

(19) **KG** (11) **158** (13) **C2**

ГОСУДАРСТВЕННОЕ АГЕНТСТВО
ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ
ПРИ ПРАВИТЕЛЬСТВЕ КЫРГЫЗСКОЙ РЕСПУБЛИКИ (КЫРГЫЗПАТЕНТ)

(51)⁶ **A01N 57/20**

(12) ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ

к патенту Кыргызской Республики

(21) 940142.1

(22) 26.07.1994

(31) 2-162191

(32) 20.06.1990

(33) JP

(46) 01.01.1997, Бюл. №3, 1997

(71)(73) Исихара Сангио Кайся ЛТД, JP

(72) Нобуюки Сакасита, Хироси Есии, Цунезо Есида, Сооити Хонзава, Хироси Кикугава, JP

(56) Патент США №4744814, кл. C07D 401/12; A01N 43/54, опубл. 1988

Заявка EP 252237, кл. A01N 57/20, опубл. 1988

(54) Гербицидная композиция

(57) Предложена гербицидная композиция для подавления сорняков, включающая в качестве производного сульфонилмочевины 1-(4,6-диметоксипиримидин-2-ил)-3-(3-трифторметил-2-пиридилсульфонил) мочевины и аммониевую соль гомоаланин-4-ил-(метил) фосфиновой кислоты при весовом соотношении 1 : (0.6-80). 4 табл., 11 прим.

Настоящее изобретение относится к гербицидной композиции, включающей в качестве активных ингредиентов 1-(4,6-диметокси-пиримидин-2-ил)-3-(3-трифторметил-2-пиридилсульфонил) мочевины (называемую далее "соединение А" и аммониевую соль гомоаланин-4-ил(метил) фосфиновой кислоты (называемую далее "соединение В"), в весовом соотношении 1:0.6-80.

Было разработано и в настоящее время применяется много разновидностей гербицидов. Поскольку объекты подавления или регулирования с помощью гербицидов включают широкое разнообразие сорняков с длительным периодом прорастания, всегда существовала потребность в разработке гербицидов, имеющих более широкий спектр гербицидного действия, высокую активность и оказывающих устойчивое гербицидное действие.

В результате исследований с целью разработки гербицида с характеристиками, упомянутыми выше, изобретатели настоящего изобретения обнаружили, что гербицидная композиция настоящего изобретения может подавлять широкое множество сорняков, появляющихся на полях с посевами сельскохозяйственных культур, а также на

непахотных землях. Было найдено, что гербицидное действие композиции настоящего изобретения выше, чем простое сложение гербицидных эффектов индивидуальных активных ингредиентов и проявляется в синергетическом гербицидном эффекте, благодаря чему гербицидная композиция настоящего изобретения может применяться при меньших количествах активных ингредиентов с расширенным гербицидным спектром и устойчивым гербицидным действием по сравнению с любым из индивидуальных активных ингредиентов, когда они применяются по одному.

Задача изобретения - создание гербицидной композиции, включающей в качестве активных ингредиентов соединение А и аммониевую соль соединения В, в весовом соотношении 1:0.6-80.

Соединение В и его соль, как активные ингредиенты, используемые в гербицидной композиции настоящего изобретения, охватывают оптические изомеры, примеры которых включают D, L - гомоаланин-4-ил (метил) фосфиновую кислоту (обычное название: D, L - глюфосинат, называемый далее "D, L - изомер соединения В" и L-гомоаланин-4-ил(метил)-фосфиновую кислоту (обычное название: L - глюфосинат, называемый далее "L - изомер соединения В").

Применяемое количество гербицидной композиции настоящего изобретения невозможно определить однозначно, потому что оно варьирует в зависимости от соотношения при смешении активных ингредиентов, типа препаративной формы, вида сорняка, являющегося объектом обработки, условий погоды и др. Однако, обычно применяется такое количество, чтобы применялось от 0.05 до 5 г и предпочтительно от 0.2 до 3 г на ар/ар (а) = 100 кв.м соединения А или его соли в сочетании от 0.3 до 30 г, и предпочтительно, от 2.5 до 15 г на ар другого конкретного гербицидного соединения (соединений), причем, общее количество активных ингредиентов составляет от 0.35 до 35 г, и предпочтительно от 2.5 до 18 г на ар. Когда гербицидная композиция настоящего изобретения применяется, ее разбавляют водой, если необходимо, или при желании могут использоваться дополнительно вспомогательные агенты (или адъюванты), такие как распределители.

Часто случается, что соответствующие активные ингредиенты проявляют некоторые недостатки с точки зрения гербицидной активности, когда они применяются по одному. Однако, могут быть случаи, когда два вида активных ингредиентов применяются в сочетании, получающаяся в результате гербицидная активность является выше, чем активность, получаемая при простом суммировании активностей каждого из двух активных ингредиентов (т.е. ожидаемая активность). В таком случае говорят, что обнаруживается синергистическое действие. Ожидаемая активность, которая приводится при конкретном сочетании двух видов гербицидов, может быть вычислена с помощью следующего уравнения, которое описывается, например, в публикации S. R. Colby, Weeds, "Calculating Synergistic and Antagonistic Responses of Herbicide Combinations", т. 15, с. 20-22 1967.

$$E = \alpha + \beta - \alpha \times \beta / 100$$

В приведенном выше уравнении α представляет степень ингибирования роста (%) при обработке количеством (г/ар) гербицида А; β представляет степень ингибирования роста (%) при обработке количеством (г/ар) гербицида В; и Е представляет ожидаемую степень торможения или ингибирования роста (%) при применении (г/ар) гербицида А и (г/ар) гербицида В.

То есть, если фактическая степень ингибирования роста (найденная величина), выше, чем степень торможения роста (вычисленная величина), определенная с помощью упомянутого выше вычисления, можно сказать, что активность, достигнутая при сочетании гербицидов, проявляется в синергистическом действии.

Гербицидная композиция настоящего изобретения является полезной ввиду того, что она полностью уничтожает широкое разнообразие сорняков, начиная от однолетних сорняков и кончая многолетними сорняками, даже когда она используется с небольшими

количествами активных ингредиентов. Кроме того, когда она применяется или в период перед появлением всходов, или после появления всходов сорняков, она является настолько эффективной, что может проявлять высокий уровень гербицидного действия при применении путем обработки почвы, листьев. Следовательно, гербицидная композиция настоящего изобретения является полезной для борьбы с сорняками не только на сельскохозяйственных и садовых угодьях, включающих нагорные поля, сады и др., но также и на несельскохозяйственных угодьях, включая игровые площадки, свободные делянки, леса и дворы или площадки с емкостями (участки хранения цистерн или емкостей).

Гербицидная композиция настоящего изобретения получается путем смешения различных вспомогательных агентов (адъювантов), с соединением А и другим конкретным гербицидным соединением с преобразованием в такую препаративную форму, как смачиваемый порошок, суспензионный концентрат, вододиспергируемые гранулы, dustы, водорастворимые гранулы, водорастворимые порошки, или растворимые концентраты, в соответствии с любым обычным методом приготовления сельскохозяйственных химикатов. Соединение А и другое конкретное гербицидное соединение могут или смешиваться вместе и преобразовываться в препаративную форму, или приготавливаться в виде отдельных препаративных форм и смешиваться вместе.

Упомянутые выше готовые препаративные формы гербицидной композиции настоящего изобретения могут содержать от 1 до 98 %, и предпочтительно от 2 до 95 %, по весовому соотношению, активных ингредиентов.

Примеры упомянутых выше вспомогательных агентов (адъювантов) включают твердые носители, такие как диатомовая земля, гашеная известь, карбонат кальция, тальк, белый уголь, каолин, бентонит, жиклит, водорастворимый крахмал, карбонат натрия, бикарбонат натрия и сульфат натрия; антифризные агенты, такие как этиленгликоль и пропиленгликоль; спредеры или распределители и поверхностно-активные агенты, такие как соли алкилсульфатов, соли алкилбензолсульфонатов, соли лигносульфоната, полиоксиэтилен-гликоль-алкиловые эфиры, полиоксиэтилен-лауриловые эфиры, полиоксиэтилен-алкилариловые эфиры, сложные эфиры полиоксиэтилен - жирных кислот, сложные эфиры полиоксиэтилен-сорбитан - жирной кислоты, простые полиоксиэтилен-стирилфениловые эфиры, соли поликарбоксилатов, соли диалкил-сульфосукцинатов, соли сульфатов алкил-дигликолевых эфиров, соли сульфатов полиокси-этилен-алкилариловых эфиров, соли полиокси-этилен-алкиларилфосфатов, полилкси-этилен-гидрированное касторовое масло, соли стирилфенилфосфата, и конденсаты солей нафталинсульфоната и формалина; пищевые (растительные) и минеральные масла, такие как оливковое, касторовое, кокосовое, кунжутное, кукурузное, рисовое, арахисовое, хлопковое, соевое, рапсовое, льняное и тунговое, капок-масло (масло хлопкового дерева), масла парайи и камелии, и жидкий парафин; растворители, такие как пропиленгликольмонометиловый эфир; тиксотропные материалы, такие как алюминий-магний-силикат и бентонит-алкиламино комплексы; и загустители, такие как ксантановая смола. Упомянутые выше вспомогательные агенты могут использоваться в предварительно смешанном виде, если необходимо. Гербицидная композиция настоящего изобретения, полученная описанным выше образом, может дополнительно включать другие гербициды, инсектициды, фунгициды, и/или регуляторы роста растений, вводимые в них.

Примеры препаративных форм гербицидной композиции настоящего изобретения, которые не являются ограничительными.

Пример 1 препаративной формы

1. Аммониевая соль D, L-изомера соединения В	30 вес. частей
2. Соединение А	2 вес. части
3. Соевое масло	54 вес. частей
4. Бентонит-алкиламино (R) комплекс	

(Нью Д Орбен® производимый фирмой 2 вес. части
Сираиси Когю Кайся, Лтд)

5. Смесь полиоксиэтилен-
алкиларилового эфира, полиоксиэтилен-
гидрированного касторового масла,
полиоксиэтилен-алкиларил-фосфата,
диалкилсульфосукцината натрия и
сложного эфира полиоксиэтилен- 12 вес. частей.
жирной кислоты (Сорпол 3747К,
производимая Тохо Кемикал Индстри
Ко. Лтд.)

Упомянутые выше компоненты равномерно смешиваются при помощи мокрого пульверизатора с получением суспензионного концентрата на масляной основе.

Пример 2 препаративной формы

- | | |
|--|----------------|
| 1. Аммониевая соль D, L-изомера
соединения В | 30 вес. частей |
| 2. Соединение А | 2 вес. части |
| 3. Нормальный жидкий парафин | 51 вес. частей |
| 4. Бентонит-алкиламино
комплекс (Нью Д Орбен®) | 2 вес. части |
| 5. Полиоксиэтиленсорби-
тантриолеат (Сорбон Т 85,
производимый Тохо Кемикал
Индастри Ко. Лтд) | 15 вес. частей |

Упомянутые выше ингредиенты равномерно смешиваются при помощи мокрого пульверизатора с получением суспензионного концентрата на масляной основе.

Пример 3 препаративной формы.

- | | |
|--|----------------|
| 1. Аммониевая соль D, L -изомера
соединения В | 30 вес. частей |
| 2. Соединение А | 2 вес. части |
| 3. Жиклит | 51 вес. частей |
| 4. Конденсат нафталин-
сульфоната натрия и формалилина
(Лавелин S, производимый Дайити
Когю Сейяку Ко. Лтд) | 2 вес. части |
| 5. Белый уголь | 10 вес. частей |
| 6. Натрий-полиокси-этилен-
алкиларилово-эфирный сульфат-
премикс с белым углем (Сорпол
5039, производимый Тохо
Кемикал Индастри Ко. Лтд) | 5 вес. частей |

Упомянутые выше компоненты смешиваются с получением смачиваемого порошка.

Пример 4 препаративной формы

- | | |
|---|----------------|
| 1. Аммониевая соль D, L -
изомера соединения В | 80 вес. частей |
| 2. Соединение А | 5 вес. частей |

- | | |
|---|---------------|
| 3. Поверхностно-активное
вещество особого
поликарбонатовокислотно-
полимерного типа (Демол
ЕР, производимый фирмой
Као Корпорейшн) | 8 вес. частей |
| 4. Сульфат натрия | 7 вес. частей |

Указанные выше компоненты растворяются или суспендируются в трехкратном количестве воды и сушатся с помощью распылительной сушилки с получением диспергируемых в воде гранул.

Пример 5 препаративной формы

- | | |
|---|---------------------|
| 1. Аммониевая соль D, L - изомера
соединения В | 2 вес. части |
| 2. Соединение А | 0.2 вес. части |
| 3. Карбонат кальция (мелкие
гранулы) | 92.8 вес.
частей |
| 4. Диалкилсульфосукцинат натрия
(Неокол У К, производимый фирмой
Дайити Когіо Сейяку Ко. Лтд) | 1 вес. часть |
| 5. Полиоксиэтилен-октилфениловый
эфир (Нойген ЕА-92, производимый
фирмой Дайити Когіо Сейяку Ко. Лтд) | 2 вес. части |
| 6. Белый уголь | 2 вес. части |

Упомянутые выше компоненты смешиваются с получением гранул.

Пример 6 препаративной формы

- | | |
|--|----------------|
| 1. Аммониевая соль D, L -
изомера соединения В | 89 вес. частей |
| 2. Соединение А | 6 вес. частей |
| 3. Конденсат нафталин-
сульфоната натрия и
формалина (Лавелин FAN) | 5 вес. частей |

Указанные выше компоненты смешиваются с получением смачиваемого порошка.

Пример 7 препаративной формы

- | | |
|---|------------------|
| 1. Аммониевая соль D, L
- изомера соединения В | 82.5 вес. частей |
| 2. Соединение А | 5.5 вес. частей |
| 3. Бикарбонат натрия | 7 вес. частей |
| 4. Алкилсульфат натрия
(Моноген У-500) | 5 вес. частей |

Упомянутые выше компоненты смешиваются вместе с получением водорастворимого порошка.

Пример 8 препаративной формы

- | | |
|---|----------------|
| 1. Аммониевая соль D, L -
изомера соединения В | 60 вес. частей |
| 2. Соединение А | 4 вес. части |

3. Алкилсульфат натрия (Моноген У-500) 15 вес. частей
4. Лигносульфонат кальция 10 вес. частей
5. Сульфат натрия 11 вес. частей

Упомянутые выше компоненты смешиваются с получением смачиваемого порошка.

Гербицидный эффект композиции настоящего изобретения далее будет продемонстрирован с помощью следующих примеров испытаний.

Пример 1 испытаний (обработка листвы). Почва нагорной местности помещалась в горшки Вагнера емкостью 1/5000 ар и в нее высаживались ростки из *Solidago altissima*, собранные на полях, которые выращивались в теплице. Когда растения достигали высоты 20-30 см, на листву растений небольшим распылителем напылялось заданное количество каждой гербицидной композиции, которая предварительно разбавлялась 15л воды на ар и затем смешивалась с 0.05 % (объем/объем) спредера (Син Рино, производимый фирмой Нихон Нояку Ко. Лтд). Через 25 дней после обработки листвы измерялся свежий вес листьев. Степень ингибирования роста (%), которая приводится в таблице 1, вычислялась в соответствии со следующим уравнением:

$$\text{Noaratu etaeaeotaa iey oinoa (\%)} = \left(1 - \frac{\text{naawee aaneehonaa ia iadadaidat n o-anoea}}{\text{naawee aaneehonaa ia iadadaidat iin o-anoea}}\right) \times 100$$

Пример 2 испытаний (обработка листвы).

Почва нагорных полей помещалась в горшки емкостью 1/10000 ар и засеивалась *Digitaria sanguinalis*. Когда растения достигали стадии 4-го листа, на листья с помощью небольшого опрыскивателя наносили заданное количество каждой гербицидной композиции, которая разбавлялась водой в количестве 15 л, воды на ар, и далее смешивалась с 0.2 % (объем/объем) спредера (Син Рино). Спустя 20 дней после обработки листьев измерялся сырой вес наземной части растений. Степень ингибирования роста (%), вычисленная с помощью уравнения, данного в примере 1 испытаний (найденная величина) и степень ингибирования роста (%), вычисленная с помощью приведенного выше уравнения Колби (вычисленная величина), приведены в таблице 2.

Пример 3 испытаний (обработка листвы).

На поле, на котором в смеси произрастали такие сорняки, как *Solidago altissima*, *Agropyron smithii* и *Digitaria sanguinalis*, когда средняя высота растений этих сорняков достигала 20-40 см, с помощью небольшого опрыскивателя осуществлялась обработка листвы заданным количеством каждой гербицидной композиции, которая предварительно разбавлялась 15л воды на ар, и затем смешивалась с 0.05 % (объем/объем) спредера (Син Рино). Через 30 дней после обработки проверялся гербицидный эффект композиции с помощью визуального наблюдения в соответствии со следующими критериями оценки.

Результаты приведены в таблице 3.

Оценка	Степень ингибирования
1	0-19
2	20-29
3	30-39
4	40-49
5	50-59
6	60-69
7	70-79
8	80-89
9	90-99
10	100

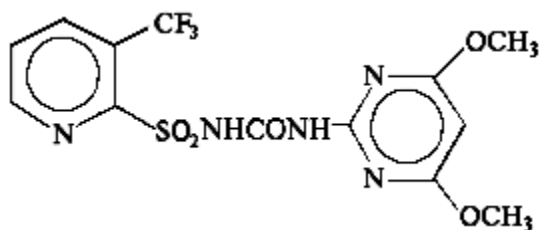
Сравнительный пример испытаний (обработка листы).

Почва нагорных полей помещалась в горшки емкостью 1/10000 ар и засеивалась *Digitaria sanguinalis*. Когда растения достигали стадии 4-го листа с помощью небольшого разбрызгивателя их обрабатывали заданным количеством каждой гербицидной композиции, разбавленным водой в количестве 15 л на ар и затем смешанным с 0.2 % (объем/объем) спредера (Син Рино). Через 15 дней после обработки измеряли сырой вес наземной части растений.

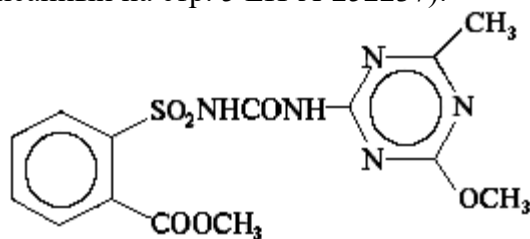
Вышеуказанное испытание проводилось в одно и то же время и в одинаковых условиях. Степень ингибирования роста (%), приведенная в нижеследующей таблице, рассчитывалась в соответствии со следующей формулой

$$\text{Степень ингибирования роста (\%)} = \left(1 - \frac{\text{сырой вес обработанной листы}}{\text{сырой вес необработанной листы}}\right) \times 100$$

Использованные соединения: Соединение А



Метсульфурон-метил (описанный на стр. 5 ЕП-А-252237):



Аммониевая соль D, α-изомера Соединения В (Баста):

Аммониевая соль D, α-изомера гомоалани-на-4-ил(метил)-фосфорной кислоты

Таблица 1

Активные ингредиенты	Количество примененных активных ингредиентов (г/а)	Степень ингибирования роста (%)
1	2	3
Соединение А	1	63
	0.5	51
	0.25	46
Аммониевая соль D, L - изомера соединения В	10	84
(торговое наименование "Баста")	5	72
	2.5	55
Аммониевая соль L - изомера соединения В	5	77
	2.5	68
	1.25	48
Соединение А	1+10	100
+	1+5	100
Аммониевая соль D, L - изомера соединения В	1+2.5	100
	0.5+10	100
(торговое наименование "Баста")	0.5+5	100
	0.5+2.5	88
	0.25+10	97
	0.25+5	94
	0.25+2.5	85
Соединение А	1+10	100
+	1+5	100
Аммониевая соль D, L - изомера соединения В	1+2.5	98
	0.5+10	100
	0.5+5	100
	0.5+2.5	92
	0.25+10	96
	0.25+5	91
	0.25+2.5	83

Таблица 2

Активные ингредиенты	Количество примененных активных ингредиентов (г/а)	Степень ингибирования роста (%)	
		найденная	вычисленная
1	2	3	4
Соединение А	5	99.4	-
	1	67.3	-
	0.6	47.4	-
	0.4	16.9	-
	0.2	5.3	-
	0.1	3.5	-
	0.05	0	-

Продолжение таблицы 2

1	2	3	4
Аммониевая соль D, L - изомера соединения В (торговое наименование "Баста")	10	100	-
	4	90	-
	3	85	-
	2	52.3	-
	1	35.8	-
	0.5	12.8	-
	0.3	0.9	-
Соединение А	1+0.5	99.4	71.5
+	1+0.3	90.3	67.6
Аммониевая соль D, L - изомера соединения В (торговое наименование "Баста")	0.6+0.5	95.0	54.1
	0.6+0.3	96.3	47.9
	0.4+0.5	95.7	27.5
	0.4+0.3	91.9	17.6
	0.2+4	96.9	90.5
	0.2+3	95.4	85.8
	0.2+2	86.9	54.8
	0.2+1	81.3	39.2
	0.2+0.5	78.8	17.4
	0.2+0.3	72.3	6.2
	0.1+4	97.2	90.4
	0.1+3	87.2	85.5
	0.1+2	75.4	54.0
	0.1+1	74.1	38.0
	0.1+0.5	72.3	15.9
	0.1+0.3	62.0	4.4
	0.05+4	96.6	90.0

	0.05+3	89.7	85.0
	0.05+2	72.0	52.3
	0.05+1	70.4	35.8
	0.05+0.5	70.4	12.8
	0.05+0.3	57.0	0.9

Таблица 3

Активные ингредиенты	Количество примененных активных ингредиентов (г/а)	Оценка
1	2	3
Соединение А	1	6
	0.5	5
Аммониевая соль D, L - изомера соединения В (торговое наименование "Баста")	10 5	7 5
Аммониевая соль D, L - изомера соединения В	10 5	6 5
Соединение А	1+10	10
+	1+5	10
Аммониевая соль D, L - изомера соединения В (торговое наименование "Баста")	0.5+10 0.5+5	10 9
Соединение А	1+10	10
+	1+5	10
Аммониевая соль D, L - изомера соединения В	0.5+10 0.5+5	10 8

Таблица 4

Активные ингредиенты	Количество примененных активных ингредиентов (г/а)	Степень ингибирования роста (%)
1	2	3
Соединение А	1 0.5 0.25 0.125 0.06 0.03	100 77.3 75.2 62.3 38.8 22.1
Аммониевая соль D, L - изомера соединения В (Баста)	5 2.5 1.25 0.6 0.3	100 75.2 63.3 11.5 0
Соединение В	0.5+2.5	97.9
+	0.5 + 1.25	93.9
Аммониевая соль D, L - изомера соединения В (Баста)	0.5 + 0.6 0.5+0.3	80.9 79.7

композиция данного изобретения	0.25 + 2.5	98.5
	0.25 + 1.25	95.5
	0.25 + 0.6	83.9
	0.25 + 0.3	87.3
	0.125 + 2.5	98.8

Продолжение таблицы 4

1	2	3
	0.125 + 1.25	91.2
	0.125 + 0.6	67.9
	0.125 + 0.3	71.5
	0.06 + 2.5	95.5
	0.06+1.25	81.2
	0.06 + 0.6	57.3
	0.06 + 0.3	49.4
	0.03 + 2.5	90.9
	0.03 + 1.25	75.8
	0.03 + 0.6	43.6
	0.03 + 0.3	40.9
Метсульфурон-метил	1	51.8
	0.5	14.8
	0.25	10.3
	0.125	0
	0.06	0
	0.03	0
Аммониевая соль D, L - изомера соединения В (Баста)	5	100
	2.5	75.2
	1.25	63.3
	0.6	11.5
	0.3	0
Метсульфурон-метил + Аммониевая соль D, L - изомера соединения В (Баста) - (соединение, описанное в ЕП-А-252237)	0.5+2.5	82.1
	0.5 + 1.25	61.5
	0.5 + 0.6	20.9
	0.5+0.3	51.8
	0.25 + 2.5	78.8
	0.25 + 1.25	60.6
	0.25 + 0.6	18.5
	0.25 + 0.3	17.1
	0.125 + 2.5	86.7
	0.125 + 1.25	66.4
	0.125 + 0.6	10.0
	0.125 + 0.3	0
	0.06 + 2.5	83.0
	0.06+ 1.25	30.0
	0.06 + 0.6	0
	0.06 + 0.3	0
	0.03 + 2.5	80.3
	0.03 + 1.25	60.6
	0.03 + 0.6	6.4
	0.03 + 0.3	0

Формула изобретения

Гербицидная композиция, включающая производное сульфонилмочевины и аммониевую соль гомоаланин-4-ил-(метил) фосфиновой кислоты, отличающаяся тем, что она в качестве производного сульфонилмочевины содержит 1-(4,6-диметоксипиримидин-2-ил)-3-(3-трифторметил-2-пиридилсульфонил) мочевины при весовом соотношении 1 : (0.6 - 80).

Ответственный за выпуск

Ногай С.А.

Кыргызпатент, 720021, г. Бишкек, ул. Московская, 62, тел.: (312) 68 08 19, 68 16 41, факс: (312) 68 17 03