

(19)



**Евразийское
патентное
ведомство**

(11) **034509**

(13) **B1**

(12) **ОПИСАНИЕ ИЗОБРЕТЕНИЯ К ЕВРАЗИЙСКОМУ ПАТЕНТУ**

- | | |
|--|---|
| (45) Дата публикации и выдачи патента
2020.02.14 | (51) Int. Cl. <i>A01N 25/02</i> (2006.01)
<i>A01N 37/18</i> (2006.01)
<i>A01N 43/72</i> (2006.01)
<i>A01N 43/88</i> (2006.01)
<i>A01P 13/02</i> (2006.01) |
| (21) Номер заявки
201800082 | |
| (22) Дата подачи заявки
2018.02.06 | |

(54) **ГЕРБИЦИДНАЯ КОМПОЗИЦИЯ НА ОСНОВЕ БЕНТАЗОНА ДЛЯ ЗАЩИТЫ
ЗЕРНОБОБОВЫХ КУЛЬТУР**

- | | |
|------------------------|-----------------------|
| (31) 2017125317 | (56) WO-A2-2012030684 |
| (32) 2017.07.17 | WO-A2-2009029518 |
| (33) RU | WO-A1-1997017852 |
| (43) 2019.01.31 | |

(71)(73) Заявитель и патентовладелец:
АО "ЩЕЛКОВО АГРОХИМ" (RU)

(72) Изобретатель:
**Славашевич Марина Александровна,
Стручков Дмитрий Сергеевич,
Желтова Елена Владимировна,
Каракотов Салис Добаевич (RU)**

(74) Представитель:
Князева Л.А. (RU)

(57) Изобретение относится к области агрохимических составов на основе бентазона. В частности, изобретение относится к гербицидной композиции гидрофобных пестицидов, которые стабильны при хранении и обладают повышенной эффективностью при защите зернобобовых культур по сравнению с обычными составами. Полученный технический результат заключается в том, что бентазон находится в наиболее мелкодисперсном состоянии, что обеспечивает высокую биологическую активность, композиция обладает высокой химической стабильностью при хранении, стабильностью рабочей жидкости при применении. Для решения поставленной технической задачи необходимо использовать гербицидную композицию, включающую в качестве активного соединения 3-(1-метилэтил)-1Н-2,1,3-бензотиадазин-4(3Н)-он 2,2-диоксида (бентазон) и вспомогательное вещество. При этом бентазон используют в виде кислоты, растворенной в адьюванте, в качестве которого используют амид карбоновой кислоты при соотношении, мас.%, 1: (0,2-10) соответственно.

B1

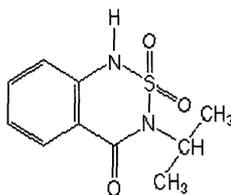
034509

034509

B1

Изобретение относится к области агрохимических составов на основе бентазона. В частности, изобретение относится к гербицидной композиции гидрофобных пестицидов, которые стабильны при хранении и обладают повышенной эффективностью при защите зернобобовых культур по сравнению с обычными составами.

Бентазон представляет собой 3-(1-метилэтил)-1Н-2,1,3-бензотиадиазин-4(3Н)-он 2,2-диоксида (см. формулу 1), практически нерастворим в воде. Его гербицидное действие описано в The Pesticide Manual, 2015



формула 1

Бентазон борется с широким диапазоном экономически важных широколистных и осоковых сорняков. Он может быть применен собственно в виде кислоты или в виде сельскохозяйственно-приемлемой соли или сложного эфира. Применение в виде соли является предпочтительным, при этом наиболее предпочтительной является натриевая соль. Бентазон (bentazon) также известен как бентазон (bentazone) и бендиоксид (bendioxide). Традиционно препараты на основе бентазона применяются либо в виде водных растворов (ВР, ВРК), представляющих собой соли бентазона, растворенные в воде, либо в виде смачивающихся порошков (СП), представляющие собой смесь бентазона и вспомогательных компонентов, которые при добавлении воды образуют рабочие жидкости в виде водных суспензий. При этом в первом случае действующим веществом является соль бентазона, обычно натриевая соль бентазона, а во втором случае - сам бентазон в виде мелких нерастворимых в воде частиц.

На территории РФ разрешены к применению следующие гербициды на основе бентазона: Базагран, ВР, Корсар, ВРК, Базон, ВР. Во всех указанных препаратах используют бентазон в виде натриевой соли. (Справочник пестицидов и агрохимикатов, разрешенных к применению на территории РФ, 2016).

При таком разнообразии ассортимента гербицидов для сельскохозяйственных культур необходим компетентный выбор, который бы обеспечил наилучшее контролирование сорной растительности в посевах и соблюдение экологической безопасности. Не все из рекомендованных гербицидов способны эффективно решить проблему засоренности.

В зависимости от того, какие надо получить биологические и/или физико-химические параметры препарата, рассматривают в качестве возможных композиций, например: смачивающийся порошок (СП), эмульсии масло в воде (м/в) или вода в масле (в/м), суспензии (КС), суспензии (СЭ), эмульгируемые концентраты (КЭ), или диспергируемые в воде грануляты (ВДГ) для обработки вегетирующих растений.

Гидрофобные пестициды, к которым относится бентазон, обычно получают в виде сухих составов вследствие их нерастворимости в воде, которые могут быть получены в виде гранул с относительно большим размером частиц, в виде порошкообразной пыли, в виде смачиваемых порошков, в виде эмульгируемых концентратов, в виде растворов солей или в виде любого из нескольких других известных типов составов.

Эффективность действия гербицида зависит не только от нормы расхода действующего вещества на единицу площади, а также от того, в каком виде это действующее вещество попадает на сорное растение. Известно, что в случае рабочих жидкостей, представляющих собой водную суспензию твердых действующих веществ, чем меньше размер частиц действующего вещества, тем выше эффективность его воздействия на сорняки.

В результате проведенного патентного поиска были отобраны для последующего анализа следующие патенты.

Известна синергическая гербицидная композиция, содержащая пеноксулам и бентазон для контроля сорняков в сельскохозяйственных культурах. Синергическая гербицидная смесь включает гербицидно-эффективное количество пеноксулама и бентазона, или его сельскохозяйственно-приемлемой соли, или сложного эфира, в которой весовое соотношение бентазона, или его сельскохозяйственно-приемлемой соли, или его сложного эфира к пеноксуламу составляет от 67:1 до 333:1 (патент РФ 2608700).

Известна устойчивая композиция гербицидного концентрата, содержащая: а) дисперсную фазу твердого пестицида, нерастворимого в воде; б) непрерывную водную фазу, содержащую водорастворимую соль пестицида, представляющую собой бентазон-натрий; в) по меньшей мере одного совместимого реологического агента; и д) по меньшей мере одного смачивателя-диспергатора (патент РФ 2622331).

Наиболее близким к заявляемой композиции является препарат Базагран, ВР, используемый в виде Na - соли (The Pesticide Manual, 2015).

Общими недостатками известных композиций являются недостаточная биологическая активность в уничтожении сорной растительности и наличие в препарате нескольких активных компонентов. Подбор оптимальной системы и оптимальной концентрации для конкретного пестицидного применения зачастую представляет собой сложную задачу.

Задачей настоящего изобретения было создание экономичного препарата, имеющего простой и доступный состав, устранение экологических последствий от применения различных смесевых препаратов с повышенными нормами расхода в посевах сои, гороха, нута и кормовых бобов.

Полученный технический результат заключается в том, что бентазон находится в наиболее мелко-дисперсном состоянии, что обеспечивает высокую биологическую активность, композиция обладает высокой химической стабильностью при хранении, стабильностью рабочей жидкости при применении.

Для решения поставленной технической задачи необходимо использовать гербицидную композицию, включающую в качестве активного соединения 3-(1-метилэтил)-1Н-2,1,3-бензотиадазин-4(3Н)-он 2,2-диоксида (бентазон) и вспомогательное вещество. При этом бентазон используют в виде кислоты, растворенной в адьюванте, в качестве которого используют амид карбоновой кислоты при соотношении мас.% 1:(0,2-10) соответственно.

Для этого был проверен ряд органических растворителей и их смесей, которые бы эффективно переводили бентазон, представляющий собой твердое вещество, в раствор. В качестве таких растворителей были использованы ксилол, сольвент, N,N-метилпирролидон, N,N-диметилформамид, N,N-диметилацетамид, N,N-диметилпентанамид, N,N-диметилформамид, N,N-диметилгексанамид, N,N-диметилгектанамид, N,N-диметилдеканамид, N,N-диметилформамид, изофорон, этилацетат, дихлорметан, ацетон, этанол и их смеси.

Неожиданно оказалось, что несмотря на достаточно высокую растворимость бентазона в указанных органических растворителях с образованием прозрачных растворов максимальную биологическую эффективность в уничтожении сорной растительности показали готовые гербицидные формуляции, содержащие лишь растворители из класса амидов карбоновых кислот. По-видимому, амиды карбоновых кислот не только обладают достаточной полярностью для растворения бентазона, но и обеспечивают эффективный транспорт действующего вещества в точки роста сорного растения, повышая тем самым эффективность его воздействия.

Препарат дополнительно может содержать хизалофоп-П-этил или другой граминцид из класса производных оксифенокси-карбоновых кислот.

В условиях вегетационного опыта была изучена видовая (соя, горох, кормовые бобы) чувствительность культурных растений к заявляемой композиции.

Была найдена определенная система активное вещество - адьювант, специфическим образом подходящая для получения жидких композиций с размером частиц менее 80 нм.

С предлагаемой системой в соответствии с изобретением можно получать неожиданно стабильные композиции активного вещества, нерастворимого в воде, являющиеся оптически прозрачными и термодинамически стабильными растворами активного вещества бентазона и адьюванта, которые включены в препарат соответствующим способом (см. табл. 1). В условиях лаборатории искусственного климата были изучены композиции, приведенные в табл. 2.

Амиды карбоновых кислот были предложены для того, чтобы повысить растворимость бентазона в нужной среде по отношению к другим молекулам. Кроме того, амиды карбоновых кислот предотвращают образование кристаллов в жидкости в мицеллярной системе. Это повысило до максимума активность гербицидной композиции через множество функций, таких как повышение удерживания капель на поверхности листа, трудно поддающейся увлажнению и повышение проникновения композиции в кутикулу растения.

Авторами данного изобретения также было неожиданно обнаружено, что применение указанных конкретных соединений приводит помимо известного эффекта защиты культур к повышению уровня подавления некоторых важных видов сорной растительности (в частности, например, *Salsola tragus* L. и *Viola arvensis* Murr) (см. табл. 3). Однако до настоящего времени указанный эффект для данной комбинации известен не был.

Предлагаемая система в соответствии с изобретением позволила получить композицию с иными, нежели представленные бентазон-соль и бентазон кислота, взятые для сравнения. Заявляемая композиция не оказывала отрицательного влияния на рост и развитие культурных растений. Применение гербицидной композиции на посевах бобовых культур (соя, гороха, кормовых бобов) снизило экологическую нагрузку (в 1,5-2 раза) при сохранении высокой биологической (96-98%) и экономической (уровень рентабельности 70-265%) эффективности в разные периоды наблюдений.

Бентазон относится к препаратам, ингибирующим фотосинтез. При метаболизме гербицида в растениях молекула гидроксильруется в положениях 6 и 8. Получившиеся гидроксильные производные связываются с моно- и полисахаридами растений в прочные конъюгаты. Абсорбируется листьями растений, но перемещение его по растению незначительно.

Изобретение иллюстрируется следующими примерами.

Пример 1. Способ получения композиции.

В амид карбоновой кислоты добавляют в биологически эффективных количествах бентазон в виде кислоты при заявляемых соотношениях. Перемешивают при нагревании до 25°C до полного растворения. Добавляют известные вспомогательные вещества, например ПАВ, при перемешивании до получения однородного состава.

Пример 2. Испытание композиции на химическую стабильность.

Испытания проводили в термокамере ТС-1/80СПУ. Определение устойчивости водных суспензионных концентратов и растворов, содержащих бентазон-*Na*-соль, бентазон-кислота и бентазон-кислота с адьювантом при хранении. Методом ВЭЖХ определяли количество ингредиентов в растворе. Размеры частиц в рабочей жидкости определяли с помощью микросайзера ф. FRITTSCH.

Приготовленные рабочие жидкости хранили при температуре 30°C в течение 30 дней. Затем образцы оценивали по гомогенности, изменению концентрации бентазона и стабильности водных композиций. Образцы, оцененные как устойчивые, не имели изменения в концентрации действующего вещества при сравнении с исходными образцами, хранившимися при комнатной температуре. Результаты сведены в табл. 1.

Пример 3. Лабораторные биологические испытания.

Испытания проводили в лаборатории искусственного климата. В качестве модели двудольных сорняков использовали подсолнечник.

Условия проведения опыта.

Опрыскивание растений проводили в фазу 2-4 листа. Посев в почву на глубину 3-4 см по 4 повторам в варианте. Выращивание при 22-23°C и режиме освещения 10000 Люкс при 16-часовом световом дне. Срок учета в опыте 23-е сутки после обработки.

Полученный эффект гарантирует повышенную надежность в борьбе с конкурирующими сорняками сельскохозяйственных культур, Норма расхода в лабораторных условиях заявленной композиции 240 г/га, бентазона *Na*-соль и бентазона кислоты - 240 г/га (в пересчете на кислоту). Результаты представлены в табл. 2.

В качестве амида карбоновой кислоты использовали *N,N*-диметилформаид (опыт 7), *N,N*-диметилдеканаид (опыт 8), диметилацетамид (опыт 6), *N,N*-диметилдеканаид (опыт 8), *N,N*-диметилпентанаид (опыт 9). В опыте 4 использовали изофорон, относящийся к классу ненасыщенные циклические кетоны, и этилацетат (опыт 5), относящийся к классу эфиров карбоновых кислот.

Пример 4. Мелкоделяночные биологические испытания.

Полевой мелкоделяночный опыт, культура - соя.

Место проведения опыта: Российская Федерация, Алтайский край. Почвенно-климатическая зона: I - зона подзолистых и дерново-подзолистых почв таежно-лесной области, норма высева семян: 180 кг/га. Фаза развития растений в момент обработки: 2-3 настоящих листьев.

В табл. 3 представлено влияние композиции (бентазон:диметилдеканаид) 1:0,5 на отдельные виды сорных растений в посевах сои. Норма расхода заявляемой композиции и эталона - 900 г/га.

Помимо известного эффекта защиты культур к повышению уровня подавления некоторых важных видов сорной растительности обнаружена чувствительность гербицида к *Salsola tragus* L. и *Viola arvensis* Murr.

Средняя урожайность сои при использовании заявленной композиции - 17,4 ц/га, при использовании бентазон-соли - 14,5 ц/га, при использовании бентазон-кислоты - 13,8 ц/га.

Аналогичные результаты получены на горохе и нуте.

Заявляемая композиция при очень хорошей переносимости смеси целевыми растениями проявляет очень высокую гербицидную активность и может применяться для селективной борьбы с сорняками в бобовых культурах, в частности соя, горох, нут.

Таблица 1. Стабильность композиции при хранении

№№	Композиции, (соотношения)	Содержание бентазона в растворе при хранении, %		Характеристика рабочей жидкости		
		Исходное	30° С, через 30 дней	Агрегатное состояние раб. ж-ти	Размер частиц в раб. ж-ти	Стабильность раб. ж-ти через 24 час.
1	Бентазон кислота	45,1	44,9	суспензия	2-3 мкм	Осадок снизу – 3мл Осветление сверху – 5мл
2	Бентазон, Na-соль	45,1	45,0	раствор	Раствор	стабильный
3	Бентазон к-та + N,N-диметилгексанамид (1 : 0.1)	30,0	30,0	эмульсия	0,2-0,3 мм	Осадок 28мл
4	Бентазон к-та + N,N-диметилацетамид (1 : 1)	30,0	30,0	эмульсия	меньше 80нм	стабильный
5	Бентазон к-та + N,N-диметилформаид (1 : 10)	3,1	3,1	эмульсия	меньше 80нм	стабильный
6	Бентазон к-та + N,N-диметилгексанамид (1 : 0.2)	30,2	30,1	эмульсия	меньше 80нм	стабильный
7	Бентазон к-та + N,N-диметилгексанамид +ХЗЭ (1 : 1,33 : 0,17)	30,0	29,9	эмульсия	меньше 80нм	Стабильный
8 сравнительный	Бентазон к-та + изофорон (1 : 1)	29,9	26,3	эмульсия	10—12 мкм	Осадок 5 мл
9 сравнительный	Бентазон к-та + этилацетат (1:0.67)	30,2	28,7	эмульсия	20-25 мкм	Осадок 8 мл

Таблица 2

№№ опыта	Композиция, (соотношение компонентов)	Биологическая эффективность, %
1	Бентазон кислота	52
2	Бентазон Na-соль	73
3	Бентазон к-та + N,N-диметилгексанамид (1 : 2)	98
4	Бентазон к-та + N,N-диметилацетамид (1:1)	98
5	Бентазон к-та + N,N-диметилформаид (1:5)	96
6	Бентазон к-та : N,N-диметилдеканамид, (1 : 0,2)	98
7	Бентазон к-та : N,N-диметилпентанамид, (1 : 10)	97
8	Бентазон к-та + изофорон (1:1)	74
9	Бентазон к-та + этилацетат (1 : 0,67)	77

Таблица 3

Варианты опыта,	Снижение количества сорных растений, % к контролю							
	<i>Solanum nigrum</i>	<i>Chenopodium album</i>	<i>Salsola tragus</i>	<i>Fallopia convolvulus</i>	<i>Amaranthus retroflexus</i>	<i>Viola arvensis</i>	<i>Polygonum aviculare</i>	<i>Xanthium strumarium</i>
Бентазон к-та + диметилдеканамид (1: 0,5)	81.8	89.4	100	100	91.6	75.0	100	88
Бентазон-соль	54.5	57.8	0	100	79.1	0	50.9	32.0
Бентазон к-та (эталон)	36.4	21.0	0	66.7	75.0	0	50.0	24.0
Контроль*	11	19	3	6	24	4	4	25

*В контроле представлены данные о количестве сорняков, экз./ м².

ФОРМУЛА ИЗОБРЕТЕНИЯ

Гербицидная композиция, включающая в качестве активного соединения 3-(1-метилэтил)-1Н-2,1,3-бензотиадиазин-4(3Н)-он 2,2-диоксид (бентазон) в виде кислоты, растворенной в адьюванте, в качестве которого используют N,N-диметилацетамид, или N,N-диметилпентанамид, или N,N-диметилгексанамид, или N,N-диметилдеканамид, или N,N-диметилформамид при соотношении 1:(0,2-10) соответственно и вспомогательное вещество.

