



УКРАЇНА

(19) **UA**(11) **126576**(13) **C2**

(51) МПК

A01N 43/40 (2006.01)**A01N 43/36** (2006.01)**A01P 13/02** (2006.01)

НАЦІОНАЛЬНИЙ ОРГАН
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ
ДЕРЖАВНЕ ПІДПРИЄМСТВО
"УКРАЇНСЬКИЙ ІНСТИТУТ
ІНТЕЛЕКТУАЛЬНОЇ
ВЛАСНОСТІ"

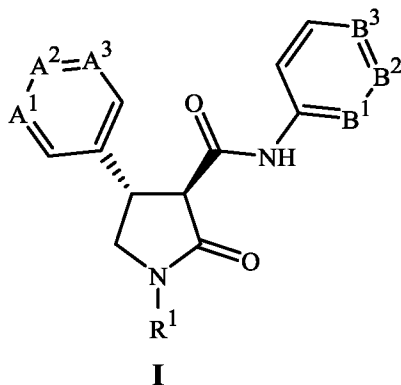
(12) ОПИС ДО ПАТЕНТУ НА ВИНАХІД

(21) Номер заявки:	а 2019 10173	(72) Винахідник(и):	Пурі Атул (US)
(22) Дата подання заявки:	16.03.2018	(73) Володілець (володільці):	ЕФЕМСІ КОРПОРЕЙШН, 2929 Walnut Street, Philadelphia, PA 19104, United States of America (US)
(24) Дата, з якої є чинними права інтелектуальної власності:	03.11.2022	(74) Представник:	Мамуня Олександр Сергійович, реєстр. №357
(31) Номер попередньої заявки відповідно до Парижської конвенції:	62/474,215, 62/572,057	(56) Перелік документів, взятих до уваги експертизою:	WO 2014/018359 A1 WO 2016/196593 A1 US 2015/0018208 A1
(32) Дата подання попередньої заявки відповідно до Парижської конвенції:	21.03.2017, 13.10.2017		
(33) Код держави-учасниці Парижської конвенції, до якої подано попередню заявку:	US, US		
(41) Публікація відомостей про заявку:	10.01.2020, Бюл.№ 1		
(46) Публікація відомостей про державну реєстрацію:	02.11.2022, Бюл.№ 44		
(86) Номер та дата подання міжнародної заявки, поданої відповідно до Договору РСТ	PCT/US2018/022849, 16.03.2018		

(54) ГЕРБІЦИДНА СУМІШ, КОМПОЗИЦІЯ ТА СПОСІБ

(57) Реферат:

Розкрито суміш, яка містить (а) сполуку формули I і її солі:

де A¹, A², A³, R¹, B¹, B² і B³ визначені в описі, і (b) 2-піридинкарбонової кислоти 4-аміно-3-хлор-6-**UA 126576 C2**

(4-хлор-2-фтор-3-метоксифеніл)-5-фтор-, фенілметилловий естер (тобто флорпірауоксифенбензил). Також розкрито композицію, яка містить цю суміш. Також розкрито спосіб застосування цієї суміші до небажаної рослинності, який включає приведення в контакт небажаної рослинності або її середовища з ефективною кількістю суміші за цим винаходом.

Цей винахід стосується суміші певних заміщених піролідинонових сполук та їх солей з флорпірауксифен-бензилом, композицій, що їх містять, та способів їх використання для боротьби з небажаною рослинністю.

РІВЕНЬ ТЕХНІКИ

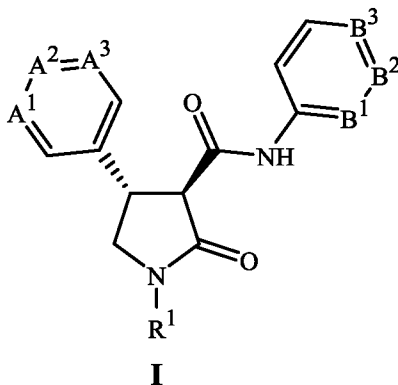
Боротьба з небажаною рослинністю є надзвичайно важливою для досягнення високої врожайності культури. Дуже бажано досягти селективного контролю за зростанням бур'янів, особливо для таких корисних культур, як рис, соя, цукровий буряк, кукурудза, картопля, пшениця, ячмінь, томати та, серед іншого, багаторічні культури. Безконтрольний ріст бур'янів на таких корисних культурах може призвести до значного зниження продуктивності і, таким чином, до збільшення витрат для споживача. Існує багато комерційно доступних продуктів для цих цілей, але залишається потреба у нових сумішах, композиціях та способі їх використання, які є більш ефективними, менш затратними, менш токсичними, екологічно безпечнішими або з іншими ділянками впливу.

Зазвичай для розширення спектру рослин, які контролюються, або підвищення якості контролю будь-яких наведених видів використовується адитивний ефект комбінації гербіцидів. Несподівано було виявлено, що деякі рідкісні комбінації дають підсилений адитивний ефект. Зараз винайдено такі цінні суміші, композиції та способи.

WO 2015/084796 і WO 2016/196593 розкривають різноманітність заміщених циклічних амідів, способи їх використання як гербіцидів та способи їх отримання. У цих публікаціях не розкриваються гербіцидна суміш, композиція та спосіб цього винаходу.

СУТЬ ВІНАХОДУ

Цей винахід стосується суміші, яка містить (а) сполуку формули I та її солі:



де

A¹ являє собою CCF₃, A² являє собою CH і A³ являє собою CH; або
A¹ являє собою CH, A² являє собою CCF₃ і A³ являє собою CH; або
A¹ являє собою N, A² являє собою CCF₃ і A³ являє собою CH; або
A¹ являє собою CCH₃, A² являє собою N і A³ являє собою COCHF₂;
R¹ являє собою C₁–C₄ алкіл;

B¹ являє собою CF, B² являє собою CH і B³ являє собою CH; або
B¹ являє собою CF, B² являє собою CF і B³ являє собою CH; або
B¹ являє собою CF, B² являє собою N і B³ являє собою CF;

і (b) 2-піридинкарбонової кислоти, 4-аміно-3-хлор-6-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифеніл)-5-фтор-, фенілметиловий естер (тобто флорпірауксифен-бензил) та його солі.

Цей винахід також включає гербіцидну суміш, яка додатково містить (с) принаймні один додатковий активний інгредієнт.

Цей винахід також стосується гербіцидної композиції, яка містить суміш за цим винаходом (тобто в гербіцидно ефективній кількості) і принаймні один компонент, вибраний із групи, що складається з поверхнево-активних речовин, твердих розріджувачів і рідких розріджувачів.

Цей винахід додатково стосується способу боротьби з ростом небажаної рослинності, який включає приведення в контакт рослини або її середовища з гербіцидно ефективною кількістю суміші за цим винаходом (наприклад такою, як композиція, описана в цьому документі).

ДЕТАЛЬНИЙ ОПИС ВІНАХОДУ

У разі відсутності інших вказівок у цьому контексті терміни "містить", "який містить", "включає", "який включає", "має", "який має", "входить до складу", "який входить до складу", "який характеризується" або будь-які їх комбінації використовують з метою позначення невиняткового включення, що не підлягає жодному обмеженню. Наприклад, суміш, композиція або спосіб, які містять перелік елементів, не обов'язково обмежуються тільки цими елементами,

але можуть включати інші елементи, не перераховані прямо або не притаманні такій суміші, композиції або способу.

Перехідна фраза "складається з" виключає будь-який елемент, стадію або інгредієнт, які не було визначено. У формулі винаходу така фраза закриває формулу винаходу для включення інших матеріалів, крім тих, які були зазначені, за винятком домішок, зазвичай пов'язаних із ними. У разі наявності в тексті формули винаходу фрази "що складається з", за винятком випадків вживання безпосередньо після преамбули, маються на увазі лише елементи, які викладено у тексті; інші елементи з формули винаходу в цілому не виключені.

Перехідну фразу "що складається по суті з" використовують для визначення суміші, композиції або способу, які включають в себе матеріали, стадії, ознаки, компоненти або елементи, додатково до тих, що розкриті в буквальному сенсі, за умови, що такі додаткові матеріали, стадії, ознаки, компоненти або елементи істотно не впливають на основну (-і) й нову (-і) характеристику (-и) заявленого винаходу. Термін "що складається по суті з" займає проміжне місце між термінами "який містить" і "складається з".

Якщо заявники визначили винахід або його частину необмежувальним терміном, таким як, наприклад "який містить", слід розуміти, що (якщо не зазначено інше) опис слід тлумачити так само, як опис винаходу з використанням термінів "що складається по суті з" або "складається з".

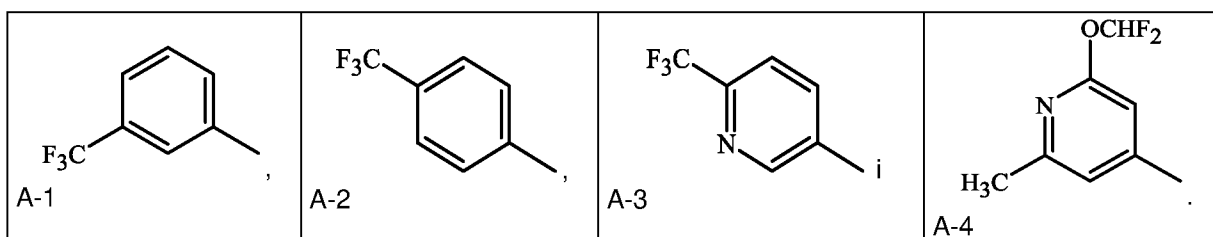
Додатково, якщо прямо не стверджується протилежне, "або" відноситься до інклюзивного "або", а не до ексклюзивного "або". Наприклад, умова А або В задовольняється будь-яким одним із наступних тверджень: "А" істинне (або наявне), а "В" хибне (або ненаявне); "А" хибне (або ненаявне), а "В" істинне (або наявне); і "А", і "В" істинні (або наявні).

Крім того, вживання прихованої невизначеності під час опису елемента або компонента за цим винаходом вважається таким, що не обмежує кількість варіантів (тобто випадків) елемента або компонента. Тому таку невизначеність треба сприймати як "один" або "принаймні один", і опис елемента або компонента в однині включає також і множину, за винятком випадків, коли число явно вказує на однину.

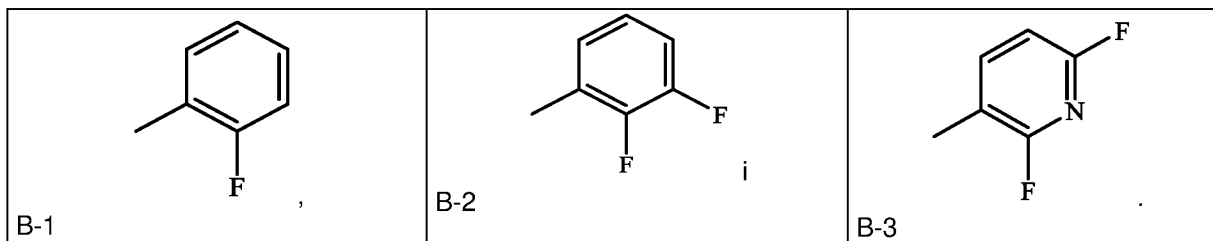
Як зазначається в цьому документі, термін "розсада", що використовується окремо або в словосполученнях, означає молоду рослину, що розвивається з ембріона насінини. Як зазначається тут, термін "широколистий", що використовується окремо або таких словосполученнях як "широколистий бур'ян" означає дводольну або двочасткову рослину, термін, який використовується для опису групи покритонасінних рослин, що характеризуються ембріонами, які мають дві сім'ядолі.

У вищезгаданих формулюваннях термін "алкіл" включає алкіл з нерозгалуженим або розгалуженим ланцюгом, такий як метил, етил, н-пропіл, і-пропіл або різні ізомери бутилу. У сполуці формули I кільце, що містить змінні A¹, A² і A³, може бути представлено наступними структурами, показаними в експонаті 1, де зв'язок, що відходить вправо, вказує на точку приєднання до залишку формули I.

Експонат 1



У сполуці формули I кільце, що містить змінні B¹, B² і B³, може бути представлено наступними структурами, показаними в експонаті 2, де зв'язок, що відходить вліво, вказує на точку приєднання до залишку формули I.

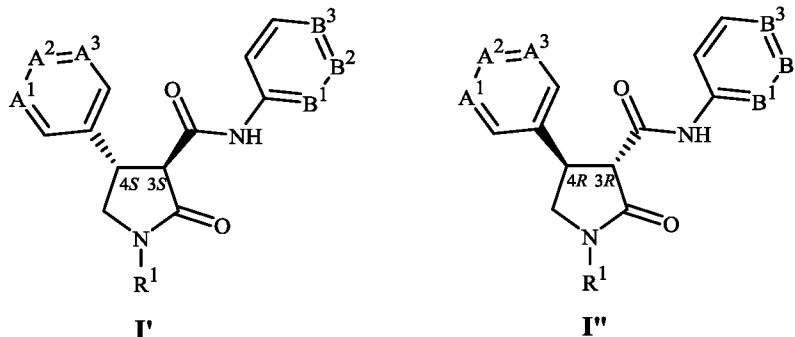


Загальна кількість атомів вуглецю в групі замісників позначається префіксом "C_i-C_j", де i та j являють собою числа від 1 до 4. Наприклад, C₁-C₄ алкіл означає алкіл від метилу до бутилу, включно з різними ізомерами алкільної групи.

Сполуку формули I за цим винаходом можна отримати з використанням способів, викладених в заявках на патент США № 15/101,615 (WO 2015/084796) та PCT/US2016/035214 (WO 2016/196593), які включені в цей документ шляхом посилання.

Сполука формули I а цим винаходом може існувати у вигляді одного або більше стереоізомерів. Різні стереоізомери включають енантіомери, діастереомери, атропізомери та геометричні ізомери. Стереоізомери є ізомерами з однаковим хімічним складом, які відрізняються розташуванням своїх атомів у просторі і включають енантіомери, діастереомери, цис- і транс-ізомери (також відомі як геометричні ізомери) та атропізомери. Атропізомери є результатом обмеженого обертання навколо одинарних зв'язків, де бар'єр обертання є досить високим, щоб дозволити виділення ізомерних видів. Фахівцю в цій галузі буде зрозуміло, що один стереоізомер може бути більш активним і/або може проявляти переважні ефекти, коли його стає більше відносно іншого (-их) стереоізомеру (-ів) або коли він відокремлений від іншого (-их) стереоізомеру (-ів). Крім того, досвідчений фахівець знає, як відокремити, збільшити вміст та/або селективно отримати вказані стереоізомери. Сполука формули I може бути присутня у вигляді суміші стереоізомерів, окремих стереоізомерів або у вигляді оптично активної форми. Сполука формули I за цим винаходом може існувати у вигляді одного або більше конформаційних ізомерів через обмежене обертання навколо амідного зв'язку (наприклад, -C(=O)-NH-) у формулі I. Цей винахід містить суміші конформаційних ізомерів. Крім того, цей винахід включає сполуку формули I, яка має більший вміст одного конформера відносно інших.

Наприклад, функціональна група C=O(NH) (зв'язана з атомом вуглецю в 3-положенні піролідинонового кільця) і кільце, яке містить змінні A¹, A² і A³ (зв'язані з атомом вуглецю у 4-положенні піролідинонового кільця) зазвичай знаходяться в транс-конфігурації. Кожен з цих двох атомів вуглецю має хіральний центр. Дві найпереважніші пари енантіомерів далі зображені як формула I' та формула I'', в яких хіральні центри ідентифіковані (тобто як 3S, 4S або як 3R, 4R). Хоча цей винахід стосується всіх стереоізомерів, переважну енантіомерну пару для біологічної функціональності ідентифікують як формулу I' (тобто конфігурацію 3S, 4S) і, переважно, як транс-конфігурацію. Для всебічного обговорення всіх аспектів стереоізомерії див. Ernest L. Eliel і Samuel H. Wilen, Stereochemistry of Organic Compounds, John Wiley & Sons, 1994.



Наведені тут молекулярні зображення відповідають стандартним правилам зображення стереохімічних властивостей. Для позначення стереоконфігурації зв'язки, які піднімаються від площини рисунка в напрямку до глядача, позначені суцільними клинами, де широкий кінець клина прикріплений до атома, що піднімається від площини рисунка до глядача. Зв'язки, що йдуть нижче площини рисунка в напрямку від глядача, позначаються пунктирними клинами, де широкий кінець клина прикріплений до атома, що знаходиться далі від глядача. Лінії постійної

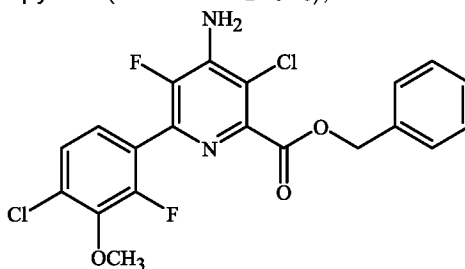
ширини позначають зв'язки, направлені протилежно або нейтрально відносно зв'язків, показаних суцільними або пунктирними клинами; лінії постійної ширини також зображують зв'язки в молекулах або частинах молекул, в яких не передбачається конкретизувати певну стереоконфігурацію.

5 Цей винахід включає рацемічні суміші, наприклад, рівні кількості енантіомерів формул I' і I''. Крім того, цей винахід включає сполуку формули I, яка є збагаченою енантіомерами порівняно з рацемічною сумішшю сполуки формули I. Також включено по суті чисті енантіомери сполуки формули I, наприклад, формула I' і формула I''.

10 У випадку енантіомерного збагачення, один енантіомер присутній у більших кількостях, ніж інший, і ступінь збагачення може бути визначена вираженням енантіомерного надлишку ("ee"), який визначається як $(2x-1) \cdot 100\%$, де x являє собою мольну частку переважного енантіомера в суміші (наприклад, ee 20 % відповідає співвідношенню енантіомерів 60: 40).

15 Переважно композиції за цим винаходом мають принаймні 50 % енантіомерного надлишку; більш переважно принаймні 75 % енантіомерного надлишку; більш переважно принаймні 90 % енантіомерного надлишку; і найбільш переважно принаймні 94 % енантіомерного надлишку більш активного ізомеру. Особливо слід зазначити енантіомерно чисті варіанти втілення більш активного ізомеру.

20 Сполука (b) за цим винаходом являє собою флорпірауксифен-бензил (наприклад, сполука формули II; 2-піридинкарбонової кислоти, 4-аміно-3-хлор-6-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифеніл)-5-фтор-, фенілметиловий естер, який зареєстровано в базі даних CAS під № 1390661-72-9), що містить флорпірауксифен (містить кислотну функціональну групу ($-\text{CO}_2\text{H}$)), естерифіковану бензильною функціональною групою (тобто $-\text{CH}_2\text{C}_6\text{H}_5$);



II

25 Хоча зображено сполуку з бензильною функціональною групою, варіанти втілення сполуки формули II включають заміну бензилу на водень або C_1 – C_4 алкільну функціональну групу, у результаті чого утворюється кислота або C_1 – C_4 алкільний естер. Флорпірауксифен-бензил є комерційно доступним у вигляді, наприклад, гербіциду Loyant™ з активною речовиною Rinskor™ (Dow AgroSciences). Для цих формулювань сполуку формули II отримали згідно зі способами, описаними у WO 2010/125332 A1 і Org. Lett. 2015, 17, 2905 з температурою
30 плавлення 138–142 °C. Альтернативно, флорпірауксифен (тобто кислота) можна отримати відповідно до способів, описаних у патенті США № 7,314,849 (B2), включеному в цей документ шляхом посилання, або придбати в кількості, потрібній для досліджень. Флорпірауксифен-бензил містить атом азоту з вільною парою електронів, здатних протонувати й утворювати солі з кислотами. Особливо придатними для цієї суміші, композиції та способу є солі, утворені з
35 основами. Відомо, що флорпірауксифен-бензил імітує рослинний гормон росту ауксин, і тим самим спричиняє неконтрольований і дезорганізований ріст, що призводить до загибелі сприйнятливих видів рослин ("імітатор ауксину"). У цьому розкритті та формулі винаходу розрахована молекулярна маса флорпірауксифен-бензилу становить 439,2 г/моль.

40 Сполуки формул I та II можуть існувати у більш ніж одній формі і, таким чином, включати всі кристалічні та некристалічні форми сполук, які вони представляють. Некристалічні форми включають варіанти втілення, які являють собою тверді речовини, такі як воски та смоли, а також варіанти втілення, які являють собою рідини, такі як розчини й розплави. Кристалічні форми включають варіанти втілення, які по суті являють собою монокристалічний тип, і варіанти втілення, які являють собою суміш поліморфів (тобто різні кристалічні типи). Термін "поліморф"
45 відноситься до певної кристалічної форми хімічної сполуки, яка може кристалізуватися в різні кристалічні форми, причому ці форми мають різне розташування та/або конформації молекул в кристалічній ґратці. Хоча поліморфи можуть мати однаковий хімічний склад, вони також можуть відрізнятися за складом через наявність або відсутність в ґратці співкристалізованої води чи інших молекул, які можуть бути слабо або сильно зв'язаними. Поліморфи можуть розрізнятися
50 за такими хімічними, фізичними та біологічними властивостями, як форма кристалів, щільність, твердість, колір, хімічна стійкість, температура плавлення, гігроскопічність, швидкість

розчинення та суспендування та біологічна доступність. Фахівцю в цій галузі буде зрозуміло, що поліморф сполук формули I і II може проявляти переважні ефекти (наприклад, відповідність для приготування придатних складів, покращені біологічні характеристики) порівняно з іншим поліморфом або сумішшю поліморфів тих самих сполук формули I і II. Отримання та виділення певного поліморфа сполук формул I та II може бути досягнуто способами, відомими фахівцям у цій галузі, включно, наприклад, з кристалізацією з використанням вибраних розчинників та температур. Для всебічного обговорення поліморфізму див. R. Hilfiker, Ed., Polymorphism in the Pharmaceutical Industry, Wiley-VCH, Weinheim, 2006.

Фахівець у цій галузі зрозуміє, що оскільки у навколишньому середовищі та під впливом фізіологічних умов солі хімічних сполук перебувають у рівновазі з їхніми відповідними не сольовими формами, солі поділяють біологічну функціональність не сольових форм. Таким чином, широке різноманіття солей сполук формул I та II є корисним для боротьби з небажаною рослинністю (тобто є придатними для застосування в сільському господарстві). Солі сполук формул I та II включають солі, отримані шляхом додавання неорганічних або органічних кислот, таких як бромистоводнева, хлористоводнева, азотна, фосфорна, сірчана, оцтова, масляна, фумарова, молочна, малеїнова, малінова, щавлева, пропіонова, саліцилова, винна, 4-толуолсульфонова або валеріанова кислоти.

Варіанти втілення цього винаходу, як описано в розділі "Суть винаходу", включають наступне, де формула I, яка використовується в наступних варіантах втілення, включає її солі.

Варіант втілення 1. Суміш, описана в суті винаходу, де A^1 являє собою CCF_3 , A^2 являє собою CH і A^3 являє собою CH .

Варіант втілення 2. Суміш, описана в суті винаходу, де A^1 являє собою CH , A^2 являє собою CCF_3 і A^3 являє собою CH .

Варіант втілення 3. Суміш, описана в суті винаходу, де A^1 являє собою N , A^2 являє собою CCF_3 і A^3 являє собою CH .

Варіант втілення 4. Суміш, описана в суті винаходу, де A^1 являє собою CCN_3 , A^2 являє собою N і A^3 являє собою $COCHF_2$.

Варіант втілення 5. Суміш за будь-яким одним із варіантів втілення 1–4, де R^1 являє собою метил, етил або пропіл.

Варіант втілення 6. Суміш за варіантом втілення 5, де R^1 являє собою метил або етил.

Варіант втілення 7. Суміш за варіантом втілення 6, де R^1 являє собою метил.

Варіант втілення 8. Суміш за будь-яким одним із варіантів втілення 1–7, де B^1 являє собою CF , B^2 являє собою CH і B^3 являє собою CH .

Варіант втілення 9. Суміш за будь-яким одним із варіантів втілення 1–7, де B^1 являє собою CF , B^2 являє собою CF і B^3 являє собою CH .

Варіант втілення 10. Суміш за будь-яким одним із варіантів втілення 1–7, де B^1 являє собою CF , B^2 являє собою N і B^3 являє собою CF .

Варіант втілення 11. Суміш за будь-яким одним із варіантів втілення 5–7, де A^1 являє собою CCF_3 , A^2 являє собою CH і A^3 являє собою CH , тоді B^1 являє собою CF , B^2 являє собою CH і B^3 являє собою CH (сполука 1).

Варіант втілення 12. Суміш за будь-яким одним із варіантів втілення 5–7, де A^1 являє собою CCF_3 , A^2 являє собою CH і A^3 являє собою CH , тоді B^1 являє собою CF , B^2 являє собою N і B^3 являє собою CF (сполука 2).

Варіант втілення 13. Суміш за будь-яким одним із варіантів втілення 5–7, де A^1 являє собою N , A^2 являє собою CCF_3 і A^3 являє собою CH , тоді B^1 являє собою CF , B^2 являє собою CF і B^3 являє собою CH (сполука 3).

Варіант втілення 14. Суміш за будь-яким одним із варіантів втілення 5–7, де A^1 являє собою CCN_3 , A^2 являє собою N і A^3 являє собою $COCHF_2$, тоді B^1 являє собою CF , B^2 являє собою CF і B^3 являє собою CH (сполука 4).

Варіант втілення 15. Суміш за будь-яким одним із варіантів втілення 5–7, де A^1 являє собою CH , A^2 являє собою CCF_3 і A^3 являє собою CH , тоді B^1 являє собою CF , B^2 являє собою CF і B^3 являє собою CH (сполука 5).

Варіант втілення 16. Суміш за будь-яким одним із варіантів втілення 5–7, де A^1 являє собою CH , A^2 являє собою CCF_3 і A^3 являє собою CH , тоді B^1 являє собою CF , B^2 являє собою N і B^3 являє собою CF (сполука 6).

Варіант втілення 17. Суміш, описана в суті винаходу або в будь-якому одному з варіантів втілення 1–16, в якій масове співвідношення (а) і (б) становить від приблизно 1: 20 до приблизно 56: 1.

Варіант втілення 18. Суміш, описана в суті винаходу або в будь-якому одному з варіантів втілення 1–16, в якій масове співвідношення (a) і (b) становить від приблизно 1: 6 до приблизно 19: 1.

5 Варіант втілення 19. Суміш, описана в суті винаходу або в будь-якому одному з варіантів втілення 1–16, в якій масове співвідношення (a) і (b) становить від приблизно 1: 2 до приблизно 4: 1.

Варіант втілення 20. Суміш, описана в суті винаходу або в будь-якому одному з варіантів втілення 1–16, в якій масове співвідношення (a) і (b) становить від приблизно 100: 1 до приблизно 4: 1.

10 Варіант втілення 21. Суміш, описана в суті винаходу або в будь-якому одному з варіантів втілення 1–16, в якій масове співвідношення (a) і (b) становить від приблизно 75: 1 до приблизно 5: 1.

15 Варіант втілення 22. Суміш, описана в суті винаходу або в будь-якому одному з варіантів втілення 1–16, в якій масове співвідношення (a) і (b) становить від приблизно 50: 1 до приблизно 10: 1.

Варіант втілення 23. Суміш, описана в суті винаходу або в будь-якому одному з варіантів втілення 1–16, в якій масове співвідношення (a) і (b) становить від приблизно 40: 1 до приблизно 10: 1.

20 Варіант втілення 24. Суміш, описана в суті винаходу або в будь-якому одному з варіантів втілення 1–16, в якій масове співвідношення (a) і (b) становить від 37,5: 1 до 12,5: 1.

Варіант втілення 25. Суміш, описана в суті винаходу або в будь-якому одному з варіантів втілення 1–16, в якій масове співвідношення (a) і (b) становить від 25: 1 до 12,5: 1.

Варіант втілення 26. Суміш, описана в суті винаходу або в будь-якому одному з варіантів втілення 1–16, в якій масове співвідношення (a) і (b) становить від 18,75: 1 до 12,5: 1.

25 Варіант втілення 27. Суміш, описана в суті винаходу або в будь-якому одному з варіантів втілення 1–16, в якій масове співвідношення (a) і (b) становить від 25: 1 до 18,75: 1.

Варіант втілення 28. Суміш, описана в суті винаходу або в будь-якому одному з варіантів втілення 1–27, в якій до складу вводять тверді або рідкі розріджувачі.

30 Варіант втілення 29. Суміш за варіантом втілення 28, складена у вигляді твердої розчинної гранули.

Варіант втілення 30. Суміш за будь-яким одним із варіантів втілення 1–29, яка бореться з ростом злакових бур'янів.

Варіант втілення 31. Суміш за будь-яким одним із варіантів втілення 1–29, яка бореться з ростом широколистих бур'янів.

35 Варіант втілення 32. Суміш за будь-яким одним із варіантів втілення 1–29, яка бореться з ростом осокових бур'янів.

Варіант втілення 33. Суміш за будь-яким одним із варіантів втілення 1–29, яка бореться з ростом бур'янів з роду, вибраного із групи, що складається з *Cyperus*, *Echinochloa*, *Heteranthera*, *Leptochloa* і *Monochoria*.

40 Варіант втілення 34. Суміш за варіантом втілення 33, яка бореться з ростом бур'янів з роду *Cyperus*.

Варіант втілення 35. Суміш за варіантом втілення 34, в якому вид являє собою *difformis*.

Варіант втілення 36. Суміш за варіантом втілення 33, яка бореться з ростом бур'янів з роду, вибраного з групи, що включає *Echinochloa* і *Leptochloa*.

45 Варіант втілення 37. Суміш за варіантом втілення 36 яка бореться з ростом бур'янів з роду *Echinochloa*.

Варіант втілення 38. Суміш за варіантом втілення 37, в якому вид являє собою *chinensis*.

Варіант втілення 39. Суміш за варіантом втілення 37, в якому вид являє собою *phylloporon*.

50 Варіант втілення 40. Суміш за варіантом втілення 33 яка бореться з ростом бур'янів з роду *Leptochloa*.

Варіант втілення 41. Суміш за варіантом втілення 40, в якому вид являє собою *chinensis*.

Варіант втілення 42. Суміш за варіантом втілення 33, яка бореться з ростом бур'янів з роду, вибраного з групи, що включає *Heteranthera* або *Monochoria*.

55 Варіант втілення 43. Суміш за варіантом втілення 42 яка бореться з ростом бур'янів роду *Heteranthera*.

Варіант втілення 44. Суміш за варіантом втілення 43, в якому вид являє собою *limosa*.

Варіант втілення 45. Суміш за варіантом втілення 42 яка бореться з ростом бур'янів роду *Monochoria*.

Варіант втілення 46. Суміш за варіантом втілення 45, в якому вид являє собою *vaginalis*.

Варіант втілення 47. Суміш за будь-яким одним із варіантів втілення 30–46, де бур'ян росте в японському рисі (*Oryza sativa*).

Варіанти втілення цього винаходу, включно з варіантами втілення 1–47, описаними вище, а також будь-які інші варіанти втілення, описані в цьому документі, та будь-які їх комбінації, стосуються композицій і способів цього винаходу.

Комбінації варіантів втілення 1–47 проілюстровані наступними варіантами.

Варіант втілення А. Суміш, описана в суті винаходу, де R¹ являє собою метил, етил або пропіл.

Варіант втілення В. Суміш, описана в суті винаходу, де R¹ являє собою метил.

Варіант втілення С. Суміш, описана в суті винаходу, в якій масове співвідношення (а) і (b) становить від приблизно 1: 20 до приблизно 56: 1.

Варіант втілення D. Суміш, описана в суті винаходу, яка бореться з ростом бур'янів з роду, вибраного із групи, що включає *Cyperus*, *Echinochloa*, *Heteranthera*, *Leptochloa* і *Monochoria*.

Варіант втілення Е. Суміш за варіантом втілення D, яка бореться з ростом бур'янів з роду *Cyperus*.

Варіант втілення F. Суміш за варіантом втілення Е, в якому вид являє собою *difformis*.

Варіант втілення G. Суміш, описана в суті винаходу або будь-якому одному з варіантів втілення з А по F, де бур'яни ростуть у *Oryza sativa*.

Суміш за цим винаходом додатково містить (с) принаймні один додатковий активний інгредієнт, який включає гербіциди, антидот гербіцидів, фунгіциди, інсектициди, нематодциди, бактерициди, акарициди, регулятори росту, такі як інгібітори линьки комах і стимулятори укорінення, хімічні стерилізатори, семіохімічні речовини, репеленти, аттрактанти, феромони, стимулятори поїдання, поживні речовини для рослин, інші біологічно активні сполуки або ентомопатогенні бактерії, віруси або гриби, задля отримання багатокомпонентного пестициду, що даватиме навіть ширший спектр сільськогосподарського захисту. Суміш за цим винаходом з іншими гербіцидами може розширити спектр дії проти додаткових видів бур'янів і придушити розростання будь-яких стійких біотипів. Таким чином, цей винахід також стосується композиції, яка додатково містить принаймні одну додаткову біологічно активну сполуку або агент (у біологічно ефективній кількості) і може додатково містити принаймні одне з поверхнево-активної речовини, твердого розріджувача або рідкого розріджувача. Інші біологічно активні сполуки або агенти можуть бути включені до складу композицій, що містять принаймні одне з поверхнево-активної речовини, твердого або рідкого розріджувача. Для сумішей за цим винаходом одна або більше інших біологічно активних сполук або агентів можуть бути включені до складу разом із представленою сумішшю з отриманням преміксу, або одна або більше інших біологічно активних сполук або агентів можуть бути включені до складу окремо від сполуки формули I, і препарати об'єднують разом перед застосуванням (наприклад, у резервуарі з матеріалом для розпорошення) або, альтернативно, застосовують послідовно.

Відповідно, як один додатковий активний інгредієнт (тобто, компонент (с)) принаймні один додатковий активний інгредієнт може являти собою один або декілька наступних гербіцидів, особливо корисних для боротьби з бур'янами: ацетохлор, ацифлуорфен та його натрієву сіль, аклоніфен, акролеїн (2-пропеналь), алахлор, алоксидим, аметрин, амікарбазон, амідосульфурон, аміноциклопірахлор та його естери (наприклад, метиловий, етиловий) та солі (наприклад, натрієві, калієві), амінопіралід, амітрол, сульфамат амонію, анілофос, азулам, атразин, азимсульфурон, бенфлбутамід, беназолін, беназолінетил, бенкарбазон, бенфлуралін, бенфуресат, бенсульфуронметил, бенсулід, бентазон, бензобіциклон, бензофенап, біциклопірон, біфенокс, біланафос, біспірибак і його натрієву сіль, бромацил, бромбутид, бромфеноксим, бромксиніл, бромксинілоктаноат, бутахлор, бутафенацил, бутаміфос, бутралін, бутроксидим, бутилат, кафенстрол, карбетамід, карфентразонетил, катехін, хлометоксифен, хлорамбен, хлорбромурон, хлорфлуренолметил, хлоридазон, хлорімуронетил, хлоротолурон, хлорпрофам, хлорсульфурон, хлорталдиметил, хлортіамід, цинідонетил, цинметилін, циносульфурон, клацифос, клефоксидим, клетодим, клодінафоппропаргіл, кломазон, кломепроп, клопіралід, клопіралідоламін, клорансуламметил, кумілурун, ціаназин, циклоат, циклопіріморат, циклосульфамурон, циклоксидим, цигалофопбутил, 2,4-D та його бутотиловий, бутиловий, ізоктиловий та ізопропіловий естери та його диметиламонієві, діоламінові та троламінові солі, даймурон, далапон, далапон-натрій, дазомет, 2,4-DB та його диметиламонієві, калієві та натрієві солі, дезмедіфам, дезметрин, дикамба та її диглікольамонієві, диметиламонієві, калієві та натрієві солі, дихлобеніл, дихлорпроп, диклофопметил, диклосулам, дифензокат метилсульфат, дифлуфенікан, дифлуфензопір, димефурон, димепіперат, диметаклор, диметаметрин, диметенамід, диметенамід-Р, диметипін, диметиларсинова кислота та її натрієва сіль, динітрамін, динотерб, дифенамід, дикат дибромід, дитіопір, діурон, динітро-

орто-крезол (DNOC), ендоталь, S-етил-N,N-дипропілтіокарбамат (EPTC), еспрокарб, еталфлуралін, етамесульфуронметил, етіозин, етофемесат, етоксифен, етоксисульфурон, етобензанід, феноксапропетил, феноксапроп-П-етил, феноксасульфон, фенхінотріон, фентразамід, фенурон, фенурон-ТСА, флампропметил, флампроп-М-ізопропіл, флампроп-М-метил, флазасульфурон, флорасулам, флуазифопбутил, флуазифоп-П-бутил, флуазолат, флукарбазон, флуцетосульфурон, флухлоралін, флуфенацет, флуфенпір, флуфенпіретил, флумецулам, флуміклорапентил, флуміюксазин, флуометурон, фтороглікофенетил, флупоксам, флупірсульфуронметил і його натрієва сіль, флуренол, флуренолбутил, флуридон, флуорохлоридон, флуороксіпір, флуртамон, флутіацетметил, фомесафен, форамсульфурон, фосамін амонію, глюфозинат, глюфозинат амонію, глюфозинат-П, гліфосат та його солі, такі як амонієва, ізопропіламонієва, калієва, натрієва (включно з сесквісіллю натрію) та тримезійна (альтернативно названа сульфосатом), галауксифен, галауксифенбензил, галауксифенметил, галосульфуронметил, галоксифопетотил, галоксифопметил, гексазінон, гідантоцидин, імазаметабензметил, імазамокс, імазапек, імазапек, імазаквін, імазаквін-амоній, імазетапек, імазетапек-амоній, імазосульфурон, інданофан, індазифлам, іофенсульфурон, йодосульфуронметил, іюксиніл, іюксиніл октаноат, іюксиніл натрій, іпфенкарбазон, ізопротурон, ізоурон, ізоксабен, ізоксафлутол, ізоксахлортол, лактофен, ленацил, лінурон, малеїновий гідразид, 2-метил-4-хлорфеноксиоцтова кислота (MCPA) та її солі (наприклад, MCPA диметиламонію, MCPA калію та MCPA натрію, естери (наприклад, MCPA-2-етилгексил, MCPA бутотил) і тіоестери (наприклад, MCPA тіоетил), 4-(4-хлор-2-метилфенокси) бутанова кислота (MCPB) та її солі (наприклад, MCPB натрій) та естери (наприклад, MCPB-етил), мекопроп, мекопроп-Р, мефенацет, мефлуїдид, мезосульфуронметил, мезотріон, метам-натрій, метаміфоп, метамітрон, метазахлор, метазосульфурон, метабензтіазурон, метиларсонова кислота та її кальцієва, моноамонієва, мононатрієва та динатрієва солі, метилдимрон, метобензурон, метобромурон, метолахлор, S-метолахлор, метосулам, метоксурон, метрибузин, метосульфуронметил, молінат, монолінурон, напроанілід, напропамід, напропамід-М, напталам, небурон, нікосульфурон, норфлуразон, орбенкарб, ортосульфамурон, оризалін, оксадіаргіл, оксадіазон, оксасульфурон, оксазикломефон, оксифлуорфен, паракватдихлорид, пебулат, пеларгонова кислота, пендиметалін, пеноксиулам, пентанохлор, пентоксазон, перфлуїдон, петоксамід, петоксиамід, фенемедифам, піклорам, піклорам-калій, піколінафен, піноксаден, піперофос, претилахлор, примісульфуронметил, продіамін, профоксидим, прометон, прометрин, пропахлор, пропаніл, пропаквізафоп, пропазин, профам, пропізохлор, пропоксикарбазон, пропірисульфурон, пропізамід, просульфоккарб, просульфурон, піраклоніл, пірафлуфенетил, пірасульфотол, піразогіл, піразолінат, піразоксифен, піразосульфуронетил, пірибензоксим, пірибутикарб, піридат, пірифталід, піримінобакметил, піримісульфан, піритіобак, піритіобак-натрій, піроксасульфоп, піроксулам, квінклорак, квінмерак, квінкламін, квізалофопетил, квізалофоп-П-етил, квізалофоп-П-тефурил, римсульфурон, сафлуфенацил, сетоксидим, сидурон, симазин, симетрин, сулькотріон, сульфентразон, сульфометуронметил, сульфосульфурон, 2,3,6-тетрабутиламоній (ТВА), трихлороцтова кислота (ТСА), ТСА-натрій, тебутам, тебутіурон, тефурилтріон, темботріон, тепралоксидим, тербацил, тербуметон, тербутилазин, тербутрин, тенілхлор, тіазопір, тіенкарбазон, тифенсульфуронметил, тіобенкарб, тіафенацил, тіокарбазил, толпіралат, топрамезон, тралкоксидим, триалат, триафамон, триасульфурон, триазифлам, трибенуронметил, триклопек, триклопекбутотил, триклопектріетиламоній, тридифан, триетазин, трифлорисульфурон, трифлудимоксазин, трифлуралін, трифлусульфуронметил, тритосульфурон, вернолат, 3-(2-хлор-3,6-дифторфеніл)-4-гідрокси-1-метил-1,5-нафтиридин-2 (1H)-он, 5-хлор-3-[(2-гідроксі-6-оксо-1-циклогексен-1-іл)карбоніл]-1-(4-метоксифеніл)-2(1H)-хінокалінон, 2-хлор-N-(1-метил-1H-тетразол-5-іл)-6-(трифторметил)-3-піридинкарбоксамід, 7-(3,5-дихлор-4-піридиніл)-5-(2,2-дифторетил)-8-гідроксипіридо[2,3-b]піразин-6(5H)-он, 4-(2,6-діетил-4-метилфеніл)-5-гідрокси-2,6-диметил-3(2H)-піридазінон, 5-[[[(2,6-дифторфеніл)метокси] метил]-4,5-дигідро-5-метил-3-(3-метил-2-тіеніл)ізоксазол (раніше метіюксолін), 4-(4-фторфеніл)-6-[(2-гідроксі-6-оксо-1-циклогексен-1-іл)карбоніл]-2-метил-1,2,4-триазин-3,5(2H, 4H)-діон, метил 4-аміно-3-хлоро-6-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифеніл)-5-фтор-2-піридинкарбоксилат, 2-метил-3-(метилсульфоніл)-N-(1-метил-1H-тетразол-5-іл)-4-(трифторметил) бензамід і 2-метил-N-(4-метил-1,2,5-оксадіазол-3-іл)-3-(метилсульфоніл)-4-(трифторметил) бензамід. Інші гербіциди також включають біогербіциди, такі як *Alternaria destruens* Simmons, *Colletotrichum gloeosporioides* (Penz.) Penz. & Sacc., *Drechslera monoceras* (MTB-951), *Myrothecium verrucaria* (Albertini & Schweinitz) Ditmar: Fries, *Phytophthora palmivora* (Butl.) Butl. і *Puccinia thlaspeos* Schub.

Для кращого контролю над небажаною рослинністю (наприклад нижчої витрати за рахунок підсиленних адитивних ефектів, більш широкого спектру бур'янів, які контролюються, або

підвищення безпеки врожаю) або для запобігання розвитку стійких бур'янів бажаними є суміші сполуки за цим винаходом з гербіцидом, вибраним із групи, що складається з атразину, азимсульфурону, бифлутаміду, бензизотіазолінону, карфентразонетилу, хлоримуронетилу, хлорсульфуронметилу, кломазону, клопіраліду, калію, клорансуламметилу, етаметсульфуронметилу, флуметсуламу, 4-(4-фторфеніл)-6-[(2-гідрокси-6-оксо-1-циклогексен-1-іл) карбоніл]-2-метил-1,2,4-триазин-3,5-(2H, 4H)-діону, флупірссульфуронметилу, флутіацетметилу, фомесафену, імазетапіру, ленацилу, мезотріону, метрибузину, метсульфуронметилу, петоксаміду, піклорами, піроксасульфону, квінклораку, римсульфурону, S-метолахлору, сульфентразону, тифенсульфуронметилу, трифлусульфуронметилу і трибенуронметилу.

Суміші за цим винаходом можуть також використовуватися в комбінації з регуляторами росту рослин, такими як авігліцин, N-(фенілметил)-1H-пурин-6-амін, епохалеон, гіберелінова кислота, гіберелін A₄ і A₇, білок гарпін, хлорид мепіквату, прогексацион кальцію, прогідрожасмон, нітрофенолят натрію й тринексапакметил та організми, що модифікують ріст рослин, такі як штам *Bacillus cereus* BP01.

Загальні посилання на сільськогосподарські засоби захисту (тобто, гербіциди, антидоти гербіцидів, інсектициди, фунгіциди, нематоциди, акарициди й біологічні агенти) включені в The Pesticide Manual, 13th Edition, C. D. S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2003 and The BioPesticide Manual, 2nd Edition, L. G. Copping, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2001.

Для варіантів втілення, де використовується один або більше цих різних компонентів для змішування, компоненти для змішування зазвичай використовуються в кількостях, аналогічних звичайним кількостям використання компонентів сумішей окремо. Більш конкретно, в сумішах активні інгредієнти часто додаються у витратній нормі, яка становить від половини до повної витратної норми застосування окремого активного інгредієнта, зазначеної на етикетках продуктів. Ці кількості викладені в таких посиланнях, як The Pesticide Manual і The BioPesticide Manual. Масове співвідношення цих різних компонентів для змішування (загалом) і цієї суміші зазвичай становить від приблизно 1: 3000 до приблизно 3000: 1. Слід відзначити масові співвідношення від приблизно 1: 300 до приблизно 300: 1 (наприклад, співвідношення від приблизно 1: 30 до приблизно 30: 1). Фахівці в цій галузі можуть за допомогою нескладного експерименту легко визначити біологічно ефективні кількості активного інгредієнта, потрібного для бажаного спектра біологічної активності. Безперечно, включення цих додаткових компонентів може розширити спектр бур'янів, з якими будуть боротися за допомогою цієї суміші, за межі спектру її дії окремо.

У певних випадках комбінації суміші за цим винаходом з іншими біологічно активними (особливо гербіцидними) сполуками або агентами (тобто активними інгредієнтами) може призвести до посиленого адитивного ефекту на бур'яни і/або послабленого адитивного ефекту (тобто, захисного впливу) на сільськогосподарські культури чи інші бажані рослини. Завжди бажано зменшувати кількість активних інгредієнтів, що вивільняються в довкілля, і в той самий час забезпечувати ефективну боротьбу зі шкідниками. Також бажаною є можливість використання більшої кількості активних інгредієнтів для забезпечення більш ефективної боротьби з бур'янами без надмірного пошкодження сільськогосподарських культур. Коли при дотриманні витратної норми гербіцидні активні інгредієнти впливають на бур'яни з підсиленням адитивним ефектом і це забезпечує агрономічно задовільні рівні боротьби з бур'янами, такі комбінації можуть бути переважними для зменшення виробничої собівартості сільськогосподарських культур та зменшення навантаження на довкілля. Коли на сільськогосподарські культури діє засіб, що захищає від гербіцидних активних компонентів, такі комбінації можуть бути переважними для підвищення захисту сільськогосподарських культур за рахунок зменшення конкуренції з бур'янами.

Слід відзначити комбінацію суміші за цим винаходом з принаймні одним іншим гербіцидним активним інгредієнтом (тобто, компонентом (с)). Особливо слід відзначити таку комбінацію, в якій інший гербіцидний активний інгредієнт має іншу ділянку впливу, яка відрізняється як від ділянки впливу компонента (а), так і від ділянки впливу компонента (b) за цим винаходом. У певних випадках комбінація принаймні з одним гербіцидним активним інгредієнтом, який має подібний спектр дії, але іншу ділянку впливу, буде особливо сприятливою для керування опірністю. Таким чином, композиція за цим винаходом може додатково містити (у гербіцидно ефективній кількості) принаймні один додатковий гербіцидний активний інгредієнт, що має схожий спектр боротьби, але іншу ділянку впливу.

Суміші за цим винаходом також можуть бути використані в комбінації з антидотами гербіцидів (тобто, як компонент (с)), вибраними з-поміж алідохлору, беноксакору, флоквінтосет-

мексилу, кумілуруну, ціометринілу, ципросульфонаміду, даймуруну, дихлорміду, дициклонону, діетолату, димепіперату, фенхлоразолетилу, фенклориму, флуразолу, флуксофеніму, фурилазолу, ізоксадифенетилу, мефенпирдіетилу, мефенату, ангідриду метоксифеноннафталіну (1,8-нафталевий ангідрид), оксабетриніл, N-(амінокарбоніл)-2-метилбензолсульфонаміду, N-(амінокарбоніл)-2-фторбензолсульфонаміду, 1-бром-4-[(хлорметил)-сульфоніл]-бензолу (BCS), 4-(дихлорацетил)-1-окса-4-азоспіро[4,5]декану (MON 4660), 2-(дихлорметил)-2-метил-1,3-діоксолану (MG 191), етил-1,6-дигідро-1-(2-метоксифеніл) - 6-оксо-2-феніл-5-піримідинкарбоксилату, 2-гідрокси-N,N-диметил-6-(трифторметил) піридин-3-карбоксаміду та 3-оксо-1-циклогексен-1-іл 1-(3,4-диметилфеніл)-1,6-дигідро-6-оксо-2-феніл-5-піримідинкарбоксилату, 2,2-дихлор-1-(2,2,5-триметил-3-оксазолідиніл)-етанону та 2-метокси-N-[[4-[[[(метиламіно)карбоніл]аміно]феніл]сульфоніл]-бензаміду для підвищення безпеки певних культур. Антидотно ефективні кількості антидотів гербіцидів можна застосовувати одночасно із сумішами за цим винаходом або застосовувати для обробки насіння. Тому аспект цього винаходу стосується гербіцидної суміші, яка містить суміш за цим винаходом і антидотно ефективну кількість антидоту гербіциду. Обробка насіння особливо корисна для селективної боротьби з бур'янами, оскільки фізично антидотом обробляються тільки сільськогосподарські культури. Тому особливо корисним варіантом втілення цього винаходу є спосіб селективної боротьби з ростом небажаної рослинності в культурі, який включає приведення в контакт ділянки культури з гербіцидно ефективною кількістю суміші за цим винаходом, де насіння, з якого вирощується культура, обробляють антидотно ефективною кількістю антидоту. Фахівець у цій галузі може легко визначити антидотно ефективні кількості антидотів шляхом простого експериментування.

Цей винахід також стосується способу боротьби з небажаною рослинністю, який включає нанесення на ділянку вегетації гербіцидно ефективних кількостей суміші за цим винаходом (наприклад, описану в цьому документі композицію). Слід зазначити, що варіанти втілення, які стосуються способів використання, включають у себе суміші за варіантами втілення, описаними вище. Суміші за цим винаходом особливо корисні для селективної боротьби з бур'янами в таких культурах, як пшениця, ячмінь, кукурудза, соя, соняшник, бавовна, олійний ріпак і рис, а також спеціальних культурах, таких як цукрова тростина, цитрусові, плодові та горіхові культури. У цьому винаході заслуговує на увагу селективна боротьба з бур'янами у культурі розсадного рису. Також заслуговує на увагу селективна боротьба з бур'янами у культурі рису, посіяного насінням.

Суміш за цим винаходом зазвичай буде використовуватися як гербіцидний активний інгредієнт у композиції, тобто складі, разом із принаймні одним додатковим компонентом, вибраним із групи, що складається з поверхнево-активних речовин, твердих розріджувачів і рідких розріджувачів, які використовуються як носії. Склад або інгредієнти композиції підбирають так, щоб вони були сумісними з фізичними властивостями активного інгредієнта, способом застосування та факторами довкілля, такими як тип ґрунту, вологість та температура.

Придатні склади включають як рідкі, так і тверді композиції. Рідкі композиції включають розчини (включно з концентратами для приготування емульсії), суспензії, емульсії (включно з мікроемульсіями, емульсіями типу "масло у воді", текучими концентратами й/або суспоемульсіями) тощо, які необов'язково можуть бути загущені до стану гелю. Головними типами водних рідких композицій є розчинний концентрат, концентрат суспензії, капсульована суспензія, концентрована емульсія, мікроемульсія, емульсія типу "масло у воді", текучий концентрат і суспоемульсія. Головними типами неводних рідких композицій є концентрат для приготування емульсії, концентрат для приготування мікроемульсії, концентрат для приготування емульсії дисперсії та олійна дисперсія.

Головними типами твердих композицій є пил, порошки, гранули, пелети, дробинки, таблетки, пігулки, наповнені плівки (включно з нанесенням покриття на насіння) тощо, які можуть бути вододисперсними ("змочуваними") або водорозчинними. Плівки та покриття, сформовані з розчинів, здатних утворювати плівки, або з текучих суспензій, особливо придатні для обробки насіння. Активний інгредієнт може бути (мікро)інкапсульовано й додатково сформовано у суспензію або твердий склад; альтернативно, весь склад активного інгредієнта може бути інкапсульований (або "нанесений у вигляді покриття"). Інкапсуляція може нормувати або затримувати вивільнення активного інгредієнта. Гранула для приготування емульсії суміщає переваги складу концентрату для приготування емульсії з перевагами сухого гранулярного складу. Сильнодіючі суміші головним чином використовуються як проміжні продукти для додаткового складу.

Склади для розпорошення зазвичай розподіляють у придатному середовищі перед розпорошенням. Такі рідкі та тверді склади складаються для того, щоб їх легко було розвести в

середовищі для розпорошення, зазвичай у воді, але іноді в іншому придатному середовищі, наприклад ароматичному чи насиченому вуглеводні або рослинній олії. Об'єми розчину для розпорошення можуть варіюватись від приблизно одного до декількох тисяч літрів на гектар, але типовішим є діапазон від приблизно десяти до декількох сотень літрів на гектар. Склади

5

для розпорошення можуть бути змішані в резервуарах з водою або іншим придатним середовищем для обробки листя повітряним чи наземним застосуванням або для застосування до середовища, в якому зростають рослини. Рідкі та сухі склади можна дозовано розподілятися безпосередньо в крапельні іригаційні системи або дозувати по борознах під час висаджування.

10

Зазвичай склади мають містити ефективні кількості активного інгредієнта, розріджувача та поверхнево-активної речовини приблизно в наступних діапазонах, які додаються до отримання 100 масових відсотків.

	Масовий відсоток		
	Активний інгредієнт, як суміш	Розріджувач	Поверхнево-активна речовина
Вододисперсні й водорозчинні гранули, таблетки та порошки	0,001–90	0–99,999	0–15
Масляні дисперсії, суспензії, емульсії, розчини (включно з концентратами для приготування емульсії)	1–50	40–99	0–50
Пил	1–25	70–99	0–5
Гранули й пелети	0,001–99	5–99,999	0–15
Сильнодіючі композиції	90–99	0–10	0–2

Серед твердих розріджувачів, наприклад, глини, такі як бентоніт, монтморилоніт, палигорськіт (атапульгіт) і каолін, гіпс, целюлоза, діоксид титану, оксид цинку, крохмаль, декстрин, сахари (наприклад, лактоза, сахароза), кремнезем, тальк, слюда, діатоміт, сечовина, карбонат кальцію, карбонат та бікарбонат натрію та сульфат натрію. Типові тверді розріджувачі описані в Watkins et al., Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers, 2nd Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jersey.

15

Рідкі розріджувачі включають, наприклад, воду, N,N-диметилалканаміди (наприклад, N,N-диметилформамід), лімонен, диметилсульфоксид, Налкілпіролідони (наприклад, N-метилпіролідинон), алкілфосфати (наприклад, триетилфосфат), етиленгліколь, триетилгліколь, пропіленгліколь, дипропіленгліколь, поліпропіленгліколь, пропіленкарбонат, бутиленкарбонат, парафіни (наприклад, білі мінеральні масла, нормальні парафіни, ізопарафіни), алкілбензоли, алкілнафталіни, гліцерин, триацетат гліцерину, сорбіт, ароматичні вуглеводні, деароматизовані аліфатичні вуглеводні, алкілбензоли, алкілнафталіни, кетони, такі як циклогексанон, 2гептанон, ізофорон і 4гідрокси-4-метил-2-пентанон; ацетати, такі як ізоамілацетат, гексилацетат, гептилацетат, октилацетат, нонілацетат, тридецилацетат і ізоборнілацетат; інші естери, такі як алкіловані лактатні естери, двоосновні естери алкіл-та арилбензоати та ґбутиролактон; і спирти, які можуть бути лінійними, розгалуженими, насиченими чи ненасиченими, такі як метанол, етанол, нпропанол, ізопропіловий спирт, н-бутанол, ізобутиловий спирт, нгексанол, 2етилгексанол, ноктанол, деканол, ізодециловий спирт, ізооктадеканол, цетиловий спирт, лауриловий спирт, тридециловий спирт, олеїловий спирт, циклогексанол, тетрагідрофурфуріловий спирт, діацетоновий спирт, крезол і бензиловий спирт.

20

25

30

35

Рідкі розріджувачі також включають гліцеринові естери насичених та ненасичених жирних кислот (зазвичай C₆-C₂₂), такі як олії з насіння рослин та фруктів (наприклад, олії з маслини, рицини, льону, кунжуту, кукурудзи (маїсу), арахісу, соняшника, виноградних зерен, сафлору, бавовняного насіння, соєвих бобів, насіння ріпаку, кокосових горіхів і пальмової серцевини), жири тваринного походження (наприклад, яловичий жир, свинячий жир, смалець, масло з печінки тріски, риба'чий жир) та суміші з них. Рідкі розріджувачі також включають алкіловані жирні кислоти (наприклад, метильовані, етильовані, бутильовані), причому ці жирні кислоти можуть бути отримані гідролізом гліцеринових естерів рослинного і тваринного походження, очищених перегонкою. Типові рідкі розріджувачі описані в Marsden, Solvents Guide, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950.

40

45

Тверді та рідкі суміші за цим винаходом часто включають одну чи більше поверхнево-активних речовин. Після додавання до рідини поверхнево-активні речовини (також відомі як ПАР) зазвичай змінюють, найчастіше знижують, поверхневий натяг рідини. Залежно від природи

гідрофільних та ліпофільних груп у молекулі поверхнево-активної речовини ПАР можуть бути придатними як змочувальні засоби, диспергувальні агенти, емульгатори або піногасники.

Поверхнево-активні речовини класифікуються на неіонні, аніонні та катіонні. Неіонні поверхнево-активні речовини, які використовують у цих композиціях, включають, серед іншого, алкоксилатні спирти, такі як алкоксилатні спирти на основі природних і синтетичних спиртів (які можуть бути розгалуженими або лінійними) та приготовані із спиртів і етиленоксиду, пропіленоксиду, бутиленоксиду або їх суміші; амінітоксилати, алканоламіди та етоксильовані алканоламіди; алкоксильовані тригліцериди, такі як етоксильована соєва, рицинова і ріпакова олії; алкілфенолалкоксилати, такі як октилфенолетоксилати, нонілфенолетоксилати, динонілфенолетоксилати й додецилфенолетоксилати (отримані з фенолів та етиленоксиду, пропіленоксиду, бутиленоксиду або їх сумішей); блок-полімери, отримані з етиленоксиду або пропіленоксиду, і блок-полімери зворотнього типу, де кінцеві блоки отримують з пропіленоксиду; етоксильовані жирні кислоти; етоксильовані жирні естери та олії; етоксильовані метилові естери; етоксильовані тристирилфеноли (включно з тими, які отримують з етиленоксиду, пропіленоксиду, бутиленоксиду або їх сумішей); естери жирних кислот, естери гліцерину, похідні на основі ланоліну, естери поліетоксилатів, такі як поліетоксильовані естери жирних кислот і сорбіту, поліетоксильовані естери жирних кислот і сорбітану і поліетоксильовані естери жирних кислот і гліцерину; інші похідні сорбітану, такі як естери сорбітану; полімерні поверхнево-активні речовини, такі як статистичні кополімери, блок-кополімери, алкідні ПЕГ (поліетиленгліколеві) смоли, прищеплені або прищеплені гребнеподібні полімери та зіркоподібні полімери; поліетиленгліколі (ПЕГ); поліетиленгліколеві естери жирних кислот; поверхнево-активні речовини на основі силікону; і похідні цукру, такі як естери сахарози, алкільні поліглікозиди та алкільні полісахариди.

Придатні аніонні поверхнево-активні речовини включають, серед іншого, алкіларилсульфонові кислоти і їх солі; карбоксильовані спирти або етоксилати алкілфенолу; похідні дифенілсульфонату; лігнін та похідні лігніну, такі як лігносульфонати; малеїнові або бурштинові кислоти, або їх ангідриди; олефінові сульфонати; фосфатні естери, такі як фосфатні естери спиртових алкоксилатів, фосфатні естери алкілфенолалкоксилатів і фосфатні естери стирилфенолових етоксилатів; поверхнево-активні речовини на основі білка; похідні саркозину; сульфат стирилфенольного етеру; сульфати й сульфонати олій та жирних кислот; сульфати й сульфонати етоксильованих алкілфенолів; сульфати спиртів; сульфати етоксильованих спиртів; сульфонати амінів та амідів, таких як N,N-алкілтаурати; сульфонати бензолу, кумолу, толуолу, ксилолу, додецилу та тридецилбензолу; сульфонати конденсованих нафталінів; сульфонати нафталіну та алкілнафталіну; сульфонати фракціонованих нафтопродуктів; сульфосукцинаматів; і сульфосукцинати та їх похідні, такі як солі діалкілсульфосукцинатів.

Придатні катіонні поверхнево-активні речовини включають, серед іншого, амідів та етоксильовані амідів; аміни, такі як N-алкілпропандіаміни, трипропілентриаміни і дипропілентетрааміни, етоксильовані аміни, етоксильовані діаміни та пропоксильовані аміни (отримані з амінів та етиленоксиду, пропіленоксиду, бутиленоксиду або їх сумішей); амінові солі, такі як аміноацетати, та діамінові солі; четвертинні амонієві солі, такі як четвертинні солі, етоксильовані четвертинні солі та дичетвертинні солі; і аміноксиди, такі як алкілдиметиламіноксид і оксиди біс-(2-гідроксietил)-алкіламіну.

Також придатними для цих композицій є суміші неіонних та аніонних поверхнево-активних речовин або суміші неіонних та катіонних поверхнево-активних речовин. Неіонні, аніонні та катіонні поверхнево-активні речовини та рекомендації з їх застосування викладено в багатьох опублікованих довідниках, включно з публікацією McCutcheon's Emulsifiers and Detergents, щорічними американськими та міжнародними виданнями, що публікує McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; Sisely and Wood, Encyclopedia of Surface Active Agents, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964; і A. S. Davidson and B. Milwidsky, Synthetic Detergents, Seventh Edition, John Wiley and Sons, New York, 1987.

Композиції за цим винаходом можуть також містити допоміжні та додаткові компоненти складів, відомі фахівцям у цій галузі як добавки до складів (деякі з них можна розглядати також як такі, що функціонують у ролі твердих розріджувачів, рідких розріджувачів або поверхнево-активних речовин). Такі допоміжні та додаткові компоненти складу можуть регулювати: рівень pH (буфери), піноутворення під час обробки (піногасники, як-от поліорганосилоксани), седиментацію активних інгредієнтів (суспендувальні агенти), в'язкість (тиксотропні загусники), ріст мікроорганізмів у контейнері (антимікробні засоби), замерзання продукту (антифризи), колір (дисперсії барвників/пігментів), змив (утворювачі плівок або клейкі засоби), випаровування (сповільнювачі випаровування) та інші властивості складів. До утворювачів плівок відносяться, наприклад, полівінілацетати, кополімери полівінілацетатів, кополімери полівінілпіролідону та

вінілацетату, полівінілові спирти, кополімери полівінілових спиртів із восками. Приклади допоміжних препаратів та добавок складів включають ті, що перераховані в McCutcheon's Volume 2: Functional Materials, щорічних американських та міжнародних виданнях, що публікує McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; і публікації PCT WO 03/024222.

Суміші сполуки формули I та будь-яких інших активних інгредієнтів зазвичай вводять у ці композиції шляхом розчинення активного інгредієнта в розчиннику або розмелюванням у рідкому чи сухому розріджувачі. Розчини, включно з концентратами для приготування емульсії, можна приготувати простим змішуванням інгредієнтів. Якщо розчинник рідкої композиції, що застосовується як концентрат для приготування емульсії, не змішується з водою, зазвичай додають емульгатор, щоб емульгувати розчинник, який містить активний інгредієнт, шляхом розведення водою. Суспензії активного інгредієнта з діаметром частинок до 2000 мкм можна розмолоти вологим способом з використанням середовищних млинів і отримати частинки з середніми діаметрами менше 3 мкм. Водні суспензії можна перетворити на готові концентрати суспензії (див., наприклад, патент США № 3,060,084) або додатково обробити з використанням сушіння розпиленням з утворенням вододисперсних гранул. Сухі склади зазвичай потребують процесу сухого розмелювання, який дозволяє отримати середні діаметри частинок у діапазоні 2–10 мкм. Пил і порошки можна приготувати шляхом змішування і звичайного подрібнення (наприклад, на молотковому млині або струменевому млині). Гранули та пелети можна приготувати розпорошенням активного матеріалу на попередньо приготовані гранулярні носії або за допомогою агломераційних методик. Дивись: "Agglomeration", Chemical Engineering, December 4, 1967, pp 147–48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, стор. 8–57 і наступні, і WO 91/13546. Пелети можна приготувати, як описано в патенті США № U.S. 4,172,714. Вододисперсні або водорозчинні гранули, можна отримати так, як описано в патентах U.S. 4,144,050, U.S. 3,920,442 і DE 3,246,493. Таблетки можна приготувати так, як описано в патентах США № 5,180,587, 5,232,701 і 5,208,030. Плівки можна приготувати, як описано в патентах GB 2,095,558 та U.S. 3,299,566.

Подальшу інформацію, що стосується приготування складу, див. у T. S. Woods, "The Formulator's Toolbox-Product Forms for Modern Agriculture" in Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge, T. Brooks and T. R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, pp. 120–133. Також див. патент U.S. 3,235,361, від стовпчика 6 рядок 16 до стовпчика 7 рядок 19 і приклади 10–41; патент U.S. 3,309,192 від стовпчика 5 рядок 43 до стовпчика 7 рядок 62 і приклади 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138–140, 162–164, 166, 167 і 169–182; патент U.S. 2,891,855 від стовпчика 3 рядок 66 до стовпчика 5 рядок 17 і приклади 1–4; Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pp 81–96; Hance et al., Weed Control Handbook, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989; і Developments in formulation technology, PJB Publications, Richmond, UK, 2000.

У наступних прикладах усі відсотки означають масові відсотки і всі склади готують звичайними способами. Номери сполук відповідають сполукам в таблиці індексів А. Без подальшого уточнення вважається, що фахівці в цій галузі можуть, користуючись попереднім описом, найповніше використати цей винахід. Таким чином, наступні приклади слід тлумачити просто як ілюстративні і не обмежені в розкритті будь-чого будь-яким чином. Відсотки є відсотками за масою, крім випадків, коли зазначено інше.

Приклад А

Сильнодіючий концентрат	
Сполука № 1 і флорпірауксифен-бензил	98,5 %
аерогель кремнезему	0,5 %
синтетичний аморфний очищений оксид кремнію	1,0 %

Приклад В

Змочуваний порошок	
Сполука № 1 і флорпірауксифен-бензил	65,0 %
поліетиленгліколевий етер додецилфенолу	2,0 %
лігнінсульфонат натрію	4,0 %
силікоалюмінат натрію	6,0 %
монтморилоніт (прожарений)	23,0 %

Приклад С

Гранули	
Сполука № 1 і флорпірауоксифен-бензил	10,0 %
гранули аттапульгіту (нелетка речовина, 0,71/0,30 мм; № сита за стандартом США: 25–50)	90,0 %

Приклад D

Екструдована пелета	
Сполука № 1 і флорпірауоксифен-бензил	25,0 %
безводний сульфат натрію	10,0 %
необроблений лігнінсульфонат кальцію	5,0 %
алкілнафталінсульфонат натрію	1,0 %
кальцієвий/магнієвий бентоніт	59,0 %

Приклад Е

Концентрат для приготування емульсії	
Сполука № 1 і флорпірауоксифен-бензил	10,0 %
сорбітолгексаолеат поліоксіетилену	20,0 %
метиловий естер C ₆ –C ₁₀ жирних кислот	70,0 %

Приклад F

Мікроемульсія	
Сполука № 1 і флорпірауоксифен-бензил	5,0 %
кополімер полівінілпіролідон-вінілацетату	30,0 %
алкілполіглікозид	30,0 %
моноолеат гліцерину	15,0 %
вода	20,0 %

5

Приклад G

Концентрат суспензії	
Сполука № 1 і флорпірауоксифен-бензил	35 %
блок-кополімер бутилполіоксіетилену/поліпропілену	4,0 %
кополімер стеаринової кислоти/поліетиленгліколю	1,0 %
стиролакриловий полімер	1,0 %
ксантанова камедь	0,1 %
пропіленгліколь	5,0 %
піногасник на основі кремнію	0,1 %
1,2-бензізотіазолін-3-он	0,1 %
вода	53,7 %

Приклад Н

Емульсія у воді	
Сполука № 1 і флорпірауоксифен-бензил	10,0 %
блок-кополімер бутилполіоксіетилену/поліпропілену	4,0 %
кополімер стеаринової кислоти/поліетиленгліколю	1,0 %
стиролакриловий полімер	1,0 %
ксантанова камедь	0,1 %
пропіленгліколь	5,0 %
піногасник на основі кремнію	0,1 %
1,2-бензізотіазолін-3-он	0,1 %
ароматичний вуглеводень нафтового походження	20,0
вода	58,7 %

Приклад І

Масляна дисперсія	
Сполука № 1 і флорпірауоксифен-бензил	25 %
сорбітолгексаолеат поліоксіетилену	15 %
органічно модифікована бентонітова глина	2,5 %
метиловий естер жирної кислоти	57,5 %

5 Це розкриття також включає приклади від А до І, за винятком того, що "сполуку № 1" замінюють на "сполуку № 2", "сполуку № 3", "сполуку № 4", "сполуку № 5" і "сполуку № 6".

Результати випробувань вказують на те, що суміші за цим винаходом є високоактивними досходовими й/або післясходовими гербіцидами й/або регуляторами росту рослин. Суміші за цим винаходом зазвичай проявляють найвищу активність для післясходової боротьби з бур'янами (тобто застосовуються після виходу бур'янів з ґрунту) і досходової боротьби з бур'янами (тобто застосовуються до появи сходів бур'янів з ґрунту). Багато сумішей за цим винаходом внаслідок селективного метаболізму в культурах порівняно з бур'янами або селективної активності на ділянці фізіологічного гальмування в культурах і бур'янах, або шляхом селективного розміщення на або в середовищі, є придатними для селективної боротьби з трав'янистими і широколистими бур'янами в межах суміші культура/бур'ян. Фахівець у цій галузі визнає, що краща комбінація цих факторів селективності може бути легко визначена шляхом проведення звичайних біологічних і/або біохімічних аналізів. Суміші за цим винаходом можуть проявляти толерантність до важливих агрономічних культур, включаючи, серед іншого, люцерну, ячмінь, бавовну, пшеницю, ріпак, цукровий буряк, кукурудзу (маїс), сорго, соєві боби, рис, овес, арахіс, овочі, помідори, картоплю, багаторічні культури, включаючи каву, какао, олійну пальму, каучукове дерево, цукрову тростину, цитрусові, виноград, фруктові дерева, горіхові дерева, банан, подорожник, ананас, хміль, чай і ліси, такі як евкаліптові та хвойні (наприклад, сосна ладанна), і дернові види (наприклад, тонконіг луговий, августинова трава, костриця і свинорий пальчатий). Слід відзначити культуру рису, посіяну з насіння. Слід відзначити культуру рису, посаджену з розсади. Суміші за цим винаходом можуть бути використані в генетично трансформованих або сортових культурах, щоб забезпечити стійкість до гербіцидів, експресувати білки, токсичні для безхребетних шкідників (наприклад, токсин *Bacillus thuringiensis*) і/або експресувати інші корисні ознаки. Фахівцю в цій галузі буде зрозуміло, що не всі суміші однаково ефективні проти всіх бур'янів. Альтернативно, цільові суміші корисні для модифікації росту рослин.

30 Оскільки суміші за цим винаходом мають як досходову, так і післясходову гербіцидну активність, для боротьби з небажаною рослинністю шляхом знищення або пошкодження рослинності або зменшення її росту, суміш може бути використана різними способами, які включають приведення в контакт гербіцидно ефективною кількістю суміші за винаходом, або композиції, яка містить вказану суміш і принаймні одну поверхнево-активну речовину, твердий розпріджувач або рідкий розпріджувач, з листям або іншою частиною небажаної рослинності або середовищем в якому знаходиться небажана рослинність, таким як ґрунт або вода, в яких росте небажана рослинність, або які оточують насіння або іншу пропагулу небажаної рослинності.

40 Гербіцидно ефективна кількість сумішей за цим винаходом визначається низкою чинників. До таких чинників належать: обраний склад, спосіб застосування, кількість та тип наявної рослинності, умови вирощування тощо. Загалом, гербіцидно ефективна кількість сумішей за

цим винаходом становить приблизно 0,001–20 кг/га з переважним діапазоном від приблизно 0,004 до 1 кг/га, приблизно від 0,004 до 0,5 кг/га, приблизно від 0,004 до 0,25 кг/га, приблизно від 0,004 до 0,1 кг/га, від 0,004 до 0,075 кг/га або від 0,004 до 0,05 кг/га. Фахівці у цій галузі можуть визначити гербіцидно ефективну кількість, необхідну для досягнення бажаного рівня боротьби з бур'янами.

В одному загальному варіанті втілення суміш за цим винаходом зазвичай наносять у складеній композиції на ділянку, яка містить бажану рослинність (наприклад, культури) і небажану рослинність (тобто бур'яни), обидві з яких можуть бути насінням, розсадою та/або більшими за розмірами рослинами, що контактують із середовищем росту (наприклад, ґрунтом). На цій ділянці композиція, яка містить суміш за цим винаходом, може бути безпосередньо нанесена на рослину або її частини, зокрема на небажану рослинність і/або застосована в середовищі росту, яке контактує з рослиною.

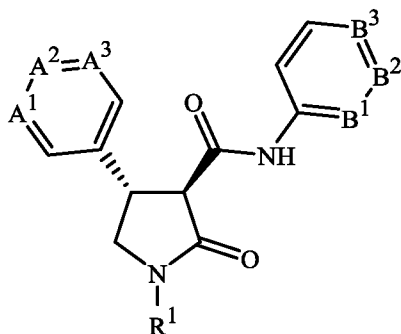
Нові та виведені сорти бажаної рослинності на ділянці, обробленій сумішшю за цим винаходом, можуть бути отримані звичайними способами культивування й селекції, або методами генної інженерії. Генетично модифіковані рослини (трансгенні рослини) являють собою ті рослини, в яких гетерологічний ген (трансген) був стабільно інтегрований у геном рослини. Трансген, який визначається його конкретним місцем розташування в геномі рослини, називається трансформацією або трансгенною подією.

Генетично модифіковані сорти рослин на ділянці, яка може бути оброблена згідно з винаходом, включають ті, що є стійкими до одного або більше біотичних стресів (шкідників, таких як нематоди, комахи, кліщі, грибки тощо) або абіотичних стресів (посуха, холодна температура, засоленість ґрунту тощо), або ті, що мають інші бажані характеристики. Рослини можуть бути генетично модифіковані для проявлення ознак, наприклад, стійкості до гербіцидів, стійкості до комах, модифікованих олійних профілів або посухостійкості. Корисні генетично модифіковані рослини, що містять події трансформації одного гена або комбінації подій трансформації, наведені в експонаті С. Додаткова інформація щодо генетичних модифікацій, перелічених у експонаті С, може бути отримана з загальнодоступних баз даних, що підтримуються, наприклад, Міністерством сільського господарства США.

Гербіцидна суміш може бути складена з окремих інгредієнтів (тобто у вигляді спільної упаковки) і змішаних разом інгредієнтів (тобто як резервуарна суміш). Альтернативно, гербіцидна суміш може бути складена окремо, потім змішана разом перед додаванням в резервуар для розпорошення (тобто гомогенна суміш розчинних гранул). Альтернативно, гербіцидна суміш може бути введена до складу разом, а потім введена до складу препарату (тобто у вигляді розчинних гранул). Кількість кожної сполуки гербіцидної суміші (тобто сполуки (a) і (b) (та необов'язково (c)) можна регулювати відповідно до наявних польових умов. Аналогічно, спосіб застосування гербіцидної суміші або композиції також включає послідовне застосування компонента (a), а потім компонента (b), або застосування а протилежному порядку.

Слід зазначити композицію, яка містить суміш за винаходом (у гербіцидно ефективній кількості), принаймні один додатковий активний інгредієнт, вибраний із групи, що складається з інших гербіцидів та антидотів гербіцидів (в ефективній кількості), і принаймні один компонент, вибраний із групи, що складається з поверхнево-активних речовин, твердих розріджувачів і рідких розріджувачів.

Наступні випробування демонструють ефективність суміші за цим винаходом у боротьбі з визначеними бур'янами. Однак боротьба з бур'янами за допомогою суміші не обмежується цими видами. Для опису сполук див. таблицю індексів А. Аббревіатура "Сполука №" означає "номер сполуки".



ТАБЛИЦЯ ІНДЕКСІВ А

R¹ являє собою CH₃

Сполука №		Температура плавлення, °C
1	A ¹ являє собою CCF ₃ , A ² являє собою CH, A ³ являє собою CH, B ¹ являє собою CF, B ² являє собою CH і B ³ являє собою CH	141,2–142,3
2	A ¹ являє собою CCF ₃ , A ² являє собою CH і A ³ являє собою CH, B ¹ являє собою CF, B ² являє собою N і B ³ являє собою CF	139–140
3	A ¹ являє собою N, A ² являє собою CCF ₃ , A ³ являє собою CH, B ¹ являє собою CF, B ² являє собою CF і B ³ являє собою CH	*
4	A ¹ являє собою CCH ₃ , A ² являє собою N, A ³ являє собою COCHF ₂ , B ¹ являє собою CF, B ² являє собою CF і B ³ являє собою CH	*
5	A ¹ являє собою CH, A ² являє собою CCF ₃ , A ³ являє собою CH, B ¹ являє собою CF, B ² являє собою CF і B ³ являє собою CH	164–165,7
6	A ¹ являє собою CH, A ² являє собою CCF ₃ , A ³ являє собою CH, B ¹ являє собою CF, B ² являє собою N і B ³ являє собою CF	*

* Дані щодо ¹H ЯМР дивіться в таблиці індексів В.

ТАБЛИЦЯ ІНДЕКСІВ В

Сполука №

Дані ¹H ЯМР (розчин CDCl₃, якщо не вказано інше)^a

3	δ 3,04 (с, 3H), 3,53 (дд, 1H), 3,64 (д, 1H), 3,83 (дд, 1H), 4,19 (к, 1H), 6,87–6,93 (м, 1H), 7,00–7,05 (м, 1H), 7,71 (д, 1H), 7,90 (д, 1H), 7,95 (т, 1H), 8,79 (с, 1H), 10,0 (с, 1H).
4	δ 2,48 (с, 3H), 3,01 (с, 3H), 3,43 (дд, 1H), 3,62 (д, 1H), 3,78 (дд, 1H), 4,06 (дд, 1H), 6,69 (с, 1H), 6,88–6,93 (м, 1H), 6,95 (с, 1H), 7,01–7,05 (м, 1H), 7,51 (т, 1H), 7,97–8,01 (м, 1H), 10,03 (с, 1H).
6	δ 3,02 (с, 3H), 3,48 (дд, 1H), 3,64 (д, 1H), 3,81 (дд, 1H), 4,12 (к, 1H), 6,78 (дд, 1H), 7,49 (д, 2H), 7,65 (д, 2H), 8,72 (м, 1H), 10,07 (с, 1H).

^a Дані ¹H ЯМР наведено в м. д. в бік слабкого поля від тетраметилсилану. Зв'язки позначені символами (с)-синглет, (д)-дублет, (т)-триплет, (м)-мультиплет, (к)-квартет, (дд)-дублет дублетів.

БІОЛОГІЧНІ ПРИКЛАДИ ВІНАХОДУ

5 ВИПРОБУВАННЯ А

Насіння лептохлої азійської (LEPCH, *Leptochloa chinensis*), ситі різнорідної (CYPDI, *Cyperus difformis*), монохорії (MOOVA, *Monochoria vaginalis*) і гетерантери (HETLI, *Heteranthera limosa*) висівали на поверхню ґрунту в чотирьох окремих секторах 16-см ванночок, заповнених пастеризованим паром ґрунтом Тама. Одночасно в окремих банках із "заглушкою" були створені насадження плоскухи звичайної (ECHCG, *Echinochloa crus-galli*), японського рису (ORYSA, *Oryza sativa*) та плоскухи рисоподібної (ECHPH, *Echinochloa phyllorogon*). Рослини вирощували в теплиці з використанням додаткового освітлення для підтримки фотоперіоду приблизно 16 год.; денна і нічна температури становили приблизно 27–30 °C і 24–27 °C відповідно. Через 8 днів рослини плоскухи звичайної, рису і плоскухи рисоподібної були пересаджені у 3 сектори окремої ванночки, і рівень води був відрегульований до кінцевої глибини 3 см. Ціллю застосування гербіциду сполуки № 1 і флорпірауксифен-бензилу (зареєстровано в базі даних CAS під № 1390661-72-9; 439,2 г/моль) була стадія появи від 2,0 до 2,5 листка, рослини обробляли досліджуваними хімічними речовинами, введеними до складу в нефітотоксичному розчиннику. Оброблені та контрольні рослини витримували у теплиці протягом 14 днів, після чого всі види порівнювали з контрольними й оцінювали візуально. Показники реакцій рослин підсумовані в таблиці А на основі оцінок за шкалою від 0 до 100, де 0 відповідає відсутності ефекту, а 100 відповідає повному контролю і є середнім значенням повторюваних показників. Відповідь, позначена тире (–), означає відсутність результату тесту.

Для визначення гербіцидних ефектів, очікуваних від сумішей, було використано рівняння Колбі. Рівняння Колбі (Colby, S. R. "Calculating Synergistic and Antagonistic Responses of Herbicide Combinations, " Weeds 1967 15(1), pp. 20–22) розраховує очікуваний адитивний ефект гербіцидних сумішей і для двох активних інгредієнтів за формулою:

$$P_{a+b} = P_a + P_b - (P_a P_b / 100)$$

де P_{a+b} - очікуваний ефект суміші від адитивного внеску окремих компонентів, виражений у відсотках:

P_a - спостережуваний ефект першого активного інгредієнта у відсотках у тій же нормі використання, що і в суміші, і

P_b - спостережуваний ефект другого активного інгредієнта у відсотках у тій же нормі використання, що і в суміші.

Результати та адитивні ефекти, очікувані за розрахунком з використанням рівняння Колбі, викладені в таблиці А. Норма застосування виражається як грам активного інгредієнта на гектар (г а. і/га). "Спостер." означає "спостережуваний ефект" і "очік." означає очікуваний ефект за рівнянням Колбі.

Таблиця А

Спостережувані та очікувані результати для сполуки 1 окремо і в комбінації з флорпірауксифен-бензилом (zareєстровано в базі даних CAS під № 1390661-72-9; 439,2 г/моль)

Норма використання (г а. і/га)		Культура		Злакові бур'яни					
		ORYSA		ECHCG		ECHPH		LEPCN	
Сполука № 1	Флорпірауксифен-бензил	Спостер.	Очік.	Спостер.	Очік.	Спостер.	Очік.	Спостер.	Очік.
50	–	0	–	70	–	75	–	75	–
75	–	0	–	70	–	85	–	85	–
–	2	0	–	0	–	0	–	0	–
–	4	0	–	0	–	0	–	0	–
50	2	0	0	75	70	85	75	75	75
75	2	0	0	75	70	90	85	90	85
50	4	0	0	75	70	80	75	75	75
75	4	0	0	75	70	90	85	85	85

Таблиця А(продовження)

Норма використання (г а. і/га)		Широколисті бур'яни				Осока	
		MOOVA		HETLI		CYPDI	
Сполука № 1	Флорпірауксифен-бензил	Спостер.	Очік.	Спостер.	Очік.	Спостер.	Очік.
50	–	70	–	70	–	0	–
75	–	70	–	70	–	0	–
–	2	90	–	90	–	80	–
–	4	100	–	100	–	85	–
50	2	100	97	100	97	80	80
75	2	100	97	100	97	85	80
50	4	100	100	100	100	100	85
75	4	100	100	100	100	100	85

Як видно з результатів, наведених у таблиці А, усі спостережувані результати для видів бур'янів були більшими, ніж результати, очікувані згідно з рівнянням Колбі, що показує адитивний ефект сполуки 1 та флорпірауксифен-бензилу на ECHCG і ECHPH. Спостережувані результати для видів бур'янів були підсиленими адитивними або такими, що не поступаються результатам, очікуваним згідно з рівнянням Колбі, тим самим показуючи адитивні або очікувані результати впливу на LEPCN та CYPDI. Також у разі застосування суміші, подібно до окремого використання сполуки 1 і флорпірауксифен-бензилу спостерігалась чудова безпека для культури рису.

ВИПРОБУВАННЯ В

Насіння видів рослин, вибраних з-поміж плоскухи звичайної (*Echinochloa crus-galli*), кохії (*Kochia scoraria*), амброзії (амброзії звичайної, *Ambrosia elatior*), райграсу італійського (райграс італійський, *Lolium multiflorum*), щетинника зеленого (щетинник зелений, *Setaria viridis*) і амаранту (*Amaranthus retroflexus*), висаджували у суміш суглинного ґрунту і піску і досходово обробляли шляхом прямого розпорошення на ґрунт досліджуваних хімічних речовин, введених до складу суміші з нефітотоксичним розчинником, до якої включили поверхнево-активну речовину.

У той же час рослини, вибрані з-поміж цих видів бур'янів, а також пшеницю (*Triticum aestivum*), кукурудзу (*Zea mays*), лисохвіст (*Alopecurus myosuroides*) і підмаренник (підмаренник чіпкий, *Galium aparine*) висадили в горщики, які містили ту саму суміш суглинного ґрунту і піску, і післясходово обробили досліджуваними хімічними речовинами, складеними в такий самий спосіб. Рослини для післясходової обробки знаходились у діапазоні висот 2–10 см і були на стадії росту від одного до двох листків. Оброблені та контрольні необроблені рослини витримували у теплиці протягом 10 днів, після чого всі оброблені рослини порівнювали з контрольними й оцінювали візуально на наявність пошкоджень. Показники реакцій рослин підсумовані в таблиці В на основі оцінок за шкалою від 0 до 100, де 0 відповідає відсутності ефекту, а 100 відповідає повному контролю. Відповідь, позначена тире (–), означає відсутність результату тесту.

Таблиця В	Сполука №	Таблиця В	Сполука №
125 г а. і/га	4	31 г а. і/га	4
Післясходова		Післясходова	
Плоскуха звичайна	90	Плоскуха звичайна	80
Лисохвіст	70	Лисохвіст	60
Кукурудза	80	Кукурудза	60
Щетинник зелений	90	Щетинник зелений	70
Підмаренник	60	Підмаренник	0
Кохія	20	Кохія	0
Амарант	60	Амарант	20
Амброзія	60	Амброзія	0
Райграс італійський	70	Райграс італійський	30
Пшениця	70	Пшениця	40

Таблиця В	Сполука №	Таблиця В	Сполука №
125 г а. і/га	4	31 г а. і/га	4
Досходова		Досходова	
Плоскуха звичайна	100	Плоскуха звичайна	100
Щетинник зелений	100	Щетинник зелений	100
Кохія	80	Кохія	0
Амарант	90	Амарант	40
Амброзія	20	Амброзія	0
Райграс італійський	90	Райграс італійський	30

ВИПРОБУВАННЯ С

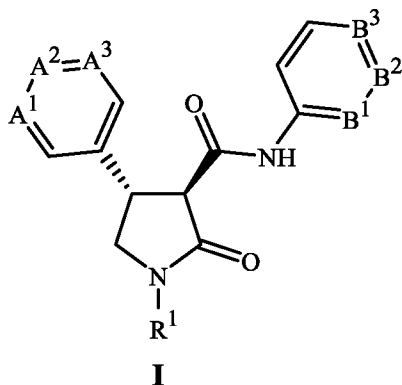
Види рослин у випробуванні зрошуваного затопленням рисового поля вибрані з-поміж рису (*Oryza sativa*), ситі різнорідної (сить різнорідна, *Cyperus difformis*), гетерантери (*Heteranthera limosa*) і плоскухи звичайної (*Echinochloa crus-galli*) вирощували для випробування до стадії появи 2 листків. Під час обробки випробувальні горщики затоплювали на 3 см над поверхнею ґрунту, обробляли шляхом додавання досліджуваних сполук безпосередньо у воду для зрошення затопленням рисового поля, і потім підтримували такий рівень води протягом випробування. Оброблені та контрольні рослини витримували у теплиці протягом 13–15 днів, після чого всі види порівнювали з контрольними й оцінювали візуально. Показники реакцій рослин підсумовані в таблиці С на основі оцінок за шкалою від 0 до 100, де 0 відповідає відсутності ефекту, а 100 відповідає повному контролю. Відповідь, позначена тире (–), означає відсутність результату тесту.

Таблиця С	Сполука №
250 г а. і/га	4

Затоплення	
Плоскуха звичайна	85
Гетерантера	100
Рис	30
Сить різнорідна	0

ФОРМУЛА ВИНАХОДУ

1. Суміш, яка містить (а) сполуку формули I або її солі:



5

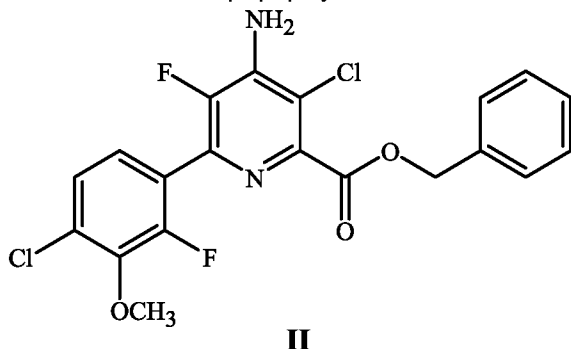
де

A¹ являє собою CCF₃, A² являє собою CH, A³ являє собою CH, B¹ являє собою CF, B² являє собою CH і B³ являє собою CH;

R¹ являє собою C₁-C₄алкіл;

10

і (b) 2-піридинкарбоної кислоти 4-аміно-3-хлор-6-(4-хлор-2-фтор-3-метоксифеніл)-5-фтор-, фенілметилловий естер формули II або його солі:



2. Суміш за п. 1, яка **відрізняється** тим, що R¹ являє собою метил, етил або пропіл.

3. Суміш за п. 2, яка **відрізняється** тим, що R¹ являє собою метил.

15

4. Суміш за п. 1, яка **відрізняється** тим, що масове співвідношення (а) і (b) становить від приблизно 1:20 до приблизно 56:1.

5. Суміш за п. 1, яка додатково містить (с) принаймні додатковий активний інгредієнт, вибраний з гербіцидів, антидотів гербіцидів, фунгіцидів, інсектицидів, нематодцидів, бактеріцидів і акарицидів.

20

6. Суміш за п. 1, яка додатково містить принаймні один компонент, вибраний із групи, що складається з поверхнево-активних речовин, твердих розріджувачів і рідких розріджувачів.

7. Спосіб боротьби з ростом небажаної рослинності, який включає приведення в контакт рослини або її середовища з гербіцидно ефективною кількістю суміші за п. 1.

8. Спосіб за п. 7, де суміш контролює ріст бур'яну роду, вибраного з групи, що складається з Cyperus, Echinochloa, Heteranthera, Leptochloa і Monochoria.

25

9. Спосіб за п. 8, де суміш контролює ріст бур'яну роду Cyperus.

10. Спосіб за п. 9, де являє собою difformis.

11. Спосіб за п. 10, де бур'яни ростуть в Oryza sativa.