

[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl<sup>7</sup>

A01N 47/36

# [12] 发明专利申请公开说明书

[21] 申请号 01103493.9

[43] 公开日 2001 年 9 月 12 日

[11] 公开号 CN 1312000A

[22] 申请日 1994.9.19 [21] 申请号 01103493.9  
分案原申请号 94193581.7

[30] 优先权

[32] 1993.9.30 [33] DE [31] P4333249.8

[71] 申请人 赫彻斯特 - 舍林农业发展有限公司

地址 联邦德国柏林

[72] 发明人 L·威尔姆斯 H·比林格 E·哈克  
H·克尼

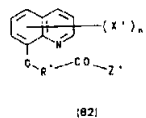
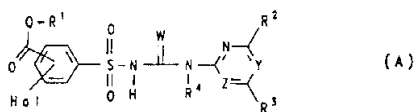
[74] 专利代理机构 中国国际贸易促进委员会专利商标事  
务所  
代理人 郭建新

权利要求书 8 页 说明书 33 页 附图页数 0 页

[54] 发明名称 新的除草剂和解毒剂混合物

[57] 摘要

本发明涉及除草剂 - 安全剂组合物, 该组合物包含:  
A) 至少一种选自式 (A) 的取代的苯磺酰脲及其盐的除草活性物质; 其中, R<sup>1</sup> - R<sup>4</sup>, W, X, Y, Z 和 Hal 如权利要求 1 中所定义, 和 B) 至少一种式 (B2) 化合物, 其中 X', Z', R\* 和 n' 如权利要求 1 中所定义。适合于作为选择性除草组合物, 用于作物, 例如玉米, 稻, 小麦, 大麦等等。

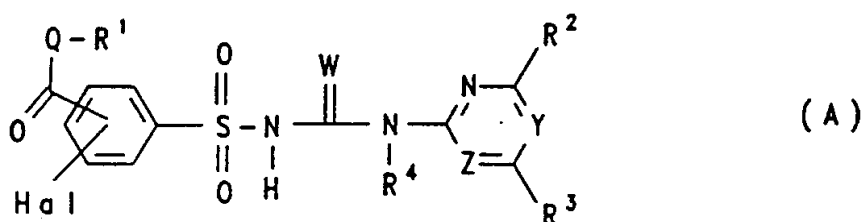


ISSN 1008-4274

## 权 利 要 求 书

1. 一种除草剂/安全剂组合物, 其含有

A) 至少一种选自式 (A) 的取代的苯基磺酰脲和其盐的除草活性物质,



式中

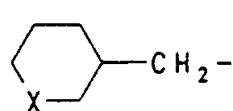
Q 是氧, 硫或  $-N(R)-$ , 其中 R 是 H,  $(C_1-C_4)$  烷基或  $(C_1-C_4)$  - 烷氧基,

W 是氧或硫,

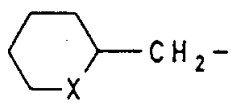
Y 和 Z 各自独立地为 CH 或 N, 其中 Y 和 Z 不同时为 CH,

$R^1$  是氢;  $(C_1-C_{12})$  - 烷基;  $(C_2-C_{10})$  - 链烯基;  $(C_2-C_{10})$  - 链炔基;  $(C_1-C_6)$  烷基, 它由相同或不同的选自下列的基团单取代或多取代: 氢,  $(C_1-C_4)$  - 烷氧基,  $(C_1-C_4)$  - 烷硫基,  $-CN$ ,  $(C_2-C_5)$  - 烷氧羰基和  $(C_2-C_6)$  - 链烯基;  $(C_3-C_8)$  - 环烷基, 它未被取代或由选自下列的一个或多个基团取代:  $(C_1-C_4)$  - 烷基,  $(C_1-C_4)$  - 烷氧基,  $(C_1-C_4)$  - 烷硫基和卤;  $(C_5-C_8)$  - 环烯基; 未取代的

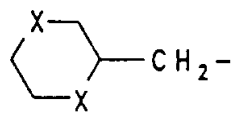
或在苯基上取代的苯基 - (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基; 或式 A-1 至 A-10 的基团,



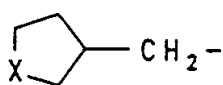
A-1



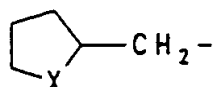
A-2



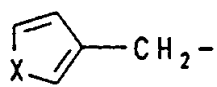
A-3



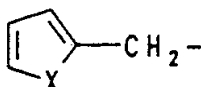
A-4



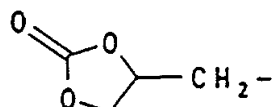
A-5



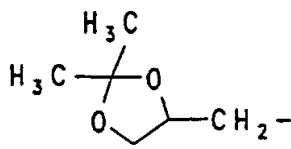
A-6



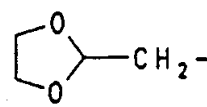
A-7



A-8



A-9



A-10

式中

X 是 O, S, S(O) 或 SO<sub>2</sub>,

R<sup>2</sup> 是氢, 卤, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-烷基或 (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-烷氧基, 后两种基团未被取代或由卤或 (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-烷氧基单取代或多取代;

R<sup>3</sup> 是氢, 卤, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-烷基, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-烷氧基或 (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-烷硫基, 后三种基团未被取代, 或由卤单或多取代, 或由 (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-烷氧基或 (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-烷硫基单或二取代; 或式 NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup> 基团, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-环烷基, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-链烯基, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-链炔基, (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)-链烯氧基或 (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-链炔氧基;

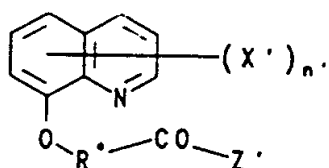
$R^4$  是氢或  $(C_1 - C_4)$  - 烷基;

$R^5$  和  $R^6$  各自独立地为氢,  $(C_1 - C_4)$  - 烷基,  $(C_3 - C_4)$  - 链烯基,  $(C_1 - C_4)$  - 卤代烷基或  $(C_1 - C_4)$  - 烷氧基, 和

Hal 是氟, 氯, 溴或碘,

和

B) 至少一种式 (B2) 的化合物,



(B2)

式中

$X'$  是氢, 卤,  $(C_1 - C_4)$  - 烷基,  $(C_1 - C_4)$  - 烷氧基, 硝基或  $(C_1 - C_4)$  - 卤代烷基,

$Z'$  是  $OR^7$ ,  $SR^7$  或  $NR^7R^8$ , 或是具有至少一个氮原子和达 3 个杂原子的、经氮原子结合到羰基上的饱和或不饱和 3 至 7 元杂环且是未取代的或由选自  $(C_1 - C_4)$  - 烷基、 $(C_1 - C_4)$  - 烷氧基或任选取代的苯基的基团取代,

$R^*$  是  $(C_1$  或  $C_2)$  - 亚烷基链, 它另外由一或两个  $(C_1 - C_4)$  - 烷基或者由  $[(C_1 - C_3)$  - 烷氧基] - 羰基取代,

$R^7$  是氢,  $(C_1 - C_{18})$  - 烷基,  $(C_3 - C_{12})$  - 环烷基,  $(C_2 - C_8)$  - 链烯基或  $(C_2 - C_8)$  - 链炔基,

上述含碳的基团未被取代, 或单或多取代,

取代基相同或不同，选自：

卤，羟基， $(C_1 - C_8)$ -烷氧基， $(C_1 - C_8)$ -烷硫基， $(C_2 - C_8)$ -链烯硫基， $(C_2 - C_8)$ -链炔硫基， $(C_2 - C_8)$ -链烯氧基， $(C_2 - C_8)$ -链炔氧基， $(C_3 - C_7)$ -环烷基， $(C_3 - C_7)$ -环烷氧基，氰基，单或双- $(C_1 - C_4)$ -烷基)-氨基，羧基， $(C_1 - C_8)$ -烷氧羰基， $(C_2 - C_8)$ -链烯氧羰基， $(C_1 - C_8)$ -烷基硫基羰基， $(C_2 - C_8)$ -链炔氧羰基， $(C_1 - C_8)$ -烷基羰基， $(C_2 - C_8)$ -链烯基羰基， $(C_2 - C_8)$ -链炔基羰基，1-(羟基亚氨基)- $(C_1 - C_6)$ -烷基，1-〔 $(C_1 - C_4)$ -烷基亚氨基〕- $(C_1 - C_4)$ -烷基，1-〔 $(C_1 - C_4)$ -烷氧基亚氨基〕- $(C_1 - C_6)$ -烷基， $(C_1 - C_8)$ -烷基羰基氨基， $(C_2 - C_8)$ -链烯基羰基氨基， $(C_2 - C_8)$ -链炔基羰基氨基，氨基羰基， $(C_1 - C_8)$ -烷基氨基羰基，二- $(C_1 - C_6)$ -烷基氨基羰基， $(C_2 - C_6)$ -链烯基氨基羰基， $(C_2 - C_6)$ -链炔基氨基羰基， $(C_1 - C_8)$ -烷氧基羰基氨基， $(C_1 - C_8)$ -烷基氨基羰基氨基， $(C_1 - C_6)$ -烷羰氧基，它未被取代或由卤、硝基、 $(C_1 - C_4)$ -烷氧基或任选取代的苯基取代， $(C_2 - C_6)$ -链烯基羰氧基， $(C_2 - C_6)$ -链炔基羰氧基， $(C_1 - C_8)$ -烷基磺酰基，苯基，苯基- $(C_1 - C_6)$ -烷氧基，苯基- $(C_1 - C_6)$ -烷氧羰基，苯氧基，苯氧基- $(C_1 - C_6)$ -烷氧基，苯氧基- $(C_1 - C_6)$ -烷氧羰基，苯基羰氧基，苯基羰基氨基，苯基- $(C_1 - C_6)$ -烷基羰基氨基，最后的9种基团未被取代或在苯环上单或多取代，优选达三取代，取代基相同或不

同，选自：卤， $(C_1 - C_4)$  - 烷基， $(C_1 - C_4)$  - 烷氧基， $(C_1 - C_4)$  - 卤代烷基， $(C_1 - C_4)$  - 卤代烷氧基和硝基，和式  $-SiR'_{3}$ ， $-O-SiR'_{3}$ ， $R'_{3}Si-(C_1 - C_8)$  - 烷氧基， $-CO-O-NR'_{2}$ ， $-O-N=CR'_{2}$ ， $-N=CR'_{2}$ ， $-O-NR'_{2}$ ， $CH(OR'_{2})$  和  $-O-(CH_2)_m-CH(OR'_{2})_{2}$ ，其中上述式中的  $R'$  相互独立地为氢， $(C_1 - C_4)$  - 烷基，未取代的苯或被相同或不同的选自下列的基团单或多取代、优选达三取代的苯：卤， $(C_1 - C_4)$  - 烷基， $(C_1 - C_4)$  - 烷氧基， $(C_1 - C_4)$  - 卤代烷基， $(C_1 - C_4)$  - 卤代烷氧基和硝基，或者成对时，为  $(C_2 - C_6)$  - 亚烷基链且  $m$  是 0 至 6，和式  $R''O-CHR''(OR'')-(C_1 - C_6)$  - 烷氧基的取代烷氧基，式中  $R''$  相互独立地为  $(C_1 - C_4)$  - 烷基或一同为  $(C_1 - C_6)$  亚烷基且  $R''$  为氢或  $(C_1 - C_4)$  - 烷基， $R^8$  是氢， $(C_1 - C_6)$  - 烷基， $(C_1 - C_6)$  - 烷氧基或任选取代的苯基，

$n'$  是从 1 至 5 的整数，和

$m'$  是 0 或 1。

2. 一种如权利要求 1 中所要求的除草剂/安全剂组合物，其中，式 (A) 的除草剂或其盐中，

$R^1$  是氢； $(C_1 - C_6)$  - 烷基； $(C_2 - C_6)$  - 链烯基； $(C_2 - C_6)$  - 链炔基； $(C_1 - C_4)$  - 烷基，它可以由选自卤、 $(C_1 - C_2)$  - 烷氧基、 $(C_1 - C_2)$  - 烷硫基、 $(C_2 - C_3)$  - 烷氧羰基和  $(C_2 - C_4)$  - 链烯基的基团单取代至四取代； $(C_5 - C_6)$  - 环烷基，它未被取代，或由选自  $(C_1 - C_4)$  - 烷基、 $(C_1 -$

$C_4$ ) - 烷氧基、 $(C_1 - C_4)$  - 烷硫基和卤的一个或多个基团取代； $(C_5 - C_6)$  - 环烯基；苄基，它未被取代，或在苯基部分被一至三个选自卤、 $(C_1 - C_2)$  - 烷基、 $(C_1 - C_2)$  - 烷氧基、 $(C_1 - C_2)$  - 卤代烷基、 $(C_1 - C_2)$  - 烷硫基和 $(C_2 - C_4)$  烷氧羰基的基团取代，或是上述式 A-1 至 A-10 的基团，和

Hal 是氯、溴或碘，

$R^2$  是氢，卤， $(C_1 - C_2)$  - 烷基， $(C_1 - C_2)$  - 烷氧基，后两种基团未被取代或者由卤或 $(C_1 - C_3)$  - 烷氧基单或多取代，

$R^3$  是氢，卤， $(C_1 - C_2)$  - 烷基， $(C_1 - C_2)$  - 烷氧基或 $(C_1 - C_2)$  - 烷硫基，上述含烷基的基团为未被取代的或由卤单或多取代，或由 $(C_1 - C_2)$  - 烷氧基或 $(C_1 - C_2)$  - 烷硫基单或二取代；或为式  $NR^5R^6$  基团；

$R^4$  是氢或甲基，且

$R^5$  和  $R^6$  相互独立地为氢或 $(C_1 - C_2)$  - 烷基。

3. 一种如权利要求 1 或 2 中所要求的除草剂/安全剂组合物，其中，式 (B2) 的安全剂中，

$R^7$  是氢， $(C_1 - C_8)$  - 烷基或 $(C_3 - C_7)$  - 环烷基，上述含碳的基团为未被取代的或由卤单或多取代，或由选自下列的基团单或二取代：羟基， $(C_1 - C_4)$  - 烷氧基，羧基， $(C_1 - C_4)$  - 烷氧羰基， $(C_2 - C_6)$  - 链烯氧羰基， $(C_2 - C_6)$  - 链炔氧羰基，1-(羟基亚氨基)- $(C_1 - C_4)$  - 烷基，1-[( $C_1 - C_4$ ) - 烷基亚氨基]- $(C_1 - C_4)$  - 烷基，1-[( $C_1 - C_4$ ) - 烷氧亚氨基]- $(C_1 - C_4)$  - 烷基和式  $-SiR'_3$ ， $-O-N$

=  $\text{CR}'_2$ ,  $-\text{N}=\text{CR}'_2$  和  $-\text{O}-\text{NR}'_2$ , 其中在上述中的  $\text{R}'$  相互独立地为氢或  $(\text{C}_1-\text{C}_4)$ -烷基或者, 成对时, 为  $(\text{C}_4-\text{C}_5)$ -亚烷基链, 且

$\text{X}'$  是氢, 卤, 甲基, 乙基, 甲氧基, 乙氧基,  $(\text{C}_1$  或  $\text{C}_2)$ -卤代烷基。

4. 一种如权利要求 1 至 3 中任一权项所要求的除草剂/安全剂组合  
物, 其中, 在式 (B2) 的安全剂中,

$\text{W}'$  是 (W3),

$\text{X}'$  是氢, 卤或  $(\text{C}_1-\text{C}_2)$ -卤代烷基,

$n'$  是 1, 2 或 3,

$\text{Z}'$  是式  $\text{OR}^7$  基团,

$\text{R}^7$  是氢,  $(\text{C}_1-\text{C}_8)$ -烷基,  $(\text{C}_1-\text{C}_4)$ -卤代烷基,  $(\text{C}_1-\text{C}_4)$ -羟基烷基,  $(\text{C}_3-\text{C}_7)$ -环烷基,  $(\text{C}_1-\text{C}_4)$ -烷氧基- $(\text{C}_1-\text{C}_4)$ -烷基, 三- $(\text{C}_1-\text{C}_2)$ -烷基硅基和

$\text{R}^9$  是  $(\text{C}_1-\text{C}_8)$ -烷基或  $(\text{C}_1-\text{C}_4)$ -卤代烷基。

5. 一种如权利要求 1 至 4 中任一权项所要求的除草剂/安全剂组合  
物, 它加工成制剂形式 (除草组合物) 且包含 0.1 至 95% (重  
量) 的活性物质 (A) 和 (B) 和 1 至 99.9% (重量) 的常规  
加工辅助剂。

6. 一种如权利要求 1 至 5 中任一权项所要求的除草剂/安全剂组合  
物, 它包含重量配比为 1: 100 至 100: 1 的活性物质 (A) 和  
(B)。

7. 一种防止除草剂 (A) 药害副作用的保护作物的方法, 它包括,  
在施用除草剂 (A) 之前、之后、或与之一起施用有效量的 (B)



型安全剂于植物、植物部分、植物种子或栽培区域, 除草剂(A)和安全剂(B)的组合如权利要求1至6中任一权项所定义的。

8.如权利要求7中所要求的方法, 其中, 作物是禾谷类, 稻或玉米。

9.如权利要求7或8中所要求的方法, 其中, 式(A)化合物或其盐以0.001至10kg活性物质/公顷的施用量施用, 且安全剂:除草剂为1:100至100:1的重量配比。

10.(B)型化合物作为安全剂防止作物受除草剂(A)的药害副作用的应用, 除草剂/安全剂组合如权利要求1至6中任一权项所定义。



# 说明书

## 新的除草剂和解毒剂混合物

本发明涉及的技术领域是作物保护产品，特别是活性物质/解毒剂组合物（或活性物质/安全剂组合物），这些组合物突出地适用于防治作物中的有害植物。

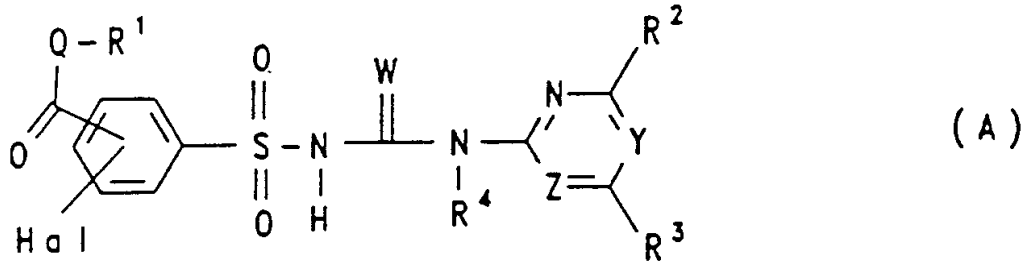
一些最近开发的除草活性物质在应用上显现出很好的技术特性，且可以以很低的施用量施用而防治广谱的禾本科杂草和阔叶杂草。

然而，许多强活性物质并不充分适合于（选择性用于）某些重要作物，如玉米、稻或禾谷类，这样其应用便很有限。这就是为什么它们根本不能用在某些作物上，或只能以不能保证防治有害植物所需的很低的施用量使用的原因。具体地说，许多在下文中作进一步定义的式（A）除草剂不能完全选择性地用来防治玉米、稻、禾谷类或一些其它作物中的有害植物。

非常意外的是，我们近来的实验业已显示，当上述除草剂与某些起除草剂解毒剂或安全剂作用的化合物一起施用时，作物如玉米、稻、小麦、大麦和其它作物可以受到这些除草剂的保护，但却不会遭受不良的损害。

因此，本发明涉及除草剂/安全剂组合物，例如以除草组合物的形式，其包含：

A) 至少一种选自式 (A) 的取代的苯基磺酰脲和其盐的除草活性物质,



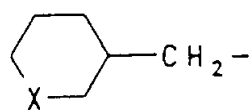
式中

Q 是氧, 硫或  $-N(R)-$ , 其中 R 是 H,  $(C_1 - C_4)$  烷基或  $(C_1 - C_4)$  - 烷氧基, 优选 O 或 S, 特别是 O;

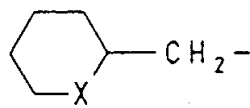
W 是氧或硫, 优选 O;

Y 和 Z 各自独立地为 CH 或 N, 其中 Y 和 Z 不同时为 CH, 优选 Y 是 CH 或 N 且 Z 是 N;

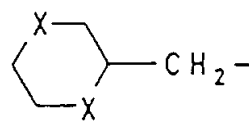
$R^1$  是氢;  $(C_1 - C_{12})$  - 烷基;  $(C_2 - C_{10})$  - 链烯基;  $(C_2 - C_{10})$  - 链炔基;  $(C_1 - C_6)$  烷基, 它由相同或不同的选自下列的基团单取代或多取代: 氢,  $(C_1 - C_4)$  - 烷氧基,  $(C_1 - C_4)$  - 烷硫基,  $-CN$ ,  $(C_2 - C_5)$  - 烷氧羰基和  $(C_2 - C_6)$  - 链烯基;  $(C_3 - C_8)$  - 环烷基, 它未被取代或由选自下列的一或多个基团取代:  $(C_1 - C_4)$  - 烷基,  $(C_1 - C_4)$  - 烷氧基,  $(C_1 - C_4)$  - 烷硫基和卤;  $(C_5 - C_8)$  - 环烯基; 未取代的或在苯基上取代的苯基 -  $(C_1 - C_4)$  - 烷基; 或式 A - 1 至 A - 10 的基团,



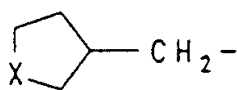
A-1



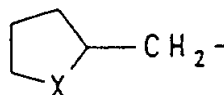
A-2



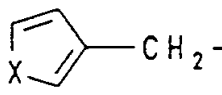
A-3



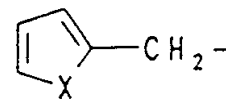
A-4



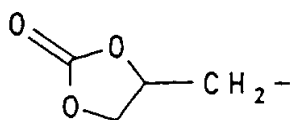
A-5



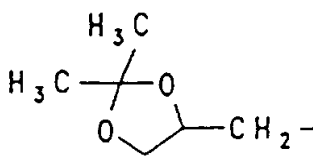
A-6



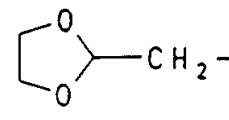
A-7



A-8



A-9



A-10

式中

X 是 O, S, S(O) 或 SO<sub>2</sub>, 优选 O,

R<sup>2</sup> 是氢, 卤, 优选氯, 或 (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-烷基或 (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-烷氧基, 后两种基团未被取代或由卤或 (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-烷氧基单取代或多取代;

R<sup>3</sup> 是氢, 卤, 优选氯, 或 (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-烷基, (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-烷氧基或 (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-烷硫基, 后三种基团未被取代, 或由卤单或多取代, 或由 (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-烷氧基或 (C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-烷硫基单或二取代; 或式 NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup> 基团, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-环烷基, (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-链烯基, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-链炔基, (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)-链烯氧基或 (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-链炔氧基;

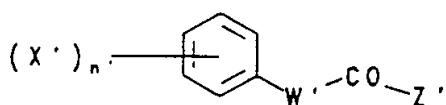
R<sup>4</sup> 是氢或 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基;

$R^5$  和  $R^6$  各自独立地为氢,  $(C_1 - C_4)$ -烷基,  $(C_3 - C_4)$ -链烯基,  $(C_1 - C_4)$ -卤代烷基或  $(C_1 - C_4)$ -烷氧基, 和

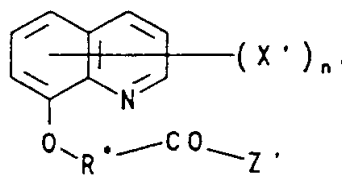
Hal 是氟, 氯, 溴或碘,

和

B) 至少一种选自式 (B1) 和 (B2) 的化合物,



(B1)



(B2)

式中

$X'$  是氢, 卤,  $(C_1 - C_4)$ -烷基,  $(C_1 - C_4)$ -烷氧基, 硝基或  $(C_1 - C_4)$ -卤代烷基,

$Z'$  是  $OR^7$ ,  $SR^7$  或  $NR^7R^8$ , 或是具有至少一个氮原子和达 3 个杂原子的、经氮原子结合到羰基上的饱和或不饱和 3 至 7 无杂环且是未取代的或由选自  $(C_1 - C_4)$ -烷基、 $(C_1 - C_4)$ -烷氧基或任选取代的苯基的基团取代, 优选由式  $OR^7$ 、

$NHR^8$  或  $N(CH_3)_2$ , 特别是式  $OR^7$  取代,

$R^*$  是  $(C_1$  或  $C_2)$  亚烷基链, 它另外由一或两个  $(C_1 - C_4)$ -烷基或者由  $[(C_1 - C_3)$ -烷氧基]-羰基取代,

$R^7$  是氢,  $(C_1 - C_{18})$ -烷基,  $(C_3 - C_{12})$ -环烷基,  $(C_2 - C_8)$ -链烯基或  $(C_2 - C_8)$ -链炔基,

上述含碳的基团未被取代，或单或多取代，

优选达三取代，取代基相同或不同，选自：

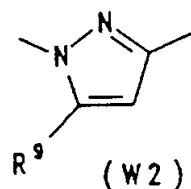
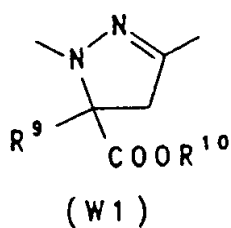
卤，羟基， $(C_1 - C_8)$ -烷氧基， $(C_1 - C_8)$ -烷硫基，  
 $(C_2 - C_8)$ -链烯硫基， $(C_2 - C_8)$ -链炔硫基， $(C_2 - C_8)$ -链烯氧基， $(C_2 - C_8)$ -链炔氧基， $(C_3 - C_7)$ -  
 环烷基， $(C_3 - C_7)$ -环烷氧基，氰基，单或双- $(C_1 - C_4 - 烷基)$ -氨基，羧基， $(C_1 - C_8)$ -烷氧羰基， $(C_2 - C_8)$ -链烯氧羰基， $(C_1 - C_8)$ -烷基硫基羰基， $(C_2 - C_8)$ -链炔氧羰基， $(C_1 - C_8)$ -烷基羰基， $(C_2 - C_8)$ -链烯基羰基， $(C_2 - C_8)$ -链炔基羰基，1-(羟基亚氨基)- $(C_1 - C_6)$ -烷基，1-[( $C_1 - C_4$ )-烷基亚氨基]- $(C_1 - C_4)$ -烷基，1-[( $C_1 - C_4$ )-烷氧基亚氨基]- $(C_1 - C_6)$ -烷基， $(C_1 - C_8)$ -烷基羰基氨基， $(C_2 - C_8)$ -链烯基羰基氨基， $(C_2 - C_8)$ -链炔基羰基氨基，氨基羰基， $(C_1 - C_8)$ -烷基氨基羰基，二- $(C_1 - C_6)$ -烷基氨基羰基， $(C_2 - C_6)$ -链烯基氨基羰基， $(C_2 - C_6)$ -链炔基氨基羰基， $(C_1 - C_8)$ -烷氧基羰基氨基， $(C_1 - C_8)$ -烷基氨基羰基氨基， $(C_1 - C_6)$ -烷羰氧基，它未被取代或由卤、硝基、 $(C_1 - C_4)$ -烷氧基或任选取代的苯基取代， $(C_2 - C_6)$ -链烯基羰氧基， $(C_2 - C_6)$ -链炔基羰氧基， $(C_1 - C_8)$ -烷基磺酰基，苯基，苯基- $(C_1 - C_6)$ -烷氧基，苯基- $(C_1 - C_6)$ -烷氧羰基，苯氧基，苯氧基- $(C_1 - C_6)$ -烷氧基，苯氧基- $(C_1 - C_6)$ -烷氧羰基，苯基羰氧基，苯基羰基氨基，苯基- $(C_1$

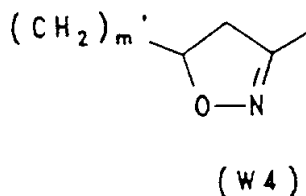
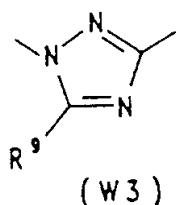
- C<sub>6</sub>) - 烷基羰基氨基, 最后的 9 种基团未被取代或在苯环上单或多取代, 优选达三取代, 取代基相同或不同, 选自: 卤, (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - 烷基, (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - 烷氧基, (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - 卤代烷基, (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - 卤代烷氧基和硝基, 和式 - SiR'<sub>3</sub>, - O - SiR'<sub>3</sub>, R'<sub>3</sub>Si - (C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>) - 烷氧基, - CO - O - NR'<sub>2</sub>, - O - N = CR'<sub>2</sub>, - N = CR'<sub>2</sub>, - O - NR'<sub>2</sub>, CH(OR'<sub>2</sub>)和 - O - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - CH(OR'<sub>2</sub>), 其中上述式中的 R' 相互独立地为氢, (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - 烷基, 未取代的苯或被相同或不同的选自下列的基团单或多取代、优选达三取代的苯: 卤, (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - 烷基, (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - 烷氧基, (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - 卤代烷基, (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - 卤代烷氧基和硝基, 或者成对时, 为 (C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub>) - 亚烷基链且 m 是 0 至 6, 和式 R'' O - CHR'' (OR'') - (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - 烷氧基的取代烷氧基, 式中 R'' 相互独立地为 (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - 烷基或一同为 (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) 亚烷基且 R'' 为氢或 (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - 烷基,

R<sup>8</sup> 是氢, (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - 烷基, (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>) - 烷氧基或任选取代的苯基,

n' 是从 1 至 5 的整数, 优选 1 至 3,

W' 是式 (W1) 至 (W4) 之一的一种二价杂环基,





$R^9$  是氢,  $(C_1 - C_8)$ -烷基,  $(C_1 - C_8)$ -卤代烷基,  $(C_3 - C_{12})$ -环烷基或任选取代的苯基,

$R^{10}$  是氢,  $(C_1 - C_8)$ -烷基,  $(C_1 - C_8)$ -卤代烷基,  $(C_1 - C_4)$ -烷氧基- $(C_1 - C_4)$ -烷基,  $(C_1 - C_6)$ -羟基烷基,  $(C_3 - C_{12})$ -环烷基或三- $(C_1 - C_4)$ -烷基硅基,  
和

$m'$  是 0 或 1.

除非在特定情况下另有定义,以下定义适合于式 (A)、(B1) 和 (B2) 的基团:

烷基, 链烯基和链炔基是直链或支链的且具有达 8 个、优选达 4 个碳原子; 此定义类似地适合于取代的烷基、链烯基和链炔基的脂族部分或类似地适合于由其衍生的基团, 如卤代烷基, 羟烷基, 烷氧羰基, 烷氧基, 烷醇基, 卤代烷氧基等等.

烷基是, 例如甲基, 乙基, 正和异丙基, 正-、异-、叔-和 2-丁基, 戊基基团, 己基基团如正己基、异己基和 1, 3-二甲

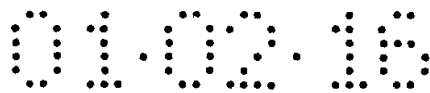


基-丁基, 庚基基团如正庚基、1-甲基己基和1,4-二甲基戊基。链烯基是, 例如烯丙基, 1-甲基丙-2-烯-1-基, 丁-2-烯-1-基, 丁-3-烯-1-基, 1-甲基-丁-3-烯-1-基和1-甲基-丁-2-烯-1-基。链炔基是, 例如炔丙基, 丁-2-炔-1-基, 丁-3-炔-1-基或1-甲基-丁-3-炔基。

环烷基优选具有3至8个碳原子且是, 例如, 环丁基, 环戊基, 环己基或环庚基。如果适宜, 环烷基具有达2个(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基作为取代基。

卤是氟, 氯, 溴或碘, 优选是氟, 氯, 溴, 特别是氟或氯。卤代烷基, 卤代链烯基和卤代链炔基是被卤单、双或多取代的烷基、链烯基或链炔基, 如CF<sub>3</sub>, CHF<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>F, CF<sub>3</sub>CF<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>FCHCl, CCl<sub>3</sub>, CHCl<sub>2</sub>或CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>Cl。卤代烷氧基是, 例如, OCF<sub>3</sub>, OCHF<sub>2</sub>, OCH<sub>2</sub>F, CF<sub>3</sub>CF<sub>2</sub>O或CF<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>O。

芳基优选具有6至12个碳原子且是, 例如, 苯基, 萘基或联苯基, 但优选苯基。此定义类似地适合于由其衍生的基团, 如芳氧基, 芳酰基或芳氧烷基。任选取代的苯基是, 例如, 未被取代的苯或具有一、二或三个相同或不同的选自下列的取代基的苯: 氢, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-卤代烷基, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-卤代烷氧基, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷硫基, (C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>)-烷氧羰基, (C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>)-烷基羰氧基, 甲酰胺基, (C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>)-烷基羰基氨基, (C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub>)-烷基氨基羰基, 二[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基]-氨基羰基和硝基。如, 邻、间和对甲苯基, 二甲基苯基, 2-、3-和4-氯苯基, 2-、3-和4-三氟-和-三氯苯



基，2，4-、3，5-、2，5-和2，3-二氯苯基或邻、间和对甲氧苯基。此定义类似地适合于任选取代的芳基。

式(A)的化合物可以形成盐，其中 $-\text{SO}_2-\text{NH}-$ 基上的氢被农业上可接受的阳离子替换。这些盐的例子是金属盐，特别是碱金属盐(例如钠或钾盐)或碱土金属盐，或者其它铵盐或与有机胺的盐。同样，盐的形成可由强酸与式(A)化合物杂环部分加成反应而发生。适合此目的酸是，例如HCl， $\text{HNO}_3$ ，三氯乙酸，乙酸或棕榈酸。

在下文中，除草剂(A)是指式(A)化合物和其盐。

一些式(A)、(B1)或(B2)的化合物可以含有一或多个不对称碳原子或者双键，其未在式中具体指出。然而，可能的且由其特定立体形状所限定的立体异构体，如对映体，非对映体，Z和E异构体，均由通式包括，且可以通过常规的方法从立体异构体混合物中获得或者通过结合使用立体化学上纯的原料的立体选择性反应而制备。因此，上述立体异构体可以根据本发明以纯体形式和其混合物形式采用。

本发明的特别重要的除草剂/安全剂组合物是带有式(A)化合物或其盐的那些组合物，其中

$\text{R}^1$  是氢； $(\text{C}_1-\text{C}_6)$ -烷基； $(\text{C}_2-\text{C}_6)$ -链烯基； $(\text{C}_2-\text{C}_6)$ -链炔基； $(\text{C}_1-\text{C}_4)$ -烷基，它可由选自下列的基团单取代至四取代，优选单取代：卤， $(\text{C}_1-\text{C}_2)$ -烷氧基， $(\text{C}_1-\text{C}_2)$ -烷硫基， $(\text{C}_2-\text{C}_3)$ -烷氧羰基和 $(\text{C}_2-\text{C}_4)$ -链烯基； $(\text{C}_5-\text{C}_6)$ -环烷基，它未被取代或由一或多个选自下列的基团取代： $(\text{C}_1-\text{C}_4)$ -烷基， $(\text{C}_1$

- C<sub>4</sub>) - 烷氧基, (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - 烷硫基和卤; (C<sub>5</sub> - C<sub>6</sub>) - 环烯基; 苄基, 它未被取代或在苯基部分被一至三个选自下列的基团取代: 卤, (C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) - 烷基, (C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) - 烷氧基, (C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) - 卤代烷基, (C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) - 烷硫基和 (C<sub>2</sub> - C<sub>4</sub>) - 烷氧羰基, 或一个上述的式 A - 1 至 A - 10 基团, 和

Hal 是氯, 溴或碘.

其它的特别重要的本发明除草剂/安全剂组合物是带有式

(A) 化合物或其盐的那些组合物, 式中

R<sup>2</sup> 是氢, 卤, 优选氯, (C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) - 烷基, (C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) - 烷氧基, 最后两种基团未被取代或被卤或 (C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>) - 烷氧基单或多取代.

R<sup>3</sup> 是氢, 卤, 或优选氯, (C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) - 烷基, (C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) - 烷氧基或 (C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) - 烷硫基, 上述含烷基的基团未被取代或被卤单或多取代或者被 (C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) - 烷氧基或 (C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) - 烷硫基单或多取代; 或式 NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup> 的基团;

R<sup>4</sup> 是氢或甲基,

R<sup>5</sup> 和 R<sup>6</sup> 相互独立地为氢或 (C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) - 烷基且

Hal 是氯或碘.

优选的根据本发明的除草剂/安全剂组合物是带有式 (A) 化合物或其盐的那些组合物, 式中

W 是氧原子,

Y 是 CH 或 N,

Z 是 N

$R^2$  是氢,  $CH_3$ ,  $CH_2CH_3$ ,  $OCH_3$ ,  $OCH_2CH_3$ ,  $OCHF_2$  或  $Cl$ ,

$R^3$  是氢,  $CH_3$ ,  $CH_2CH_3$ ,  $OCH_3$ ,  $OCH_2CH_3$ ,  $OCHF_2$ ,  $NH(CH_3)$ ,  $N(CH_3)_2$ ,  $CF_3$ ,  $OCH_2CF_3$  或  $Cl$ ,

$R^4$  是  $H$  或  $CH_3$  且

$Hal$  是碘。

其它的特别重要的除草剂组合物是如下这些, 其中式 (B1) 或 (B2) 中,

$R^7$  是氢,  $(C_1 - C_8)$ -烷基或  $(C_3 - C_7)$ -环烷基, 上述的含碳基团未被取代或被卤单或多取代, 或者被选自下列的基团单或二取代, 优选单取代: 羟基,  $(C_1 - C_4)$ -烷氧基, 羧基,  $(C_1 - C_4)$ -烷氧羰基,  $(C_2 - C_6)$ -链烯氧羰基,  $(C_2 - C_6)$ -链炔氧羰基,  $1 - (羟基亚氨基) - (C_1 - C_4)$ -烷基,  $1 - [(C_1 - C_4)$ -烷基亚氨基] -  $(C_1 - C_4)$ -烷基,  $1 - [(C_1 - C_4)$ -烷氧基亚氨基] -  $(C_1 - C_4)$ -烷基, 和式  $-SiR'_3$ 、 $-O - N = CR'_2$ 、 $-N = CR'_2$  和  $-O - NR'_2$  基团, 其中上述式中的  $R'$  相互独立地为氢或  $(C_1 - C_4)$ -烷基或成对时为  $(C_4 - C_5)$ -亚烷基链,

$R^9$  是氢,  $(C_1 - C_8)$ -烷基,  $(C_1 - C_6)$ -卤代烷基,  $(C_3 - C_7)$ -环烷基或苯基且

$R^{10}$  是氢,  $(C_1 - C_8)$ 烷基,  $(C_1 - C_8)$ -卤代烷基,  $(C_1 - C_4)$ -烷氧基 -  $(C_1 - C_4)$ -烷基,  $(C_1 - C_6)$ -羟基烷基,  $(C_3 - C_7)$ -环烷基或三 -  $(C_1 - C_4)$ -烷基硅基,

和除草剂组合物

其中，式 ( B1 ) 或 ( B2 ) 中

X' 是氢，卤，甲基，乙基，甲氧基，乙氧基，( C<sub>1</sub> 或 C<sub>2</sub> ) - 卤代烷基，优选氢，卤或 ( C<sub>1</sub> 或 C<sub>2</sub> ) - 卤代烷基。

优选的除草组合物是如下这些：

其中在式 ( B1 ) 中，

X' 是氢，卤，硝基或 ( C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> ) - 卤代烷基，

n' 是 1, 2 或 3，

Z' 是式 OR<sup>7</sup> 基团，

R<sup>7</sup> 是氢，( C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> ) - 烷基或 ( C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub> ) - 环烷基，其中上述的含碳基团未被取代，或被相同或不同的卤单取代或多取代，优选达三取代，或被选自下列的基团单取代或二取代、优选单取代：羟基，( C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> ) - 烷氧基，( C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> ) - 烷氧羰基，( C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> ) - 链烯氧羰基，( C<sub>2</sub> - C<sub>6</sub> ) - 链炔氧羰基，1 - ( 羟基亚氨基 ) - ( C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> ) - 烷基，1 - [ ( C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> ) - 烷基亚氨基 ] - ( C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> ) - 烷基，1 - [ ( C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> ) - 烷氧基亚氨基 ] - ( C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> ) - 烷基和式 - SiR'<sub>3</sub>、- O - N = R'<sub>2</sub>、- N = CR'<sub>2</sub> 和 - O - NR'<sub>2</sub>，其中上述式中的 R' 相互独立地为氢或 ( C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> ) - 烷基，或成对时为 ( C<sub>4</sub> 或 C<sub>5</sub> ) - 亚烷基，

R<sup>9</sup> 是氢，( C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> ) - 烷基，( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) - 卤代烷基，( C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub> ) - 环烷基或苯基和

R<sup>10</sup> 是氢，( C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> ) - 烷基，( C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub> ) - 卤代烷基，( C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> ) - 烷氧基 - ( C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> ) - 烷基，( C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> ) - 羟基

烷基, (C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>) - 环烷基或三 - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - 烷基硅基。

其它的优选除草组合物是如下这些:

其中式 (B2) 中,

X' 是氢, 卤或 (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - 卤代烷基,

n' 是 1, 2 或 3, 其中 (X')<sub>n'</sub> 优选是 5 - Cl,

Z' 是式 OR<sup>7</sup> 基团,

R\* 是 CH<sub>2</sub>, 且

R<sup>7</sup> 是氢, (C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>) - 烷基, (C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>) - 卤代烷基或 (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - 烷氧基 - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - 烷基, 优选 (C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>) - 烷基。

特别优选的除草组合物是如下这些:

其中, 式 (B1) 中

W' 是 (W1)

X' 是氢, 卤或 (C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) 卤代烷基,

n' 是 1, 2 或 3, 其中 (X')<sub>n'</sub> 优选是 2, 4 - Cl<sub>2</sub>,

Z' 是式 OR<sup>7</sup> 基团,

R<sup>7</sup> 是氢, (C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>) - 烷基, (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - 卤代烷基, (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - 羟基烷基, (C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>) - 环烷基, (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - 烷氧基 - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - 烷基, 三 - (C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) - 烷基硅基, 优选 (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - 烷基,

R<sup>9</sup> 是氢, (C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>) - 烷基, (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - 卤代烷基或 (C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>) - 环烷基, 优选氢或 (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - 烷基, 且

R<sup>10</sup> 是氢, (C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>) - 烷基, (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - 卤代烷基, (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - 羟基烷基, (C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>) - 环烷基, (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) -

烷氧基 - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - 烷基或三 - (C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) - 烷基硅基,  
 优选氢或 (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - 烷基。

其它的特别优选的除草组合物是如下这些:

其中在式 (B1) 中,

W' 是 (W2)

X' 是氢, 卤或 (C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) 卤代烷基,

n' 是 1, 2 或 3, 其中 (X')<sub>n'</sub> 优选是 2, 4 - Cl<sub>2</sub>,

Z' 是式 OR<sup>7</sup> 基团,

R<sup>7</sup> 是氢, (C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>) - 烷基, (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - 卤代烷基, (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - 羟基烷基, (C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>) - 环烷基, (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub> - 烷氧基) - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - 烷基, 三 - (C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) - 烷基硅基,  
 优选 (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - 烷基, 且

R<sup>9</sup> 是氢, (C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>) - 烷基, (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - 卤代烷基, (C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>) - 环烷基或苯基, 优选氢或 (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - 烷基。

其它的特别优选的除草组合物是如下这些:

其中, 在式 (B1) 中,

W' 是 (W3),

X' 是氢, 卤或 (C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) 卤代烷基,

n' 是 1, 2 或 3, 其中 (X')<sub>n'</sub> 优选是 2, 4 - Cl<sub>2</sub>,

Z' 是式 OR<sup>7</sup> 基团,

R<sup>7</sup> 是氢, (C<sub>1</sub> - C<sub>8</sub>) - 烷基, (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - 卤代烷基, (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - 羟基烷基, (C<sub>3</sub> - C<sub>7</sub>) - 环烷基, (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - 烷氧基 - (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - 烷基, 三 - (C<sub>1</sub> - C<sub>2</sub>) - 烷基硅基,  
 优选 (C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>) - 烷基, 且

$R^9$  是  $(C_1 - C_8)$  - 烷基或  $(C_1 - C_4)$  - 卤代烷基, 优选  $C_1$  - 卤代烷基。

其它的特别优选的除草组合物是如下这些:

其中在式 (B1) 中,

$W'$  是 (W4),

$X'$  是氢, 卤, 硝基,  $(C_1 - C_4)$  烷基或  $(C_1 - C_2)$  - 卤代烷基, 优选  $CF_3$  或  $(C_1 - C_4)$  - 烷氧基,

$n'$  是 1, 2 或 3,

$m'$  是 0 或 1,

$Z'$  是式  $OR^7$  基团, 且

$R^7$  是氢,  $(C_1 - C_4)$  - 烷基, 羧基 -  $(C_1 - C_4)$  - 烷基或  $(C_1 - C_4)$  - 烷氧羰基 -  $(C_1 - C_4)$  - 烷基, 优选  $(C_1 - C_4)$  - 烷氧基 -  $CO - CH_2 -$ ,  $(C_1 - C_4)$  - 烷氧基 -  $CO - C(CH_3)H -$ ,  $HO - CO - CH_2 -$  或  $HO - CO - C(CH_3)H -$ 。

式 (B1) 的化合物公知于 EP - A - 333 131 (ZA - 89/1960), EP - A - 269 806 (US - A - 4, 891, 057), EP - A - 346 620 (AU-A-89/34951) 和国际专利申请 PCT/EP 90/01966 (WO - 91/08202) 和 PCT/EP 90/02020 (WO - 91/07874) 和引述于其中的文献, 或可以由或类似地由这些公开文献中描述的方法制备。式 (B2) 的化合物公知于 EP - A - 94 349 (US - A - 4, 902, 340), EP - A - 191 736 (US - A - 4, 881, 966) 和 EP - A - 0492 366 和这些公开文献中引述的文献, 或可以由或类似地由这些公开文献中描述的方法制备。一



些化合物更进一步地描述于德国专利申请 P 42 25 493.0 中。

根据本发明的适合的除草活性物质是那些式 (A) 的嘧啶或三嗪衍生物, 这些衍生物本身, 由于它们对作物的损害太大, 不能或不宜施用于禾谷类作物和/或玉米。

式 (A) 的化合物公知于, 例如, EP - A - 007 687, EP - A - 0291851, DE - A - 7900472, US - A - 4, 566, 898 和 WO92/13845, 或可以由上述公开文献中提到的方法类似地制备。

下列各组化合物已证实是上述除草活性物质的安全剂:

- a) 二氯苯基吡啶啉 - 3 - 羧酸型化合物 (即, 式 (B1) 其中 W' 是 W1 且  $(X')_{n'} = 2, 4 - Cl_2$  的化合物), 优选化合物如 1 - (2, 4 - 二氯苯基) - 5 - (乙氧羰基) - 5 - 甲基 - 2 - 吡啶啉 - 3 - 羧酸乙酯 (B1 - 1) 和其描述于 WO91/07874 的相关化合物。
- b) 二氯苯基吡啶羧酸衍生物 (即, 式 (B1) 其中 W' 是 W2 且  $(X')_{n'} = 2, 4 - Cl_2$  的化合物), 优选化合物如 1 - (2, 4 - 二氯苯基) - 5 - 甲基吡啶 - 2 - 羧酸乙酯 (B1 - 2), 1 - (2, 4 - 二氯苯基) - 5 - 异丙基吡啶 - 3 - 羧酸乙酯 (B1 - 3), 1 - (2, 4 - 二氯苯基) - 5 - (1, 1 - 二甲基乙基) 吡啶 - 3 - 羧酸乙酯 (B1 - 4), 1 - (2, 4 - 二氯苯基) - 5 - 苯基吡啶 - 3 - 羧酸乙酯 (B1 - 5) 和其描述于 EP - A - 333 131 和 EP - A - 269 806 的相关化合物。
- c) 三嗪羧酸型化合物 (即式 (B1) 其中 W' 是 W3 且  $(X')$ )

$n'$  是 2, 4 - Cl<sub>2</sub> 的化合物), 优选化合物如解草啞, 即 1 - (2, 4 - 二氯苄基) - 5 - 三氯甲基 - (1H) - 1, 2, 4 - 三唑 - 3 - 羧酸乙酯 (B1 - 6), 和相关化合物 (参见 EP - A - 174 562 和 EP - A - 346 620)。

d) 5 - 苄基 - 或 5 - 苜基 - 2 - 异噁唑啉 - 3 - 羧酸型化合物, 优选化合物如 5 - (2, 4 - 二氯苄基) - 2 - 异噁唑啉 - 3 - 羧酸乙酯 (B1 - 7) 或 5 - 苜基 - 2 - 异噁唑啉 - 3 - 羧酸乙酯 (B1 - 8), 和描述于 WO91/08202 的相关化合物。

e) 8 - 喹啉氧乙酸型化合物, 例如式 (B2) 其中 (X')<sub>n'</sub> 是 5 - Cl, 氢, Z' 是 OR<sup>7</sup>, R<sup>\*</sup> 是 CH<sub>2</sub> 的化合物, 优选化合物如

(5 - 氯 - 8 - 喹啉氧) - 乙酸 (1 - 甲基己 - 1 - 基) 酯 (B2 - 1),

(5 - 氯 - 8 - 喹啉氧) - 乙酸 (1, 3 - 二甲基丁 - 1 - 基) 酯 (B2 - 2),

(5 - 氯 - 8 - 喹啉氧) 乙酸 (4 - 烯丙氧丁基) 酯 (B2 - 3),

(5 - 氯 - 8 - 喹啉氧) - 乙酸 (1 - 烯丙氧丙 - 2 - 基) 酯 (B2 - 4),

(5 - 氯 - 8 - 喹啉氧) - 乙酸乙酯 (B2 - 5),

(5 - 氯 - 8 - 喹啉氧) - 乙酸甲酯 (B2 - 6),

(5 - 氯 - 8 - 喹啉氧) - 乙酸烯丙酯 (B2 - 7),

(5 - 氯 - 8 - 喹啉氧) - 乙酸 [2 - (2 - 亚丙基亚氨基氧) - 1 - 乙基] 酯 (B2 - 8), 和

(5-氯-8-喹啉氧)-乙酸(2-氧代丙-1-基)酯(B2-9)

和描述于 EP - A - 86 750、EP - A - 94 349 和 EP - A - 191 736 或 EP - A - 0 492 366 的相关化合物。

f) (5-氯-8-喹啉氧)-丙二酸型化合物(即式(B2)其中 $(X')$ 是5-Cl,  $Z'$ 是 $OR^7$ ,  $R^*$ 是-CH(COO-烷基)-的化合物), 优选化合物如(5-氯-8-喹啉氧)丙二酸二乙酯, (5-氯-8-喹啉氧)丙二酸二烯丙酯, (5-氯-8-喹啉氧)丙二酸甲乙酯和描述于德国专利申请 P42 25493.0 中的相关化合物。

g) 苯氧乙酸或苯氧丙酸衍生物型或者芳族羧酸型活性化合物, 例如, 2, 4-二氯苯氧乙酸(酯)(2, 4-滴), 4-氯-2-甲基苯氧丙酸酯(2甲4氯丙酸), 2甲4氯或3, 6-二氯-2-甲氧苯甲酸(酯)(麦草畏)。

式(B1)和(B2)以及例如上组a)至g)的安全剂(解毒剂)除低或防止当式(A)的除草活性物质施于作物时会出现的药害, 而不会对这些除草活性物质防治有害植物的效力产生不利影响。这使得常规作物保护产品的大田施用范围更宽, 且扩展到(例如)诸如小麦、大麦、玉米和其它禾本科作物等作物, 这些除草剂施用于这类作物原本是不可能的, 或只在有限的程度, 即低剂量、广谱作用小。

除草活性物质和上述安全剂可以一起使用(作为现成混合物或通过桶混方法), 或以所需的任何顺序前后使用。安全剂: 除草活性物质的重量配化可以在很宽的范围内变化, 且优选是在1: 100

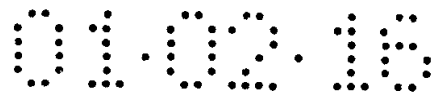
至 100: 1 的范围内, 特别是 1: 10 至 10: 1。在各情况下除草活性物质和安全剂的最适量取决于所用除草活性物质或安全剂的类型和要处理的植物体的种类, 并可以在各单独情况下由适合的初步试验确定。

安全剂主要施用于特别是玉米和禾谷类作物(小麦、黑麦、大麦、燕麦), 稻, 高粱, 也可施用于棉花和豆类, 优选禾谷类和玉米。

根据其特性, 式(B1)和(B2)的安全剂可以用于作物种子的预处理(拌种), 或在播种之前掺入种穴中, 或在出苗之前或之后与除草剂一起使用。苗前处理包括在播种前处理栽培的区域和处理已播种的栽培区域, 但此时作物还未生长。与除草剂一起的联合施用是优选的。桶混物或现成混合物可用于此目的。所需的安全剂施用量可以在很宽的范围内变化, 施用量取决于适效和所用的除草活性物质, 一般而言, 其范围为 0.001 至 5kg, 优选 0.005 至 0.5kg 活性物质每公顷。

因此, 本发明还涉及防止出现式(A)除草剂药害副作用的保护作物的方法, 该方法包含, 在式(A)的除草活性物质施用之前、之后或与之一起, 施用有效量的式(B1)和/或(B2)化合物于作物、作物的种子或栽培的区域。

按照生物学和/或理化参数所预先确定的, 式(B1)和(B2)化合物和其与一或多种上述除草活性物质的组合物可以各种方式加工。下列可能性是适合的剂型的实例: 可湿性粉剂(WP), 乳油(EC), 水溶粉剂(SP), 水溶浓缩物(SL), 浓乳剂(BW)如水包油和油包水乳液, 可喷雾溶液或乳液, 胶囊悬浮剂(CS),



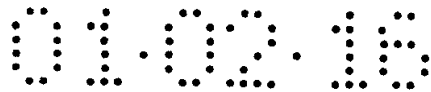
油或水基可分散剂 ( SC ) , 悬乳剂, 悬浮剂, 粉剂 ( DP ) , 油可混溶液 ( OL ) , 拌种产品, 微颗粒、喷雾颗粒、涂敷颗粒和吸附颗粒形式的颗粒剂 ( GR ) , 土壤施用或撒播用颗粒剂, 水溶颗粒剂 ( SG ) , 水可分散颗粒剂 ( WG ) , 超低容量制剂, 微囊剂和蜡剂。

这些剂型的各个类型原则上是已知的, 且描述于, 例如, Winnacker-Kuchler, " Chemische Technologie " , Volume 7, C. Hauser Verlag Munich, 4 th Ed. 1986; Wade Van Valkenburg, " Pesticide Formulations " , Marcel Dekker N. Y., 1973; K. Martens, " Spray Drying Handbook " , 3rd Ed. 1979, G. Goodwin Ltd. London 中。

所需的加工辅助剂, 如惰性材料, 表面活性剂, 溶剂和其它添加剂, 也是已知的, 且描述于, 例如,

Watkins, " Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers " , 2nd Ed., Darland Books, Caldwell N. J.; H. v. Olphen " Introduction to Clay Colloid Chemistry " , 2nd Ed., J. Wiley & Sons, N. Y., Marsden " Solvents Guide, 2nd Ed., Interscience, N. Y. 1963; McCutcheon's " Detergents and Emulsifiers Annual " , MC Publ. Corp., Ridgewood N. J.; Sisley and Wood, " Encyclopedia of Surface Active Agents " , Chem. Publ. Co. Inc. N. Y. 1964; Schönfeldt, " Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte " [Surface-Active Ethylene Oxide Adducts], Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976; Winnacker-Küchler " Chemische Technologie " [Chemical Technology], Volume 7, C. Hauser Verlag Munich, 4th Ed. 1986.

与其它农药活性物质、化肥和/或生长调节剂的组合物也可以以



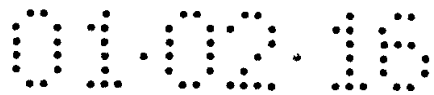
这些剂型为基础制备，例如以现成混合物或桶混物的形式。

可湿性粉剂是可均匀分散于水中的制剂，它除了有效成分外，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，聚氧乙烯化的烷基酚，聚氧乙烯化的脂肪醇和脂肪胺，脂肪醇聚乙二醇醚硫酸盐，烷基磺酸盐或烷基芳基磺酸盐，木素磺酸钠，2，2' - 二萘基甲烷 - 6，6' - 二磺酸钠，二丁基萘磺酸钠或油酰甲基牛磺酸钠，还有稀释剂或惰性物质。

乳油通过溶解活性物质于有机溶剂，例如，丁醇，环己酮，二甲基甲酰胺，二甲苯或高沸点芳族或烃化合物，加上一或多种离子型或非离子型表面活性剂（乳化剂）而制备。可以采用的乳化剂的例子有：烷基芳基磺酸钙，如十二烷基苯磺酸钙，或非离子表面活性剂，如脂肪酸聚乙二醇酯，烷基芳基聚乙二醇醚，脂肪醇聚乙二醇醚，环氧丙烯/环氧乙烯缩合产物（例如嵌段聚合物），烷基聚醚，失水山梨醇脂肪酸酯，聚氧乙烯失水山梨醇脂肪酸酯，或其它聚氧乙烯失水山梨醇酯。

粉剂通过将活性物质与细分散的固体物质一起研磨而制得。固体物质例如滑石粉，天然陶土类诸如高岭土、膨润土和叶蜡石或硅藻土。

颗粒剂可以通过将活性物质喷雾到吸附性颗粒化惰性材料上，或者通过采用粘合剂，将活性物质浓缩物涂到载体表面而制得。所述的载体例如砂，高岭土或颗粒化惰性材料，粘合剂例如聚乙烯醇，聚丙烯酸钠或矿物油。一般而言，水可分散颗粒剂通过常规的方法生产，如通过喷雾干燥，流化床造粒，盘造粒，采用高速搅拌器的混合，和无固体惰性材料的挤压法。适合的活性物质



也可以以生产化肥的常规方法造粒，如果需要可以以与化肥的混合物的形式。

一般而言，农药制剂包含 0.1 至 99 %（重量），特别是 0.1 至 95 %（重量）的式（B1）和/或（B2）活性物质，或者式（A）和（B1）和/或（B2）的除草剂/解毒剂活性物质混合物，和 1 至 99.9 %（重量），特别是 5 至 99.8 %（重量）的固体或液体添加剂，和 0 至 25 %（重量），特别是 0.1 至 25 %（重量）的表面活性剂。

在可湿性粉剂中，活性物质浓度是，例如，大概 10 至 99 %（重量），余下的为常规制剂组分，补齐至 100 %（重量）。在乳油的情况下，活性物质浓度是大概 1 至 80 %（重量）。粉剂形式的制剂通常包含大概 1 至 20 %（重量）的活性物质，可喷雾溶液含大概 0.2 至 20 %（重量）的活性物质。在颗粒剂的情况下，如水可分散颗粒剂，活性物质含量将部分取决于活性物质是液体还是固体形式。一般而言，水可分散颗粒剂包含 10 至 90 %（重量）之间的活性物质。

此外，提到的活性物质制剂，如果适宜，可包含粘合剂、润湿剂、分散剂、乳化剂、渗透剂、溶剂、填料或载体，其在各情况下为常规的。

使用时，商业可得的制剂，如果适宜，可用惯常方式稀释，例如在可湿性粉剂、乳油、分散剂和水可分散颗粒的情况下采用水稀释。粉剂、颗粒剂和可喷雾溶液形式的制剂通常在使用前不再用其它惰性物质稀释。当采用桶混方法时，除了存在于制剂中的表面活性剂外，再以 0.1 至 0.5 %（重量）的浓度加入润湿剂，例如非离子润湿剂或脂肪醇聚乙二醇醚硫酸盐型的润湿剂（参见，例如，德



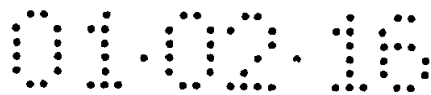
国专利申请 P 40 29 304.1 )，根据本发明的组合物的效力可以达到特别高的水平。所需的安全剂施用量随外在条件如（除了个别的外）温度、湿度和所用除草剂的性质而变化。

以这些制剂为基础，也可能生产与其它物质的组合物。所述的其它物质为作物栽培上的活性物质，例如农药，诸如杀虫剂，杀螨剂，杀菌剂和除草剂，和/或化肥和/或生长调节剂，例如，以现成混合物或桶混物形式。

可以在混合的制剂或桶混物中用来与根据本发明的活性物质组合的组份例如有已知的活性物质，其描述于例如， Weed Research 26,441-445(1986),或“ The Pesticide Manual ” 9th edition, The British Crop Protection Council, 1990/91, Bracknell , England 和引述于其中的文献。可以作为除草剂提到的、由文献得知的、可与式 ( I ) 化合物组合的活性化合物的例子是下列（注：化合物以国际标准化组织的通用名或是化学名，如果适宜，与常用代码一起给出）：乙基乙草胺；三氟羧草醚；苯草醚；氟草醚酯，即 [ [ [ 1 - [ 5 - [ 2 - 氟 - 4 - ( 三氟甲基 ) 苯氧基 ] - 2 - 硝基苯基 ] - 2 - 甲氧基亚乙基 ] 氨基 ] 氧基 ] 乙酸及其甲酯；甲草胺；枯杀达；阿特拉净； amidosulfuron；杀草强；灌木枯，即氨基磺酸铵；莎稗磷；黄草灵；阿特拉津；丙氟草净；燕麦灵； BAS 516H，即 5 - 氟 - 2 - 苯基 - 4H - 3, 1 - 苯并噁嗪 - 4 - 酮；氟噻草啉；氟草胺；吡草黄；苄嘧黄隆；吡草磷；苯达松；吡草酮；benzofluroxypyr；新燕灵；噻草隆；双丙氟酰磷；治草醚；草啶酮；溴丁酰草胺；溴酚脞；溴草腈； bromuron；buminafos；羟草酮；丁草胺；butamifos；丁烯草胺；丁硫咪唑酮；丁乐胺；异丁草丹；草威胺；



烯草安, 即 2 - 氯 - N, N - 二 - 2 - 丙烯基 - 乙酰胺; 硫烯草丹, 即 2 - 氯丙烯基二乙基二硫代氨基甲酸酯; 炔草酯, 即, 2 - [ 4 - [ ( 5 - 氯 - 3 - 氟 - 2 - 吡啶基 ) 氧基 ] 苯氧基 ] 丙酸及其 2 - 丙炔酯; 氯硝醚; 草灭平; 丁禾灵; 氯秀谷隆; 炔草灵; 伐草克; 氯甲丹; 杀草敏; 氯嘧磺隆; 草枯醚; 绿麦隆; 绿醚隆; 氯苯胺灵; 绿黄隆; 敌草索; 氯草硫安; 环庚草醚; 醚黄隆; 炔草酮; 异噁草酮; 稗草胺; 烯草酮; clopyralid; 丙草津; 草灭特; 环草酮 ( cycloxydim ); 环莠隆; 苯草快; 环丙津; 环戊安; 2, 4 - 滴丁酸; 茅草枯; 甜草灵; 敌草净; 燕麦敌; 麦草畏; 敌草腈; 高 2, 4 - 滴丙酸盐; 禾草灵; 乙酰甲草胺; 甲氧醚隆; 草吡唑; 吡氯草胺; dimefuron; 二甲去草胺; 戊草净; 异噁草酮; dimefuron; dimethipin; dimetrasulfuron; 敌乐胺; 地乐酚; 特乐酚; 草乃敌; 杀草净; 敌草快; 氯硫草定; 敌草隆; 二硝甲酚; 甘草津; 吡氯草胺, 即 5 - 氨基 - 1 - ( 1, 1 - 二甲基乙基 ) - N - 甲基 - 3H - 吡唑 - 4 - 酰胺; 环草索; 丙草丹; 禾草畏; 炔氟乐灵; ethametsulfuron-methyl; 赛黄隆; 乙嗪草酮; 甜草味; F5231, 即, N - [ 2 - 氯 - 4 - 氟 - 5 - [ 4 - ( 3 - 氟丙基 ) - 4, 5 - 二氢 - 5 - 氧代 - 1H - 四唑 - 1 - 基 ] 苯基 ] - 乙磺酰胺; F6285, 即, 1 - [ 5 - ( N - 甲基磺酰 ) - 氨基 - 2, 4 - 二氯苯基 ] - 3 - 甲基 - 4 - 二氟甲基 - 1, 2, 4 - 三唑 - 5 - 酮; 2, 4, 5 - 涕丙酸; fenoxan; 噁唑禾草灵; 非草隆; 草氟安; flazasulfuron; 吡氯禾草灵及其酯衍生物; 氯氟乐灵; flumetsulam; N - [ 2, 6 - 二氟苯基 ] - 5 - 甲基 - ( 1, 2, 4 ) - 三唑并 [ 1, 5a ] 咪啉 - 2 - 磺酰胺; 伏草隆; flumipropyn; 氟甲消草醚; 乙羧氟草醚;



氟啶酮; 氟咯草酮; 氟草烟; 吡草酮; 氟黄胺草醚; 杀木磷; 氟味草醚; 草铵膦; 草甘膦; halosafen; 吡氟氯禾灵及其酯衍生物; 环嗪酮; 稗草胺, 即, N - ( 2, 3 - 二氯苯基 ) - 4 - ( 乙氧甲氧基 ) 苯甲酰胺; 咪草酯; 灭草烟; 灭草啞; 甲咪草烟

( imazethamethapyr ); 咪草烟; imazosulfuron; 碘草腈; 异丁咪啉酮; 异丙乐灵; 异丙隆; 异噁隆; 异噁草胺; 恶草醚; 特灭隆; 乳氟禾草灵; 环草啶; 利谷隆; 2 甲 4 氯; 2 甲 4 氯丁酸; 2 甲 4 氯丙酸; 苯噻草胺; 氟草胺; 甲本嗪; 吡草胺; 噻唑隆; 硫威钠; 定草噁; 去草酮; methyldaimuron; 秀谷隆; 甲氧毒草胺; 甲氧隆; 赛克津; 甲黄隆; 抑芽丹; 环草丹; 草庚安; 单脲二氢硫酸盐

( monocarbamide dihydrogensulfate ); 绿谷隆; 二乙环草丹; MT128, 即, 6 - 氯 - N - ( 3 - 氯 - 2 - 丙烯基 ) - 5 - 甲基 - N - 苯基 - 3 - 吡嗪胺; MT5950, 即, N - [ 3 - 氯 - 4 - ( 1 - 甲基乙基 ) 苯基 ] - 2 - 甲基 - 戊酰胺; 萘丙胺; 草萘胺; 抑草生; NC 310, 即, 4 - ( 2, 4 - 二氯苯甲酰 ) - 1 - 甲基 - 5 - 苄氧吡唑; 丁草隆; 烟嘧黄隆; 吡氟草胺; 磺乐灵; 除草醚; 草硝醚; 氟吡酮; orbencarb; 磺胺乐灵; 噁草灵; 乙氧氟甲草醚; 百草枯; 草克丹; 二甲戊乐灵; 苯氟磺安; 甜菜宁; 棉胺宁; 毒草定; 啶草磷; piributicarb; pirifenop-butyl; 丙草胺; 氟密黄隆; 环氟津; prodiamine; 环丙氟乐灵; 甘扑津; 扑灭通; 扑草净; 毒草安; 敌稗; 啶草酯及其酯衍生物; 扑草津; 苯胺灵; 炔敌稗; 甲硫基磺乐灵; 苄草丹; 广草安; 吡唑特; 杀草敏; 吡嘧黄隆; 苄草啞; 吡草特; 二氯喹啉酸; 喹草酸; 喹禾灵及其酯衍生物; ( 乙酯 ) 喹乐灵, ( 四氢糠基酯 ) 喹乐灵; renriduron; 沙草隆; S275, 即,

2 - [ 4 - 氯 - 2 - 氟 - 5 - ( 2 - 丙炔氧基 ) 苯基 ] - 4, 5, 6, 7 - 四氢 - 2H - 吡啶; S 482, 即, 2 - [ 7 - 氟 - 3, 4 - 二氢 - 3 - 氧代 - 4 - ( 2 - 丙炔基 ) - 2H - 1, 4 - 苯并噁嗪 - 6 - 基 ] - 4, 5, 6, 7 - 四氢 - 1H - 异吡啶 - 1, 3 - ( 2H ) - 二酮; 另丁通; 稀禾定; 环己隆; 西玛津; 西玛净; 氟萘草酯, 即, 2 - [ [ 7 - ( 2 - 氯 - 4 - ( 三氟甲基 ) 苯氧基 ) - 2 - 萘基 ] 氧基 ] 丙酸及其甲酯; 噻黄隆; sulfazuron; 啉噻黄隆; 三氯乙酸; tebutam; 丁噻隆; 杀草宁; 芽根灵; 特氯啉; 特丁通; 特丁津; 特丁草净; TFH 450, 即, N, N - 二甲基 - 3 - [ ( 2 - 乙基 - 6 - 甲基苯基 ) - 磺酰 ] - 1H - 1, 2, 4 - 三唑 - 1 - 酰胺; 伏噻隆; 噻黄隆; 杀草丹; 仲草丹; 苯草酮; 野麦畏; 醚苯黄隆; triazofenamide; 苯黄隆; 乙氯草定; 灭草环; 草达津; 氟乐灵; 三甲隆; 灭草丹; WL 110547, 即, 5 - 苯氧基 - 1 - [ 3 - ( 三氟甲基 ) 苯基 ] - 1H - 四唑。

所需的根据本发明的式 ( A ) 化合物施用量随外在条件如 ( 除个别情况外 ) 温度、湿度和所用的除草剂的性质而变化。它可在很宽的范围内变化, 例如, 在 0.001 和 10.0kg/ha 或更多活性成分, 但优选在 0.005 和 5kg/ha 之间。

下列实施例旨在说明本发明:

#### A. 制剂实施例:

- a) 将 10 份重量的式 ( B1 ) 和/或 ( B2 ) 化合物或者 10 份重量的式 ( A ) 除草活性物质与式 ( B1 ) 和/或 ( B2 ) 的安全剂的活性物质混合物, 与 90 份重量的作为惰性物质的滑石粉混合, 并将此混合物在锤磨机中粉碎而获得粉剂。



- b)容易分散于水中的可湿性粉剂，通过混合 25 份重量的式 ( B1 ) 和/或 ( B2 ) 化合物或者 25 份重量的式 ( A ) 除草活性物质与式 ( B1 ) 和/或 ( B2 ) 安全剂的活性物质混合物、 64 份重量的作为惰性物质的含高岭土石英、 10 份重量的木素磺酸钾和 1 份重量的作为润湿剂和分散剂的油酰甲基牛磺酸钠，并将此混合物在孔盘 ( Pinned-disc ) 磨机中研碎而获得。
- c)容易分散于水中的可分散浓缩物，通过混合 20 份重量的式 ( B1 ) 和/或 ( B2 ) 化合物或者 20 份重量的式 ( A ) 除草活性物质与式 ( B1 ) 和/或 ( B2 ) 安全剂的活性物质混合物、 6 份重量的烷基酚聚乙二醇醚 (®Triton X207 )、 3 份重量的异十三醇聚乙二醇醚 ( 8EO ) 和 71 份重量的石蜡矿物油 ( 沸点范围例如大概 255 至高于 277 ℃ )，并将此混合物在球磨机中研磨至低于 5 微米的细度而获得。
- d)乳油获取于 15 份重量的式 ( B1 ) 和/或 ( B2 ) 化合物或 15 份重量的式 ( A ) 除草活性物质和式 ( B1 ) 和/或 ( B2 ) 安全剂的活性物质混合物、 75 份重量的作为溶剂的环己酮和 10 份重量的作为乳化剂的乙氧基化壬基酚。
- e)水可分散粒剂通过混合
- |   |        |
|---|--------|
| 75 份重量的式 ( B1 ) 和/或 ( B2 ) 化合物，                         |        |
| 或 75 份重量的式 ( A ) 除草活性物质和式 ( B1 ) 和/或 ( B2 ) 安全剂的活性物质混合物 |        |
| 10 份重量  | 木素磺酸钙  |
| 5 份重量   | 月桂基硫酸钠 |
| 3 份重量   | 聚乙烯醇和  |

7份重量 高岭土，

将此混合物在孔盘磨机上研磨，并通过喷上作为造粒液体的水，在流化床中将粉末造粒而获得。

f)水可分散颗粒也可通过在胶体磨中匀化和预粉碎

25份重量 式(B1)和/或(B2)化合物，或者25份重量  
量 的式(A)除草活性物质与式(B1)和/或  
(B2)安全剂的活性物质混合物

5份重量 2, 2' - 二萘基 - 甲基 - 6, 6' - 二磺酸钠

2份重量 油酰基甲基牛磺酸钠

1份重量 聚乙烯醇

17份重量 碳酸钙和

50份重量 水，

随后将此混合物在珠磨机 (bead mill) 中研磨，并通过单物质喷头的方式在喷雾塔中雾化和干燥所得悬浮液而获得。

生物实施例

实施例 1

让栽于塑料盆的小麦和大麦 (作为作物) 和风草 (作为有害植物的例子) 在温室中长到3叶期，然后用除草剂和安全剂的混合物苗后处理。式(A)除草剂和式(B)化合物以300升水/公顷的施用量 (换算过的) 以水悬浮液或乳液的形式施用。处理4周后，目测植物由施用的除草剂造成的任何类型的损害，特别是考虑遭受的生长抑制程度，以与未处理对照比较的百分率评估之 (见表1)。

即使当大量过量的除草剂施用时，作物中的严重损害也大大降低，且较少的损害得到完全补偿。添加根据本发明的安全剂对化合

物 H1 和 H2 的除草活性没有不利影响，这点参照风草的例子可见。

因此，根据本发明的除草剂 (A) 和安全剂 (B) 的混合物突出地适合于禾谷类作物的杂草选择性防治。

表 1: 苗后活性 (以%计)

除草剂/ 安全剂	施用量 [g a.i./ha]	小麦 *	大麦 *	风草 * ( <i>Apera spica vent.</i> )
H1	50	75	80	-
	25	60	65	100
	12	40	50	98
H1+S1	50+25	20	45	-
	25+12	10	25	100
	12+6	0	15	98
H1+S2	50+25	15	50	-
	25+12	5	15	100
	12+6	0	5	99
H1+S3	50+25	30	50	-
	25+12	15	25	100
	12+6	5	10	98
H1+S4	50+25	25	-	-
	25+12	10	-	100
	12+6	5	-	99

除草剂/ 安全剂	施用量 [g a.i./ha]	小麦 *	大麦 *	风草 * (Apera spica vent.)
H1+S5	50+25	15	40	-
	25+12	10	20	100
	12+6	0	10	98
H2	50	90	90	-
	25	65	65	100
	12	60	55	100
H2+S1	50+25	20	35	-
	25+12	0	20	100
	12+6	0	10	98
H2+S3	50+25	30	30	-
	25+12	10	10	98
	12+6	5	10	98
H2+S4	50+25	25	40	-
	25+12	10	10	98
	12+6	10	0	98
H2+S5	50+25	10	15	-
	25+12	10	10	99
	12+6	0	0	99
H2+S6	50+50	30	60	-
	25+25	20	55	95
	12+12	5	15	50
H2+S7	50+50	30	45	-
	25+25	20	35	95
	12+12	5	35	95

表 1 中的缩写:

\* = 小麦、大麦和风草, 均为 3 叶期

H1 = N - [ ( 甲氧基 - 6 - 甲基 - 1, 3, 5 - 三嗪 - 2 - 基 ) 氨基羰基 ] - 5 - 碘 - 2 - 甲氧羰基 - 苯磺酰胺

H2 = N - [ ( 4 - 甲氧基 - 6 - 甲基 - 1, 3, 5 - 三嗪 - 2 - 基 ) 氨基羰基 ] - 5 - 氯 - 2 - 异丙氧羰基 - 苯磺酰胺

S1 = ( 5 - 氯 - 8 - 喹啉氧 ) 丙二酸二乙酯

S2 = ( 5 - 氯 - 8 - 喹啉氧 ) 乙酸 ( 2 - 甲基己 ) 酯

S3 = 1 - ( 2, 4 - 二氯苯基 ) - 5 - ( 乙氧羰基 ) - 5 - 甲基 - 2 - 吡啶啉 - 3 - 羧酸乙酯

S4 = 1 - ( 2, 4 - 二氯苯基 ) - 5 - 三氯甲基 - ( 1H ) - 1, 2, 4 - 三唑 - 3 - 羧酸乙酯

S5 = ( 5 - 氯 - 8 - 喹啉氧 ) 丙二酸 ( 1 - 甲基乙基 ) 酯

S6 = 3, 6 - 二氯 - 2 - 甲氧苯甲酸 ( 麦草畏 )

S7 = ( R ) - 2 ( 4 - 氯 - 2 - 甲基苯氧基 ) 丙酸

- = 未测。

## 实施例 2

让栽于塑料盆的玉米栽培种 Felix 和 Dea 在温室中长到 4 叶期, 然后用除草剂 ( A ) 和安全剂 ( B ) 的混合物苗后处理。活性物质以 300 升水/公顷的施用量 ( 换算过的 ) 以水悬浮液或乳液的形式施用。处理 4 周后, 目测植物由施用的除草剂造成的任何类型的损害, 特别是考虑遭受的生长抑制程度 ( 表 2 )。

以与未处理对照比较的百分率评估之。

结果表明, 化合物 ( B ) 能够有效地降低玉米植株受到的除草



剂损害。

即使当大量过量的除草剂施用，作物中的严重损害也大大降低，且较少的损害得到完全补偿。因此，除草剂（A）和安全剂（B）的混合物突出地适合于玉米的杂草选择性防治。

表 2：苗后效果（以%计）

除草剂/ 安全剂	施用量 [g a.i./ha]	玉米 (Felix) *	玉米 (Dea) *
H1	50	30	20
	25	20	10
	12	10	0
H1+S5	50+50	0	0
	25+25	0	0
	12+12	0	0

表 2 中的缩写：

\* = 3 - 4 叶期

H1 = 见表 1

S5 = 见表 1

### 实施例 3

将稻播种于塑料盆中并让其在最适宜的生长条件下在温室中生长。当其达到4叶期时，用除草剂（A）和安全剂（B）处理。处理3周后，观测植物的任何类型的除草剂损害，特别是考虑遭受的生长抑制和变细的程度。结果表明，安全剂有效地降低稻所遭受的除草剂损害。

因此，除草剂（A）和安全剂（B）的混合物适于稻中的杂草选择性防治。添加根据本发明的安全剂未使采用的防治有害植物的除草剂的除草活性受到不利影响，其活性相当于只使用除草剂获得的比较值。