

[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl.

A01N 43/56 (2006.01)

A01P 13/00 (2006.01)



[12] 发明专利说明书

专利号 ZL 02823212.7

[45] 授权公告日 2007 年 3 月 28 日

[11] 授权公告号 CN 1306871C

[22] 申请日 2002.11.13 [21] 申请号 02823212.7

[30] 优先权

[32] 2001.11.23 [33] DE [31] 10157545.9

[86] 国际申请 PCT/EP2002/012673 2002.11.13

[87] 国际公布 WO2003/043423 德 2003.5.30

[85] 进入国家阶段日期 2004.5.21

[73] 专利权人 拜尔作物科学有限公司

地址 德国法兰克福

[72] 发明人 M·施米特 L·维尔姆斯

F·齐默 C·罗辛格

H·比林格尔 H·P·胡夫

E·哈克

[56] 参考文献

WO0030447A 2000.6.2

DE19961465A 2000.7.6

审查员 索 翌

[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 吴亦华

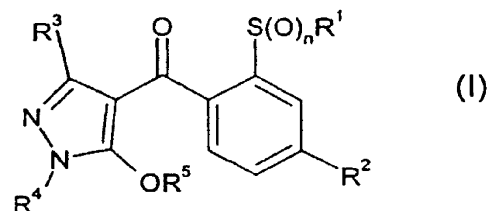
权利要求书 2 页 说明书 16 页

[54] 发明名称

包含苯甲酰基吡唑和安全剂的除草组合物

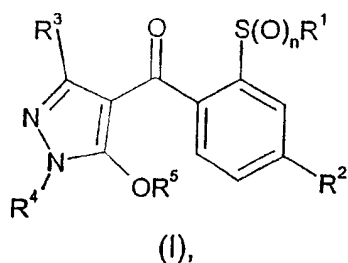
[57] 摘要

本文涉及包含式(I)除草化合物和起安全剂作用的化合物的除草组合物。在式 I 中, R^1 至 R^4 表示氢、卤素、烷基和卤代烷基。



1. 一种除草组合物, 包含

A) 除草有效量的一种或多种式 (I) 化合物, 如果适合的话也以它们的盐形式,



其中

R^1 为甲基或乙基;

R^2 为三氟甲基、氟、氯或溴;

R^3 为氢或甲基;

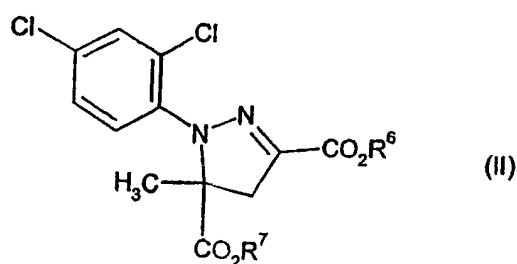
R^4 为甲基或乙基;

R^5 为氢、甲基磺酰基、乙基磺酰基、正丙基磺酰基、苯磺酰基、4-甲苯磺酰基、苄基、苯甲酰基甲基、硝基苯甲酰基甲基或 4-氟苯甲酰基甲基, 以及

n 为 0, 1 或 2, 和

B) 选自组 B1 的解毒有效量的至少一种化合物 (组分 B):

B1 式 II 化合物



其中 R^6 和 R^7 彼此分别为氢或 (C_1-C_4) -烷基;

包括它们的立体异构体和农业上有用的盐。

2. 根据权利要求1的除草组合物, 其中

R^1 为甲基;

R^2 为三氟甲基;

R^3 为氢或甲基;

R^4 为甲基或乙基;

R^5 为氢, 和

n 为 2。

3. 根据权利要求1或2的除草组合物, 其特征在于, 除草剂: 安全剂的重量比为 1:100 至 100:1。

4. 一种控制有用作物中有害植物的方法, 其特征在于, 包含施用如权利要求1至3所述的一种或多种除草有效量的除草剂/安全剂组合物于有害植物、植物、植物种子或植物生长区域。

5. 根据权利要求4的方法, 其特征在于, 植物选自下组: 玉米、小麦、黑麦、大麦、燕麦、水稻、高粱、棉花、甘蔗和大豆。

6. 根据权利要求4或5的方法, 其特征在于, 植物是基因改良的。

包含苯甲酰基吡唑和安全剂的除草组合物

本发明涉及植物保护剂技术领域，特别是适合用于有用植物作物中控制竞争有害植物的除草剂/解毒剂组合物(活性成分/安全剂组合物)。

作为对-羟苯基丙酮酸过氧化酶(HPPD)抑制剂的大量除草活性成分是已知的。最近公开了更多的这类活性物质，如在 WO 99/58509 和 DE 10016116.2 中。

如同许多其它除草活性成分，这些 HPPD 抑制剂也不总是足以很好地被一些重要作物耐受(即在作物中没有足够的选择性)，如玉米、水稻或谷类，因此它们的利用是非常有限的。因此在一些作物中它们不能使用或极少量地使用，以致不能保证所需要的广泛控制有害植物的除草活性。特别地，许多上述提及的除草剂不能作为完全选择性的除草剂用于在玉米、水稻、谷类、甘蔗和一些其它作物中控制有害植物。

已知用于克服这些缺点，使用除草活性成分与所谓的安全剂或解毒剂组合。例如，WO 99/66795 和 WO 00/30447 公开了大量 HPPD 抑制剂和多种安全剂的各种组合。尤其是，WO 00/30447 也公开了苯甲酰基吡唑与不同安全剂混合。

对于安全剂的理解是，其解除或降低除草剂对有用植物的毒性，而实质上不降低控制有害植物的除草作用。

由于还不知道安全剂减少除草剂的有害作用的机制，寻找用于某类除草剂的安全剂仍是一件困难的任务。因此，与某类除草剂组合起安全剂作用的化合物的事实不能得出是否该化合物对其它种类除草剂也有安全剂作用的结论。从而，在许多实例中，当安全剂用于保护有用植物免受除草剂损害时，安全剂仍会显现某些缺点，包括：

- 安全剂降低除草剂控制有害植物的活性，
- 保护有用植物的特性不足，
- 与给定除草剂混合的安全剂/除草剂组合应用的有用植物谱不够

广。

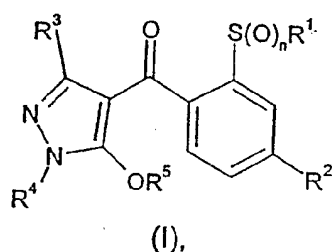
· 给定安全剂不能与足够多的除草剂相组合。

本发明的目的是提供选自 HPPD 抑制剂的除草剂类与适合提高这些除草剂对重要作物的选择性的安全剂的更多组合物。

目前已发现新组合物，即选自 HPPD 抑制剂的某些除草剂，特别是选自在苯甲酰基团的 2 位和 4 位连有经选择的取代基的苯甲酰基吡唑，与一些提高这些除草剂对重要作物的选择性的经选择的安全剂相组合。

因此，本发明涉及一种除草活性组合物，包含

A) 除草有效量的一种或多种式 (I) 化合物，如果适合的话也以它们的盐形式，



其中

R^1 为甲基或乙基；

R^2 为三氟甲基、氟、氯或溴；

R^3 为氢或甲基；

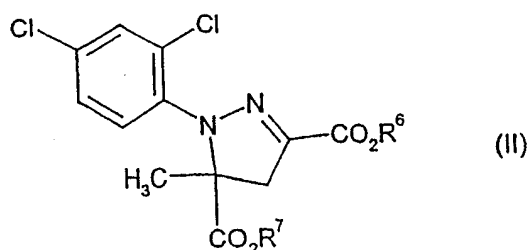
R^4 为甲基或乙基；

R^5 为氢、甲基磺酰基、乙基磺酰基、正丙基磺酰基、苯磺酰基、4-甲基磺酰基、苄基、苯甲酰基甲基、硝基苯甲酰基或 4-氟苯甲酰基，以及

n 为 0, 1 或 2, 和

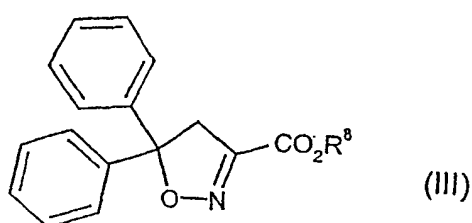
B) 选自组 B1 至 B6 之一的解毒有效量的至少一种化合物(组分 B):

B1 式 II 化合物



其中 R^6 和 R^7 彼此分别为氢或 (C_1-C_4) -烷基;

B2 式 III 化合物



其中 R^8 为氢或 (C_1-C_4) -烷基;

B3 解草腈、肟草安、解草啉、解草安、喹氧乙酸、抑草胺、解草酮、furilazole、4-二氯乙酰基-1-氧杂-4-氮杂-螺[4,5]癸烷(AD-67);

B4 1,8-萘二酸酐、二苯基甲氧乙酸甲酯、

氰基甲氧亚氨基(苯基)乙腈(抑害腈)、

2-二氯甲基-2-甲基-1,3-二氧戊环(MG-191)、

N-(4-甲苯基)-N'-(1-甲基-1-苯乙基)脲(香草隆)、

1-[4-(N-2-甲氧基苯甲酰基氨基磺酰基)苯基]-3-甲基脲、

1-[4-(N-2-甲氧基苯甲酰基氨基磺酰基)苯基]-3,3-二甲基脲、

1-[4-(N-4,5-二甲基苯甲酰基氨基磺酰基)苯基]-3-甲基脲、

1-[4-(N-萘甲酰基氨基磺酰基)苯基]-3,3-二甲基脲、

1-(乙氧基羰基)乙基 3,6-二氯-2-甲氧基苯甲酸酯
(lactidichlor)

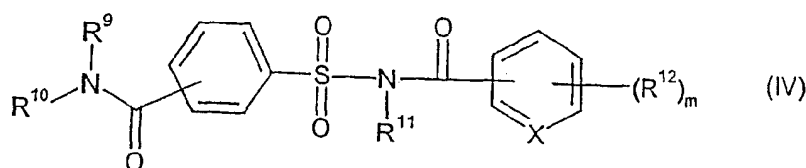
及它们的盐和酯, 优选 (C_1-C_8) 、

3-二氯乙酰基-2,2,5-三甲基噁唑烷、

1,3-二甲基丁-1-基(5-氯-8-喹啉氧基)乙酸酯、

(5-氯-8-喹啉氧基) 乙酸 4-烯丙氧基丁酯、
 (5-氯-8-喹啉氧基) 乙酸 1-烯丙氧基丙-2-酯、
 (5-氯-8-喹啉氧基) 乙酸乙酯、
 (5-氯-8-喹啉氧基) 乙酸甲酯、
 (5-氯-8-喹啉氧基) 乙酸烯丙酯、
 (5-氯-8-喹啉氧基) 乙酸 2-(2-亚丙基亚氨基氧基)-1-乙酯、
 (5-氯-8-喹啉氧基) 乙酸 2-氧代-丙-1-酯;

B5 式 (IV) 的酰基氨磺酰苯甲酰胺, 如果适合的话也以其盐的形式,



其中

X 为 CH 或 N;

R^9 为氢、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_2-C_6) -链烯基、 (C_2-C_6) -炔基, 最后提及的 4 个基团是未取代的或被一个或多个选自下组的相同或不同取代基取代的基团: 卤素、 (C_1-C_6) -烷氧基、 (C_1-C_6) -卤烷氧基、 (C_1-C_2) -烷基亚磺酰基、 (C_1-C_2) -烷基磺酰基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基羰基、 (C_1-C_4) -烷基羰基和在环状基团的情况下, 也有 (C_1-C_4) -烷基和 (C_1-C_4) -卤烷基;

R^{10} 为氢、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_2-C_6) -链烯基、 (C_2-C_6) -炔基, 最后提及的 3 个基团是未取代的或被一个或多个选自下组的相同或不同取代基取代的基团: 卤素、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基和 (C_1-C_4) -硫烷基, 或

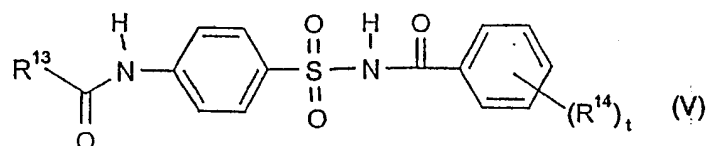
R^9 和 R^{10} 与键连它们的氮原子一起形成吡咯烷基或吡啶基;

R^{11} 为氢、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_2-C_4) -链烯基或 (C_2-C_4) -炔基;

R^{12} 相同或不同地为卤素、硝基、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤烷基、 (C_1-C_4) -卤烷氧基、 (C_1-C_4) -烷氧基、氰基、 (C_1-C_4) -硫烷基、 (C_1-C_4) -烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) -烷基磺酰基，

m 为 0、1 或 2；

B6 式 (V) 的 N -酰基磺酰胺和它们的盐



其中

R^{13} 为氢、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基，最后提及的 2 个基团是未取代的或被一个或多个选自下组的取代基取代的基团：卤素、 (C_1-C_4) -烷氧基、卤代 (C_1-C_6) -烷氧基和 (C_1-C_4) -硫烷基以及在环状基团的情形下，也有 (C_1-C_4) -烷基和 (C_1-C_4) -卤烷基，

R^{14} 为卤素、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤烷基如三氟甲基、卤代 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_4) -烷氧基和 (C_1-C_4) -硫烷基，

t 为 1 或 2，

包括它们的立体异构体和农业上有常用的盐。

用于本发明的“除草活性量”指适用于对植物生长有不利影响的一种或多种除草剂的量。

用于本发明的“解毒剂活性量”指适用于至少部分削减除草剂或除草剂混合物对有用植物毒性效果的一种或多种安全剂的量。

除非另外明确定义，通常下文给出的定义适用于式 (I) 基团。

烷基，也包括复合意义（如烷氧基或卤烷氧基）中，指例如甲基、乙基、正或异丙基、正-、异-、叔-或 2-丁基、正戊基和正己基。链烯基和炔基的意义也可以类似理解。

式 (I) 至 (V) 的化合物也包含具相同拓扑的原子连接的所有立体异构体，及其混合物。该类化合物包含一个和多个不对称的碳原子和/或双键。通过它们特殊的空间结构而定义的可能的对映异构体和/或非

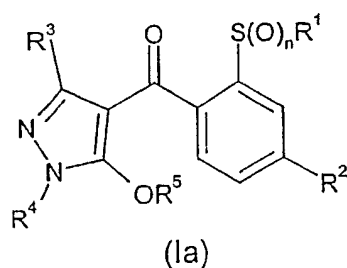
对映异构体, 可通过常用的方法可从立体异构体混合物中获得, 或另外通过立体化学上纯的初始物质进行立体选择性反应来制备。

本发明适宜的除草化合物是通式 (I) 的那些化合物, 由于它们对作物太大的损害, 该类化合物在有用作物如谷类作物、水稻或玉米中不能单独使用, 或不能理想地使用。

通式 (I) 除草剂得知于例如 DE 10016116.2。组 B1 的化合物得知于 US 5,703,008 和 US 5,700,758。组 B2 的化合物得知于 WO 95/07897 和其中引用的文献中。组 B3 的活性物质的化学结构, 参考它们的通用名, 得知于例如“农药手册”, 第 12 版, 2000, British Crop Protection Council。组 B4 的化合物得知于例如 EP-A-0 086 750、EP-A-0 94349 (US 4,902,340)、EP-A-0 191736 (US 4,881,966) 和 EP-A-0 492 366 和其中引用的文献中。组 B5 的化合物得知于 WO-A-97/45016 中, 组 B6 的化合物在德国专利申请 197 42 951.3 中有描述。上述文献包含了制备方法和初始物质的详细信息。在此明确引用这些文献, 通过引用将其结合进本说明书中。

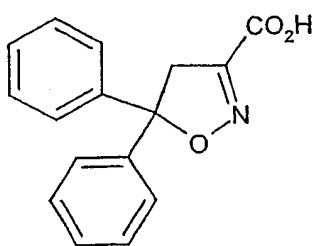
在本申请的范围内, 术语“除草组合物”和“除草剂/安全剂组合物”具有相同的意思。

优选的除草组合物是包含 A1、A2、A3 和 A4 化合物的一种式 (Ia) 除草活性物质:

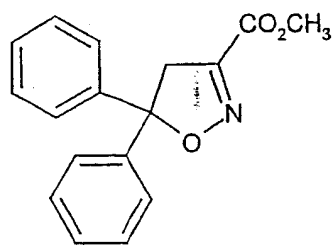


Nr.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	n
(A1)	CH ₃	CF ₃	H	CH ₃	H	2
(A2)	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₃	H	2
(A3)	CH ₃	CF ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	2
(A4)	CH ₃	CF ₃	H	CH ₂ CH ₃	H	2

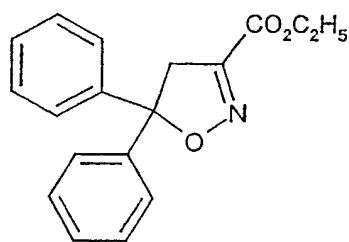
同样优选的除草组合物包含, 作为安全剂的, 一种或多种选自含有下列化合物组的化合物: 吡咯二酸二乙酯 (B1.1)、解草腈 (B3.1)、肟草安 (B3.2)、解草啉 (B3.3)、解草安 (B3.4)、喹氧乙酸 (B3.5)、抑草胺 (B3.6)、解草酮 (B3.7)、furilazole (B3.8) 和化合物 B2.1、B2.2、B2.3、B5.1、B5.2、B5.3、B5.4、B5.5、B5.6 和 B5.7:



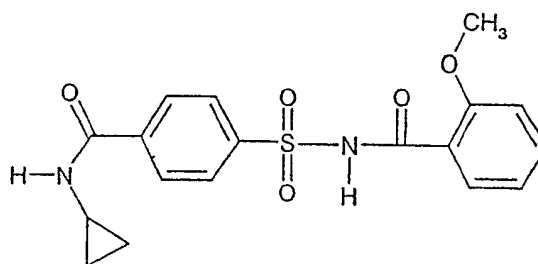
(B2.1)



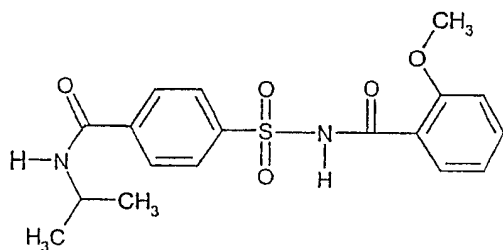
(B2.2)



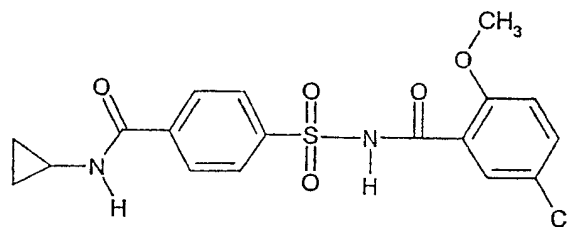
(B2.3)



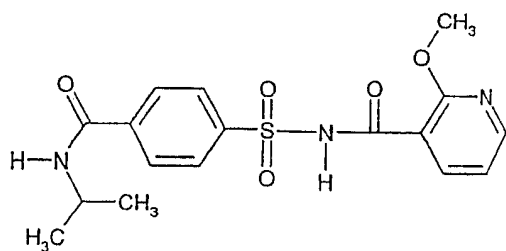
(B5.1)



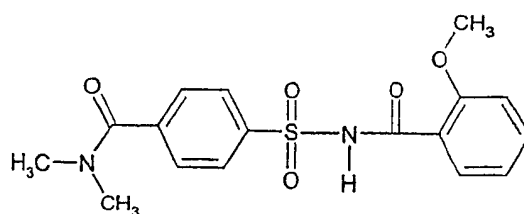
(B5.2)



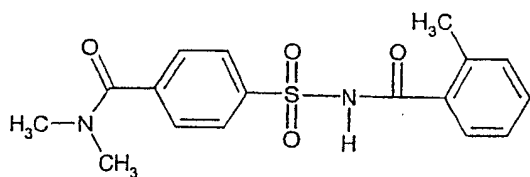
(B5.3)



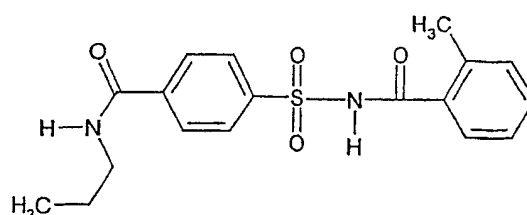
(B5.4)



(B5.5)



(B5.6)



(B5.7)

特别优选的除草组合物是包含下列两种化合物 (A) + (B) 组合:

(A1)+(B1.1), (A1)+(B2.1), (A1)+(B2.2), (A1)+(B2.3), (A1)+(B3.1), (A1)+(B3.2),
(A1)+(B3.3), (A1)+(B3.4), (A1)+(B3.5), (A1)+(B3.6), (A1)+(B3.7), (A1)+(B3.8),
(A1)+(B5.1), (A1)+(B5.2), (A1)+(B5.3), (A1)+(B5.4), (A1)+(B5.5), (A1)+(B5.6),
(A1)+(B5.7);

(A2)+(B1.1), (A2)+(B2.1), (A2)+(B2.2), (A2)+(B2.3), (A2)+(B3.1), (A2)+(B3.2),
(A2)+(B3.3), (A2)+(B3.4), (A2)+(B3.5), (A2)+(B3.6), (A2)+(B3.7), (A2)+(B3.8),
(A2)+(B5.1), (A2)+(B5.2), (A2)+(B5.3), (A2)+(B5.4), (A2)+(B5.5), (A2)+(B5.6),
(A2)+(B5.7);

(A3)+(B1.1), (A3)+(B2.1), (A3)+(B2.2), (A3)+(B2.3), (A3)+(B3.1), (A3)+(B3.2),
(A3)+(B3.3), (A3)+(B3.4), (A3)+(B3.5), (A3)+(B3.6), (A3)+(B3.7), (A3)+(B3.8),
(A3)+(B5.1), (A3)+(B5.2), (A3)+(B5.3), (A3)+(B5.4), (A3)+(B5.5), (A3)+(B5.6),
(A3)+(B5.7);

(A4)+(B1.1), (A4)+(B2.1), (A4)+(B2.2), (A4)+(B2.3), (A4)+(B3.1), (A4)+(B3.2),
(A4)+(B3.3), (A4)+(B3.4), (A4)+(B3.5), (A4)+(B3.6), (A4)+(B3.7), (A4)+(B3.8),
(A4)+(B5.1), (A4)+(B5.2), (A4)+(B5.3), (A4)+(B5.4), (A4)+(B5.5), (A4)+(B5.6),
(A4)+(B5.7).

本文提及的作为安全剂（解毒剂）的化合物降低或抵消当在有用植物的作物中使用式（I）除草活性物质产生的毒性作用，基本上对这些除草活性物质控制有害植物的效果无不利影响。从而，常规作物保护剂的应用领域可大大地拓宽并且扩大至例如，作物如小麦、大麦、水稻和玉米，在这些作物中可利用先前没有可能或仅仅有限的除草剂，即在低剂量下具有窄控制谱作用的除草剂。

除草活性物质和上述提及的安全剂可一同施用（以预混合或桶混方法）或以任何所需顺序先后使用。安全剂与除草活性物质的重量比可在宽范围内变化，并且优选的范围为 1:100 至 100:1，特别优选的是 1:10 至 10:1。除草活性物质和安全剂的最佳用量取决于每个实例中所使用的除草活性物质类型、安全剂和处理植物的种类，并且在每个实例中该用量可通过常规的简单预试验确定。

本发明的组合物优选用于下列作物中控制不需要的有害植物：玉米和谷类如小麦、黑麦、大麦、燕麦、水稻、高粱，以及棉花、甜菜、甘蔗和大豆，优选谷类、水稻和玉米。

根据它们的特性，本发明使用的安全剂可用于预处理作物种子（拌种），或在播种前将其引入种子犁沟，或在植物苗前或苗后与除草剂一同施用。苗前处理不仅包括播种前对栽培区域的处理，而且包括对已播种的尚未生长的栽培区域的处理。优选与除草剂一同施用。可使用桶混或预混合达到该目的。

所需安全剂的施用量可在宽范围内变化，分别取决于安全剂的指示和使用的除草活性物质；通常，每公顷活性物质的用量范围为 0.001 至 0.5kg，优选 0.005 至 0.5kg。

因此，本发明也涉及一种保护作物免受式（I）除草剂的毒性副作用的方法，其特征在于，包括在施用式（I）除草活性物质 A 之前、之后或同时，施用拮抗有效量的一种或多种组分 B 的化合物于植物、植物种子或栽培区域。

根据本发明的除草剂/安全剂组合物也可以用于控制已知的或发展中的转基因作物中的有害的植物。通常，转基因植物表现有特别优越的

性质,例如对某些植物保护剂的抗性、对植物病害或植物病害病原体,如某些昆虫或微生物如真菌、细菌或病毒的抗性。其它的特殊性质涉及例如收成产物的数量、质量、储藏性能、组分和特定成分。所以,转基因植物以经提高的淀粉含量或经调整的淀粉品质或那些具有不同的脂肪酸组分的收成产物而著称。

根据本发明组合物的应用,优选施用于重要的转基因经济作物,例如谷类如小麦、大麦、黑麦、燕麦、粟、稻、木薯和玉米,或作物:甜菜、甘蔗、棉花、大豆、油菜、马铃薯、蕃茄、豌豆及其它蔬菜类。

分别视其生物和/或物理化学参数而定可以各种方式配制组分B的安全剂及其与一种或多种上述式(I)除草活性物质的组合物。可能适合的制剂是,例如可湿性粉剂(WP)、乳油(EC)、水溶性粉剂(SP)、水溶液(SL)、浓乳剂(BW)如水包油和油包水乳剂、可喷雾型溶液或乳液、胶囊悬浮剂(CS)、油或水基的分散剂、超微乳剂(sospoemulsions)、悬浮剂、粉剂(DP)、油溶液剂(OL)、拌种组合物、微粒状的颗粒剂(GR)、喷洒颗粒剂、涂层颗粒剂和吸收颗粒剂、土壤施用及播散粒剂、水溶性颗粒剂(SG)、水分散颗粒剂(WG)、ULV制剂、微型胶囊类和蜡类。

所述各种配制类型基本上是已知,并例如在:Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie (化学技术)",第7册, C. Hauser Verlag München, 第四版, 1986; Wade van Falkenberg, "Pesticides Formulations (农药配制)", Marcel Dekker N. Y., 1973; K. Martens, "喷雾干燥手册(Spray Drying Handbook)", 第三版, 1979, G. Goodwin Ltd. London 中有描述。

所述必要的调配助剂,如惰性材料、表面活性剂、溶剂及其它的添加剂同样是已知的并例如在:Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carrier(杀虫粉尘稀释液和载体手册)",第二版, Darland Books, Caldwell N. J.; H. v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry (粘土胶体化学入门)", 第二版, J. Wiley & Sons, N. Y.; Marsden, "Solvents Guide (溶剂指南)", 第二版, Interscience,

N.Y. 1963; McCutcheon's, "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N.J.; Sisley and Wood, "Encyclopedia of surface Active Agents (表面活性剂百科全书)", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964; Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxid-addukte (表面活性的环氧乙烷加成物)", Wiss Verlagsgesell., Stuttgart 1976; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", 第7册, C. Hauser Verlag München, 第四版, 1986中有描述。

以这些制剂为基础,以即刻可使用形式或者桶混合形式制备与其它农药活性物质如除草剂、杀真菌剂、杀虫剂以及安全剂、肥料和/或生长调节剂的组合物。

可湿性粉剂是均匀分散在水中的制剂,其在活性物质以外除了稀释剂或惰性物质,还含有离子型和/或非离子型表面活性剂(润湿剂、分散剂),例如:聚氧乙基化的烷基酚类、聚乙氧基化的脂肪醇类或脂肪胺类、烷磺酸酯类、烷基苯磺酸酯类、木质磺酸钠、2,2'-二萘甲烷-6,6'-二磺酸钠、二丁基萘磺酸钠或油酰甲基牛磺酸钠。用于制造可湿性粉末,将除草性活性物质利用常用的装置如锤磨机、鼓风磨机和空气喷射磨机磨成细粉,并且将该活性物质与调配助剂同时地或先后地加以混合。

乳油是通过将活性物质溶解在有机溶剂中,如丁醇、环己酮、二甲基甲酰胺、二甲苯或还有沸点较高的芳族或烃或添加一个或多个离子型和/或非离子型表面活性剂(乳化剂)的有机溶剂混合物。可以使用的乳化剂的实例是:烷芳基磺酸的钙盐(如十二烷基苯-磺酸钙)或非离子型乳化剂(如脂肪酸聚乙二醇酯、烷芳基聚乙二醇醚、脂肪醇聚乙二醇醚、环氧丙烷-环氧乙烷-缩合产物、烷基聚醚、山梨糖醇酐酯类、聚氧乙烯山梨糖醇酐脂肪酸酯类或聚氧乙烯山梨糖醇酯。粉剂是将活性物质与磨成细粉状的固体物质加以磨碎而得,所述固体物质例如:滑石、天然黏土(如高岭土、膨润土和叶蜡石)或硅藻土。

悬浮剂可以为水基或油基的。可采用例如商业上通用的球磨机进行湿磨制备,如果适合的话,可加入例如上述其它制剂类型实例中的表面活性剂。

制备例如水包油乳剂(EW)，可以利用含水的有机溶剂，使用搅拌器、胶体研磨器和/或静态混合器，如果适合的话，可加入例如上述其它制剂类型实例中的表面活性剂。

粒剂的制备可以通过将活性物质喷洒在吸附性粒状的惰性物质上，或将活性物质浓缩物借助粘合剂(如聚乙烯醇，聚丙烯酸钠或矿物油)涂敷在载体(如砂、高岭土或粒状惰性物质)的表面上。适宜的活性物质也可以使用制造肥粒料常规方法并视需要与肥料的混合物一同粒化。

水可分散性粒剂通常是利用常规方法如喷雾式干燥法、流体化床式制粒法、碟式制粒法、用高速搅拌器混合法混合和无固体惰性物质的挤压制备而成。

关于碟式、流化床、挤压机和喷撒颗粒剂的制备方法，参见下述工艺，例如“喷雾干燥手册”第3版，1979年，G. Goodwin Ltd., London; J. E. Browning, “团聚作用”，化学和工程 1967, pages 147 et seq.; “Perry’s 化学工程师手册”，第5版，McGraw-Hill, New York 1973, 第8-57页。

对于更详细的作物保护剂制剂参见，例如 G. C. Klingman, “杂草控制科学”，John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, 第81-96页和 J. D. Freyer, S. A. Evans, “杂草控制手册”，第5版，Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, 第101-103页。

农用化学品制剂通常含有0.1至99重量%，尤其0.1至95%的组B活性物质或除草剂/解毒剂活性物质混合物(I)B，和1至99.9重量%，特别是按5至99.8重量%的固态或液态添加剂，以及0至25重量%，特别是0.1至25重量%的表面活性剂。

就可湿性粉剂而言，活性物质的浓度约为10~90重量%，至100%的剩余部分由常规制剂组分构成。就乳油而言，活性物质的浓度可以例如是1~80重量%。粉状制剂含有1~20重量%的活性物质，而可喷雾型溶液含有约0.2~20重量%的活性物质。就颗粒剂如水可分散性粒剂而言，活性物质的含量部分取决于活性物质是否是液态或固态。通常水

可分散性粒剂的活性物质含量介于 10 和 90 重量 % 之间。

此外，前述的活性物质制剂视需要包含分别为常用的胶粘剂、润湿剂、分散剂、乳化剂、渗透剂、防腐剂、防冻剂、溶剂、填料、着色剂、消泡剂、蒸发抑制剂、pH 调节剂和粘度调节剂。

所需式 (I) 除草剂的施用量可随着外部条件改变，例如尤其是，温度、湿度和所使用除草剂的类型。该施用量可在宽范围内变化，例如介于 0.001 和 10.0 kg/ha 之间或更多活性物质，但是优选介于 0.005 和 5 kg/ha 之间。

下列实施例阐明了本发明：

A 制剂实施例

a) 粉剂的制备是将 10 重量份组 B 化合物或式 (I) 除草活性物质与组 B 化合物的活性物质混合物与 90 重量份作为惰性物质的滑石混合，并在锤磨机中粉碎该混合物。

b) 在水中容易分散的可湿性粉剂的制备是将 25 重量份的组 B 化合物或式 (I) 除草活性物质与组 B 化合物的活性物质混合物、64 重量份作为惰性物质的含石英的高岭土、作为湿润剂和分散剂的 10 重量份木质素磺酸钾和 1 重量份油酰甲基牛磺酸钠相混合，并在栓型碟式磨粉机上研磨该混合物。

c) 在水中容易分散的分散性浓缩剂的制备是将 20 重量份的组 B 化合物或式 (I) 除草活性物质与组 B 化合物的活性物质混合物、6 重量份的烷基苯酚聚乙二醇醚 (®Triton X 207)、3 重量份异十三烷醇聚乙二醇醚 (8 E0) 和 71 重量份的链烷烃矿物油 (例如沸程约 255 至高于 277 °C) 相混合，并且在球磨机上研磨该混合物至小于 5 微米的细度。

d) 乳油是由下列物质组成：15 重量份的组 B 化合物或式 (I) 除草活性物质与组 B 化合物的活性物质混合物、75 重量份作为溶剂的环己酮和 10 重量份的乙氧基壬基酚作为乳化剂。

e) 水分散颗粒剂，其是利用下列方式制得：将

75 重量份的组 B 化合物或式 (I) 除草活性物质与组 B 化合物的活性物质混合物，

10 重量份的木质磺酸钙,

5 重量份的月桂硫酸钠,

3 重量份的聚乙烯醇和

7 重量份的高岭土

加以混合, 将该混合物在栓型碟式磨粉机中磨成细粉, 将粉末在流体化床中通过喷洒作为粒化液体的水以使之粒化。

f) 水分散颗粒剂, 其也可利用下列方式制得:

25 重量份的组 B 化合物或式 (I) 除草活性物质与组 B 化合物的活性物质混合物,

5 重量份的 2, 2'-二萘基甲烷-6, 6'-二磺酸钠,

2 重量份的油酰甲基牛磺酸钠,

1 重量份的聚乙烯醇,

17 重量份的碳酸钙和

50 重量份的水,

在胶体磨上均化及粉碎, 接着将该混合物在球磨机中磨成细粉, 在喷雾塔中利用单物质喷嘴将如此得到的悬浮体加以雾化和干燥。

B 生物学实施例

苗后试验

将有用植物的种子置于敞开的土壤中并用土壤覆盖。在三叶期, 即开始种植约 3 周后, 将配制成可乳化浓缩剂或粉剂的除草剂和安全剂以水分散剂或悬浮剂或乳剂的形式处理植物, 以折算为 300 至 800L/ha 水的各种剂量喷洒绿色的植物部位。处理 14 天后, 目测计算对有用植物的损害。结果表明: 与仅使用除草剂相比, 通过使用本发明的包含除草剂和安全剂的组合物可显著降低对有用植物的伤害。分别根据施用量、有用植物种类和本发明组合物的类型, 与仅使用除草剂相比对植物减少的损害可高至 100%。

本发明包含除草剂和安全剂的一些除草组合物的试验结果在下表显示。表 2 显示与仅使用除草剂相比, 使用本发明的组合物对小麦作物

的损害的减少。表 3 显示与仅使用除草剂相比，使用本发明的组合物对不同栽培品种的玉米作物的损害的减少。

Tabelle 1

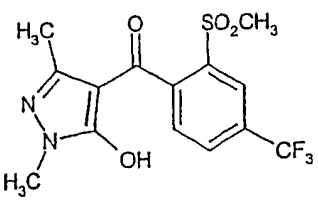
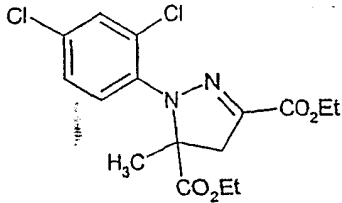
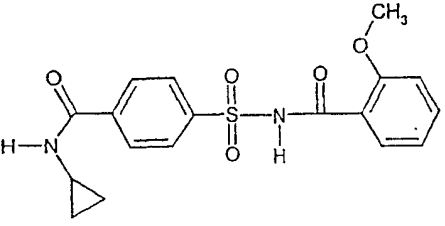
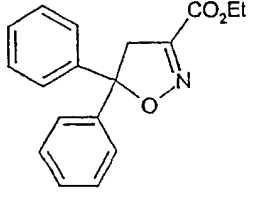
Struktur	Struktur
 terbutolol A2	 B1.1
 B5.1	 Safen B2.3

表 2

化合物	剂量 (g a.i./ha)	小麦损害的减少
A2+B1.1	75+15	-56%

表 3

化合物	剂量 (g a.i./ha)	玉米损害的减少
A2+B5.1	200+100	-100%(品种 “DEA”)
A2+B2.3	150+150	-100%(品种 “HELIX”)