдозріджуючим шаром) та сушіння. Необов'язково активний інгредієнт може бути подрібнений або сам по собі, або в суміші з деякими або всіма іншими інгредієнтами.

Наступні необмежуючі приклади ілюструють винахід.

ПРИКЛАД 1

Тепличний експеримент, що показує несподіване збільшення біологічної активності у відношенні бур'янів після нанесення сполуки (ізоксафлутолу).

Горшки 7×7см² заповнюють нестерильним суглинним ґрунтом. Насіння бур'янів (*Amaranthus retroflexus*, *Echinochloa crus galli* та *Setaria viridis*) поміщають у три окремі дрібні лунки з насіннями кукурудзи (*Pioneer*

3394), уведеними на глибину 4см у проміжку в кожному горщику та насіння злегка покривають ґрунтом.

1мл розчину технічного ізоксафлутолу, підходяще розведеного для одержання дози, еквівалентної 6,25, 12,5, 25, 50 та 100г/га, в ацетонітрилі, рівномірно наносять піпеткою на поверхню ґрунту в горщиках (повторюють 10 разів), відповідно до наступного режиму.

На день 1, набір з 5 горщиків обробляють 5 рівнями доз (6,25-100г/га) та встановлюють окремо в теплиці. У той же час, на день 1, другий набір з 4 горщиків обробляють 4 рівнями доз (обробка А: 6,25-50г/га) разом із третім набором з 3 горщиків, оброблених 3 рівнями доз (обробка В: 6,25-25г/га). На день 2, кожний із другого та третього наборів горщиків обробляють знову, горщики одержують ідентичні обробки А та В, та другий набір горщиків встановлюють окремо в теплиці. На день 3, кожний із третього набору горщиків обробляють знову, горщики одержують ідентичну обробку В. На день 4, кожний із третього набору горщиків обробляють, горщики одержують ідентичну обробку В та горщики встановлюють окремо в теплиці.

Горщики підтримують у теплиці з поливом зверху (3× щодня) та додатковим освітленням. Візуальну оцінку % зниження в порівнянні з неопрацьованими контрольними рослинами реєструють через 14 днів після обробки. Результати (середнє з 10 повторів) показані в таблиці 1, де режим дозування відноситься до числа нанесень у добу з наступною дозою сполуки на кожний день.

Таблиця 1

% ушкодження 14 ДПО: порівняння разового та багаторазового нанесення

% ушкодження				
Режим дозування	Amare	Echcg	Setvi	Кукурудза (Р 3394)
2×6,25	34	18	18	0
1×12,5	0	0	0	0
4×6,25	80	97	75	0
2×12,5	46	68	42	0
1×25	8	32	10	0
4×12,5	79	100	91	6
2×25	42	70	44	0
1×50	50	84	24	2
4×25	90	100	11	6
2×50	78	96	66	10
1×100	79	94	59	8

Як можна бачити в таблиці 1, ефективність гербіциду на ключові види бур'янів поліпшується 2 нанесеннями, розділеними 1 днем, та знезацька ще більш підвищується 4 нанесеннями, розділеними 3 днями, у порівнянні з разовим нанесенням тієї ж сумарної дози сполуки. Повторні нанесення, мабуть, не роблять ніякого впливу на фітотоксичність для кукурудзи.

ПРИКЛАД 2

Готують 30% водний розчин геролу та при перемішуванні 67г додають до 80г суспензії ізоксафлутолу (250г/л) у воді, що містить диспергатор (полінафталінсульфат натрію), щоб зберігати суспензію. Додають порошкоподібний карбонат кальцію (1г) та отриману суміш обробляють ультразвуком перед додаванням полісілоксанової олії (600мл), щоб одержати емульсію. Додають оцтову кислоту (3мл) та перемішування продовжують протягом 2 годин. Перемішування припиняють та верхній шар декантують з осаду. Цю тверду речовину відфільтровують, промивають водою та сушать, щоб одержати мікрочастинки інкапсульованого ізоксафлутолу. Інкапсульований матеріал може бути складений з використанням описаних раніше способів.

Герол: кополімер діетиленгліколь-етиленгліколь-ізофталева кислота-5-сульфоізофталат натрію-терефталева кислота-триетиленгліколь.

ПРИКЛАД 3

Кукурудзу висівають та потім вирощують на ділянці, де присутні бур'яни та насіння бур'янів. Бур'яни обрані з: *Alopecurus myosuroides*, *Avena fatua*, *Diaetaria sanguinalis*, *Echinochloa crus-galli*, *Eleusine indica*, *Lolium multiflorum*, *Setaria viridis*, *Sorghum halepense*, *Cyperus esculentus*, *Cv-perus iria*, *Cyperus rotundas*, *Eleocharis acicularis*, *Abutilon theophrasti*, *Amaranthus retroflexus*, *Bidens pilosa*, *Chenopo-dium album*, *Galium aparine*, *Ipomoea purpurea*, *Lamium pur-pureum*, *Matricaria inodora*, *Sesbania exalta*, *Sinapis arven-sis*, *Solanum laiorum*, *Stellaria media*, *Veronica hederifolia*, *Veronica Persia*, *Viola arvensis* та *Xanthium strumarium*.

Через тиждень після посіву кукурудзи ізоксазол розпорошують в вигляді інкапсульованого препарату, як описано раніше, при нормі 105г/га гербіцидно активної сполуки, масове відношення ізоксазол:сополієфір дорівнює 1:10. Кількості ізоксазолу формули (I) та ДКН вимірюють через 4 дні в ґрунтового моноліті глибиною 5 см навколо насіння або взходу. Виявлено, що масове відношення ізоксазол:ДКН дорівнює 1.

Активність ізоксазолу на культурну рослину та бур'яни спостерігають спустя 3 тижні та виявляють її рівній 2% та 95%, відповідно.

Подібне нанесення в аналогічних ґрунтових умовах без сополієфіру забезпечує масове відношення ізоксазол:ДКН 0,1 та гербіцидну активність як на культурну рослину, так й на бур'яни 15% та 95%, відповідно.

ПРИКЛАД 4

Кукурудзу висівають на ділянці, де присутні бур'яни та насіння бур'янів виду *Setaria viridis*. Ізоксазол розпорошують на поверхню ґрунту в вигляді інкапсульованої сполуки при нормі 105г гербіцидно активної сполуки на гектар. Активність ізоксазолу на кукурудзу та *Setaria viridis* спостерігають через 6, 11, 14 та 17 днів

після обробки (ДПО).

Активність 4-бензоїлізоксазолу
у відношенні *Setaria viridis*

Норма нанесення г/га	Склад	ДПО			
		6	11	14	17
105	Інкапсульований	0	40	70	90
	WG	10	50	75	100

Активність 4-бензоїлізоксазолу
у відношенні кукурудзи

Норма нанесення г/га	Склад	ДПО			
		6	11	14	17
105	Інкапсульований	0	0	3	8
	WG	0	5	7	10

Активність у відношенні *Setaria viridis* інкапсульованого складу дорівнює активності WG складу. Інкапсульований склад має знижену фітотоксичність стосовно кукурудзи на 20-30%, ніж WG склад.

ПРИКЛАД 5

Кукурудзу висівають та вирощують на ділянці, де присутні бур'яни та насіння бур'янів. Бур'янами є *Amaranthus retroflexus*, *Echinochloa crus-galli* та *Setaria viridis*. Розчини ізоксазолу в ацетонітрилі наносять безпосередньо на поверхню ґрунту при рівнях доз 100, 50 та 2г/га на ділянках А, В та С, відповідно. 1 ДПО рівень доз 50 та 25г/га наносять на ділянки В та С, відповідно, 2 та 3 ДПО рівні доз 25г/га наносять на ділянку С

Активність ізоксазолу у відношенні кукурудзи
та видів бур'янів спостерігають на 14 ДПО

Режим дозування	Amare	Echcg	Setvi	Кукурудза
4×25г/га	90	100	77	6
2×50г/га	78	96	66	10
1×100г/га	79	94	59	8

Підтримування ізоксазолу в поверхневому шарі ґрунту на ділянці, що містить насіння та сходи бур'янів, шляхом послідовного нанесення низьких рівнів доз ізоксазолу забезпечує поліпшену активність у відношенні бур'янів.