

[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[ 51 ] Int. Cl<sup>7</sup>  
A01N 43/40  
A01N 25/32  
/( A01N43/40,47 : 36,  
43 : 824,41 : 10,  
25 : 32)



[12] 发明专利申请公开说明书

[21] 申请号 02818825. X

[43] 公开日 2004 年 12 月 29 日

[11] 公开号 CN 1558718A

[22] 申请日 2002.9.26 [21] 申请号 02818825. X  
[30] 优先权  
[32] 2001. 9.27 [33] CH [31] 1782/2001  
[32] 2002. 3.14 [33] CH [31] 460/2002  
[86] 国际申请 PCT/EP2002/010831 2002.9.26  
[87] 国际公布 WO2003/028460 英 2003.4.10  
[85] 进入国家阶段日期 2004.3.25  
[71] 申请人 辛根塔参与股份公司  
地址 瑞士巴塞尔  
[72] 发明人 U·霍夫尔

[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 张 敏

权利要求书 1 页 说明书 7 页

[54] 发明名称 除草组合物  
[57] 摘要

增效除草组合物，其中除了含有常规的惰性制  
剂助剂外，还含有炔草酯和甲磺胺磺隆、甲基磺草  
酮或氟噻草胺的混合物作为活性成分。

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

1. 一种增效除草组合物，其中除含常规惰性制剂助剂外，还含有下列成分的混合物作为活性成分

a) 炔草酯和

b) 增效有效量的至少一种选自甲磺胺磺隆、甲基磺草酮和氟噻草胺的化合物。

2. 如权利要求 1 所述的除草组合物，其中含有除草剂拮抗有效量的安全剂解草酯、吡咯二酸二乙酯或双苯噁唑酸作为附加成分 c)。

3. 一种控制有益植物作物中不希望的植物生长的方法，包括令除草有效量的权利要求 1 所述组合物作用于栽培植物或其位置。

4. 权利要求 3 所述的方法，其中的栽培植物是谷类。

## 除草组合物

本发明涉及一种新的增效除草组合物，该组合物含除草活性成分组合，所述除草活性成分组合适用于选择性防治有益植物作物例如谷类作物中的杂草。

本发明还涉及防治有益植物作物中的杂草的方法，以及所述新组合物用于此目的的用途。

如 The Pesticide Manual, 第 12 版, BCPC, 2000, Entry No. 156 中所述, 炔草酯 (clodinafop-propargyl) 具有除草活性。同样, 氟噻草胺 (flufenacet) 和 甲基磺草酮 (mesotrione) 分别描述于 The Pesticide Manual, 第 12 版, BCPC, 2000, Entry No. 362 和 500 中。甲磺胺磺隆 (mesosulfuron) 在例如 W001/24633 和 W000/3591 中有提及。

现已意外地发现不定量的至少两种活性成分的组合, 即炔草酯与至少一种上述活性成分的组合, 产生一种增效作用, 能苗前和苗后防治大多数杂草, 特别是出现于有益植物作物中的杂草, 而且基本不会损伤该有益植物。

因此, 本发明提出一种用于选择性杂草防治的新的增效组合物, 该组合物除含常规的惰性制剂助剂外, 还含有下列成分的混合物作为活性成分

a) 炔草酯和

b) 增效有效量的至少一种选自甲磺胺磺隆、甲基磺草酮和氟噻草胺的化合物。

非常意外的是本发明上述活性成分的组合超过了原则上预期的对欲防治杂草的加和作用, 因此特别是在下述两方面拓宽了两种活性成分的作用范围: 首先降低了单个化合物的用量, 同时保持了良好的作用水平。其次, 当单个化合物在低用量范围下无农业作用的情况下, 本发明组合物也能获得高的杂草防治水平。结果是显著拓宽了杂草防治谱, 另

外增加了对有益植物作物的选择性，这正是在无意过量使用活性成分的情况下所需要和期望的。本发明组合物在保持很好地防治有益植物中的杂草的同时，还对后茬作物有较大的适应性。

本发明组合物可用于防治大量农业上重要的杂草，如马唐属、狗尾草属、欧白芥属、茄属、稗属、假高粱、罗氏草属、莎草属、苘麻属、黄花稔属、苍耳属、苋属、藜属、甘薯属、猪殃殃属、苧菜属和婆婆纳属。本发明组合物适用于所有农业上常规使用的施用方法，例如苗前施用、苗后施用和拌种。本发明组合物特别适用于防治谷类中的杂草，以及非选择性杂草防治。有益植物的作物还应理解为包括因常规的育种或基因工程方法而变得对除草剂或除草剂类有耐受性的作物。

本发明组合物含任何希望混合比的活性成分，通常一种成分比另一种成分过量。活性成分(炔草酯与混合配对成分)间优选混合比是 8:1 至 1:5，优选 5:1 至 1:2。

用量可在大范围内变化，并且取决于土壤的状况、施用的类型(苗前或苗后；拌种；施用于播沟；免耕施用等)、作物、欲防治的杂草、当时的气候条件和由施用类型、施用时间以及靶标作物决定的其他因素。通常，本发明活性成分混合物可以以 0.1-5kg 活性成分混合物/ha 的用量施用。

因此，本发明还提出一种选择性除草组合物，其中除含常规惰性制剂助剂如载体、溶剂和润湿剂外，还含有下列成分的混合物作为活性成分

a) 炔草酯，

b) 增效有效量的至少一种选自甲磺胺磺隆、甲基磺草酮和氟噻草胺的化合物，和

c) 除草剂拮抗有效量的作为安全剂的解草酯、吡咯二酸二乙酯或双苯噁唑酸。

解草酯和吡咯二酸二乙酯分别描述于 The Pesticide Manual, 第 12 版, BCPC, 2000, Entry No. 492 和 163 中。双苯噁唑酸在例如 DE4331448 中有提及。安全剂炔草酯和吡咯二酸二乙酯还可以其碱金属盐、碱土金

属盐、铕盐或铵盐的形式使用。其实例描述于例如 W002/34048 中。还可施用炔草酯的水合物，该物质在 W002/36566 中有提及。

本发明所用的活性成分可以未改性的形式，即在合成中获得的形式使用，但优选以常规方式与制剂加工技术中常用助剂如溶剂、固体载体或表面活性剂一起配制成制剂，如在 W097/34483 的第 9-13 页所述例如配制成乳油、可直接喷雾溶液或可稀释溶液、可湿性粉剂、可溶性粉剂、粉剂、颗粒剂或微胶囊剂。如同组合物的性质一样，根据预期的目的和当时的情况选择施用方法如喷雾、雾化、喷粉、润湿、撒布或浇注。制剂即含本发明混合物和任选的一种或多种固体或液体制剂助剂的组合物、制品或混合物是以已知的方式制备的，例如通过将活性成分与制剂助剂如溶剂或固体载体均匀混合和/或研磨制备。在制剂的制备过程中还可另外加入表面活性化合物(表面活性剂)。

溶剂和固体载体的实例在例如 W097/34485 第 6 页中举出。根据欲配制的式 I 化合物的性质，适宜的表面活性化合物是具有良好的乳化、分散和润湿性的非离子、阳离子和/或阴离子表面活性剂和表面活性剂混合物。适宜的阴离子、非离子和阳离子表面活性剂的实例列于例如 W097/34485 的第 7 和 8 页。此外，在制剂加工技术中常规使用的表面活性剂也适用于制备本发明的除草组合物，所述表面活性剂特别是描述在 “McCUTCHEON’S Detergents and Emulsifiers Annual” MC Publishing Corp., Ridgewood New Jersey, 1981, Stache, H., “Tensid-Taschenbuch”, Carl Hanser Verlag, Munich/Vienna, 1981, 和 M. and J. Ash, “Encyclopedia of Surfactants”, 第 I-III 卷, Chemical Publishing Co., New York, 1980-81 中。

除草制剂通常含 0.1-99wt%、特别是 0.1-95wt%的本发明活性成分混合物，1-99.9wt%的固体或液体制剂助剂，和 0-25wt%、特别是 0.1-25wt%的表面活性剂。

虽然市售产品优选被配制成浓缩物，但最终使用者一般会使用稀释的制剂。组合物还可包含其他添加剂如稳定剂例如植物油或环氧化植物油(环氧化椰子油、菜籽油或豆油)、消泡剂例如硅油、防腐剂、粘度调

节剂、粘合剂、增粘剂，还有肥料或其他活性成分。优选的制剂尤其具有下列组成：

(%=重量百分比)

乳油：

活性成分混合物： 1-90%，优选 5-20%

表面活性剂： 1-30%，优选 10-20%

液体载体： 5-94%，优选 70-85%

粉剂：

活性成分混合物： 0.1-10%，优选 0.1-5%

固体载体： 99.9-90%，优选 99.9-99%

胶悬剂：

活性成分混合物： 5-75%，优选 10-50%

水： 94-24%，优选 88-30%

表面活性剂： 1-40%，优选 2-30%

可湿性粉剂：

活性成分混合物： 0.5-90%，优选 1-80%

表面活性剂： 0.5-20%，优选 1-15%

固体载体： 5-95%，优选 15-90%

颗粒剂：

活性成分混合物： 0.1-30%，优选 0.1-15%

固体载体： 99.5-70%，优选 97-85%。

下列实施例进一步说明本发明，而不是限制本发明。

| <u>F1. 乳油</u> | a) | b)  | c)  | d)  |
|---------------|----|-----|-----|-----|
| 活性成分混合物       | 5% | 10% | 25% | 50% |
| 十二烷基苯磺酸钙      | 6% | 8%  | 6%  | 8%  |
| 蓖麻油聚乙二醇醚      | 4% | -   | 4%  | 4%  |
| (36mol 环氧乙烷)  |    |     |     |     |
| 辛基苯酚聚乙二醇醚     | -  | 4%  | -   | 2%  |
| (7-8mol 环氧乙烷) |    |     |     |     |

|                                       |      |     |     |     |
|---------------------------------------|------|-----|-----|-----|
| 环己酮                                   | -    | -   | 10% | 20% |
| 芳烃混合物 C <sub>9</sub> -C <sub>12</sub> | 85 % | 78% | 55% | 16% |

通过用水稀释上述浓缩物可得到任何希望浓度的乳剂。

|                                       |      |     |     |     |
|---------------------------------------|------|-----|-----|-----|
| <u>F2. 溶液</u>                         | a)   | b)  | c)  | d)  |
| 活性成分混合物                               | 5%   | 10% | 50% | 90% |
| 1- 甲氧基-3-(3-甲氧基-<br>2- 丙氧基)-丙烷        | -    | 20% | 20% | -   |
| 聚乙二醇<br>(分子量 400)                     | 20%  | 10% | -   | -   |
| N-甲基-2-吡咯烷酮                           | -    | -   | 30% | 10% |
| 芳烃混合物 C <sub>9</sub> -C <sub>12</sub> | 75 % | 60% | -   | -   |

上述溶液适用于以微滴的形式施用。

|                            |      |     |     |     |
|----------------------------|------|-----|-----|-----|
| <u>F3. 可湿性粉剂</u>           | a)   | b)  | c)  | d)  |
| 活性成分混合物                    | 5%   | 25% | 50% | 80% |
| 木质素磺酸钠                     | 4%   | -   | 3%  | -   |
| 月桂基硫酸钠                     | 2%   | 3%  | -   | 4%  |
| 二异丁基萘磺酸钠                   | -    | 6%  | 5%  | 6%  |
| 辛基苯酚聚乙二醇醚<br>(7-8mol 环氧乙烷) | -    | 1%  | 2%  | -   |
| 高度分散的硅酸                    | 1%   | 3%  | 5%  | 10% |
| 高岭土                        | 88 % | 62% | 35% | -   |

将活性成分与助剂充分混合，并在适宜的磨中将混合物充分研磨，得到可湿性粉剂，该可湿性粉剂可以用水稀释，以得到任何希望浓度的悬浮剂

|                                                             |       |     |     |
|-------------------------------------------------------------|-------|-----|-----|
| <u>F4. 包衣颗粒剂</u>                                            | a)    | b)  | c)  |
| 活性成分混合物                                                     | 0.1%  | 5%  | 15% |
| 高度分散的硅酸                                                     | 0.9%  | 2%  | 2%  |
| 无机载体(直径 0.1-1mm)<br>例如 CaCO <sub>3</sub> 或 SiO <sub>2</sub> | 99.0% | 93% | 83% |

将活性成分溶解于二氯甲烷中，将此溶液喷到载体上，随后真空蒸发除去溶剂。

| <u>F5. 包衣颗粒剂</u>                    | a)    | b)  | c)  |
|-------------------------------------|-------|-----|-----|
| 活性成分混合物                             | 0.1%  | 5%  | 15% |
| 聚乙二醇<br>(分子量 200)                   | 1.0%  | 2%  | 3%  |
| 高度分散的硅酸                             | 0.9%  | 1%  | 2%  |
| 无机载体(直径 0.1-1mm)                    | 98.0% | 92% | 80% |
| 例如 $\text{CaCO}_3$ 或 $\text{SiO}_2$ |       |     |     |

在混合器中，将磨细的活性成分均匀涂布到被聚乙二醇润湿的载体上。以此方式可获得无尘包衣颗粒剂。

| <u>F6. 挤出颗粒剂</u> | a)    | b)  | c)  | d)  |
|------------------|-------|-----|-----|-----|
| 活性成分混合物          | 0.1%  | 3%  | 5%  | 15% |
| 木质素磺酸钠           | 1.5%  | 2%  | 3%  | 4%  |
| 羧甲基纤维素           | 1.4%  | 2%  | 2%  | 2%  |
| 高岭土              | 97.0% | 93% | 90% | 79% |

将活性成分与助剂混合并研磨，混合物用水润湿。将该混合物挤出，然后在空气流中干燥。

| <u>F7. 粉剂</u> | a)    | b)  | c)  |
|---------------|-------|-----|-----|
| 活性成分混合物       | 0.1%  | 1%  | 5%  |
| 滑石            | 39.9% | 49% | 35% |
| 高岭土           | 60.0% | 50% | 60% |

通过将活性成分与载体混合并在适宜的磨中研磨该混合物可获得即用粉剂。

| <u>F8. 胶悬剂</u>           | a) | b)  | c)  | d)  |
|--------------------------|----|-----|-----|-----|
| 活性成分混合物                  | 3% | 10% | 25% | 50% |
| 乙二醇                      | 5% | 5%  | 5%  | 5%  |
| 壬基酚聚乙二醇醚<br>(15mol 环氧乙烷) | -  | 1%  | 2%  | -   |

---

|          |      |      |      |      |
|----------|------|------|------|------|
| 木质素磺酸钠   | 3%   | 3%   | 4%   | 5%   |
| 羧甲基纤维素   | 1%   | 1%   | 1%   | 1%   |
| 37%甲醛水溶液 | 0.2% | 0.2% | 0.2% | 0.2% |
| 硅油乳液     | 0.8% | 0.8% | 0.8% | 0.8% |
| 水        | 87%  | 79%  | 62%  | 38%  |

将磨细的活性成分与助剂紧密混合，得到胶悬剂，用水该胶悬剂稀释，可制备任何希望浓度的悬浮剂。

通常，更实用的是将本发明混合物中的活性成分分别配制，并在施用前在撒药器中以希望的混合比例混合到一起，形成水中“桶混物”的形式。

### 生物实施例

#### 实施例 B1: 苗前试验

在温室条件下，将试验植物播种于盆中。使用标准土壤作为栽培基质。在苗前阶段，将除草剂单独和以混合物的形式施用到土壤表面。用量取决于在田间或温室条件下所确定的最佳浓度。在 2-4 周后评价试验(100%作用=植物完全死亡；0%作用=无植物毒性作用)。在此试验中使用的混合物表现出良好的结果。

#### 实施例 B2: 苗后试验:

在温室条件下，将试验植物种植在盆中至施药后阶段。使用标准土壤作为栽培基质。在苗后阶段，将除草剂单独和以混合物的形式施用到试验植物。用量取决于在田间或温室条件下所确定的最佳浓度。在 2-4 周后评价试验(100%作用=植物完全死亡；0%作用=无植物毒性作用)。在此试验中使用的混合物表现出良好的结果。