

[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl⁷

A01N 41/10

A01N 43/707 A01N 43/70

A01N 43/68

//(A01N41/10,43:707,

43:70,43:68)



[12] 发明专利申请公开说明书

[21] 申请号 01815741.6

[43] 公开日 2003年11月26日

[11] 公开号 CN 1458823A

[22] 申请日 2001.9.17 [21] 申请号 01815741.6

[30] 优先权

[32] 2000.9.18 [33] GB [31] 0022932.8

[86] 国际申请 PCT/EP01/10695 2001.9.17

[87] 国际公布 WO02/21920 英 2002.3.21

[85] 进入国家阶段日期 2003.3.17

[71] 申请人 拜尔作物科学股份有限公司

地址 法国里昂

[72] 发明人 K·帕勒特 A·斯拉特

[74] 专利代理机构 中国国际贸易促进委员会专利
商标事务所

代理人 刘明海

权利要求书2页 说明书7页

[54] 发明名称 新除草组合物

[57] 摘要

本发明涉及控制区域内杂草生长的方法，该方法包括向所述区域施用：(a) 2-(2'-硝基-4'-甲基磺酰基苯甲酰基)-1,3-环己烷二酮，或它们的农业上可接受的盐或金属络合物；和(b) 除莠去津外的三嗪类除草剂；以及它们作为除草剂的用途。

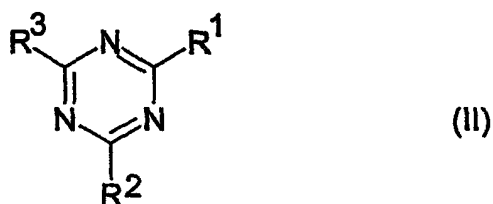
I S S N 1 0 0 8 - 4 2 7 4

1.控制区域内杂草生长的方法,该方法包括向所述区域内施用:

(a)2-(2'-硝基-4'-甲磺酰基苯甲酰基)-1,3-环己烷二酮或它们的农业上可接受的盐或金属络合物;以及

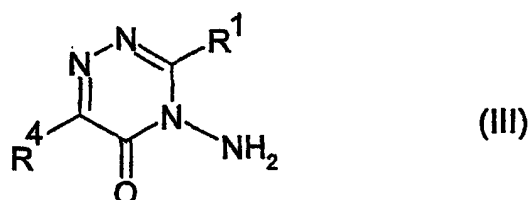
(b)除莠去津外的三嗪类除草剂。

2.权利要求1的方法,其中三嗪类除草剂是式(II)化合物:



其中 R1 代表氯或具有 1-6 个碳原子的直链或支链烷硫基或烷氧基;R2 代表叠氮基,一烷基氨基,二烷基氨基或环烷基氨基,其中烷基或环烷基部分可任选被一个或多个选自氟基和烷氧基的取代基取代;以及 R3 代表具有 1-6 个碳原子的直链或支链 N-烷基氨基;

或式(III)化合物:



其中 R1 如上定义以及 R4 代表具有 1-6 个碳原子的直链或支链烷基。

3.权利要求2的方法,其中在式II中,R2代表叠氮基,具有1-4个碳原子的直链或支链N-烷基氨基,其中烷基部分任选被氟基或甲氧基取代。

4.权利要求1或2的方法,其中三嗪类除草剂选自:

西玛津,即 6-氯-N2,N4-二乙基-1,3,5-三嗪-2,4-二胺;以及氟草津,即 2-(4-氯-6-乙氧基-1,3,5-三嗪-2-基氨基)-2-甲基丙腈。

5.权利要求4的方法,其中三嗪类除草剂是氟草津。

6.权利要求1或2的方法,其中三嗪类除草剂是嗪草酮,即4-氨基-6-叔丁基-3-甲硫基-1,2,4-三嗪-5(4H)-酮。

7.根据上述权利要求中任一项的方法,其中苯甲酰基环己烷二酮的施用量为每公顷5g至500g以及三嗪类除草剂的施用量为每公顷250g至5000g。

8.根据上述权利要求中任一项的方法,其中苯甲酰基环己烷二酮的施用量为每公顷25g至150g以及三嗪类除草剂的施用量为每公顷500g至1500g。

9.根据上述权利要求中任一项的方法,用于防治玉米中的禾本科杂草。

10.根据上述权利要求中任一项的方法,其中化合物是在杂草出苗前施用。

11.一种除草组合物,包括:

(a)如权利要求1所定义的式I的苯甲酰基环己烷二酮衍生物,或其农业上可接受的盐或金属络合物;以及

(b)除莠去津外的三嗪类除草剂;

结合除草上可接受的稀释剂或载体和/或表面活性剂。

12.权利要求11的除草组合物,其中(a):(b)的比例为2:1至1:1000 wt/wt。

13.权利要求11或12的除草组合物,其中(a):(b)的比例为1:4至1:60 wt/wt。

14.一种产品,包括(a)如权利要求1所定义的式I的苯甲酰基环己烷二酮,或其农业上可接受的盐或金属络合物;以及(b)除莠去津外的三嗪类除草剂,作为混配制剂以同时,分别或依次方式施用,控制区域内杂草的生长。

新除草组合物

本发明涉及新除草组合物，包括苯甲酰基环己烷二酮和除草的1,3,5-三嗪或1,2,4-三嗪酮化合物的混合物。还涉及该混合物的用途以及控制杂草的方法。

上述化合物都是本领域的已知除草剂。1,3,5-三嗪和1,2,4-三嗪酮除草剂(下文称作三嗪类除草剂)都是本领域公知的并包括作为选择性除草剂公开在例如“The Pesticide Manual”,第12版,2000以及更早版本(British Crop Protection Council)中的莠灭净(N^2 -乙基- N^4 -异丙基-6-甲硫基-1,3,5-三嗪-2,4-二胺),莠去津(6-氯- N^2 -乙基- N^4 -异丙基-1,3,5-三嗪-2,4-二胺),叠氮津(4-叠氮基- N -异丙基-6-甲硫基-1,3,5-三嗪-2-基胺),氟草津[2-(4-氯-6-(乙氧基)-1,3,5-三嗪-2-基氧基)-2-甲基丙腈],盖草津[N^2 -异丙基- N^4 -(3-甲氧基丙基)-6-甲硫基-1,3,5-三嗪-2,4-二胺],嗪草酮(4-氨基-6-叔丁基-3-甲硫基-1,2,4-三嗪-5(4H)-酮),扑草净(N^2 , N^4 -二异丙基-6-甲硫基-1,3,5-三嗪-2,4-二胺),扑灭通(N^2 , N^4 -二异丙基-6-甲氧基-1,3,5-三嗪-2,4-二胺),扑灭津(6-氯- N^2 , N^4 -二异丙基-1,3,5-三嗪-2,4-二胺),西草净(N^2 , N^4 -二乙基-6-甲硫基-1,3,5-三嗪-2,4-二胺),西玛津(6-氯- N^2 , N^4 -二乙基-1,3,5-三嗪-2,4-二胺),特丁津(N^2 -叔丁基-6-氯- N^4 -乙基-1,3,5-三嗪-2,4-二胺),特丁净(N^2 -叔丁基- N^4 -乙基-6-甲硫基-1,3,5-三嗪-2,4-二胺)和草达津(6-氯- N^2 , N^2 , N^4 -三乙基-1,3,5-三嗪-2,4-二胺)。下述式(I)的除草的4-苯甲酰基异噁唑公开在欧洲专利(申请)公开号0418175,0487357,0527036和0560482中。

除草的苯甲酰基环己烷二酮已公开在文献,例如欧洲专利公开号0186118中。特别是美国专利5,506,196公开了2-(2'-硝基-4'-甲磺酰基苯甲酰基)-1,3-环己烷二酮。

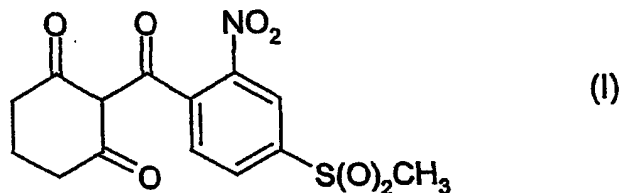
已发现三嗪类除草剂与某些苯甲酰基环己烷二酮衍生物混合使用,可在不丧失作物选择性的前提下扩大除草活性谱。因此上述混剂具有

显著的技术进步。在说明书中使用的术语“混剂”是指苯甲酰基环己烷二酮除草剂和三嗪类除草剂的“混剂”。

本发明还寻求提供一种除草组合物,该组合物在不降低(并优选提高)杂草防治水平的前提下可降低施用至环境中的三嗪类除草剂的剂量。

本发明提供了一种控制区域内杂草(即不需要的植物)生长的方法,该方法包括向该区域施用除草有效量的:

(a) 式(I)的苯甲酰基环己烷二酮:

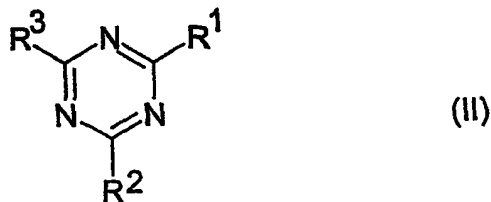


即 2-(2'-硝基-4'-甲磺酰基苯甲酰基)-1,3-环己烷二酮,或其农业上可接受的盐或金属络合物;以及

(b) 除莠去津外的三嗪类除草剂。

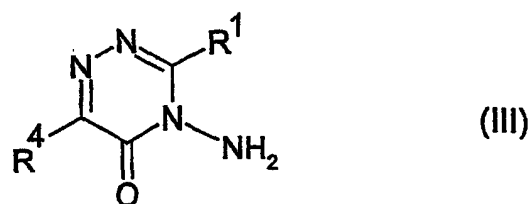
三嗪类除草剂和苯甲酰基环己烷二酮通常是以除草组合物(即与适用于除草组合物的适宜的稀释剂或载体和/或表面活性剂结合)制剂形式使用,例如下文所述的制剂。

优选的三嗪类除草剂是式(II)化合物:



其中 R^1 代表氯或具有 1-6 个碳原子的直链或支链烷硫基或烷氧基; R^2 代表叠氮基,一烷基氨基,二烷基氨基或环烷基氨基,其中烷基或环烷基部分可任选被一个或多个选自氟基和烷氧基的取代基取代;以及 R^3 代表具有 1-6 个碳原子的直链或支链 N-烷基氨基;

或式(III)化合物:



其中 R^1 如上定义以及 R^4 代表具有 1-6 个碳原子的直链或支链烷基。

更优选 R^1 代表氯或甲硫基以及 R^3 代表具有 1-4 个碳原子的直链或支链 N-烷基氨基。

优选含有上述式(II)化合物的组合物,其中 R^2 代表叠氨基,具有 1-4 个碳原子的直链或支链 N-烷基氨基(其中烷基部分任选被氟基或甲氧基取代)。

还优选的上述式(II)化合物是,其中 R^3 代表 N-(叔丁基)氨基, R^2 代表 N-乙氨基和 R^1 代表氯或甲硫基,这些化合物是已知的并分别称作特丁津和特丁净。

优选的上述式(II)化合物是,其中 R^1 代表氯, R^3 代表 N-乙氨基和 R^2 代表 N-乙氨基或 N-(2-甲基丙腈)氨基,分别称作西玛津和氟草津;最优选氟草津。

优选的上述式(III)化合物是其中 R^1 代表甲硫基, R^4 代表叔丁基的化合物,称作嗪草酮。

三嗪类除草剂和苯甲酰基环己烷二酮的施用量可根据生长的杂草和它们的种群,使用的组合物,施药时间,气候和土壤条件,以及(当用于控制作物生长区内的杂草生长时)需处理的作物等情况而变化。通常,考虑这些因素的条件下,施用量在每公顷 5g 至 500g 苯甲酰基环己烷二酮和 250g 至 5000g 三嗪类除草剂时可获得很好的除草效果。然而,可以理解的是根据实际遇到的杂草防治情况,可以使用更高或更低的施用量。

在该地区是作物生长区或将用于种植作物的杂草侵染区进行选择性的杂草防治时,特别适合的施用量为每公顷 5g 至 500g 苯甲酰基环己烷

二酮和 250g 至 5000g 三嗪类除草剂,优选每公顷使用 25 至 150g 苯甲酰基环己烷二酮和 500g 至 1500g 三嗪类除草剂.当用于作物生长区时,施用量应足以控制杂草的生长但又不会对作物产生严重的永久性的伤害.

上述混用可用于防治作物例如玉米和栽培作物如甘蔗地中的非常广谱的一年生阔叶杂草和禾本科杂草,同时对作物没有明显的永久性的伤害.上述混用既具有叶面活性而且还具有残余活性,因此可在很长的作物生长发育期内使用,即从作物出苗前杂草苗前至作物出苗后杂草苗后.

具有上述特性的本发明方法中,优选(a)和(b)混用防治玉米地中的禾本科杂草.

当三嗪类除草剂是莠灭净时,还优选(a)和(b)混用防治甘蔗地中的禾本科杂草.

上述方法中,优选(a)和(b)混用时(a):(b)的比例为 2:1 至 1:1000 wt/wt,特别优选 1:3 至 1:60 wt/wt(或 1:3.3 至 1:60 wt/wt).

术语‘苗前施用’表示在作物出苗前施用至存在杂草种子或杂草苗的土壤.术语‘苗后施用’表示施用至已出苗长出土壤表面的杂草的地上或暴露部分.术语‘叶面活性’表示施用至已出苗露出土壤表面的杂草的地上或暴露部分后产生的除草活性.术语‘残余活性’表示施用至在杂草出苗露出土壤表面前有杂草种子或杂草苗的土壤获得的除草活性,由此可杀死在施药时已长出的杂草苗或抑制施用后土壤中种子的萌发.

本发明中,优选 PPI 或苗前施用,以及最优选苗前施用苯甲酰基环己烷二酮和三嗪类除草剂.

优选将苯甲酰基环己烷二酮和三嗪类除草剂的混剂施用至作物生长区或将用于种植作物的区域,其中作物例如是玉米,甘蔗或栽培作物.优选作物是玉米.

根据通常的实际应用情况,可在使用前通过将每种除草组分的各制剂混配制成罐混制剂.

通过下述非限定性试验解释本发明。

实施例 1

将各种阔叶和禾本科杂草种子播种在没有消毒的粘壤土中。然后将以各种比例溶解在丙酮和水混合物中的系列浓度的单一除草剂或两种除草剂的混合物喷雾土表。所述杂草是反枝苋、狗尾草、大狗尾草和稗草。

处理后两周,与未处理对照比较以评估抑制植物生长百分数。

观察到本发明混剂可防治一种或多种杂草。

实施例 2

将如实施例 1 所列的各种杂草种子播种并生长至 1-3 叶期。将以各种比例溶解在丙酮和水混合物中的系列浓度的单一除草剂或两种除草剂的混合物苗后施用。

处理后两周,与未处理对照比较以评估抑制植物生长百分数。

观察到本发明混剂可防治一种或多种杂草。

本发明的另一特点是提供了除草组合物,包括:

(a)2-(2'-硝基-4'-甲磺酰基苯甲酰基)-1,3-环己烷二酮,或其农业上可接受的盐或金属络合物;以及

(b)除莠去津外的三嗪类除草剂;

以及结合和优选均匀地分散于除草上可接受的稀释剂或载体和/或表面活性剂。

术语“除草组合物”广义上可以理解为不仅包括可作为除草剂直接施用的组合物还包括施用前必须稀释的浓缩物。优选,组合物中含有 0.05-90%重量的苯甲酰基环己烷二酮和三嗪类除草剂。

除非另有说明,说明书中出现的百分数和比例都是以重量计。

通常使用的组合物中(a):(b)的比例为 1:6000 至 64:1[(a):(b) wt/wt], 优选比例为 1:600 至 4:1 wt/wt(或 1:600 至 3.41:1 wt/wt),更优选比例为 1:100 至 2:1 wt/wt(或 1:100 至 1.33:1 wt/wt)并特别优选比例为 1:20 至 1:1 wt/wt(或 1:20 至 1:1.33 wt/wt)。

除草组合物中可含有固体和液体载体以及表面活性剂(例如湿润

剂,分散剂或乳化剂或它们的混合物)。本发明除草组合物中可使用的表面活性剂是离子或非离子型表面活性剂,例如磺化蓖麻酸酯,季铵衍生物,基于环氧乙烷和壬基-或辛基酚缩合物的产品,或通过与环氧乙烷缩合使游离羟基醚化赋予可溶性的无水山梨糖醇羧酸酯,硫酸酯和磺酸的碱金属和碱土金属盐如琥珀酸二壬酯磺酸钠和琥珀酸二辛酯磺酸钠以及高分子量磺酸衍生物的碱金属和碱土金属盐如木素磺酸钠和木素磺酸钙。适合的固体稀释剂或载体的实例是硅酸铝,滑石,煅烧氧化镁,硅藻土,磷酸三钙,粉状软木,吸收性炭黑以及粘土如高岭土和膨润土。适合的液体稀释剂的实例包括水,苯乙酮,环己酮,异佛尔酮,甲苯,二甲苯,以及矿物、动物和植物油(这些稀释剂可以单独使用或混合使用)。

如果需要的话,本发明除草组合物还可以含有常规助剂如粘合剂,保护性胶体,增稠剂,渗透剂,稳定剂,螯合剂,防结块剂,着色剂和缓蚀剂。这些助剂还可用作载体或稀释剂。

可湿性粉剂(或用于喷雾的粉剂)中通常含有 20-95%的苯甲酰基环己烷二酮和三嗪类除草剂,以及它们除固体赋形剂外,通常含有 0-5%的湿润剂,3-10%的分散剂以及如适合 0-10%的一种或多种稳定剂和/或其它添加剂如渗透剂,粘合剂或防结块剂和着色剂。

适用于喷雾的水悬浮剂,可通过这样的方式制备获得稳定的液体产品(通过精细研磨),该产品不产生沉淀并通常含有 10-75%苯甲酰基环己烷二酮和三嗪类除草剂,0.5-15%表面活性剂,0.1-10%的触变剂,0-10%适合的添加剂如消泡剂,缓蚀剂,稳定剂,以及水或有机液体,活性物质在其中是微溶或不溶的。可溶解一些有机固体物质或无机盐有助于防止沉淀或作为水的防冻剂。

本发明除草组合物优选是可湿性粉剂和水分散性粒剂。

本发明除草组合物还可包括苯甲酰基环己烷二酮和三嗪类除草剂,以及结合和优选均匀地分散于一种或多种其它农药活性化合物以及如需要一种或多种适宜的农药上可接受的稀释剂和载体。优选的本发明除草组合物是那些包括苯甲酰基环己烷二酮和三嗪类除草剂并混合其它除草剂的组合物。

可将本发明组合物包装成含有苯甲酰基环己烷二酮和三嗪类除草剂以及任选上述其它农药活性化合物的产品,以及优选地,作为上述除草组合物以及优选需在施用前稀释的除草浓缩物,包括用于盛装上述苯甲酰基环己烷二酮和三嗪类除草剂或所述除草组合物的容器,容器中含有苯甲酰基环己烷二酮和三嗪类除草剂以及与上述容器贴近地放在一起的说明书,指明其中含有的上述苯甲酰基环己烷二酮和三嗪类除草剂或除草剂组合物用于控制杂草生长的方式。通常容器可以是常规的用于储藏在普通室温下为固体或液体的化学物质和浓缩除草组合物的各种类型的容器,例如塑料或金属制的罐和桶(可以是内部涂层过的),玻璃和塑料瓶;以及当容器中的内容物为固体,例如颗粒状除草组合物时,可以使用盒,例如纸板、塑料、金属制盒或袋。通常容器应具有足够的容量,即含有的活性成分或除草组合物的量足以处理至少1公顷土地从而可控制该区域的杂草生长,但不应超出便于常规方法操作的尺寸。说明书应与容器贴近地放在一起,例如直接印刷在上面或粘贴于容器上的标牌或标签上。通常说明书中指出容器中的内容物,如必要稀释后,以每公顷0.5-512g苯甲酰基环己烷二酮和8-3000g三嗪类除草剂的施用量以前面所述的方式和目的施用于控制杂草的生长。

美国专利公开号5,006,158中公开的方法可用于制备式(I)的苯甲酰基环己烷二酮。

根据本发明的另一特征,提供了一种产品,包括:将

(a)2-(2'-硝基-4'-甲磺酰基苯甲酰基)-1,3-环己烷二酮或它们的农业上可接受的盐或金属络合物;以及

(b)除莠去津外的三嗪类除草剂;

作为混配制剂以同时,分别或依次方式施用,控制区域内杂草的生长。

尽管本发明通过各种优选实施方案进行了描述,但本领域普通技术人员可以想到在此基础之上作出各种的改进、替代、省略和变化而不背离本发明的主旨。因此,意旨本发明的范围仅通过下述权利要求的范围所限定,包括它们的等价物。