

[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl⁷

A01N 47/38

A01N 25/32

/(A01N47/38, 43:653,
43:56, 43:42, 39:04)



[12] 发明专利说明书

[21] ZL 专利号 00812161.3

[45] 授权公告日 2005 年 4 月 27 日

[11] 授权公告号 CN 1198507C

[22] 申请日 2000.8.16 [21] 申请号 00812161.3

[30] 优先权

[32] 1999.8.27 [33] DE [31] 19940860.2

[86] 国际申请 PCT/EP2000/007982 2000.8.16

[87] 国际公布 WO2001/015533 德 2001.3.8

[85] 进入国家阶段日期 2002.2.27

[71] 专利权人 拜尔公司

地址 德国莱沃库森

[72] 发明人 D·福伊希特 P·达门

M·W·德鲁斯 B·克劳斯科普夫

M·克雷默 R·庞岑

H-J·桑特尔 A·维尔曼

J·克卢斯 K-H·米勒

审查员 王莉敏

[74] 专利代理机构 中国专利代理(香港)有限公司

代理人 张元忠 邵红

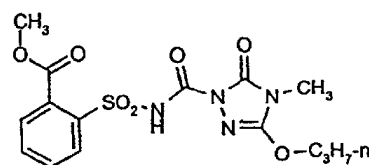
权利要求书 1 页 说明书 28 页

[54] 发明名称 基于取代的苯基磺酰基氨基羰基三唑啉酮和安全剂的选择性除草剂

[57] 摘要

本发明涉及新的选择性除草剂, 包含有效量的活性化合物组合物, 该组合物包含(a)式(I)的2-(2-甲氧基羰基-苯基磺酰基氨基羰基)-4-甲基-5-丙氧基-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮和/或一种或多种式(I)化合物的盐, 尤其是钠盐, 和(b)至少一种提高作物相容性的化合物, 并选自下组化合物: α -(1,3-二氧戊环-2-基-甲氧亚氨基)-苯基乙腈(解草腈), α -(氰基-甲氧亚氨基)-苯基乙腈(抑害腈), 4-氯-N-(1,3-二氧戊环-2-基-甲氧基)- α -三氟-苯乙酮肟(肟草安), 4,6-二氯-2-苯基-嘧啶(解草啶), 4-二氯乙酰基-3,4-二氢-3-甲基-2H-1,4-苯并噁嗪(解草酮), 5-氯-喹啉-8-氧乙酸1-甲基-己酯(喹氧乙酸), 2,2-二氯-N-(2-氧代-2-(2-丙烯基氨基)-乙基)-N-(2-丙烯基)-乙酰胺(DKA-24), 1,8-萘酸酐, 1-(2,4-二氯-苯基)-5-三氯甲基-1H-1,2,4-三唑-3-羧酸乙酯(解草唑乙酯), 2-氯-4-三氟甲基-噻唑-5-羧酸苯基甲基酯(解草安), 3-二氯乙酰基-5-(2-呋喃基)-2,2-二甲基噁唑烷(解草呋, MON13900), 4-二氯

乙酰基-1-氧杂-4-氮杂-螺[4.5]-癸烷(AD-67), 2-二氯-甲基-2-甲基-1,3-二氧戊环(MG-191), 2,2-二氯-N-(1,3-二氧戊环-2-基-甲基)-N-(2-丙烯基)-乙酰胺(PPG-1292), 2,2-二氯-N,N-二-2-丙烯基-乙酰胺(抑害胺), N-(4-甲基-苯基)-N'-(1-甲基-1-苯基-乙基)-脲(香草隆), 1-二氯乙酰基-六氢-3,3,8a-三甲基吡咯并[1,2-a]-嘧啶-6(2H)-酮(BAS-145138), N-(2-甲氧基-苯甲酰)-4-(甲基氨基羰基氨基)-苯磺胺和说明书中描述的其他安全剂和解毒剂和2,4-二氯苯氧基乙酸(2,4-D)及其衍生物。



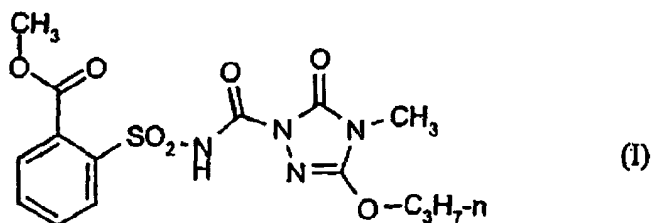
(I)

知识产权出版社出版

ISSN 1008-4274

1. 组合物, 包含有效量的活性化合物组合物, 该组合物包含
 (a) 式(I)的 2-(2-甲氧基羰基-苯基磺酰基氨基羰基)-4-甲基-5-
 丙氧基-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮

5



和/或一种或多种式(I)化合物的盐,

和

(b) 至少一种提高作物相容性的化合物, 其选自下列化合物:

- 10 1-(2,4-二氯苯基)-4,5-二氢-5-甲基-1H-吡唑-3,5-二羧酸二乙酯, [(5-氯-8-喹啉基)氧基]乙酸 1-甲基己基酯和/或 1-(2,4-二氯苯基)-5-(三氯甲基)-1H-1,2,4-三唑-3-羧酸乙酯。

2. 根据权利要求 1 的组合物, 其特征在于组分(b)是化合物 1-(2,4-二氯苯基)-4,5-二氢-5-甲基-1H-吡唑-3,5-二羧酸二乙酯。

- 15 3. 根据权利要求 1 或 2 的组合物用于防治不需要的植物的用途。

4. 防治杂草的方法, 其特征在于令根据权利要求 1 或 2 的组合物作用于不需要的植物和/或其生长环境。

- 20 5. 制备除草组合物的方法, 其特征在于将根据权利要求 1 或 2 的组合物与表面活性剂和/或填充剂混合。

基于取代的苯基磺酰基氨基羰基三唑啉酮和安全剂的
选择性除草剂

5 本发明涉及新的选择性除草活性化合物组合物，该组合物一方面包含 2-(2-甲氧基羰基-苯基磺酰基氨基羰基)-4-甲基-5-丙氧基-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮和/或其盐，尤其是其钠盐，和另一方面含至少一种能提高作物相容性的化合物并且该组合物特别适用于选择性防治各种有用作物中的杂草。

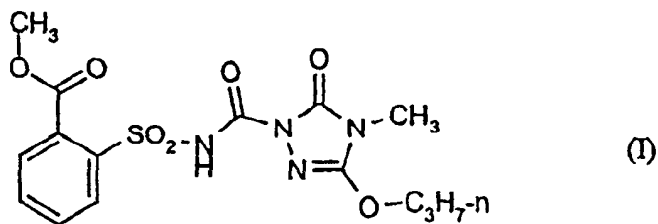
10 取代的苯基磺酰基氨基羰基-三唑啉酮是已知的有效除草剂（参见例如 EP-A 507171）。然而，这些化合物的活性和/或其与作物的相容性并不总是完全令人满意的。

此外，获得协同作用的取代的苯基磺酰基氨基羰基-三唑啉酮和其他除草活性化合物的活性化合物组合物已被公开（参见 DE-A 15 19638887）。然而，这些组合产物的使用性能不总是完全令人满意。2-(2-三氟甲氧基-苯基磺酰基氨基羰基)-4-甲基-5-甲氧基-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑啉-3-酮与某些安全剂的组合也已公开于 EP-A 931456。

令人惊讶的是现已发现 2-(2-甲氧基羰基-苯基磺酰基氨基羰基)-4-甲基-5-丙氧基-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮和/或其盐当与下文
20 所述的能提高作物相容性的化合物（安全剂/解毒剂）一起使用时能特别有效地防止对作物的损害并可特别有利地用作广谱组合制剂用于选择性防止有用作物如谷类中的杂草。

本发明提供选择性除草组合物，其特征在于包含活性化合物组合物，该组合物包含

25 (a) 式(I)的 2-(2-甲氧基羰基-苯基磺酰基氨基羰基)-4-甲基-5-丙氧基-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮

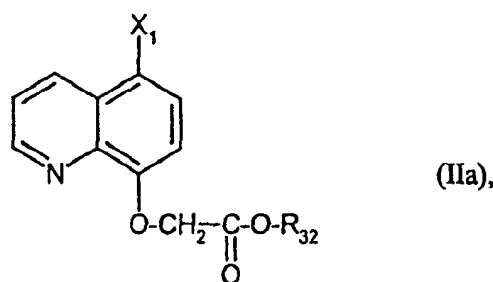


和/或一种或多种式(I)化合物的盐, 尤其是钠盐,
和

(b) 至少一种提高作物相容性的化合物, 其选自下列化合物:

α -(1, 3-二氧戊环-2-基-甲氧亚氨基)-苯基乙腈(解草腈), α -(氯
5 基甲氧亚氨基)-苯基乙腈(抑害腈), 4-氯-N-(1, 3-二氧戊环-2-基-甲
氧基)- α -三氯-苯乙酮肟(肟草安), 4, 6-二氯-2-苯基-嘧啶(解草啶),
4-二氯乙酰基-3, 4-二氢-3-甲基-2H-1, 4-苯并噁嗪(解草酮), 5-氯-
喹喔啉-8-氧基乙酸 1-甲基-己酯(喹氧乙酸), 2, 2-二氯-N-(2-氧代-
2-(2-丙烯基氨基)-乙基)-N-(2-丙烯基)-乙酰胺(DKA-24), 1, 8-萘酸
10 酐, 1-(2, 4-二氯-苯基)-5-三氯甲基-1H-1, 2, 4-三唑-3-羧酸乙酯(解
草唑乙酯), 2-氯-4-三氯甲基-噻唑-5-羧酸苯基甲基酯(解草安), 3-
二氯乙酰基-5-(2-呋喃基)-2, 2-二甲基噁唑烷(解草呋, MON13900),
4-二氯乙酰基-1-氧杂-4-氮杂-螺[4.5]-癸烷(AD-67), 2-二氯甲基-2-
甲基-1, 3-二氧戊环(MG-191), 2, 2-二氯-N-(1, 3-二氧戊环-2-基-甲
15 基)-N-(2-丙烯基)-乙酰胺(PPG-1292), 2, 2-二氯-N, N-二-2-丙烯基-
乙酰胺(抑害胺), N-(4-甲基-苯基)-N'-(1-甲基-1-苯基-乙基)-脲(香
草隆), 1-二氯乙酰基-六氢-3, 3, 8a-三甲基吡咯并[1, 2-a]-嘧啶-
6(2H)-酮(BAS-145138), N-(2-甲氧基-苯甲酰)-4-(甲基氨基羰基氨
基)-苯磺胺和/或下列通式定义的化合物

20



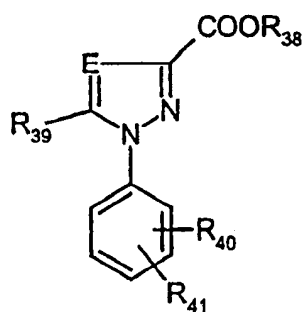
其中

R_{32} 代表氢, C_1 - C_8 -烷基或 C_1 - C_6 -烷氧基-或 C_3 - C_6 -烯氧基-取代的
 C_1 - C_8 -烷基和

25

X_1 代表氢或氯;

或式(IIb)的化合物



(IIb),

其中

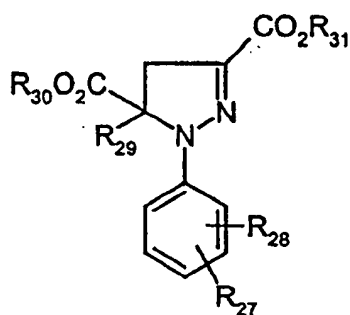
E 代表氮或次甲基;

5 R_{38} 代表 C_1-C_4 -烷基;

R_{39} 代表 $-CCl_3$, 苯基或卤代苯基, 和

R_{40} 和 R_{41} 彼此独立地代表氢或卤素;

或式 (IIc) 的化合物



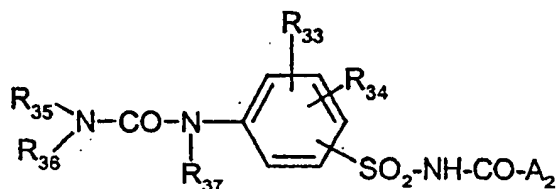
(IIc),

其中

R_{27} 和 R_{28} 彼此独立地代表氢或卤素和

R_{29} , R_{30} 和 R_{31} 彼此独立地代表 C_1-C_4 -烷基;

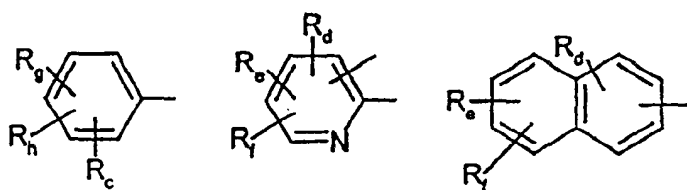
或式 (IId) 的化合物



(IId)

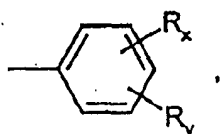
其中

A_2 代表下列基团

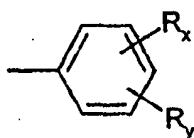


R_{35} 和 R_{36} 彼此独立地代表氢, C_1 - C_8 -烷基, C_3 - C_8 -环烷基, C_3 - C_6 -烯基, C_3 - C_6 -炔基,

5



或 C_1 - C_4 -烷氧基-或



10 取代的 C_1 - C_4 -烷基; 或

R_{35} 和 R_{36} 共同形成 C_4 - C_6 -亚烷基桥, 该桥可以被氧、硫、 SO 、 SO_2 、 NH 或 $-N(C_1-C_4-烷基)-$ 间断;

R_{37} 代表氢或 C_1 - C_4 -烷基;

15 R_{33} 代表氢, 卤素, 氰基, 三氟甲基, 硝基, C_1 - C_4 -烷基, C_1 - C_4 -烷氧基, C_1 - C_4 -烷硫基, C_1 - C_4 -烷基亚磺酰基, C_1 - C_4 -烷基磺酰基, $-COOR_j$, $-CONR_kR_m$, $-COR_n$, $-SO_2-NR_kR_m$ 或 $-OSO_2-C_1-C_4$ -烷基;

20 R_g 代表 氢, 卤素, 氰基, 硝基, C_1 - C_4 -烷基, C_1 - C_4 -卤代烷基, C_1 - C_4 -烷硫基, C_1 - C_4 -烷基亚磺酰基, C_1 - C_4 -烷基磺酰基, $-COOR_j$, $-CONR_kR_m$, $-COR_n$, $-SO_2NR_kR_m$, $-OSO_2-C_1-C_4$ -烷基, C_1 - C_6 -烷氧基或被 C_1 - C_4 -烷氧基或卤素取代的 C_1 - C_6 -烷氧基, C_3 - C_5 -烯氧基或被卤素取代的 C_3 - C_6 -烯氧基, 或代表 C_3 - C_6 -炔氧基或

R_{33} 和 R_{34} 一起形成可被卤素或 C_1 - C_4 -烷基取代的 C_3 - C_4 -亚烷基桥,

或形成被卤素或 C_1-C_4 -烷基取代的 C_3-C_4 -亚链烯基(Alkenylen)桥, 或形成可被卤素或 C_1-C_4 -烷基取代的 C_3-C_4 -亚链二烯基(Alkadienylen)桥;

R_{34} 和 R_h 彼此独立地代表氢, 卤素, C_1-C_4 -烷基, 三氟甲基, C_1-C_6 -烷氧基, C_1-C_6 -烷硫基或 $-COOR_j$;

R_c 代表 氢, 卤素, 硝基, C_1-C_4 -烷基或甲氧基,

R_d 代表 氢, 卤素, 硝基, C_1-C_4 -烷基, C_1-C_4 -烷氧基, C_1-C_4 -烷硫基, C_1-C_4 -烷基亚磺酰基, C_1-C_4 -烷基磺酰基, $-COOR_j$ 或 $CONR_kR_m$;

R_e 代表 氢, 卤素, C_1-C_4 -烷基, $-COOR_j$, 三氟甲基或甲氧基, 或

R_d 和 R_e 一起形成 C_3-C_4 -亚烷基桥;

R_f 代表 氢, 卤素或 C_1-C_4 -烷基;

R_x 和 R_y 彼此独立地代表 氢, 卤素, C_1-C_4 -烷基, C_1-C_4 -烷氧基, C_1-C_4 -烷硫基, $-COOR_{38}$, 三氟甲基, 硝基或氰基;

R_j , R_k 和 R_m 彼此独立地代表 氢或 C_1-C_4 -烷基; 或

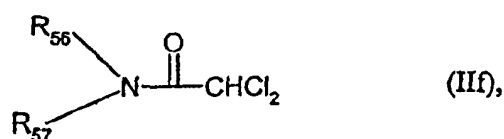
R_k 和 R_m 一起形成可被氧、NH 或 $-N(C_1-C_4\text{-烷基})$ -间断的 C_4-C_6 -亚烷基桥;

R_n 代表 C_1-C_4 -烷基, 苯基或卤素-, C_1-C_4 -烷基-, 甲氧基-, 硝基-或三氟甲基取代的苯基;

R_{38} 代表氢, C_1-C_{10} -烷基, C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基, C_1-C_4 -烷硫基- C_1-C_4 -烷基, 二- C_1-C_4 -烷基氨基- C_1-C_4 -烷基, 卤代- C_1-C_8 -烷基, C_2-C_8 -链烯基, 卤代- C_2-C_8 -链烯基, C_3-C_8 -炔基, C_3-C_7 -环烷基, 卤代- C_3-C_7 -环烷基, C_1-C_8 -烷基羰基, 烯丙基羰基, C_3-C_7 -环烷基羰基, 苯甲酰基, 该基团是未取代的或在苯环上至多三次被相同或不同的取代基取代, 所述取代基来自卤素, C_1-C_4 -烷基, 卤代- C_1-C_4 -烷基, 卤代- C_1-C_4 -烷氧基或 C_1-C_4 -烷氧基; 或代表糠酰基, 噻吩基; 或代表被下列基团取代的 C_1-C_4 -烷基, 即被苯基、卤代苯基、 C_1-C_4 -烷基苯基、 C_1-C_4 -烷氧基苯基、卤代- C_1-C_4 -烷基苯基、卤代- C_1-C_4 -烷氧基苯基、 C_1-C_6 -烷氧基羰基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_8 -烷氧基羰基、 C_3-C_8 -烯氧基羰基、 C_3-C_8 -炔氧基羰基、 C_1-C_8 -烷硫基羰基、 C_3-C_8 -烯硫基羰基、 C_3-C_8 -炔硫基羰基、氨基甲酰基、单- C_1-C_4 -烷基氨基羰基、二- C_1-C_4 -烷基氨基羰基取代; 或代表苯基氨基羰基, 该基团是未取代的或在苯基上至多三次被相同或不同的取代基取代, 所述取代基来自卤素、 C_1-C_4 -烷基、卤代- C_1-C_4 -

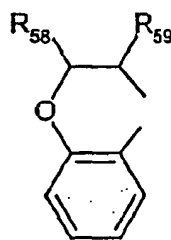
- 烷基, 卤代- C_1-C_4 -烷氧基和 C_1-C_4 -烷氧基或在苯环上被氰基或硝基单取代或代表二氧戊环-2-基, 该基团是未取代的或被一个或两个 C_1-C_4 -烷基取代, 或代表二氧己环-2-基, 该基团是未取代的或被一个或两个 C_1-C_4 -烷基取代, 或代表被氰基, 硝基, 羧基或 C_1-C_8 -烷硫基- C_1-C_8 -烷氧基羰基取代的 C_1-C_4 -烷基;

或式 (II f) 的化合物

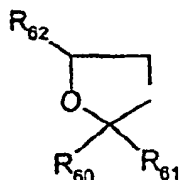


其中

- 10 R_{56} 和 R_{57} 彼此独立地代表 C_1-C_6 -烷基或 C_2-C_6 -链烯基; 或 R_{56} 和 R_{57} 一起代表

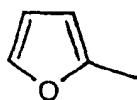


- 15 R_{58} 和 R_{59} 彼此独立地代表 氢或 C_1-C_6 烷基; 或 R_{56} 和 R_{57} 一起代表

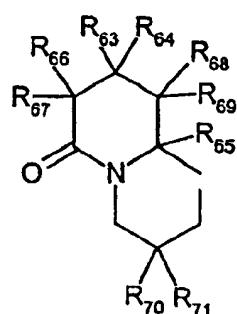


R_{60} 和 R_{61} 彼此独立地代表 C_1-C_4 -烷基, 或 R_{60} 和 R_{61} 一起代表 $-(CH_2)_5-$; R_{62} 代表氢, C_1-C_4 -烷基或

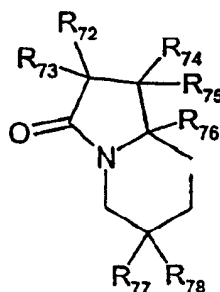
20



或 R_{56} 和 R_{57} 一起代表

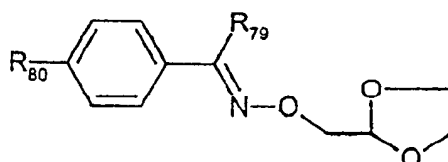


或



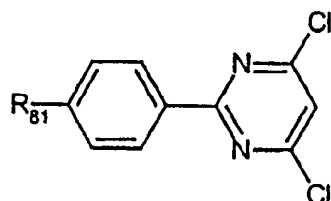
R_{63} , R_{64} , R_{65} , R_{66} , R_{67} , R_{68} , R_{69} , R_{70} , R_{71} , R_{72} , R_{73} , R_{74} , R_{75} , R_{76} ,
5 R_{77} 和 R_{78} 彼此独立地代表氢或 C_1 - C_4 -烷基;

或式 (IIg) 的化合物



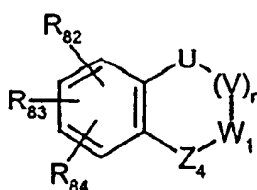
(IIg),

其中 R_{79} 代表氢或氯和
10 R_{80} 代表氟基或三氟甲基,
或式 (IIh) 的化合物



(IIh)

其中
15 R_{81} 代表氢或甲基,
或式 (IIj) 的化合物



(IIj),

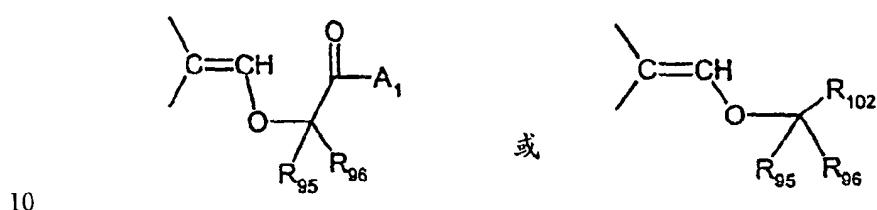
其中

R_{82} 代表 氢, C_1-C_4 -烷基, 被 C_1-C_4 -烷基- X_2 -或 C_1-C_4 -卤代烷基- X_2 -取代的 C_1-C_4 -烷基, 代表 C_1-C_4 -卤代烷基, 硝基, 氰基, $-COOR_{85}$, $-NR_{86}R_{87}$, $-SO_2NR_{88}R_{89}$ 或 $-CONR_{90}R_{91}$,

5 R_{83} 代表 氢, 卤素, C_1-C_4 -烷基, 三氟甲基, C_1-C_4 -烷氧基或 C_1-C_4 -卤代烷氧基;

R_{84} 代表 氢, 卤素或 C_1-C_4 -烷基;

U , V , W_1 和 Z_4 彼此独立地代表 氧, 硫, $C(R_{92})R_{93}$, 羰基, NR_{94} ,



其中

R_{102} 代表 C_2-C_4 -链烯基或 C_2-C_4 -炔基;

条件是 a) 至少一个环组成部分 U 、 V 、 W_1 或 Z_4 是羰基并且与这个或这些环组成部分相邻的环组成部分代表基团

15



其中该基团只出现一次; 和

b) 两个相邻的环单元 U 和 V , V 和 W_1 和 W_1 和 Z 不可以同时代表氧;

20 R_{95} 和 R_{96} 彼此独立地代表 氢或 C_1-C_8 -烷基; 或

R_{95} 和 R_{96} 一起形成 C_2-C_6 -亚烷基;

A_1 是 $R_{99}-Y_1$ -或 $-NR_{97}R_{98}$;

X_2 是 氧或 $-S(O)_s$;

Y_1 是 氧或 硫;

25 R_{99} 是 氢, C_1-C_8 -烷基, C_1-C_8 -卤代烷基, C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_8 -烷基, C_3-C_6 -烯氧基- C_1-C_8 -烷基或 苯基- C_1-C_8 -烷基, 其中的苯环可被 卤素、

C_1-C_4 -烷基、三氟甲基、甲氧基或甲基- $S(O)_s$ -取代, 代表 C_3-C_6 -链烯基, C_3-C_6 -卤代链烯基, 苯基- C_3-C_6 -链烯基, C_3-C_6 -炔基, 苯基- C_3-C_6 -炔基, 氧杂环丁烷基, 呋喃基或四氢呋喃基;

R_{85} 代表氢或 C_1-C_4 -烷基;

5 R_{86} 代表氢, C_1-C_4 -烷基或 C_1-C_4 -烷基羰基;

R_{87} 代表氢或 C_1-C_4 -烷基; 或

R_{86} 和 R_{87} 一起形成 C_4 -或 C_5 -亚烷基;

R_{88} , R_{89} , R_{90} 和 R_{91} 彼此独立地代表氢或 C_1-C_4 -烷基; 或 R_{88} 与 R_{89} 或 R_{90} 与 R_{91} 一起彼此独立地代表 C_4 -或 C_5 -亚烷基, 其中的一个碳原子可

10 以被氧或硫代替或一个或两个碳原子可被 $-NR_{100}$ -代替;

R_{92} , R_{100} 和 R_{93} 彼此独立地代表氢或 C_1-C_8 -烷基; 或

R_{92} 和 R_{93} 一起代表 C_2-C_6 -亚烷基;

R_{94} 代表氢或 C_1-C_8 -烷基;

15 R_{97} 代表 氢; C_1-C_8 -烷基, 苯基, 苯基- C_1-C_8 -烷基, 其中的苯环可以被氟、氯、溴、硝基、氰基、 $-OCH_3$, C_1-C_4 -烷基或 CH_3SO_2 -取代, 代表 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_8 -烷基, C_3-C_6 -链烯基或 C_3-C_6 -炔基;

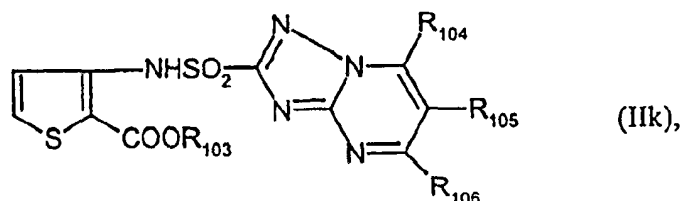
R_{98} 代表氢, C_1-C_8 -烷基, C_3-C_6 -链烯基或 C_3-C_6 -炔基, 或

R_{97} 和 R_{98} 一起代表 C_4 -或 C_5 -亚烷基, 其中的一个碳原子可被氧或硫代替, 或一个或两个碳原子可被 $-NR_{101}$ -代替;

20 R_{101} 代表 氢或 C_1-C_4 -烷基;

r 代表 0 或 1; 和

s 代表 0, 1 或 2, 或式 (IIk) 化合物



25 其中

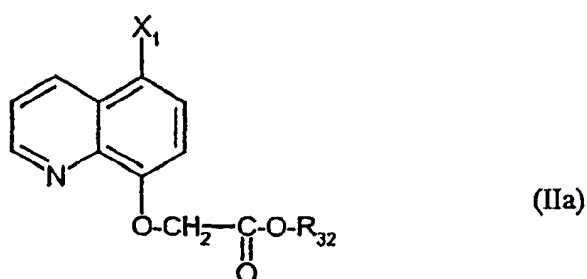
R_{103} 代表 氢, C_1-C_6 -烷基, C_3-C_6 -环烷基, C_3-C_6 -链烯基或 C_3-C_6 -炔基; 和

R_{104} , R_{105} 和 R_{106} 彼此独立地代表氢, C_1-C_6 -烷基, C_3-C_6 -环烷基或 C_1-C_6 -烷氧基, 条件是取代基 R_{104} , R_{105} 和 R_{106} 中的一个不是氢,

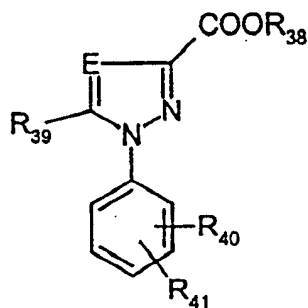
其中，通常每重量份式(I)的活性化合物 2-(2-甲氧基羰基-苯基磺酰基氨基羰基)-4-甲基-5-丙氧基-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮或其盐有 0.001 - 1000 重量份上述组(b)化合物。

在通式定义的组(b)化合物中，优选下表所列化合物：

5 表 1 式(IIa)化合物



化合物编号	X ₁	R ₃₂
1.01	Cl	-CH(CH ₃)-C ₅ H ₁₁ -n
1.02	Cl	-CH(CH ₃)-CH ₂ OCH ₂ CH=CH ₂
1.03	Cl	H
1.04	Cl	C ₄ H ₉ -n

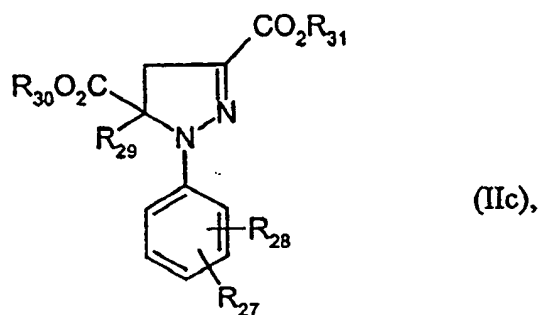
表2 式 (IIb) 化合物

(IIb)

5

化合物编号	R_{38}	R_{39}	R_{40}	R_{41}	E
2.01	CH_3	苯基	2-Cl	H	CH
2.02	CH_3	苯基	2-Cl	4-Cl	CH
2.03	CH_3	苯基	2-F	H	CH
2.04	CH_3	2-氯苯基	2-F	H	CH
2.05	C_2H_5	CCl_3	2-Cl	4-Cl	N
2.06	CH_3	苯基	2-Cl	4- CF_3	N
2.07	CH_3	苯基	2-Cl	4- CF_3	N
2.08	CH_3	2-氯苯基	2-Cl	H	CH

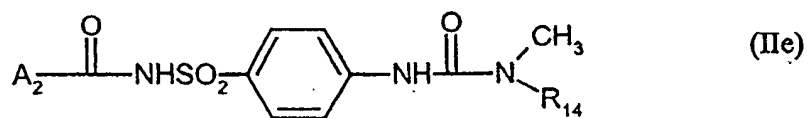
表3 式 (IIc) 化合物



5

化合物编号	R ₂₉	R ₃₀	R ₃₁	R ₂₇	R ₂₈
3.01	CH ₃	CH ₃	CH ₃	2-Cl	4-Cl
3.02	CH ₃	C ₂ H ₅	CH ₃	2-Cl	4-Cl
3.03	CH ₃	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	2-Cl	4-Cl

表4 式 (IIe) 化合物



10

化合物编号	A ₂	R ₁₄
4.001		H
4.002		H

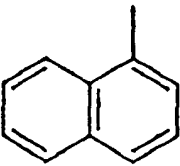
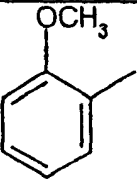
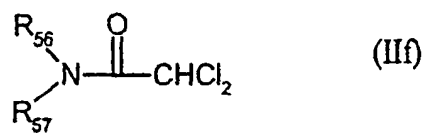
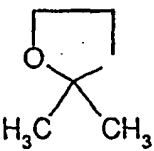
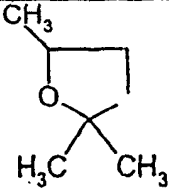
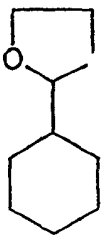
化合物编号	A ₂	R ₁₄
4.003		CH ₃
4.004		CH ₃

表5 式(III_f)化合物

化合物编号	R ₅₆	R ₅₇	R ₅₆ + R ₅₇
5.001	CH ₂ =CHCH ₂	CH ₂ =CHCH ₂	-
5.002	-	-	
5.003	-	-	
5.004	-	-	

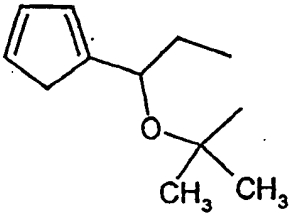
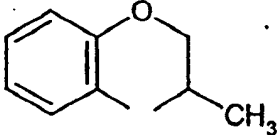
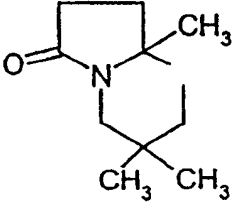
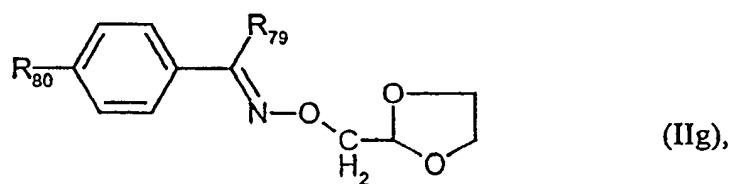
化合物编号	R ₅₆	R ₅₇	R ₅₆ + R ₅₇
5.005	-	-	
5.006	-	-	
5.007	-	-	

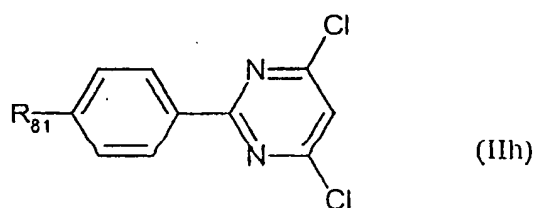
表6 式(IIg)化合物



5

化合物编号	R ₈₀	R ₇₉
6.01	H	CN
6.02	Cl	CF ₃

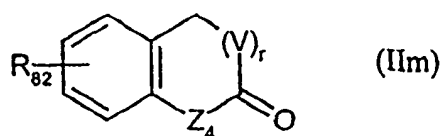
表7 式(IIh)化合物



化合物编号	R ₈₁
7.01	H
7.02	CH ₃

表8 式(IIm)化合物

5



化合物编号	R ₈₂	Z ₄	V	r
8.001	H		O	1
8.002	H		O	1
8.003	H		O	1
8.004	H		O	1
8.005	H		CH ₂	1
8.006	H		CH ₂	1

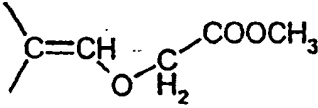
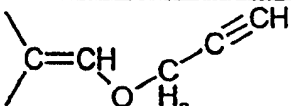
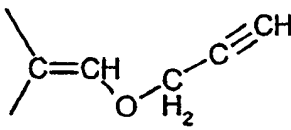
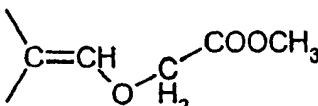
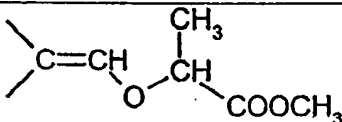
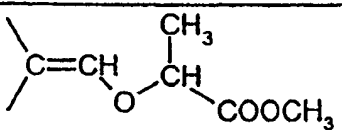
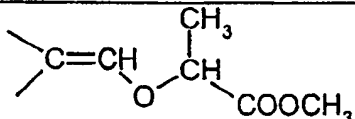
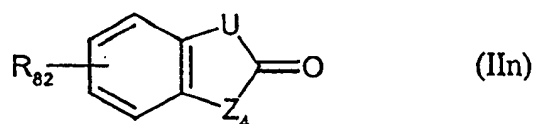
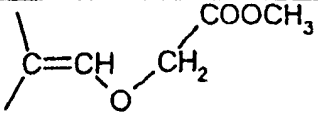
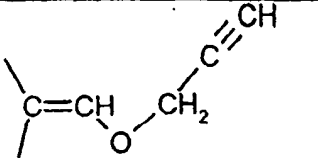
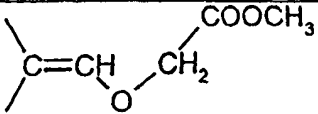
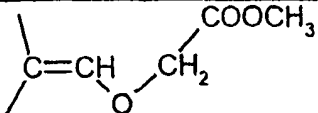
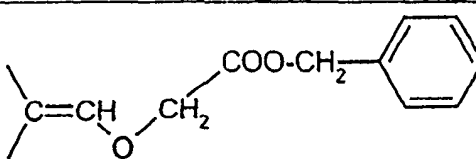
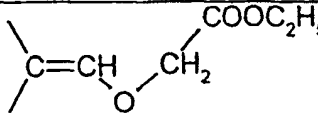
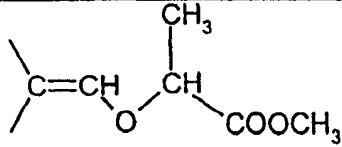
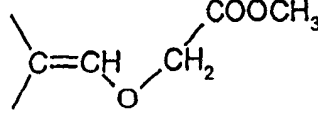
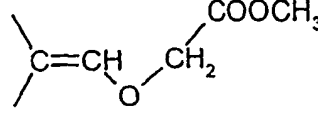
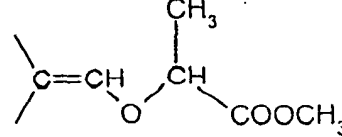
化合物编号	R ₈₂	Z ₄	V	r
8.007	H		S	1
8.008	H		S	1
8.009	H		NCH ₃	1
8.010	H		NCH ₃	1
8.011	H		NCH ₃	1
8.012	H		O	1
8.013	H		S	1

表9 式 (IIIn) 化合物



化合物编号	U	R ₈₂	Z ₄
9.001	O	H	
9.002	O	H	
9.003	O	5-Cl	
9.004	CH ₂	H	
9.005	CH ₂	H	
9.006	CH ₂	H	
9.007	NH	5-Cl	
9.008	NH	5-Cl	
9.009	NH	H	
9.010	NH	H	

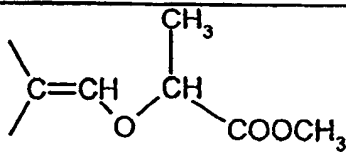
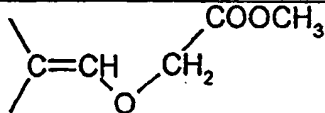
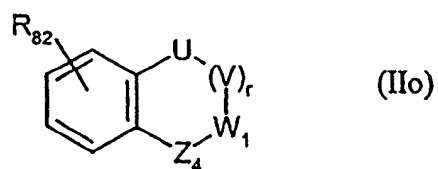
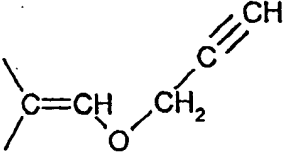
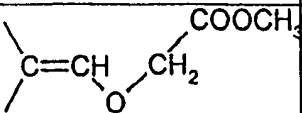
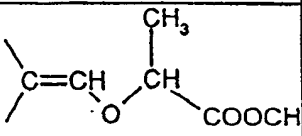
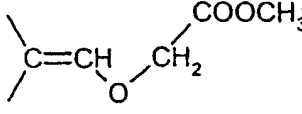
化合物编号	U	R ₈₂	Z ₄
9.011	NCH ₃	H	
9.012	NCH ₃	H	

表10 式 (IIo) 化合物



5

化合物编号	U	V	r	W ₁	Z ₄	R ₈₂
10.001	O	C=O	1		CH ₂	H
10.002	O	C=O	1		CH ₂	H
10.003	CH ₂	C=O	1		CH ₂	H
10.004	CH ₂	C=O	1		CH ₂	H

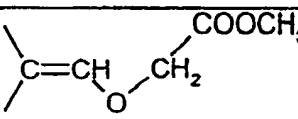
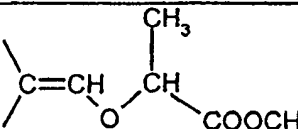
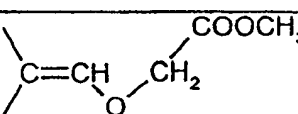
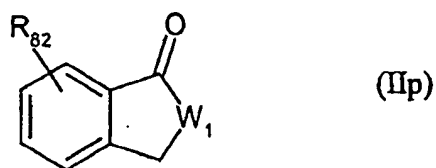
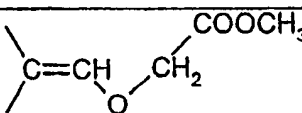
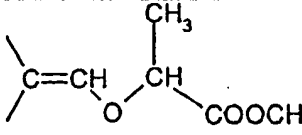
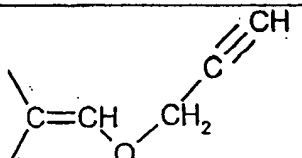
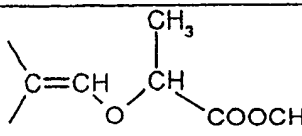
化合物编号	U	V	r	W ₁	Z ₄	R ₈₂
10.005	CH ₂	CH ₂	1		C=O	H
10.006	CH ₂	CH ₂	1		C=O	H
10.007	NCH ₃	C=O	1		CH ₂	H

表11 式(Ⅱp)化合物



化合物编号	R ₈₂	W ₁
11.001	6-Cl	
11.002	6-Cl	
11.003	H	
11.004	H	

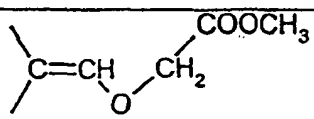
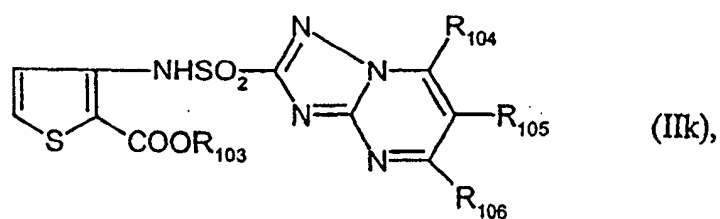
化合物编号	R ₈₂	W ₁
11.005	H	

表12 式(IIIk)化合物



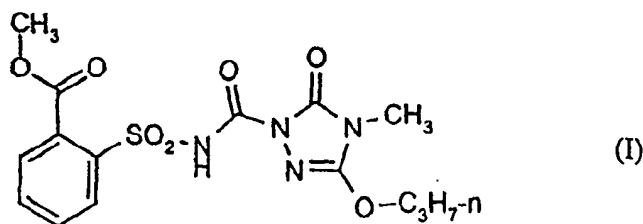
5

化合物编号	R ₁₀₃	R ₁₀₄	R ₁₀₅	R ₁₀₆
12.01	CH ₃	H	环丙基	H
12.02	CH ₃	C ₂ H ₅	环丙基	H
12.03	CH ₃	环丙基	C ₂ H ₅	H
12.04	CH ₃	CH ₃	H	H
12.05	CH ₃	CH ₃	环丙基	H
12.06	CH ₃	OCH ₃	OCH ₃	H
12.07	CH ₃	CH ₃	OCH ₃	H
12.08	CH ₃	OCH ₃	CH ₃	H
12.09	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H
12.10	C ₂ H ₅	CH ₃	CH ₃	H
12.11	C ₂ H ₅	OCH ₃	OCH ₃	H
12.12	H	OCH ₃	OCH ₃	H
12.13	H	CH ₃	CH ₃	H
12.14	C ₂ H ₅	H	H	CH ₃
12.15	H	H	H	CH ₃
12.16	CH ₃	H	H	CH ₃

本发明特别优选的是特征在于含活性化合物组合物的选择性除草组合物，所述活性化合物组合物含

(a) 式(I)的 2-(2-甲氧基羰基-苯基磺酰基氨基羰基)-4-甲基-5-丙氧基-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮

5



和/或一种或多种式(I)化合物的盐，尤其是钠盐，

和

(b) 1-(2,4-二氯苯基)-4,5-二氢-5-甲基-1H-吡唑-3,5-二羧酸二乙酯(吡咯二酸二乙酯)，[(5-氯-8-喹啉基)氧基]乙酸 1-甲基己基酯(喹氧乙酸异庚酯)和/或 1-(2,4-二氯苯基)-5-(三氯甲基)-1H-1,2,4-三唑-3-羧酸乙酯(解草唑乙酯)。

其中，通常每重量份式(I)的活性化合物 2-(2-甲氧基羰基-苯基磺酰基氨基羰基)-4-甲基-5-丙氧基-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮有 0.001-1000 重量份上述组(b)化合物。

令人惊讶的是还发现，除草活性物质 2,4-二氯苯氧基-乙酸(2,4-D)及其衍生物也可用作上述安全剂。

因此，另一优选的实施方案是一方面含式(I)化合物和/或其盐，另一方面含 2,4-D 和/或其衍生物的混合物。典型的 2,4-D 衍生物是例如其酯。

在组(b)化合物中，最优选 1-(2,4-二氯苯基)-4,5-二氢-5-甲基-1H-吡唑-3,5-二羧酸二乙酯(吡咯二酸二乙酯)。

化合物 1-(2,4-二氯苯基)-4,5-二氢-5-甲基-1H-吡唑-3,5-二羧酸二乙酯(吡咯二酸二乙酯)，[(5-氯-8-喹啉基)氧基]乙酸 1-甲基己基酯(喹氧乙酸异庚酯)和 1-(2,4-二氯苯基)-5-(三氯甲基)-1H-1,2,4-三唑-3-羧酸乙酯(解草唑乙酯)分别公开于下列专利申请中：DE-A3939503、EP-A191736 和 DE-A 3525205。2,4-D 是已知的除草剂。

优选的式(I)化合物的盐是钠盐，钾盐，铵盐，甲基铵盐，乙基铵

盐, 正或异丙基铵盐, 正、异、仲或叔丁基铵盐, 二甲基铵盐, 二乙基铵盐, 二正丙基铵盐, 二异丙基铵盐, 二正丁基铵盐, 二异丁基铵盐, 二仲丁基铵盐, 三甲基铵盐, 三乙基铵盐, 三丙基铵盐, 三丁基铵盐, 三甲基铯和三乙基铯。

- 5 特别优选的式(II)或(III)化合物的盐是钠盐, 钾盐, 铵盐, 甲基铵盐, 乙基铵盐, 正或异丙基铵盐, 二甲基铵盐, 二乙基铵盐, 二正丙基铵盐, 二异丙基铵盐和三甲基铯盐, 尤选的是钠盐。

令人惊讶的是现已发现, 上述定义的式(I)的 2-(2-甲氧基羰基-苯基磺酰基氨基羰基)-4-甲基-5-丙氧基-2, 4-二氢-3H-1, 2, 4-三唑-3-酮
10 或其盐和上文所列组(b)的安全剂/解毒剂的活性化合物组合物不仅能被作物极好地耐受, 而且具有特别高的除草活性, 可用于各种作物, 特别是谷类, 尤其是小麦, 以及大豆、马铃薯、玉米和稻以选择性地防除杂草。

本文认为令人惊讶的是大量已知的能拮抗除草剂对作物的破坏作用的安全剂或解毒剂, 特别是上述组(b)化合物几乎能完全抵消 2-(2-甲氧基羰基-苯基-磺酰基氨基羰基)-4-甲基-5-丙氧基-2, 4-二氢-3H-1, 2, 4-三唑-3-酮及其盐, 尤其是其钠盐对作物的破坏作用, 而不会不利地影响对杂草的除草活性。

本文要强调特别和最优选的组(b)组分的特别有利的作用, 特别是在保护作为作物的谷类植物如小麦、大麦和黑麦方面的有利作用。

本发明的活性化合物组合物可用于例如下列植物:

双子叶杂草属: 欧白芥属, 独行菜属, 猪殃殃属, 繁缕属, 藜属, 母菊属, 春黄菊属, 旋花属, 田青属, 节节菜属, 白麻属, 刺酸模属, 三叶草属, 毛茛属, 蒲公英属, 苎麻属, 千里光属, 苋属, 马齿苋属, 苍耳属, 番薯属,
25 蓼属, 豚草属, 蓟属, 苦苣菜属, 茄属, 蒺藜属, 芝麻属, 婆婆纳属, 曼陀罗属, 堇菜属, 酢浆草属, 粟属, 矢车菊属, 牛膝菊属, 水松叶属, 母草属等。

双子叶作物属: 棉属, 大豆属, 甜菜属, 胡萝卜属, 菜豆属, 豌豆属, 茄属, 亚麻属, 甘薯属, 巢菜属, 烟草属, 番茄属, 花生属, 芸苔属, 莴苣属, 黄瓜属, 南瓜属等。

单子叶杂草属: 稗属, 狗尾草属, 黍属, 马唐属, 梯牧草属, 早熟禾属, 羊茅属, 蟋蟀草属, 毒麦属, 雀麦属, 燕麦属, 莎草属, 高粱属, 冰草属, 雨

久花属, 飘拂草属, 慈姑属, 荸荠属, 蔗草属, 雀稗属, 鸭嘴草属, 翦股颖属, 看麦娘属, 狗牙根属, 臂形草属, 狗牙根属, 尖瓣花属, 龙爪茅属等。

单子叶作物属: 稻属, 玉米属, 小麦, 大麦属, 燕麦属, 黑麦属, 高粱属, 黍属, 甘蔗属, 菠萝, 天门冬属, 葱属等。

- 5 然而, 本发明活性化合物组合物的应用决不限于这些属, 而是可以相同的方式应用于其他植物。

根据本发明, 作物指所有的植物和植物品种, 包括转基因植物和植物品种。

- 10 作物与本发明活性化合物组合物相容的有利作用在某些浓度比下是特别明显的。然而, 活性化合物组合物中的活性化合物的重量比可在较宽的范围内变化。通常每重量份式(I)的活性化合物或其盐有0.001-1000重量份, 优选0.01-100重量份, 特别优选0.1-10重量份一种属于上述(b)组的能提高作物相容性的化合物(解毒剂/安全剂)。

- 15 该活性化合物或活性化合物组合物可转化成常规的制剂如溶液, 乳剂, 可湿性粉剂, 悬浮剂, 粉剂, 粉尘剂、糊剂、可溶性粉剂, 颗粒剂, 浓悬乳剂, 浸渍活性化合物的天然和合成材料, 和聚合物包封的极细胶囊(Feinstverkapselungen)。

- 20 这些制剂以已知的方式制备, 例如通过将活性化合物与填充剂混和, 所述填充剂是液体溶剂和/或固体载体, 可任意选择地使用表面活性剂, 所述表面活性剂是乳化剂和/或分散剂和/或成泡剂。

- 如果使用的填充剂是水, 还可以使用例如有机溶剂作为助溶剂。适宜的液体溶剂主要有: 芳香烃, 如二甲苯、甲苯或烷基苯, 氯代芳香烃和氯代脂族烃, 如氯苯、氯乙烯或二氯甲烷, 脂族烃, 如环己烷或石蜡, 例如石油馏分, 矿物和植物油, 醇类, 如丁醇或乙二醇, 及其醚和酯, 酮类, 如丙酮、甲乙酮、甲基异丁基酮或环己酮, 强剂性溶剂, 如二甲基甲酰胺和二甲基亚砷, 以及水。
- 25

适宜的固体载体是:

- 例如铵盐和天然矿物粉末, 如高岭土, 粘土, 滑石, 白垩, 石英, 硅镁土, 蒙脱土或硅藻土和合成矿物粉末, 如高分散硅酸, 氧化铝, 硅酸盐。
- 30 适合颗粒剂的固体载体是, 例如, 粉碎和分级的岩石, 如方解石, 大理石, 浮石, 海泡石和白云石以及无机和有机粉末的合成颗粒以及有机材料, 如锯末, 坚果壳, 玉米穗茎和烟草茎的颗粒; 适宜的乳化剂和/或发泡剂

是,例如非离子和阴离子乳化剂,如聚氧乙烯脂肪酸酯,聚氧乙烯脂肪醇醚,例如烷基芳基聚乙二醇醚,烷基磺酸盐,烷基硫酸盐,芳基磺酸盐以及蛋白水解产物;适宜的分散剂是,例如木质素亚硫酸盐废液和甲基纤维素。

- 5 在制剂中可使用粘合剂,如羧甲基纤维素,粉末,颗粒或胶乳状的天然和合成聚合物,如阿拉伯树胶,聚乙烯醇,聚乙酸乙烯酯,以及天然磷脂,如脑磷脂和卵磷脂,和合成磷脂。其他添加剂可以是矿物和植物油。

- 10 还可以使用着色剂,如无机颜料,例如氧化铁,氧化钛和普鲁士兰,和有机着色剂,如茜素染料,偶氮染料和金属酞菁染料,和痕量营养物,如金属盐,例如,铁、锰、硼、铜、钴、钼和锌的盐。

制剂中通常含有0.1-95重量%,优选0.5-90重量%的包含安全剂的活性化合物。

- 15 本发明的活性化合物组合物通常以成品制剂的形式使用。然而,在活性化合物组合物中所含的活性化合物也可在使用时以单独制剂的形式混和,即桶混的形式。

- 20 新的活性化合物组合物还可以其本身或制剂形式与其他已知除草剂作为混剂使用,这里,还可以使用成品制剂形式或桶混形式。与其他已知的活性化合物,如杀真菌剂、杀虫剂、杀螨剂、杀线虫剂、鸟驱避剂,生长激素,植物营养物和改善土壤结构的试剂的混合物也是可能的。为了某些预定的应用,尤其是在苗后方法中,包含植物耐受的矿物或植物油(例如商品制剂“Oleo® DuPont 11E”)或铵盐例如硫酸铵或硫氰酸铵作为制剂中的其他添加剂也是有利的。

- 25 该新活性化合物组合物可以以本身、制剂或通过进一步稀释制得的使用形式使用,例如现用溶液,悬浮剂,乳剂,粉剂,糊剂和颗粒剂的形式使用。以常规的方式例如通过泼浇、喷洒、喷雾、喷粉或撒施使用。

- 30 本发明活性化合物组合物的用量可以在某一范围内变化;尤其取决于天气和土壤因素。通常的用量在0.05-5Kg/ha,优选0.05-2Kg/ha,特别优选0.1-1.0Kg/ha。

本发明的活性化合物组合物可在出苗前和苗后施用,即通过苗前和苗后方法施用。

应用实施例:

所述活性化合物以常规制剂的形式使用。式(I)化合物的钠盐使用 70WG 或 70WP, 吡咯二酸二乙酯使用 100EC, 解草唑乙酯和喹氧乙酸异庚酯使用我们自己制备的活性化合物试验室制剂。活性化合物和必要时的安全剂被用于制备含 0.1% 添加剂 Renex-36 的含水喷雾液。

实施例 A

苗后试验

使用活性化合物制剂喷洒栽培在 $10 \times 10\text{cm}$ 罐 (生长介质: 土壤或 Vermiculite) 中的试验植物, 每种情况下, 使每单位面积使用预定量的活性化合物。选择喷雾液的浓度以便在 500 l 水/ha 中施用所需量的活性化合物。

大约 18 天后比较未处理对照的发育评定作物的损伤度%。

数字表示:

0%=无损伤 (如未处理的对照)

15 100%=完全破坏/损伤

活性化合物、用量、试验植物和结果示于下表中, 表中所用术语具有下列含义:

小麦 = Orestis 品种的小麦

大麦 = Coronar 品种的大麦

20 a. i. = 活性成分 = 活性化合物/安全剂

式(I)化合物的钠盐=

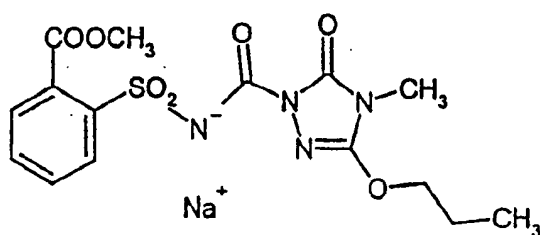


表 A1 苗后试验/温室

活性化合物	用量 (g a. i. /ha)	小麦的损伤 [%]
式 (I) 化合物的钠盐	180	30
	90	20
式 (I) 化合物的钠盐 + 解草唑乙酯	180+500	10
	90+500	10
	180+45	10
	90+45	10

表 A2 苗后试验/温室

活性化合物	用量 (g a. i. /ha)	小麦的损伤 [%]
式 (I) 化合物的钠盐	250	50
	125	30
	60	20
式 (I) 化合物的钠盐 + 吡咯二酸二乙酯	250 + 250	20
	125 + 125	0
	60 + 60	0

表 A3 苗后试验/温室

活性化合物	用量 (g a. i. /ha)	小麦的损伤 [%]
式 (I) 化合物的钠盐	125	50
	60	10
	30	5
式 (I) 化合物的钠盐 + 吡咯二酸二乙酯	125 + 125	10
	60 + 60	5
	30+30	0

表 A4 苗后试验/温室

活性化合物	用量 (g a. i. /ha)	小麦的损伤 [%]
式 (I) 化合物的钠盐	125	40
	60	30
式 (I) 化合物的钠盐 + 吡咯二酸二乙酯	125 + 250	10
	60+250	0

表 A5 苗后试验/温室

活性化合物	用量 (g a. i. /ha)	大麦的损伤 [%]
式 (I) 化合物的钠盐	60	70
	30	70
	15	50
式 (I) 化合物的钠盐 + 吡咯二酸二乙酯	60 + 60	60
	30+30	50
	15+15	30

表 A6 苗后试验/温室

活性化合物	用量 (g a. i. /ha)	大麦的损伤 [%]
式 (I) 化合物的钠盐	60	60
	30	60
	15	50
	8	50
式 (I) 化合物的钠盐 + 吡咯二酸二乙酯	60+200	50
	30+200	30
	15+200	30
	8+200	5
	60+50	60
	30+50	40
	15+50	30
	8+50	10

表 A7 苗后试验/温室

活性化合物	用量 (g a. i. /ha)	小麦的损伤 [%]
式 (I) 化合物的钠盐	250	50
	125	30
	60	20
式 (I) 化合物的钠盐 + 喹氧乙酸异庚酯	250 + 250	20
	125 + 125	10
	60 + 60	0

表 A8 苗后试验/温室

活性化合物	用量 (g a. i. /ha)	小麦的损伤[%]
式(I)化合物的钠盐	125	50
	60	10
	30	5
式(I)化合物的钠盐 + 喹氧乙酸异庚酯	125 + 125	10
	60 + 60	5
	30+30	0

表 A9 苗后试验/温室

活性化合物	用量 (g a. i. /ha)	大麦的损伤[%]
式(I)化合物的钠盐	60	70
	30	70
	15	50
式(I)化合物的钠盐 + 喹氧乙酸异庚酯	60+60	60
	30+30	50
	15+15	30